



精製組成物の発明の新規性
— 東京地裁平成20年11月26日判決—

弁護士 人見友美

1. 事案の概要

本件は、高純度アカルボースについての特許権を有する原告が、被告製剤を製造、販売する被告に対し、被告製剤は原告が特許権を有する特許発明の技術的範囲に属し、被告製剤を製造、販売する行為は原告の特許権を侵害するとして、特許法100条1項に基づき、被告製剤の製造及び販売の差止めを求めるとともに、同条2項に基づき、被告製剤の廃棄を求めた事案である。

アカルボースは、アクチノプラネス属のミノ糖産生菌を培養し、その発酵汁を濃縮・精製するという工程を経て生産されるものであり、人間の小腸のサッカラーゼ酵素複合体の阻害剤として活性を有することから、糖尿病の処置のための医薬品として用いられており、特開昭50-53593の公開特許公報(出願人原告、公開日昭和50年5月12日。以下「乙1文献」)により、開示されている。

2. 本件特許権

特許番号	第2502551号
発明の名称	高純度アカルボース
出願番号	特願昭61-292667
出願日	昭和61年12月10日
優先日	1985年12月13日(甲2。以下、「出願時」又は「出願前」との記載は、それぞれ「優先日時」又は「優先日前」を含むものとする。)
登録日	平成8年3月13日
延長期間	2年5月5日

➤ 構成要件

- A 水とは別に約93重量%以上のアカルボース含有量を有する
- B 精製アカルボース組成物

3. 被告製剤

被告製剤に含まれるアカルボース組成物のアカルボース含有量は、99.3~99.7重量%である。

4. 争点

- (1) 被告製剤は、本件特許発明の技術的範囲に属するか。
- (2) 本件特許は、特許無効審判により無効にされるべきものか。
 - ア 本件特許発明は、特開昭57-185298の公開特許公報(乙2。以下「乙2文献」という。)及び特開昭57-212196の公開特許公報(乙3。以下「乙3文献」という。)により新規性を欠くか。
 - イ 本件特許は、平成2年法律第30号による改正前の特許法36条3項(以下「旧36条3項」という。)又は昭和62年法律第27号による改正前の特許法36条4項(以下「旧36条4項」という。)に違反するか。
 - ウ 本件特許発明は、進歩性を欠くか。

5. 争点に対する判断(新規性に関するア、イについて)

(1) 本件特許発明について

本件特許発明は、「水とは別に約93重量%以上のアカルボース含有量を有する精製アカルボース組成物」を特許請求の範囲とするものであって、物の発明である。そして、本件明細書の発明の詳細な説明には、「アカルボースは人間の小腸のサッカラーゼ酵素複合体の阻害剤であり、糖尿病の処置のための薬剤に使用される。アカルボースはO-4, 6-ジデソキシ-4-[(1S, 4R, 5S, 6S) -4, 5, 6-トリヒドロキシ-3-(ヒドロキシメチル)-2-シクロヘキセン-1-イル-アミノ]- α -D-グルコピラノシル-(1 \rightarrow 4)-O- α -D-グルコピラノシル-(1 \rightarrow 4)-グルコピラノースである。阻害剤はアクチノプラネス(Actionoplanes)種の発酵によって得られ(略)、発酵汁から単離しなければならない。この目的のために精製法が記述されている(略)。これらの精製法において、アカルボースは、強酸カチオン交換体に結合し、塩溶液又は主に希酸で溶出せしめられる。」(3欄13行~30行)と記載され、従来技術である強酸カチオン交換体を用いた精製方法によって得られる「アカルボースは乾燥物質において78~88%のアカルボース含有量を有する(HPLC法)。これらの調製物は依然糖に対する着色反応を呈する二次成分約10~15%、灰分1~4%及びいくつかの着色成分の形で不純物を含有する。人間の薬剤に用いるには更に高程度の純度が必要である」(3欄30行~35行)ところ、このような精製方法により得られた予備精製物を、本件明細書に記載された弱酸カチオン交換体を用いた精製方法によって1段階精製することにより、「アカルボースの含有量は少なくとも90重量%に、好ましくは95~98重量%またはそれ以上に増加し、サルフェート化灰分は0~0.5%に減少し、そして糖様二次成分(sugar-like secondary component)は10重量%以下、好ましくは2~5重量%又はそれ以下に減少する。斯くして本発明は糖様二次成分を10重量%以下で含有するアカルボースに関する。糖様二次成分を2~5重量%含有するアカルボースは好適であり、そして本発明は特に好ましくは糖様二次成分を2重量%以下で含有するアカルボースに関する。」(3欄45行~4欄5行)と記載されている。そして、「組成物」とは、その厳密な定義はともかく、二種以上の成分からなるものであり(乙5参照)、前記のような本件明細書の発明の詳細な説明の記載からすれば、本件特許発明において「アカルボース組成物」という場合の

カルボース以外の他の成分は、糖様二次成分その他の不純物を対象としている（原告自身、アカルボース以外の成分は、不純物であることを認めている。）。

(2) 乙1文献、乙2文献、乙3文献及び乙12文献について

ア 公開特許公報である乙1文献に記載された当該特許発明は、「アミノ糖化合物の製造法、薬剤並びに薬剤入り食料及び飲料」を発明の名称とし、昭和49年9月19日に原告を出願人として特許出願がされ、昭和50年5月12日に公開されたものである。乙1文献には、特許発明の実施例として、68,000SIU/gの化合物を得たことが記載されており（22頁右上欄10行～12行）、当該化合物は、アカルボースと認められるが、その純度は記載されていない（乙1）。

イ 公開特許公報である乙2文献に記載された当該特許発明は、「アミノサイクリトール誘導体」を発明の名称とし、昭和57年5月4日に原告を出願人として特許出願がされ（優先権主張は、1981年5月5日）、昭和57年11月15日に公開されたものである。乙2文献には、比較例として用いられたアカルボースに関して、次の及びの記載があるが、その精製方法や純度は記載されていない（乙2）。

ウ 公開特許公報である乙3文献に記載された当該特許発明は、「飽和したアミノシクリトール誘導体」を発明の名称とし、昭和57年6月11日に原告を出願人として特許出願がされ（優先権主張は、1981年6月13日）、昭和57年12月27日に公開されたものである。乙3文献には、実施例1中の比較例として次の記載があるが、その精製方法や純度は記載されていない（乙3）。

エ 公開特許公報及び特許公報である乙12文献に記載された当該特許発明は、「グリコシド水解酵素抑制剤の新規薬剤調製物」を発明の名称とするものであり、昭和57年9月1日に原告を出願人として特許出願がされ（優先権主張は、1981年9月1日）、昭和58年3月17日に特許公開され、平成7年5月1日に特許公告がされたものである。乙12文献には、当該発明と関連するアカルボースに関して、それぞれ次の記載があるが、いずれもその精製方法、純度及びサッカラーゼ阻害活性は、記載されていない（乙12の1及び2）。

(3) 乙2文献及び乙3文献に記載されたアカルボースについて

ア 本件明細書の発明の詳細な説明に「阻害剤含量は446,550SIUで、純粋な無水アカルボース5.75gに相当した。」と記載されていること（甲2,8欄14行～15行）からすれば、純度100重量%のアカルボースの比活性は、約77,661SIU/gであると認められる。

イ 他方、乙2文献及び乙3文献に記載されたアカルボースの比活性は、77,700SIU/gであって、前記の方法で算出された純度100重量%のアカルボースの比活性約77,661SIU/gの値と極めて近接していることからすれば、その純度は、厳密には確定できないとしても、100重量%又はそれに極めて近接したものであると認められる。もっとも、乙2文献及び乙3文献には、アカルボースの純度は記載されておらず、本件特許の出願前にアカルボースの純度を算定することができたと認めるに足る証拠はないから、乙2文献及び乙3文献に記載された77,700SIU/gの比活性を有するアカルボースの純度は、本件特許の出願前には不明であったといわざるを得な

い。しかしながら、「精製アカルボース組成物」におけるアカルボース以外の成分が不純物であることに照らせば、比活性値が高いほど、それに比例してアカルボースの純度も高くなるものと解され、そのことは当業者であれば容易に想定できるものであると認められる（原告自身、比活性がアカルボースの含有量の推認の手がかりになることは認めている。）ところ、乙1文献に記載された比活性68, 000SIU/gのアカルボースに対して、乙2文献及び乙3文献に記載された比活性77, 700SIU/gのアカルボースは、阻害比活性が高いことから、より純度の高いものと認識されることが明らかである。そして、比活性77, 700SIU/gという特性を有するアカルボースが、本件特許の出願前に存在した以上、本件特許の出願後に、その特性に基づく純度（100重量%又はそれに極めて近接した純度）の算出が可能になったとしても（その算出方法に相応の技術的意義があることは別として）、比活性により規定されるアカルボースと当該純度のアカルボースが物質として同一であることを否定するのは、不合理といわざるを得ない。

以上のことからすると、純度100重量%又はそれに極めて近接した純度のアカルボースが乙2文献及び乙3文献に記載されていたものと認めるのが相当といえる。

なお、被告は、乙12文献に記載されたアカルボースも純度100重量%のものである旨主張する。確かに、乙12文献に記載されている発明は、アカルボースを用いた「新規薬剤調製物」であることから、当該発明において利用されるアカルボースは「人間の薬剤に用いる」ことができるほどの高純度のものであったことは、推認することができる。しかしながら、乙12文献の記載内容は前記エのとおりであり、その純度はもちろん、比活性すら記載がないから、乙12文献の記載内容に基づいてその純度を認定することはできず、他にその純度を認めるに足る証拠もない。したがって、乙12文献に記載されたアカルボースの純度は不明であり、これが100重量%であると認めることはできない。

ウ そして、アカルボースが、アクチノプラネス属のアミノ糖産生菌を培養し、その発酵汁を濃縮精製するという工程を経て生産されるものであることからすれば、乙2文献及び乙3文献に記載されたアカルボースは、精製アカルボースであると認められる（原告自身、乙2文献及び乙3文献に記載されたアカルボースが、アクチノプラネス属のアミノ糖産生菌の発酵汁を精製して作成したものと推測されるとしている。）。

エ このように、乙2文献及び乙3文献に純度100重量%又はそれに極めて近接した純度の精製アカルボースが開示されている以上、本件特許の対象である純度93重量%以上の精製アカルボース組成物は、本件特許発明の特許出願前に、乙2文献及び乙3文献に記載されていたと認められる。

オ これに対して、原告は、乙2文献及び乙3文献に記載されたアカルボースの比活性が純度100重量%のアカルボースの比活性を超えており、活性が高い不純物が混在した可能性があることに加え、「無水」との記載がないことから水のある程度含んだ物質を指していると解されるから、無水状態での比活性は更に高いことになるので、乙2文献及び乙3文献に記載されたアカルボースは、純度100重量%のものではなく、他の物質を含む組成物と解すべきであると主張する。しかしながら、そもそも、純度100重量%のアカルボースの比活性約77, 661SIU/gと、乙2文献及び乙3文献に記

載されたアカルボースの比活性77, 700 S I U / g との比活性の差は39 S I U / gにすぎず、この程度の差は測定誤差の範囲内と推測され、有意的な差とは認められない。そして、アカルボースは、アクチノプラネス属のアミノ糖産生菌を培養し、その発酵汁を濃縮精製して生産するものであり、人間に対する薬剤に用いるためには、その純度を高めることが必要であったということが本件特許の出願前の公知の技術的課題であったのであるから、乙2文献及び乙3文献に記載されたアカルボースに活性が高い不純物が混在していたと考えるのは、不自然であり、また、アカルボースの純度を高めることによりその活性も向上するという本件特許の技術的課題とも矛盾する。そして、前記イのとおり、比活性値が高いほどそれに比例してアカルボースの純度も高くなるものと認められる（原告自身、比活性がアカルボースの含有量の推認の手がかりになることは認めている。）。以上のことからすれば、原告の前記主張は、合理性を欠き、直ちに採用することができない。

(4) 乙2文献及び乙3文献が引用発明となり得るか。

ア 平成11年法律第41号による改正前の特許法29条1項3号（以下「旧29条1項3号」という。）は「特許出願前に日本国内又は外国において頒布された刊行物に記載された発明」については特許を受けることができない旨規定するところ、原告は、乙2文献及び乙3文献には、それに記載されたアカルボースの精製方法の記載がないことから、旧29条1項3号にいう「刊行物に記載された発明」となり得ないと主張する。

イ 確かに、同号に規定する「特許出願前に頒布された刊行物に記載された発明」というためには、特許出願時の技術水準を基礎として、その刊行物に接した当業者がその発明を実施することができる程度に、発明の内容が開示されていることが必要であると解される。そして、乙2文献及び乙3文献には、当該各文献に記載されたアカルボースの製造方法は記載されていない（前記(2)イ及びウ）。

しかしながら、乙2文献及び乙3文献が公開された当時は、それらに記載されたアカルボースの純度は不明であったものの、実質的には、その純度は100重量%又はそれに近似したものであると認められることは、前記のとおりである。そして、乙1文献では68, 000 S I U / gの比活性を有するアカルボースが開示され、乙2文献及び乙3文献では77, 700 S I U / gの比活性を有するアカルボースが開示されているところ、これらの乙1ないし乙3文献に係る特許出願の出願人は、いずれも原告自身であるから、原告においては、乙2文献及び乙3文献が特許出願された時点までには、乙1文献で開示されたアカルボースより比活性が高い、すなわち、より純度が高いアカルボースを精製したものと認められ、これを比較例として実際に用いて対比実験を行った旨を乙2文献及び乙3文献に記載している。また、化学物質は、一般に、大量の原材料を前提として精製を繰り返すことにより、得られる収量はともかく、より高純度のものが取得できる場合が多いことは、当業者にとって技術常識であるところ、本件の場合、強酸カチオン交換体によるカラムクロマトグラフィを用いてアカルボースを分離精製する手法が従来から知られており、当該手法を用いてアカルボースの分離・分種を丹念に繰り返せば、アカルボースの純度を高めていくことが可能であったものと推測される（原告自身も、乙2文献及び乙3文献で用いられた精製方法が不明であるとしながら、従来技術によって精製を行った可能性が高いことを自認している。）。以上のことから

すれば、当業者においても、当該従来技術を用いるなどして、乙2文献及び乙3文献に記載されたアカルボースを精製することは可能であったと認められる。

ウ したがって、乙2文献及び乙3文献は、旧29条1項3号の「刊行物」としての適格を有するものと認められる。

- (5) 前記(1)のとおり、本件特許発明は、アカルボースの精製方法やその純度の算定方法についての特許発明ではなく、「約93重量%以上のアカルボース含有量を有する精製アカルボース組成物」という物を対象とした特許発明であることから、本件特許発明の対象物である「約93重量%以上のアカルボース含有量を有する精製アカルボース組成物」が「刊行物に記載され」ている以上、新規性を欠くと認められる。

よって、本件特許は、昭和62年法律第27号附則3条1項及び同法による改正前の特許法123条1項1号並びに平成11年法律第41号の附則2条12項及び旧29条1項3号により、特許無効審判により無効にされるべきものと認められる。

6. 新規性（特許法29条）

産業上利用することができる発明をした者は、次に掲げる発明を除き、その発明について特許を受けることができる。

1. 特許出願前に日本国内又は外国において公然知られた発明
2. 特許出願前に日本国内又は外国において公然実施をされた発明
3. 特許出願前に日本国内又は外国において、頒布された刊行物に記載された発明又は電気通信回線を通じて公衆に利用可能となった発明

- 「特許出願前に頒布された刊行物にある技術的思想が記載されているというためには、出願当時の技術水準を基礎として、当業者が刊行物を見るならば特別の思考を要することなく容易にその技術的思想を実施し得る程度にその内容が開示されていることが必要であると解されるが、「光学活性置換ベンジルアルコール」の本願発明は物の発明であるから、物としての同一性を判断するに当たって、これと対比される刊行物の記載には物の構成が開示されていれば十分とすべきであって、その物を製造する具体的な方法まで開示されている必要は必ずしもないというべきである」（平成3年10月1日東京高等裁判所判決／平成3年（行ケ）第8号審決取消請求事件）

以上