

生田哲郎◎弁護士・弁理士／佐野辰巳◎弁護士

医薬品有効成分の製法発明で 均等侵害が認められた事例

[東京地方裁判所 平成26年12月24日判決 平成25年(ワ)第4040号]

1. 事件の概要

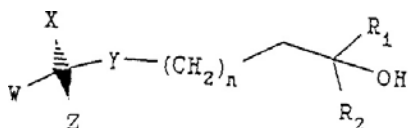
本件は、医薬品の有効成分（マキサカルシトール）の製造方法の発明に関して、均等侵害が認められた事例の第一審判決であり、控訴審は未了です。また、本件特許(特許第3310301号)は特許庁に無効審判が係属しています。

今後、控訴審において判断が変わる可能性があります。均等論の第1要件から第5要件の全要件について詳しく裁判所の判断が示されており、特に第1要件（発明の本質的部分）の考え方、第2要件（置換可能性）の判断において、対比すべき被告方法の考え方は参考になるでしょう。

2. 発明の概要

本件特許は、登録時に請求項の数が41あり、また無効審判で訂正請求がなされています。本件訴訟で争点となった訂正後の請求項13の発明(訂正発明)は、構成要件に分説すると、次のようになります。

A-1 下記構造を有する化合物の製造方法であって：



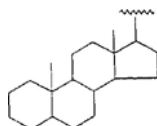
A-2' (式中、nは1であり；

A-3' R₁およびR₂はメチルであり；

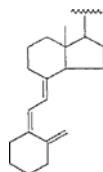
A-4' WおよびXは各々独立に水素またはメチルであり；

A-5' YはOであり；

A-6' そしてZは、式：

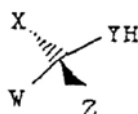


のステロイド環構造、または式：



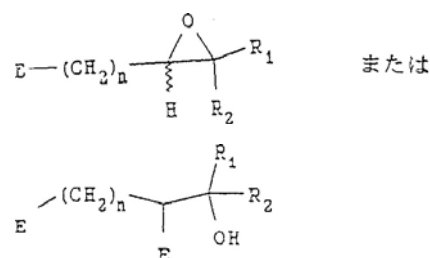
のビタミンD構造であり、Zの構造の各々は、1以上の保護または未保護の置換基および／または1以上の保護基を所望により有していてもよく、Zの構造の環はいずれも1以上の不飽和結合を所望により有していてもよい)

B-1 (a)下記構造：



(式中、W、X、YおよびZは上記定義の通りである)
を有する化合物を

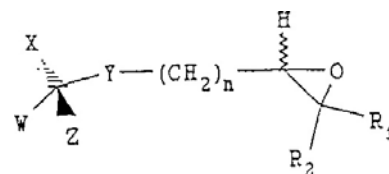
B-2 塩基の存在下で下記構造：



(式中、n、R₁およびR₂は上記定義の通りであり、そしてEは脱離基である)

を有する化合物と反応させて、

B-3 下記構造：



を有するエポキシド化合物を製造すること；

C (b)そのエポキシド化合物を還元剤で処理して化合物を製造すること；および

D (c)かくして製造された化合物を回収すること；

E を含む方法。

訂正発明は多くの化学構造式が用いられており、分かりにくいかもしれませんが、本件の争点を理解するには、次の2工程の反応と捉えれば十分です。

[工程 I] B-1の出発物質とB-2の試薬を反応させて、B-3のエポキシド化合物を得る工程(上記構成要件B-1~B-3)

[工程 II] 上記エポキシド化合物のエポキシ環を開環する工程(上記構成要件C)

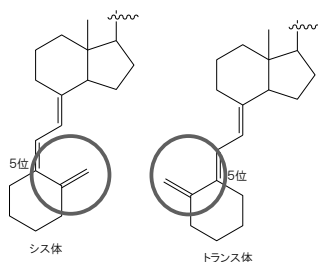
3. 争点

本件では、均等の第1~5要件(争点1~5)、進歩性欠如の無効理由3つ(争点6~8)、実施可能要件違反の無効理由(争点9)、サポート要件違反の無効理由(争点10)、差止めの必要性(争点11)が争点になりました。

誌面の都合上、以下では争点1および2に絞って説明します。

本件発明(訂正発明)と被告方法は、おおむね次の2点で相違しています。

(1) 本件発明の「Z」は、シス体のビタミンD構造であるのに対し、被告方法の出発物質は、上記B-1の「Z」部分がトランス体のビタミンD構造である点。



(2) 本件発明は工程 I および工程 II でマキサカルシトール(シス体)を得るのに対して、被告方法は工程 I および工程 II でトランス体の物質を製造し、さらに工程 III でトランス体をシス体に変換する点。

4. 裁判所の判断

(1) 争点1(第1要件:本質的部分)

「特許法が保護しようとする発明の実

質的価値は、従来技術では達成し得なかった技術的課題の解決を実現するための、従来技術に見られない特有の技術的思想に基づく解決手段を、具体的な構成をもって社会に開示した点にあるから、明細書の特許請求の範囲に記載された構成のうち、当該特許発明特有の解決手段を基礎付ける技術的思想の中核をなす特徴的部分が特許発明における本質的部分であると理解すべきである。

まず、訂正発明のうち、原告が被告方法と対比している場合(マキサカルシトールを目的物質とし、本件試薬を使用する場合は、出発物質(構成要件B-1)と本件試薬を塩基の存在下で反応させて中間体のエポキシド化合物(構成要件B-3)を製造し(以下『第1段階の反応』という。)、同エポキシド化合物を還元剤で処理して(エポキシ環を開環して)、マキサカルシトールを得る(構成要件C。以下『第2段階の反応』という。))ことからなるものである。

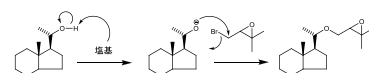
そして、訂正明細書(甲15)には、……、訂正発明は、従来技術に比して、マキサカルシトールを含む訂正発明の目的物質を製造する工程を短縮できるという効果を奏するものと認められる」

「ここで、訂正発明が工程を短縮できるという効果を奏するために採用した課題解決手段を基礎付ける重要な部分(訂正発明の本質的部分)は、ビタミンD構造又はステロイド環構造を有する目的物質を得るために、かかる構造を有する出発物質に対して、構成要件B-2の試薬(本件試薬を含む。)を塩基の存在下で反応させてエポキシド化合物を製造し(第1段階の反応)、同エポキシド化合物を還元剤で処理す

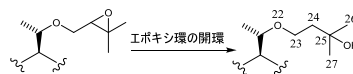
る(エポキシ環を開環する)(第2段階の反応)という2段階の反応を利用することにより、所望の側鎖(マキサカルシトールの側鎖)を導入するところにあると認めるのが相当である。

被告らは、出発物質がビタミンD構造の場合、シス体を用いることと構成要件B-2の試薬(本件試薬を含む。)を用いることの組合せが訂正発明の特徴であり、出発物質がシス体であることも、訂正発明の本質的部分である旨主張する」

「ビタミンD構造の出発物質がシス体であっても、トランス体であっても、第1段階の反応で、出発物質の22位のOH基に塩基の存在下で本件試薬と反応させてエポキシド化合物を合成する下図のような反応



に変わりはなく、第2段階の反応で、エポキシ環を開環してマキサカルシトールの側鎖を導入する下図のような反応



にも変わりはない。

被告方法は、ビタミンD構造の出発物質に本件試薬を使用し、第1段階の反応と第2段階の反応という2段階の反応を利用している点において、訂正発明と課題解決手段の重要部分を共通にするものであり、出発物質及び中間体がシス体であるかトランス体であるかは、課題解決手段において重要な意味を持つものではない。

以上によれば、目的物質がビタミンD構造の場合において、出発物質及び中間体がシス体であるかトランス体であるかは、訂正発明の本質的部分でな

いというべきである。

したがって、被告方法は、均等の第1要件を充足する」

(2) 争点2 (第2要件：置換可能性)

「上記……のとおり、訂正発明によるマキサカルシトールの製造方法は、従来技術に比して工程を短縮できるといふ効果を奏するものと認められる。

被告方法は、ビタミンD構造の出発物質に本件試薬を使用し、第1段階の反応と第2段階の反応という2段階の反応を利用している点において、出発物質及び中間体をシス体からトランス体に置き換えても、従来技術に比して工程を短縮できるといふ訂正発明の目的を達することができ、訂正発明と同一の作用効果を奏するものと認められる。

被告らは、出発物質がトランス体である被告方法では、トランス体の物質Dをシス体に転換する工程Ⅲが不可欠であり、その分だけ、シス体から出発する訂正発明の場合より工程数が多く、また、その結果、収率が低下することが不可避であるので、被告方法は、製造工程の短縮という訂正発明の効果を奏しない、と主張する。

しかし、被告方法の工程Ⅲにおいてトランス体をシス体に転換する工程を加味しても、最終的な工程数は従来方法よりも改善されていると認められるから、被告方法が訂正発明と同一の作用効果を奏しないとはいえない。

なお、原告は、均等の第2要件の判断において、訂正発明の構成要件に対応しないトランス体からシス体への変換工程は考慮の対象でない旨主張しているが、被告方法の工程Ⅰ、Ⅱのみと訂正

発明とを対比すると、被告方法の工程Ⅰ、Ⅱではトランス体の物質Dが得られるにすぎず、医薬品の有効成分として有用なシス体のマキサカルシトールを得ることはできないのであるから、訂正発明と同一の作用効果を奏しないことが明らかであり、訂正発明と対比すべきは被告方法の全部でなければならない」

5. 考察

本件では、出発物質（構成要件B-1の化合物）の「Z」のビタミンD環の構造が、シス体とトランス体で相違することが、発明の本質的部分の相違であるか否かが大きな争点になりました。

シス体とトランス体の相違は、医薬品の有効成分としての効果は大きく違うものと予想されます。そのため、医薬品の物質発明や用途発明であれば、ビタミンD環構造のシス体とトランス体の相違は発明の本質的部分の相違と考えられるでしょう。

争点2において、原告が、本件発明と被告方法の工程Ⅰ(エポキシド化合物の生成)～工程Ⅱ(エポキシ環の開環)を対比すべきであって、工程Ⅲ(トランス体をシス体に変換する工程)は考慮対象とすべきでない旨を主張したのに対し、裁判所は、被告方法の工程Ⅰ～Ⅱだけでは医薬品の有効成分として有用なシス体を得ることができないことから、被告方法の工程Ⅰ～Ⅲの全部と対比する

必要がある旨の判断をしています。

目的物質として、すなわち医薬品の有効成分として考慮する際には、シス体とトランス体の相違は無視できない大きな違いですので、前記裁判所の判断は妥当といえるでしょう。

他方で、本件発明は、物質発明でも用途発明でもなく、製造方法の発明です。

マキサカルシトールの側鎖を導入するための化学反応という観点でみれば、シス体とトランス体の構造異性の位置と反応位置が十分に離れていること、および、トランス体をシス体に変換する方法が公知技術であることも鑑みれば、シス体とトランス体の相違は、それほど重要ではないと考えられるでしょう。

そのため裁判所は、出発物質および中間体がシス体であるかトランス体であるかについては本件発明の本質的部分ではないと判断したものとと思われます。

また、判決文を読む限りでは、被告らは、出発物質としてトランス体を用いることの積極的な理由(工程Ⅲが必要になっても、あえてトランス体を出発物質とすることのメリットなど)を主張していないようです。

仮に、出発物質としてトランス体を用いることのメリットと、シス体を用いることのメリットが全く異なるという主張ができたならば、発明の本質的部分の判断に影響があったかもしれません。

いくた てつお

1972年東京工業大学大学院修士課程修了。技術者としてメーカーに入社。82年弁護士・弁理士登録後、もっぱら、国内外の侵害訴訟、ライセンス契約、特許・商標出願等の知財実務に従事。この間、米国の法律事務所に勤務し、独国マックス・プランク特許法研究所に在籍。

さの たつみ

1989年東北大学大学院理学修士課程修了後、化学メーカーに入社し、特許担当者として勤務。2007年弁護士登録後、生田・名越・高橋法律特許事務所在籍。