

～～～～～～～～～～～～～～～～～～～～  
**\* \* ユニード国際特許事務所 \* \***  
**News Flash 2001年6月30日**  
～～～～～～～～～～～～～～～～～～～～

向夏の候、貴社ますますご清祥のこととお喜び申し上げます。平素は格別のご高配を賜り、厚くお礼申し上げます。今月の判例紹介です。

本件は、本年5月14日に東京地裁で判決のあったぶるスタグランジン類の医薬用途発明(眼圧降下剤・緑内障治療薬)に関する特許の均等論を争った事件です。

**PG 眼圧降下剤特許事件**

H13.5.14 東京地裁判決

平成 11(ワ)16175

侵害差止請求事件

原告 上野製薬

代理人：田倉整、片山英二、小田島平吉他

被告 ファルマシア(株)、ファルマシア&アップジョン Inc. 他

代理人：大場正成、尾崎英男、嶋末和秀、谷義一他

裁判官：(長)飯村敏明、石村智、沖中康人

判決要旨：原告の被告ファルマシア(株)に対する請求は理由がないので棄却。被告ファルマシア&アップジョン Inc 他に対する請求は不適法であり却下。

**1. 原告発明**

発明の名称：「眼圧降下剤」

出願日：1988年9月14日

登録日：1994年7月27日

登録番号：特許第1858208号

**特許請求の範囲：**

13,14-ジヒドロ-15-ケト-プロスタグランジンA類、B類、C類、D類、F類及びJ類からなる群から選ばれるプロスタグランジン類を有効成分として含有することを特徴とする眼圧降下剤又は緑内障治療薬

**2. 争点**

1) 文言侵害 被告製品ラタノプラスト(13,14-ジヒドロ-17-フェニル-18,19,20-トリノル-PGF<sub>2</sub>-イソプロピルエステル)は13,14-ジヒドロ-15-ケト-プロスタグランジン類に該当するか？

2) 均等性 両者は均等物か？

3) 国際裁判管轄権 被告ファルマシア&アップジョン Inc に対する訴えにつき国際裁判管轄を有するか？

**3. 各主張と判決**

**1) 文言侵害**

**(1) 原告の主張**

化学構造の同一性：両者の差異は15位の水酸基(被告)とケト基(原告)であるがこれは極めて似通っており殆ど同一である。

作用効果の同一性：両者において主作用に優位の差はない。

作用機序の同一性：被告製品は生体投与された場合、少量ではあるが15-ケト-ラタノプロスト酸に代謝され、これは微量でも眼圧降下作用をもつので実質的に同一の作用機序で薬効を発揮する。

**(2) 被告の主張(省略)**

**(3) 判決 (原告主張いずれも認めず)**

化学構造の同一性：化学物質において、その化学構造から性質を予測することができない場合も多く、化学構造にわずかな相違があっても、異なる性質を有する例の多いことは経験則に照らして明らかである。特に、薬物の作用については、化学構造に強く依存し、化学構造が僅かに異なる

ただけでも、薬理作用の異なる場合が多い。化学構造上の相違が僅かであるという、被告化合物が、本件発明の化合物と同一と評価することはできない。

作用効果の同一性：いずれの証拠も、実験系に不備があり、両者の作用効果が同一とは判断できない。

作用機序の同一性：眼圧降下作用が代謝生成された15-ケト-ラタノプロスト酸の主たる寄与であると解することは出来ない。

**2) 均等性**

**(1) 原告の主張**

本質的部分：15-ケト-プロスタグランジン類に眼圧降下作用があることは既に知られていた。その中で15-ケト-プロスタグランジン類を含む公知のプロスタグランジン類の薬理作用の改善のために、本件発明では、13,14位を単結合とした代謝物すなわち13,14-ジヒドロ体を選択し、発明を完成させた。よって、本件発明の本質的部分は、13,14-ジヒドロ体を選択した点にある。

置換可能性：両物質は眼圧降下能及び一過性眼圧上昇の副作用のないことにおいて同等であり、構造的にも酸化還元関係にあることから本発明化合物を被告製品の有効成分に置き換えることは可能である。

置換容易性：PGの15位の水酸基は生体内代謝でケト基に変わることで、15位のケト基が還元されると活性が上昇すること、15位水酸基のPGF<sub>2</sub>が高い眼圧降下作用を有すること、15位ケト基のPGF<sub>2</sub>もわずかだが眼圧降下作用を有することが公知であったから、15位ケト基の本件発明に接した者は15位水酸基に置換した被告化合物も同様の薬効を発揮すると容易に想到しえた。

**(2) 被告の主張(省略)**

**(3) 判決**

本質的部分：本件明細書の記載によれば、ヒト又は動物の代謝物として存在が知られPG類の有する種々の生理活性を殆ど示さない13,14-ジヒドロ-15-ケト-PG類が眼圧降下作用を示すこと及びPG類が示す一過性の眼圧上昇等の副作用がないことを見出し、その成果を基礎に「13,14-ジヒドロ-15-ケト-PG類」を有効成分とする眼圧降下剤又は緑内障治療剤としたことが本発明であり、本件発明の課題解決を基礎付ける特徴的な部分である。

本件発明は、有効成分として単一の化合物(群)からなる「眼圧降下剤」ないし「緑内障治療薬」の発明であるから、有効成分を構成する化合物そのものが発明における課題解決の特徴部分(本質的部分)であって、化合物の構造の一部である「13,14-ジヒドロ」部分のみを発明の特徴部分というべきではない。かくして被告製品の有効成分は原告発明化合物と比較して、15位がケト基(=O)ではなく、水酸基(-OH)である点において、本件発明の本質的部分において相異なる。

置換可能性：作用効果の同一性の証拠は示されておらず本件発明化合物を被告製品の有効成分に置換えることは可能であると出来ない。

置換容易性：15位の水酸基が眼内代謝でケト基に変化することの証拠はない。PGF<sub>2</sub>は15位がケト基も水酸基も一過性眼圧上昇の副作用をもつことから、本件特許化合物の15位のケト基を水酸基に変えることは容易に想到し得ない。

**3) 国際裁判管轄権**

原告は、被告ファルマシア・インクが、被告ファルマシアの100パーセント親会社であること、被告ファルマシア・アクチュエボラークが、同ファルマシアと同一グループに属し、スウェーデン国内において「被告製品：ラタノプロスト」についての基礎開発をしたり、これを製造して、日本へ輸出したりしていることから、不法行為地としての裁判籍を認めるべきであると主張する。

しかし、被告ファルマシアは我が国において法人格を取得し独自の法的責任下で経済活動を行っていること、その販売額は原告の主張によれば被告製品だけでも年間約100億円に上り営業活動の規模は決して小さいとはいえないこと、被告ファルマシアの法人格が形式的・形骸化しているとはいえないこと等の事実を鑑みれば、親会社の関係にあるというだけの理由（被告ファルマシア・インク）や外国において製造行為をしたことやグループの一員であるというだけの理由（ファルマシア・アクチェボラーク）で、我が国内に経営基盤を有しない同被告らに対して、過大な負担を強いる結果となる我が国における応訴を強要することは、正に当事者間の公平、裁判の適正・迅速を期するという理念に反する。

よって同被告らに対する訴訟事件について、不法行為地としての裁判籍を肯定するのは妥当でない。

#### 4. コメント

P G類化合物における15位の置換基の差異（水酸基かケト基）における均等性が論じられた。

同様のケースとしてPGF2の1-5Cアルキルエステルの物質特許でも本質部分が構造の一部であるアルキルエステル化による眼圧降下作用の促進が発明の本質部分であるとの原告の主張が否定（東京地裁、東京高裁）された。

本件でも原告の主張する13,14-ジヒドロ体という部分の選択が発明の本質であるとの言い分は否定され、化合物全体を発明の本質であると認定し、両者は本質部分において差異を有すると判断した。

物質特許及び医薬用途特許にあつては、その化合物全体が発明の本質と認定されてしまえば、置換基における変異では均等論を持ち込むことは困難になる。クレイムの記載、明細書の記載にあつては、化合物全体が発明の本質ではなく、特徴部分はこの部位にありますと積極的な説明、権利請求を試みる必要があるようである。

（担当 弁理士 庄司 隆）