

進歩性の判断に関する裁判例

－「フルオレン誘導体の結晶多形体およびその製造方法」事件－

H31.2.14 判決 知財高裁 平成 29 年（行ケ）第 10236 号（甲事件）

審決（無効・不成立）取消請求事件：請求棄却

概要

専ら合成樹脂の原材料として使用される化合物について、ある結晶形の結晶が公知であったとしても、単体で使用されて機能を発揮する医薬化合物とは異なり、その用途・性質の面から直ちに結晶多形体の探索が基礎づけられるものではないとして、当業者が別の結晶多形体を得る動機付けはないと判断された事例。

特許請求の範囲

【請求項 1】（下線は、訂正箇所）

ヘテロポリ酸の存在下、フルオレノンと 2-フェノキシエタノールとを反応させた後、得られた反応混合物から 50℃未満で 9, 9-ビス（4-（2-ヒドロキシエトキシ）フェニル）フルオレンの析出を開始させることにより 9, 9-ビス（4-（2-ヒドロキシエトキシ）フェニル）フルオレンの粗精製物を得、次いで、純度が 85%以上の該粗精製物を芳香族炭化水素溶媒に溶解させた後に 65℃以上で 9, 9-ビス（4-（2-ヒドロキシエトキシ）フェニル）フルオレンの析出を開始させる 9, 9-ビス（4-（2-ヒドロキシエトキシ）フェニル）フルオレンの結晶多形体の製造方法。

主な争点

本件発明 1 の容易想到性判断の誤り（取消事由 1）

裁判所の判断

原告が、合成樹脂の技術分野においても、当該分野の結晶多形体の探索及びその手法に対して、医薬品等化合物と同様に化合物の結晶多形体を得る動機付けが成立することを主張したのに対して、裁判所は以下のように判断した。

『（2）相違点 1-2 の容易想到性について

ア 異なる結晶多形体を製造する動機付けについて

本件発明 1 では、BPEF の多形体 B を製造するために特定の溶媒（芳香族炭化水素溶媒）を用いた再結晶化操作が行われているのに対し、引用方法発明では、多形体 A と異なる結晶多形体を得るための再結晶化操作が行われず、単に多形体 A の白色結晶が製造されているにすぎない。したがって、引用方法発明に接した当業者が、多形体 A と異なる結晶多形体を製造しようとする動機付けられるのかどうかについて、以下検討する。

（ア）a 前記 5～9 で認定した各刊行物の記載によると、「多くの化合物について、結晶多形体が存在しており、結晶多形体の違いにより、化合物の嵩密度・・・（略）・・・、バイオアベイラビリティ

ィー、安定性などが変わり得るもので、特にバイオアベイラビリティの向上等が求められる医薬・農薬品化合物や単体で特異的な機能性発現が求められる化合物の分野では、結晶多形体の制御は、工業的にも重要なものとされている。」という技術常識が、本件優先日当時に存在していたことが認められるものの、このような技術常識から直ちに BPEF について、多形体 A と異なる結晶多形体を製造する動機付けの存在を認めることはできない。

b 本件明細書（甲 1）、甲 6、9～13 及び弁論の全趣旨によると、本件で問題になっている BPEF は、専ら合成樹脂（ポリマー）の原材料として使用される単量体（モノマー）であり、最終的には溶融重合又は溶液重合されて結晶形をとどめなくなり、結晶多形体の違いにかかわらず、同じ化学構造のポリマーとなる化合物であると認められるのであり、単体で使用され何らかの機能を発揮する医薬品化合物のようなものとは異なり、その用途・性質の面から直ちに結晶多形体の探索が基礎づけられるようなものではないといえる。

c 本件明細書の段落【0003】によると、BPEF について、高純度で高い反応性を有し、ポリマーに合成したときに分子量が高く分子量分布が狭く、かつ未反応モノマーやオリゴマー含有率が低いことが要求されていたと認められるところ、本件優先日当時、それらの事項やその他の物性、嵩密度をはじめとする粉体特性等に関して、多形体 A について何らかの課題があったり、工業的プロセスでの不都合があったりして、多形体 A 以外の結晶多形体を得る必要があると当業者に認識されていたことを認めるに足りる証拠はない。

d (a) 上記 c 認定の本件明細書の記載及び甲 67・・・（略）・・・からすると、モノマーとしての BPEF について、高純度化の要求があり、結晶形の違いが、ある種のモノマーの純度に影響を与える場合があると当業者が認識していたことは認められるが、①・・・（略）・・・結晶多形体の制御のためには、できるだけ多くの析出条件で網羅的に結晶化を試みるというスクリーニング法に依拠せざるを得なかったところ、このようなスクリーニング法を採用して、所望の物性や粉体特性等を有する結

晶多形体の析出条件を特定することは、当業者にとっても相応の試行錯誤、すなわち、相応の労力や費用を要するものであったと認められること、②本件優先日当時、・・・(略)・・・高純度のBPEFを得る方法が既に明らかになっていたことや甲6の段落【0025】に必要な応じて再結晶化やそれ以外の精製操作を行ってもよい旨の記載があることからすると、BPEFの高純度化を目指す当業者としては、上記①のとおり費用・労力がかかり、かつ所望の純度向上が得られるか不透明な新たな結晶多形体を探索するという手法ではなく、通常は、純度の向上が確実に見込まれ、より適切といえる上記②のような各手法を選択するといえる。

・・・(略)・・・

f 以上をまとめると、本件優先日当時、BPEFについて、その用途・性質の面からみて、直ちに結晶多形体探索の動機付けがあるとはいえず、かつ、多形体Aについて純度向上やその他の物性、粉体特性等の点で特に課題が認識されておらず、しかも、純度向上のためには結晶多形体の制御以外に他に適切な手法が複数あったのであるから、敢えて時間や費用を要する異なる結晶多形体を製造する動機付けがあったと認めることはできない。

・・・(略)・・・

(イ) 原告は、①前訴判決・・・(略)・・・からすると、ファインケミカルに属するBPEFについては動機付けがあった、②本件明細書・・・(略)・・・からすると、高純度かつより良い粉体特性を有するモノマーを製造するために結晶多形体を作り分けることが本件優先日当時に技術常識になっていたと主張する。

しかし、上記①について、前訴判決の・・・(略)・・・は、主に結晶多形体探索のための手法(スクリーニング法)について述べているものであって、BPEFについて、結晶多形体を得る動機付けがあることを認定しているものではないから、この点についての原告の上記主張は採用することができない。

また、上記②について、モノマーやBPEFに関らずと、原告が指摘する本件明細書の記載から、原告が主張する技術常識の存在を認定することはできず、この点についての原告の上記主張も採用することができない。

・・・(略)・・・

ウ 小括

以上からすると、相違点1-2について、引用方法発明に基づいて当業者が容易に想到することができたものとはいえない。』

を否定した。

なお取消事由1に係る本件発明1は製造方法の発明であるが、本判決では、別請求項に係る結晶多形体そのものの発明に対しても取消事由1の理由を適用して容易想到性を否定している。

以上から、医薬品とは異なる技術分野の化合物の結晶多形体に対しては、医薬品の技術分野の判決で認定される技術常識は適用されず、個別の技術分野の技術常識によって判断されることが確認された。

2 医薬品の技術分野では、既に特定の化合物の結晶が知られている場合には、医薬品化合物の結晶化に関する技術常識をもとに、既に知られている化合物の結晶とは別の結晶多形体を得ることの動機付けを肯定する判例が多数存在する(例えば、知財高裁平成29年(行ケ)第10196号、平成29年(行ケ)第10147号、平成28年(行ケ)第10112号、平成23年(行ケ)第10445号など)。

本判決は、医薬品化合物の技術分野については、従来の判決と同様の技術常識が存在することを肯定している。

実務上の指針

1 結晶多形体を得る動機付けの有無を検討するにあたって、医薬品以外の技術分野では、本判決の判示内容が参考になる。即ち、明細書の記載の他に、結晶多形体によって解決可能な課題や、従来の結晶多形体の不都合が出願時の当業者に認識されていたかどうかを検討すべきであろう。

2 一方、医薬品化合物の結晶多形体においては、従来の判例と同様の技術常識が参酌されると思われる。その場合、発明が通常の結晶化法を用いる限りでは、原則として結晶多形体を得る動機付けが肯定される。

そのため、結晶多形体の進歩性が肯定されるには、例えば、引用発明と比較した有利な効果、使用した結晶化法の特殊性、阻害要因の存在などの主張を行う必要がある。

以上

検討

1 本判決は、合成樹脂の単量体の結晶多形体である本件発明の多形体について、単体で使われず、結晶形をとどめない形で実用されるものであること、及び、出願時に結晶多形体を探索する必要性がある課題やプロセス上の不都合が当業者に認識されていないことを理由に、当該多形体を製造する動機付け