

名称：「セレコキシブ組成物」事件

審決取消請求事件

知的財産高等裁判所：令和元年（行ケ）第10137号 判決日：令和2年10月28日

判決：請求棄却

条文：特許法29条2項

キーワード：進歩性

判決文：https://www.ip.courts.go.jp/app/files/hanrei_jp/809/089809_hanrei.pdf

[事案の概要]

特定の粒度分布で特定した製薬組成物において、当該特定が医薬品の原料粉末では一般的であることを認めるに足りる証拠はないとして、本件発明の進歩性を肯定した審決が維持された事例。

[事件の経緯]

原告は、特許第3563036号の特許権者である。

原告が、当該特許に係る発明についての特許を無効とする無効審判（無効2018-800071号）を請求し、被告が訂正を請求したところ、特許庁が、当該請求を棄却する審決をしたため、原告は、その取り消しを求めた。

知財高裁は、原告の請求を棄却し、審決を維持した。

[本願発明]（下線は、訂正箇所）

【請求項1】

一つ以上の薬剤的に許容な賦形剤と密に混合させた10mg乃至1000mgの量の微粒子セレコキシブを含み、一つ以上の個別な固体の経口運搬可能な投与量単位を含む製薬組成物であって、粒子の最大長において、セレコキシブ粒子の D_{90} が $200\mu\text{m}$ 未満である粒子サイズの分布を有する製薬組成物。

[主な取消事由]

1. 進歩性判断の誤り

[裁判所の判断]（筆者にて適宜抜粋、下線）

取消事由1-1（甲1を主引用例とする本件発明1の進歩性判断の誤り）

『ア そこで検討するに、本件明細書には、・・・(略)・・・との記載がある。

これらの記載は、未調合のセレコキシブを粉砕し、「セレコキシブの D_{90} 粒子サイズ」を「約 $200\mu\text{m}$ 以下」とした場合には、セレコキシブの生物学的利用能が改善されること、ピンミリングのような衝撃粉砕を用いることにより、他のタイプの粉砕と比較して、最終組成物に改善されたブレンド均一性がもたらせることを示したものと見える。

イ しかるところ、甲1には、甲1発明の「セレコキシブを300mg含む経口投与用カプセル」にいう「セレコキシブ」について、その調製方法を示した記載はなく、また、粉砕により微細化をしたセレコキシブを用いることや、その微細化条件を「セレコキシブの D_{90} 粒子サイズ」で規定することについての記載も示唆もない。

・・・(略)・・・

これらの記載は、溶解速度を改善するために製剤側で制御可能なファクターは、表面積と溶解度であり、表面積を増大する方法として、薬物粒子を微細化する手段が最もよく利用されていること、薬物粒子は多くの場合、粉砕機を用いて粉砕され、通常有機薬物結晶では十数 μm から数 μm 程度まで微細化できること、微細化により粒子径が小さくなると、表面積の増加に

より溶解速度が増大し、また、微細化によりバイオアベイラビリティを改善できることが多くの難溶性薬物で報告されていることなどを示すものである。

一方で、甲9及び10には、特定の大きさよりも小さい粒子サイズの粒子が効果を奏する粉体の場合には、その粒度分布を、平均粒子径ではなく、「所望の大きさよりも小さい粒子サイズの粒子が粉末全体に占める割合」で特定することは、医薬品の原料粉末では一般的であることについての記載や示唆はなく、ましてや、セレコキシブの微細化条件として「セレコキシブのD₉₀粒子サイズ」で規定することや、「セレコキシブのD₉₀粒子サイズ」を「約200μm以下」とした場合には、セレコキシブの生物学的利用能が改善されることについての記載も示唆もない。他に特定の大きさよりも小さい粒子サイズの粒子が効果を奏する粉体の場合には、その粒度分布を、平均粒子径ではなく、「所望の大きさよりも小さい粒子サイズの粒子が粉末全体に占める割合」で特定することは、医薬品の原料粉末では一般的であることを認めるに足りる証拠はない。

そうすると、甲1に接した当業者において、甲1発明のセレコキシブを300mg含む経口投与用カプセルにおいて、経口吸収性（生物学的利用能）の改善及び薬効成分の含量均一性の改善のために、薬効成分のセレコキシブの粒子サイズを小さくすることに思い至ったとしても、セレコキシブの微細化条件として「粒子の最大長において、セレコキシブ粒子のD₉₀が200μm未満である粒子サイズの分布を有する」との構成（相違点1-2に係る本件発明1の構成）を採用することについての動機付けがあるものと認めることはできないから、甲1及び技術常識ないし周知技術に基づいて、当業者が上記構成を容易に想到することができたものと認めることはできない。』

取消事由2-1（甲2発明を主引用例とする本件発明1の進歩性判断の誤り）

『しかしながら、甲2には、甲2発明の製薬組成物に含まれるセレコキシブについて、粉碎により微細化したセレコキシブを用いることや、その微細化条件を「セレコキシブのD₉₀粒子サイズ」で規定することについての記載も示唆もない。

また、特定の大きさよりも小さい粒子サイズの粒子が効果を奏する粉体の場合には、その粒度分布を、平均粒子径ではなく、「所望の大きさよりも小さい粒子サイズの粒子が粉末全体に占める割合」で特定することは、本件優先日当時、医薬品の原料粉末では一般的であったことを認めるに足りる証拠はないことは、前記2（2）イのとおりである。

そうすると、甲2に接した当業者において、甲2発明の製薬組成物において、経口吸収性（生物学的利用能）の改善及び薬効成分の含量均一性の改善のために、薬効成分のセレコキシブの粒子サイズを小さくすることに思い至ったとしても、セレコキシブの微細化条件として「粒子の最大長において、セレコキシブ粒子のD₉₀が200μm未満である粒子サイズの分布を有する」との構成（相違点1-2に係る本件発明1の構成）を採用することについての動機付けがあるものと認めることはできないから、甲2及び技術常識ないし周知技術に基づいて、当業者が上記構成を容易に想到することができたものと認めることはできない。』

[コメント]

本判決では、D₉₀という粒度分布で特定した製薬組成物において、医薬品の原料粉末では一般的であることが認められず、進歩性が肯定されている。本事件のように、当業者的には一見容易想到にも思われる発明特定事項であっても動機付けの立証が難しい場合もある。

また、本件特許に対しては、サポート要件欠如とされた別訴（平成30年（行ケ）第10110号等）があり、特許庁に差し戻されている。

以上
(担当弁理士：東田 進弘)