

「ビタミンD及びステロイド誘導体の合成中間体製造法」侵害事件（東京地裁判決）

本事件は、製法発明における出発原料のシス体とトランス体の差異についての均等論適用の可否があらそわれ、均等侵害が認められた。

平成 25 年（ワ）第 4040 号 特許権侵害差止請求事件

（平成 26 年 12 月 24 日判決言渡、口頭弁論終結日 平成 26 年 9 月 12 日）

原告：中外製薬株式会社

（弁護士 尾崎英男他）

被告：DKSH ジャパン株式会社他

（弁護士 新保克芳他）

判決：原告勝訴判決（原告の均等主張が認められた）

訴訟費用は、被告の負担とする。

裁判官：東京地裁民事 29 部

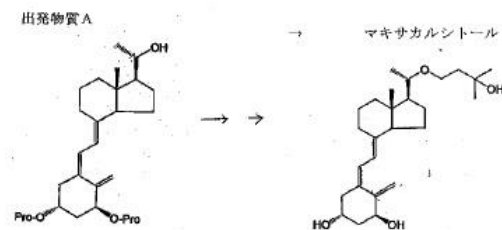
裁判長 嶋末和秀、裁判官 鈴木千帆、西村康夫

1. 事件の概要

発明の名称 ビタミンDおよびステロイド誘導体の合成用中間体およびその製造方法

特許番号 第 3310301 号、出願日 平成 9 年 9 月 3 日（特願平 10-512795）（優先権平 8.9.3US） 登録日 平 14.5.24

特許請求の範囲：下記のビタミン D 誘導体のシス体を出発物質とするマサキカルシトールの製造方法（詳細省略）（特徴は、第一段階反応でエポキシド化合物を作り、第二段階でエポキシ環を開環する）



2. 本件の争点

被告方法は本件発明と均等なものとして技術的範囲に属するか（均等要件の充足性）、本件発明は無効か、差止の必要性が争われたが、本紹介では均等問題のみを対象とした。被告方法と本件発明の差異は、本件発明では、出発物質 A（シス体）から全工程をシス体構造で進め、最終産物（マサキカルシトール）を得るのに対し、被告方法では、出発物質 A が、シス体ではなくトランス体であり、最終工程までの全工程をトランス体構造で進め、最終工程でトランス体をシス体に転換して最終産物（マサキカルシトール）を得ることである。

3. 裁判所の判断

結論：被告方法は本件発明と均等なものとして技術的範囲に属する。

1) 争点 1（均等第一要件：差異が本質的部分でない）

本件発明は、出発物質（構成要件 B-1）と本件試薬を塩基の存在下で反応させて中間体のエポキシド化合物（構成要件 B-3）を製造し（以下「第 1 段階の反応」という。）、同エポキシド化合物を還元剤で処理して（エポキシ環を開環して）、マサキカルシトールを得る（構成要件 C。以下「第 2 段階の反応」という。）ことからなる。

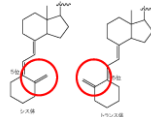
本件発明の効果は、従来技術に比して、マサキカルシトールを含む本件発明の目的物質を製造する工程を短縮できるという効果を奏するものと認められる。

本件発明が工程を短縮できるという効果を奏するために採用した課題解決手段を基礎付ける重要な部分（本件発明の本質的部分）は、ビタミンD構造又はステロイド環構造を有する目的物質を得るために、かかる構造を有する出発物質に対して、構成要件 B-2 の試薬を塩基の存在下で反応させてエポキシド化合物を製造し（第 1 段階の反応）、同エポキシド化合物を還元剤で処理する（エポキシ環を開環する）（第 2 段階の反応）という 2 段階の反応を利用することによ

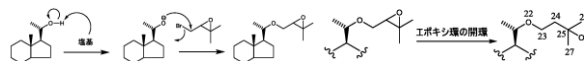
り、所望の側鎖（マサキカルシトールの側鎖）を導入するところにある。

被告らは、出発物質がビタミンD構造の場合、シス体を用いることと構成要件 B-2 の試薬（本件試薬を含む。）を用いることの組合せが本件発明の特徴であり、出発物質がシス体であることも、本件発明の本質的部分である旨主張する。

ビタミンD類の基本的な骨格は上部の二環から繋がる 3 つの二重結合「トリエン」があり、この「トリエン」は、二重結合部分では結合を軸として回転することができないため、ビタミンD類には、このトリエン構造に由来する幾何異性体が下図に示すように 2 つ存在する。



ビタミンD構造の出発物質がシス体であっても、トランス体であっても、第 1 段階の反応で、出発物質の 2 2 位の OH 基に塩基の存在下で本件試薬と反応させてエポキシド化合物を合成する下図のような反応に変わりはなく、第 2 段階の反応で、エポキシ環を開環してマサキカルシトールの側鎖を導入する下図のような反応にも変わりはなく。



被告方法は、ビタミンD構造の出発物質に本件試薬を使用し、第 1 段階の反応と第 2 段階の反応という 2 段階の反応を利用している点において、本件発明と課題解決手段の重要部分を共通にするものであり、出発物質及び中間体がシス体であるかトランス体であるかは、課題解決手段において重要な意味を持つものではない。

以上から、目的物質がビタミンD構造の場合において、出発物質及び中間体がシス体であるかトランス体であるかは、本件発明の本質的部分でないというべきであり、被告方法は、均等の第 1 要件を充足する

2) 争点 2（均等第二要件：置換可能性）

本件発明によるマサキカルシトールの製造方法は、従来技術に比して工程を短縮できるという効果を奏するものと認められる。

被告方法は、ビタミンD構造の出発物質に本件試薬を使用し、第 1 段階の反応と第 2 段階の反応という 2 段階の反応を利用している点において、出発物質及び中間体をシス体からトランス体に置き換えても、従来技術に比して工程を短縮できるという本件発明の目的を達することができ、本件発明と同一の作用効果を奏するものと認められる。

被告らは、出発物質がトランス体である被告方法では、トランス体の物質 D をシス体に転換する工程 III が不可欠であり、その分だけ、シス体から出発する本件発明の場合より工程数が多く、また、その結果、収率が低下することが不可避であるので、被告方法は、製造工程の短縮という本件発明の効果を奏しない、と主張する。しかし、被告方法の工程 III においてトランス体をシス体に転換する工程を加味しても、最終的な工程数は従来方法よりも改善されていると認められるから、被告方法が本件発明と同一の作用効果を奏しないとはいえない。

なお、原告は、均等の第 2 要件の判断において、本件発明の構成要件に対応しないトランス体からシス体への変換工程は考慮の対象でない旨主張しているが、被告方法の工程 I, II のみと本件発明とを対比すると、被告方法の工程 I, II ではトランス体の物質 D が得られるにすぎず、医薬品の有効成分として有用なシス体のマサキカルシトールを得ることはできないのであるから、本件発明と同一の作用効果を奏しないことが明らかであり、本件発明と対比すべきは被告方法の全部でなければならない。

以上から、被告方法は、本件発明と同一の作用効果を奏しており、

被告方法は、均等の第2要件を充足する。

3) 争点3 (均等第三要件：置換容易性)

所望のビタミンD誘導体を製造するに際し、トランス体の化合物を出発物質として、適宜側鎖を導入し、シス体のビタミンD誘導体を得る方法は、本件優先日当時、既に当業者の知るところであった。

そうすると、本件発明を知る当業者は、被告方法実施時点において、本件発明におけるビタミンD構造の出発物質をシス体からトランス体に置き換え、最終的にトランス体の物質Dをシス体に転換するという被告方法を容易に想到することができたものと認められる。

被告らは、物性や化学的性質が異なるトランス体でも本件発明と同様に側鎖が導入できるかは不明であり、ましてその収率は不明であるから、当業者は置換を容易に想到できないと主張する。

しかし、マキサカルシトールの側鎖の導入に際して反応する第2位のOH基は、トランス体とシス体とで構造が異なる二重結合の位置から遠く、これら二重結合の位置によってマキサカルシトールの側鎖の導入過程の反応が異なるとは考え難いから、当業者は、シス体のビタミンD構造の化合物を出発物質とした場合であっても、本件発明と同様に、マキサカルシトールの側鎖の導入が可能であると認識し、トランス体とシス体の置換を容易に想到できるものと認めるのが相当である。

以上から、当業者は、被告方法の実施時点において、本件発明の出発物質及び中間体をトランス体からシス体に置き換えることを容易に想到できたものというべきであり、被告方法は、均等の第3要件を充足する。

4) 争点4 (均等第四要件：容易想到性の否定)

被告らは、被告方法は、乙4発明を中心とする本件優先日時点における公知技術に基づいて、容易に推考できたものであると主張する。

(相違点1) 被告方法では、4-プロモ-2,3-エポキシ-2-メチルブタン(本件試薬)により側鎖を導入し、本件試薬により導入されたエポキシ環を開環しているのに対し、乙4発明では側鎖導入試薬は式Z-R³で示される試薬であり、試薬がエポキシ基を含まず、試薬で導入されたエポキシ環を還元剤で処理して開環する工程についても開示がない点。

(相違点2) 被告方法の目的物質はマキサカルシトールであり、導入される側鎖の炭素原子数が5であるのに対して、乙4発明の目的物質は、導入された側鎖の炭素原子数が7~12であり、マキサカルシトールではない点。

公知文献に接した当業者は、乙4発明の出発物質を出発物質とし、乙3の2の製造例11と同様の方法により出発物質の22位のOH基を置換し、続いて乙3の2の製造例12と同様の方法により側鎖をマキサカルシトールの側鎖に置換し、最後にトランス体からシス体に転換する方法によりマキサカルシトールを製造する方法を、容易に推考できるといえる。

しかし、これと異なり、本件試薬を用いて出発物質の22位のOH基をエポキシ化し、続いてエポキシ環を開環してマキサカルシトールの側鎖を導入し、最後にトランス体からシス体に転換してマキサカルシトールを製造するという方法については、乙4の2、乙3の2には何らの記載も示唆もない。

本件試薬自体は公知であった(乙9)が、乙9記載の試薬をマキサカルシトールの製造に使用することは、乙4の2にも、乙9にも、本件訴訟に書証として提出された他の公知文献にも、記載されておらず、その示唆もない。そうすると、上記のとおり、乙4発明をマキサカルシトールの製造に応用することを想到した当業者においても、乙9記載の試薬を乙4発明と組み合わせて被告方法を推考する動機付けがあるとはいえないので、相違点1は、当業者において容易に推考できるものとはいえない。

以上から、被告方法は、被告ら主張の公知技術から容易に推考できたものとはいえない。

5) 争点5 (均等第五要件：禁反言)

被告らは、本件発明のうち、出発物質がビタミンD構造の場合には、出発物質がシス体に意識的に限定されたものとみるべきである旨主張する。

本件明細書には、「シス体」、「トランス体」、「5E」、「5Z」といった、シス体とトランス体の区別を明示する用語は使用されておらず、トランス体を用いる先行技術との相違によって、本件特許が登録されるに至ったような事情も見当たらない。本件発明において、出発物質及び中間体がビタミンD構造の場合に、シス体に意識的に限定したとか、トランス体を意識的に除外したとまでは認められない。

被告らは、明細書に他の構成の候補が開示され、出願人においてその構成を記載することが容易にできたにもかかわらず、あえて特許請求の範囲に特定の構成のみを記載した場合には、当該他の構成に均等論を適用することは、均等論の第5要件を欠くこととなり、許されないと解するべきで、本件特許の出願人であるコロンビア大学及び原告において、出発物質をシス体に意識的に限定したものである旨主張する。

しかし、本件明細書に引用された文献の内容においてトランス体とシス体を区別していたとしても、本件明細書の本文においてトランス体とシス体を明確に区別した記載がないことは上記のとおりであり、出願人らが出発物質をシス体に意識的に限定した根拠となるものではない。目的物質がシス体であるからといって、出発物質もシス体でなければならぬわけではなく、出願人らが出発物質を意識的に限定した根拠となるものではない。トランス体の出発物質からシス体の目的物質を得る方法は公知であったが、本件明細書にそのような他の構成の候補が開示されていたわけではないから、出願人らにおいて出発物質にトランス体を記載しなかったからといって、出発物質をシス体に意識的に限定したとまではいえない。

対象製品等に係る構成が、特許出願手続において特許請求の範囲から意識的に除外されたというには、出願人又は特許権者が、出願手続等において、対象製品等に係る構成が特許請求の範囲に含まれないことを自認し、あるいは補正や本件により当該構成を特許請求の範囲から除外するなど、対象製品等に係る構成を明確に認識し、これを特許請求の範囲から除外したと外形的に評価し得る行動がとられていることを要すると解すべきであり、特許出願当時の公知技術等に照らし、対象製品等に係る構成を容易に想到し得たにもかかわらず、そのような構成を特許請求の範囲に含めなかったというだけでは、対象製品等に係る構成を特許請求の範囲から意識的に除外したというとはできないといえるべきである。

R体-S体の立体異性(鏡像異性)とシス体-トランス体の立体異性(幾何異性)とは性質が異なるものであるから、本件明細書においてR体とS体の区別を前提とする記載があるからといって、出発物質をシス体に意識的に限定した根拠となるものではない。

被告らの指摘する図がトランス体を意識した記載であると認めるに足りる証拠はなく、SO₂の付加により保護されたビタミンD構造について2種類の図(トランス体とシス体ではなく、同一の構造を回転させた図)を記載したからといって、出発物質をシス体に意識的に限定した根拠となるものではない。

以上から、本件において、出発物質をトランス体とする被告方法が本件特許の出願手続等において特許請求の範囲から意識的に除外されたものに当たるなどの特段の事情はなく、被告方法は、均等の第5要件を充足する。

4. コメント

被告方法は、シス体を使うことで何らかの有利な効果がなく、迂回発明、改悪発明に該当する。本判決では、このような発明に対する均等論適用に工夫がされており、妥当な判決であると考えられる。

担当：中筋、庄司、大杉



特許業務法人ユニード国際特許事務所