

70メックス結晶型侵害事件

今回は、平成22年4月15日大阪地裁判決言渡し、結晶物質の文言侵害可否と結晶性残渣に対する結晶の進歩性の判断事例です。

大阪地裁 特許権侵害差止等請求事件

平成21年(ワ)第2208号 平成21年(ワ)第12412号

原告：塩野義製薬株式会社 代理人：弁護士重富貴光，古賀大樹，定金史朗

被告：A：伊藤忠ケミカルフロンティア(株) B：沢井製薬(株)

被告ら訴訟代理人：弁護士新保克芳、高崎仁、洞敬、井上彰

地裁判決主文：原告の請求をいずれも棄却。訴訟費用は、原告負担。

裁判官：大阪地裁第26民事部 裁判長裁判官山田陽三、達野ゆき，北岡裕章

1. 本件発明

原告の特許権

日本出願：1991年3月25日(特願平3-60137)

登録日：1999年7月30日

特許番号 第2960790号

発明の名称 経口投与用セファロsporin水和物結晶

特許請求の範囲【請求項1】

下表のX線回折像を示す(要件A)7-[Z]-2-(2-アミノアザール-4-アザール)-2-アザールアミノ-3-カバールモルホリン-3-セフェム-4-カバール酸ピロリドリン塩酸塩一水和物(要件B)の結晶(要件C)

【表1】

表1 X線解析像データ(パラメータ)

対象：特定の物質特許(化合物の結晶型の特許)

2. 原告製品

原告は、本件特許に基づき、本件セフェム塩酸塩水和物を有効成分とする抗生剤「70メックス」を製造販売している。

3. 被告各製品

被告製品1：被告Aは、韓国法人 Yungjin Pharmaceutical Co., Ltd 製造に係る被告製品1を、業として輸入し、70メックスの後発医薬品を製造販売することを予定している医薬品メーカーに対し、販売する計画を有している。

被告製品2ないし4：被告Bは、被告Aから被告製品1の供給を受けて、本件セフェム塩酸塩水和物を有効成分とする、70メックスの後発医薬品を製造販売する計画を有し、「被告製品2」、「被告製品3」について製造、販売を開始し、「被告製品4」について製造販売承認を取得した。

被告各製品は、いずれも、本件発明の構成要件B・Cを充足する。

4. 争点

(1)特許権の侵害

ア 被告各製品は、本件発明の構成要件Aを充足するか(争点1)

イ 本件特許権は、下記の無効原因を有しており、特許無効審判により無効にされるべきものか(争点2)

新規性欠如(平11年法律第41号による改正前の特29条1項1号)あるいは進歩性欠如(同2項)(争点2-1)

明細書記載不備(平6年法律第116号による改正前の特36条5項2号〔以下「改前特36条5項2号」という。〕)(争点2-2)判決なし。

(2)原告の損害(争点3)判決なし。

5. 裁判所の判断

1)争点1

(1) 構成要件Aの文言が示す技術的範囲

本件発明の構成要件Aは、「下表のX線回折像を示す」であり、本件発明が示すX線回折像として、30のピーク(回折角と強度)が記載されている。【表1】は、X線回折像そのものではなく、X線回折測定の結果現れたピークの回折角と強度を示したものである。物質のX線回折像中には、強度や形状の異なる多くのピークが存在するところ、その中で、当該物質を特許出願するにあたり、個々のピークをクームするか、何個のピークをクームするか、どの回折角をクームするか、強度までクームするか、数値を記載するか、数値に幅を持たせるかなどは、出願人の判断に委ねられている。出願人である原告は、本件発明について、X線回折像そのものではなく、それを形成する30のピーク(回折角と強度)を個別に特定して、特許請求の範囲を示すために必要な要素と判断して抽出し、これが最終的に特許請求の範囲として登録されるに至った。

構成要件Aの「下表のX線回折像を示す」とは、結局、本件発明のX線回折像の中に、本件【表1】の30のピークが全て存在することを意味すると解される。

(2) 被告製品1のX線回折測定結果

本件においては、訴訟係属中に、当事者間の合意に基づき、日立協和により、被告製品1について、それぞれ白金メーター及びガラスメーターを使用したX線回折測定が行われた。

その測定結果からは、次の事実が認められる。

被告製品1(物質)自体は、そのX線回折像に、本件構成要件Aの15番目と24番目の2つのピークに対応するピークを有していない。文言解釈を前提にすれば、被告製品1は、他の28ピークの回折角や強度について判断するまでもなく、本件発明の構成要件Aを充足しない。

(3) 本件2つのピークの由来

本件2つのピークは、白金メーターピークであるとしても説明が困難でなく、かつ、検出の原因として、白金メーターの使用以外には考えにくいから、白金メーターピークであると考えのが合理的である。本件2つのピークは、本件発明の特定のためには余分な事項であるが、それにもかかわらず、特許請求の範囲に、その回折角及び強度が記載されていることになり、特許請求の範囲中、本件2つのピークに係る記載は、事後的・客観的にみれば、誤った記載というべきである。誤記のなかには、特許法上の訂正審判や訂正の請求による訂正を待つまでもなく、誤記であることを前提として、特許請求の範囲を解釈することができる場合も存在するが、本件2つのピークの記載は、単なる誤記(表記上の誤り)とは性格を異にする。

本件特許出願に際し、原告は、本件2つのピークが本件セフェム塩酸塩一水和物結晶のピークであると信じ、特許請求の範囲として表示のとおりをクームしているのであって、後に、その信じていたところが誤りであったことが判明したに過ぎないと認めるのが相当である(原告が本件2つのピークが本件セフェム塩酸塩一水和物結晶のピークではなく、白金メーターのピークであると認識していたのであれば、その旨を本件明細書に記載したはずである)。出願時において要件とした事項であっても、後に、実際には不要であったことが判明することは、一般に生じ得る事態であるが、特許請求の範囲の記載を前提とする第三者の行為は、このような出願人の調査不足や不注意によって規制されるべきではない。

(4) 全体的なパターンによる構成要件充足の判断の可否(原告の主張)

原告は、本件発明のような結晶に係る特許請求の範囲を解釈するにあたり、特許請求の範囲にX線回折像が記載されている場合は、個々のピークではなく、特許請求の範囲に記載されたX線回折像の全体的なパターンを考慮して、これと全体的なパターンが一致するX線回折像を示す結晶を技術的範囲に含むと理解すべきであるところ、被告製品1のX線回折像の全体的なパターンは、特許請求の範囲のX線回折像のそれと一致すると主張する。

特許発明の技術的範囲は、願書に添付した特許請求の範囲の記載に基づいて定めなければならないところ（特許法70条1項）、化学の分野において、一般に、結晶構造の同一性判断が、X線回折の全体的なパターンを比較する方法で行われていたとしても、原告が「全体的なパターン」を特許請求の範囲において明らかにしなかった以上、本件発明の技術的範囲を「全体的なパターン」を基準に定めることはできない。

(5) 本件2つのピークの由来に係る認識可能性（原告の主張）
被告ら（当業者）が、本件2つのピークの由来が、白金剤がピークであることを容易に認識できたとはいえない。

(6) 本件2つのピークに係る当業者の一般的認識（原告の主張）
構成要件Aに記載された本件2つのピークが、本件エシル塩酸塩一水和物結晶のピークではないと容易に気づいて、特許請求の範囲から本件2つのピークを除外して理解するのが通常であるとはいえない。

(7) 結論
被告各製品は、本件発明の構成要件Aを充足しない。

2) 争点2-1（新規性欠如あるいは進歩性欠如）について

(1-1) 乙13（日本薬学会講演要旨集）
本件エシル塩酸塩及びその製法は、乙13により、本件特許出願日以前において公知であった。

(1-2) 乙14（特許公報）
乙14には、本件エシル及び製造方法が開示されているといえる。乙14には、本件エシル塩酸塩及びその製法が開示されており、当業者であれば、乙14から本件エシル塩酸塩を製造することができる。乙14の実施例6（酸付加塩）の2）には、次のとおり、塩酸化の過程で、結晶性残渣が得られることが記載されている。

「[塩酸塩] 7-[(Z)-2-(2-t-ブトキシカルボニルアミノ) 4-イル]-2-ペンテニル]アミノ-3-フェニル-4-カルボキシル] 250mg をアニソール2ml とトリフルオロ酢酸2ml にとかし、室温で150分間かきまぜたのち、濃縮する。残渣に炭酸水素Na水を加えて酢酸エチルで抽出する。抽出液をシリカゲルカラムで精製すれば、77-[(Z)-2-(2-アミノ) 4-イル]-2-ペンテニル]アミノ-3-フェニル-4-カルボキシル] 250mg を得る。これをジクロロメタンにとかし、塩化水素の酢酸エチル溶液を加えて濃縮する。結晶性残渣をエチルで洗えば上記エシルの塩酸塩を得る。」

ここに具体的に記載されたエシルの塩酸塩は、本件エシル塩酸塩と構造が極めて類似しており（R中のOHが加水分解されているか否かのみ相違である。）、その残渣が「結晶性」であることから、本件エシル塩酸塩の残渣も「結晶性」であるといえる。

本件エシル塩酸塩の結晶性残渣及びその製法は、乙14により公知であったといえる。

(3) 本件発明の新規性
本件発明は、本件エシル塩酸塩一水和物結晶であり、次項(4)の相違点を有するから、新規性を欠如していない。

(4) 本件発明の進歩性

結晶性残渣という点において、本件発明との相違の程度がより少ない乙14に開示の本件エシル塩酸塩の結晶性残渣発明と、本件発明との相違点

ア) 一致点及び相違点
本件エシル塩酸塩一水和物結晶である本件発明と本件エシル塩酸塩の結晶性残渣発明とは、本件エシル塩酸塩である点において一致し、前者は結晶であるが、後者は結晶性残渣である点、前者は一水和物であるが、後者はこの点が明らかでない点において相違する。

イ) 相違点 について
本件エシル塩酸塩一水和物の結晶は、粗製の本件エシル塩酸塩をメタノールと水の混合溶媒から再結晶する方法により製造される。

結晶化の試み及び溶媒の選択について
医薬品の分野において、「結晶性」との知見が得られれば、当業者であれば、当然に結晶化（再結晶）を試みるといえる、結晶化についての動機付けは存在する。

本件エシル塩酸塩の結晶性残渣は、合成により得られた化合物には不純物が含まれており、これを精製するために再結晶することは、一般的な手法である。「結晶性残渣」との記載があれば、通常は、再結晶にまで思い至るといえる。結晶化溶媒のわからない新規化合物については、まずは、いくつかの単一溶媒で結晶化を試み、ここで適当な溶媒が見つからなかった場合は、混合溶媒での結晶化を試みることになる。メタノールと水の混合溶媒は、混合溶媒の代表的なものである。

本件エシル塩酸塩の結晶性残渣を希メタノールにより再結晶して本件エシル塩酸塩の結晶を得ることは、当業者にとって容易想到であった。最適な析出条件について

本件は、本件エシル塩酸塩の結晶を得ること自体が容易想到であったが問題となっており、そのための最適な析出条件は問題となっていない。

ウ) 相違点 について
本件エシル塩酸塩の結晶は、高温状態に置いて無水物結晶としない限りは、一水和物結晶の状態にあるといえる。本件エシル塩酸塩一水和物結晶が1種類しかないことは原告自身が主張し、立証するところであるから、前記イの工程により得られた本件エシル塩酸塩の結晶は、本件エシル塩酸塩一水和物の結晶であるといえる。

相違点 は、本件発明と本件エシル塩酸塩の結晶との相違点となるべきものではないと認められる。

エ) 結論
本件発明は、乙14により当業者が容易に発明をすることができたものというべきであって、本件特許は、進歩性欠如の無効理由があり、特許無効審判において無効にされるべきものと認められる。

3) まとめ
前記1のとおり、被告各製品は、本件発明に係る技術的範囲に属さない。また、前記2のとおり、本件特許は特許無効審判により無効にされるべきものであるから、特104条の3第1項により、原告は被告らに対し、本件特許権を行使することができない。

コメント：出願実務において、X線回折データを請求項要件とする場合の特定における留意点を再確認させられる。回折像も請求項にいれておくこと。実体は同じ物質であるのに、錯誤により要素とされたパラメータの違いにより文言侵害が排除された。あとは白金剤による数値を、意味のない数字として均等論はむりなのだろうか？製法の容易性のみから進歩性を否定されたが、物質特許としての完全な戦いはされていない。少し、物足りなさを感じる事例である。
中筋吉吉、庄司隆、大杉卓也