

平成30年1月22日判決言渡

平成29年(行ケ)第10007号 審決取消請求事件

口頭弁論終結日 平成29年12月5日

判 決

原 告 バイエルクロップサイエンス
株式会社

同訴訟代理人弁護士 城 山 康 文
山 内 真 之
大 石 裕 太
同 弁理士 小 野 誠
坪 倉 道 明
川 寄 洋 祐

被 告 ビーエーエスエフ ソシエタス
・ヨーロッパ

同訴訟代理人弁護士 田 中 成 志
板 井 典 子
山 田 徹
沖 達 也
同 弁理士 江 藤 聡 明
倉 脇 明 子
山 口 修

主 文

- 1 原告の請求を棄却する。
- 2 訴訟費用は原告の負担とする。

事実及び理由

第1 請求

特許庁が無効2015-800065号事件について平成28年12月6日にした審決を取り消す。

第2 事案の概要

1 特許庁における手続の経緯等

(1) 被告は、平成10年8月5日、発明の名称を「2-ベンゾイルシクロヘキサノン-1,3-ジオン」とする発明について特許出願（優先権主張：平成9年8月7日、ドイツ連邦共和国。外国語特許出願）をし、平成22年9月24日、特許権の設定登録を受けた（特許番号第4592183号。請求項の数4。以下「本件特許」という。甲71）。

(2) 平成25年3月14日、請求項2の削除を含む訂正審決がされ、同審決は確定した（甲72）。

(3) 原告は、平成27年3月17日、本件特許について無効審判を請求し（甲73）、特許庁は、上記審判請求を無効2015-800065号事件として審理を行った。

(4) 原告は、平成28年8月26日、本件特許について訂正を請求した（以下「本件訂正」という。甲92）。

(5) 特許庁は、平成28年12月6日、本件訂正を認めた上、「本件審判の請求は、成り立たない。」との別紙審決書（写し）記載の審決（以下「本件審決」という。）をし、その謄本は、同月15日、原告に送達された。

(6) 原告は、平成29年1月12日、本件審決の取消しを求める本件訴訟を提起した。

2 特許請求の範囲の記載

(1) 本件訂正前の特許請求の範囲請求項 1, 3, 4 の記載は, 別紙 1 のとおりである。以下, これら発明を「本件発明 1」などといい, 本件発明 1, 3 及び 4 を総称して「本件発明」という。また, 明細書及び図面 (甲 7 2) を併せて「本件明細書」という。

(2) 本件訂正後の特許請求の範囲請求項 1, 3, 4 の記載は, 別紙 2 のとおりである。以下, これら発明を「本件訂正発明 1」などといい, 本件訂正発明 1, 3 及び 4 を総称して「本件訂正発明」という。また, 明細書及び図面 (甲 9 2) を併せて「本件訂正明細書」という。なお, 下線部は, 本件訂正に係る部分である。

3 本件審決の理由の要旨

(1) 本件審決の理由は, 別紙審決書 (写し) 記載のとおりである。要するに, 本件訂正を認めた上, ①本件訂正発明は, 実施可能要件に違反しない, ②本件訂正発明は, サポート要件に違反しない, ③本件訂正発明 1 及び 3 は, 下記アの引用例 1 に記載された発明 (以下「引用発明 1」という。) 及び下記イないしエの引用例 2 ないし 4 に記載された発明 (以下「引用発明 2」などという。) に基づいて, 本件訂正発明 4 は, 引用発明 2 並びに引用発明 1, 3 及び 4 に基づいて, 当業者が容易に発明をすることができたものであるとはいえない, ④本件訂正発明は, 特許法 184 条の 18 で準用する同法 123 条 1 項 5 号違反 (原文新規事項追加) に当たらない, というものである。

ア 引用例 1 : 特開平 8 - 20554 号公報 (甲 1)

イ 引用例 2 : 特開平 7 - 206808 号公報 (甲 2)

ウ 引用例 3 : 特開平 6 - 321932 号公報 (甲 3)

エ 引用例 4 : 特開平 6 - 271562 号公報 (甲 4)

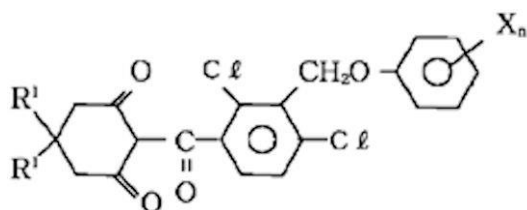
(2) 本件訂正発明と引用発明との対比

本件審決が認定した引用発明 1, 本件訂正発明 1 及び 3 と引用発明 1 との一致点及び相違点, 引用発明 2, 本件訂正発明 4 と引用発明 2 との一致点及び相違点は,

次のとおりである。

ア 引用発明 1

一般式

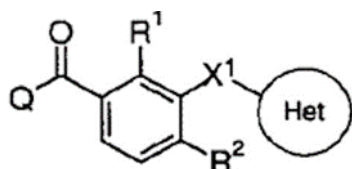


[式中、 R^1 は水素原子または低級アルキル基を表し、 X は低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、低級アルキニルオキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基、トリフルオロメチル基、 $-COR^2$ 基（ただし、基中、 R^2 は低級アルキル基、低級アルコキシ基または低級アルキルアミノ基を表す。）、 $-NHCOR^3$ 基（ただし、基中、 R^3 は低級アルキル基または低級アルキルアミノ基を表す。）、 $-S(O)_mR^4$ 基（ただし、基中、 R^4 は低級アルキル基を表し、 m は0または2を表す。）、 $-C(CH_3)=NOR^5$ 基（ただし、基中、 R^5 は低級アルキル基を表す。）または $-(CH_2)_yCN$ 基（ただし、基中、 y は0または1を表す。）を表し、 n は0、1または2を表す。]で示されるシクロヘキサジオン誘導体。

イ 本件訂正発明 1 及び 3 と引用発明 1 との一致点及び相違点

(ア) 一致点

式 Ia



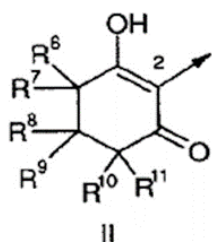
Ia

[但し、 R^1 が、ハロゲンを表し、

R^2 が水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

n が1又は2を表し、

Qが2位に結合する式II



[但し、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 及び R^{11} が、それぞれ水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、上記 CR^8R^9 単位が、 $C=O$ で置き換わっていても良い]

で表されるシクロヘキサン-1, 3-ジオン環を表し、

X^1 が酸素により中断されたエチレン鎖または $-CH_2O-$ を表す]

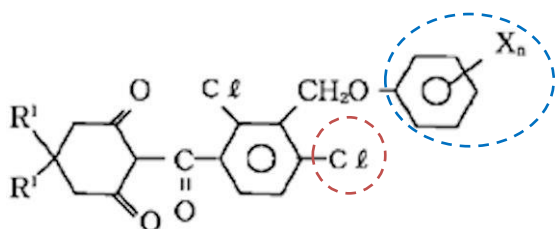
で表される2-ベンゾイルシクロヘキサン-1, 3-ジオン又はその農業上有用な塩

(イ) 相違点1

本件訂正発明1は、 R^2 が、 $-S(O)_nR^3$ であるのに対し、引用発明1においては、対応する基が、ハロゲンの1種であるクロロ（塩素）である点

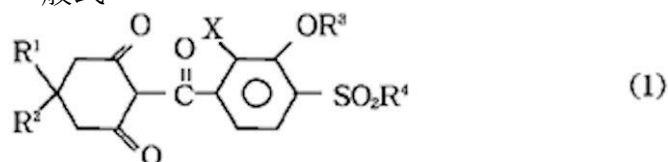
(ウ) 相違点2（本件訂正発明3においては、下線部を除く。）

本件訂正発明1は、Hetが、オキシラニル、2-オキセタニル、3-オキセタニル、2-テトラヒドロフラニル、3-テトラヒドロフラニル、2-テトラヒドロチエニル、2-ピロリジニル、2-テトラヒドロピラニル、2-ピロリル、5-イソオキサゾリル、2-オキサゾリル、5-オキサゾリル、2-チアゾリル、2-ピロリジニル、1-メチル-5-ピラゾリル、1-ピラゾリル、3, 5-ジメチル-1-ピラゾリル、又は4-クロロ-1-ピラゾリルであるのに対し、引用発明1においては、対応する基が、特定の基Xを0, 1又は2個有するフェニル基である点

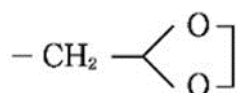


ウ 引用発明 2

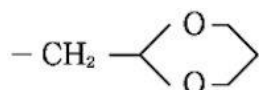
一般式



[式中、 R^1 および R^2 は、水素原子または低級アルキル基を表し、 R^3 は、 $-CH_2CH(OR^7)_2$ 基であってその R^7 が環構造を形成する低級アルキレン基である



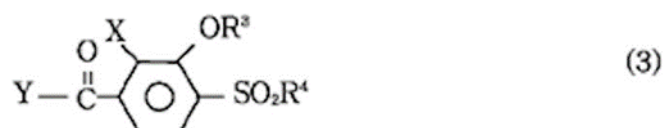
又は



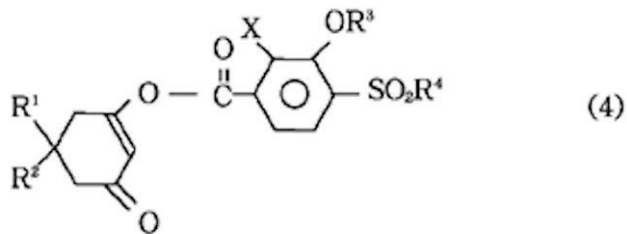
を表し、 R^4 は、低級アルキル基を表し、 X は、ハロゲン原子を表す。] で示されるシクロヘキサンジオン誘導体の製造方法であって、一般式 (2)



(式中、 R^1 、 R^2 は前記の意味を表す。) で示されるシクロヘキサンジオン誘導体と、一般式 (3)



(式中、 R^3 、 R^4 および X は、前記の意味を表し、 Y は、ハロゲン原子を表す。) で示されるベンゾイルハライド誘導体とを反応させることにより、一般式 (4)

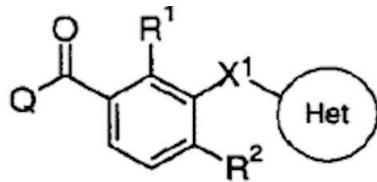


(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 およびXは前記の意味を表す。)で示される中間体を得、次いでシアナイド源を触媒として反応させることにより、上記一般式(1)で示される化合物を製造する方法

エ 本件訂正発明4と引用発明2との一致点及び相違点

(ア) 一致点

式Ia



Ia

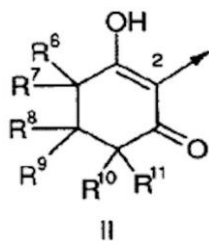
[但し、 R^1 が、ハロゲンを表し、

R^2 が、 $-S(O)_nR^3$ を表し、

R^3 が水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

nが1又は2を表し、

Qが2位に結合する式II



[但し、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 及び R^{11} が、それぞれ水素又は $C_1\sim C_4$ アルキルを表し、上記 CR^8R^9 単位が、 $C=O$ で置き換わっていても良い]

で表されるシクロヘキサン-1, 3-ジオン環を表す]

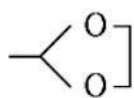
で表される2-ベンゾイルシクロヘキサン-1, 3-ジオンの製造方法であって、置換又は非置換のシクロヘキサン-1, 3-ジオンQを、アシル化剤でアシル化し、適宜触媒の存在下に、アシル化生成物を転位させて化合物I aを得ることを特徴とする製造方法。

(イ) 相違点3

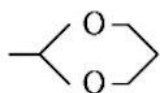
本件訂正発明4は、 X^1 が、酸素により中断されたエチレン鎖又は $-CH_2O-$ であるのに対し、引用発明2においては、対応する基が、 $-OCH_2-$ である点

(ウ) 相違点4

本件訂正発明4は、Hetが、オキシラニル、2-オキセタニル、3-オキセタニル、2-テトラヒドロフラニル、3-テトラヒドロフラニル、2-テトラヒドロチエニル、2-ピロリジニル、2-テトラヒドロピラニル、2-ピロリル、5-イソオキサゾリル、2-オキサゾリル、5-オキサゾリル、2-チアゾリル、2-ピロリジニル、1-メチル-5-ピラゾリル、1-ピラゾリル、3, 5-ジメチル-1-ピラゾリル、若しくは4-クロロ-1-ピラゾリル、又は上記のうち初めの3つを除いたものの何れかであるのに対し、引用発明2においては、対応する基が、



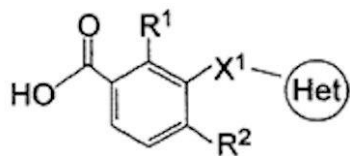
又は



である点

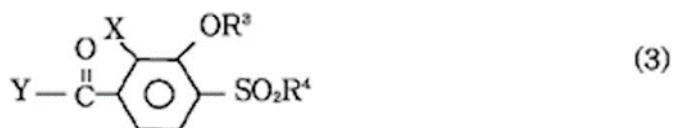
(エ) 相違点5

本件訂正発明 4 は、アシル化剤がカルボン酸 III b'



III b'

であるのに対し、引用発明 2 においては、アシル化剤が一般式 (3)



(本件審決注：Yは、ハロゲン原子である。他の置換基は省略する。) で示されるベンゾイルハライド誘導体、すなわち、カルボン酸ハライドである点

4 取消事由

- (1) 本件訂正の可否 (取消事由 1)
- (2) 実施可能要件に係る判断の誤り (取消事由 2)
- (3) サポート要件に係る判断の誤り (取消事由 3)
- (4) 本件訂正発明の容易想到性に係る判断の誤り (取消事由 4)
- (5) 原文新規事項追加に係る判断の誤り (取消事由 5)

第 3 当事者の主張

1 取消事由 1 (本件訂正の可否) について

[原告の主張]

(1) マーカッシュ・クレームの補正に関する審査基準によれば、補正により選択肢を削除して特定の選択肢の組合せを請求項に残すことによって、新たな技術的事項を導入することとなる場合があるから、補正後の選択肢が当初明細書等の記載の範囲にあるからといって当該補正が許容されるわけではない。訂正についても同様である。

(2) 請求項1に係る本件訂正は認められない。請求項1に係る本件訂正は、H e tにつき「18個の選択肢」に限定するものであるが、本件明細書の【0061】、表A及び表37によつては、H e tに関する「18個の選択肢」は把握できないし、X¹が「酸素により中断されたエチレン鎖または—CH₂O—」を表す場合に、H e tが「18個の選択肢」であると把握することはできない。審決の予告を受けて、特定のX¹とH e tの組合せを選択したという本件訂正に至る経緯（甲90、91）を考慮しても、本件審決の「H e tが(【0061】記載の)12個である場合に式I aの、H e t以外の置換基や部分構造が特定のものに限られるというものでもない」とした認定は誤りである。特許請求の範囲の減縮だからといって、新規事項の追加でないとはいえない。

(3) 本件訂正は、本件明細書の方法Cにより生産できないものを含んでいた本件発明の広範なX¹とH e tの組合せの中から、上記方法Cにより適宜生産できると被告が主張し得る範囲のX¹とH e tの特定の組合せを任意に残したものである。そして、本件訂正後のX¹とH e tの組合せであれば方法Cにより生産できることが本件明細書に開示ないし示唆されているとはいえないから、この点からも、本件訂正後のX¹とH e tの特定の組合せを任意に選択することは、新規な技術的事項を追加するものである。

(4) 請求項3に係る本件訂正は認められない。請求項1と同様、H e tが特定の「15個の選択肢」であること、X¹が「酸素により中断されたエチレン鎖または—CH₂O—」のときにH e tが特定の「15個の選択肢」であることは記載されていない。

〔被告の主張〕

(1) 本件訂正は、本件特許に係る特許侵害訴訟における訂正の再抗弁の予備的主張及び無効審判事件における審決の予告を受けて行ったものである。X¹は審決の予告で製造可能(例えば、原料化合物を入手できる範囲)とされた5種のうち訂正の再抗弁に合う2種とした。H e tは、甲62に示されたアルコール原料に由来するH

e t から，訂正の再抗弁の予備的主張に係る X^1 の結合の形成には関与しないアルコールに由来する H e t を削除し，本件明細書の合成例で用いられたことにより，入手の可否が既に証明されていたアルコール材料から得られる H e t を合わせて 18 種類の H e t とした。本件訂正は，審査基準に沿うもので，新規事項の追加ではない。第三者にとって不測の不利益も生じない。

(2) 本件明細書の【0061】，表A及び表37には多くの置換基が挙げられているとしても，その中で該当する置換基を参照することは容易である。本件明細書の【0061】に H e t と X^1 との特定の組合せの記載があるかではなく，方法Cの説明（【0050】【0051】）と，合成実施例の工程bと，H e t としての開示（【0061】，表A及び表37）があれば，請求項1における全ての化合物が明細書に開示されていると理解できる。

2 取消事由2（実施可能要件に係る判断の誤り）について

〔原告の主張〕

(1) 化合物の生産について

ア 本件明細書には，本件発明に該当する1の化学物質の合成例（【0131】～【0134】）及び7個の化学物質（【0135】表37）が具体的に記載されているが，これらはごく限られた種類のものである。当該合成例の反応条件，試薬及び溶媒が，方法Cに関する反応条件として示されている極めて広範囲に記載された【0052】～【0056】の範囲内であったとしても，本件訂正発明1及び3に係る化学物質を生産することにつき，当業者に通常期待し得る程度を超える試行錯誤が要求されるというべきである。

イ X^1 が「 $-CH_2OCH_2-$ 」である化学物質の合成方法（方法C）と， X^1 が「 $-CH_2O-$ 」である工程bとを関連付けるべきでない。すなわち，方法Cにおける X^1 ， X^2 ， X^3 の定義「 X^2 が，炭素原子が少なくとも1個で，最大5個の，直鎖又は分枝アルキレン鎖，…を表し， X^3 が，最大5個の炭素原子を有する，直鎖又は分枝アルキレン鎖…を表し，且つ X^2OX^3 は基 X^1 を形成する」からは， X^3 が単結

合（つまり、炭素原子を含まず、且つ鎖でもないもの）ではないことが明確であるから、方法Cは、 X^1 が「 $-CH_2OCH_2-$ 」等の場合に関するものであって、「 $-CH_2O-$ 」の場合は含まない。

ウ 甲56は出願10年後の実験であり、参酌できない。

(2) 化合物を使用できることについて

ア 本件明細書には、化学物質の施与率が非常に広範な数値範囲で示されているだけであり（【0129】）、「使用実施例」などとして、除草作用の検証方法の概要が示されているにすぎず（【0136】～【0140】）、本件明細書には、実際に試験を行った結果は、何ら記載されていない。そうであるにもかかわらず、本件審決が、常法に従い除草のために施用できることは明らかであり、施用すれば、常法に従い除草特性を確認することができることは明らかであるとして、実施可能要件を満たすとした判断は誤りである。

イ 化学物質発明の有用性をその化学構造だけから予測することは困難であり、試験してみなければ判明しないことは当業者の広く認識するところである。化学物質の発明の有用性を知るには、実際に試験を行い、その試験結果から、当業者にその有用性が認識できることを要する。

仮に、当業者が「常法に従い除草特性を確認」したとしても、本件明細書にはいかなる実験結果も記載されていないのであるから、当該化学物質を使用するためには、当業者に通常期待し得る程度を超える試行錯誤が要求されるというべきである。

ウ ①甲99の「化学物質番号55」は本件共通構造を有するにもかかわらず、本件訂正明細書に記載の施与量の上限の約1.5倍（4.48kg/h a）で試験された雑草にも除草効果を示さなかった。また、②甲101の本件共通構造を有する6つの化学物質は、引用例1ないし4よりも多い80g/h aの施与量で行った実験において、いずれの雑草（カラスムギ、シヨクヨウガヤツリ、イヌビエ、イチビ）に対しても除草活性を示していない。上記①及び②からすれば、「シクロヘキサン-1, 3-ジオンの2位がカルボニル基を介して中央のベンゼン環に結合した

構造」(以下「本件共通構造」という。)上の置換基の種類・組合せが、除草活性の発現に大きく影響することは明らかであり、本件共通構造を有する化学物質が必ずしも除草活性を示すものではない。

[被告の主張]

(1) 化合物の生産について

化合物の生産については、審決の予告で実施可能要件を充足すると判断された化合物のみを含むよう訂正した。結合生成ができることについて、 $-X^1-He t$ の結合部分以外は当事者間に争いはない。また、本件審決は、請求項1の18の $He t$ につき、 $HO-CH_2-He t$ の化合物が入手できること、請求項1に係る化合物が製造できることを認定した。 X^1 が $-CH_2O-$ 、 $-CH_2-O-CH_2-$ の化合物が合成できることは、本件明細書に開示されている。

(2) 化合物を使用できることについて

本件訂正明細書には、化合物の構造の詳細、製造例(【0130】～【0134】)、除草剤組成物の調製(【0110】～【0129】)が十分に開示されており、本件化合物を除草剤として使用できる。

使用すること(除草特性)について、当業者は、除草作用が認められるベンゾイルシクロヘキサジオンについて、化合物の開発を試みていた。本件訂正明細書の記載(使用実施例の記載。【0136】～【0141】)、周知技術(甲2～4, 19, 99)から化合物の除草作用が理解できるし、実験データは不要である。化合物、対象の全てについてデータを揃えることは実務的に不可能である。

3 取消事由3(サポート要件に係る判断の誤り)について

[原告の主張]

(1) 本件訂正発明の解決課題について

本件訂正明細書には、除草剤の有効成分の「候補化合物となる化合物」を提供することが課題であるとの記載はない。本件訂正発明の課題は、実際に除草作用を有することにより除草剤の有効成分となる化合物を提供することにあるというべきで

ある。

(2) 化合物の除草特性について

ア 本件訂正明細書には、本件訂正発明に係る化学物質が除草活性を有することを裏付ける具体的な記載（試験データ）は何もない。また、被告による実験成績証明書（甲 5 1， 5 2， 6 3）において、本件訂正発明に係る化学物質の優れた効果が示されているものの、これらの除草作用の試験をしたのは本件出願日から 10 年以上後である。

イ 本件共通構造を持った化合物であれば、必ず除草活性を示すという技術常識はない（甲 9 9， 1 0 1）。また、本件訂正発明がサポート要件を満足するとの根拠（化学構造上の共通性）として本件審決が示した従来技術（引用例 1 ないし 4）は限られた先行技術であって、当業者の技術常識とはいえない。

(3) 化合物の生産について

本件明細書には、本件訂正発明 1 及び 3 に係る化合物を当業者が実際に生産し得る程度の具体的な合成方法ないし合成例が記載されていない。本件明細書記載の方法 C に準じて適宜生産し得るというだけでは、サポート要件を満たすとはいえない。

〔被告の主張〕

(1) 特許請求の範囲に記載された発明は、発明の詳細な説明に記載された発明で、「発明の詳細な説明の記載により、出願時の技術常識に照らし」当業者が当該発明の課題を解決できると認識し得る範囲のものである（本件訂正明細書【0007】【0008】【0011】及び【0109】）。また、特許請求の範囲に記載された発明が、発明の課題を解決するに足る有用性を有していることが発明の詳細な説明に記載されていれば足りるところ、本件訂正明細書【0005】【0109】の記載から有用性を認識することができ、被告が補足的に提出した実験成績証明書（甲 5 1， 5 2， 6 3）から、本件訂正明細書【0109】に記載された効果を奏することが確認できる。

(2) 本件訂正発明の解決課題について

「候補化合物」なる用語は、一般に医薬関係で用いられ、新薬となる以前の化合物を含む請求項1の化合物全体を表現したにすぎない。本件訂正発明については、除草特性が改良された化合物の発明であって、除草剤の発明ではない。本件審決は、このことを、「本願発明1及び3の課題は、除草特性が改良された化合物であって、除草剤の有効成分又はその候補化合物となる化合物を提供することである」と認定判断したものである。また、本件訂正発明は、キラル中心等を発明の課題とするものでもない。

(3) 化合物の除草特性について

本件訂正発明は、除草特性が改良された化合物の発明であって、除草剤の発明ではない。本件訂正発明の化合物の構造を見れば、当業者は、その化合物の有用性を認識することができ、これを生産した後は、常法に従い除草特性を確認することができる。

化学物質発明の効果が直接に示される必要はなく、従来技術(乙1～4)を参照して明細書の記載を見ることによって、除草特性が改良されているであろうとの推測がなされれば、課題を解決することができることと認識されるべきである。

(4) 化合物の生産について

前記2〔被告の主張〕(1)記載のとおりである。

4 取消事由4(本件訂正発明の容易想到性に係る判断の誤り)について

〔原告の主張〕

(1) 「化合物が生産できれば、除草特性は常法で確認できる(化合物の構造の共通性に基礎付けられる)。」という本件審決のサポート要件の理由付け及び論理が、万が一容認されるのであれば、当業者は、引用例1記載の一般手順中の「(5)フェノール」に代えて、甲69等で公知の出発原料を用いることにより、本件訂正発明1及び3の化合物を生産できることを認識できる。そして、当該化合物も本件共通構造を有するから、除草特性を常法に従って確認できる。

したがって、本件訂正発明は、引用例1の記載及び甲69等に示される技術常識

に基づいて、容易に想到することができる。

(2) 本件共通構造を有する除草活性化合物の技術分野において、置換基を種々変更して得られた化合物の除草特性を確認してみることは広く行われていたことであるから、当業者にはそのような動機付けがある。本件訂正発明の解決課題が単に常法に従って除草特性を確認できる化合物の提供に止まるのであれば、引用発明1の発明者も数多くのシクロヘキサジオン誘導体を合成して除草特性を確認したように(引用例1【0010】)、中央のベンゼン環の2～4位を他の基に置き換えることに動機付けがある。

ア 相違点1について

引用例2に記載の化合物は本件共通構造を有し、当該化合物のベンゼン環の4位(本件訂正発明の R^2)は、本件訂正発明と同じアルキルスルホニル基($-S(O)_nR^3$)である。また、引用例2には、当該化合物が比較薬剤とされた化合物よりも優れた除草特性を有していることが記載されている。したがって、当業者は、相違点1に係る構成を有する化合物を生産して除草特性を確認することを動機付けられている。

イ 相違点2について

引用例2には、Hetの完全飽和ヘテロシクリル基に対応する「1,3-ジオキサラン-2-イル」が開示され(本件明細書の【0061】にも例示されている。)、当該化合物が優れた除草特性を有していることが記載されている(引用例2の【0058】ないし【0063】)。したがって、当業者は、引用発明1においてHetに対応するフェニル基を、引用例2の置換基である「完全飽和ヘテロシクリル基」等に変更することを動機付けられている。そして、本件訂正発明1及び3の具体的なHetに限定することについては、引用例1の一般手順中の対応する出発物質((5)のフェノール)を完全飽和ヘテロシクリル基に対応する出発物質に変更してみることが動機付けられている。

(3) 得られた化合物の除草特性を常法に従い確認できるので、本件訂正発明は格

別顕著な効果を奏するものでない。

〔被告の主張〕

(1) 容易想到性の判断の過程において事後分析的思考を用い、先行技術の内容の検討に本件訂正発明の「解決手段」ないし「解決結果」の要素を意識的にとりこむ、原告の主張は誤りである。サポート要件(発明が課題を解決するように記載されているかどうか)の判断と、発明の進歩性の判断における動機付けの有無の判断が相関性を有するという原告の主張の前提は誤りである。

(2) 引用発明1との相違点に引用例2ないし4を組み合わせる動機付けはない。課題が解決されている引用発明1に、改めて引用発明2を組み合わせる動機はない。引用例2の比較化合物A及びD(ベンゼン環の4位にアルキルスルホニルが存在する。)が、他の比較化合物に比して、とりわけ優れているわけでもなく、上記A及びDの構成を採用する動機付けはない。さらに、引用発明1のベンゼン環4位は塩素に固定されていて、塩素を他の基に変更する可能性が示されていない。

相違点2についても、引用例2から、引用例1の化合物の除草効果向上又は作物に対する薬害低下のための示唆は得られず、これを引用発明1に適用する動機付けはない。また、甲69も所定の用途での使用について記載するものではなく、引用発明1の材料として2-ヒドロキシテトラヒドロフランを用いることを読み取ることとはできない。

引用例1及び2の製造方法からは、本件訂正発明のX¹とH e tとの結合を要する化合物は合成できない。

引用例2ないし4を勘案したとしても、引用例1の化合物に対し、引用例2ないし4のヘテロシクリルを組み込むことは不可能である(X¹が-CH₂O-の化合物は、引用例1ないし4から容易に想到することができない。)

5 取消事由5(原文新規事項追加に係る判断の誤り)について

〔原告の主張〕

本件明細書のX¹の定義は、国際出願明細書のX¹の定義を個別化したものである。

本件明細書の X¹ の定義は、国際出願明細書に具体的に示されている 8 個の X¹ の記載から導き出せない。新たな技術的事項を導入するものであるから、このような補正は許されない。

〔被告の主張〕

本件訂正は「(当初明細書に記載した事項以外の)個別化」には当たらない(取消事由 1 と同じ)。

請求項 1 及び 3 の X¹ は、国際出願明細書に含まれ、何ら問題はない。

第 4 当裁判所の判断

1 本件訂正発明について

(1) 本件訂正発明に係る特許請求の範囲は、前記第 2 の 2 (2) のとおりであり、本件訂正明細書 (甲 9 2) には、おおむね以下の記載がある。

ア 背景技術、発明が解決しようとする課題

本発明は、式 I で表される 2-ベンゾイルシクロヘキサノール-1, 3-ジオン又はその農業上有用な塩に関する (【0001】 【0002】)。

さらに本発明は、式 I の化合物を製造する方法及びそのための中間体、化合物 I を含む組成物、式 I の化合物の使用、並びに有害植物防除用としての化合物 I を含む組成物に関する (【0003】)。

2-ベンゾイルシクロヘキサノール-1, 3-ジオンは、文献、例えば EP-A 2 7 8 7 4 2, EP-A 2 9 8 6 8 0, EP-A 3 2 0 8 6 4 及び WO 9 6 / 1 4 2 8 5 に開示されている (【0004】)。

しかしながら、従来技術の化合物が示す除草特性及びその栽培植物の安全性は、完全に満足できるものではない (【0005】)。

本発明の目的は、新規な、特に除草作用において、特性が改良された化学物質を提供することにある (【0006】)。

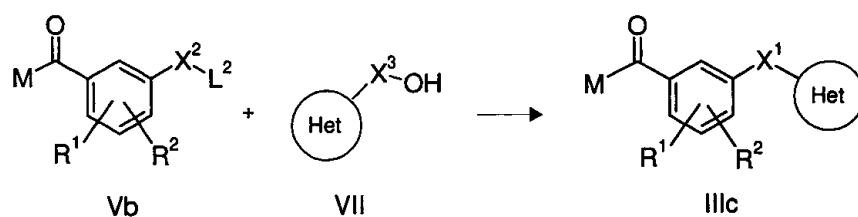
本発明者等は、この目的が式 I の 2-ベンゾイルシクロヘキサノール-1, 3-ジオン及びその除草作用により達成されることを見出した (【0007】)。

さらに本発明者等は、化合物 I を含み極めて良好な除草作用のある除草剤組成物を見出した。さらに、本発明者等は、これら組成物を製造する方法及びこの化合物 I を用いて望ましくない植生を制御する方法を見出した（【0008】）。

イ 式 I の化合物の合成についての一般的な記載

方法 C :

適当な置換ヘテロシクリル V II を安息香酸エステル V b で置換して、本発明の安息香酸エステル III c を得る；（【0050】）



（【0051】【化14】）

一般に、出発材料は等モル量で用いられる。しかしながら、過剰量の出発材料又は他の成分を使用することが有利であろう（【0052】）。

適宜、反応を塩基の存在下で行うことが有利であろう。出発材料及び補助塩基は、等モル量で用いることが有利である。特定の場合、V II に対して、過剰量の補助塩基、例えば 1.5 ~ 3 モル等量用いることが有利であろう（【0053】）。

適当な補助塩基は、第三級アルキルアミン（例えば、トリエチルアミン、ピリジン）、アルカリ金属炭酸塩（例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム）、アルカリ金属水素化物（例えば、水素化ナトリウム）である。トリエチルアミン、ピリジン及び炭酸カリウムを用いることが好ましい（【0054】）。

適当な溶剤の例としては、塩素化炭化水素（例えば、塩化メチレン、1,2-ジクロロエタン）、芳香族炭化水素（例えば、トルエン、キシレン、クロロベンゼン）、エーテル（例えば、ジエチルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン）、非プロトン性極性溶剤（例えば、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド）、又はエステル（例えば、

酢酸エチル) , 或いはこれらの混合物である (【0055】)。

一般に反応温度は, 0℃~反応混合物の沸点の間である (【0056】)。

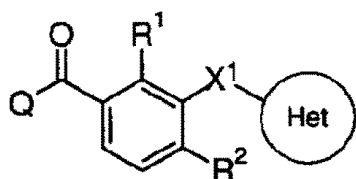
ウ 例示の記載

他の意味の例として, 下記のことを挙げる事ができる: …

ヘテロシクリル, 及びヘテロシクリルオキシのヘテロシクリル基: 酸素, 窒素及び硫黄原子から選ばれる1~3個のヘテロ原子を有する3~7員の飽和又部分不飽和の単環もしくは多環ヘテロシクリル, 例えば, オキシラニル, 2-テトラヒドロフラニル, 3-テトラヒドロフラニル, 2-テトラヒドロチエニル, …, 2-ピロリジニル, …, 2-テトラヒドロピラニル, …

ヘテロアリアル, 及びヘテロアリアルオキシのヘテロアリアル基: 炭素環員とは別に, 1~4個の窒素原子, 又は1~3個の窒素原子と1個の酸素又は硫黄原子, 又は1個の酸素原子, 又は1個の硫黄原子をさらに有していても良い芳香族の単環もしくは多環基, 例えば, …2-ピロリル, …, 5-イソオキサゾリル, …, 2-オキサゾリル, …, 5-オキサゾリル, 2-チアゾリル, …, 2-ピリジニル, … (【0061】)。

エ 式I aの化合物についての記載



Ia

以下の式I aで表される化学物質が最も好ましい。即ち, 置換基R¹, R²及びQがそれぞれ上記と同義であり, X¹が, 1個の他の酸素原子を含むC₁~C₂アルキレン鎖又はC₂アルキニレン鎖を表し, そしてHetが, 3~6員, 好ましくは5員又は6員の部分飽和若しくは完全飽和ヘテロシクリル基, 又は下記の3個の群: 即ち, 窒素, 酸素と少なくとも1個の窒素との組み合わせ, 又は硫黄と少なくとも1個の窒素との組み合わせ, 特に好ましくは以下の2個の群: 即ち, 窒素, 又は酸

素と少なくとも1個の窒素との組み合わせから選択される3個まで、特に好ましくは1個又は2個のヘテロ原子を有する、3～6員、好ましくは5員又は6員のヘテロ芳香族基を表し、且つこのヘテロシクリル基又はヘテロ芳香族基は、部分的に又は完全にハロゲン化されていても、及び／又はR⁵で置換されていても良い（【0068】）。

さらに、以下の、本発明の式Iaで表される化学物質が極めて最も好ましい。即ち、置換基R¹、R²及びX¹がそれぞれ上記と同義であり、Hetが、5員又は6員の部分飽和若しくは完全飽和ヘテロシクリル基、又は下記の3個の群：即ち、窒素、酸素と少なくとも1個の窒素との組み合わせ、又は硫黄と少なくとも1個の窒素との組み合わせ、特に好ましくは以下の2個の群：即ち、窒素、又は酸素と少なくとも1個の窒素との組み合わせから選択される3個まで、特に好ましくは1個又は2個のヘテロ原子を有する、5員又は6員のヘテロ芳香族基、を表し、且つこのヘテロシクリル基又はヘテロ芳香族基は、部分的に又は完全にハロゲン化されていても、及び／又はR⁵で置換されていても良い（【0069】）。

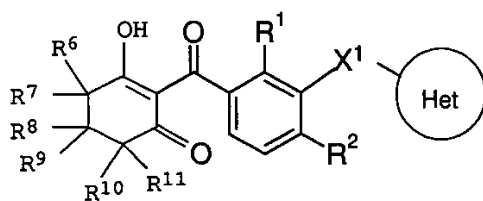
オ 表1～36の式Ibの化合物についての記載

下記の表1～36の化学物質Ibが特に好ましい（【0070】）。

表A

No.1～920まで物質が列挙され、そのうち実施例として、オキシラニル（No.116）、2-オキセタニル（No.118）、3-オキセタニル（No.131）、2-ピロリル（No.146）、5-イソオキサゾリル（No.168）、2-オキサゾリル（No.185）、5-オキサゾリル（No.187）、2-チアゾリル（No.188）、1-メチル-5-ピラゾリル（No.195）、2-ピリジニル（No.204）が記載されている（【0071】）。

下記の表1～36は、式Ibで表される2-ベンゾイルシクロヘキサン-1,3-ジオンに基づくものである。



Ib

表 1 : 化合物 1. 1 ~ 1. 9 2 0

R^1 が塩素, R^2 がメチルスルホニル, $R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}$ 及び R^{11} がそれぞれ水素であり, そして個々の化合物について, 置換基 X^1 及びH e tが表Aの各行に対応する式I bで表される化合物 (【0072】~【0074】)。

カ 除草剤用途についての記載

化合物 I 及びその農業上有用な塩は, 異性体混合物, また純粋な異性体の形態で, 除草剤として好適である。I を含む除草剤組成物は, 非栽培領域の植生の制御に, 特に高い施与率で効果的である。これらの組成物は, オオムギ, 米, トウモロコシ, 大豆, 及び綿花等の作物の中の広葉の雑草及びイネ科の雑草 (U n k r a e u t e r u n d S c h a d g r a e s e r) に対して, 栽培植物に損傷を与えることなく作用する。この効果は, 主に低施与率で観察される (【0109】)。

施与方法の相違によるが, 化合物 I 又はこれらを含む組成物は, 更に多くの栽培植物に, 望ましくない植物の除去のために使用することができる。適当な作物として以下のものを挙げるができる :

タマネギ (A l l i u m c e p a)

パイナップル (A n a n a s c o m o s u s)

ナンキンマメ (A r a c h i s h y p o g a e a)

… (【0110】)。

直接使用可能な製剤の有効成分 I の濃度は, 広い範囲で変更することができる。一般に, その処方は, 少なくとも 1 種の有効成分を, 0.001 ~ 98 重量%, 好ま

しくは0.01～95重量%の量で含む。有効成分は90～100%の純度（NMRスペクトルによる）のもの、好ましくは95～100%の純度のものが使用される（【0118】）。

本発明の化合物Iの製造を、下記の調製例に示す：

I：20重量部の化合物Iを、80重量部のアルキル化ベンゼン、10重量部の、オレイン酸N-モノエタノールアミド（1モル）のエチレンオキシド（8～10モル）付加体、5重量部のドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム及び5重量部の、ヒマシ油（1モル）のエチレンオキシド（40モル）付加体からなる混合物に溶解させる。この溶液を100000重量部の水に注ぎ、その中で微細に分散させ、これにより0.02重量%の有効成分を含む水性分散液を得る（【0119】）。

有効化合物（物質）の施与率は、施与目的、季節、対象の植物および成長段階に応じて、1ヘクタールあたり0.001～3.0kgの有効物質（a. s.）の量、好ましくは0.01～1.0kgの量である（【0129】）。

キ 合成実施例の記載

出発材料と生成物の幾つかの合成を、以下に記載する（【0130】）。

{2-クロロ-3-[(1-メチルピラゾール-5-イル)オキシメチル]-4-メチルスルホニルフェニル} {5,5-ジメチル-1,3-ジオキソシクロヘキサ-2-イル} メタノン

工程a：2-クロロ-3-ブロモメチル-4-メチルスルホニル安息香酸メチル80g（0.3モル）の2-クロロ-3-メチル-4-メチルスルホニル安息香酸メチル、54g（0.31モル）のN-ブロモスクシンイミド及び1.5gのアゾイソブチロニトリルを、76℃で6時間攪拌した。反応混合物をろ過し、そして減圧下に溶剤を除去した。収量：104g；融点：83～85℃（【0131】）。

工程b：2-クロロ-[(1-メチルピラゾール-5-イル)オキシメチル]-4-メチルスルホニル安息香酸メチル4.3g（44ミリモル）の1-メチル-5-ヒドロキシピラゾール、9.1gの炭酸カリウム及び100mlのテトラヒドロフラ

ンを、65℃で1時間加熱した。この混合物に、15g（44ミリモル）の2-クロロ-3-ブロモメチル-4-メチルスルホニル安息香酸メチル及び150mlのテトラヒドロフランを添加し、40℃で4時間加熱した。この混合物を、12時間攪拌し、減圧下に溶剤を除去し、酢酸エチルに溶解し、炭酸水素ナトリウム溶液及び水で洗浄し、乾燥し、そして溶剤を除去した。粗生成物を、シリカゲル上で精製した（溶離液：シクロヘキサン／酢酸エチル＝1／1）。収量：7.6g；融点70℃（【0132】）。

工程c：2-クロロ-〔（1-メチルピラゾール-5-イル）オキシメチル〕-4-メチルスルホニル安息香酸30mlのテトラヒドロフランと30mlの水との混合物中の、6.95g（19ミリモル）の2-クロロ-〔（1-メチルピラゾール-5-イル）オキシメチル〕-4-メチルスルホニル安息香酸メチルを、0.93gの水酸化リチウムを用いて室温で12時間処理した。10%濃度塩酸を用いて反応混合物のpHを4に調整し、塩化メチレンで抽出した。有機層を乾燥し、溶剤を除去した。収量：4.3g；融点197℃（【0133】）。

工程d：{2-クロロ-3-〔（1-メチルピラゾール-5-イル）オキシメチル〕-4-メチルスルホニルフェニル}{5,5-ジメチル-1,3-ジオキソシクロヘキサ-2-イル}メタノン50mlのアセトニトリル中の、1.0g（2.9ミリモル）の2-クロロ-3-〔（1-メチルピラゾール-5-イル）オキシメチル〕-4-メチルスルホニル安息香酸、0.4g（2.9ミリモル）のジメドン及び0.72gのN,N-ジシクロヘキシルカルボジイミドを、40℃で4時間加熱した。反応混合物を室温で12時間攪拌させた後、0.87gのトリエチルアミン及び0.57gのトリメチルシリルニトリルを添加した。その後、反応混合物を40℃で6時間加熱し、ろ過し、減圧下に溶剤を除去し、そして残留物をシリカゲル上で精製した（溶離液：トルエン／テトラヒドロフラン／酢酸：100／0／0～4／1／0.1）。収量：0.25g；融点82℃（【0134】）。

ク 表37の化合物についての記載

表37には、No.37. 1～37. 7まで7種の物質が列挙され、1-ピラゾリル (No.37. 1。以下同じ。)、3, 5-ジメチル-1-ピラゾリル (37. 2, 37. 4, 37. 6)、4-クロロ-1-ピラゾリル (37. 3, 37. 5, 37. 7) が記載されている (【0135】)。

ケ 使用実施例の記載

[使用実施例]

式Iで表される置換2-ベンゾイルシクロヘキサン-1, 3-ジオンの除草作用を下記の温室実験で示した (【0136】)。

プラスチック植木鉢を栽培容器として用い、約3.0%の腐葉土を含むローム質砂を培養基とした。被検植物の種子を種類ごとに播種した (【0137】)。

事前法 (pre-emergence treatment) により、水中に懸濁または乳化させた有効成分を、種子を撒いた後に微細散布ノズルを使用して直接撒布した。出芽と成長を促進させるために容器を軽く灌水し、次いで植物が根付くまで透明のプラスチックの覆いを被せた。有効成分により害が与えられない限り、この被覆が被検植物の均一な出芽をもたらす (【0138】)。

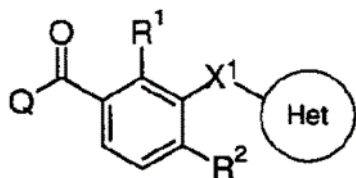
事後法 (post-emergence treatment) により、被検植物を、発育型によるが、草丈3～15cmとなった後、水中に懸濁または乳化させた有効成分で処理することのみを行った。この目的のため、被検植物を直接播種し同一の容器で栽培することも、当初は別々に苗として植え、処理の行われる2～3日前に試験用容器に移植することも可能である (【0139】)。

各被検植物を種類により、10～25℃または20～35℃に保持し、実験期間を2～4週間とした。この間、被検植物を管理し、個々の処理に対する反応を評価した (【0140】)。

(2) 前記(1)によれば、本件訂正発明の概要は以下のとおりである。

ア 本件訂正発明は、式Iで表される2-ベンゾイルシクロヘキサン-1, 3-ジオン又はその農業上有用な塩に関する (【0001】 【0002】)。

イ 本件発明に係る化学物質（安息香酸エステル的一种）は，適当なヘテロシクル等を安息香酸エステルで置換して得られる（方法C）。下記式I aで表される



Ia

化合物が最も好ましい。すなわち，Qがシクロヘキサノール，3-ジオン環，X¹が，1個の他の酸素原子を含むC₁~C₂アルキレン鎖又はC₂アルキニレン鎖を表す。そして，Hetが，3~6員，好ましくは5員又は6員の部分飽和若しくは完全飽和ヘテロシクル基，又は下記の3個の群：すなわち，窒素，酸素と少なくとも1個の窒素との組合せ，又は硫黄と少なくとも1個の窒素との組合せ，特に好ましくは以下の2個の群：すなわち，窒素，又は酸素と少なくとも1個の窒素との組合せから選択される3個まで，特に好ましくは1個又は2個のヘテロ原子を有する，3~6員，好ましくは5員又は6員のヘテロ芳香族基を表し，且つこのヘテロシクル基又はヘテロ芳香族基は，部分的に又は完全にハロゲン化されていても，及び/又はR⁵で置換されていても良い。（【0050】【0051】【0068】）

（本件訂正発明1（又は3）に係る化学物質は，上記式I aにおいて，R¹をハロゲン，R²を-S(O)_nR³，X¹を酸素により中断されたエチレン鎖又は-CH₂O-，Hetを特定の18種類（又は15種類）のヘテロ環構造に限定した化学物質である。）

ウ 本件訂正発明に係る化学物質及びその農業上有用な塩は，異性体混合物，また純粋な異性体の形態で，除草剤として好適に用いられ，非栽培領域の植生の制御に，特に高い施与率で効果的で，オオムギ，米，トウモロコシ，大豆，及び綿花等の作物の中に広範囲に残った雑草及び牧草に対して，栽培植物に損傷を与えることなく作用する（【0109】）。

2 取消事由1（本件訂正の可否）について

(1) 本件訂正は、審決の予告（甲90）において実施可能要件に係る記載不備が指摘されたことに対して、明細書に明示的に記載されていた置換基 X^1 及びH e tの選択肢（【0061】，表A及び表37）を，CAS REGISTRY物質レコード（甲69）に示されていることから入手できることが確認された原料物質より合成される化学物質に限定したものである。すなわち，本件訂正発明は，本件発明の R^1 を1種類（ハロゲン）， R^2 を1種類（ $-S(O)_nR^3$ ）， X^1 を2種類（酸素により中断されたエチレン鎖又は $-CH_2O-$ ），H e tをヘテロシクリル基及びヘテロ芳香族基（ヘテロアール）のうちの本件明細書に挙げられている多数の物質の中から18種類又は15種類の化合物に限定したものである。そして，本件訂正後の化学物質群は，いずれも本件訂正前の請求項に記載された各選択肢に内包されていることが明らかである。したがって，本件訂正は，特許請求の範囲を減縮するものである。

また，訂正後の化学物質群は，訂正前の基本骨格（シクロヘキサン-1，3-ジオンの2位がカルボニル基を介して中央のベンゼン環に結合した構造。本件共通構造）を共通して有するものである。加えて，訂正後の化学物質群について，訂正前の化学物質群に比して顕著な作用効果を奏するとも認め難い。そうすると，選択肢を削除することによって，本件明細書の全ての記載を総合することにより導かれる技術的事項との関係において，新たな技術的事項を導入するものではない。

このように，本件訂正は，特許請求の範囲の減縮を目的とし，また，本件明細書に開示された技術的事項に新たな技術的事項を導入するものでないから，本件明細書の全ての記載を総合することにより導かれる技術的事項の範囲内である。

したがって，本件訂正は，特許法134条の2第9項が準用する126条5項の規定に違反しない。

(2) 原告の主張について

ア 原告は，選択肢を削除する訂正が認められるのは，特定の選択肢の組合せを採用することが当初明細書等に記載されているといえる場合だけであり，本件明細

書の【0061】は、多種多様なヘテロシクリルやヘテロ芳香族基（ヘテロアリアル）を、単に「列挙」しているにすぎず、本件明細書の他の記載を参酌しても、訂正後のH e tの「18個の選択肢」やそれらと特定のX¹（酸素により中断されたエチレン鎖又は—CH₂O—）との組合せは記載されていないことから、本件訂正は新たな技術的事項を導入するものであり、認められない、特許庁の審査基準においても同旨の考え方が採用されていると主張する。

（ア） 特許庁「特許・実用新案審査基準」の第IV部第2章（甲35）には、特許請求の範囲の補正、特に下位概念化及びマーカッシュ形式のクレームについて、以下のように記載されている。

「(2) 発明特定事項を下位概念化又は付加する補正の場合

a 請求項の発明特定事項の一部を限定して、当初明細書等に明示的に記載された事項又は当初明細書等の記載から自明な事項まで下位概念化する補正は、新たな技術的事項を導入するものではないので許される。

b 請求項の発明特定事項を下位概念化する補正が当初明細書等に明示的に記載された事項又は当初明細書等の記載から自明な事項までは下位概念化しない補正であっても、この補正により新たな技術上の意義が追加されないことが明らかな場合であれば、新たな技術的事項を導入するものではない。したがって、このような補正は許される。

c 他方、請求項の発明特定事項を下位概念化する補正であっても、この補正により当初明細書等に記載した事項以外のものが個別化されることになる場合は、その補正は、新たな技術的事項を導入するものである。したがって、このような補正は許されない。」

「(5) マーカッシュ形式等の択一形式のクレームについてする補正の場合

a マーカッシュ形式等の択一形式で記載された請求項において、一部の選択肢を削除する補正は、残った発明特定事項で特定されるものが新たな技術的事項を導入するものではない場合には許される。

b 当初明細書等に化学物質が多数の選択肢群の組合せの形で記載されている場合に、以下の(i)又は(ii)の補正により追加された、又は残された特定の選択肢の組合せが新たな技術的事項を導入するものではないとは認められない場合がある。

(i) 当初明細書等に記載された多数の選択肢の範囲で特定の選択肢の組合せを請求項に追加する補正

(ii) 選択肢を削除した結果として特定の選択肢の組合せが請求項に残る補正

例えば、補正の結果、出願当初に複数の選択肢を有していた置換基について選択肢が唯一となり、選択の余地がなくなる場合には、そのような特定の選択肢の組合せを採用することが当初明細書等に記載されている場合(下記cの例を参照。)を除き、その補正は許されない。なぜなら、選択肢としての当初の記載は、特定の選択肢の採用を意味していたとは認められないからである。

c 他方、選択肢の削除が実施例の記載を伴った選択肢が残るようになされることにより、このようにして残った選択肢が、実施例等の当初明細書等の全体の記載を基に判断した場合には、新たな技術的事項を導入するものではないと認められる場合がある。

例えば、当初明細書等に複数の選択肢を有する置換基の組合せの形で化学物質群が記載されていた場合には、当初明細書等に実施例等で記載されていた「単一の化学物質」に対応する特定の選択肢の組合せからなる化学物質(群)の記載のみを請求項に残す補正は許される。」

(イ) また、特許庁が公表している「審査ハンドブック付属書A 新規事項を追加する補正に関する事例集」(甲102)には、事例35【補正2】として、「補正後の特許請求の範囲に記載した化学物質は、…という特定の組合せが唯一の選択肢となるが、このような特定の組合せを採用することは出願当初の明細書等のいずれの箇所にも記載されておらず、また、記載されているのと同然ともいえない。さらに、この補正が新たな技術的事項を導入するものではないといえる特段の事情も

見いだせない。したがって、【補正2】の場合には、補正後の特許請求の範囲に記載された化学物質は、当初明細書等に記載した事項の範囲内のものとはいえない。」と記載されている。

(ウ) しかし、原告がその主張の根拠とする審査基準においても、訂正の結果、残った発明特定事項で特定されるものが新たな技術的事項を導入するものであるか否かで判断すべきものとされているところ、本件訂正においては、前記(1)のとおり、新たな技術的事項は導入されていない。

イ 原告は、本件訂正後のX¹とH e tの組合せであれば方法Cにより生産できることが本件明細書に開示ないし示唆されているとはいえないから、本件訂正後のX¹とH e tの特定の組合せを任意に選択することは、新規な技術的事項を追加するものであると主張する。

しかし、後記3(2)イのとおり、原料化合物が入手できれば、X¹が「-CH₂O-」, 「-CH₂OCH₂-」のいずれの場合についても、本件明細書の記載と出願時の技術常識に基づいて、当業者に通常期待し得る程度を超える試行錯誤を求めることなく、当該化学物質を製造することができるから、本件訂正後のX¹とH e tの組合せであれば方法Cにより生産できることが本件明細書に開示されているといえる。

したがって、新たな技術的事項が導入されたということとはできない。

ウ よって、原告の上記各主張はいずれも理由がない。

(3) 小括

したがって、本件訂正は特許請求の範囲の減縮を目的とするものであり、新規事項の追加には当たらないから、本件訂正を認めた審決の判断に誤りはない。

よって、取消事由1は理由がない。

3 取消事由2（実施可能要件に係る判断の誤り）について

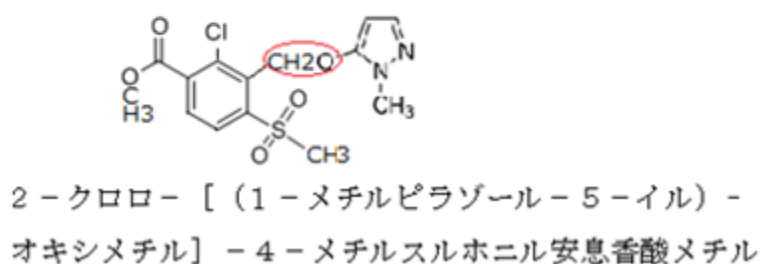
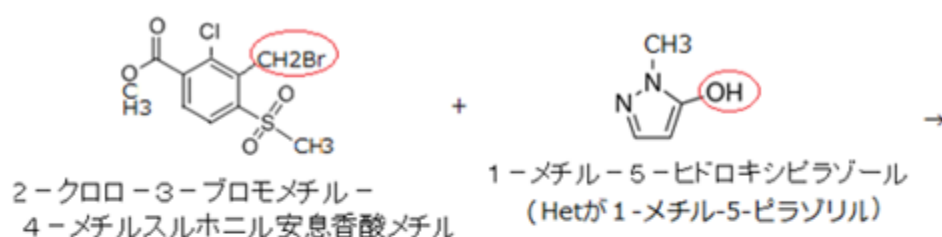
(1) 特許法36条4項1号は、明細書の発明の詳細な説明の記載は、「その発明の属する技術の分野における通常の知識を有する者がその実施をすることができる

程度に明確かつ十分に記載したもの」でなければならないと定めるところ，この規定にいう「実施」とは，物の発明においては，当該発明に係る物の生産，使用等をいうものであるから，実施可能要件を満たすためには，明細書の発明の詳細な説明は，当業者が「その物を製造できるように」，また，「その物を使用できるように」記載されていなければならない。

(2) 本件訂正発明に係る化学物質の製造について

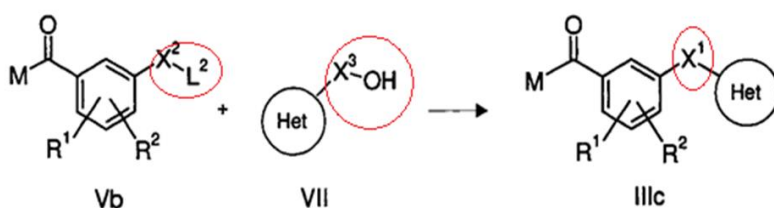
ア 本件訂正明細書には，本件訂正発明に係る化学物質の製造について，以下の記載がある。

【0131】～【0134】には，本件訂正発明に該当する1の化学物質である {2-クロロ-3-[(1-メチルピラゾール-5-イル)オキシメチル]-4-メチルスルホニルフェニル} {5,5-ジメチル-1,3-ジオキソシクロヘキサ-2-イル} メタノン (X¹が-CH₂O-, Hetが1-メチル-5-ピラゾリルの場合) の合成例が示されている。かかる合成工程において，X¹の「-CH₂O-」結合部分は，「工程b」(【0132】)において形成される。(下図)



また，同様の合成方法によって得られる7つの化学物質が表37(【0135】)に示されている。

他方，【0050】～【0057】には，「方法C」として，置換ヘテロシクリル（下図のV II）を安息香酸エステル（同V b）で置換して，本件発明に係る安息香酸エステル（同III c）を得る方法が記載され，出発材料，添加する試薬，材料の添加割合，溶媒，反応温度等について記載されている。



イ 本件訂正発明に係る化学物質の製造に関して，請求項1の式I aにおける「 $-X^1-$ 」の結合部分（すなわち， X^1 が「 $-CH_2O-$ 」である場合と，「 $-CH_2OCH_2-$ 」である場合）に着目して，これら化学物質が製造できるように記載されているか否かについて判断する。

（ア） X^1 が「 $-CH_2O-$ 」である場合

本件明細書における製造実施例（【0131】～【0134】）で具体的な反応条件と共に開示されている工程b（【0132】）の記載によれば，当業者は，原料である $HO-Het$ が入手できれば， X^1 が「 $-CH_2O-$ 」である化合物の製造を実施することができる。そして，甲69に記載されているとおり，原料となるアルコールはいずれも入手可能であることから，上記化合物を当業者が容易に製造することが可能である。

（イ） X^1 が「 $-CH_2OCH_2-$ 」である場合

前記1(1)キのとおり，本件明細書における製造実施例（【0131】～【0134】）では，用いる物質の量，溶媒，塩基，反応温度，反応時間等の諸条件や，各工程で得られる化学物質の融点や量が，具体的に記載されているほか，前記1(1)イのとおり，一般的な製造工程である置換安息香酸誘導体III cを合成するスキーム（方法C）に関する記載（【0050】～【0056】）においても出発材料の構造の詳細及び使用量，他の使用材料（塩基，補助塩基，溶媒）の種類及び使用量，

並びに反応温度が記載されている。

そして、製造実施例（【0131】～【0134】）には X^1 として「 $-CH_2O-$ 」である化合物に関するものが示されているのみで、 X^1 が「 $-CH_2OCH_2-$ 」である化学物質の製造に関する実施例の記載こそないものの、原料化学物質である $HO-CH_2-Het$ （甲62，69参照）が入手できれば、上記方法Cの記載（【0050】～【0056】）も参考にしつつ、合成例の工程bに示された周知の反応と同様の合成を行うことにより、 X^1 が「 $-CH_2OCH_2-$ 」である化学物質も当業者が容易に合成することができるものと認められる。

（ウ） そうすると、請求項1の式I aにおける X^1 が「 $-CH_2O-$ 」，「 $-CH_2OCH_2-$ 」のいずれの場合についても、本件明細書の記載と出願時の技術常識に基づけば、当業者に通常期待し得る程度を超える試行錯誤を求めることなく、当該化学物質を製造することができるものと認められる。

ウ 原告の主張について

（ア） 原告は、本件明細書には、本件訂正発明に該当する1の化学物質の合成例（【0131】～【0134】）及び7個の化学物質（【0135】表37）が具体的に記載されてはいるが、これらはごく限られた種類のものである、当該合成例の反応条件、試薬及び溶媒が、方法Cに関する反応条件として示されている極めて広範囲に記載された【0052】～【0056】の範囲内であったとしても、本件訂正発明1及び3に係る化学物質を生産することにつき、当業者に通常期待し得る程度を超える試行錯誤が要求されると主張する。

しかし、前記イ（イ）のとおり、当業者であれば、過度の試行錯誤を要することなく、当該物質を製造することができるものと認められる。

（イ） 原告は、 X^1 が「 $-CH_2OCH_2-$ 」である化学物質の合成方法（方法C）と、 X^1 が「 $-CH_2O-$ 」である工程bとを関連付けるべきでない、すなわち、方法Cにおける X^1 ， X^2 ， X^3 の定義「 X^2 が、炭素原子が少なくとも1個で、最大5個の、直鎖又は分枝アルキレン鎖、…を表し、 X^3 が、最大5個の炭素原子を有する、

直鎖又は分枝アルキレン鎖…を表し、且つ X^2OX^3 は基 X^1 を形成する」からは、 X^3 が単結合（つまり、炭素原子を含まず、かつ鎖でもないもの）ではないことが明確であるから、方法Cは、 X^1 が「 $-CH_2OCH_2-$ 」等の場合に関するものであって、「 $-CH_2O-$ 」の場合は含まない旨主張する。

しかし、方法Cの X^3 の定義「最大5個の炭素原子」は、 X^2 の定義「炭素原子が少なくとも1個で、最大5個の」と異なり、「炭素原子数が零」の場合（すなわち、 X^3 が単結合の場合）を含み得るように書き分けられていると解釈することに、技術的な矛盾はない。そして、前記イのとおり、本件訂正明細書における化学物質の製造方法に関する一般的な記載（方法C）及び合成例である工程bの記載に接した当業者は、 X^1 が「 $-CH_2O-$ 」又は「 $-CH_2OCH_2-$ 」である本件訂正発明に係る化学物質を製造することができる。

(ウ) したがって、原告の上記各主張はいずれも理由がない。

(3) 本件訂正発明に係る化学物質の使用について

ア 本件訂正明細書には、以下の記載がある。

本件訂正発明の化学物質は、従来技術の2-ベンゾイルシクロヘキサノン-1,3-ジオンに比べて、稲等の栽培植物には影響を与えずに望ましくない栽培植物に対して除草作用を示すという除草作用及び安全性において満足できる効果を有する（【0003】～【0008】）。

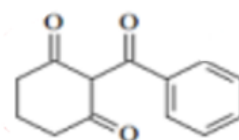
作物の中の広葉の雑草及びイネ科の雑草（Unkraeuter und Schadaegraeser）に対して、栽培植物に損傷を与えることなく作用する（【0109】）。

本件訂正発明に係る化学物質又はこれを含む除草剤組成物を種々の作物に、水性分散液の噴霧や粒状態の散布等、様々な態様によって施与することができる（【0112】～【0129】）。

本件訂正発明に係る化学物質の除草剤としての使用実施例（事前法、事後法による温室実験の方法）（【0136】～【0140】）

イ 本件訂正明細書において本件訂正発明に係る化学物質について使用することができるように記載されているか否かについて判断する。

前記アの本件訂正明細書の記載から、2-ベンゾイルシクロヘキサノン-1,3-ジオン化合物は、除草作用を有することが従来から知られていたものと理解される。また、引用例1ないし同4



(甲1～4)には、本件訂正発明と「シクロヘキサノン-1,3-ジオンの2位がカルボニル基を介して中央のベンゼン環に結合した構造」(本件共通構造。上図)において共通する化合物、つまり2-ベンゾイルシクロヘキサノン-1,3-ジオン化合物が除草剤の有効成分の物質として有用であることが記載されている。

そうすると、当業者は、本件訂正発明に係る、本件共通構造を有する2-ベンゾイルシクロヘキサノン-1,3-ジオン化合物を【0136】～【0140】に記載の使用実施例に従って施用すれば、従来技術から除草剤の有効成分とされる2-ベンゾイルシクロヘキサノン-1,3-ジオン化合物と同様に課題を解決できることを理解することができるから、実際に除草試験を行った結果の記載の有無にかかわらず、過度の試行錯誤を要することなく、本件訂正発明に係る新規化学物質を除草剤として使用することができる。

ウ 原告の主張について

(ア) 原告は、実施可能要件を満たすためには、実際に試験を行い、その試験結果から、当業者にその有用性が認識できることを必要であって、通常、一つ以上の代表的な実施例が必要である、また、用途発明であれば、通常、用途を裏付ける実施例が必要であると主張する。

しかし、前記イのとおり、本件共通構造を有する2-ベンゾイルシクロヘキサノン-1,3-ジオン化合物は、除草作用を有し、除草剤の有効成分として有用であることが従来から知られていたことからすれば、本件共通構造を有する2-ベンゾイルシクロヘキサノン-1,3-ジオン化合物であれば、同様の効果を奏するものと推認できるから、本件訂正発明については、改めて試験を行うまでもなく、有用性が

認められるというべきである。また、本件訂正発明は、除草剤の有効成分の化学物質に係る発明であるから、いわゆる用途発明には当たらないし、用途発明に準じて実施例が必要であるということもできない。

(イ) 原告は、①甲99の「化合物番号55」は本件共通構造を有するにもかかわらず、本件訂正明細書に記載の施与量の上限の約1.5倍(4.48kg/ha)で試験されたどの雑草にも除草効果を示さなかったこと、②甲101の本件共通構造を有する6つの化学物質は、引用例1ないし4よりも多い80g/haの施与量で行った実験において、いずれの雑草(カラスムギ、シヨクヨウガヤツリ、イヌビエ、イチビ)に対しても除草活性を示していないこと、以上によれば、本件共通構造上の置換基の種類・組合せが、除草活性の発現に大きく影響することは明らかであり、本件共通構造を有する化学物質が必ずしも除草活性を示さないと主張する。

しかし、原告の挙げる上記各物質は、いずれも本件訂正発明の技術的範囲に含まれないものであるから、上記各物質が除草効果を示さないことをもって、本件訂正発明が実施可能要件に欠けるということとはできない。

また、甲99によれば、本件共通構造を有する93種類の物質で実験を行ったところ、「化合物番号55」を除く大半のものについて除草効果が示されているし、甲101は、4種類の雑草について実験したものにすぎない。したがって、上記各物質についての実験結果を考慮しても、本件共通構造を有する物質であれば、過度の試行錯誤を要することなく、本件訂正発明に係る新規化学物質を除草剤として使用することができる旨の前記イの判断は左右されない。

(ウ) したがって、原告の上記各主張はいずれも理由がない。

(4) 小括

以上のとおり、本件訂正明細書における発明の詳細な説明の記載は、その記載に基づいて当業者が過度の試行錯誤を要することなく、本件訂正発明に係る化学物質を製造し、使用することができることが記載されているといえる。

したがって、本件訂正明細書は実施可能要件を満たしている。

4 取消事由3（サポート要件に係る判断の誤り）について

(1) 特許請求の範囲の記載が、明細書のサポート要件に適合するか否かは、特許請求の範囲の記載と発明の詳細な説明の記載とを対比し、特許請求の範囲に記載された発明が、発明の詳細な説明に記載された発明で、発明の詳細な説明の記載により当業者が当該発明の課題を解決できると認識できる範囲のものであるか否か、また、その記載や示唆がなくとも当業者が出願時の技術常識に照らし当該発明の課題を解決できると認識できる範囲のものであるか否かを検討して判断すべきものである。

(2) 発明の課題は、原則として、発明の詳細な説明の記載から把握すべきであるところ、一般に、化学物質に関する発明の課題は、新規かつ有用な化学物質を提供することにあるものと考えられる。

本件訂正明細書には、前記1(1)のとおり記載がある。また、本件訂正明細書【0003】～【0006】の記載から、本件訂正発明の課題は、従来から優れた除草活性と作物に対する安全性を示すことが知られている2-ベンゾイルシクロヘキサノール-1,3-ジオン化合物であって、新規かつ有用な化合物を提供することにあると認められる。

(3) 前記(2)のとおり、本件訂正発明の課題は、優れた除草活性と作物に対する安全性を有する新規な2-ベンゾイルシクロヘキサノール-1,3-ジオン化合物を提供することにあるものと認められる。前記3(3)イで検討したとおり、当業者は、本件訂正発明の化学物質の化学構造と従来技術の除草化学物質との共通性から、本件訂正発明に係る化学物質が、従来技術の除草剤の有効成分と同様に課題を解決できることを推認することができる。例えば、引用例1ないし4は、いずれも「シクロヘキサノール-1,3-ジオン誘導体および除草剤」であり、いずれも「優れた除草活性と作物に対する安全性を有する」とされ、優れた除草活性を示すことが開示されている。

また、サポート要件を満足するために、発明の詳細な説明において発明の効果に関する実験データの記載が必ず要求されるものではない。特に本件訂正発明は、新

規な化学物質に関する発明であるから、医薬や農薬といった物の用途発明のように具体的な実験データ、例えば、具体的な除草活性の開示まで求めることは相当でない。

(4) 原告の主張について

ア 原告は、本件訂正明細書には、本件訂正発明に係る化学物質が除草活性を有することを裏付ける具体的な記載（試験データ）は何もない、また、被告による実験成績証明書（甲 5 1， 5 2， 6 3）において、本件訂正発明に係る化学物質の優れた効果が示されているものの、これらの除草作用の試験をしたのは本件出願日から 10 年以上後であると主張する。

しかし、前記(3)のとおり、本件訂正明細書の記載及び出願時の技術常識に基づいて、本件訂正発明に係る化学物質が、従来技術の除草剤の有効成分と同様に課題を解決できることを推認することができるのであるから、被告が出願後に行った実験成績証明書の参照の有無にかかわらず、発明の詳細な説明に具体的な実験データがないことをもってサポート要件違反とする、原告の主張を採用することはできない。

イ 原告は、本件共通構造をもった化合物であれば必ず除草活性を示すという技術常識はなく（甲 9 9），また、本件訂正発明がサポート要件を満足するとの根拠（化学構造上の共通性）として本件審決が示した従来技術（引用例 1 ないし 4）は限られた先行技術であって、当業者の技術常識とはいえない旨主張する。

しかし、2-ベンゾイルシクロヘキサン-1，3-ジオン化合物（本件共通構造を有する化合物群）が除草活性を示すことが従来から知られていることについては、本件明細書【0003】～【0006】に記載されているとおりである。そうすると、発明の詳細な説明において、請求項に係る発明が発明の課題を解決できることを当業者が認識できるように記載されているものと認めるのが相当である。

また、甲 9 9 に示された化合物番号 5 5 など、仮に、本件訂正発明に係る一般式と共通構造を有する化学物質に、特定のある植物に対して除草活性を示さないものが含まれるとしても、前記 3 (3) ウ(イ)のとおり、共通構造を有する化学物質が除草

活性を示すことを推認できる以上，本件訂正発明に係る化学物質のうち実際に除草活性を示さない態様を確認し，これを除くように請求項を記載しなければ，サポート要件を満たさないと解することは相当でない。

(5) 小括

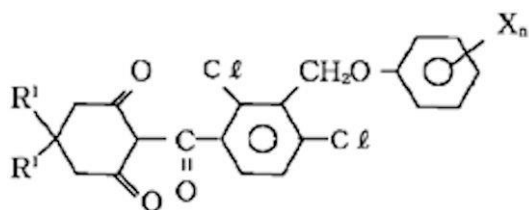
以上のとおり，本件訂正発明は，発明の詳細な説明に記載された発明で，発明の詳細な説明の記載により当業者が当該発明の課題を解決できると認識できる範囲のものであるといえるから，請求項の記載はサポート要件を満たすものである。

5 取消事由 4（本件訂正発明の容易想到性に係る判断の誤り）について

(1) 引用例の記載

ア 引用例 1（甲 1）には，以下の記載があり，これによれば，引用例 1 には，前記第 2 の 3 (2) ア記載の引用発明 1 が開示されていることが認められる（当事者間に争いはない。）。

(ア) 【請求項 1】一般式



[式中，R¹は水素原子または低級アルキル基を表し，Xは低級アルキル基，低級アルケニル基，低級アルコキシ基，低級アルキニルオキシ基，ハロゲン原子，ニトロ基，トリフルオロメチル基，-COR²基（ただし，基中，R²は低級アルキル基，低級アルコキシ基または低級アルキルアミノ基を表す。），-NHCOR³基（ただし，基中，R³は低級アルキル基または低級アルキルアミノ基を表す。），-S(O)_mR⁴基（ただし，基中，R⁴は低級アルキル基を表し，mは0または2を表す。），-C(CH₃)=NOR⁵基（ただし，基中，R⁵は低級アルキル基を表す。）または-(CH₂)_yCN基（ただし，基中，yは0または1を表す。）を表し，nは0，1または2を表す。]で示されるシクロヘキサンジオン誘導体。

(イ) 産業上の利用分野

本発明は、新規なシクロヘキサジオン誘導体および該誘導体を活性成分として含有することを特徴とする除草剤に関する（【0001】）。

(ウ) 発明が解決しようとする課題

これら…文献に記載の化合物は、後記試験例に示すように、除草効力が不十分であったり、作物に薬害を与えたりすることから、必ずしも満足すべきものとはいえない。そのため、このような欠点のない除草剤の開発が望まれている（【0008】）。

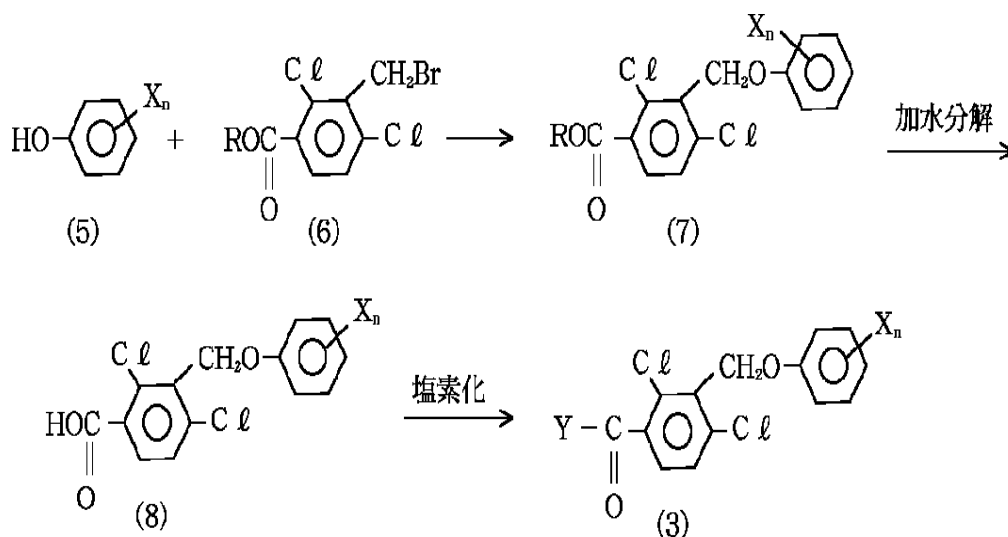
本発明は、これらの化学物質に代わり、優れた除草活性と作物に対する安全性を有するシクロヘキサジオン誘導体およびそれを含有する水稻および畑作物用除草剤を提供することにある（【0009】）。

(エ) 課題を解決するための手段

次に、本発明の一般式（1）の化合物の代表的な具体例を表1～表3に示す（【0014】）。

(オ) 実施例

…また、一般式（3）の出発原料は新規の化合物であり、下記の反応式で示すとおり、公知の方法に準じて合成することができ、その製造例を参考製造例に示した（【0031】）。

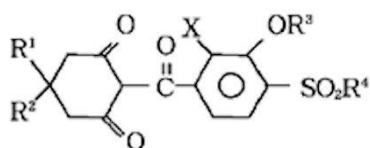


(X, Yおよびnは前記と同じ意味を表し, Rは炭素数1~4のアルキル基を表す。)

(【0032】)

イ 引用例2には, 以下の記載がある。

(ア) 【請求項1】一般式



[式中, R¹およびR²は, 水素原子または低級アルキル基を表し, R³は, -CH₂OR⁵基(ただし, 基中, R⁵は, 低級アルキル基を表す。), -CH₂CH₂OCH₂CH₂OR⁶基(ただし, 基中, R⁶は, 低級アルキル基を表す。)または-CH₂CH(OR⁷)₂基(ただし, 基中, R⁷は, 低級アルキル基を表すか, または環構造を形成する低級アルキレン基を表す。)を表し, R⁴は, 低級アルキル基を表し, Xは, ハロゲン原子を表す。]で示されるシクロヘキサンジオン誘導体。

(イ) 産業上の利用分野

本発明は, 新規なシクロヘキサンジオン誘導体および該誘導体を活性成分として含有することを特徴とする除草剤に関する(【0001】)。

(ウ) 発明が解決しようとする課題

しかしながら, これら…文献に記載の化合物は, 後記試験例に示すように, 除草効力が不十分であったり, 作物に薬害を与えたりすることから, 必ずしも満足すべきものとはいえない。そのため, このような欠点のない除草剤の開発が望まれている(【0008】)。本発明は, これらの化合物に代わり, 優れた除草活性と作物に対する安全性を有するシクロヘキサンジオン誘導体およびそれを含有する水稻および畑作物用除草剤を提供することにある(【0009】)。

(エ) 課題を解決するための手段

次に, 本発明の一般式(1)の化合物の代表的な具体例を表1~2に示す(【0014】)。

化合物 No.	置換基					物性値
	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	
1	H	H	-CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C ℓ	n _D ²⁰ 1.5641
2	H	H	-CH ₂ OC ₂ H ₅	CH ₃	C ℓ	n _D ²⁰ 1.5630
3	H	H	-CH ₂ OC ₃ H ₇ - n	CH ₃	C ℓ	n _D ²⁰ 1.5622
4	H	H	-CH ₂ OC ₃ H ₇ - n	C ₂ H ₅	C ℓ	n _D ²⁰ 1.5615
5	H	H	-CH ₂ OC ₃ H ₇ - iso	CH ₃	C ℓ	n _D ²⁰ 1.5624
6	H	H	-C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OCH ₃	CH ₃	C ℓ	n _D ²⁰ 1.5580
7	H	H	-C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OCH ₃	C ₂ H ₅	C ℓ	n _D ²⁰ 1.5568
8	CH ₃	CH ₃	-C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OCH ₃	C ₂ H ₅	C ℓ	n _D ²⁰ 1.5559
9	C ₂ H ₅	H	-C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OCH ₃	C ₂ H ₅	C ℓ	n _D ²⁰ 1.5560
10	n - C ₃ H ₇	H	-C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OCH ₃	C ₂ H ₅	C ℓ	n _D ²⁰ 1.5547
11	n - C ₄ H ₉	H	-C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OCH ₃	C ₂ H ₅	C ℓ	n _D ²⁰ 1.5523
12	H	H	-C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	CH ₃	C ℓ	n _D ²⁰ 1.5564
13	H	H	-C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ℓ	n _D ²⁰ 1.5555
14	H	H	-CH ₂ CH $\begin{cases} \diagup \text{OCH}_3 \\ \diagdown \text{OCH}_3 \end{cases}$	CH ₃	C ℓ	n _D ²⁰ 1.5643
15	H	H	-CH ₂ CH $\begin{cases} \diagup \text{OC}_2\text{H}_5 \\ \diagdown \text{OC}_2\text{H}_5 \end{cases}$	CH ₃	C ℓ	n _D ²⁰ 1.5622
16	H	H	-CH ₂ $\begin{cases} \diagup \text{O} \\ \diagdown \text{O} \end{cases}$	CH ₃	C ℓ	n _D ²⁰ 1.5671
17	H	H	-CH ₂ $\begin{cases} \diagup \text{O} \\ \diagdown \text{O} \end{cases}$	C ₂ H ₅	C ℓ	n _D ²⁰ 1.5662
18	H	H	-CH ₂ $\begin{cases} \diagup \text{O} \\ \diagdown \text{O} \end{cases}$	CH ₃	C ℓ	n _D ²⁰ 1.5659
19	H	H	-CH ₂ OCH ₃	CH ₃	Br	n _D ²⁰ 1.5730
20	H	H	-CH ₂ OC ₂ H ₅	CH ₃	Br	n _D ²⁰ 1.5721

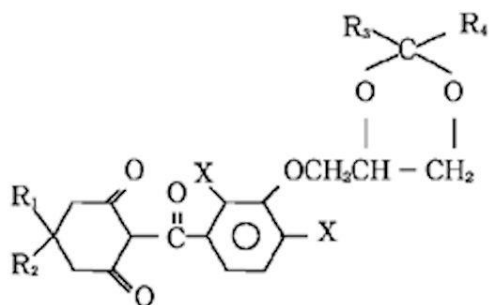
(【0016】【表1】)

化合物 No.	置換基					物性値
	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	
21	H	H	-CH ₂ OC ₃ H ₇ - n	CH ₃	Br	n _D ²⁰ 1.5712
22	H	H	-CH ₂ OC ₃ H ₇ - n	C ₂ H ₅	Br	n _D ²⁰ 1.5704
23	H	H	-C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OCH ₃	CH ₃	Br	n _D ²⁰ 1.5671
24	H	H	-C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OCH ₃	C ₂ H ₅	Br	n _D ²⁰ 1.5660
25	CH ₃	CH ₃	-C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OCH ₃	C ₂ H ₅	Br	n _D ²⁰ 1.5651
26	H	H	-C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	CH ₃	Br	n _D ²⁰ 1.5656
27	H	H	-CH ₂ CH $\begin{cases} \text{OCH}_3 \\ \text{OCH}_3 \end{cases}$	CH ₃	Br	n _D ²⁰ 1.5728
28	H	H	-CH ₂ CH $\begin{cases} \text{OC}_2\text{H}_5 \\ \text{OC}_2\text{H}_5 \end{cases}$	CH ₃	Br	n _D ²⁰ 1.5713
29	H	H	-CH ₂ $\begin{cases} \text{O} \\ \text{O} \end{cases}$	CH ₃	Br	n _D ²⁰ 1.5767
30	H	H	-CH ₂ $\begin{cases} \text{O} \\ \text{O} \end{cases}$	C ₂ H ₅	Br	n _D ²⁰ 1.5759
31	H	H	-CH ₂ $\begin{cases} \text{O} \\ \text{O} \end{cases}$	CH ₃	Br	n _D ²⁰ 1.5747

(【0017】【表2】)

ウ 引用例3には、以下の記載がある。

(ア) 【請求項1】一般式



(式中、R₁、R₂、R₃およびR₄は、水素原子または低級アルキル基を表し、Xは塩素原子または臭素原子を表す。)で示されるシクロヘキサンジオン誘導体。

(イ) 産業上の利用分野

本発明は、新規なシクロヘキサンジオン誘導体および該誘導体を活性成分として

含有することを特徴とする除草剤に関する（【0001】）。

（ウ） 発明が解決しようとする課題

しかしながら、これら…文献に記載の化合物は、後記試験例に示すように、除草効力が不十分であったり、作物に薬害を与えたりすることから、必ずしも満足すべきものとはいいがたい。そのため、このような欠点のない除草剤の開発が望まれている（【0008】）。

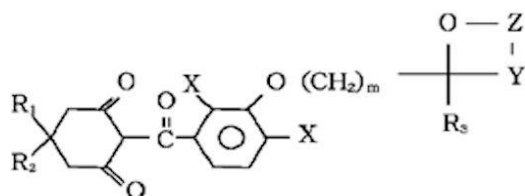
本発明は、これらの化合物に代わり、優れた除草活性と作物に対する安全性を有するシクロヘキサジオン誘導体およびそれを含有する水稻および畑作物用除草剤を提供することにある（【0009】）。

（エ） 発明の効果

本発明化合物は、既知の類似化合物に比べ、優れた除草効力を有し、かつ作物と雑草間に優れた選択性を示す。すなわち、水田の湛水処理において、問題となる種々の雑草、例えばタイヌビエなどのイネ科雑草、アゼナ、キカシグサ、ミゾハコベなどの広葉雑草、タマガヤツリ、ホタルイ、マツバイ、ミズガヤツリなどのカヤツリグサ科雑草、コナギ、ウリカワなどに幅広く作用してほぼ完全に除草することができ、しかも水稻に対しては全く薬害を与えない（【0072】）。

エ 引用例4には、以下の記載がある。

（ア） 【請求項1】 一般式



（式中、R₁、R₂およびR₃は水素原子または低級アルキル基を表し、Xは塩素原子または臭素原子を表し、Yは酸素原子または硫黄原子を表し、Zは低級アルキル基で置換されてもよい低級アルキレン基を表し、mは1または2の整数を表す。）で示されるシクロヘキサジオン誘導体。

（イ） 産業上の利用分野

本発明は、新規なシクロヘキサンジオン誘導体および該誘導体を活性成分として含有することを特徴とする除草剤に関する（【0001】）。

（ウ） 発明が解決しようとする課題

しかしながら、これら…文献に記載の化合物は、後記試験例に示すように、除草効力が不十分であったり、作物に薬害を与えたりすることから、必ずしも満足すべきものとはいいがたい。そのため、このような欠点のない除草剤の開発が望まれている（【0008】）。

本発明は、これらの化合物に代わり、優れた除草活性と作物に対する安全性を有するシクロヘキサンジオン誘導体およびそれを含有する水稻および畑作物用除草剤を提供することにある（【0009】）。

（エ） 発明の効果

本発明化合物は、既知の類似化合物に比べ、優れた除草効力を有し、かつ作物と雑草間に優れた選択性を示す。すなわち、水田の湛水処理において、問題となる種々の雑草、例えばタイヌビエなどのイネ科雑草、アゼナ、キカシグサ、ミゾハコベなどの広葉雑草、タマガヤツリ、ホタルイ、マツバイ、ミズガヤツリなどのカヤツリグサ科雑草、コナギ、ウリカワなどに幅広く作用してほぼ完全に除草することができ、しかも水稻に対しては全く薬害を与えない（【0072】）。

（2） 本件訂正発明1の容易想到性

ア 本件訂正発明1と引用発明1との間には、本件審決が認定したとおりの相違点1及び2が認められる。

イ 相違点1の容易想到性

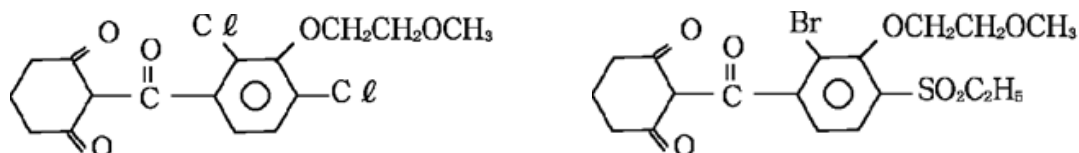
（ア） 相違点1は、本件訂正発明1は、 R^2 が、 $-S(O)_nR^3$ であるのに対し、引用発明1においては、対応する基が、ハロゲンの1種であるクロロ（塩素）である点である。

（イ） 引用例1では、シクロヘキサンジオン化合物のベンゼン環の3位に直鎖状の基が結合している化合物（従来技術である比較薬剤AないしD）に対して、同位

置に置換フェニル基を導入することにより優れた除草効果を奏することを見いだしている。そして、引用例1においては、上記ベンゼン環の4位（本件訂正発明のR₂に相当）に結合する基は塩素に固定されていることから、ベンゼン環の4位にアルキルスルホニル基（-S(O)_nR³）である化合物が開示された引用例2を参酌しても、引用発明1の上記4位の塩素基をアルキルスルホニル基に変更する動機付けはない。

(ウ) 原告は、引用例2には、引用発明2が、ベンゼン環の4位に引用発明1と同様に塩素基が結合した（ただし、同3位の置換基は引用発明1と相違する。）比較薬剤Cよりも除草活性に優れること等が記載されていることから、引用発明1の同4位の塩素基を、引用発明2の同4位のアルキルスルホニル基（-S(O)_nR³）に置換する動機付けがあると主張する（下図参照）。

[参考] 引用例2における比較薬剤C（左図）と比較薬剤A（右図）



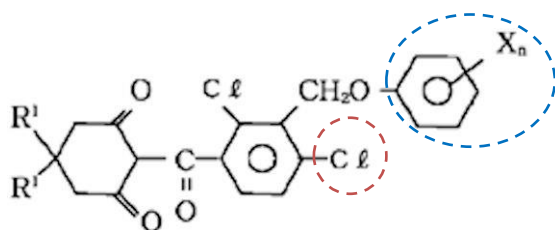
しかし、引用例2における比較薬剤C及びAは、ベンゼン環の3位の置換基が引用発明1よりも除草活性の劣る、引用発明1の従来技術の置換基と同じであり、引用発明2との関係においても、引用発明2よりも除草活性の劣るものとして開示されているのであるから、引用発明1の同4位の塩素基をアルキルスルホニル基（-S(O)_nR³）に置換することによって優れた除草効果が期待される等の動機を見いだすことはできない。

したがって、引用例2の比較薬剤の記載から、引用発明1のベンゼン環の4位の置換基の変更を想起することはできない。

(エ) 以上のとおり、相違点1は、容易に想到することができない。

ウ 相違点2の容易想到性

(ア) 相違点2は、本件訂正発明1は、H e tが、オキシラニル、2-オキセタニル、3-オキセタニル、2-テトラヒドロフラニル、3-テトラヒドロフラニル、2-テトラヒドロチエニル、2-ピロリジニル、2-テトラヒドロピラニル、2-ピロリル、5-イソオキサゾリル、2-オキサゾリル、5-オキサゾリル、2-チアゾリル、2-ピリジニル、1-メチル-5-ピラゾリル、1-ピラゾリル、3,5-ジメチル-1-ピラゾリル、又は4-クロロ-1-ピラゾリルであるのに対し、引用発明1においては、対応する基が、特定の基Xを0, 1又は2個有するフェニル基である点である。



(イ) 引用例2（化学物質16～18, 29～31）, 引用例3及び引用例4には、シクロヘキサンジオンのベンゼン環の3位に、OCH₂基やO(CH₂)₂基を介して外形上はヘテロ環構造を結合する化合物が記載されているといえる。

しかし、引用例2ないし4のいずれにも前記相違点2に係る特定のH e tのいずれかについての開示はない。また、引用例2ないし4のいずれにも、ベンゼン環の3位を特定のヘテロ環オキシメチルとすることは記載されておらず、3位の基としてヘテロ環を有する構造が少数記載されているものの、ベンゼン環に結合する部分の構造はヘテロ環メチルオキシ（-OCH₂-ヘテロ環）か、ヘテロ環エチルオキシ（-OCH₂CH₂-ヘテロ環）であって、ヘテロ環の連結基は本件訂正発明1におけるX¹とは異なる。したがって、引用発明1に、引用例2ないし4に記載された発明を組み合わせても、3位の構造が、本件訂正発明1に係る特定のヘテロ環オキシメチル（-CH₂O-H e t）構造を有する化学物質を得ることはできない。

そうすると、引用発明1に、引用例2ないし4に記載されている事項を組み合わ

せても、引用発明 1 に係る化合物におけるベンゼン環の 3 位の置換基が本件訂正発明 1 に係る特定の H e t 構造とはならない。そして、上記組合せによって得られる化合物について、引用発明 1 の特定の H e t 構造（相違点 2）に置換する動機付けがあるともいえない。

エ 小括

以上のとおり、本件訂正発明 1 は、引用発明 1 及び引用例 2 ないし 4 に記載された事項に基づいて当業者が容易に発明をすることができたものということとはできない。

(3) 本件訂正発明 3 の容易想到性

前記(2)と同様、引用発明 1 との間の相違点 1 及び 2 を容易に想到することができたとはいえない。

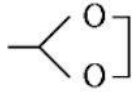
(4) 本件訂正発明 4 の容易想到性

ア 本件訂正発明 4 と引用発明 2 との間には、本件審決が認定したとおりの相違点 3 ないし 5 が認められる。

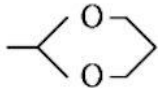
イ 相違点 3 及び 4 の容易想到性

(ア) 相違点 3 は、本件訂正発明 4 は、 X^1 が、酸素により中断されたエチレン鎖又は $-CH_2O-$ であるのに対し、引用発明 2 においては、対応する基が、 $-OCH_2-$ である点である。

相違点 4 は、本件訂正発明 4 は、H e t が、オキシラニル、2-オキセタニル、3-オキセタニル、2-テトラヒドロフラニル、3-テトラヒドロフラニル、2-テトラヒドロチエニル、2-ピロリジニル、2-テトラヒドロピラニル、2-ピロリル、5-イソオキサゾリル、2-オキサゾリル、5-オキサゾリル、2-チアゾリル、2-ピリジニル、1-メチル-5-ピラゾリル、1-ピラゾリル、3, 5-ジメチル-1-ピラゾリル、若しくは 4-クロロ-1-ピラゾリル、又は上記のうち初めの 3 つを除いたものの何れかであるのに対し、引用発明 2 においては、対応する基が、

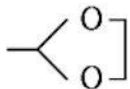


又は

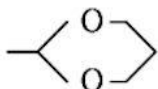


である点である

(イ) 引用発明 2 の目的化合物は、シクロヘキサン-1, 3-ジオンの 2 位がカルボニル基を介して中央のベンゼン環に結合した構造を有する (本件共通構造) 点で、本件訂正発明 4 の目的化合物と共通するものであり、中央のベンゼン環のカルボニルが置換した位置を 1 位とすると、2 位及び 4 位の置換基も共通するが、3 位の置換基は、 $-OCH_2-$ に続いて



又は



であることを、発明を特定する事項とするものである。

引用発明 2 から出発して本件訂正発明 4 の構成に至るためには、上記の 3 位の置換基を、特定のヘテロ環オキシメチル ($-CH_2O-Het$) に置き換える必要がある。

しかし、引用発明 2 は、上記の 3 位の置換基を必須とする発明であり、引用例 2 の全ての記載をみても、上記の 3 位の置換基は、「 $-OR^3$ 」であって「 R^3 は、 $-CH_2OR^5$ 基 (ただし、基中、 R^5 は、低級アルキル基を表す。)、 $-CH_2CH_2OCH_2CH_2OR^6$ 基 (ただし、基中、 R^6 は、低級アルキル基を表す。) または $-CH_2CH(OR^7)_2$ 基 (ただし、基中、 R^7 は、低級アルキル基を表すか、または環構造を形成する低級アルキレン基を表す。) を表し」というものであるから、

引用発明 2 の上記の 3 位の置換基を，本件訂正発明 4 の目的化合物の特定のヘテロ環オキシメチルに置き換えることには，阻害要因がある。

(ウ) また，引用例 1 には，シクロヘキサン-1，3-ジオンの 2 位がカルボニル基を介して中央のベンゼン環に結合した構造を有する，除草剤としての有用性を有する化合物の発明が記載されており，中央のベンゼン環の 3 位は，特定の X で置換していてもよいフェニルオキシメチルである。つまり，引用例 1 にも，中央のベンゼン環の 3 位を特定のヘテロ環オキシメチルとすることは記載されていない。したがって，引用発明 2 に，引用発明 1 を組み合わせても，3 位の構造が，本件訂正発明 4 の特定のヘテロ環オキシメチル ($-CH_2O-He t$) となることはなく，そもそも，引用発明 2 の 3 位の化学構造を変化させるために引用発明 1 を組み合わせる動機付けとなるものもない。

(エ) さらに，引用例 3 及び 4 にも，シクロヘキサン-1，3-ジオンの 2 位がカルボニル基を介して中央のベンゼン環に結合した構造を有する，除草剤としての有用性を有する化合物の発明が記載されているが，引用例 3 及び 4 のいずれにも，中央のベンゼン環の 3 位を特定のヘテロ環オキシメチルとすることは記載されておらず，3 位の基としてヘテロ環を有する構造が少数記載されているとしても，せいぜい，ヘテロ環メチルオキシ ($-OCH_2-$ ヘテロ環) か，ヘテロ環エチルオキシ ($-OCH_2CH_2-$ ヘテロ環) であって，本件訂正発明 4 における X^1 とは異なる連結基のものであり， $He t$ も異なる。

したがって，引用発明 2 に，引用例 3 及び 4 に記載された発明を組み合わせても，3 位の構造が，本件訂正発明 4 の特定のヘテロ環オキシメチル ($-CH_2O-He t$) とはならない。そして，上記組合せによって得られる化合物について，引用発明 4 の特定の $He t$ 構造に置換する動機付けがあるともいえない。

(オ) 以上のとおり，引用発明 2 において，相違点 3 及び 4 に係る本件訂正発明 4 の構成を備えたものとすることは，当業者が容易に想到し得ることではない。

ウ 小括

したがって、相違点5について検討するまでもなく、本件訂正発明4は、引用発明2並びに引用例1、3及び4に記載された発明に基づいて当業者が容易に発明をすることができたとはいえない。

(5) 原告の主張について

原告は、本件審決のサポート要件に関する判断に従えば、当業者は引用例1の記載及び甲69等を示される技術常識に基づいて、本件訂正発明に係る化合物を生産できることを認識でき、得られた化合物は本件共通構造を有するので、「除草特性を常法に従って確認」できたことは明らかであるから、本件訂正発明は引用例1の記載及び甲69等を示される技術常識に基づいて、容易に発明をすることができたと主張する。

しかし、請求項に係る発明が課題を解決し得ること（本件訂正発明の場合は除草活性を有すること）を理解できるか否かについての判断と、公知技術に基づいて請求項に係る発明を容易に発明することができたか否かの判断は別異のものであるから、サポート要件に関する判断に従って進歩性の判断をすること自体、採用できない。

また、原告が主張するように、当該技術分野において、本件共通構造を有するシクロヘキサン-1,3-ジオン化合物に種々の置換基を導入することで除草剤の改良及びその効果の確認が行われているとしても、当業者が、引用例1ないし4の開示に基づいて特定の置換基を導入した本件訂正発明に係る化合物を容易に想到し得るとの理由は見いだせないことは、前記(2)ないし(4)のとおりである。

(6) 小括

したがって、本件訂正発明を容易に想到することができたとはいえない。

6 取消事由5（原文新規事項追加に係る判断の誤り）について

(1) 原告は、本件明細書における X^1 の定義は、国際出願日における国際出願の明細書（以下「国際出願明細書」という。）の X^1 の定義を個別化したものであることが明らかであり、国際出願明細書（表A及び表37）に具体的に示されている8

個の X¹以外のものも含んでおり、当該 8 個の X¹の記載から導き出せないから、新たな技術的事項を導入するものであると主張する。

(2) 前記 2 のとおり、本件訂正は適法であり、本件訂正によって、「X¹が酸素により中断されたエチレン鎖または—CH₂O—を表し」とされている。そこで、本件訂正後の上記記載について、原文新規事項追加に当たるかを判断する。

国際出願明細書と同一の内容が記載されている甲 8 には、X¹の具体的な構造として、酸素により中断されたエチレン鎖である「—CH₂OCH₂—」及び「—CH₂O—」が示されている。原告は、X¹の定義が「個別化」されたと主張するが、かかる X¹の定義は、国際出願明細書に記載されている X¹の種類（範囲）から減縮されたものであって、かつ、本件訂正発明に係る化学物質が個別のものに特定されるものではない。また、明細書の記載を参酌しても、X¹の種類を減縮することによって請求項に係る発明に対して何ら新たな技術的事項を導入するものではない。

(3) 原告は、国際出願明細書における用語“*unterbrechen*”の解釈に関連して、当該語が「遮断」（鎖の端部に酸素がつく意）の意味として用いられていたことは明らかであると主張する。

しかし、当該用語に「中断」（鎖の中ほどに酸素が挿入される意）の意味もあることは原告も認めているのであって、訂正後の X¹の定義である「酸素により中断されたエチレン鎖」である「—CH₂OCH₂—」が国際出願明細書に記載されていたとの判断を左右するものではない。

(4) したがって、本件訂正後の明細書に記載されている X¹の定義は、国際出願日における国際出願の明細書に記載した事項の範囲内であるから、取消事由 5 に理由はない。

7 結論

以上のとおり、原告主張の取消事由はいずれも理由がないから、原告の請求を棄却することとし、主文のとおり判決する。

知的財産高等裁判所第 4 部

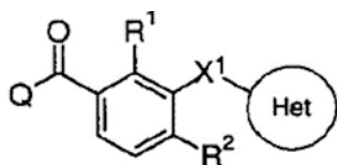
裁判長裁判官 高 部 眞 規 子

裁判官 古 河 謙 一

裁判官 関 根 澄 子

別紙 1 (本件訂正前の請求項)

【請求項 1】 式 I a



Ia

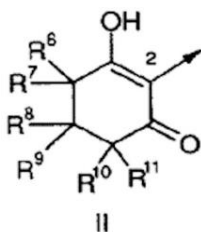
[但し、 R^1 が、ニトロ、ハロゲン、シアノ、チオシアナト、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_2\sim C_6$ アルケニル、 $C_2\sim C_6$ アルキニル、 $-OR^3$ 又は $-S(O)_nR^3$ を表し、

R^2 が、水素、又はハロゲン以外の R^1 で述べた基の1個を表し、

R^3 が水素、 $C_1\sim C_6$ アルキルを表し、

n が1又は2を表し、

Qが2位に結合する式II



II

[但し、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 及び R^{11} が、それぞれ水素又は $C_1\sim C_4$ アルキルを表し、上記 CR^8R^9 単位が、 $C=O$ で置き換わっていても良い]

で表されるシクロヘキサン-1, 3-ジオン環を表し、

X^1 が酸素により中断された、エチレン、プロピレン、プロペニレンまたはプロピニレン鎖、或いは $-CH_2O-$ を表し、

H e t が、

窒素、酸素及び硫黄から選択される1～3個のヘテロ原子を有する、3～6員の部分飽和若しくは完全飽和ヘテロシクリル基、又は

下記の3個の群：窒素，酸素と少なくとも1個の窒素との組み合わせ，又は硫黄と少なくとも1個の窒素との組み合わせから選択されるヘテロ原子を3個まで有する，3～6員のヘテロ芳香族基，を表し，且つ上述のヘテロシクリル基又はヘテロ芳香族基は，部分的に又は完全にハロゲン化されていても，及び／又はR⁵で置換されていても良く，

R⁵が水素，ヒドロキシル，メルカプト，アミノ，シアノ，ニトロ，ホルミル，C₁～C₄アルキルアミノ，C₁～C₄ジアルキルアミノ，C₁～C₄アルコキシカルボニル，C₁～C₄アルキルカルボニル，C₁～C₄アルキルカルボニルオキシ，C₁～C₄アルキル，C₁～C₄ハロアルキル，C₁～C₄アルキルチオ，C₁～C₄ハロアルキルチオ，C₁～C₄アルコキシ，C₁～C₄ハロアルコキシを表し，且つ上記アルキル基は，それぞれ1個以上の下記の基：シアノ，ホルミル，C₁～C₄アルキルアミノ，C₁～C₄ジアルキルアミノ，C₁～C₄アルコキシカルボニル，C₁～C₄アルキルカルボニル，C₁～C₄アルキルカルボニルオキシ，C₁～C₄アルキル，C₁～C₄ハロアルキル，C₁～C₄アルキルチオ，C₁～C₄ハロアルキルチオ，C₁～C₄アルコキシ，C₁～C₄ハロアルコキシで置換されていても良い]

で表される2-ベンゾイルシクロヘキサノン-1，3-ジオン又はその農業上有用な塩。

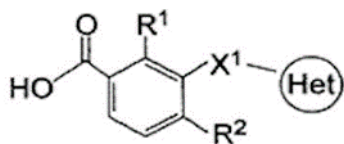
【請求項3】 Hetが，

窒素，酸素及び硫黄から選択される1～3個のヘテロ原子を有する，5員若しくは6員の部分飽和若しくは完全飽和ヘテロシクリル基，又は

下記の3個の群：窒素，酸素と少なくとも1個の窒素との組み合わせ，又は硫黄と少なくとも1個の窒素との組み合わせから選択されるヘテロ原子を3個まで有する，5員若しくは6員のヘテロ芳香族基，を表す請求項1に記載の式Iaで表される2-ベンゾイルシクロヘキサノン-1，3-ジオン。

【請求項4】 請求項1又は3に記載の式Iaで表される2-ベンゾイルシクロヘキサノン-1，3-ジオンの製造方法であって，置換又は非置換のシクロヘキサノン-1，

3-ジオンQを、カルボン酸Ⅲb'



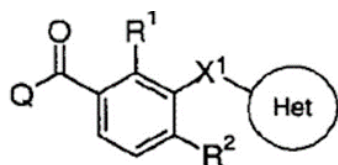
Ⅲb'

[但し、置換基R¹、R²、X¹及びH e tが、それぞれ請求項1と同義である]
でアシル化し、適宜触媒の存在下に、アシル化生成物を転位させて化合物I aを得ることを特徴とする製造方法。

以上

別紙2 (本件訂正後の請求項)

【請求項1】 式Ia



Ia

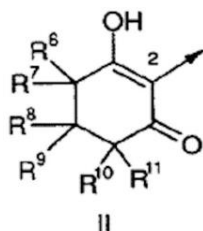
[但し、R¹が、ハロゲンを表し、

R²が、-S(O)_nR³を表し、

R³が水素、C₁~C₆アルキルを表し、

nが1又は2を表し、

Qが2位に結合する式II



II

[但し、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰及びR¹¹が、それぞれ水素又はC₁~C₄アルキルを表し、上記CR⁸R⁹単位が、C=Oで置き換わっていても良い]

で表されるシクロヘキサン-1,3-ジオン環を表し、

X¹が酸素により中断されたエチレン鎖または-CH₂O-を表し、

H e t が、

オキシラニル、2-オキセタニル、3-オキセタニル、2-テトラヒドロフラニル、3-テトラヒドロフラニル、2-テトラヒドロチエニル、2-ピロリジニル、2-テトラヒドロピラニル、2-ピロリル、5-イソオキサゾリル、2-オキサゾリル、5-オキサゾリル、2-チアゾリル、2-ピリジニル、1-メチル-5-ピラゾリル、1-ピラゾリル、3,5-ジメチル-1-ピラゾリル、または4-クロロ-1-

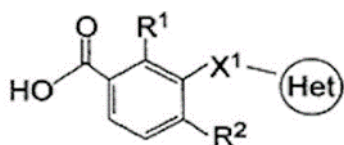
ピラゾリルを表す]

で表される 2-ベンゾイルシクロヘキサン-1, 3-ジオン又はその農業上有用な塩。

【請求項3】 Hetが,

2-テトラヒドロフランル, 3-テトラヒドロフランル, 2-テトラヒドロチエニル, 2-ピロリジニル, 2-テトラヒドロピラニル, 2-ピロリル, 5-イソオキサゾリル, 2-オキサゾリル, 5-オキサゾリル, 2-チアゾリル, 2-ピリジニル, 1-メチル-5-ピラゾリル, 1-ピラゾリル, 3,5-ジメチル-1-ピラゾリル, または4-クロロ-1-ピラゾリルを表す請求項1に記載の式I aで表される2-ベンゾイルシクロヘキサン-1, 3-ジオン。

【請求項4】 請求項1又は3に記載の式I aで表される2-ベンゾイルシクロヘキサン-1, 3-ジオンの製造方法であって, 置換又は非置換のシクロヘキサン-1, 3-ジオンQを, カルボン酸III b'を,



III b'

[但し, 置換基R¹, R², X¹及びHetが, それぞれ請求項1と同義である]
でアシル化し, 適宜触媒の存在下に, アシル化生成物を転位させて化合物I aを得ることを特徴とする製造方法。

以上