

## 淡路町知財研究会 5月ゼミ

平成24年(行ケ)第10206号 有利な効果により進歩性が  
(知財高判H25.7.24) 認められた事例

平成25年(行ケ)第10170号 有利な効果でも進歩性が  
(知財高判H26.8.7) 認められなかった事例

2017/05/27 担当：田岡 洋

# 今回のテーマ

「有利な効果」って、進歩性の主張に使えるの？

ちょっと、審査基準を振り返ってみましょう。

# 進歩性の判断手順

特許・実用新案 審査基準（平成27年9月改訂）

- (1) 審査官は、請求項に係る発明と主引用発明との間の相違点に関し、**進歩性が否定される方向に働く要素**(3.1参照)に係る諸事情に基づき、他の引用発明（以下この章において「副引用発明」という。）を適用したり、技術常識を考慮したりして、**論理付けができるか否かを判断する**。
- (2) 上記(1)に基づき、**論理付けができないと判断した場合は**、審査官は、請求項に係る発明が**進歩性を有している**と判断する。
- (3) 上記(1)に基づき、論理付けができると判断した場合は、審査官は、**進歩性が肯定される方向に働く要素**（3.2参照）に係る諸事情も含めて総合的に評価した上で**論理付けができるか否かを判断する**。
- (4) 上記(3)に基づき、**論理付けができないと判断した場合は**、審査官は、請求項に係る発明が**進歩性を有している**と判断する。  
上記(3)に基づき、**論理付けができた**と判断した場合は、審査官は、請求項に係る発明が**進歩性を有していない**と判断する。

# 論理付けのための主要要素

## 特許・実用新案 審査基準

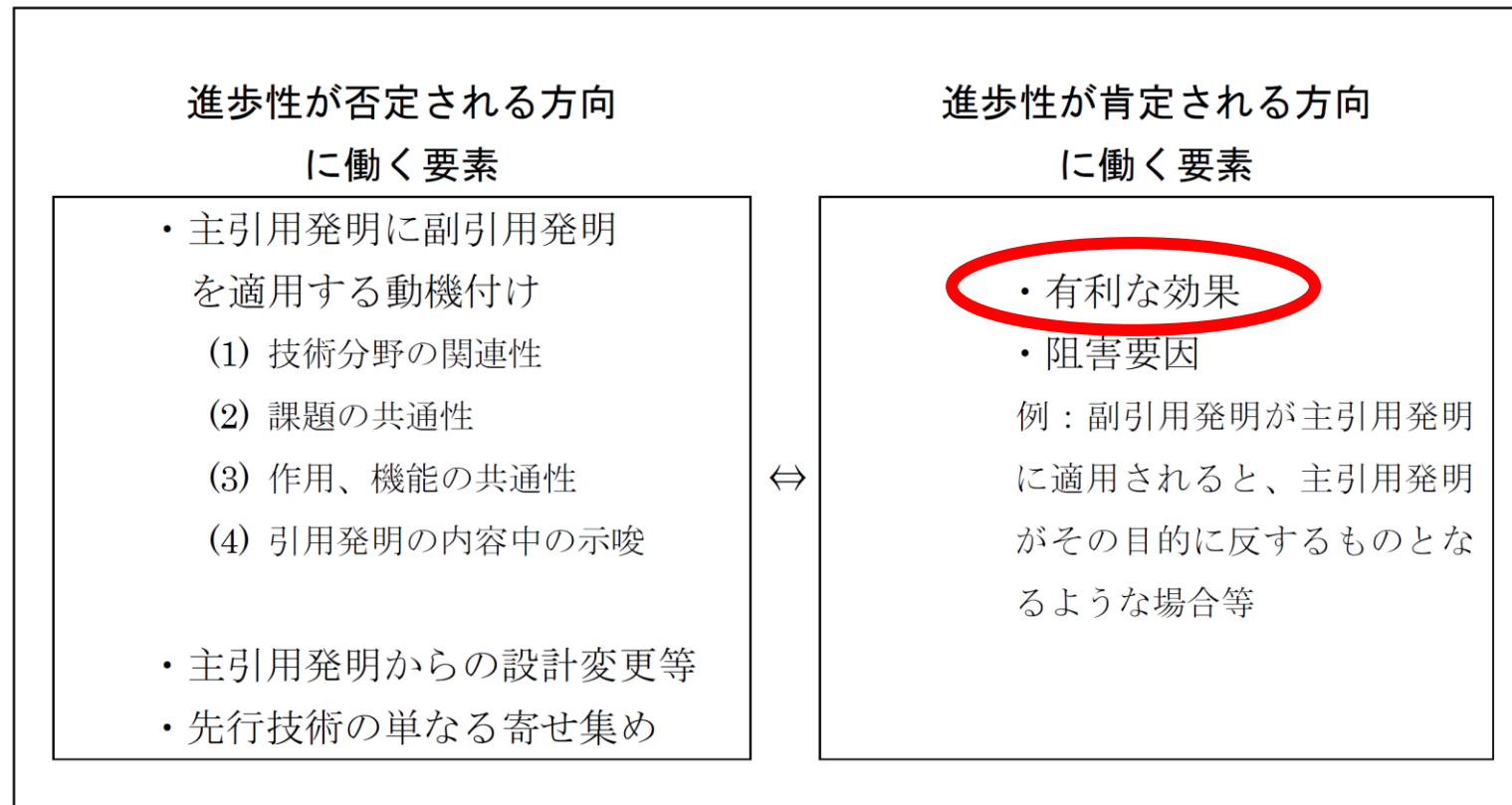


図 論理付けのための主要要素

# 有利な効果

特許・実用新案 審査基準

請求項に係る発明が、引用発明と比較した**有利な効果**を有している場合は、審査官は、**その効果を参酌して**、当業者が請求項に係る発明に容易に想到できたことの論理付けを試みる。そして、請求項に係る発明が引用発明と比較した有利な効果を有していても、当業者が請求項に係る発明に容易に想到できたことが、十分に論理付けられた場合は、請求項に係る発明の進歩性は否定される。

# 有利な効果（つづき）

特許・実用新案 審査基準

しかし、引用発明と比較した有利な効果が、例えば、以下の(i)又は(ii)のような場合に該当し、**技術水準から予測される範囲を超えた顕著なもの**であることは、進歩性が肯定される方向に働く有力な事情になる。

(i) 請求項に係る発明が、引用発明の有する効果とは**異質な効果**を有し、この効果が出願時の技術水準から**当業者が予測することができたものではない**場合

(ii) 請求項に係る発明が、引用発明の有する効果と**同質の効果であるが、際だって優れた効果**を有し、この効果が出願時の技術水準から**当業者が予測することができたものではない**場合

# 有利な効果（つづき）

特許・実用新案 審査基準

## (2) 意見書等で主張された効果の参酌

以下の(i)又は(ii)の場合は、審査官は、意見書等において主張、立証（例えば、実験結果の提示）がなされた、引用発明と比較した有利な効果を参酌する。

(i) **その効果が明細書に記載されている場合**

(ii) その効果は明細書に明記されていないが、**明細書又は図面の記載から当業者がその効果を推論できる場合**

しかし、審査官は、意見書等で主張、立証がなされた効果が明細書に記載されておらず、かつ、明細書又は図面の記載から当業者が推論できない場合は、その効果を参酌すべきでない。

## 有利な効果（つづき）

審査基準を読む限り、有利な効果の主張は有効であるようにも思われるが・・・

（阻害要因と同レベル？）



# 「効果」の取扱い

平成28年度弁理士会特許委員会答申

進歩性判断における発明の「効果」の取り扱いに関しては、

独立要件説（発明の容易想到性とは独立した要件であり、容易想到性が肯定された場合でも、予測できない顕著な「効果」により進歩性が認められるという説）と、

評価障害事実説（当業者が容易に発明することができたことを否定する方向に働く評価障害事実であるという考え方）と

がある。

# 「効果」の取扱い（つづき）

平成28年度弁理士会特許委員会答申

本委員会で検討したところ、独立要件説に基づいた主張、すなわち、構成の容易想到性の議論とは離れて、「仮に構成が容易想到でも、顕著な効果がある」との主張によって、効果の顕著性のみによって進歩性が認められた裁判例は、見当たらなかった。

ただし、①**構成が容易想到であると認定した上で**、又は、②**構成が容易想到であるか否かに関わらずという文脈で、発明の「効果」のみを理由として進歩性を認めた**裁判例は**極僅か**に存在する。

- ・平成24年（行ケ）第10207号「光学活性ピペリジン誘導体の酸付加塩及びその製法事件」 ←**今回の事例 1**
- ・平成23年（行ケ）第10018号「うっ血性心不全の治療へのカルバゾール化合物の利用事件」（第一次判決） ←**第二次判決で無効**

# 事例の紹介

**事例 1** : 審査ハンドブック附属書D (審判決例集) (45)-9  
平成24年 (行ケ) 第10206号 (知財高判平成25年7月24日)  
「光学活性ピペリジン誘導体の酸付加塩」 (無効審判)

**事例 2** : 審査ハンドブック附属書D (審判決例集) (45)-11  
平成25年 (行ケ) 第10170号 (知財高判平成26年8月7日)  
「(+)-2-[1-(3-エトキシ-4-メトキシフェニル)-2-メチルスルホニルエチル]-4-アセチルアミノインドリン-1, 3-ジオン, その使用方法及び組成物」 (査定不服審判)

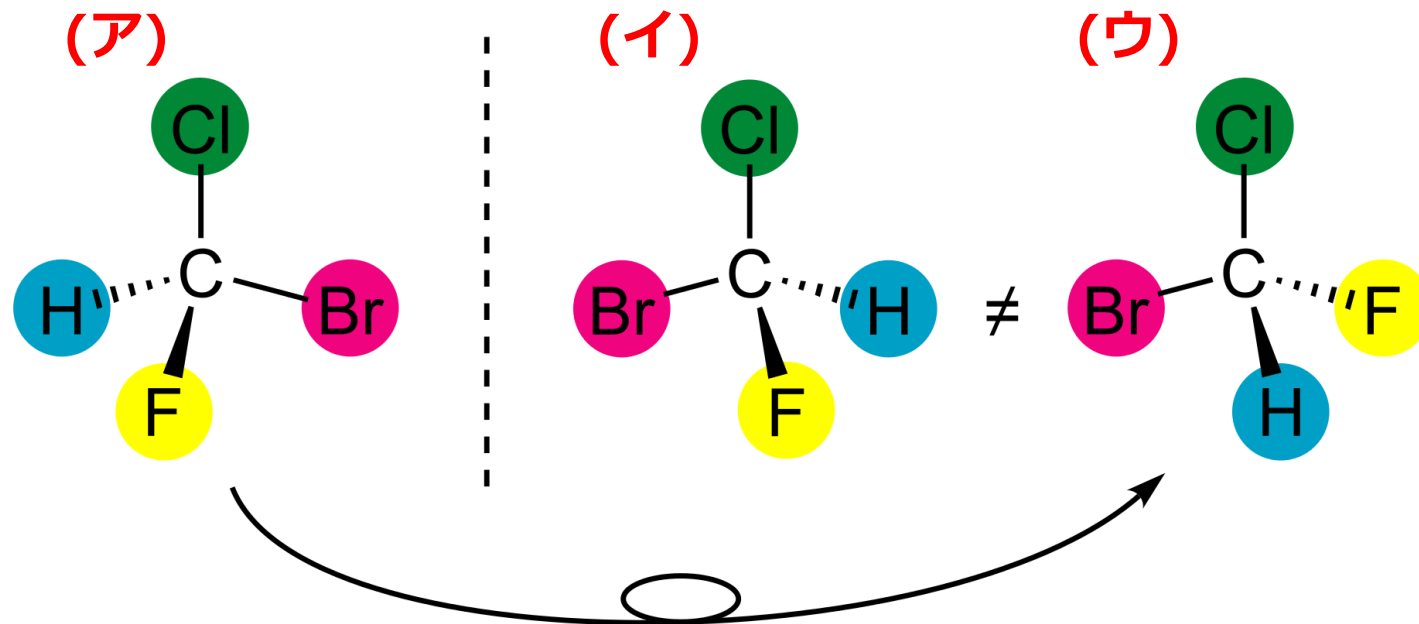
ラセミ体に対する光学異性体の効果が . . .

事例 1 : **認められた** (進歩性あり)

事例 2 : **認められなかった** (進歩性なし)

# 光学異性体とは

互いに鏡像の関係にある 1 対の立体異性体。鏡像異性体ともいう。



図中、左の分子（ア）と真中の分子（イ）とは、点線を挟んで鏡像の関係にある。

（ア）の分子の向きを変えて並べると（ウ）、（イ）とは重ならない。

（重ねるためには、結合を切って組み替えなければならない）

⇒（ア）と（イ）とは、異なる分子（異性体）である。

出典：Wikipedia「キラリティー」

<https://ja.wikipedia.org/wiki/%E3%82%AD%E3%83%A9%E3%83%AA%E3%83%86%E3%82%A3%E3%83%BC>

# 光学異性体とは（つづき）

光学異性体の場合、化合物の命名法では化学式は同じ表記になってしまうため、記号を付して区別する。記号の付し方には何通りかある。

(R) と (S)	事例 1 で使用
(+) と (-)	事例 2 で使用
D と L	今回は登場せず

この他の用語

**ラセミ体**：光学異性体の等量混合物

**光学分割**：ラセミ体から片方の光学異性体を単離する操作

# 光学異性体とは（つづき）

光学異性体どうしでは・・・

物理的性質：おなじ

融点、沸点、屈折率・・・

化学的性質：おなじ

他の化合物（光学活性ないもの）  
との反応性・・・

生物学的性質：**異なる**

酵素との反応

生物に対する薬理活性

# 光学異性体とは（つづき）

## 事例 1 , 事例 2 に共通する技術常識

「研究の精密化に伴い、医薬品、農薬、食品、飼料、香料などの分野で光学活性体を扱うことの重要性が日ごとに増大していることはいうまでもない。**光学活性体が対掌体により生理活性をまったく異にする場合が多い**からである。…不幸な事件のために有名になってしまったサリドマイド…も、（R）体は催奇形性をもたないが（S）体には強い催奇形成があり、ラセミ体を実用に供したことが悲惨な薬害事件…をひき起す原因となった。…したがって、**光学的に純粋な対掌体をいかにして入手（合成または分割）するかは**、医薬品のみならず生物活性物質を対象とする研究において、不斉中心をもつ化合物を扱う場合、**避けて通ることのできない重要課題である。**」（事例 1 の甲 3 ; 事例 2 の甲 3）

⇒医薬化合物の場合、ラセミ体を光学分割し、光学異性体を単離して使用することの強い動機付けが存在した。

# 事例 1 の経過

## 出願経過 (特願2000-032961)

(基礎出願	平成 8年12月26日)
(原出願	平成 9年12月19日)
出願分割	平成12年 2月10日
出願審査請求	平成15年 1月30日
拒絶理由通知	平成18年10月31日
意見書・補正書	平成19年 1月 4日
拒絶査定	平成19年 2月27日
審判請求	平成19年 4月 4日
審決 (登録)	平成22年 7月26日
登録	平成22年 8月 6日
特許第4562229 号	

## 特許無効審判 (無効2011-800097)

審判請求	平成23年 6月9日
答弁書	平成23年 8月30日
口頭審理	平成23年12月16日(?)
審決 (不成立)	平成24年 5月9日

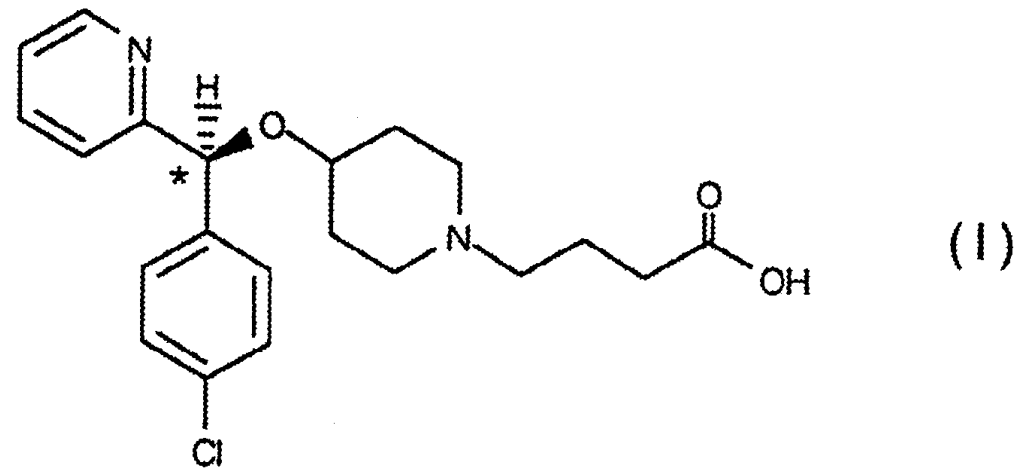
→請求人が出訴



# 事例 1 : 本件特許発明

## 本件特許発明 1

「実質的に (R) 体を含むしない, (S) - 4 - [ 4 - [ ( 4 - クロロフェニル ) ( 2 - ピリジル ) メトキシ ] ピペリジノ ] ブタン酸・ベンゼンスルホン酸塩を有効成分としてなる, 医薬組成物。」



抗ヒスタミン作用を有し、抗アレルギー剤、抗炎症剤等に用いられる。

# 事例 1 : 引用例との対比

## 本件特許発明 1

**実質的に (R) 体含有しない, (S) - 4 - [ 4 - [ ( 4 - クロロフェニル ) ( 2 - ピリジル ) メトキシ ] ピペリジノ ] ブタン酸・ベンゼンスルホン酸塩を有効成分としてなる, 医薬組成物。**

## 引用例 (甲 2 発明)

4 - [ 4 - [ ( 4 - クロロフェニル ) ( 2 - ピリジル ) メトキシ ] - 1 - ピペリジル ] ブタン酸のベンゼンスルホン酸塩を有効成分とする抗ヒスタミン剤

## 相違点

- 本件特許発明 1 : **実質的に (R) 体含有しない, (S) 体**  
甲 2 発明 : **光学異性について特定されていない** (= ラセミ体)

# 事例 1：構成は、容易か？（あまり大事じゃない）

【なぜか…】光学分割（ラセミ体から光学異性体を単離）の実現容易性が争われた

- ・ 高速液体クロマトグラフィー（HPLC）法か、ジアステレオマー法か？  
＜被告データ＞ 本件化合物は、ジアステレオマー法だとうまく光学分割できない
- ・ HPLC法を選択できた場合に、具体的な方法（移動相・固定相の選択）は容易か？  
＜原告データ＞ 本件化合物は、優先日当時に選択できた移動相・固定相で光学分割可能

## 審決では・・・

- ・ 優先日当時は、ジアステレオマー法が一般的（＝**構成は非容易**）
- ・ 仮にHPLC法を選択できたとしても、移動相の選択は非容易

## →**判決では・・・**

- ・ 光学分割の実現は容易（審決を否定＝**構成は容易想到**）

# 事例 1：構成は、容易か？（さらに脱線）

【疑問】そもそも、物の発明で実現容易性（製法）も判断するのか？

## 審判請求人（原告）の主張（審判段階）

「本件特許発明 1 は物の発明であって製造方法の発明ではないから製造方法の容易想到性や実現の困難性は、本件発明 1 の進歩性に判断において考慮すべきでなく、発明とは技術思想であるから特許法第 29 条第 2 項における容易想到性は思想としての想到容易性であって、思想を具現化する実現容易性を意味するではない」（審決）

### →**審決では・・・**

「特許の対象となるのは、産業上利用できる発明であることが特許法第 29 条に規定されており、産業上利用できる発明である以上、単なる思想ではなく具現化された（あるいは、事実上具現化されうる）思想としての発明について判断されることになる。

また、その物の製造方法も具現化されていない限り、物の発明が具現化されることはあり得ないから、物の発明について容易想到性を判断する際には、その製法についても判断の対象となる。」

### **取消訴訟では争点にもならず**

物の発明の容易想到性を判断するのに製法も判断の対象となる？

# 事例 1 : では、効果は？

**構成は、容易。**

しかし、

## 裁判所の判断

「実質的には（R）体を含むしない、（S）体である本件化合物のベンゼンスルホン酸塩が、甲 2 公報に記載された本件化合物のベンゼンスルホン酸塩と比較して**顕著な効果を有するのであれば、本件特許発明 1 の進歩性を肯定することができるというべき**であるから、次に、実質的には（R）体を含むしない、（S）体である本件化合物のベンゼンスルホン酸塩の有する効果について検討する。」

# 事例 1 : (S) 体の効果

本件明細書には、(S) 体 (本件特許発明) と (R) 体 (もう一つの光学異性体) との比較試験結果は記載されている (【表 1】 【表 2】)。


しかし、本件明細書には、(S) 体とラセミ体 (甲 2 発明) との比較試験結果は記載されていない。

→ **実験成績証明書**を出願後 (出願段階の意見書) に提出

# 事例 1 : (S) 体の効果 (つづき)


## ヒスタミンショック死抑制試験 (モルモット) での生存率

本件明細書にも同様の試験あり。ただしラセミ体との比較ではなかった。

(S) 体 (本件発明)	100%		<b>3 倍</b>
ラセミ体 (甲 2 発明)	33%		

## ヒスタミン誘発収縮試験での収縮抑制率

本件明細書には本試験の記載はない。意見書にて登場

(S) 体 (本件発明)	21%		<b>7 倍 !</b>
ラセミ体 (甲 2 発明)	3%		

# 事例 1：効果に関する認定

## 原告の主張（判決文より）

「ラセミ体ではそれを構成する2種の光学異性体のうち一方のみが所望の生物活性を有している場合が大変多い（甲71）ところ、（S）体が（R）体より効果があるといっても、それは光学異性体間でごく普通に認められることである・・・」

## 裁判所の判断

「本件化合物の（S）体のベンゼンスルホン酸塩がそのラセミ体に対して約7倍という高い活性を示したことが記載されているところ、この数値は、**仮に2種の光学異性体のうち一方のみが生物活性を有し、他方が生物活性を有しないと仮定した場合の活性の差、すなわち、2倍の差を上回る**ものである。

したがって、本件化合物の（S）体は、その（R）体と比較して、当業者が通常考えるラセミ体を構成する2種の光学異性体間の生物活性の差以上の高い活性を有するものといえることができる。」

→予測できない顕著な薬理効果あり ⇒ 進歩性あり



# 事例2の経過

## 出願経過（特願2003-577877）

(米国出願 1 (米国出願 2	平成14年 3月20日) 平成15年 1月 7日)
国際出願 出願審査請求 拒絶理由通知 意見書・補正書	平成15年 3月20日 平成18年 1月17日 平成21年 6月30日 平成21年12月28日
拒絶査定	平成22年 5月25日

## 拒絶査定不服審判（不服2010-21522）

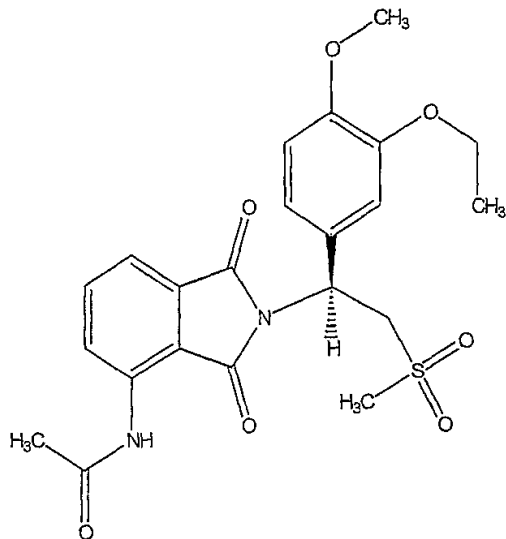
審判請求・補正書 前置報告書 審尋 回答書	平成22年 9月24日 平成23年 2月28日 平成23年11月 1日 平成24年 4月26日
審決（不成立）	平成25年 2月19日

→請求人が出訴

# 事例 2 : 本件発明

## 本件発明 1

「**立体異性体として純粋な (+)** - 2 - [ 1 - ( 3 - エトキシ - 4 - メトキシフェニル ) - 2 - メチルスルホニルエチル ] - 4 - アセチルアミノイソインドリン - 1, 3 - ジオン, 又はその製薬上許容される塩, 溶媒和物若しくは水和物 ; 及び製薬上許容される担体, 賦形剤又は希釈剤を含む, **乾癬治療用**医薬組成物。」



ホスホジエステラーゼ 4 ( P D E 4 ) の酵素活性を阻害し、炎症・乾癬等の治療用途に使用できる。

## 事例 2 : 本件明細書等の記載

### 本件化合物の試験結果

ラセミ体や光学異性体かなり詳細に記載されている。

- ・ P D E 1 ~ 7 中での P D E 4 選択性
- ・ 炎症関連因子 (cAMP, TNF- $\alpha$ 等) の産生抑制作用
- ・ ただし、乾癬への治療効果を直接的に示す結果は記載なし

### 用途

「鬱病、喘息、炎症、炎症性皮膚疾患、**乾癬**、アトピー性皮膚炎、接触皮膚炎、関節リウマチ、骨関節炎、慢性閉塞性肺疾患、慢性肺炎症性疾患、炎症性腸疾患、クローン病、ベーチェット病又は大腸炎の治療又は予防方法・・・」 (出願当初請求項20)

## 事例 2 : 引用発明（刊行物 1）の記載

- ・ 本件化合物（ラセミ体）を製造したこと（【0089】～【0091】）
- ・ P D E 4 の阻害作用をはじめ、薬理作用を確認した試験結果は記載されていない。
- ・ 用途  
「本化合物はまた、それぞれ、ヘルペスウイルスによって引き起こされる感染症等のウイルスによる感染症、あるいはウイルス性結膜炎、**乾癬**、アトピー性皮膚炎などの、過剰な T N F α 及び P D E I V の産生が仲介するまたはにより悪化される極在的な病気の状態の治療または予防に局所的に使用されてもよい。」（【0039】）

## 事例 2 : 引用例との対比

### 相違点

「本願補正発明においては、有効成分が「**立体異性体として純粋な (+)**」エナンチオマーであること、及び、用途が「**乾癬治療用**」であることが特定されているのに対し、引用発明においては、このような特定がされていない点。」

### 判決

- ・ 事例 1 と異なり、光学分割の容易性は、争点となっていない。
- ・ 「乾癬治療用」との構成に想到することは、容易（裁判所の判断）。
  - ・ ・ ・ 効果は？

## 事例 2 : 効果の検討 (原告の主張)

「ラセミ体を 50% の不純物を含有するものと捉えれば、二つの光学異性体の一方がラセミ体と比較して 2 倍を超える薬理活性を示すことは説明がつかず、ラセミ体と比較して 2 倍を超えるかどうかを効果の顕著性の判断基準とすべきである。また、本願化合物の効果の顕著性を判断するにあたっては、それぞれのデータを個別に比較評価するのみでなく、乾癬治療という効果との関係における重要性を考慮して、特に TNF- $\alpha$  阻害活性を評価すべきである。」

事例 1 での裁判所の判断に沿ったような主張

## 事例 2：効果の検討（裁判所の判断）

### 光学異性体の医薬としての効果の評価基準について

「薬理活性を有する光学異性体に対してもう一方の光学異性体が競合阻害したり、生体内で片方の光学異性体がもう一方に変換されるなどの反応が起こることに起因して、**ラセミ体の薬理活性は必ずしも有効な光学異性体の2分の1となるわけではない**ことが、本願優先日前から広く認識されていた。光学異性体においては、一方の光学異性体が他方の光学異性体の有する薬理活性に何ら影響を与えない場合のみならず、一方の光学異性体が存在することで他方の光学異性体の薬理作用を阻害をしたり、一方の光学異性体が生体内で活性のある他方の光学異性体に変換されたりすることで、他方の光学異性体の活性に影響を与えることもあるのであって、**ラセミ体の活性が光学異性体の2分の1とは大きく異なる場合が充分想定される。**」

## 事例 2：効果の検討（裁判所の判断）（つづき）

「そうすると、光学異性体が構成として容易想到であるにもかかわらず、当該光学異性体のもつ薬理活性が公知のラセミ体のそれと比較して顕著であることを根拠として当該光学異性体についての進歩性が肯定されるかは、当該光学異性体のラセミ体と比較した薬理活性の意義や性質、薬理活性の差異が生体内におけるものか試験管内でのものか、当該化合物に関する当業者の認識その他の事情を総合考慮して、当該光学異性体の薬理活性が当業者にとって予想できない顕著なものであったかが探究されるべきもので、単に薬理活性がラセミ体の2倍であるとの固定的な基準によって判断されるべきものではないと解するのが相当である。」

・・・あれ？ 事例 1 と異なる！



## 事例 2 : 効果の検討 (裁判所の判断) (つづき)

### T N F - α 産生阻害活性

「本願明細書の実施例 3 に記載された本願化合物の T N F - α 阻害活性の値は、原告提出の甲 2 3 報告書に記載されたラセミ体の値と比較すると、ヒト全血では約 1. 5 倍、別のヒト全血では約 4 倍、ヒト P B M C では約 2. 5 倍、マウス血清では約 2 0 倍高い (甲 2 3)。しかし、**光学異性体の活性がラセミ体の 2 倍を上回ることをもって、直ちに予想外の顕著な効果であるとする事ができない**ことは前記(1)のとおりである。そして、ヒトの試料における約 1. 5 ないし 4 倍程度活性が強いとしても、本願明細書の実施例 3 及び甲 2 3 報告書は、生体外へ単離した血液、P B M C、又は血清を用いたものであるから、生体に投与した場合の活性の程度が同様であるか否かは不明であることを考慮すると、これをもって当業者の予想を超えた顕著な効果であるとまでは認められない。また、マウス血清では T N F - α 阻害活性の値が約 2 0 倍の強さであったとの点についても、**本願補正発明の乾癬治療用医薬組成物はヒトへの適用を念頭に置いたものであるから、ヒトの試料における効果が上述のとおり顕著であるとまでいえない以上、たとえマウスの試料での効果がある程度高いとしても本願補正発明の進歩性判断は左右されない。**」

# まとめ

事例 1では、

**「仮に 2 種の光学異性体のうち一方のみが生物活性を有し、他方が生物活性を有しないと仮定した場合の活性の差、すなわち、2 倍の差を上回る」**

か否かで、効果の顕著性を判断し、本件特許発明の効果は予測できないものであるとして進歩性を認めた。

# まとめ（つづき）

**事例 2**では、

「光学異性体が構成として容易想到であるにもかかわらず、当該光学異性体のもつ薬理活性が公知のラセミ体のそれと比較して顕著であることを根拠として当該光学異性体についての進歩性が肯定されるかは、・・・を総合考慮して、当該光学異性体の薬理活性が当業者にとって予想できない顕著なものであったかが探究されるべきもので、単に薬理活性がラセミ体の2倍であるとの固定的な基準によって判断されるべきものではないと解するのが相当である。」

として、一部の作用では、2倍を超えた効果があるにもかかわらず、効果の顕著性を認めず、進歩性欠如との審決を維持した。

# 結局のところ・・・

- ・ 結局、どっちで考えるべきなのか？
- ・ 事例 1 と事例 2 とで、なぜ異なる結論になってしまったのか？
- ・ 構成が容易想到であるにもかかわらず、効果が顕著であるとして進歩性が認められた判例は、事例 1 など、極僅か。  
(しかも、いずれも微妙な事例・・・)

→ **「有利な効果」の主張は、進歩性にあまり有効でないのか？**