

大法院2019フ10609判決に対する考察

1. 事案の概要

- ・ 事件番号：2019フ10609登録無効(特)
- ・ 関連特許：韓国特許登録第0908176号“因子Xa抑制剤としてのラクタム-含有化合物及びその誘導体”
- ・ 宣告日：2021年4月8日

2. 判決の要旨

(1) 選択発明の進歩性判断基準

先行発明に特許発明の上位概念が公知となっている場合も、構成の困難性が認められれば、進歩性が否定されない。先行発明に、発明をなす構成要素のうち一部を二個以上の置換基から一つ以上選択することができるように記載する、いわゆるマーカッシュ(Markush)形式で以って記載された化学式と、その置換基の範囲内に理論上含まれるだけであって、具体的に開示されていない化合物を請求の範囲とする特許発明の場合にも、進歩性判断のために構成の困難性を問いたださなければならない。

大法院2009.10.15.宣告2008フ736、743判決などは、‘いわゆる選択発明の進歩性が否定されないためには、選択発明に含まれる下位概念全てが先行発明の有する効果と質的に異なる効果を有しているか、または質的な差がなくとも量的に顕著な差がなければならず、この時、選択発明における発明の詳細な説明には、先行発明に比べて上記のような効果があることを明確に記載しなければならない’と判示した。これは、構成の困難性が認められ難い事案において、効果の顕著性があれば進歩性が否定されないという趣旨であるため、先行発明に特許発明の上位概念が公知となっているという理由のみにより、構成の困難性を問いたださないまま、効果の顕著性の有無のみで以って進歩性を判断してはならない。

(2) 進歩性判断時における選択発明の効果の考慮方法

特許発明の進歩性を判断する際には、その発明の有する特有な効果も共に考慮しなければならない。先行発明に理論的に含まれる数多くの化合物のうち、特定の化合物を選択する動機や暗示などが先行発明に開示されていない場合も、それが何ら技術的意義のない任意の選択に過ぎない場合であれば、そのような選択に困難があると見ることがで

さないが、発明の効果は、選択の動機がないため、構成が困難な場合であるか、任意の選択に過ぎない場合であるかを区別できる重要な標識になり得るためである。

(3) 選択発明における効果の記載の程度

効果の顕著性は、特許発明の明細書に記載されて通常の技術者が認識または推論することのできる効果を中心に判断しなければならない(大法院2002. 8. 23. 宣告2000フ3234判決などを参照)、もし、その効果が疑わしいときは、その記載内容の範囲を越えない限度で出願日以後に追加的な実験資料を提出するなどの方法で以って、その効果を具体的に主張・証明することが許容される(大法院2003. 4. 25. 宣告2001フ2740判決を参照)。

3. 事案の詳細

(1) 事実関係

経口用抗凝固剤であるエリキュース医薬品に関し、被告(ジェネリック製薬会社)は、原告(オリジナル製薬会社)のエリキュース医薬品に関する物質特許発明(本件特許発明)が既に公知となった先行発明によって進歩性が否定されることを理由として特許無効審判を提起し、これについて特許審判院は、本件特許発明の進歩性が否定されると判断し、これに対して原告は特許法院に審決取消訴訟を提起した。

一方、本件第1項の発明は、ラクタム環を有する化合物のうちアピキサバン及びその製薬上許容される塩に関するものである。

先行発明であるWO00/39131号は、本件第1項の発明の化合物であるアピキサバンを含んでいるものの、上記の先行発明から本件第1項の発明に至るためには、先行発明に記載の66個の母核のうち第1母核を選択した後、改めて全ての置換基を特定の方式で同時に選択して組み合わせなければならない。

よって、本件の争点は、本件特許発明が多様な組み合わせが可能な一般式の形態の化合物を開示している先行発明によって進歩性が否定されるか否かである。

(2) 原審(特許法院)の判断

特許法院は、本件特許発明は'先行発明に記載された上位概念に含まれる下位概念のみを構成要素とする選択発明'に該当し、このような選択発明は、明細書に記載されて

いる効果を中心に厳格な特許要件を適用して進歩性を判断しなければならないが、本件特許発明が先行発明に比べて異質的な効果や量的に顕著な効果を有しているという点が明細書に記載されていないため、本件特許発明がそのような効果を有しているとは見難いので、本件特許発明は進歩性が否定されると判断した。

(3)大法院の判断

しかし、大法院は、以下のような要旨の理由で以って原審の判決を破棄した。

i)先行発明は、66個の母核構造から選択される化合物および各母核構造に適用される置換基の種類と選択可能な原子などを多様に羅列している。ここで提示された化学式は、母核構造の選択と各置換基の組み合わせによって、理論上数億種類以上の化合物を含むようになる。

ii)先行発明において一般式で記載された化合物から本件第1項の発明に至るためには、先行発明にマーカッシュタイプで以って記載された化合物のうち、第1段階の実施態様として優先順位なしに羅列された66個の母核のうち第1母核を選択した後、改めて上記の母核構造の全ての置換基を特定の方式で以って同時に選択して組み合わせなければならない。特に、本件第1項の発明の効果を示す核心的な置換基として見ることでできるラクタム環は、第1母核の置換基Aに連結された置換基Bの部分に位置するべきであるが、先行発明には、上記のようなラクタム環が具体的に開示されてもいない。先行発明の‘より好ましい実施態様’として記載された34個の母核構造において置換基Bとして可能な数多くの構造のうち、ラクタム環を優先的に考慮するだけの事情もない。

iii)先行発明の‘よりさらに好ましい実施態様’と記載された計107個の具体的な化合物を検討しても、本件第1項の発明と全体的に類似の構造を有しているか、または置換基Bであってラクタム環を有する化合物を見出すことができない。

iv)本件特許発明における明細書の記載および出願日以後に提出された実験資料などによると、本件第1項の発明は、公知となった因子Xa抑制剤と比べて改善されたXa抑制活性および選択性を有し、血液濃度の最高-最低特性を減少させる因子(清浄率と分布容積)と、受容体から活性薬物の濃度を増加させる因子(蛋白質結合、分布容積)などを調節して、薬物の生体内における吸収、分布、備蓄、代謝、排泄に関する薬動学的効果を改善し、他の薬物と同時に投与されることのできる併用投与の効果を改善した発明であ

ることが分かる。

v)優れた薬理効果を有する化合物を、実験なしに化学構造にのみ基づいて予測することはかなり難しいので、新規な化合物を開発する通常の技術者は、既に知られている生物学的活性を有する化合物に基づいて構造的に類似した化合物や誘導体を設計して合成した後、その薬効を評価する過程を経て、改善された薬効を有する化合物を探すようになり、より優れた薬効を有する化合物を見出すときまでこのような作業を繰り返すようになる。

しかし、先行発明と本件第1項の発明は、注目している化合物およびその構造が異なり、本件第1項の発明の構造を、優先的に又は容易に選択する事情や、動機あるいは暗示があるとも見難いので、通常の技術者が先行発明から技術的価値のある最適な組み合わせを見出して本件第1項の発明に到達するまでは、数多くの選択肢を組み合わせつつ試行錯誤を繰り返さなければならないものと見られる。

vi)上記のような事情を総合してみると、本件第1項の発明は、通常の技術者がその発明の内容を既に知っていることを前提として事後的に判断しない限り、先行発明からその構成を導き出すことが容易であるとは見ることができず、改善された効果もあるので、先行発明によって進歩性が否定されることは困難であるように見られる。

ところが、原審は、これとは異なり、上記のような理由によって構成の困難性の有無は問いたさないうまま、先行発明に比べて異質的效果や量的に顕著な効果が認められ難いという理由のみを以って本件特許発明の進歩性が否定されると判断した。このような原審の判決には、特許発明の進歩性判断に関する法理を誤解して、必要な審理を尽くさなかったことから、判決に影響を及ぼした誤りがある。

4. 検討意見

i)選択発明の進歩性判断に関し、これまで大法院は、選択発明に含まれる下位概念全てが先行発明の有する効果と質的に異なる効果を有しているか、または質的な差がなくとも量的に顕著な差があるかを中心に進歩性の有無を判断してきた。

しかし、上記の大法院の判決においては、選択発明にも一般的な進歩性判断の方法を

適用して、構成の困難性が認められれば進歩性が肯定されると判断した。これは、既存に大法院が選択発明の進歩性有無を判断するにあたって、効果を中心に進歩性の有無を判断してきたことに対して、選択発明の進歩性判断の際に構成の困難性も審理されなければならないということを明確にしたものである。

大法院が全員合議体の判決でなく小部判決にて上記の判決をしたことは、従来の異質的又は顕著な効果中心の法理は、構成の困難性が認められない場合に適用されるものであって依然として有効であるため、既存判例の変更ではなく、単に構成の困難性の基準を追加するという意味であるものと見られる。しかし、上記の大法院の判決は、効果中心のこれまでの実務を完全に変えるものと予想される。

ii)一方、選択発明の効果に関する明細書の記載について、従来に大法院は、'選択発明の明細書中、発明の説明には異質的又は顕著な効果があることを明確に記載しなければならない、上記のような効果が明確に記載されているとするためには、発明の説明に質的な差を確認することのできる具体的な内容や、量的に顕著な差があることを確認することのできる定量的記載がなければならない(大法院2012.8.23.宣告2010フ3424判決などを参照)、もし、その効果が疑わしいときには、出願日以後に出願人が具体的な比較実験資料を提出するなどの方法によって、その効果を具体的に主張・立証すれば良い(大法院2003.4.25.宣告2001フ2740判決などを参照)'と判示した。

これに対し、上記の大法院の判決においては、効果の顕著性は、明細書に明確に記載された効果ではなく、'明細書に記載されて通常の技術者が認識又は推論することのできる効果'を中心に判断すると判示し、もし、その効果が疑わしいときには、その記載内容の範囲を越えない限度で出願日以後に追加的な実験資料を提出するなどの方法によって、その効果を具体的に主張・証明することが許容されると明示して、明細書の記載および出願日以後に提出された実験資料などによって、本件特許発明の改善された薬効を認めた。これは、構成の困難性のある選択発明に対して、一般発明と同じ程度で効果の顕著性を立証すれば良いと判断したものと見られる。

iii)今後の見通し

既存には、厳格であった選択発明の進歩性判断基準によって、選択発明に対する進歩性判断は大半が進歩性が否定されるという結論であった。これに関する珍しい例外が、異質的な効果が認められたオランザピンの判決(大法院2012.8.23.宣告2010フ3424判決)程度であった。

しかし、大法院の上記の判決により、進歩性が肯定される選択発明が増加するものと予想され、特に製薬分野においては、オリジナル製薬会社とジェネリック製薬会社との間の特許紛争の際にオリジナル医薬品特許の特許性をより強化させるものと見られる。