

名称: 「ゾレドロネートの使用」 事件

審決取消請求事件

知的財産高等裁判所: 平成 26 年(行ケ)第 10045 号 判決日: 平成 26 年 12 月 24 日

判決: 認容判決(審決取消)

特許法第 29 条第 2 項

キーワード: 容易想到性、動機づけ、用法用量、

[概要]

本事案は、原告が、「骨代謝疾患の処置のための医薬の製造のための、ゾレドロネートの使用」に関する発明につき、特許出願をしたところ、拒絶査定(29条2項)を受け、これに対して不服審判を請求したが、不成立審決(拒絶審決)を受けたため、これに不服のある原告が、審決の取り消しを求め、審決が取り消された事案である。

[本願発明(補正後の本願請求項1)]

2-(イミダゾール-1-イル)-1-ヒドロキシエタン-1,1-ジホスホン酸(ゾレドロン酸)又はその薬学的に許容される塩を有効成分として含む処置剤であって、

ビスホスホネート処置を必要とする患者に4mgのゾレドロン酸を15分間かけて静脈内投与することを特徴とする処置剤。

[審決が認定した引用発明]

ゾレドロン酸を有効成分として含む薬剤であって、乳癌又は多発性骨髄腫のような溶骨性疾患の患者に4mgのゾレドロン酸を5分間かけて点滴することを特徴とする薬剤。

[審決が認定した一致点]

2-(イミダゾール-1-イル)-1-ヒドロキシエタン-1,1-ジホスホン酸(ゾレドロン酸)又はその薬学的に許容される塩を有効成分として含む処置剤であって、ビスホスホネート処置を必要とする患者に4mgのゾレドロン酸を分単位の一定時間をかけて静脈内投与することを特徴とする処置剤。

[審決が認定した相違点]

分単位の一時間が、引用発明では「5分間」であるのに対し、本願発明では「15分間」である点。

[争点]

相違点に係る容易想到性の判断の誤り(取消事由1)

[裁判所の判断]

<取消事由1について>

・・・引用例1及び2に開示されたゾレドロン酸の第I相及び第II相臨床試験の結果によれば、ゾレドロン酸は、4mgという低用量で従来用いられていたパミドロン酸90mgに匹敵する薬効を奏し、5分間の短時間の静脈点滴で安全性が確保できるものであると理解できる。そうすると、このようIII相試験で、当該用法用量による安全性について違った結果が生じて用法用量をより安全性の高いものに変更する可能性があることを考慮しても、第I相及び第II相臨床試験の段階では、安全性に疑問を呈するような結果は全く出ていないのであるから、患者の利便性や負担軽減の観点からも、引用例1及び2の記載からは、4mgのゾレドロン酸を5分間かけて点滴するとの引用発明の投与時間を更に延長する動機付けを見出すことは困難であるというべきである。

・・・引用例3の記載について・・・エチドロネート及びクロドロネートは、初期の臨床試験に用いられていた第一世代のビスホスホネートであり、至適投与方法が確立されていなかった初期の頃に、エチドロネートの短時間投与で腎障害による死亡例が報告されたことが発端となって、その後開発された種々のビスホスホネートに関しても緩徐な投与が推奨されることとなったものであるが、エチドロネートの100倍ないし1000倍の骨吸収抑制作用の薬効を有するパミドロン酸、インカドロン酸及びアレンドロン酸といった第二世代、第三世代のビスホスホネートは使用量が少量で足りることもあり、患者の利便性との兼ね合いで急速投与が検討され、パミドロン酸は1～1.5mg/分、インカドロン酸及びアレンドロン酸は10mg/30分の急速投与で安全性が確認されただけでなく、これら3つの製剤については逆に腎機能障害の改善効果の報告もあることが認められる。

このような本願優先日当時の第二世代及び第三世代のビスホスホネートの開発の経緯及び急速投与の実績からすれば、当業者としても、引用例3に記載された第一世代のビスホスホネートの急速投与による腎臓への有害事象に関する知見は、第三世代のビスホスホネートであるゾレドロン酸に直ちに当てはまるものではないと理解されるものと認められる。

そうすると・・・ゾレドロン酸はパミドロン酸よりも100ないし850倍も活性が高いビスホスホネートであって、インカドロン酸及びアレンドロン酸よりもさらに骨吸収抑制作用が高く少量投与で足りることも考慮すれば、患者の利便性や負担軽減の観点からも、引用例1及び2において安全性が確認されたゾレドロン酸4mgの5分間投与という投与時間を、更に延長する動機付けがあると認めることは困難である。

以上のとおり、ゾレドロン酸の急速投与については、腎臓に対する安全性が課題の一つとされ、引用例2の第I相臨床試験でも、その点の確認が行われ、第II相試験(引用例1)を経た上で、さらにはそれに引き続く第III相臨床試験において、腎臓に対する安全性の関係で異なる結果が生じることも可能性としては存在したが、引用例1及び2の第I相臨床試験、第II相臨床試験では、4mg 5分間投与で腎臓に対する安全性に疑問を呈する結果は確認されていないこと、引用例3の記載も本願優先日当時、第三世代のビスホスホネートであるゾレドロン酸に直ちに当てはまるものではないと理解されることからすると、引用例1及び2において安全性が一応確認されたゾレドロン酸4mgの5分間投与という投与時間を更に延長し、これを15分間とする動機付けがあると認めることはできない。

したがって、本願発明は、引用発明に基づき、引用例2及び3を適用して容易に発明することができたとは認められないから、原告主張の取消事由1は理由がある

以上