

新規性・進歩性の判断に関する裁判例  
「光学活性ピペリジン誘導体」事件

H25. 7. 24 判決 知財高裁 平成 24 年（行ケ）第 10207 号

特許維持審決取消請求事件：請求棄却（審決維持）

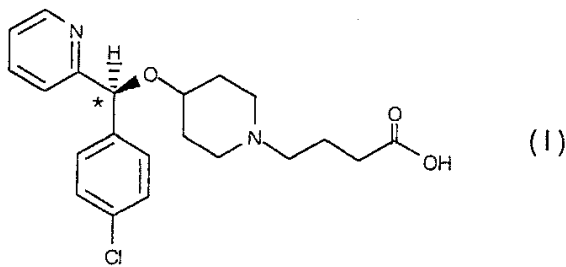
概要

ラセミ体が公知の場合であっても、**その用途や作用等を参酌すれば、光学異性体に新規性及び進歩性**が認められると判断した事例。

〔特許請求の範囲〕

〔請求項 1〕

式 (I)



で示される絶対配置が (S) 体である光学活性ピペリジン誘導体のベンゼンスルホン酸塩。

〔争点〕

(1) 新規性についての判断の誤りの有無

医薬に用いられる光学異性体の物質自体にかかる発明について、先行文献（甲 1 公報）によるラセミ体の開示により、新規性なし、と判断されることの是非

(2) 進歩性についての判断の誤りの有無

①光学分割を行うことの困難性の有無

②一般的に光学異性体のうち一方のみが所望の生理活性を有していることが知られている状況下において、光学異性体の効果の顕著性を考慮することの是非

〔原告の主張〕（筆者にて適宜要約、下線。以下同様。）

(1) 取消事由 1（新規性について）

①東京高裁平成 3 年 10 月 1 日判決は、ラセミ体が公知であれば、その光学異性体には新規性がない旨判示している。特許庁もこの判決以降、これに沿って判断しており、ラセミ体が開示されている甲 1 公報に基づいて、(S) 体を対象とする本件特許発明が新規性を欠くことは明らかである。

②本件化合物を光学分割する方法が自明でないとする審決の判断は誤りである。

③被告らは (S) 体である本件化合物を含む医薬が受けた製造承認に基づいて、甲 1 公報に係る特許権の存続期間の延長登録を受けており、甲 1 発明に本件化合物が含まれることを自認している。

(2) 取消事由 2（進歩性に関して）

①審決は、本件化合物の光学分割を行うことの困難性を認めているが、誤りである。

②本件特許発明の効果について、明細書には、エステル化された (S) 体および (R) 体の化合物の薬理効果を比較したデータのみが開示されており、エステル化されていない本件化合物は勿論、ラセミ体との効果上の違いは何ら理解できない。ラセミ体では、それを構成している 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することは多く、ごく普通に認められることであり、本件特許発明の進歩性を基礎づけるような顕著な効果は認められない。

〔被告らの反論〕

(1) 取消事由 1（新規性について）

甲 1 公報では、本件特許発明のように (S) 体を用いることの特定がない。本件化合物のラセミ体から、実験報告書に記載された分取方法・条件を用いて (S) 体を分取することは、本件特許発明の優先日当時知られていない。さらに、甲 1 公報では、本件特許発明のベンゼンスルホン酸塩の記載がない。従って、本件特許発明には新規性が認められる。

東京高裁平成 3 年判決は、殺虫剤の中間体であり、そのままでは何も活性のない「物」に関してなされた判決であり、「医薬の有効成分として用いられる化合物」に関する発明である本件特許発明には及ばない。

原告はさらに、甲 1 公報に係る特許権の存続期間の延長登録と本件特許発明の特許性との関係について主張するが、甲 1 公報に係る特許権の延長登録の無効理由を論じても意味がなく、本件特許発明の特許性とは全く別の問題である。

(2) 取消事由 2（進歩性に関して）

光学分割の方法に困難性がある。

本件特許発明の薬理効果については、審決が認定しているとおりであり、審決の判断に誤りはない。

### 〔裁判所の判断〕

#### (1) 取消事由 1 (新規性について)

①東京高裁平成3年判決は、(その当時の技術常識に鑑みて)光学異性体は、一般に、旋光性の方向以外の物理的・化学的性質においては差異がないから、ラセミ体の開示をもって光学異性体が開示されているというべきであるとして上記発明の新規性を否定した判決であり、本件特許の優先日の技術常識を参酌したものではないことが明らかである。ラセミ体自体は公知であっても、それを構成する光学異性体の中で生物に対する作用が異なることを開示した点に新規性を認めるべきである。すなわち、平成8年12月26日における技術常識に照らして新規性の有無を判断すべきであり、平成3年当時の判決や昭和50年の運用指針の規定を根拠とするのは誤りである。

②先行文献において、本件化合物を光学分割する方法が記載されているに等しいとすることはできない。(カラムを使用して分割できる物質が多数存在するとしても、本件特許発明の分割に用いたカラムを使用して本件化合物ないしこれと化学構造が類似した化合物を光学分割できる例が知られていない以上、本件化合物を光学分割する方法が記載されているに等しいということとはできない。)

③特許庁における延長登録の実務の是非はさておき、甲1公報に係る特許権の存続期間の延長登録がみとめられているからといって、甲1公報に(S)体の本件化合物のベンゼンスルホン酸塩が開示されているということにはならない。延長登録が認められたか否かは、本件の新規性の判断に何ら関係ない。

#### (2) 取消事由 2 (進歩性に関して)

①光学分割の困難性に関しては、優先日当時の技術常識として、光学分割用カラムの重要性も認識されており、当業者が、本件化合物の光学分割を行う際にジアステレオマー法を最初に検討するとして審決の判断には誤りがある。また、本件特許発明における移動相や固定相の選択も当業者に容易想到と言えらる。光学異性体の取得の困難性の判断について、審決には誤りがある。

②本件明細書の開示と実験成績証明書の内容(モルモットから摘出した回腸におけるヒスタミン誘発収縮とヒスタミンショック死抑制作用試験結果)から、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、ということができない。本件化合物は、甲1発明であるラセミ体の本件化合物のベンゼンスルホン酸塩と比較して、当業者が予測することのできない顕著な薬理効果を有するものといえる。従って、結論において、審決に取り消すべき違法はない。

### 〔検討〕

本判決では、医薬の有効成分として用いられる化合物にかかる発明において、ラセミ体が公知の場合であっても、光学異性体に新規性があることが確認されている。さらに、光学異性体を含む医薬の薬効の顕著性により用いられる物質自体に進歩性がある場合として、ラセミ体と比較した場合の数値の差が指標になり得ることが示唆されている。実際に、光学異性体の効果とラセミ体の効果の差異が何倍以上であれば進歩性があり、何倍までは進歩性なし、とするような考え方自体が技術的に妥当かは検討が必要と思われる。

なお、同原告および被告による同一の医薬製品に関わる事件である、平成24年(行ケ)10206号においては、医薬に係る発明について同様の判断がなされている。医薬に係る発明であれば、医薬としての効果参酌による進歩性の判断は妥当と考えられるが、本件のような物の発明においても全く同じ判断基準を適用することが適切であるのか疑問が残る。光学異性体の取得の困難性等の理由づけの方が、物の発明についての進歩性の説明としては、妥当という意見もある。

### 《実務上の指針》

医薬品のライフサイクルマネジメントにおいて、特許による保護期間をできる限り延長することは、研究開発型の製薬メーカーにとって必須の課題である。光学異性体自体を単独で出願し、権利化を図ることは、保護期間延長のための重要な戦略と位置づけることができる。

以上