米国における先行技術の内在的開示

特許請求項の個別の要素すべてが先行技術文献によって明示的もしくは内在的に開示されていた場合、その請求項は当該先行技術文献によって先知されていたとして合衆国特許法第 102 条（35 USC §102）に基づき拒絶されることがある。内在性の法理によれば、請求項の中で問題となる限定が先行技術の中に必然的に存在しているか、先行技術により明示的に開示された要素の組合せの当然の帰結である」場合、その先行技術文献は前記の限定を内在的に開示しているとされる。[11] 合衆国連邦巡回控訴裁判所の最近の判例 [22] においては、特定の合成物に関する不完全な説明のみが先行技術に含まれており、それだけでは当業者が当該合成物の構成要素を把握しえない場合、それらの構成要素について内在性の法理を適用することはできないと裁判所は認定している。先行技術が請求項の個別の要素すべてを明示的もしくは内在的に開示していない場合、係争中の請求項が無効とされることはない。

Endo Pharmaceuticals Solutions, Inc.（以下「Endo」と称する）と Bayer Intellectual Property GmbH and Payer Pharma AG（以下「Bayer」と称する）は、2 件の特許の様々な請求項を侵害したとして Custopharm Inc.（以下「Custopharm」と称する）を提訴した。これらの特許は一般に、注射によるテストステロン補充療法に用いられる持続性注射剤 Aveed®の処方および注射に関係するものである。被告の Custopharm は侵害については原告の主張に同意したものの、係争中の請求項は無効であると主張した。当該請求項が無効であることを Custopharm は立証していないと地裁は結論し、それを不服とした Custopharm は上訴した。連邦巡回は地裁の一審判決を支持した。

争点となった請求項は次の 3 つの主要な要素を対象としたものであった：(1) 750mg のウンデカン酸テストステロン（TU）；(2) ヒマシ油と溶剤（ある請求項では安息香酸ベンジルと明記されている）から構成される賦形剤；(3) 注射スケジュール。これら 3 つの要素はすべて先行技術に照らして自明であると Custopharm は主張した。裁判所はそれぞれの要素を個別に検討し、そのいずれもが先行技術に照らして自明ではないと認定した。後述するように、裁判所は要素(2)を論じるにあたって内在性の法理を検討している。

争点となった先行技術は Behre[33]、Nieschlag[44]および von Eckardstein[55]の文献で、ヒマシ油に TU を混入した合成物を用いた TU 注射に関わる臨床試験について述べた学術論文（以下「先行技術論文」と称する）であった。安息香酸ベンジルや溶剤の使用に関する開示もしくは記述は、前記論文には含まれていない。係争

---

[1] *Par Pharmaceutical v. TWI Pharmaceuticals, Inc.*, 2014-1391 (Fed. Cir., December 3, 2014)

[2] *Endo Pharmaceuticals Solutions v. Custopharm Inc.*, 2017-1719 (Fed. Cir., July 13, 2018)

[3] H.M. Behre et al., *Intramuscular injection of testosterone undecanoate for the treatment of male hypogonadism: phase I studies*, 140 Eur. J. Endocrinol. 414 (1999) Behre は、ヒマシ油に混入された TU の 1 回の投与量 1000mg の半減期と茶実油に混入された TU の 1 回の投与量 1000mg の半減期を比較している。

[4] E. Nieschlag et al., *Repeated intramuscular injections of testosterone undecanoate for substitution therapy in hypogonadal men*, 51 Clin. Endocrinol. 757 (1999) Nieschlag は、6 週間の間隔でヒマシ油に混入した TU1000mg の筋肉内注射を 4 回行うことの適否を調査している。

[5] S. von Eckardstein & E. Nieschlag, *Treatment of Male Hypogonadism with Testosterone Undecanoate Injected at Extended Intervals of 12 Weeks: A Phase II Study*, 23(3) J. Androl. 419 (2002) von Eckardstein は注射の間隔を増やしつつ（最初は 6 週間毎に注射するが、徐々に注射の間隔が引き延ばされ、10 回目の注射の後では 12 週間となる）3.2 年の期間にわたって行われる長期的な TU 治療の効能と安全性を調査している。

中の特許の優先日より後に公表された Saad[6]の論文は、先行技術論文において使用された賦形剤がヒマシ油 40%、安息香酸ベンジル 60%から成ることを開示していた。Saad の論文は係争中の特許の優先日より後に公表されており、そこで開示された情報は優先日以前には当業者に提供されていなかったため、Saad を先行技術文献として援用することはできない。

先行技術論文に記載された研究でヒマシ油と安息香酸ベンジルから構成される処方が使用されていたことを Saad の論文が後日に開示している以上、その処方は先行技術論文の中に「必然的に存在」していたはずであると Custopharm は主張した。裁判所は、以下のような推論に基づき、この主張に異を唱えた。

先行技術論文は、注射される合成物の薬物動態学的な挙動に関して詳細な記述を提供しているがゆえに安息香酸ベンジルを含める賦形剤の処方を内在的に開示しており、当業者であれば、報告された薬物動態学的な挙動に基づき、ヒマシ油 40%、安息香酸ベンジル 60%から構成される賦形剤が組成に含まれていると判断しえたはずである、と Custopharm は主張した。裁判所はこの主張に同意せず、当業者が報告された薬物動態学的な挙動のみに基づいて賦形剤の組成を判断しえたことを Custopharm は立証していないと認定した。なぜなら、先行技術には安息香酸ベンジル以外にも候補となる溶剤が多数挙げられており、それら他の溶剤も似たような挙動を引き起こす可能性があるからだ。内在性は「蓋然性や可能性によって立証しうるものではなく」、「特定の事象が所与の一連の状況の結果である*可能性がある*という事実のみでは不十分である」と裁判所は指摘している。

Custopharm が援用した 2 件の判例は本件の状況には当てはまらないと裁判所は認定している。そのうち *In re Omeprazole*[7] の事案では、本来的な分離層を含む医薬合成物を対象とした請求項が問題となっているが、この分離層は特許に記載された成分を使用したことによる当然の帰結であった。この本来的な分離層は、特許に記載された成分が特許に記載された通りの方法で配合されれば常に同様の分離層が生じるという理由で内在的なものである。先行技術の中で明示された薬物動態学的なプロフィールが生じるのはヒマシ油 40%と安息香酸ベンジル 60%を混合した場合に限られるという事実を Custopharm は証明していない、と裁判所は考えた。従って、本件の事実関係を *In re Omeprazole* のそれと類比させることはできない。

In re Crish[8] の事案では、ヒトのインボルクリン遺伝子プロモーターの配列を対象とした特許請求項と、人のインボルクリン遺伝子の構造を開示した先行技術文献が問題となった。この先行技術文献にはプロモーター領域のおよその大きさが示されていたが、プロモーター領域の配列は開示されていなかった。ヒトのインボルクリン遺伝子プロモーター領域が既知であり、係争中の特許に示された配列が先行技術の配列の中に必然的に含まれることを、この先行技術文献は明らかにしていた。本件訴訟における先行技術には、特許請求された賦形剤の組成のみが先行技術に記載された薬物動態学的な挙動を生じさせることを示す証拠は含まれていない。

裁判所は以下のように説明している。

> *Crish 事件*および *Omeprazole 事件*の判例は、「既知の」先行技術による製造物に内在的に存在する特性もしくは特徴に関するものである。だが本件の場合、先行技術論文の中で詳述されている TU 注射剤の組成は、これらの判例と同様な意味

---

[6] F. Saad, et al., *More than eight years' hands-on experience with the novel long-acting parenteral testosterone undecanoate*, 9(3) Asian J. Androl 291 (2007).

[7] *In re Omeprazole Patent Litigation*, 2007-1414 (Fed. Cir., August 20, 2008).

[8] *In re Crish,* 2004-1075 (Fed. Cir., December 21, 2004).

> で「既知」であるとは言えない。本件の先行技術論文には、TU とは別の主要な成分である安息香酸ベンジルを含む合成物賦形剤の処方は開示されていない。もちろん、安息香酸ベンジルとヒマシ油の混合比の開示もない。それに、当業者が報告された薬物動態学的なプロフィールに基づいて開示されていない賦形剤の処方を判断しえたことを示す証拠や、開示されていない賦形剤の処方が必然的に先行技術論文で調査された TU 注射剤の特徴となることを示す証拠は、記録には全く含まれていない。本件の状況に基づいて言えば、TU 注射剤の構成要素に関する記述の不完全性は、当業者がその組成を把握することを妨げるものである。従って、製造物に関する先行技術論文の開示に欠落があった場合、その欠落を埋め合わせるために内在性の法理を用いることは不可能である。

ヒマシ油 40%、安息香酸ベンジル 60%という賦形剤の処方が実際に先行技術において使用されていたにも関わらず、裁判所は、当該処方は先行技術に内在的に存在するものではないと認定した。

今回の判決を考慮して、先行技術の開示が特定の要素を内在的に開示しているとされるのは、その要素が開示の教示内容として先行技術の中に必然的に存在する場合のみであるという点を、特許実務者は念頭に置いておくべきであろう。問題の要素が先行技術の中に現実に存在していたという事実は、その要素が先行技術の開示に内在するか否かの分析とは無関係である。それゆえ特許実務者は、先行技術の要素のうち明示的に開示されてないものを、当然に内在的に開示されているものとして扱ってはならない。むしろ、そのような要素が内在的に開示されているか否かを判断する際には、内在性に関する判例法に照らして慎重に分析を行わなければならない。