

～進歩性判断における「効果」の考え方～

最判令和元年8月27日平成30年（行ヒ）第69号
「アレルギー性眼疾患治療薬事件」

知的財産権法研究会
弁護士 中務 尚子

第1 事案の概要

本件は、「アレルギー性眼疾患を処置するためのドキセピン誘導体を含む局所的眼科処方物」とする特許（特許第3068858号。以下「本件特許」といい、本件特許に係る発明を「本件特許発明」という。）につき特許無効審判が請求され、その手続の経過において、進歩性の有無に関連して本件特許発明が予測できない顕著な効果を有するか否かが問題となった事案である。

原判決（知財高判平成29年11月21日平成29年（行ケ）第10003号）は、本件特許発明が有する効果を優先日当時の他の化合物の有する効果との比較で捉え、これを当業者にとって予測できない顕著なものとはいえないと判示したところ、本判決は、本件特許発明の効果が予測できない顕著なものか否かは、優先日当時に本件特許発明の構成が奏するものとして当業者が予測できなかったか否かという観点から検討しなければならないとして、原判決を破棄差戻した。

第2 本件特許及びその技術背景

1 本件特許

本件特許発明は、アレルギー性結膜炎などヒトのアレルギー性眼疾患を処置するための点眼剤として、オキセピン誘導体である「11-（3-ジメチルアミノプロピリデン）-6,11-ジヒドロジベンズ [b, e] オキセピン-2-酢酸」（以下「本件化合物」という。）を、ヒト結膜肥満細胞安定化の用途に適用する薬剤に関するものである。なお本件化合物は出願時において公知である。

本件は、後記第3記載の経過をたどっているが、本件訂正後の請求項1の記載は以下のとおりである。

「ヒトにおけるアレルギー性眼疾患を処置するための局所投与可能な、点眼剤として調製され

た眼科用ヒト結膜肥満細胞安定化剤であって、治療的有効量の11-（3-ジメチルアミノプロピリデン）-6, 11-ジヒドロジベンズ [b, e] オキセピン-2-酢酸またはその薬学的に受容可能な塩を含有する、ヒト結膜肥満細胞安定化剤。」

2 優先日当時の技術的な背景

(1) 抗アレルギー薬

本件特許発明及び本件における進歩性判断の理解の一助のため、その技術的な背景について説明すると、本件特許発明の属する技術的分野において、抗アレルギー薬とは、その作用機序によって、次の2つに大別される。

- ① 肥満細胞から産生・遊離される、ヒスタミンなどのアレルギー反応や炎症の発現に介在する化学伝達物質に対する拮抗作用を有する薬剤
- ② それらの化学伝達物質の肥満細胞からの遊離抑制作用を有する薬剤

ところで肥満細胞はヒスタミンを産生する細胞の一つである。また、上記①にいう「拮抗作用」とは、用語的には、ある現象に対して2つの要因が同時に働いて、互いにその効果を打ち消し合う作用のことである。

後記に述べる第2次審決の認定事実によると、上記①に該当することとなる抗ヒスタミン薬とは、「受容体との反応において重要と考えられる共通の分子構造（エチルアミン側鎖）をもつものであって、肥満細胞ではなく、放出されたヒスタミンに反応する細胞が有する受容体の拮抗剤という作用機序を有するものである。そして、ヒスタミンの産生あるいは代謝を有意に変えないというものであるから、肥満細胞におけるヒスタミン産生・代謝には変化を及ぼさないものである。しかも抗ヒスタミン効果は増加したヒスタミン活性が存在する時のみに明らかというのであるから、ヒスタミンの放出が増大している時にはじめて抗ヒスタミン効果が得られるということであり、ヒスタミンの放出抑制とは無関係である」とされている。

このように「抗ヒスタミン作用」を有する薬剤（上記の①に該当）と「ヒスタミン遊離抑制作用」を有する薬剤（上記の②に該当）はその作用機序が異なる。

そして本件特許発明は、その発明特定事項を「ヒト結膜肥満細胞安定化」とするものであり、本件特許の明細書の記載から、上記二つに大別される抗アレルギー薬のうち、上記の②に該当する薬剤に関するものである。

(2) 「肥満細胞の不均一性」

「肥満細胞の不均一性」とは、異なる肥満細胞によって、様々な化合物に対する反応性が異なることを指す。本件特許の明細書には、「齧歯類の肥満細胞のタイプが、ヒトの肥満細胞のタイプとは異なることは、現在十分に確立されている」こと、「種間および種内の両者の肥満細胞で認められるこれらの差異は、肥満細胞の不均一性と呼ばれる」こと、「異なる肥満細胞は薬理的薬剤に異なる応答を示す」ことが記載されている。

そのため、本件においては、モルモットやラットなどの肥満細胞とヒトの肥満細胞の反応性の差異やその程度、あるいは結膜肥満細胞と皮膚肥満細胞の反応性の差異やその程度が問題となった。