

「ピリミジン誘導体」事件（審決取消訴訟事件）	
事件の表示	平成28年（行ケ）第10182号、10184号 判決日：平成30年4月13日 知的財産高等裁判所 特別部
判決	審決維持（原告請求棄却）
参照条文	特許法第29条第2項等
キーワード	進歩性

以下、二重下線等の強調は筆者による。

判決文においては、読みやすさのため、正確さを極力失わない範囲で記載を適宜省略している。省略部分には「……」を挿入している。

また、必要に応じて注釈を挿入している。注釈部分には「筆者注：」と記載している。

1. 事案の概要

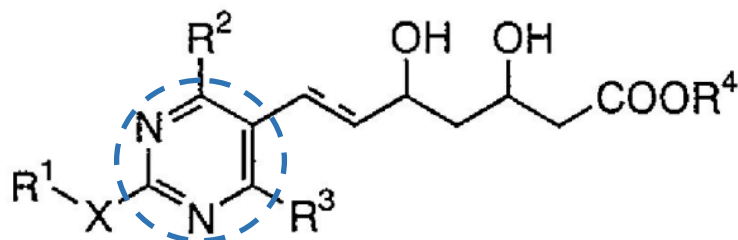
本件は、本件特許（特許第2648897号）に対する特許無効審判（無効2015-800095）における棄却審決を不服とした審決取消訴訟事件である。本件は大合議事件である。争点は、進歩性（特許法第29条第2項）等である。ここでは進歩性に限定して議論する。

2. 本件発明

本件発明（本件請求項1に記載の発明）を以下に示す。なお、化学式中、青い破線の丸で囲んだ部分は、本件発明及び引用発明に係る化合物の主要部分「ピリミジン環」を示す（以降の化学式においても同様）。赤字太線部は、本件発明と甲1発明（後述）との相違点のうち、本件において論じられた相違点を示す。

【請求項1】式（I）：

【化1】



（式中、

R¹は低級アルキル；

R²はハロゲンにより置換されたフェニル；

R³は低級アルキル；

R⁴は水素またはヘミカルシウム塩を形成するカルシウムイオン；

Xはアルキルスルホニル基により置換されたイミノ基；

破線は2重結合の有無を、それぞれ表す。）

で示される化合物またはその閉環ラクトン体である化合物。

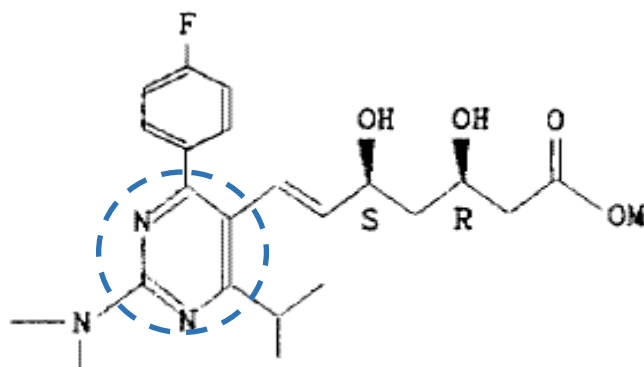
(筆者注：本件発明の化合物は、体内でのコレステロールの生成を抑制する医薬品に係る。)

(筆者注：「基」とは、有機化合物の性質を特徴づける原子の集団（原子団）を意味する。)

(筆者注：Rⁿは、複数の選択肢の中から任意に選ばれる原子又は原子団。)

3. 先行文献に記載の発明

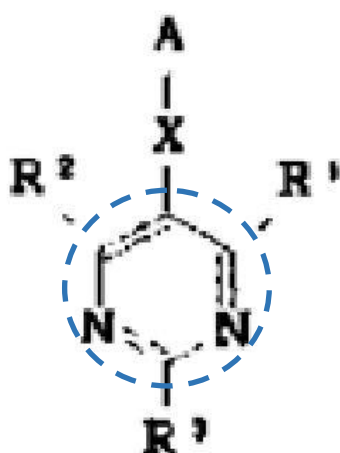
(1) 甲1発明 (抜粋)



(M=N a) の化合物

(2) 甲2発明 (抜粋)

「一般式



式中、R³は……か、アルキルを表わし、……或いは式-NR⁴R⁵、但し、R⁴及びR⁵は上記の意味を有する、の基で、……またはアルキルスルホニルからなる同一もしくは相異なる基で一置換、二置換または三置換されていてもよく……」

4. 本件発明と甲1発明との相違点（抜粋）

(1-i)

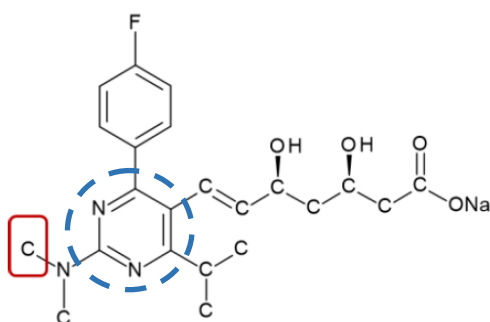
Xが、本件発明1では、アルキルスルホニル基により置換されたイミノ基であるのに対し、甲1発明では、メチル基により置換されたイミノ基である点

5. 原告らの主張（抜粋）

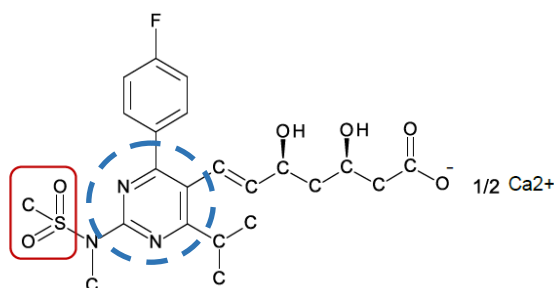
「……

ア 甲1からの動機付け

(ア) 甲1発明の化合物（甲1の実施例1b）の化合物）と本件発明化合物の構造は、下図のとおりであり、その相違点（赤枠部分）は、ピリミジン環の2位（筆者注：下記ピリミジン環の左下の位置）のN原子の置換基が、メチル基かメチルスルホニル基かだけである（ナトリウム塩かカルシウム塩かの違いもあるが、この違いは、本件発明化合物の進歩性に何ら寄与しない。）。



甲1発明の化合物



本件発明化合物（ロスバスタチン）

(イ) 甲1発明の化合物は、……優れた *in vivo* 活性（筆者注：生体内での活性）を有する。……したがって、当業者が、甲1発明の化合物をリード化合物（筆者注：創薬過程の出発点となる化合物）とする動機付けがあった。

(ウ) 本件優先日当時、……当業者が、リード化合物である甲1発明の化合物の親水性を高めることにより、……HMG-C o A還元酵素阻害剤（筆者注：肝臓でコレステロールが合成されるときに必要な酵素の働きを妨げる薬剤）の標的臓器である肝臓へ化合物を選択的に移行させるために、親水性の置換基を導入する動機付けがあった。

そして、……甲1発明の化合物に親水性の置換基を導入するには、ピリミジン環の2位への導入が必然であり、当業者は、甲1発明の化合物のピリミジン環の2位に親水性の置換基を導入する動機付けがあった。

……

(エ) a リード化合物を改変する際には……当業者は、改変による構造変化ができるだけ小さくなるように、……ジメチルアミノ基（筆者注：イミノ基の下位概念の1つ）の一方のメチル基（CH₃）のみを親水基に置換する。

b メチルスルホニル基が最も親水性に寄与する……から、甲1発明の化合物のピリミジン環の2位のジメチルアミノ基の一方のメチル基をメチルスルホニル基に置換することは容易である。

c 甲2の一般式（I）を考慮すると、甲1発明の化合物のピリミジン環の2位のジメチルアミノ基の一方のメチル基をメチルスルホニル基に置換することはなおさら容易である。

すなわち……甲1発明の化合物のピリミジン環の2位のジメチルアミノ基のN原子の置換基は、6個（アルキル基、アリール基、アラルキル基、アシル基、アルキルスルホニル基、アリールスルホニル基）しか記載がなく、この中から親水性であり、メチル基と比較して分子の大きさの変化が小さいアルキルスルホニル基であるメチルスルホニル基を選択することは、極めて容易である。……」

6. 裁判所の判断（抜粋）

「……

(1) 進歩性の判断について

……進歩性に係る要件が認められるかどうかは、特許請求の範囲に基づいて特許出願に係る発明（以下「本願発明」という。）を認定した上で、同条（筆者注：特許法第29条）1項各号所定の発明と対比し、一致する点及び相違する点を認定し、相違する点が存する場合には、当業者が、出願時（又は優先権主張日。以下「3 取消事由1について」において同じ。）の技術水準に基づいて、当該相違点に対応する本願発明を容易に想到することができたかどうかを判断することとなる。

このような進歩性の判断に際し、本願発明と対比すべき同条1項各号所定の発明（以下「主引用発明」といい、後記「副引用発明」と併せて「引用発明」という。）は、通常、本願発明と技術分野が関連し、当該技術分野における当業者が検討対象とする範囲内のものから選択されるところ、同条1項3号の「刊行物に記載された発明」については、当業者が、出願時の技術水準に基づいて本願発明を容易に発明をすることができたかどうかを判断する基礎となるべきものであるから、当該刊行物の記載から抽出し得る具体的な技術的思想でなければならない。そして、当該刊行物に化合物が一般式の形式で記載され、当該一般式が膨大な数の選択肢を有する場合には、当業者は、特定の選択肢に係る具体的な技術的思想を積極的あるいは優先的に選択すべき事情がない限り、当該刊行物の記載から当該特定の選択肢に係る具体的な技術的思想を抽出することはできない。

したがって、引用発明として主張された発明が「刊行物に記載された発明」であって、

当該刊行物に化合物が一般式の形式で記載され、当該一般式が膨大な数の選択肢を有する場合には、特定の選択肢に係る技術的思想を積極的あるいは優先的に選択すべき事情がない限り、当該特定の選択肢に係る具体的な技術的思想を抽出することはできず、これを引用発明と認定することはできないと認めるのが相当である。

この理は、本願発明と主引用発明との間の相違点に対応する他の同条 1 項 3 号所定の「刊行物に記載された発明」（以下「副引用発明」という。）があり、主引用発明に副引用発明を適用することにより本願発明を容易に発明をすることができたかどうかを判断する場合において、刊行物から副引用発明を認定するときも、同様である。……」

「……

(2) 甲 1 発明について

……

(ウ) a

……

甲 2 には、甲 2 の一般式 (I) で示される化合物のうちの「殊に好ましい化合物」のピリミジン環の 2 位の置換基 R^3 の選択肢として「 $-NR^4R^5$ 」が記載されるとともに、 R^4 及び R^5 の選択肢として「メチル基」及び「アルキルスルホニル基」が記載されている。

しかし、甲 2 に記載された「殊に好ましい化合物」における R^3 の選択肢は、極めて多数であり、その数が、少なくとも 2000 万通り以上あることにつき、原告らは特に争っていないところ、 R^3 として、「 $-NR^4R^5$ 」であって R^4 及び R^5 を「メチル」及び「アルキルスルホニル」とすることは、2000 万通り以上の選択肢のうちの一つになる。

……

そうすると、甲 2 にアルキルスルホニル基が記載されているとしても、甲 2 の記載からは、当業者が、甲 2 の一般式 (I) の R^3 として「 $-NR^4R^5$ 」を積極的あるいは優先的に選択すべき事情を見いだすことはできず、「 $-NR^4R^5$ 」を選択した上で、更に R^4 及び R^5 として「メチル」及び「アルキルスルホニル」を選択すべき事情を見いだすことは困難である。

したがって、甲 2 から、ピリミジン環の 2 位の基を「 $-N(CH_3)(SO_2R')$ 」（筆者注：本願発明に係る基）とするという技術的思想を抽出し得ると評価することはできないのであって、甲 2 には、相違点 (1-i) に係る構成が記載されているとはいえ、甲 1 発明に甲 2 発明を組み合わせることにより、本件発明の相違点 (1-i) に係る構成とすることはできない。」

「b (a) ……

(b) ……

……HMG-CoA還元酵素阻害剤において、相対的に親水性の高い化合物が、肝選択性を高める可能性があることが示唆されているといえるから、副作用を考慮して、肝臓に

対して選択性が高いHMG-C o A還元酵素阻害剤を得るために、HMG-C o A還元酵素阻害活性を示す化合物を、親水性という指標で評価し、親水性の高い（log Pが2以下の）化合物を選択するという動機は本件優先日当時の当業者が認識できたものといえる。

（c）しかし、一方で、……甲16には、中央の芳香族環の6位における嵩高の親油性の置換基が合成HMG-C o A還元酵素阻害剤の生物活性に大きく寄与することが記載され……甲16の記載に接した当業者であれば……甲1発明の化合物のピリミジン環の2位の「ジメチルアミノ基」の部分に、嵩高の親油性の置換基、特に、嵩高のアルキル基又はフェニル部分を導入することにより力価（筆者注：薬の強さを表す用語）の顕著な上昇を期待できると認識するといえる。

そうすると、たとえ、……より親水性の高い化合物を選択するという動機があったとしても、その一方で、甲1発明の化合物においては、そのピリミジン環の2位の「ジメチルアミノ基」部分に、嵩高の親油性の置換基、特に、嵩高のアルキル基あるいはフェニル部分を導入することにより力価の顕著な上昇を期待できると当業者は認識したといえるから、甲1発明の化合物のピリミジン環の2位の「ジメチルアミノ基」を、嵩高の親油性の置換基とはせずに、より親水性の高い置換基とすることの動機付けが、本件優先日当時の当業者にあつたとはいえない。」

7. コメント

（1）本件の意義

本件における「広い範囲の刊行物の記載から引用発明がどのように認定されるか」に関する判断は、以後の多くの判例や審査審判で前提とされている。すなわち、

1) 特許法29条1項3号の「刊行物に記載された発明」については、当業者が、出願時の技術水準に基づいて本件発明を容易に発明をすることができたかどうかを判断する基礎となるべきものであるから、当該刊行物の記載から抽出し得る具体的な技術的思想でなければならない。

2) 引用例となる刊行物に ①化合物が一般式の形式で記載され、 ②当該一般式が膨大な数の選択肢を有する場合には、 ③特定の選択肢に係る技術的思想を積極的あるいは優先的に選択すべき事情がない限り、当該特定の選択肢に係る具体的な技術的思想を抽出することはできず、これを引用発明と認定することはできない。

なお、上記2)の「当該一般式が膨大な数の選択肢を有する場合には」は、より厳密には以下のように言い換えられると考えられる。

「刊行物に当該一般式の選択肢が記載されていない場合は勿論のこと、選択肢が記載されていても、その数が膨大である場合には」

（2）上記6. に関する補足

上記6. の最後のカギ括弧部では、「積極的あるいは優先的に選択すべき事情」についてより深く論じることにより、「特定の選択肢に係る具体的な技術的思想を抽出する」動機付けに関する原告の主張をより確実に退けたものと解される。具体的には、原告が主張した「甲1発明の化合物の……『ジメチルアミノ基』をより親水性の高い置換基とする」こと以外に「嵩高の親油性の置換基とする」という別の好ましい選択肢が本件優先日当時であったため、上記事情は認められないと判断された。これについて2点意見を述べる。

1) 中間処理等で「特定の選択肢に係る具体的な技術的思想を抽出する」動機付けを否定したい状況が生じた場合、別の好ましい選択肢を具体的に挙げるという手法も考えられる。但し、包袋禁反言には注意（別の好ましい選択肢を挙げる場合、過剰な列挙は避け、必要最小限に留めておくのが良さそう）。

2) 判例における「別の好ましい選択肢」は、原告が提出した別の先行文献に記載されていたため、裁判官によって認定された。このため、原告が主張した特定の選択肢は「積極的あるいは優先的に選択すべき事情」を有しないと認定された。仮に、上記別の先行文献が提出されておらず、上記別の好ましい選択肢が裁判官によって認定されなかつたら、原告が主張した特定の選択肢に「積極的あるいは優先的に選択すべき事情」が認められた可能性もあったのではないかと考えられる。また、この事情が認められた場合、本件発明の進歩性が否定され得たかどうかについても関心がある。

(3) 他の技術分野への応用について

本件は化学分野における判例だが、本件の考え方を機械分野等の他の技術分野に応用することも、基本的には可能かと考えられる。

機械分野では、例えば「刊行物に記載の装置を構成する部材の選択肢（又は複数の部材の組合せの選択肢）の数が膨大である場合には、特別な事情がない限り、特定の選択肢に係る具体的な技術的思想を当該刊行物から抽出することはできない」と考えることができる。この考え方自体は妥当と思われる。一方で、機械分野において上記選択肢がどの程度以上記載されていれば膨大と認定されるかについては、未知数な部分もある。

以上