

本件は、2003年12月26日に東京高裁で判決のあった「タキキニン拮抗体の医学的新規用途」の特許性について争われた事件です。医薬用途発明の開示要件は、機能表現で化合物を特定する場合、十分な化合物の例示を要することはこれまでの認識どおりであります。一方、医薬用途発明の進歩性については、「先行の刊行物の記載からでは、当該具体的な化合物のその用途について、推測される膨大な可能性の一つにすぎない」場合には、当該化合物の該用途について主張できるとした基準をしめしており意義ある判決です。

弁理士 庄司 隆

タキキニン拮抗体の医薬用途特許事件

H15.12.26 判決

東京高裁 平成15(行ケ)104

特許取消決定取消請求事件

原告 グラクソ・グループ・リミテッド

代理人:吉武賢次、宮嶋学 補佐:中村行孝、紺野昭男、横田修孝

被告 特許庁長官 代理人:谷口浩行、一色由美子、伊藤三男

裁判官:(長)篠原勝美、岡本岳、早田尚貴

判決要旨:特許第3020757号の請求項8に係る特許を取消すとの部分を取消。原告のその余の請求を棄却する。

1. 原告発明とその経緯

発明の名称:「タキキニン拮抗体の医学的新規用途」

特許番号:第3020757号発明 「本件特許」

優先権主張:1991年(平成3年)9月20日

出願:平成4年9月18日

設定登録:平成12年1月14日

特許異議の申立:異議2000-72673号事件

訂正請求:平成13年9月10日 「本件訂正」

決定:平成14年11月7日

「訂正を認める。特許第3020757号の請求項1ないし9に係る特許を取り消す。」

特許請求の範囲:

【請求項1】タキキニン拮抗体を有効成分としてなり、該タキキニン拮抗体がNK₁受容体拮抗体である、嘔吐治療剤。(訂正発明1)

【請求項8】タキキニン拮抗体が(2S, 3S)-3-(2-メトキシベンジルアミノ)-2-フェニルピペリジン、またはその薬学的に許容される酸付加塩である、請求項7に記載の治療剤。(訂正発明8)

2. 争点

1) 取消事由1(特36条違反)

訂正発明1~7及び9に係る本件明細書の記載には不備があり、当該発明に係る特許は、「改正前特許法36条4項、5項及び6項」に規定する要件を満たさない特許出願に対してされたものである。

2) 取消事由2(進歩性欠如)

訂正発明6は、引用文献に記載された発明に基づいて当業者が容易に発明をすることができたものである。

3) 取消事由3(進歩性欠如)

訂正発明8は、引用文献に記載された発明に基づいて当業者が容易に発明をすることができたものである。

3. 判決

1) 取消事由1(明細書の記載事項に関する認定判断の誤り)

(1) 本件特許請求の範囲の記載は、「NK₁受容体拮抗体を有効成分とする嘔吐治療剤」として、有効成分をその機能によって規定する構成を採用している。原告の主張は、この特定方法は、本発明の本質を的確に規定したもので、上記方法以外によって当該発明を適切に特定することはできないと主張する。

(2) 改正前特許法36条4項は、「発明の詳細な説明には、その発明の属する技術の分野における通常の知識を有する者が容易にその実施をすることができる程度に、その発明の目的、構成及び効果を記載しなければならない」と規定している。本件訂正発明のような医薬用途発明は、一般に、有効成分として記載されている物質自体から、それが発明の構成である医薬用途に利用できるかどうかを予測することは困難であるから、当業者が容易にその実施をすることができる程度に記載されているというためには、明細書に当該物質が当該医薬用途に利用できることを薬理データ又はそれと同視すべき程度の記載により裏付けの必要がある(東京高裁平成8年(行ケ)第201号、平成10年10月30日判決)。その裏返しとして、医薬用途発明は、特許請求の範囲に記載された発明が発明の詳細な説明において裏付けられた範囲を超えるものである場合は、その特許請求の範囲の記載は、発明の詳細な説明に記載したものであるとはいえず、特許を受けようとする発明の構成に欠くことができない事項のみを記載したものであるともいえない(改正前特許法36条5項1号及び2号に規定する要件を満足しない)。

(3) 本件発明の詳細な説明の記載において、医薬用途の裏付けとなる記載は、以下である;

(±)シス-3-(2-メトキシベンジルアミノ)-2-フェニルピペリジンのうち、(2S, 3S)鏡像異性体はNK₁受容体拮抗体としての効力があり、嘔吐を抑制する効果が認められ、(2R, 3R)鏡像異性体はNK₁受容体拮抗体としての効力が(2S, 3S)のもの1/1000しかなく、嘔吐試験でも不活性であったこと、

式(I)で表される化合物である(エキソ、エキソ)-2-(ジフェニルメチル)-N-((2-メトキシフェニル)メチル)-1-アザピシクロ[2.2.1]ヘプタン-3-アミンは、嘔吐を抑制したこと、

N-[N1-[L-ピログルタミン-L-アラニン-L-アスパルチル-L-プロリン-L-アスパラギニン-L-リシル-L-フェニアラニン-L-チロシル]-4-メチル-1-オキソ-2S-(6-オキソ-5S-1,7-ジアザスピロ[4.4]ノナン-7-イル)ペンチル]-L-トリプトファンも嘔吐を抑制したこと。

上記のうち、

に記載された化合物は、「NK₁受容体拮抗作用をもつ」とされているが、そのことを明らかにするデータは示されていない。

に記載された化合物は、NK₁受容体拮抗活性を有することを示唆する記載自体が存しない。

結局、本件明細書の発明の詳細な説明において、NK₁受容体拮抗活性と嘔吐治療活性との双方が確認されているのは、上記の(±)シス-3-(2-メトキシベンジルアミノ)-2-フェニルピペリジンのうち、(2S, 3S)鏡像異性体についてのみである。

かくして、本件明細書の発明の詳細な説明においては、NK₁受容体拮抗体である(2S, 3S)-3-(2-メトキシベンジルアミノ)-2-フェニルピペリジンが嘔吐治療に利用できることは裏付けられているが、それ以外のNK₁受容体拮抗体については、NK₁受容体拮抗活性と嘔吐治療活性の相関関係を裏付ける記載がなく、それらを有効成分とする嘔吐治療剤について、当業者が容易に実施可能な程度に発明の詳細な説明の記載がされているものとは認められない。

(4) 原告は、嘔吐治療効果を有する化合物であるか否かは、化合物の構造類似性を指標とするのではなく、NK₁受容体拮抗作用を有するか否かにより決定されているのであって、ある化合物がNK₁受容体拮抗作用を示せばその化合物は抗嘔吐作用を示すことが証明されている旨主張するが、原告のこの主張は3種の化合物のすべてがNK₁受容体拮抗活性を有することが確認されているとの前提に立つところ、そもそもその前提において誤りを含むものであることは上記のとおりであるから採用できない。

原告は、本件明細書は、「NK₁受容体拮抗体が嘔吐の治療に有効である」との知見を新たに提供するものであるとの前提に立って、本件訂正発明1～7及び9の特許請求の範囲の記載は、その知見からの確に導き出されるものであるとも主張するが、本件発明の詳細な説明においては、ただ一つの化合物についてNK₁受容体拮抗活性と嘔吐治療活性の双方が確認されているにすぎず、原告のいうような「NK₁受容体拮抗体が嘔吐の治療に有用である」という包括的な知見を提供するものとは到底認められない。

(5) 本件訂正発明1～7及び9に係る特許は、改正前特許法36条4項、5項及び6項に規定する要件を満たさない特許出願に対してされたものであるとして、これを取り消した本件決定の判断は、結論において相当である。

2) 取消事由2(本件訂正発明6の進歩性に関する認定判断の誤り)について

上記1)のとおり、本件訂正発明6に係る特許を取り消した本件決定の判断は、結論において相当であるから、原告の取消事由2の主張については検討を要しない。

3) 取消事由3(本件訂正発明8の進歩性に関する認定判断の誤り)について

(1) 本件決定によると、本件訂正発明8について、以下のよう進歩性を否定した;

刊行物19に、『(+)S、S-シス-3-(2-メトキシベンジルアミノ)-2-フェニルピペリジン』(本件訂正発明8に係る化学物質と同一の物質)が記載され、この薬理活性化合物は、サブスタンスP拮抗剤であることが記載されている」こと、

刊行物15には、P物質が嘔吐作用を有することが記載されている」こと、及び

「拮抗物質または拮抗作用とは、薬物の奏する作用を減弱または消滅させる場合のものをいうことは周知である」ことを各認定した上で、

「そうすると、刊行物19に記載されている『P物質拮抗剤』とは、P物質の作用を減弱または消滅する薬物のことであることは明らかであるから、『P物質拮抗剤』とは、刊行物15の記載からみて、P物質により生じる嘔吐を減弱または消滅する薬物のことも示していることは容易に理解できるところである」と理論展開し、

「刊行物19に記載されているP物質拮抗剤であるところの『(+)S、S-シス-3-(2-メトキシベンジルアミノ)-2-フェニルピペリジン』を、嘔吐治療剤として採用してみる程度のことは容易に想到できること」であって、本件訂正発明8は、刊行物15及び19に記載された発明に基づいて当業者が容易に発明をすることができたものである」と判断した。

(2) しかし、これら文献を基にしては以下の理由で本件訂正発明8の進歩性を否定できない;

本件決定が引用する刊行物15には、サブスタンスP(P物質)の拮抗剤が実際に嘔吐を抑制することを裏付ける記載は認められない。また、刊行物19には、「本発明は、新規な3-アミノピペリジン誘導体および関連する化合物、これら化合物を含んでなる医薬組成物、ならびに炎症性および中枢神経系障害その他幾つかの障害の治療および予防におけるこれら化合物の使用に関する。本発明による医薬上活性な化合物は、P物質拮抗剤である」と記載され、当該発明に包含される多数の化合物の合成例の一つとして、例64に、(2S,3S)-シス-3-(2-メトキシベンジルアミノ)-2-フェニルピペリジンを合成したことが記載されているが、この物質が、実際にP物質拮抗剤であることや、P物質の関連する疾病の治療剤として利用できることを裏付ける記載は認められない。

刊行物15及び19においては、P物質拮抗剤が嘔吐を抑制することについても、(2S,3S)-シス-3-(2-メトキシベンジルアミノ)-2-フェニルピペリジンがP物質拮抗剤であってP物質の関連する疾病の治療剤として利用できることについても、これを裏付ける記載はないのであるから、上記物質を嘔吐治療剤として利用することは、これらの刊行物の記載から推測される膨大な可能性の一つにすぎないものというべきである。そうであるとすれば、特定の有効成分が嘔吐治療剤という特定の医薬用途に利用できることが発明の詳細な説明において裏付けられている本件訂正発明8について、そうした裏付けを欠き、単に膨大な可能性の中の一つとして本件訂正発明8に特定された物質に嘔吐治療剤としての用途があり得ることを推測させるにすぎない刊行物15及び19の記載に基づいて、その進歩性を否定することはできない。

(3) よって、本件訂正発明8について、刊行物15及び19に記載された発明に基づいて当業者が容易に発明をすることができたものであるとした本件決定は、本件訂正発明8の容易想到性の判断を誤ったものというべきであり、原告の取消事由3の主張は理由がある。

(担当 弁理士 庄司 隆)