

令和3年3月30日判決言渡 同日原本領収 裁判所書記官
平成30年(ワ)第38504号 特許権侵害差止等請求事件(A事件)
平成30年(ワ)第38508号 特許権侵害差止等請求事件(B事件)
口頭弁論終結日 令和3年1月21日

5

判 決

A事件及びB事件原告 東レ株式会社
(以下「原告」という。)

10

A事件原告訴訟代理人弁護士 重 富 貴 光
長 谷 部 陽 平
鷺 見 健 人

B事件原告訴訟代理人弁護士 畠 山 慎 市
黒 川 由 子

15

上記両事件原告訴訟代理人弁理士 皆 川 量 之

A事件被告 沢井製薬株式会社

20

B事件被告 扶桑薬品工業株式会社

上記両名訴訟代理人弁護士 小 松 陽 一 郎
原 悠 介
千 葉 あ す か

25

主 文

1 原告の請求をいずれも棄却する。

2 訴訟費用は、A事件及びB事件ともに、原告の負担とする。

事 実 及 び 理 由

第1 請求

(A事件)

- 5 1 A事件被告は、別紙被告製剤目録記載1の製剤を製造し、販売し又は販売の申出をしてはならない。
- 2 A事件被告は、別紙被告製剤目録記載1の製剤及びその半製品を廃棄せよ。
- 3 A事件被告は、原告に対し、1000万円及びこれに対する平成31年1月18日（A事件被告に対する訴状送達の日翌日）から支払済みまで年5分の
10 割合による金員を支払え。

(B事件)

- 1 B事件被告は、別紙被告製剤目録記載2の製剤を製造し、販売し又は販売の申出をしてはならない。
- 2 B事件被告は、別紙被告製剤目録記載2の製剤及びその半製品を廃棄せよ。
- 15 3 B事件被告は、原告に対し、1000万円及びこれに対する平成31年1月18日（B事件被告に対する訴状送達の日翌日）から支払済みまで年5分の割合による金員を支払え。

第2 事案の概要

本件は、発明の名称を「止痒剤」とする発明について特許を受け、当該特許
20 発明についての特許権を有する原告が、医薬品の製造販売業者である被告らに
対し、被告らがそれぞれ製造、販売及び販売の申出（以下、これらの行為を併
せて「製造販売等」という。）している止痒剤は、特許請求の範囲に記載され
た構成の各要件を文言上充足する、又は、特許請求の範囲に記載された構成と
均等なものであると主張して、特許法（以下「法」という。）100条1項及
25 び2項に基づき、各被告に対し、当該止痒剤の製造販売等の差止め及び当該止
痒剤（その半製品を含む。）の廃棄をそれぞれ求めるとともに、不法行為に基

づき， A事件被告に対しては損害金 6 億 2 2 1 0 万円の一部請求として 1 0 0 0 万円及びその遅延損害金の， B事件被告に対しては損害金 3 億 2 1 0 5 万円の一部請求として 1 0 0 0 万円及びその遅延損害金の， 各支払を求める事案である。

5 被告らは， その止痒剤の製造販売等は， 文言侵害， 均等侵害のいずれにも当たらない上， 上記特許には無効理由が存する， あるいは， 上記特許権は存続期間が経過したなどとして争っている。これに対し， 原告は， 特許権は延長登録の出願により存続期間が延長されたものとみなされ， 当該特許権の効力が上記の止痒剤の製造販売等に及ぶものであるなどと主張している。

10 1 前提事実（当事者間に争いがなく， 末尾掲記の各証拠及び弁論の全趣旨により容易に認定できる事実）

(1) 当事者

ア 原告は， 医薬品の製造販売を業とする株式会社である。

イ 被告らは， 医薬品の製造販売を業とする株式会社である。

15 (2) 原告の特許権とその存続期間の延長登録出願

ア 原告は， 下記 1 の特許権（以下「本件特許権」という。）の特許権者であったが， 平成 2 9 年 6 月 2 9 日， 本件特許権について， その特許発明の実施に下記 2 の処分（以下「本件処分」という。）を受けることが必要であるために， その特許発明の実施をすることができない期間があったとして， その存続期間の 5 年の延長を求めて， 存続期間延長登録の出願（特許出願 2 0 1 7 - 7 0 0 1 5 4。以下「本件延長登録出願」という。）をした（甲 3， 乙 3 2）。これにより， 本件特許権の存続期間は延長されたものとみなされた（法 6 7 条の 2 第 5 項本文）。

記

25 1 発明の名称 止痒剤
特許番号 特許第 3 5 3 1 1 7 0 号

出願番号 特願平10-524506号（以下、「本件特許出願」といい、その願書に添付された特許請求の範囲を「本件特許請求の範囲」、明細書を「本件明細書」という。）

5 出願日 平成9年11月21日

優先日 平成8年11月25日

2 延長登録の理由となる処分

医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律（以下「医薬品医療機器等法」という。）14条1項に規定する
10 医薬品に係る同項の承認

延長登録の理由となる処分を特定する番号

22900AMX00538000

延長登録の理由となる処分の対象となった医薬品

販売名 レミッチOD錠2.5 μ g（以下「原告製剤」という。）

15 有効成分 ナルフラフィン塩酸塩

延長登録の理由となる処分の対象となった医薬品について特定された
用途

次の患者におけるそう痒症の改善（既存治療で効果不十分な場合に
限る。） 血液透析患者、慢性肝疾患患者

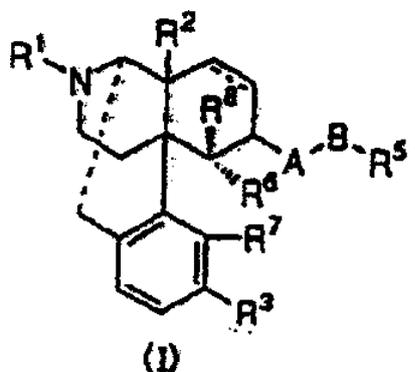
20 イ 原告は、平成30年3月5日付けで、本件延長登録出願について拒絶査定を受けたことから、同年6月1日、同査定について拒絶査定不服審判（審判2018-7539号）を請求した。

これに対し、特許庁は、令和2年3月30日付けで、上記拒絶査定不服審判の請求は成り立たない旨の審決をした。（乙イ19）

25 (3) 本件特許請求の範囲

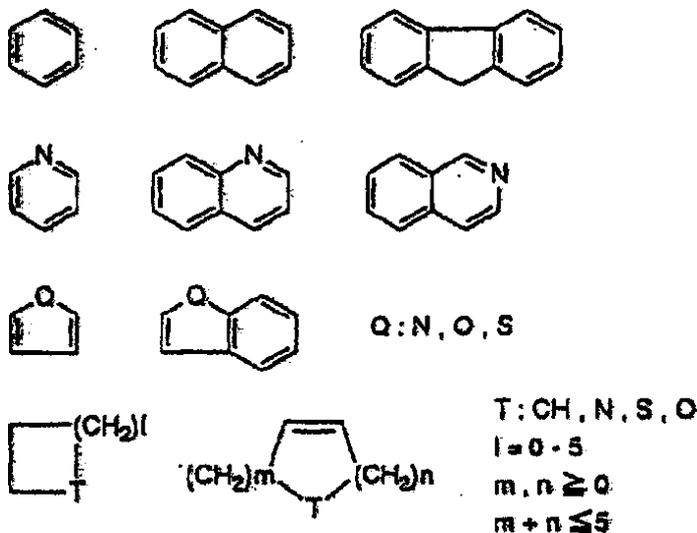
ア 本件特許請求の範囲は、請求項の数が36あり（甲2）、このうち請求

項1記載の発明（以下「本件発明」という。）は、「下記一般式（I）」



[式中、 \equiv は二重結合又は単結合を表し、 R^1 は炭素数1から5のアルキル、炭素数4から7のシクロアルキルアルキル、炭素数5から7のシクロアルケニルアルキル、炭素数6から12のアリール、炭素数7から13のアラルキル、炭素数4から7のアルケニル、アリル、炭素数1から5のフラン-2-イルアルキルまたは炭素数1から5のチオフェン-2-イルアルキルを表し、 R^2 は水素、ヒドロキシ、ニトロ、炭素数1から5のアルカノイルオキシ、炭素数1から5のアルコキシ、炭素数1から5のアルキルまたは $-NR^9R^{10}$ を表し、 R^9 は水素または炭素数1から5のアルキルを表し、 R^{10} は水素、炭素数1から5のアルキルまたは $-C(=O)R^{11}-$ を表し、 R^{11} は、水素、フェニルまたは炭素数1から5のアルキルを表し、 R^3 は水素、ヒドロキシ、炭素数1から5のアルカノイルオキシまたは炭素数1から5のアルコキシを表し、Aは $-XC(=Y)-$ 、 $-XC(=Y)Z-$ 、 $-X-$ または $-XSO_2-$ （ここでX、Y、Zは各々独立してNR⁴、SまたはOを表し、R⁴は水素、炭素数1から5の直鎖もしくは分岐アルキルまたは炭素数6から12のアリールを表し、式中R⁴は同一または異なってもよい）を表し、Bは原子価結合、炭素数1から14の直鎖または分岐アルキレン（ただし炭素数1から5のアルコキシ、炭素数1から5のアルカノイルオキシ、ヒドロキシ、弗素、塩素、臭素、ヨウ素、アミノ、ニトロ、シアノ、トリフルオロメチルおよびフェ

ノキシからなる群から選ばれた少なくとも一種以上の置換基により置換されていてもよく， 1 から 3 個のメチレン基がカルボニル基でおきかわっていてもよい) ， 2 重結合および/または 3 重結合を 1 から 3 個含む炭素数 2 から 1 4 の直鎖もしくは分岐の非環状不飽和炭化水素 (ただし炭素数 1 から 5 のアルコキシ， 炭素数 1 から 5 のアルカノイルオキシ， ヒドロキシ， 5
 弗素， 塩素， 臭素， ヨウ素， アミノ， ニトロ， シアノ， トリフルオロメチルおよびフェノキシからなる群から選ばれた少なくとも一種以上の置換基により置換されていてもよく， 1 から 3 個のメチレン基がカルボニル基でおきかわっていてもよい) ， またはチオエーテル結合， エーテル結合および/もしくはアミノ結合を 1 から 5 個含む炭素数 1 から 1 4 の直鎖もしくは分岐の飽和もしくは不飽和炭化水素 (ただしヘテロ原子は直接 A に結合することはなく， 1 から 3 個のメチレン基がカルボニル基でおきかわっていてもよい) を表し， R⁵ は水素または下記の基本骨格：



15 のいずれかを持つ有機基 (ただし炭素数 1 から 5 のアルキル， 炭素数 1 から 5 のアルコキシ， 炭素数 1 から 5 のアルカノイルオキシ， ヒドロキシ， 弗素， 塩素， 臭素， ヨウ素， アミノ， ニトロ， シアノ， イソチオシアナト， トリフルオロメチル， トリフルオロメトキシ， メチレンジオキシからなる群から選ばれた少なくとも一種以上の置換基により置換されていてもよ

い)を表し、 R^6 は水素、 R^7 は水素、ヒドロキシ、炭素数1から5のアルコキシ、炭素数1から5のアルカノイルオキシ、もしくは、 R^6 と R^7 は一緒になって $-O-$ 、 $-CH_2-$ 、 $-S-$ を表し、 R^8 は水素、炭素数1から5のアルキルまたは炭素数1から5のアルカノイルを表す。また、
5 一般式(I)は(+)体、(-)体、(±)体を含む]で表されるオピオイド κ 受容体作動性化合物を有効成分とする止痒剤。」というものである。

なお、以下において、上記一般式(I)については、その記載を省略する。

イ 本件発明を構成要件に分説すると、次のとおりとなる。

10 A 一般式(I)で表されるオピオイド κ 受容体作動性化合物(以下「本件化合物」という。)を有効成分とする

B 止痒剤。

(4) 被告らの行為

15 ア A事件被告は、別紙被告製剤目録記載1の製剤について、平成30年6月15日付けで使用基準の薬価(薬価基準)に収載されて以降、その製造販売等を行っている。

20 イ B事件被告は、別紙被告製剤目録記載2の製剤(以下、同目録記載1の製剤と併せて「被告ら製剤」という。)について、平成30年6月15日付けで使用基準の薬価(薬価基準)に収載されて以降、その製造販売等を行っている。

(5) 被告ら製剤の構成及び被告ら製剤と本件発明との対比

ア 被告ら製剤は、本件発明に対応させると、いずれも次の構成を有している。

25 a 1錠中にナルフラフィン塩酸塩2.5 μ g(そのフリー体であるナルフラフィン(以下「ナルフラフィン(フリー体)」という。))として2.32 μ g)を含有する

b 止痒剤。

イ 被告ら製剤と本件発明とを対比すると、構成 a のうち、ナルフラフィン塩酸塩については構成要件 A の「一般式 (I) で表されるオピオイド κ 受容体作動性化合物」(本件化合物) に当たらないが、ナルフラフィン(フリー体) については本件化合物に当たり、構成 b は構成要件 B の「止痒剤」に当たる(被告ら製剤において、ナルフラフィン塩酸塩とナルフラフィン(フリー体) のいずれが構成要件 A の「有効成分」に当たるかについては、当事者間に争いがある。)。

(6) 先行文献の存在

特許番号特許第 2 5 2 5 5 5 2 号の特許公報は、本件特許権の優先日より前の日である平成 8 年 8 月 2 1 日に発行された(乙ロ 1。以下、上記特許公報に開示された発明を「乙ロ 1 発明」という。)。

2 争点

(1) 被告ら製剤は本件化合物であるナルフラフィン(フリー体) を「有効成分」とするものか

(2) 被告ら製剤は本件発明に記載された構成と均等なものか

(3) 本件発明は進歩性を欠き無効にされるべきものか

(4) 本件延長登録出願により存続期間が延長されたものとみなされた本件特許権の効力は被告ら製剤の製造販売等に及ぶか

(5) 本件延長登録出願に基づく延長登録は無効ないし一部無効にされるべきものか

(6) 原告による本件特許権の行使は権利濫用となるか

(7) 先使用権の存否

(8) 損害の額

3 争点についての当事者の主張

(1) 争点(1) (被告ら製剤は本件化合物であるナルフラフィン(フリー体) を

「有効成分」とするものか) について

【原告の主張】

構成要件Aの「有効成分」とは、体内で吸収されて薬理作用を奏する部分を意味するところ、被告ら製剤は、人体への投与後、ナルフラフィン（フリー体）がナルフラフィン塩酸塩から遊離して生体に吸収されて止痒効果を奏するから、被告ら製剤において構成要件Aの「有効成分」に当たるのはナルフラフィン（フリー体）である。このことは、被告ら製剤の添付文書に「ナルフラフィン塩酸塩 2.5 μg （ナルフラフィンとして 2.32 μg ）」というようにフリー体が併記されていることから裏付けられる。

【被告らの主張】

構成要件Aの「有効成分」とは、体内での作用とは関係なく、投与前の医薬品の段階で製剤に含まれる成分のうち薬効を示す成分を意味するところ、被告ら製剤においては、投与前の医薬品の段階で製剤に含まれる成分のうち、薬効を示す成分はナルフラフィン塩酸塩であるから、被告ら製剤において構成要件Aの「有効成分」に当たるのは、ナルフラフィン塩酸塩である。

(2) 争点(2) (被告ら製剤は本件発明に記載された構成と均等なものか) について

【原告の主張】

仮に、被告ら製剤において、ナルフラフィン塩酸塩が構成要件Aの「有効成分」に当たるとしても、止痒剤に含有される本件化合物がフリー体の状態であるか、酸付加塩の状態であるかは本件発明の本質的な部分ではないこと（第1要件）、ナルフラフィン（フリー体）を有効成分とするか、ナルフラフィン塩酸塩を有効成分とするかによって止痒の薬理作用は変わらず、いずれによっても本件発明の目的を達し、同一の作用効果を奏すること（第2要件）、医薬品に用いられる原薬の開発は、まず薬効及び当該薬効に関わる薬理作用を奏する化合物（被告ら製剤でいえばナルフラフィン（フリー体））

が見いだされ、次いで塩や結晶系などのスクリーニングが行われるのであって、化合物に付加される塩の存在は薬理作用に関与しないという技術常識に照らせば、被告ら製剤の製造時において、本件化合物をナルフラフィン塩酸塩に置換することは極めて容易であること（第3要件）、本件化合物の止痒作用は本件発明によって初めて公知となったものであり、被告ら製剤は、本件特許出願当時において、公知技術と同一又は当業者（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。以下も同様。）において容易に推考できたものではないこと（第4要件）、及びナルフラフィン塩酸塩を有効成分とする止痒剤が本件特許出願に対する審査手続で特許請求の範囲から意識的に除外されたものであるなどの特段の事情は存在しないこと（第5要件）からすれば、被告ら製剤は本件発明に記載された構成と均等なものであるというべきである。

【被告らの主張】

ア オピオイド κ 受容体作動性化合物は従来技術として既知の物質であることなどに照らすと、従来技術を参酌した当業者は、本件発明を、酸付加塩という構成に変更することにより、異質かつ予測できない効果を有することとなると理解しないとはいえない。すなわち、酸付加塩という構成に変更すると、本件発明とは別の本質的部分を有することとなるものであり、本件発明と被告ら製剤とは本質的部分を異にするものというべきであるから、被告ら製剤は、均等侵害の第1要件を充足しない。

イ また、後記(3)【被告らの主張】アのとおり、本件発明は乙ロ1発明に基づき容易に発明することができたものであるから、被告ら製剤は、均等侵害の第4要件を充足しない。

ウ さらに、本件発明については、本件明細書で明確にフリー体と酸付加塩とを置き換えることができる記載となっており、ナルフラフィン塩酸塩を有効成分とする被告ら製剤が意識的に除外されていることは明らかである

から、被告ら製剤は、均等侵害の第5要件を充足しない。

エ したがって、被告ら製剤は本件発明に記載された構成と均等なものであるとはいえない。

(3) 争点(3) (本件発明は進歩性を欠き無効にされるべきものか) について

5 **【被告らの主張】**

ア 本件発明は乙ロ1発明に基づき容易に発明することができたこと

(ア) 乙ロ1発明は、「一般式(I)で表されるモルヒナン誘導体又はその薬理的に許容される酸付加塩」というものであるところ、乙ロ1発明の「一般式(I)で表されるモルヒナン誘導体」は、文言上、本件発明の「オピオイド κ 受容体作動性化合物」を含んでいる。そうすると、その意味において、乙ロ1発明は、本件発明を含むことになり、具体的に医薬用途として開示されている化合物が一致する点において乙ロ1発明に本件発明が開示されていることとなるから、本件発明と乙ロ1発明とは、本件発明においては医薬用途が止痒剤に特定されているのに対し、
10
15 乙ロ1発明においては医薬用途が特定されていない点においてのみ相違しているといえる。

(イ) しかるに、本件発明の優先日当時、公知文献であった「Annals of the New York Academy of Sciences 1988年525巻(291頁以下)」(乙ロ4)、「Pharmacology biochemistry and behavior 1993年44巻1号(45頁以下)」(乙ロ5)、「Trends in Pharmacological Sciences 1986年7巻2号(69頁以下)」(乙ロ6)及び「The FASEB journal 1995年3月9巻3号 A98 574」(乙ロ7)において、オピオイド κ 受容体作動性化合物がボンベシンによって誘発されたラット等のグルーミング(引っ掻き行動)の抑制に有効であることが指摘されており、「Journal of Pharmacological Methods 1983年10巻(107頁)」(乙ロ8)及び「European
20
25

Journal of Pharmacology 1995年275巻3号(229頁以下)」
(乙ロ9)において、ボンベシン等によって誘発されたラット等のグルーミングが痒みに由来することが知られていた。そうすると、当業者においては、オピオイド κ 受容体作動性化合物にそう痒症状の改善作用を
5 有する用途が見いだされることにつき容易に想到することができたといえる。

(ウ) したがって、本件発明は、乙ロ1発明に乙ロ第4号証ないし同第9号証の各文献に開示された公知技術及び周知技術を適用して容易に発明することができたものであるから、進歩性を欠き無効にされるべきものである。
10

イ 本件発明には顕著な効果がないこと

本件発明は公知の物質についての用途発明であるところ、本件明細書には、オピオイド κ 受容体作動性化合物であるナルフラフィン(フリー体)の止痒作用について、高度な創作性を裏付ける顕著な効果の記載がないから、本件発明は進歩性を欠き無効にされるべきものである。
15

【原告の主張】

ア 本件発明は乙ロ1発明に基づき容易に発明することができたものではないこと

(ア) 本件発明と乙ロ1発明とは、被告らが主張する点だけでなく、本件発明の化合物がオピオイド κ 受容体作動性化合物であるのに対し、乙ロ1発明の化合物がモルヒナン誘導体である点においても相違している。
20

(イ) また、本件発明においては医薬用途が止痒剤に特定されているのに対し、乙ロ1発明においては医薬用途が特定されていないという相違点については、次の諸点を指摘することができる。すなわち、乙ロ第4号証ないし同第9号証の各文献には、止痒剤(ヒトの痒みの治療薬)に関する公知技術が何ら提示されていない。また、本件発明の優先日当時、ボ
25

ンベシンによって誘発されるグルーミングの行動原理は科学的に明らかにされておらず、特定の化合物がボンベシンによって誘発されるグルーミングを抑制したからといって、当該化合物がそう痒症状の改善に有効であるとはいえなかった。他方で、本件発明の優先日当時、オピオイド κ 受容体作動性化合物であっても、ボンベシンによって誘発されるグルーミングに対して抑制効果を示さないものが多数存在していた。さらに、乙ロ第4号証ないし同第7号証の各文献に記載された化合物は無視し得ない副作用を有しており、上記各文献に開示された技術を乙ロ1発明に適用することについては阻害要因が存在する。

これらによれば、上記各文献には上記相違点に係る技術が開示されているとはいえず、また、上記各文献に開示された技術を乙ロ1発明に適用する動機付けがないというべきである。

(ウ) したがって、本件発明は乙ロ1発明に基づいて容易に発明をすることができたものではない。

イ 本件発明には顕著な効果があること

本件発明の優先日当時、オピオイド κ 受容体作動性化合物であってもボンベシンによって誘発されるグルーミングに対して抑制効果を示さないものが存在する一方、オピオイド κ 受容体作動作用を有しない化合物であってもボンベシンによって誘発されるグルーミングに対して抑制効果を示すものが存在していたことから、オピオイド κ 受容体作動作用とボンベシンによって誘発されるグルーミングに対する抑制効果とは必ずしも結びつけられておらず、オピオイド κ 受容体作動作用が止痒作用・効果を有するという公知技術・周知技術は存在しなかった。しかも、本件発明の優先日当時、オピオイド κ 受容体作動性化合物を人体に投与してその止痒効果を確認した例は存在しなかったから、本件明細書において本件発明の化合物を人体に投与してその止痒効果が確認されている以上、本件発明が顕著な作

用効果を有することは明らかであって、この点からしても、本件発明は乙
ロ 1 発明に基づいて容易に発明をすることができたものではない。

(4) 争点(4) (本件延長登録出願により存続期間が延長されたものとみなされた
本件特許権の効力は被告ら製剤の製造販売等に及ぶか) について

5 **【原告の主張】**

ア 医薬用途特許につき医薬品医療機器等法上の処分を理由とする延長登録
出願がされた場合、法 6 8 条の 2 の「政令で定める処分の対象となった
物」は当該医薬品の有効成分及び効能・効果によって特定されるから、上
記延長登録出願により存続期間が延長された特許権の効力は、政令で定め
10 る処分の対象となった医薬品と有効成分及び効能・効果が一致する医薬品
の製造販売等に及ぶと解すべきである。

これを本件についてみると、本件延長登録出願は特定のオピオイドκ受
容体作動性化合物を有効成分とする止痒剤に関する医薬用途特許について
されたものであり、医薬品医療機器等法上の処分である本件処分を理由と
15 するものであるところ、本件処分の対象となった原告製剤と被告ら製剤と
は、有効成分を同じくし、いずれも止痒剤であって、血液透析患者におけ
るそう痒症の改善（既存治療で効果不十分な場合に限る。）の範囲で効
能・効果が一致する。

したがって、本件延長登録出願により存続期間が延長されたものとみな
20 された本件特許権の効力は被告ら製剤の製造販売等に及ぶというべきであ
る。

イ また、仮に法 6 8 条の 2 の「政令で定める処分の対象となった物」を医
薬品の成分、分量、用法、用量及び効能・効果によって特定するとしても、
医薬用途特許発明についての本質、技術的特徴、作用効果は医薬品の有効
25 成分と効能・効果（用途）にあり、有効成分以外の成分その他の要素は医
薬用途特許発明の本質、技術的特徴、作用効果と直接的に関係するもので

はない。そうすると、政令で定める処分の対象となった医薬品と、同医薬品と有効成分及び効能・効果が一致する医薬品とは実質同一なものというべきであるところ、前記アのとおり、原告製剤と被告ら製剤とは有効成分及び効能・効果が一致するから、本件延長登録出願により存続期間が延長されたものとみなされた本件特許権の効力は被告ら製剤の製造販売等に及ぶというべきである。

ウ さらに、被告ら製剤の添加物は、その製造販売承認申請時において、錠剤ないし口腔内崩壊錠の添加物として通常用いられる周知・慣用な添加物であって、被告ら製剤は、周知・慣用技術に基づき、原告製剤に異なる添加物を付加し、又は原告製剤の添加物を異なる添加物に転換し、若しくは脱落させたものである上、被告ら製剤は、原告製剤に製剤的な機能を新たに付加するものではなく、口腔内崩壊特性にも実質的な差異は認められないから、原告製剤と被告ら製剤との差異は、僅かなもの又は全体的にみて形式的なものにすぎない。

したがって、被告らが主張する後記の判断枠組みを前提にしたとしても、被告ら製剤は、本件処分の対象となった原告製剤と実質同一なものであるから、本件延長登録出願により存続期間が延長されたものとみなされた本件特許権の効力は、被告ら製剤の製造販売等に及ぶというべきである。

【被告らの主張】

ア 法68の2の「政令で定める処分の対象となった物」は、医薬品の成分、分量、用法、用量及び効能・効果によって特定すべきであり、存続期間が延長された特許権の効力は、原則として、これらの要素によって特定された医薬品についての「当該特許発明の実施」の範囲に及ぶと解すべきであるところ、被告ら製剤と原告製剤とは、被告ら製剤には原告製剤のものとは異なる添加物が配合されている点、及び、被告ら製剤の効能・効果からは慢性肝疾患患者が除外されている点において、本件処分で定められた成

分及び効能・効果に関する差異があることになる。そうすると、被告ら製剤が原告製剤と実質同一なものと認められない限り、本件延長登録出願により存続期間が延長されたものとみなされた本件特許権の効力は、被告ら製剤の製造販売等に及ばない。

5 イ しかるに、被告ら製剤は、本件処分より前に原告製剤のものとは全く異なる独自の添加物を配合することにより製剤化されたものであって、本件処分の申請時における周知・慣用技術に基づき、一部において異なる成分を付加し、あるいはこれに転換等したものではない。また、被告ら製剤は原告製剤において安定性を担保している成分を使用しておらず、被告ら製剤と原告製剤とは、医薬品としての本質的特徴である技術的特徴が相当異なっていることに加え、被告ら製剤の効能・効果からは慢性肝疾患患者が除外されている点において効能・効果の一部も異なっている。これらを併せ考慮すると、原告製剤と被告ら製剤の差異が僅かなもの又は全体的にみて形式的なものにすぎないとはいえず、被告ら製剤が、原告製剤と実質同
10 一なものとして、本件延長登録出願により存続期間が延長されたものとみなされた本件特許権の効力範囲に属するとはいえないというべきである。

ウ したがって、本件延長登録出願により存続期間が延長されたものとみなされた本件特許権の効力は、被告ら製剤の製造販売等に及ばないというべきである。

20 (5) 争点(5) (本件延長登録出願に基づく延長登録は無効ないし一部無効にされるべきものか) について

【被告らの主張】

ア 本件発明の実施に本件処分を受ける必要があったとは認められないこと
本件処分の対象である原告製剤はナルフラフィン塩酸塩を有効成分とする
25 ものであるところ、ナルフラフィン塩酸塩は本件化合物に含まれないから、原告製剤は本件発明を充足しない。

そうすると、本件発明の実施に本件処分を受ける必要があったとは認められないから、本件延長登録出願に基づく延長登録は、その要件を欠くものとして無効にされるべきものである。

イ 本件延長登録出願で延長を求める期間が本件発明の実施をすることができなかつた期間を超えていること

5 (ア) 原告は、本件処分を受けるより前に、本件処分の対象となった原告製剤と同一の有効成分及び用途等を有するカプセルについて承認処分を受けており、本件処分は、カプセルからOD錠への剤形追加承認処分ということになるところ、一般的に、剤形追加承認処分を受けるためには、
10 生物学的同等性試験を行うことで足りるとされており、同試験自体は通常多くの日数を要せず、その審査期間も1年弱程度であるとされている。そうすると、本件発明について、臨床試験の期間と審査期間を加えた「実施をすることができなかつた期間」は1年であるというべきである。

15 (イ) 仮に本件発明について「実施をすることができなかつた期間」が1年であるとはいえないとしても、特許第5337430号、特許第5549586号及び特許第5648480号の各特許権について、本件延長登録出願と同一の処分を理由として、延長期間を1年11か月26日とする延長登録がされていることから、本件延長登録出願に基づく延長期間もこれと同じ期間とすべきである。

20 (ウ) したがって、本件延長登録出願に基づく延長登録は、延長期間が1年又は1年11か月26日を超える部分について無効にされるべきである。

【原告の主張】

ア 本件発明の実施に本件処分を受けることが必要であったと認められること

25 (ア) 原告製剤において薬効となる薬理作用を奏する成分（有効成分）はナルフラフィン（フリー体）であるから、原告製剤は、ナルフラフィン

(フリー体) を有効成分とする止痒剤であり、本件発明の技術的範囲に属する。

(イ) また、仮に、原告製剤の有効成分がナルフラフィン塩酸塩であるとしても、原告製剤において止痒作用を発揮する成分はナルフラフィン（フリー体）であり、ナルフラフィン（フリー体）により止痒効果を生じさせる医薬品である点において、原告製剤は、本件発明の技術的範囲に属する止痒剤と実質同一である。

(ウ) したがって、本件発明の実施に本件処分を受けることが必要であったと認められる。

イ 本件延長登録出願で延長を求める期間が本件発明の実施をすることができなかつた期間を超えていることについては、争う。

(6) 争点(6) (原告による本件特許権の行使は権利濫用となるか) について

【被告らの主張】

特許請求の範囲に「酸付加塩」の記載がない本件発明には、ナルフラフィン塩酸塩に係る構成は含まれないと解すべきであるところ、原告は、「酸付加塩」の記載の有無がクレーム解釈上も影響することを認識していたにもかかわらず、本件訴訟を提起した。その上、原告は、本件延長登録出願について、本件発明にはナルフラフィン塩酸塩を有効成分とする原告製剤は含まれず本件発明の実施に本件処分が必要であったとは認められないことを理由として拒絶審決がされた後においても、本件訴訟を維持している。これらの原告の行為は、権利の濫用として許されない。

【原告の主張】

被告らの上記主張は争う。

(7) 争点(7) (先使用権の存否) について

【被告らの主張】

本件延長登録出願により存続期間が延長されたものとみなされる特許権の

対象となる特許発明は、本件発明の「止痒剤」という用途が更に「OD錠」という用途に限定された「ナルフラフィン塩酸塩を有効成分とする止痒剤のOD錠」になると解すべきである。しかして、被告らは、この限定された特許発明を知らないで、本件延長登録出願の前に、ナルフラフィン塩酸塩を有効成分とする止痒剤のOD錠を独自に開発し、安定性試験や生物学的同性等試験も行って後発医薬品の製造販売承認申請を行った上、承認後には上市している。これらによれば、このような被告らの製造販売等の行為については、法79条を類推適用して、先使用権が認められるべきである。

【原告の主張】

被告らの主張は、延長登録制度の趣旨にも、先使用権制度の趣旨にも、文理解釈にも反するもので、独自の見解といわざるを得ず、採用する余地のないものである。

(8) 争点(8) (損害の額) について

【原告の主張】

ア 原告は、A事件被告による本件特許権の侵害により、原告製剤の販売に係る逸失利益その他の損害を被ったために、専門家である弁護士に委任してA事件被告に対して本件訴訟を提起せざるを得なくなったものであり、本件訴訟の複雑さ等を考慮すると、原告が本件を解決するために支出した弁護士費用に係る損害は2000万円を下らず、その損害の総額は、上記弁護士費用相当額も含めて6億2210万円を下らない。本件訴訟では、これらの損害の総額のうち、弁護士費用相当額の一部である1000万円の賠償を求める。

イ 原告は、B事件被告による本件特許権の侵害により、原告製剤の販売に係る逸失利益その他の損害を被ったために、専門家である弁護士に委任してB事件被告に対して本件訴訟を提起せざるを得なくなったものであり、本件訴訟の複雑さ等を考慮すると、原告が本件を解決するために支出した

弁護士費用に係る損害は2000万円を下らず、その損害の総額は、上記
弁護士費用相当額も含めて3億2105万円を下らない。本件訴訟では、
これらの損害の総額のうち、弁護士費用相当額の一部である1000万円
の賠償を求める。

5 **【被告らの主張】**

原告の上記主張は争う

第3 当裁判所の判断

1 争点(1) (被告ら製剤は本件化合物であるナルフラフィン (フリー体) を「有
効成分」とするものか) について

10 (1) 前記前提事実(3)アのとおり、本件発明の特許請求の範囲は「一般式 (I)
で表されるオピオイド κ 受容体作動性化合物を有効成分とする止痒剤」とい
うものであり、本件発明は「止痒剤」という医薬品の製剤を組成する「有効
成分」に関する発明であるところ、本件特許権に関する特許公報 (甲2) に
掲載された本件明細書の記載内容を見ても、この構成要件Aの「有効成分」
15 という用語について特段の定義をした記載は見当たらない。そうすると、本
件発明において、この「有効成分」という用語は、医薬品の分野における当
業者が理解する通常の意味で用いられているというべきである。そこで、以
下、同用語の意味を明らかにするべく、医薬品に関する文献等の記載につい
て検討する。

20 (2) 後記括弧内掲記の証拠等によれば、医薬品に関する文献等において、医薬
品の製剤の「有効成分」について、次のとおり記述されていることが認めら
れる。

ア 「active constituent 有効成分 医薬品の組成は有効成分とその他の
成分に分けられる。有効成分は薬の効果 (たとえば鎮痛) をもたらすもの
25 であり、その他の成分 (たとえば色素, 香料, 甘味剤, 充填剤) は、その
有効成分を患者が服用しやすい医薬品 (製剤) に仕上げるものである。」

(「英和・和英 医薬実用英語ハンドブック」。乙イ15)

イ 「有効成分 薬剤に含有される成分の中で薬効を示す成分のこと。飲みやすくする矯味薬，形状をととのえる賦形剤は含まれない。」(「医薬実務用語集 第9版」。乙イ14)。

5 ウ 「医薬品の有効成分である原薬は，そのほとんどが固体の結晶として単離され，医薬品(製剤)開発に供されるが，一概に結晶といっても，低分子原薬が取り得る形態は様々であり，単一結晶であるフリー体，あるいは複合結晶である水和物，溶媒和物，塩および共結晶，さらにそれぞれの結晶多形が存在する可能性があり，多くの候補形態の中から開発に最適な原薬形態すなわち開発形態を選択することが望ましい。開発形態を探索するために候補化合物の原薬形態スクリーニングを実施し，それにより見出された複数の候補形態の中から良好な物性と安定性を有する原薬形態を選択し，その後の製剤開発を進めるのが製薬企業で実施されている一般的なアプローチである。」，「医薬品の原薬形態とは，有効成分である原薬の固体状態を表現する用語であり，(中略)同一の有効成分であっても様々な形態を取り得ることが想像されるが，(中略)実際に利用されている原薬形態のうち，単一成分の結晶であるフリー体あるいは複合成分の結晶である水和物および塩が大勢を占めている。」(「ファインケミカルシリーズ 医薬品原薬の結晶化と物性評価：その最先端技術と評価の実際」の「第1編」の「第4章 原薬の開発形態検討」。甲95)

10

15

20

エ 「添加剤は，製剤に含まれる有効成分以外の物質で，有効成分及び製剤の有用性を高める，製剤化を容易にする，品質の安定化を図る，又は使用性を向上させるなどの目的で用いられる。製剤には，必要に応じて，適切な添加剤を加えることができる。」(「第十七改正日本薬局方」(平成28年3月7日厚生労働省告示第64号)の製剤総則の[1]製剤通則(6))

25

(3) これらの記述によれば，医薬品の分野において，製剤は，主に単一成分の

結晶であるフリー体又は複合成分の結晶である水和物及び塩の形態をとっている原薬を有効成分として、これに、色素、香料、甘味剤、充填剤、矯味薬、賦形剤などの添加剤を加えて組成されたものをいうと認められる。

5 そうすると、「止痒剤」という製剤を組成する「有効成分」に関する発明である本件明細書の記載に接した当業者としては、通常、この構成要件Aの「有効成分」とは、添加剤を加えて製剤として組成される基となる原薬のことをいうものと理解するといえ、同「有効成分」との文言については、同様の意義を有するものと解するのが相当である。

10 これを被告ら製剤についてみると、証拠（甲A1，甲B1）によれば、被告ら製剤はいずれもナルフラフィン塩酸塩を原薬として、これに添加剤としてアスパルテーム（L-フェニルアラニン化合物）、結晶セルロース、トレハロース、ヒドロキシプロピルセルロース及びL-ロイシンを加えて組成されたものであると認められるから、被告ら製剤において構成要件Aの「有効成分」に当たるものは、本件化合物であるナルフラフィン（フリー体）では
15 なく、その酸付加塩であるナルフラフィン塩酸塩であるというべきである。

(4) これに対し、原告は、構成要件Aの「有効成分」とは、体内で吸収されて薬理作用を奏する部分を意味し、被告ら製剤においては、ナルフラフィン（フリー体）がこれに当たる旨主張し、その添付文書にも「ナルフラフィン塩酸塩 2.5 μg （ナルフラフィンとして 2.32 μg ）」というようにフリー体が併記されていることを指摘し、上記主張に沿う説明や用例が記載された文献（甲74，75，77ないし88）を提出している。
20

しかしながら、上記説示のように、当業者は、通常、構成要件Aの「有効成分」とは、添加剤を加えて製剤として組成される基となる原薬のことをいうものと理解するのであって、構成要件Aの「有効成分」との文言は、同様の意義を有するものと解されるところ、被告ら製剤において、投与前の医薬品に含まれているのがナルフラフィン塩酸塩であると認められる以上、被告
25

ら製剤において、ナルフラフィン（フリー体）が構成要件Aの「有効成分」に当たるとはいえない。また、添付文書の上記括弧書き中の記載（「ナルフラフィン塩酸塩 2.5 μg （ナルフラフィンとして 2.32 μg ）」という記載）に接した当業者においては、構成要件Aの「有効成分」について上記の理解に基づいて当該記載を見るのであるから、被告ら製剤において同「有効成分」に当たるものは、ナルフラフィン塩酸塩であると理解するというべきである。さらに、原告の主張に沿う上記の説明や用例は、製剤に関するものとはいえない（甲74、75、77、78）か、製剤に関するものといえとしても、製剤の組成について述べたものとはいえない（甲79ないし88）から、前記(3)の判断を左右するものではない。

(5) したがって、被告ら製剤は、本件化合物であるナルフラフィン（フリー体）を「有効成分」とするものとは認められず、構成要件Aを充足しないこととなる。

2 争点(2)（被告ら製剤は本件発明に記載された構成と均等なものか）について

(1) 前記1で判示したとおり、被告ら製剤はナルフラフィン塩酸塩を有効成分とするものであることから、本件発明と被告ら製剤とは、本件発明に記載された構成を有する止痒剤が本件化合物を有効成分とするものであるのに対し、被告ら製剤は本件化合物の酸付加塩であるナルフラフィン塩酸塩を有効成分とするものである点において相違することとなる。

しかしながら、特許請求の範囲に記載された構成中に他人が製造等をする製品と異なる部分が存する場合であっても、①上記部分が特許発明の本質的部分ではなく、②上記部分を上記製品におけるものと置き換えても、特許発明の目的を達することができ、同一の作用効果を奏するものであって、③上記のように置き換えることに、当業者が上記製品の製造等の時点において容易に想到することができたものであり、④上記製品が特許発明の特許出願時における公知技術と同一又は当業者がこれから上記出願時に容易に推考でき

たものではなく、かつ、⑤上記製品が特許発明の特許出願手続において特許請求の範囲から意識的に除外されたものに当たるなどの特段の事情もないときは、上記製品は、特許請求の範囲に記載された構成と均等なものとして、特許発明の技術的範囲に属するものと解するのが相当である（最高裁平成10年2月24日第三小法廷判決・民集52巻1号113頁）。

そして、出願人が、特許出願時に、特許請求の範囲に記載された構成中の上記製品と異なる部分につき、上記製品に係る構成を容易に想到することができたにもかかわらず、これを特許請求の範囲に記載しなかった場合において、客観的、外形的にみて、上記製品に係る構成が特許請求の範囲に記載された構成を代替すると認識しながらあえて特許請求の範囲に記載しなかった旨を表示していたといえるときには、上記製品が特許発明の特許出願手続において特許請求の範囲から意識的に除外されたものに当たるなどの上記製品と特許請求の範囲に記載の構成とが均等なものといえない特段の事情が存するといふべきである（最高裁平成29年3月24日第二小法廷判決・民集71巻3号359頁）。

(2) そこで検討するに、証拠（甲2）によれば、本件明細書の発明の詳細な説明には、次の記載のあることが認められる（当該記載部分については、特許出願から設定登録までの間に補正はなされていない。）。

「技術分野

本発明は、各種の痒みを伴う疾患における痒みの治療に有用なオピオイドκ受容体作動性化合物およびこれを含んでなる止痒剤に関する。」

「背景技術

痒み（そう痒）は、皮膚特有の感覚で、炎症を伴う様々な皮膚疾患に多く見られるが、ある種の内科系疾患（悪性腫瘍、糖尿病、肝疾患、腎不全、腎透析、痛風、甲状腺疾患、血液疾患、鉄欠乏）や妊娠、寄生虫感染が原因となる場合や、ときには薬剤性や心因性で起きることもある。

(中略)

このようなそう痒の治療には、内服剤として抗ヒスタミン剤、抗アレルギー剤などが主に用いられ、また外用剤としては、抗ヒスタミン剤、副腎皮質ステロイド外用剤、非ステロイド系抗消炎剤、カンフル、メントール、フェノール、サリチル酸、タール、クロタミトン、カプサイシンなど保湿剤（尿素、ヒルドイド、ワセリンなど）が用いられる。しかし内服剤の場合、作用発現までに時間のかかることや、中枢神経抑制作用（眠気、倦怠感）、消化器系に対する障害などの副作用が問題となっている。一方、外用剤の場合では、止痒効果が十分でないことや特にステロイド外用剤では長期使用における副腎機能低下やリバウンドなどの副作用が問題となっている。

オピオイドと痒みについては、オピオイドが鎮痛作用を有する一方で痒みのケミカルメディエーターとしても機能することが知られていた。（以下、略）

このように、従来よりオピオイド系作動薬は痒みを惹起し、その拮抗薬が止痒剤としての可能性があると考えられてきた。しかし、オピオイド系拮抗薬を止痒剤として応用することは現在までのところ実用化されていない。

本発明の目的は、上記の問題点を解決した止痒作用が極めて速くて強いオピオイド κ 受容体作動薬およびこれを含んでなる止痒剤を提供することにある。」

「発明の開示

本発明はオピオイド κ 受容体作動性化合物およびこれを有効成分とする止痒剤である。」

「発明を実施するための最良の形態

(中略)

本発明でいう κ 受容体作動薬はオピオイド κ 受容体に作動性を示すもので

あればその化学構造的異性にとられるものではないが、 μ および δ 受容体よりも κ 受容体に高選択性であることが好ましい。より具体的には、オピオイド κ 受容体作動性を示すモルヒナン誘導体またはその薬理的に許容される酸付加塩が挙げられ、中でも、一般式 (I) (中略) で表されるオピオイド κ 受容体作動性化合物またはその薬理的に許容される酸付加塩である (中略) 。

(中略)

上記 κ 受容体作動薬の中で、一般式 (I) , (III) , (IV) , (V) , (VI) および (VII) で表される物質に対する薬理的に好ましい酸付加塩としては、塩酸塩, 硫酸塩, 硝酸塩, (中略) 等があげられ、中でも塩酸塩, 臭化水素酸塩, リン酸塩, 酒石酸塩, メタンスルホン酸塩等が好まれるが、もちろんこれらに限られるものではない。」

- (3) これらの記載によれば、本件発明の目的は、各種の痒みを伴う疾患における痒みの治療のために止痒作用が極めて速くて強いオピオイド κ 受容体作動薬を有効成分とする止痒剤を提供することにあるところ、本件明細書には、まさしくその有効成分となるオピオイド κ 受容体作動薬として、本件発明に記載された本件化合物のほかに、その薬理的に許容される酸付加塩が挙げられることが、「オピオイド κ 受容体作動性化合物またはその薬理的に許容される酸付加塩」というように明記されているほか、同化合物に対する薬理的に好ましい酸付加塩の具体的態様 (塩酸塩, 硫酸塩, 硝酸塩等) も明示的に記載されている。

そうすると、出願人たる原告は、本件明細書の記載に照らし、本件特許出願時に、その有効成分となるオピオイド κ 受容体作動薬として、本件化合物を有効成分とする構成のほかに、その薬理的に許容される酸付加塩を有効成分とする構成につき容易に想到することができたものと認められ、それにもかかわらず、これを特許請求の範囲に記載しなかったというべきである。

そして、本件発明につき、出願人たる原告の主観的意図いかににかかわらず、第三者たる当業者の立場から客観的にその内容を把握できる徴表である本件明細書においては、本件化合物の薬理的に許容される酸付加塩という構成は、まさしく、各種の痒みを伴う疾患における痒みの治療のために止痒作用が極めて速くて強いオピオイドκ受容体作動薬を有効成分とする止痒剤を提供するという本件発明の目的を達成する構成として、当該目的と関連する文脈において、特許請求の範囲に記載された本件化合物と並んで、明示的、具体的に記載されているものである。

これらによれば、出願人たる原告は、本件特許出願時に、本件化合物の薬理的に許容される酸付加塩を有効成分とする構成を容易に想到することができたにもかかわらず、これを特許請求の範囲に記載しなかったものであるといえ、しかも、客観的、外形的にみて、上記構成が本件発明に記載された構成（本件化合物を有効成分とする構成）を代替すると認識しながらあえて特許請求の範囲に記載しなかった旨を表示していたといえるものというべきである。

そうすると、本件発明については、本件化合物の酸付加塩であるナルフラフィン塩酸塩を有効成分とする被告ら製剤が、本件特許出願の手續において特許請求の範囲から意識的に除外されたものに当たるなどの、被告ら製剤と本件発明に記載された構成（本件化合物を有効成分とする構成）とが均等なものといえない特段の事情が存するというべきである。

- (4) したがって、被告ら製剤は、本件発明に記載された構成と均等なものとして、本件発明の技術的範囲に属するということとはできない。これに反する原告の主張は、上記説示に照らし、採用の限りでない。

3 結語

以上によれば、被告ら製剤は、本件化合物であるナルフラフィン（フリー体）を「有効成分」とするものとは認められず、構成要件Aを充足しないこと

となり，また，本件発明に記載された構成と均等なものとして，本件発明の技術的範囲に属するということもできない。原告は，その他縷々主張するが，その主張内容に照らしてこれらを慎重に精査しても，そのいずれについても，上記説示を左右するに足りるものはない。

5 よって，その余の争点について判断するまでもなく，原告の請求はいずれも理由がないから，これらを棄却することとして，主文のとおり判決する。

東京地方裁判所民事第47部

10 裁判長裁判官 田 中 孝 一

裁判官 横 山 真 通

15

裁判官 西 尾 信 員

別 紙

被告製剤目録

- 1 ナルフラフィン塩酸塩OD錠2.5 μ g「サワイ」
- 5 2 ナルフラフィン塩酸塩OD錠2.5 μ g「フソー」

以 上