



「DPP IVインヒビターの使用」事件  
(知財高判令和8年2月9日 令和7年(行ケ)第10054号<sup>1)</sup>)

概要

(1) 審決取消訴訟において、進歩性の判断の誤りが争点となった事例。  
(2) 裁判所は、薬事承認が下りていない事実は特許法上の「技術常識」の認定とは無関係であり、また、臨床試験による一般的な最適化の手法を用いて特定の用量を導き出すことは当業者の通常の創作能力の範囲内であるとして、本件発明の進歩性を否定した(特許庁審決を維持)。

対象特許の請求項1 (特許第6143809号<sup>2)</sup>【対象審判(無効2023-800045号事件)】

【請求項1】

経口投与用に5mg用量の1-[(4-メチル-キナゾリン-2-イル)メチル]-3-メチル-7-(2-ブチン-1-イル)-8-(3-(R)-アミノ-ペリジンを1-イル)キサンチンを含む、タイプ2糖尿病の治療用医薬組成物であって、1日に1回投与するための前記医薬組成物。

相違点

請求項1に係る本件発明と甲1(特表2006-503013号公報<sup>3)</sup>)に記載の発明(甲1発明)との相違点(原告、被告で認定に争いがある)は、次の表の通りである。

	本件発明	甲1発明
被告が主張する相違点(審決と同じ)	「5mg用量」「1日に1回投与する」と特定されている	用量及び投与回数は特定されていない
原告が主張する相違点	本件化合物をタイプ2糖尿病の治療用医薬組成物という用途に5mg、1日1回経口投与という用量及び投与経路で使用する事が特定されている	(用途・投与経路を含め)これらの点がいずれも特定されていない

裁判所の判断

(1) まず、「DPP IV阻害薬は…未だ臨床試験段階であり、治療薬として承認されておらず、実際に治療に使用されていなかったから、「2型糖尿病の経口投与可能な治療薬として使用可能であること」が技術常識であったとはいえない」として、審決の技術常識の認定が誤りであるとする原告の主張に対し、裁判所(知財高裁)は次のように判断した。  
…本件優先日当時、甲1発明の出願人である原告以外にも、複数の製薬会社(当業者)が、DPP IV阻害薬によって2型糖尿病を治療する発明につき特許出願を行い、複数のDPP IV阻害薬につき2型糖尿病治療薬としての薬事承認に向けた臨床試験が進められていたと認められる。そうすると、本件優先日当時、DPP IV阻害薬一般が、DPP IV阻害活性に基づいてインスリンの作用を増強することにより、2型糖尿病(タイプ2糖尿病)に対して治療効果を有し、経口投与可能な治療薬として使用可能であることは、当業者にとって技術常識であったとみることができる。…薬事承認は、医薬品として製造販売す

<sup>1</sup> <https://www.courts.go.jp/hanrei/95513/detail8/index.html>

<sup>2</sup> <https://www.j-platpat.inpit.go.jp/c1801/PU/JP-6143809/15/ja>

<sup>3</sup> <https://www.j-platpat.inpit.go.jp/c1801/PU/JP-2006-503013/11/ja>

ることを承認する行政行為であり…、これを受けなければ実際の治療には使用できないものであるが、このことと、当該医薬品が特定の疾病に対して治療効果を有するかに係る当業者の認識は別個の問題である。そして、…DPPIV阻害薬については、本件優先日当時において、当業者の間に、上記技術常識が存在していたと認められ、薬事承認の有無はこの点の判断を左右するものではない。(下線は筆者による)

その上で、裁判所は、審決での甲1発明及び相違点1の各認定に誤りはない、とした。

(2) また、当業者が甲1文献の記載から「5mg用量」「1日1回投与」に想到することが容易であったとはいえない旨の原告の主張について、裁判所は次のように判断した。  
…医薬品の用量は、通常、非臨床試験の結果などを総合的に判断し、ヒトに対して十分に安全と見込まれる用量を推定して初回投与量とし、段階的に用量を増して安全用量の範囲を推定する第I相試験から、第II相試験、第III相試験へと順に進めていく手順を踏んで、最終的に決定されるとの技術常識…に照らせば、甲1文献に接した当業者は、上記幅のある数値の下限値(1mg、1日1回投与)を初回投与量の参考として用い、上記手順を踏んで最終的な用量を決定すると認められ、本件発明1が特定する「5mg」「1日1回投与」との用量は、上記手順を踏んだ結果、最終的に当業者が選択し得るいくつかの用量に当然に含まれるとみることができる。したがって、当業者が、「5mg」「1日1回投与」との用量に想到することは容易であったと認められる。(下線は筆者による)

(3) また、第I相試験における初回投与量の決定は、米国食品医薬品局(FDA)のガイダンスが示す基準に従ってされるのが技術常識であり、同基準によれば、本件発明1の「5mg用量」には到達しない旨の原告の主張について、裁判所は次のように判断した。  
…本件優先日当時、上記初回投与量の決定に関する基準は、上記米国食品医薬品局(FDA)の基準以外にも複数存在したのであるから…、特定の基準によって初回投与量を決定するとの技術常識が存在したと認めるに足りない。(下線は筆者による)

(4) さらに、甲1文献には実施例の製剤例として75mgという用量が記載されていることから、この用量を初回投与量として設定し、「5mg用量」に想到しないとの原告の主張について、裁判所は次のように判断した。

…しかし、技術常識…に照らせば、当業者が、甲1文献に好ましい投与量として示された「1ないし100mgの範囲」の下限値を大幅に超える75mgを、ヒトに対して十分に安全と見込まれる初回投与量として設定する合理的な理由があるとは解し難い。(下線は筆者による)

## まとめ

本件では、裁判所は、薬事承認が下りていない事実は特許法上の「技術常識」の認定とは無関係であると認定した。本件判決で示された考え方を適用し、相手方の進歩性を否定する局面で、対象特許の出願日時点で薬事承認前であったとしても、学术论文、学会の抄録、治験情報のプレスリリース等の情報を集めることで、「作用機序に基づく効果は既に技術常識であった」と、進歩性欠如の議論を補強することは有用であると考えられる。

また裁判所は臨床試験による一般的な最適化の手法を用いて特定の用量を導き出すことは当業者の通常の創作能力の範囲内であると認定した。医薬発明において単なる用法・用量の最適化を越えて進歩性を主張するためには、明細書作成時に可能な範囲で具体的な試験結果と共に特定の疾病への顕著な効果を記載しておくことが重要であると考えられる。

**キーワード** 特許、進歩性(29条2項)、相違点の認定、医薬

[担当] 深見特許事務所 中村 考志

## [注記]

本レポートに含まれる情報は、一般的な参考情報であり、法的助言として使用されることを意図していません。知財案件に関しては、弁理士にご相談ください。