

薬品の承認や薬価収載（製造販売）が抑制される。再審査期間と特許が切れることをLOE (Loss of Exclusivity) という。

この様な背景から、ある有効成分について、最初の先発品が承認を得た後、その有効成分について効能や剤形の異なる医薬品を開発するとともに、製品を保護する特許を、時期をずらして出願し、再審査制度と特許制度による保護期間を最大限活用して、LOEを少しでも遅らせるLCMを行う。そして、先発の特許が存在するにもかかわらず、後発品が承認あるいは製造販売された場合には、特許権侵害訴訟により後発品の参入を阻止する。

2 後発品開発と早期の市場参入

後発品の開発は、売上の最大化のため、より早期に市場に参入することが重要である。売上のメーカーは、より早期に市場に参入するため、先発品のLOEを早め先発品の再審査期間終了後すみやかに当局への承認申請ができるよう開発を進める。先発の特許期間中に後発品の同等性試験を実施しても、試験研究の例外規定³により特許権侵害にならないことも最大限活用する。当局の審査においては、後発品の承認予定日に先発の物質・用途特許が存在しないことが承認の条件になる（パテントリンケージ）⁴。さらに、承認後、薬価収載を希望する際には、先発特許を侵害しないことについて、先発側との調整（事前調整）を行うよう当局からお達し⁵が出ている。そのため、後発品承認予定日と薬価収載の時点における先発特許の有無を調査することも後発品開発の一部となる。再審査期間は短縮できないが、特許は無効審判等⁶により潰すことができるので、後発品参入の妨げになる先発特許が存在する場合、予め無効審判を請求して特許を無効化する。

3 先発対後発医薬品の特許を巡るせめぎあい

最近の先発対後発の特許を巡るせめぎあいのうち、オキサリプラチン事件⁷、プレガバリン

事件⁸、そして以下に紹介するピタバスタチンの結晶特許事件⁹では多数の後発メーカーが当事者となった。

最近のケースとして他には、マキサカルシトール事件¹⁰、エルデカルシトール事件¹¹、リツキシマブ事件¹²、セレコキシブ事件¹³、フェブキソスタット事件¹⁴、ナルフラフィン事件¹⁵、ロスバスタチン事件¹⁶等が挙げられる。

このうち、差止と損賠請求訴訟で先発の勝訴が確定したのは、マキサカルシトール事件のみである。本稿で取り上げるピタバスタチン製剤事件（差止請求）もこれに続くかと思われたが、損賠事件では一転して後発が勝訴した。

III ピタバスタチン製剤事件

1 背景—先発品「リバロ」発売から結晶特許事件の判決まで—

ピタバスタチンとは、高コレステロール血症治療剤「リバロ」の有効成分¹⁷である。「リバロ」は、日産化学株式会社（以下「日産化学」という。）が原薬を創製、製造し、興和株式会社（以下「興和」という。）が独占的にグローバル展開している医薬品である¹⁸。国内では、2003年9月に「リバロ®錠」の販売が開始され、2013年2月に口腔内崩壊錠「リバロ®OD錠」が剤形追加承認を受けて同年7月に販売された。

「リバロ®錠」の再審査期間（家族性高コレステロール（小児）以外）は、2011年7月16日まで、物質特許（特許第2569746号）の延長後の満了日は2013年8月3日であった。

2013年8月15日、「リバロ」の後発品が承認されると、日産化学は同社のピタバスタチンの結晶特許（特許第5186108号、5267643号）を侵害するとして、2013年12月25日以降順次、後発品を扱うメーカー合計16社に対して差止請求訴訟を提起したが、第一審・第二審判決とも、特許無効ないし非侵害との判断により原告の請求は棄却されて事件は確定し、後発勝利で幕を閉じた。

2 ピタバスタチン製剤事件

ピタバスタチン製剤事件を、差止請求訴訟、無効審判1、無効審判2、損賠請求訴訟、及び無効審判3の順で紹介する。

(1) 差止請求訴訟

地裁判決（東京地判平成29年9月29日）

興和は2015年10月30日、東和薬品の後発品「ピタバスタチンCa・OD錠4mg『トーワ』」（被告製品、本件4mg製品）¹⁹が、同社の製剤特許（特許第5190159号（159特許））を侵害するとして、東和薬品に対して、差止を求めて東京地裁に特許権侵害訴訟を提起した。被告製品は、有効成分であるピタバスタチンカルシウム水和物（ピタバスタチンカルシウムとして4mg）のほか、クロスポピドンを含む錠剤（口腔内崩壊錠〔OD錠〕）をPTP包装してなる医薬品であり、以下に示す本件発明の構成要件A～Eを充足している。

【請求項1】（本件発明1）

- A： 次の成分（A）及び（B）：
 （A） ピタバスタチン又はその塩；
 （B） カルメロース及びその塩、クロスポピドン並びに結晶セルロースよりなる群から選ばれる1種以上；を含む、かつ、
 B： 水分含量が2.9質量%以下である固形製剤が、
 C： 気密包装体に収容して
 D： なる医薬品

【請求項2】（本件発明2）

- E： 固形製剤の水分含量が1.5～2.9質量%である。

争点は、先使用権の成否、及び特許の有効性（進歩性）の有無2点であった。

先使用権は、特許法79条において「特許出願に係る発明の内容を知らないで自らその発明をし、又は特許出願に係る発明の内容を知らない

でその発明をした者から知得して、特許出願の際現に日本国内においてその発明の実施である事業をしている者又はその事業の準備をしている者は、その実施又は準備をしている発明及び事業の目的の範囲内において、その特許出願に係る特許権について通常実施権を有する。」と規定されている。先願主義の下、先に発明をしながら出願をしなかった先発明者と特許権者の間の公平を図ることを立法趣旨とする規定である。

被告は、被告製品（本件4mg製品）及び本件2mg製品が、本件発明2の技術的範囲に属することについて認めた上、先使用権の成立を基礎付ける事実として、本件出願日（2012年8月8日）までに、本件2mg錠剤のサンプル薬を製造して本件2mg製品の製造販売承認の申請に必要な治験を実施したことや、本件4mg錠剤のサンプル薬を製造して被告製品（本件4mg製品）の製造販売承認の申請に必要な治験を実施し、これらサンプル薬の水分含量が本件発明2の構成要件Eの範囲内であったことについて主張した。

裁判所は、本件出願日までに、被告の社内において、本件発明2の内容を知らないでこれと同じ内容の発明がされていた（被告が被告の従業員等から当該発明を知得していた）と認めることは困難であるし、この点を措くとしても、本件出願日までに、本件2mg製品及び被告製品（本件4mg製品）の内容が、本件発明2の構成要件Eを備えるものとして、一義的に確定していたと認めることはできず、本件発明2を用いた事業について、被告が即時実施の意図を有し、かつ、その即時実施の意図が客観的に認識される態様、程度において表明されていたとはいえないから、被告に先使用権が成立したということとはできない、と判断した。

また、特許の有効性について、被告は、本件発明2は、当業者が乙7発明（特許第4981194号）及び周知の技術事項に基づいて容易に発明をすることができたものであって、進歩性を欠くと主張したが、裁判所は、本件発明2と乙7発明

との二つの相違点、すなわち、乙7発明では医薬組成物が気密包装体に収容されているか否かが明らかでない点（相違点①）、及び固形製剤の水分含量が「1.5～2.9質量%」の数値範囲にあるか否かが明らかでない点（相違点②）について、相違点①は実質的な相違点ではなく、相違点②は、乙7発明から容易に想到できたものではないとして、本件発明2が進歩性を有すると判断した。

被告は、これを不服として控訴した。

知財高裁判決（知財高判平成30年4月4日）

控訴審での争点も先使用权と特許の有効性（進歩性）であり、判決は地裁判決を支持した。しかし、先使用权について高裁は、特許法79条にいう「発明の実施である事業…の準備をしている者」とは、少なくとも、特許出願に係る発明の内容を知らないで自らこれと同じ内容の発明をした者又はこの者から知得した者でなければならない（最二判昭和61年10月3日民集40巻6号1068頁）。よって、控訴人が先使用权を有するといえるためには、サンプル薬に具現された技術的思想が本件発明2と同じ内容の発明でなければならないと述べた。

そのうえで、控訴人が、本件出願日までに製造し、治験を実施していた本件2mg錠剤のサンプル薬及び本件4mg錠剤のサンプル薬の水分含量は、いずれも本件発明2の範囲内（1.5～2.9質量%の範囲内）にあったということではできないとした。さらに加えて、仮に、本件2mg錠剤のサンプル薬又は本件4mg錠剤のサンプル薬の水分含量が1.5～2.9質量%の範囲内にあったとしても、本件発明2は、ピタバスタチン又はその塩の固形製剤の水分含量を1.5～2.9質量%の範囲内にするという技術的思想を有するものであるのに対し、サンプル薬においては、錠剤の水分含量を1.5～2.9質量%の範囲内又はこれに含まれる範囲内に収めるという技術的思想はなく、また、錠剤の水分含量を1.5～2.9質量%の範囲内における一定の数値とする技術的思想も存在しない。よって、サンプル

薬に具現された技術的思想が、本件発明2と同じ内容の発明であるということではできないと判示した。

控訴人（原審被告）は、上告及び上告受理の申立を行ったが受理されず、2019年2月14日に事件は確定した。

(2) 無効審判1（令和2年9月18日審決、無効2018-800092）

東和薬品は、興和の159特許に対して合計3件の無効審判を請求している。1件目の審判請求では、請求項1及び2に係る発明について進歩性欠如を主張した。

審判の手続きにおいて、特許権者は複数回の訂正請求を行い、審決では2020年2月7日付け訂正請求の訂正後の請求項1～5について訂正が認められ、請求項1ないし2にかかる特許が無効と判断された。最終的に、後発品をカバーする請求項6が生き残り²⁰、事実上当初の159特許を維持した形となった。

(3) 無効審判2（令和3年1月7日審決、無効2019-800029）

東和薬品は、2019年4月5日に2件目の審判を請求して、請求項1及び2に係る発明について特許無効を主張したが、請求項1及び2は、無効審判1の審決確定（2020年10月30日）により消滅したため、本件審判は、審判請求の対象を欠くとして、2021年1月7日に却下され、同2月7日に確定した。

(4) 損賠請求訴訟

地裁判決（東京地判令和4年3月24日）

興和は、2018年6月1日以降、東和薬品に対して損賠額の合計が約188億円となる4件の損賠請求訴訟を提起した²¹。

第1事件の提起からおおよそ4年後となる2022年3月に出された判決は、サポート要件違反により特許無効との理由で原告の請求を棄却した。原告勝訴の差止請求訴訟の結論から一転、後発の逆転勝訴となった。

サポート要件に関して裁判所は、本件各発明の課題を「ラクトン体の生成率を抑制した医薬品を提供すること」と認定したうえで、当業者が、本件各発明の固形製剤の水分含量を2.9質量%以下にすることにより、結晶セルロースを除いた構成によってラクトン体の生成率(40℃75% RH 2か月後)が0.23%と0.35%の間のいずれかの値以下に抑制された医薬品を提供することができることを認識することはできず、本件各発明の課題を解決することができることを認識することはできない、よってサポート要件を充足しないと判断した。ここで本件各発明は、損賠請求訴訟係属中の2020年12月17日に、東和薬品が請求した3件目の無効審判手続き(無効審判3)における訂正請求により、請求項6~9にかかる発明となっていたが、いずれの請求項にかかる発明も結晶セルロースを必須成分としない部分を含むものであった。判決では、結晶セルロースを含む発明については、発明の詳細な説明の記載により当事者が当該発明の課題を解決できると認識することができるが、それ以外の発明については、課題を解決できると認識できないと判断したのである。同判決に対し、興和は控訴した。

知財高裁判決(知財高判令和4年9月21日)

知財高裁は、進歩性欠如により特許無効との理由で、控訴を棄却した。特許無効の理由こそ異なるものの、後発の勝訴が維持された。

進歩性に関して知財高裁は、本件各発明はいずれも進歩性を有しないと判断した。ここで本件各発明は、無効審判3の手続きにおける訂正請求により、請求項6, 9にかかる発明ないし訂正請求項6, 9にかかる発明となっており、本件発明6, 9と乙12発明と相違点(相違点1)、訂正発明6と乙12発明との相違点(相違点1~3)、及び訂正発明9と乙発明との相違点(相違点1~4)は、いずれも当業者がなしえた事項であるか、当業者の予測の範囲であり、かつ顕著な効果を有するとはいえないので進歩性を有しないと判断された。

なお、上告期限(2022年10月5日)までに上告及び上告受理申立てはなく事件は確定した²²。

(5) 無効審判3(令和5年1月24日審決, 無効2020-800121)

東和薬品は、2020年12月17日に、159特許に対して3件目の無効審判を請求した。請求の趣旨は、請求項6ないし9に係る発明について、進歩性欠如、サポート要件違反、実施可能要件違反により特許を無効とするというものであった。審理中に訂正請求がされて請求項6, 7, 8, 9となったが、請求項7, 8は削除されたため、最終的に請求項6, 9に係る発明について、進歩性欠如とサポート要件違反により特許が無効とされ、請求項7, 8については審判請求が却下された。審決は2023年2月24日に確定した。

進歩性欠如とサポート要件違反の判断は、それぞれ損賠請求訴訟の高裁と地裁における判断と同様であった。

IV 考察

1 先使用権の抗弁

一般に、特許権侵害の抗弁として先使用権の主張が有力であると考えられることが多い。しかし、ピタバスタチン製剤事件の知財高裁の判断を考慮すると、対象特許がパラメータによる特定を含む発明である場合、その出願より前に同一の技術的思想が存在したことを証明するのは、もはやほぼ不可能である。

先使用権の抗弁が難しい場合、公然実施(公知技術)の抗弁を主張することも考えられる。「公然実施」が認められるためには、発明の内容を不特定多数の者が知り得る状況で、その発明が実施されることが必要である²³。しかし、少なくとも後発医薬品の開発過程において、同等性試験のために作成したサンプル薬自体や、サンプル薬に関するデータが「公然実施」の状態に置かれることはまずない。そうすると、先発対後発医薬品の特許権侵害訴訟においては、侵害の否認が出来ない場合の抗弁は、ほぼ特許

無効の主張に尽きることになるだろう。

なお、医薬分野で先使用権が争点になった過去の事件として、後発品の即時実施の意図の要件として、原告製品との同等性が確認できていることを要すると判断したクレメジン事件²⁴がある。

2 後発対策としての先発の特許出願戦略

興和の159特許は、後発品の申請直前と思われる2012年8月8日に出願された後、同年10月23日に早期審査を利用して審査請求され、3ヶ月余で翌年2月1日に登録となり、続く4月24日に登録公報が発行された。通常、特許は出願後1年6ヶ月で公開されるが、この特許はそのはるか前に登録公報として突如出現し、後発メーカーを驚かせたものと推測する。後発側に、先発特許をつぶす対策を講じる十分な時間を与えない巧妙な方法であり、最近の先発対後発医薬品の特許を巡るせめぎあいから生まれた新手の戦略であると言える。先使用権の抗弁の困難性を考慮すると、先発としてはこのようなタイミングでパラメータ発明の特許出願権利化を行うのがより効果的であろう。

後発側は、このようなタイミングで先発の特許が出願権利化された場合、将来の無効の主張に備えて早急に準備を進める必要があると考える。

3 訴訟戦略

先発対後発医薬品の特許を巡るせめぎあいにおいて、先発が勝訴するのは容易ではない。理由は、先発が簡単に勝訴するような状況では、後発は参入を控えるというのが一つの理由だと考える。訴訟が起きるのは、双方に見解の違いが生じる余地があるからであり、誰もが白黒つけられる事案については訴訟に発展しにくい。

先発勝訴に向けて一番のハードルとなるのは、後発側からの特許無効化のアクションである。先発側は特許が潰される前に早期に決着をつける必要がある。ピタバスタチン製剤事件では、差止の地裁判決は2017年9月29日、高裁判決は

2018年4月4日であり、その後2018年6月1日に最初の損賠請求訴訟を提起している。さらに毎年の売上に基づいて損賠請求を繰り返したためか、損賠請求の地裁判決がでたのは請求から4年後の2022年3月2日であった。これに対して、損賠請求でも先発が勝訴したマキサカルシトール事件では、差止の地裁判決は2014年12月24日、損賠請求は、2015年8月10日に提起して2017年7月27日に判決が出ている。

よって、先発が損賠請求訴訟でも勝つためには、より早期に第一審判決が出るように訴訟を進行する必要があると考える。早期に損賠請求訴訟の判決が確定すれば、主張の制限（特許法104条の4）により、判決確定後に無効審決が確定したとしてもこれを主張することができなくなる。

4 無効審判戦略

先発側は、無効審判で特許が潰される前に決着をつけることが重要であるとともに、審理中に訂正制度（特許法134条の2等）をうまく活用して特許が無効となるのを防ぐべきである。ピタバスタチン製剤事件では、損賠が遅かったことが悔やまれる一方で、目線を変えると特許権者が巧みに訂正を行った結果、差止請求では勝訴を勝ち取ることが出来たともいえるかもしれない。

後発側は、早期に無効審判を請求できるように準備をすることが重要である。さらに、無効審判は、同一の事実及び同一の証拠に基づく請求でなければ²⁵複数回請求できるので、粘り強く新たな証拠を探して、繰り返し無効審判請求することも効果的であると考えられる。なお、サポート要件や実施可能要件の判断は、発明の課題や出願時の技術常識の認定により判断が変化するので、このような点について検討を重ねることも有用であろう。

V おわりに

以上、ピタバスタチン製剤事件を通して見えてくる先発対後発医薬品の特許を巡るせめぎあ

いについて検討した。先使用权の抗弁、先発の出願権利化のタイミング、訴訟戦略、そして無効審判に至るまで、これまでにない論点について判断がされ、新たな戦略が生まれている。先発対後発医薬品の特許を巡るせめぎあいが、先発対後発医薬品の競争においてイノベーションを起こしているといえる。ピタバスタチン製剤事件以外にもこのような傾向が散見されるので、引き続き調査・研究を続けていきたい。

〔注〕

- 1 ピタバスタチン、オキサリプラチン、プレガバリン等
- 2 薬機法14条の4
- 3 特許法69条1項, 最判平成11年4月16日, 平成10年(受)153
- 4 平成21年6月5日付け医政経発第0605001号・薬食審査発第0605014号(通称「二課長通知」)
- 5 平成21年1月15日付け医政経発第0115001号
- 6 無効審判(特許法123条1項), 特許異議申立(特許法121条1項)
- 7 東京地判平成28年3月3日, 地裁判決13件, 高裁判決11件(特許第4430229号の事件)
- 8 侵害訴訟: 東京地判令和3年11月24日, 地裁判決26件, 高裁判決16件, 審決取消訴訟: 知財高判令和4年3月7日
- 9 東京地判平成27年6月25日, 地裁判決6件, 高裁判決5件(原審被告数: 16社)
- 10 最判平成29年3月24日, 東京地判平成27年7月27日
- 11 東京地判令和4年2月24日, 東京地判令和4年5月27日, 東京地判令和4年12月13日
- 12 東京地判令和元年5月29日
- 13 知財高判令和元年11月14日
- 14 知財高判平成30年11月20日
- 15 東京地判令和3年3月30日
- 16 知財高判平成30年4月13日
- 17 実際の製品には、カルシウム塩であるピタバスタチンカルシウムが使用されており、これが体内でピタバスタチンとなって薬効を発揮する。
- 18 日産化学, 興和ニュースより: https://www.nissanchem.co.jp/news_release/news/n2013_12_26.pdf (as of Aug 14, 2023)
- 19 被告はOD錠4mgだけでなく、同1mg製品、及び同2mg製品(本件2mg製品)を販売していた。
- 20 本件審決は、2020年10月30日に確定したので、159特許は請求項6の内容でさかのぼって特許出願、出願公開、特許権の設定登録がされたものとなる(特許法128条)。
- 21 東和薬品プレスリリース: <https://www.towayakuhin.co.jp/pdf/news180622-1.pdf>, <https://www.towayakuhin.co.jp/pdf/news190402.pdf>, <https://www.towayakuhin.co.jp/pdf/news200406.pdf>, <https://www.towayakuhin.co.jp/pdf/news210414.pdf> (as of Aug 14, 2023)
- 22 東和薬品プレスリリース: <https://www.towayakuhin.co.jp/pdf/news221006.pdf> (as of Aug 14, 2023)
- 23 2014年3月27日判決 東京地判平成24年(ワ)11800, 参考文献: 牧山皓一「特許権侵害訴訟において、公然実施による抗弁を主張する際の留意点」*パテント* Vol.62, NO.3, 27~35頁
- 24 東京地判平成21年8月27日
- 25 一事不再理(特許法167条)

IBL

国際取引法学会へのご参加 お待ちしております!

国際取引法学会は、研究者・実務家・法曹等が協働して国際取引法学の振興を図る場と機会を提供しております。全国大会の開催、学会誌および「国際商事法務」誌における研究報告の公表などを通じて研究成果の社会発信に努めています。活動詳細・入会案内は当学会ウェブサイト (<http://www.asas.or.jp/jaibl>) をご覧ください。