

—米国判例〈ノバルティス事件〉—

Novartis Pharmaceuticals Corp. v. Eon Labs Manufacturing Inc.
70 USPQ2d 1438 (CAFC 2004.4.2)

21世紀知的財産研究会
(略称 I P R I)
担当：弁理士 三 枝 英 二

—原審：デラウェア州地裁 2002年12月9日判決—

論点：

- ・プロドラッグ¹と特許権侵害
- ・特許請求の範囲の解釈－文言「ヒドロゾル」の解釈
- ・直接侵害及び侵害教唆乃至寄与侵害
- ・均等

1. 事件の概要

1-1. 事件の経緯

- (1) ノバルティスは、米国特許5389382号（以下「382特許」という。）の特許権者である。
- (2) ノバルティスは、エオンの製造販売するカプセル製剤が382特許を侵害するとして、デラウェア州地裁に提訴した。
- (3) 原審判決は、エオンの製剤は、382特許の直接侵害にも均等論下の侵害にも当たらず、また侵害教唆乃至寄与侵害にも当たらないと判決した。
- (4) ノバルティスはこれを不服とし、CAFCに控訴した。
- (5) CAFCは原審判決を支持し、ノバルティスの控訴を棄却した。

1-2. 382特許

争点となったクレーム1は以下の通りである。

1 プロドラッグについては、後掲3-1参照。「プロドラッグと特許権侵害」については、先に「特許管理」Vol. 43 No. 10 P.1241 (1993)において発表した。上記拙稿では、後掲判例No. 5「ゼニス事件」原審判決及び後掲判例No. 6「オルソ・ファーマシューティカル事件」判決並びに英国貴族院判決「ビーチャム事件」を紹介した。

「シクロスポリンの固体粒子と上記粒子の粒径分布を維持する為の安定剤とを含み、上記シクロスポリンは100ml当たり0.5g以下の水溶解度を有し、水に対するシクロスポリンの重量比が約1：300～約1：1500であり、且つ安定剤に対するシクロスポリンの重量比が約1：1～約1：50であるヒドロゾル。」

シクロスポリンは、臓器移植患者に投与して拒絶反応の危険性を減少させる免疫抑制剤である。シクロスポリン自体の特許は既に消滅している。シクロスポリンは水に難溶性であるから、人体に吸収されやすい水性製剤として投与するのが難しい。

382特許は、シクロスポリンを水性製剤であるヒドロゾルの形態として投与できる製剤に関する。ヒドロゾルは水性媒体に固体粒子が懸濁している液体であり、コロイド溶液ともいわれる。固体粒子の粒径は通常1 nm ($=10^{-9}$ m)～10,000nmである。本発明のヒドロゾル製剤は、シクロスポリンを水混和性液体、たとえばエタノールに溶解し、これに多量の水を加えることによって調製される。これによって人体により吸収されやすい薬剤の超微粒子の水性分散液が得られる。この超微粒子の成長を防ぐ為に、安定剤が加えられている。

1-3. 争点

ノバルティスは、エオンを382特許を侵害するとして訴えた。

エオンは、シクロスポリンを少量のエタノールに溶解した溶液を含有するカプセルを製造している。上記カプセルには水は存在せず、且つ内部のシクロスポリンは完全にエタノールに溶解しているから、エオンのカプセル内の溶液はヒドロゾルではない。しかし、ノバルティスは、エオンのカプセルが患者に投与されると、カプセルが患者の胃内の水分と混合し、患者の胃内で382特許を侵害するヒドロゾルを形成する、従って、エオンによるカプセルの製造販売行為は、382特許の侵害教唆乃至寄与侵害に当たると主張した。

また、ノバルティスは、体内におけるヒドロゾルの生成は382特許を均等論下に侵害すると主張した。

2. 判決

2-1. 原審判決（アラウエア州地裁）

原審はノバルティスの主張を斥け、クレームに記載されたヒドロゾルなる文言は次の2つの要素を必要とすると判示した。

- (a) ヒドロゾルは、合成された医薬製剤である。従って、患者の胃内でのみ形成されるシクロスポリン粒子の分散液を含まない。
- (b) クレームされたヒドロゾルは、静脈注射によって投与すると明細書に記載されているから、ヒドロゾルは合成された医薬製剤に限定され、患者の胃内で形成されるものを含まない。

以上の認定判断に基づき、原審は、エオンのカプセルの使用は、直接侵害も文言上又は均等論下の侵害も生ぜず、従って侵害教唆乃至寄与侵害にも当たらないと判示し、ノバルティスの訴えを棄却した。

次に、ノバルティスの均等の主張に対し、原審は、均等論侵害を認めることはクレームの限定、即ちヒドロゾルは合成された医薬製剤に限られるという限定をないものにするから、均等論侵害はないと判示した。

2-2. CAFC判決

判決は、明細書に記載された「ヒドロゾル」、「医薬」、「製剤」等の文言を辞書により検討し、夫々の文言の意味を明らかにしている。そして、「医薬」は病気を治療するのに用いられる薬品を意味し、「製剤」は投与前に調製されたものを意味するとし、ヒドロゾルに関連して記載されている「医薬製剤」は病気を治療するために投与される予め存在する製品であり、従って必ず体外で調製されるものであると認定した。このことから判決は、「ヒドロゾル」について次のように認定判断した。

「本件において、明細書にはクレームされたヒドロゾルは医薬製剤に関連して記載されており、他の意味を有する語としては記されていない。ノバルティスは、明細書には患者の体内でヒドロゾルが生成する旨の記載も実施例もないことを認めている。寧ろ、アブストラクトには、『本発明は、静脈注射可能な安定した薬理的に許容される形態で薬理活性化合物のヒドロゾルを提供する。』と記されている。また明細書には、ヒドロゾルは静脈注射可能な安定した薬理的に許容される形態で薬剤の固体粒子を含有すると記されている。明細書には繰返し、本発明は、医薬製剤、医薬製剤の調製方法及び医薬製剤を用いる治療方法の発明であると記されている。辞書によると、『医薬』は薬効のある薬品と定義されている。これらの記載は、ヒドロゾルのより狭い定義を支持している。クレームされた注射可能な溶液であるヒドロゾルは、薬理的に活性化化合物の粒子を静脈注射の目的で水性ヒドロゾルの形態で用いる点に新規性があり、先行技術とは区別される。注射可能なヒドロゾルは、必ず体外で調製されなければならないから、これらの記述は、ヒドロゾルは体外で調製された医薬製剤を意味するという限定された定義を支持している。」

更に、審査経過を参酌し、次のように認定判断した。

「382特許の審査経過からも同一結論に達する。審査官は、最初にノバルティスのクレームは自明であると拒絶した。ノバルティスは、本発明は固体医薬化合物の微粒子を無定形のコロイド形態としたものであり、この点で先行技術と相違すると主張した。更にノバルティスは、本発明の分散液は静脈注射により投与できる微細粒子を含有すると反論した。これらの主張も同様に、ヒドロゾルは患者に注射できる医薬製剤であることを明確に示している。」

以上の辞書、明細書の記載及び審査経過による認定判断に基づき、次のように判示した。

「明細書及び審査経過から、ヒドロゾルは狭義の意味を有すると結論する。即ち、『ヒドロゾル』なる文言は、体外で調製されたコロイド溶液中の固体粒子の分散液から成る医薬組成物に限定される。」

次に、ノバルティスの直接侵害及び寄与侵害の主張に対し、次のように判示した。

「ノバルティスは、エオンはシクロスポリンをヒドロゾルの形態で販売していないことを認めしており、投与後にヒドロゾルを形成するとのみ主張している。従って、ヒドロゾルの適正な解釈を採用することにより、382特許の直接侵害はない。基礎となる直接侵害が存在しないから、侵害教唆乃至寄与侵害もあり得ない。」

更に、ノバルティスの均等の主張に対し、次のように判示した。

「ノバルティスは、たとえクレームされたヒドロゾルが体外で調製された製剤に限定されるとしても、体内でのヒドロゾルの生成は、均等論下に382特許を侵害すると主張している。地裁は、均等論下の侵害を認めるとクレームの限定をないことにするから、均等論下の侵害はないとの略式判決をした。当裁判所もこれに同意する。」

体内での特定の分散液の生成が均等論下の侵害に当たるとすると、分散液は体外で調製されるというクレームされた要件をないことにするから、均等論下に侵害することはない。均等論侵害

は、争点となっているクレームの要素と係争の製剤の対応する要素との間の相違が非実質的であることを必要とする。争点となっているクレームの範囲を胃内で生成する分散液を含ませるように拡張することは、必然的に『ヒドロゾル』という限定をクレームから外すことになる。」

本判決に対し、クレベンジャー判事は反対意見を述べた。反対意見の要点は、以下の通りである。

「『ヒドロゾル』は、単純に液媒が水であるゾルを意味する。文言『ヒドロゾル』について、辞書類には、ヒドロゾルが作られる場所について記載がない。ヒドロゾルはどこでも作ることができ、体外での製造は、体内を含めた製造場所のより狭い区分である。狭い区分が存在することにより、(文言の意味が)不明瞭になることはない。狭い区分の存在は、文言がしばしば広い意味と狭い意味を持っていることを示すだけである。我々は、明細書及び審査経過を検討して、特許権者が広い意味を明確に放棄したか否かを決定する。もし否であれば、実施例、たとえば本件特許における静脈及び注射の実施例、によって広い範囲を狭くして狭い意味に解釈することはできない。

特許においてクレームされた医薬は体内又は体外で調製でき、且つ侵害は適切な証明があれば何れの場合にも生ずることを、我々の判例法は長く認めてきた。これらの先例は、本件と同様に、患者の治療に関する。医薬の通常の意味は、製造場所の限定を有さない(『シェーリング事件』²、『ヘキスト事件』³、『ゼニス事件』⁴参照)。各先例は医薬製剤を含んでいる。しかし、体外で製造された(特許とは)異なる組成物の投与によりクレームされた組成物が体内で医薬として生成するとき、『医薬』なる文言について辞書の定義を適用して特許権者の侵害を証明する権利を否定したのは、本件が最初である。」

3. 研究(プロドラッグと特許権侵害)

3-1. プロドラッグ

エオンのカプセルが382特許を侵害するとするノバルティスの主張は、プロドラッグについての侵害論に準拠している。即ち、プロドラッグは公知の医薬化合物(A)の生体への吸収性を向上させる、毒性を低下させる、安定性を向上させる、薬効の持続性を向上させる等の目的で、医薬化合物(A)の構造の一部を化学的に修飾した化合物であり、製造販売されている段階では医薬化合物(A)とは構造を異にする別異の化合物であるが、患者に投与すると生体内で代謝され医薬化合物(A)となって薬効を発揮する化合物である。医薬化合物(A)が特許されているとき、特許権者は、プロドラッグは患者に投与されると生体内で特許の医薬化合物(A)を生成して薬効を発揮するから、患者の上記行為は特許の直接侵害に当たり、従ってプロドラッグの製造販売行為は侵害教唆乃至寄与侵害に当たると主張し、更には均等論下にも特許を侵害すると主張して幾つかの事例で争われてきた。本件において、ノバルティスは、製剤特許である382特許について、エオンの製剤は患者に投与すると生体内で胃内の水分と混合し、特許の製剤(ヒドロゾル)を生成するから、382特許を侵害すると主張した。

我が国には、プロドラッグについて特許に係る医薬化合物(A)の侵害に当たるか否かを判断した事例はない。従って、ノバルティス事件を中心に、外国の事例を見ながらこの問題を検討した

2 後掲判例No. 4事件

3 Hoechst-Roussel Pharms. Inc., v. Lehman, 42 USPQ2d 1220 (CAFC 1997)

4 後掲判例No. 5事件

い。

3-2. 特許請求の範囲の解釈—文言「ヒドロゾル」の解釈

米国では、明細書に記載された用語の意味を辞書により明らかにすることは古くから行われており、多くの先例がある⁵。控訴審においてCAFCは、これらの先例にならって、明細書に記載されている「ヒドロゾル」、「医薬」、「製剤」等の用語の意味を辞書類に従って明らかにしている。そして、ヒドロゾルに関連して記載されている「医薬製剤」について、「医薬」は病気を治療するのに用いられる薬品を意味し、「製剤」は投与前に調製されたものを意味するとし、「医薬製剤」は病気を治療するために投与される予め存在する製品であり、従って必ず体外で調製されるものであると認定している。このことから、明細書に「医薬製剤」として記載され、また静脈注射可能な形態であると記載された「ヒドロゾル」は、体外で調製されたヒドロゾルに限定されると認定判断している。

また、審査経過を参酌して、ノバルティスが、本発明「ヒドロゾル」は、固体医薬化合物の微粒子を無定形のコロイド形態としたものである点で先行技術と相違すると主張したこと、及び本発明のヒドロゾルは静脈注射により投与できる微細粒子を含有するものであると主張したことから、「ヒドロゾル」は患者に注射できる医薬製剤であり、明細書の記載と併せて、「ヒドロゾル」は体外で調製されたコロイド溶液中の固体粒子の分散液から成る医薬製剤に限定されると認定している。

3-3. 直接侵害及び侵害教唆乃至寄与侵害

医薬製剤であるヒドロゾルを以上のように解すると、エオンの製剤を服用した患者はその胃内でヒドロゾルを生成するとしても、体外で調製されたものではないから、患者は382特許を直接侵害することはないことになる。我が国においては、特許権の効力は業としての実施に及び、個人的実施や家庭的実施には及ばないとされているが、米国においては業としての実施に限られておらず、特許権の効力は個人的又は家庭的実施にも及ぶ。従って、患者の行為も、業としての実施ではないが、特許権侵害の対象となる。しかし本件では、上記の通り、患者の胃内でヒドロゾルを生成するとしても、患者の行為は本件特許を直接侵害することはない。

米国において侵害教唆乃至寄与侵害は、直接侵害の存在を前提として成立する。患者が直接侵害することのない本件においては、侵害教唆乃至寄与侵害は成立しない。

以下に、プロドラッグについて、文言解釈、直接侵害、侵害教唆乃至寄与侵害について判断した本件以前の判例を挙げる。

〈判例No. 1 メレルダウ事件〉

Marion Merrell Daw Inc. v. Baker Norton Pharmaceutical Inc.

41 USPQ2d 1127 (フロリダ州南地区地裁 1996年11月12日判決)

本事例は、化合物自体のクレームを合成手段によって製造された化合物に限定して解釈し、人の体内で代謝により生産された化合物を非侵害としたものである。

メレルダウ (MMD) の特許は2件あり、3878217号 (217特許) は、アレルギー性反応の治療薬である「ターフェナジン」に関する特許であり、4254129号 (129特許) は、ターフェナジンが

5 a) Texas Digital Sys., Inc. v. Telegenix, Inc., 64 USPQ2d 1812 (CAFC 2002)

b) Inverness Med. Switz. GmbH v. Warner Lambert Co., 64 USPQ2d 1933 (CAFC 2002)

患者に投与されたとき代謝により体内で生成するターフェナジン酸代謝物（TAM）に関しており、クレーム1～9は、TAM自体の発明、クレーム10はTAMを有効成分として含有する医薬製剤の発明、クレーム11はTAMを患者に投与してアレルギー性疾患を治療する方法の発明である。TAMは、人の肝臓でターフェナジンが代謝されたときに生産される代謝産物である。217特許は既に消滅しているが、129特許は有効に存在する。

本件はプロドラッグとは開発の順序が逆で、既に特許されている医薬化合物「ターフェナジン」の代謝産物を後に見つけ出し、その代謝産物をクレームしたものである。217特許が消滅すると、ベーカーノートンは217特許を実施するためにFDAに製造承認の申請をした。これに対しMMDは、ベーカーノートンのターフェナジンを患者に投与すると、患者はその肝臓で必然的にTAMを生成するから、有効に存続している129特許を直接侵害し、従ってベーカーノートンのターフェナジンの製造販売行為は侵害教唆に当たるとして、本件訴訟を提起した。

ベーカーノートンは、消滅した217特許の実施によって129特許を侵害することはないと主張した。

直接侵害及び侵害教唆について、判決は先ずクレームを検討し、以下のように認定した。

- a. クレーム1には、特定の構造式を有する化合物と記されており、この化合物が合成手段により製造されたものに限られるのか否かについて争いがあるが、クレームにはこの化合物が合成されたものに限られるとの記載はないが、生体内で生成したTAMに関する旨の記載もない。
- b. クレーム10は、投与単位の医薬組成物であり、このクレーム10は、合成されたTAM製剤に限られる。
- c. クレーム6～9には、薬理的に許容される塩と記されている。これも特許が合成品に与えられたことの証左である。
- d. 上記クレームの構成は、TAMが合成された化合物に限られることを示している。

次に判決は、明細書の記載を検討し、明細書には、TAMの化学的合成及びその実施例、抗ヒスタミン剤としてのTAMの有用性及びTAMを有効量投与する投与モードが詳細に記されているが、代謝により生体内で生成したTAMに関する記載は全くないことから、TAMは合成されたものに限られると認定した。

次に審査経過を検討し、出願当初のクレーム2には「実質的に純粋なTAM」がクレームされていたが、審査官がクレーム1とクレーム2との間に差異はないとして拒絶したのに対し、MMDはクレーム2を削除し、それにより特許が付与された。代謝産物であるTAMは実質的に純粋ではないから、上記クレーム2の削除は、クレームに記載された「化合物」は（純粋であり）、合成手段によって生成した化合物に限られるという審査官の解釈をMMDが必然的に認めたことになる。従って、審査経過は、クレーム1のTAMは合成手段によって得られたものに限られるとの解釈を支持していると認定した。

以上の認定に基づき、次の通り判決した。

「ベーカーノートンのターフェナジン製品の投与は、摂取した患者の肝臓で代謝されてTAMを生成する。クレーム1は合成的に生成したTAMに限られるとの当裁判所の解釈からすると、ベーカーノートンの製品の投与によるTAMの生成は、129特許を侵害しない。ベーカーノートンの行為は、129特許の範囲外である。」

尚、本件はCAFCに控訴されたが、和解により取下げられた。

MMDは、本件特許（基本特許及びTAM）に対応する英国特許及び独国特許を有し、英国及び独国で同様の侵害訴訟を提起した。

〈判例No. 2 英国メレルダウ事件 英国貴族院 1995年10月26日判決〉

判決は、既に消滅したターフェナジン自体の特許の明細書に、「ターフェナジンの摂取によって人体内で一種の化学反応を生じ、抗ヒスタミン効果を発現する。」と記されていることから、「ターフェナジン明細書は、ターフェナジンの摂取によって体内で化学反応を生ずることを教えており、この態様で発明を実施するという目的に対しては、これは酸代謝物（米国でいうTAM）を生成するという十分な記載である。この記載の下に、酸代謝物は先行技術の一部となった。」とした。即ち、酸代謝物は新規性を欠くから、特許は無効であると判決した。

〈判例No. 3 独国メレルダウ事件 ミュンヘン高裁 1993年6月3日判決〉

判決は、何人も満了により消滅した特許を自由に実施できる。ターフェナジンは公知物質であり、先行技術であるから、何人もTAM特許を侵害することなしに市販できると判示した。

メレルダウは、消滅する特許の医薬化合物ターフェナジンの代謝産物TAMを後に見つけ出し、TAMの特許を取得して、ターフェナジンの特許による保護期間の延長を図ったが、米国、英国及び独国において、理由は異なるが、失敗に終わった。

〈判例No. 4 シェーリング事件〉

Schering Corp. v. Geneva Pharmaceutical Inc. 67 USPQ2d 1664 (CAFC 2003)

本事例は、ノバルティス事件において、クレベンジャー判事が反対意見の中で、医薬の通常の意味は製造場所の限定を有しないとした先例として挙げた判例の一つである。

本事例においても、係争の特許は、上掲メレルダウ事件と同様に、既に特許されている医薬化合物の代謝産物を後に見つけ出し、その代謝産物をクレームしたものである。

シェーリングは、アレルギー疾患治療薬である抗ヒスタミン剤「ロラタジン」を包含する米国特許4,282,233号（233特許）及び「ロラタジン」の代謝産物（DCL）を包含する米国特許4,659,716号（716特許）を有しており、716特許のクレーム1～4は、DCL化合物自体の発明、クレーム5～13は医薬組成物の発明、クレーム14～16はアレルギー疾患の治療法の発明である。716特許の最先の優先日の1年以上前に233特許は付与されており、従って233特許は716特許の先行技術となっている。233特許は既に消滅しているが、716特許は有効に存続する。233特許が消滅すると、多数のジェネリック社がFDAにロラタジンの製造承認を申請した。シェーリングは、ニュージャージー州地裁に侵害訴訟を提起した。ジェネリック社の一つであるジュネーブは特許無効の略式判決を求めて、反訴をした。

原審は、反訴に基づき、先ず特許の有効性の判断をした。そして、716特許のクレーム1及び3は人体内で代謝されたものも、純粹又は単離された形態で合成されたものも全ての形態のDCLを含むと解釈した。当事者はこの解釈に合意した。このクレーム解釈を採用して、原審は、233特許にはDCLについての記載はないが、233特許に記載された方法を実施するとDCLは必ず形成されると認定した。このことから、原審は、233特許は716特許のクレーム1及び3を予見させるとし、クレーム1及び3は新規性がなく無効であると判示し、有効性についての略式判決を求める被控訴人の反訴を認めた。

控訴審において、CAFCは以下の通り認定判断をした。

- ① DCLは通常の条件下でロラタジンから必ず不可避免的に生成する。DCLは患者にロラタジンを投与したときの必然の結果である。
- ② ロラタジンの使用は、代謝産物DCLを包含する716特許のクレーム1及び3を侵害することになるだろう。人がある化合物を摂取し、それを代謝して代謝産物を生成するとき、その代

謝産物に対するクレームを侵害する可能性がある。

先行技術であるロラタジンの代謝産物は、クレームされた発明と同一の化合物である。クレーム 1 及び 3 は個々の化合物がマーカッシュ形式でクレームされた化合物クレームである。DCLは、クレーム 1 及び 3 の範囲内に入っている。先行技術は、その代謝産物はDCLであることを内在的に記載しているから、クレーム 1 及び 3 は予見性があり、無効である。換言すれば、ロラタジンを摂取する患者は、必ずその化合物をDCLに代謝する。従って、上記行為はクレーム 1 及び 3 を侵害する可能性がある。その結果、ロラタジンを患者に投与することを記す先行技術は、クレーム 1 及び 3 を予見させる。

- ③ 716特許は、医薬組成物をカバーするクレーム 5～13及びDCLを含む組成物を投与することによってアレルギー性疾患を治療する方法をカバーするクレーム 14～16を有している。233特許はDCLを単離することを記載していないから、上記クレームを予見させる実施可能な記載を欠く。従って、これらのクレームは233特許により予見されないと認定する。

即ち、シェーリング事件の原審は、716特許のクレーム 1 及び 3 は体外及び体内で生産されたDCLを含むと解釈した。この解釈は、後に見出された代謝産物は体外で生産されたものに限られると限定解釈した前掲判例No.1「メレルダウ事件」とは異なっている。しかし、上記原審の解釈に対し、原告も被告も争うことなく同意している。これは、上記解釈を採用することにより、特許権者シェーリングは、被告ジュネーブが716特許を侵害しているとの主張が容易になり、被告は、716特許は233特許から予見性があり無効であるとの主張が容易になるためと考えられる。CAFCにおいては当事者がこの解釈に合意したから、上記解釈は争になっていない。そして原審は、このように解釈すると、233特許の方法を実施すると必ずDCLが生成するから、233特許は716特許のクレーム 1 及び 3 を予見させ、従ってクレーム 1 及び 3 は新規性を欠き無効であると判断した。CAFCは、上記解釈に基づいて、医薬化合物の代謝産物が特許されている場合に、当該医薬化合物を摂取して特許されている代謝産物を体内で生成するときは、代謝産物の特許を侵害する可能性があることを示唆した上で、原審と同じ理由で233特許は716特許のクレーム 1 及び 3 を予見させるとした。

更にCAFCは、233特許はDCLを単離することを記載していないから、医薬組成物のクレーム及び治療法のクレームは233特許から予見されないと判示している。そうすると、被控訴人ジュネーブは上記解釈に合意したことによって化合物クレーム 1 及び 3 は無効とすることはできたが、医薬組成物のクレーム及び治療法のクレームは有効なものとして残った。しかも判決は、医薬化合物を摂取して特許された代謝産物を体内で生成するときは、代謝産物の特許を侵害する可能性があることを示唆している。シェーリングが提起した侵害訴訟の判断は引続き行われるが、ジュネーブは和解せざるを得ない立場に追い込まれたと思われる。

ノバルティス事件において、クレベンジャー判事が反対意見の中で、先例として挙げた本件シェーリング事件に対し、次のように述べて、ノバルティス事件はシェーリング事件とは異なるとしている。

「シェーリング事件では、当事者は争点のクレームが医薬ロラタジンの代謝産物、即ち医薬の投与により患者の体内で生産される化合物を包含することに同意した。我々は、これらのクレームは医薬自体に対する先行特許により予見されると判示した。この結論は、部分的には先行するクレームされた医薬を摂取すると代謝産物が生成し、従って代謝産物の特許を侵害することになるだろうという考え方に基づいている。しかし、本件（ノバルティス事件）では、クレームが摂取後に生成する化合物を包含することに対する（当事者の）同意は存在しない。これが論争の核心である。」

〈判例No. 5 ゼニス事件〉

Zenith Laboratories Inc. v. Bristol-Myers Squibb Co. 30 USPQ2d 1285 (CAFC 1994)

(原審：24 USPQ2d 1652 ニュージャージー州地裁 1992年)

本事例も、クレベンジャー判事が反対意見の中で、医薬の通常の意味は製造場所の限定を有しないとされた先例としてあげた判例の一つである。

本件は、米国特許第4504657号（以下「657特許」という。）の特許権者であるプリストルに対して、ゼニスが非侵害確認の訴えを提起した事例である。

657特許は、セファドロキシル系抗生物質であるセファドロキシル化合物に関しており、その唯一のクレームであるクレーム1は、37の特定のX線回折パターンを有するセファドロキシル1水塩（以下、判決に従い発明者の名を採って「ボウザード1水塩」という。）である。

ゼニスはセファドロキシル半水塩である「セファドロキシルDC」についてFDAの製造承認を受け、セファドロキシルDCが657特許を侵害しないことの確認を求めて訴訟を提起した。

上記セファドロキシルDCは、製造され、市販されている段階では特許のボウザード1水塩とは異なる物質であるが、患者に投与されると、生体内でボウザード1水塩に変化し吸収されて血流に入り、抗生物質として作用する。

本件の争点の一つは、ゼニスによるセファドロキシルDCの販売行為が657特許の侵害教唆に当たるか否かである。

原審は、セファドロキシルDCを服用してボウザード1水塩を胃内で生成する患者の行為は、657特許の文言どおりの侵害に当たるとした上で、ゼニスによるセファドロキシルDCの販売行為は侵害教唆に当たると判示した。

控訴審では、審査経過において投与前のボウザード1水塩はセファドロキシルDCの公知形態に比して優れた製造上の利点を有することをプリストルが強調したことから、ゼニスは657クレームはボウザード1水塩の投与前の粉末状形態に限られると主張した。これに対し、CAFCは次のように述べて、ゼニスの上記主張を斥けた。

「特許が付与されたクレームは、特定のX線回折パターンを発現するセファドロキシルDCの結晶形態に限定されているが、プリストルが審査経過で強調した製造上の特性を有する投与前の形態の化合物に限定されていない。」

即ち、クレームに投与前の形態の化合物に限られる旨の記載がない以上、そのように限定して解釈できないと判示した。

次に、セファドロキシルDCを服用した患者の胃内でボウザード1水塩が実際に生成しているといえるか否かを検討し、次のように判示して、原審判決を覆した。

「プリストルの試料により示されたX線回折パターンは、相関強度を有する僅か30の回折線である。原審は、この回折線のうち僅か22の線をクレームに記された対応する回折線と比較した。この比較に基づき、原審は、両者はプリストルが侵害分析を行うのに十分類似していると結論した。実際には、クレームに記載された回折線の数37ある。クレームに記載された回折線のうち、15（全体の40%に相当）が比較において考慮されなかった。……投与されたセファドロキシルDCから胃内で生成する結晶が、657特許を文字通り侵害するか否かに関して立証されていないとするゼニスの主張は正当である。投与後のセファドロキシルDCと657クレームとを比較する証拠を欠如している点において、プリストルは使用による侵害を立証できておらず、従って我々はゼニスによるセファドロキシルDCの販売行為が657特許の侵害教唆に当たるとする原審判決を覆す。」

先のノバルティス事件において、クレベンジャー判事が反対意見の中で先例として挙げた上記

ゼニス事件に対し、ノバルティス事件はゼニス事件と相違するとして、次のように述べている。「本件（ノバルティス事件）は、クレームされた化合物は投与前の形態に限定されないと判示したゼニス事件とは異なる。争点のクレームには、特定の化学物質即ち特定のX線回折特性により特徴付けられた結晶形態を有するセファドロキシル1水塩が記載されていた。クレームの文言の意味は明確であり、且つ投与前の形態に限られる旨の記載もその旨の暗示も一切なかった。従って、我々はクレームをそのように限定する根拠がないと認定した。従って、我々は、クレームは特定のX線回折パターンを発現するセファドロキシルDCの結晶形態に限定されているが、その投与前の形態の化合物に限定されていないと判示した。しかし、本件（ノバルティス事件）では、ヒドロゾルの明確な意味は明らかではなく、且つゼニス事件には、明細書及び審査経過においてなされた陳述を検討し、辞書の意義の中から（文言の意義を）選択するという長年の先例を変更する理由が全くない。」

3-4. 均等

米国において均等は、特許発明の構成要素とは異なる構成要素を有する第三者の実施形態が、特許発明と実質的に同一の方法で実質的に同一の機能を果たし、実質的に同一の結果を達成するときに成立するとされている。即ち、均等は侵害形態が特許発明と方法、機能及び結果の三要素において実質的に同一であるときに成立するとされている。

プロドラッグ特許についてこれを見ると、プロドラッグを服用した患者は、胃内で代謝して、特許に係る医薬化合物を代謝産物として生成する。この代謝により生成した医薬化合物は正に特許に係る医薬化合物そのものであるから、特許の医薬化合物と実質的に同一の方法で実質的に同一の機能を果たし、実質的に同一の結果を達成することになる。ノバルティス事件においても、エオンのカプセルの投与により患者の胃内で特許に係るヒドロゾルが生成するから、特許発明と実質的に同一の方法で実質的に同一の機能を果たし、実質的に同一の結果を達成するという均等成立要件を充足することになる。従って、ノバルティスはこの考え方の下に、均等の主張をしたと考えられる。

ノバルティス事件の原審は、特許に係るヒドロゾルは体外で製造されたものに限定されると限定解釈した。このことから、均等を容認することは、体外で製造されたものに限定されるという要件をないものにするということになるとして、ノバルティスの均等の主張を斥けた。

控訴審も、以下のように述べて、原審判決を支持した。

「体内での特定の分散液の生成が均等論下の侵害に当たるとすると、分散液は体外で調製されるというクレームされた要件をないことにするから、均等論下に侵害することはない。均等論侵害は、争点となっているクレームの要素と係争の製剤の対応する要素との間の相違が非実質的であることを必要とする。争点となっているクレームの範囲を胃内で生成する分散液を含ませるように拡張することは、必然的に『ヒドロゾル』という限定をクレームから外すことになる。」

本件と同様の考え方は、前掲判例No. 1メレルダウ事件にもみることができる。

〈前掲判例No. 1 メレルダウ事件〉

メレルダウ事件では、先に述べたように、クレームの記載、明細書の記載及び審査経過から、クレーム1に記載されたターフェナジンの代謝産物であるTAMは、合成的に製造されたTAMに限定されると解釈した。

そして、MMDの均等の主張に対し、「当審は、ベーカーノートンが消滅した217特許を実施する行為、即ちターフェナジンを製造及び販売する行為が、合成的に製造されたTAMに限られる

と認定したクレームの範囲を拡張して、129特許を（均等論下に）侵害するとするMMDの主張を採用をしない。」と述べて、限定的に解釈したクレームを均等論により拡張解釈して特許の侵害を容認することはできないとしている。

〈前掲判例No. 5 ゼニス事件〉

原審判決は、以下のように、ゼニスのセファドロキシルDCは、特許の医薬化合物と方法、機能及び結果の三要素において実質的に同一であると認定した上で、即ち均等成立要件を充足すると認定した上で、禁反言の法理により均等に基づく侵害の認定を排除した。

「係争のセファドロキシルDCは、たとえその製造及び投与前の状態では特許を侵害しないとしても、投与後に生体内においてボウザード1水塩に変化するので、ボウザード1水塩に係る係争特許と実質的に同一の方法で実質的に同一の機能を果たし、実質的に同一の結果を達成する。しかし特許は、（審査経過で強調された）ボウザード1水塩の製造上の利点を唯一の根拠として付与されており、従って侵害と認められる均等の範囲は特許が付与された製造上の特徴において均等である化合物に限られる。この見地から、均等理論による侵害の認定は審査経過に基づく禁反言により排除される。」

控訴審においてCAFCは、先ず次のように述べて、審査経過禁反言を適用しないと判示した。「審査経過禁反言の本質は、特許権者は審査経過で放棄した主題を訴訟において取戻せないことにある。本件では、ブリストルは問題になっている陳述によって、投与前の形態以外のボウザード1水塩の形態を放棄したとは認められない。製造上の利点に関する陳述が657特許の取得に何らかの役割を果たしたことを示す記録はない。更に、審査官の特許付与についての意見によると、特許付与の唯一の根拠は、単一の先行文献である米国特許3,781,287号及びクレームされた化合物は上記引例に関係しないとするブリストルの説得力のある意見であった。審査官は、製造上の利点に関する陳述に基づいて特許を付与したのではない。」

次に、ブリストルの均等の主張に対し、次のように判示した。

「セファドロキシルの公知形態に比してボウザード結晶が有する優れた製造関連特性（カプセル化の容易性）についての審査経過におけるブリストルの多くの主張からみて、唯一ではないとしても、他の形態に比してのボウザード結晶の主たる機能は摂取前の製造上の利点にある。他の機能は記載も示唆もされていない。セファドロキシルDCの摂取の結果として患者の胃内で予期せずボウザード結晶が生成するとしても、それは上記機能を全く果たさない。即ち均等論における機能／方法／結果テストを充足しない。従って法律問題として、均等論下の侵害はあり得ない。」

即ち、特許に係るボウザード1水塩は公知のセファドロキシルに比してカプセル化を容易にするという審査経過でブリストルが強調した製造上の利点をボウザード1水塩の機能として捉え、そのような機能を果たさないセファドロキシルDCとは機能を異にするから、両者は均等とはいえないと判決した。

プロドラッグについて均等を容認した事例として、次の判例がある。

〈判例No. 6 オルソ・ファーマシューティカル事件〉

Ortho Pharmaceutical Corp. v. Smith 18 USPQ2d 1977 (ペンシルバニア州地裁1990)

スミスらは、経口避妊薬として有用な女性ホルモンの一種であるステロイド化合物に関する米国特許3959322号（322特許）の特許権者である。

オルソ・ファーマシューティカル社は、上記特許のクレームされたステロイド化合物のプロドラッグに当たる「ノルゲステイメート」を製造販売していたが、特許権者に対し、上記特許権は本来無効であるから侵害に当たらないとの確認を求める訴訟を提起した。特許権者は、「ノルゲステイメート」は均等理論の下に322特許を侵害すると反訴した。

裁判所は、特許は有効であるとした上で、「ノルゲステイメート」は、生体内で特許の化合物を生成し、経口避妊薬として特許の化合物と実質的に同一の方法で実質的に同一の機能を果たし、実質的に同一の結果を達成するものであるから、均等理論の下に322特許を侵害すると判決した。

本件はCAFCに控訴されたが、控訴審では、オルソ・ファーマシューティカルは均等論については争わず、特許の有効性のみを争った。その結果、CAFCは均等論については判断していない。