

シクロスポリン含有医薬組成物特許侵害差止請求事件

今回は、平成15(2003)年7月24日付け大阪地裁判決で、医薬組成物に関する特許についての侵害差止請求に関するものです。

原告はシクロスポリンを有効成分とする脂溶性製剤である医薬品を世界各国で販売しており、特許製品であるシクロスポリンを含有する水中油(oil-in-water、(以下「o/w」ともいう。))型前濃縮物を製造し、これを我が国の子会社に輸出し、「ネオール」という商品名で販売しています。

一方、被告は、平成14年3月15日に被告製品について、「ネオール」の後発品として厚生労働大臣から薬事法に基づく製造承認を受けています。

ここでは、特許製品に対する後発品が、特許発明の技術的範囲に属するか否かを判断しています。後発品として製造承認を受けた製剤であっても、必ずしも、特許発明の構成要件を充足するだけでなく技術的範囲に属するとは限らないことを示したものです。

大阪地裁 平成15(2003)年7月24日判決

平成14年(ワ)第6205号

原告：ノバルティス アクチエンゲゼルシャフト

代理人：品川澄雄，他

被告：メルク・ホイ株式会社

代理人：村林隆一，他、保佐人弁理士：三枝英二，他

地裁判決：原告の請求をいずれも棄却する。訴訟費用は原告負担とする。

1. 経緯

1988.09.16：優先権主張日

(グレート・ブリテン北部アイルランド連合王国)

1989.09.14：出願日

1995.03.22：特許公告

1995.12.08：登録(特許番号1996397号)

2000.06.14：期間延長登録出願(期限2013.12.19)

2001.09.18：期間延長登録出願(期限2014.09.14)

2. 原告発明

本件特許発明の構成要件

- a 有効成分としてシクロスポリンを含有する
- b 水中油(o/w)型のマイクロエマルジョン前濃縮物である
- c 医薬組成物

3. 被告製品

被告は、平成14年3月15日に被告製品について、「ネオール」の後発品として厚生労働大臣から薬事法に基づく製造承認を受けた。

被告製品の組成は、有効成分 - シクロスポリン、 溶解剤 - ポリオキシリル35ヒマシ油、 溶解補助剤 - クエン酸トリエチル、 溶解補助剤 - モノラウリン酸ソルビタン、 プロピレングリコール脂肪酸エステル、 その他カプセルの基材又は可塑剤、 着色剤である。

被告製品は、本件特許発明の構成要件 a 及び c を充足す

る。

4. 本件特許と被告物質の争点

(1) 構成要件充足性

被告製剤は、本件特許発明の構成要件 b. 「水中油(o/w)型のマイクロエマルジョン前濃縮物である」を充足するか？

(2) 本件特許に無効理由が存在することが明らかか？

ア 記載不備

(前濃縮物、マイクロエマルジョンは不明瞭か？)

イ 新規性欠如

ウ 進歩性欠如

5. 裁判所の判断

(1) 争点(1)構成要件充足性について

・「マイクロエマルジョン前濃縮物」の意義について

本件特許権の優先権主張日当時の各種文献の記載から、当業者が「マイクロエマルジョン」という語の意義について有する認識は、水および疎水性(親油性)有機成分を含めた有機成分を含有する非オパーク(透明)又は実質的に非オパークのコロイド状分散液であったと推認される。本件明細書のマイクロエマルジョン前濃縮物の「前濃縮物」という語は、その文言によれば、マイクロエマルジョンになる前段階のものを意味すると理解することができる。

本件明細書において、「水中油(o/w)型のマイクロエマルジョン」とは、疎水性(親油性)有機成分の小滴が水中に分散した液であり、透明又は実質的に透明であり、小滴の粒径は、2000 未満で、好ましくは約1000 未満であるものという意味で用いられており、また「マイクロエマルジョン前濃縮物」とは、水と接触させたときに、攪拌手段を用いるなど実質的なエネルギーの供給を受けることなく、自然発生的に又は自然発生に近い形で、マイクロエマルジョンを形成するもの、という意味で用いられていたことが認められる。

・被告製剤は本件特許発明の「マイクロエマルジョン前濃縮物」の構成を具備するか

被告製剤は、1:5の希釈率で水に希釈された場合、自然発生的にはもとより、ガラス棒による攪拌や攪拌器による攪拌によって相当程度のエネルギーを加えられてもマイクロエマルジョンにならない。

前記のとおり、被告製品は、原告の製造に係る「ネオール」の後発品として製造承認を受けたものであるが、被告製剤がマイクロエマルジョン前濃縮物であることを示す資料を提出した上で製造承認を受けたのかが明らかではない。また、被告のホームページによれば、本件特許発明の実施品である先発品と、後発品である被告製剤の全血中シクロスポリン濃度の経時的推移がほぼ同じであることが認められるが、血中濃度がほぼ同じであることをもって、被告製剤も先発品と同様にマイクロエマルジョン前濃縮物であるといえるかどうか明らかではない。したがって、これらの製造承認や血中濃度の推移の一致の事実を勘案したとしても、被告製剤がマイクロエマルジョン前濃縮物であることが立証されたとはいえない。

なお、被告は「マイクロエマルジョン前濃縮物」の意義として、水に接触させたときにマイクロエマルジョンを形成し得る、というだけでは、機能を記載したにとどまり、製剤

の組成を具体的構成によって特定したとはいえないから、本件特許発明の技術的範囲は、本件明細書に示された具体的な組成のもの（「1.1.低分子量モノ-またはポリ-オキシ-アルカンジオールの医薬的に許容し得るC1-5アルキルまたはテトラヒドロフルフリル・ジ-または部分エーテル、または1.2.1,2-プロピレングリコール」の親水相成分と、脂肪酸トリグリセリド類の親油相成分を含有するもの）に限定解釈される旨主張する。しかし、仮に被告の主張するように、本件特許発明の技術的範囲が、本件明細書に示された具体的な組成のものに限定解釈されるとしても、被告製剤の組成は、本件明細書に示された具体的な組成を備えないから、被告製剤は、構成要件bを充足しない。

その他に、被告製剤が構成要件bを充足することを認めるに足りる証拠はなく、したがって、被告製剤が構成要件bを充足することは、立証されたとはいえない。

(2) その他

以上によれば、その余の点について判断するまでもない。

(3) 結論

被告製品は、本件特許発明の技術的範囲に属するとは認められない。

よって、本訴請求はいずれも理由がないから棄却する。

6. コメント

本判決では、医薬品の後発品である被告製品が、先発品にかかる特許の構成要件b、「水中油(o/w)型のマイクロエマルジョン前濃縮物である」を充足しないことを理由に、本件特許発明の技術的範囲に属さないから、原告の請求が棄却されました。

被告製剤は、特許発明の組成物と組成（製剤的な価値）は異なるが、全血中シクロスポリン濃度の経時的推移がほぼ同じであることにより後発品として厚生労働省の製造承認を受けることができました。特許での保護と薬事法許認可制度の判断基準の差異に基づく矛盾を感じます。

この事例は、組成物クレームでは、後発品を排除することが困難であることを示す例といえます。特許で後発品を確実に排除するために、製造方法についての請求項の意義についても検討すべきであると思われます。例えば、「水中油(o/w)型組成物を調製する工程を含むマイクロエマルジョン前濃縮物であるシクロスポリン含有医薬組成物の製造方法」という請求項を設けていれば、後発品を排除することができたかも知れません。

特許では被告製剤を排除でませんでした。一方、被告製品の医薬組成物としての欠陥も明らかになりました。

本件特許発明と被告製剤の関係を検討する過程で、被告製剤は「ガラス棒による攪拌や攪拌器による攪拌によって相当程度のエネルギーを加えられてもマイクロエマルジョンにならない。」ことが示されました。つまり、被告製品は代謝されるまでにマイクロエマルジョンを形成することができず、医薬としての効果を発揮することができないと考えられることまでが、裁判の過程で明らかにされてしまったともいえます。競合する後発品の医薬組成物等の製剤的価値を検討する上で、特許侵害訴訟の判決内容を詳細に検討することは重要であるようです。

(H15年10月 担当弁理士 資延由利子)