令和３年３月２５日判決言渡

令和２年（行ケ）第１００９８号　審決取消請求事件

口頭弁論終結日　令和３年２月２６日

判　　決

原　　告　　東レ株式会社

同訴訟代理人弁護士　　重冨貴光

長谷部陽平

鷲見健人

同訴訟代理人弁理士　　皆川量之

被　　告　　沢井製薬株式会社

（以下「被告沢井製薬」という。）

同訴訟代理人弁護士　　小松陽一郎

原悠介

千葉あすか

被　　告　　ニプロ株式会社

（以下「被告ニプロ」という。）

同訴訟代理人弁護士　　川田篤

同訴訟代理人弁理士　　森本敏明

河村一乃

主　　文

１　特許庁が無効２０２０－８００００４号事件について令和２年７月２８日にした審決のうち「特許第３５３１１７０号の特許権存続期間延長登録出願２０１７－７００３１０号に基づく特許権の存続期間の延長登録のうち『処分の対象となった医薬品について特定された用途』が『慢性肝疾患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）』との部分を無効とする。」という部分以外を取り消す。

２　原告のその余の請求を棄却する。

３　訴訟費用はこれを２分し，その１を原告の負担とし，その余を被告らの負担とする。

事　実　及　び　理　由

第１　当事者の求めた裁判

１　原告

特許庁が無効２０２０－８００００４号事件について令和２年７月２８日にした審決を取り消す。

２　被告沢井製薬

原告の請求を棄却する。

３　被告ニプロ

(1) 主位的答弁

本件訴えのうち被告ニプロに対する訴えを却下する。

(2) 予備的答弁

原告の請求を棄却する

第２　事案の概要

本件は，特許権の存続期間の延長登録を無効とする審決に対する取消訴訟である。争点は，①被告ニプロに被告適格があるか否か，②発明の名称を「止痒剤」とする特許第３５３１１７０号（以下「本件特許」という。）を実施するために，後述する

処分（以下「本件処分」という。）を受けることが必要であったか否か，③延長登録の一部について無効理由があった場合に，当該延長登録の一部のみを無効にすることができるか否かである。

なお，上記①について，当審は，令和２年１２月２日，被告ニプロに被告適格があり，被告ニプロの被告適格に対する本案前の抗弁は理由がないとする中間判決を言い渡した。

１　手続の経緯

⑴　原告は，発明の名称を「止痒剤」とする発明につき，平成９年１１月２１日（優先日：平成８年１１月２５日［以下「本件優先日」という。］，優先権主張国：日本）に特許出願し（特願平１０－５２４５０６号），平成１６年３月１２日に特許第３５３１１７０号として設定登録を受けた（甲１，２。請求項の数３６。以下「本件特許」といい，各請求項に係る発明を，請求項の順に「本件発明１」などといい，これらをまとめて「本件発明」という。また，本件特許に係る明細書及び図面を「本件明細書」という。）。

⑵　原告は，平成２９年１１月２０日，本件特許について，存続期間延長登録の出願（出願番号２０１７－７００３１０号。以下「本件延長登録出願」という。）をした（甲３，４，１１６）。

本件延長登録出願は，原告が受けた，販売名を「レミッチＯＤ錠２．５μｇ」とする医薬品（以下「本件医薬品」という。）についての令和元年法律第６３号による改正前の「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「薬機法」という。）１４条９項の医薬品製造販売承認事項一部変更承認に基づくものであり，特許発明の実施について，平成２８年法律第１０８号による改正前の特許法（以下「旧特許法」という。）６７条２項の政令に定める処分を受けることが必要であった処分（本件処分）を次のとおりとするものである。

ア　延長を求める期間　５年

イ　延長登録の理由となる処分

薬機法１４条９項に規定する医薬品に係る同項の承認

ウ　処分を特定する番号

２２９００ＡＭＸ００５３８０００

エ　処分を受けた日

平成２９年９月２２日

オ　処分の対象となった医薬品

販売名　　レミッチＯＤ錠２．５μｇ

有効成分　　ナルフラフィン塩酸塩

カ　処分の対象となった医薬品について特定された用途

（補正前）

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）

透析患者，慢性肝疾患患者

（補正後）

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）

透析患者（血液透析患者を除く），慢性肝疾患患者

(3) 本件医薬品については，本件処分に先立ち，平成２９年３月３０日に薬機法１４条１項に基づく医薬品製造販売承認（以下「先行処分」という。）がされていたところ，先行処分における効能・効果は，「次の患者におけるそう痒症状の改善（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」であった（甲３６，１０４）。

(4) 特許庁の審査官は，本件延長登録出願の審査の過程で，「処分の対象となった医薬品について特定された用途」のうち，血液透析患者を対象とする部分は，先行処分に包含されるものであるとして，平成３０年３月１３日付け拒絶理由通知（甲２６）を発し，原告はそれを受けて，同年４月２０日付けの手続補正書で本件延長登録に係る願書の「処分の対象となった医薬品について特定された用途」を上記(2)のとおり補正し（甲１４１），同年７月２５日に延長の期間を「５年」とする本件

特許権の存続期間の延長登録（以下「本件延長登録」という。）がされた（甲１，１４２）。

(5) 被告沢井製薬は，令和２年１月２３日，本件延長登録について無効審判（無効２０２０－８００００４号事件）を請求し，被告ニプロは，同年４月１０日，特許法１４８条１項に基づく参加申請をし，特許庁は，同年６月１１日，参加を許可する決定をした（甲６０，弁論の全趣旨）。

特許庁は，令和２年７月２８日，「特許第３５３１１７０号の特許権存続期間延長登録出願２０１７－７００３１０号に基づく特許権の存続期間の延長登録を無効とする。」との審決（以下「本件審決」という。）をし，その謄本は同年８月６日に原告に送達された。

２　本件発明の要旨

本件特許の請求項１～１０，１５，２１，２６，３１～３６の特許請求の範囲の記載は，次のとおりである。

【請求項１】

下記一般式（Ｉ）

［式中，

┅

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NR^4，ＳまたはＯを表し，R^4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R^4は同一または異なっていてもよい）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14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，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１４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，R^5は水素または下記の基本骨格：

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，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。

【請求項２】

前記一般式（Ｉ）において，R^1がメチル，エチル，プロピル，ブチル，イソブチル，シクロプロピルメチル，アリル，ベンジルまたはフェネチルであり，R^2，R^3が各々独立して水素，ヒドロキシ，アセトキシまたはメトキシであり，Ａが－XC（＝Ｙ）－（ここで，ＸはNR^4，Ｓ，またはＯを表し，ＹはＯを表し，R^4は水素または炭素数１から５のアルキルを表す），－XC（＝Ｙ）Ｚ－，－Ｘ－または－XSO_2－（ここで，Ｘ

は NR^4を表し，ＹはＯまたはＳを表し，ＺはNR^{4}またはＯを表し，R^4は水素または炭素数１から５のアルキルを表す）であり，Ｂが炭素数１から３の直鎖アルキレンであり，R^6とR^7とは一緒になって－Ｏ－であり，R^8が水素であるものである請求項１記載の止痒剤。

【請求項３】

前記一般式（Ｉ）において，Ａが－XC（＝Ｙ）－または－XC（＝Ｙ）Ｚ－（ここで，ＸはNR^{4}を表し，ＹはＯを表し，ＺはＯを表し，R^4は炭素数１から５のアルキルを表す）であるものである請求項２記載の止痒剤。

【請求項４】

前記一般式（Ｉ）において，　R^2が水素または下記の基本骨格：

　 　Q＝O，S

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）で表されるものである請求項２記載の止痒剤。

【請求項５】

前記一般式（Ｉ）において，Ａが－XC（＝Ｙ）－または－XC（＝Ｙ）Ｚ－（ここで，ＸはNR^{4}を表し，ＹはＯを表し，ＺはＯを表し，R^4は炭素数１から５のアルキルを表す）で表されるものである請求項４記載の止痒剤。

【請求項６】

前記一般式（Ｉ）において，R^1がメチル，エチル，プロピル，ブチル，イソブチル，シクロプロピルメチル，アリル，ベンジルまたはフェネチルであり，R^2およびR^3が

各々独立して水素，ヒドロキシ，アセトキシまたはメトキシであり，Ａが－XC（＝Ｙ）－（ここで，ＸはNR^{4}を表し，ＹはＯを表し，R^{4}は炭素数１から５のアルキルを表す）であり，Ｂが－CH＝CH－，－Ｃ≡Ｃ－，－CH$_2$O－，または－CH$_2$S－であり，R^{6}とR^{7}が一緒になって－Ｏ－であり，R^{8}が水素であるものである請求項１記載の止痒剤。

【請求項７】

前記一般式（Ｉ）において，R^{5}が水素または下記の基本骨格：

　 　Q＝O，S

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）で表されるものである請求項６記載の止痒剤。

【請求項８】

前記一般式（Ｉ）において，Ｂが－CH＝CH－または－Ｃ≡Ｃ－のものである請求項６記載の止痒剤。

【請求項９】

前記一般式（Ｉ）において，R^{5}が水素または下記の基本骨格：

　 　Q＝O，S

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）で表されるものである請求項８記載の止痒剤。

【請求項１０】

下記一般式（ＩＩ）

(II)

［式中

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７から１３のアラルキル，炭素数４から７のアルケニルまたはアリルを表し，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，R^4は水素，炭素数１から５の直鎖もしくは分枝アルキル，または炭素数６から１２のアリールを表し，Ａは炭素数１から６のアルキレン，－CH＝CH－または－Ｃ≡Ｃ－を表し，R^5は下記の基本骨格：

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，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は炭素数１から５のアルキル，アリルであり，X^-はその薬理学的に許容される対イオン付加塩を表す。また，一般式（II）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。

【請求項１５】

下記一般式（ＩＩＩ）

(III)

［式中，

$\overset{\cdots}{\underline{\quad}}$

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７から13のアラルキル，炭素数４から７のアルケニルまたはアリルを表し，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，R^4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，Ａは炭素数１から６のアルキレン，－CH＝CH－または－Ｃ≡Ｃ－を表し，R^5は下記の基本骨格：

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，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）を表す。また，一般式（III）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またはその薬理学的に許容される酸付加塩を有効成分とする止痒剤。

【請求項２１】

一般式（ＩＩ）

(II)

［式中，

$\overset{\cdot\cdot\cdot}{—}$

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７から１３のアラルキル，炭素数４から７のアルケニルまたはアリルを表し，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，R^4は水素，炭素数１から５の直鎖もしくは分枝アルキル，または炭素数６から１２のアリールを表し，Ａは炭素数１から６のアルキレン，－CH＝CH－または－Ｃ≡Ｃ－を表し，R^5は下記の基本骨格：

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，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は炭素数１から５のアルキルまたはアリルであり，X^-はその薬理学的に許容される対イオン付加塩を表す。また，一般式(II)は（＋）体，（－）体，（±）体を含む］で表されるモルヒナン４級アンモニウム塩誘導体。

【請求項２６】

一般式（ＩＩＩ）

(III)

［式中，

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７から13のアラルキル，炭素数４から７のアルケニルまたはアリルを表し，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，R^4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，Ａは炭素数１から６のアルキレン，－CH＝CH－または－Ｃ≡Ｃ－を表し，R^5は下記の基本骨格：

T : CH, O
l = 0—5
m, n ≧ 0
m + n ≦ 5

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，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）を表す。また，一般式（III）は（＋）体，（－）体，（±）体を含む］で表されるモルヒナン－Ｎ－オキシド誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩。

【請求項３１】

請求項２１ないし２５記載のモルヒナン４級アンモニウム塩誘導体を含んでなる医薬。

【請求項３２】

請求項２６ないし３０記載のモルヒナン－Ｎ－オキシド誘導体またはその薬理学的に許容される酸付加塩を含んでなる医薬。

【請求項３３】

一般式（ＶＩＩＩ）

(VIII)

で表される３級アミンを，アルキル化剤を用いて４級アンモニウム塩化することを特徴とする一般式（ＩＩ）

(II)

（上記一般式（VIII）および（II）において，

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７から13のアラルキル，炭素数４から７のアルケニルまたはアリルを表し，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，R^4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，Ａは炭素数１から６のアルキレン，－CH＝CH－または－Ｃ≡Ｃ－を表

し，R^5は下記の基本骨格：

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，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）を表す。）で表される化合物の製造法。

【請求項３４】

アルキル化剤が炭素数１から５のヨウ化アルキル，炭素数１から５の臭化アルキル，炭素数１から５の塩化アルキル，炭素数１から５のメタンスルホン酸アルキル，炭素数１から５のジアルキル硫酸，ヨウ化アリル，臭化アリルまたは塩化アリルである請求項３３記載の製造法。

【請求項３５】

一般式（ＩＸ）

(IX)

で表される３級アミンを，酸化剤を用いて酸化することを特徴とする一般式（ＩＩＩ）で表される化合物の製造法。

(III)

（上記一般式（IX）および（III）において，

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７から１３のアラルキル，炭素数４から７のアルケニルまたはアリルを表し，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，R^4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，Ａは炭素数１から６のアルキレン，－CH＝CH－または－Ｃ≡Ｃ－を表し，R^5は下記の基本骨格：

T : CH, O
l = 0—5,
m, n ≧ 0
m + n ≦ 5

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，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）を表す。）

【請求項３６】

酸化剤が有機カルボン酸の過酸化物，過酸化水素，第３ブチルヒドロペルオキシド，クメンヒドロペルオキシドまたはオゾンである請求項３５記載の製造法。

３　本件審決の理由の要点

⑴　被告沢井製薬の主張する無効理由

ア　無効理由１

本件発明に係る「止痒剤」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」ものであって，「一般式（Ｉ）で表されるオピオイドκ受容体作動性化合物」の酸付加塩である「ナルフラフィン塩酸塩」を発明特定事項として含んでいない。

他方，本件医薬品の有効成分は「ナルフラフィン塩酸塩」であるから，本件発明の実施に旧特許法６７条２項の政令で定める処分を受けることが必要であったとは認められない。

イ　無効理由２

本件延長登録では，その理由となる処分（本件医薬品の承認）における「処分の対象となった物について特定された用途」は，「透析患者（血液透析患者を除く），慢性肝疾患患者」におけるそう痒症の改善であるとされているが，「慢性肝疾患患者」については，本件処分には存在しない（本件処分の適用患者ではない），又は先行処分と重複するから，本件発明の実施に旧特許法６７条２項の政令で定める処分を受けることが必要であったとは認められない。

ウ　以上からすると，本件延長登録は，旧特許法１２５条の２第１項１号に該当し，無効とすべきものである。

⑵　無効理由１について

ア　本件医薬品の有効成分について

本件医薬品の有効成分は，本件処分の対象となった医薬品の有効成分の記載，「医薬品インタビューフォーム」（甲９。以下「本件インタビューフォーム」という。）及び「添付文書」（甲２５。以下，「本件添付文書」という。）からすると，ナルフラフィン塩酸塩であると認められる。

イ　ナルフラフィン塩酸塩が本件発明の発明特定事項を満たすかどうかについて

(ｱ) 本件発明は，①一般式（Ｉ）で表される化合物に関する発明（本件発明１～９及び２０），②一般式（ＩＩ）で表される化合物に関する発明（本件発明１０～１４，２０～２５，３１，３３及び３４），③一般式（ＩＩＩ）で表される化合物に関する発明（本件発明１５～２０，２６～３０，３２，３５及び３６）の三つに大別されるところ，ナルフラフィンは，一般式（Ｉ）に含まれ，本件発明２～９及び２０はすべて本件発明１に従属するから，本件医薬品が本件発明１の発明

特定事項を備えているといえるか否かについて判断する。

(ｲ) 本件特許の請求項１には「下記一般式（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。」と記載されており，「オピオイドκ受容体作動性化合物」とは，「一般式（Ｉ）で表される化合物」（例えば，ナルフラフィンのフリー体）そのものを意味している。これに対して，「一般式（Ｉ）で表される化合物の塩」は，一般式（Ｉ）における環構造中のＮに塩酸（ＨＣｌ）のH^+が配位結合して塩酸（ＨＣｌ）を含む塩酸塩を形成しているものであるから，「一般式（Ｉ）で表される化合物」とは別の化合物である。したがって，「一般式（Ｉ）で表される化合物の塩」，例えば，ナルフラフィン塩酸塩は，請求項１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」に文言上（化学構造上）含まれていない。

また，本件明細書には，「一般式（Ｉ）で表されるオピオイドκ受容体作動性化合物」が，一般式（Ｉ）で表されるオピオイドκ受容体作動性化合物（フリー体）のみならず，酸付加塩をも含むものを意味することを定義付ける記載はない。

一方，一般式（ＩＩ）の化合物については，請求項１０に「下記一般式（ＩＩ）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，請求項１と同様の記載がされているが，一般式（ＩＩ）は，［式中，・・・X^-はその薬理学的に許容される対イオン付加塩を表す。・・・］というものであって，対イオン付加塩を含むものであることが明記されている。

さらに，一般式（ＩＩＩ）の化合物については，請求項１５に「下記一般式（ＩＩＩ）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学的に許容される酸付加塩を有効成分とする止痒剤。」と記載されており，薬理学的に許容される酸付加塩を含むものであることが明記されている。

上記の本件特許の特許請求の範囲及び本件明細書の記載に照らすと，本件特許の特許請求の範囲は，塩を含むか否かを明示的に記載していて，一般式（ＩＩ）及び一般式（ＩＩＩ）の化合物に関しては塩を含むが，一般式（Ｉ）の化合物に関して

は塩を含まないものであると解するのが相当である。

そうすると，ナルフラフィン塩酸塩を有効成分とする本件医薬品は，本件発明１の発明特定事項を備えておらず，本件発明２～３６の発明特定事項も備えていないから，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は認められない。

(ｳ) 出願当初の本件特許の特許請求の範囲の請求項３（甲１９）には，一般式（Ｉ）で表されるオピオイドκ受容体作動性化合物の薬理学的に許容される酸付加塩が含まれていたが，平成１３年４月２４日付け拒絶理由通知（甲２０，３３。以下「本件拒絶理由通知」という。）に応答した同年７月１６日付け手続補正（甲２２。以下「本件補正」という。）により，出願当初の請求項３は補正されて，独立項である請求項１となり，その際に，その末尾が「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。」となって，「その薬理学的に許容される酸付加塩を有効成分とする止痒剤」は含まないものとなった。他方で，（Ｉ）以外の一般式で表される化合物については，本件補正の後も一貫して薬理学的に許容される塩を有効成分とする止痒剤が明示的に特許請求の範囲に記載されたままである。このような審査経過に照らすと，ナルフラフィン塩酸塩などの「一般式（Ｉ）で表されるオピオイドκ受容体作動性化合物の薬理学的に許容される酸付加塩」を有効成分とする止痒剤は，本件補正により特許請求の範囲から除外されたものと解するよりほかない。仮に，手続補正をした者の意図がそうでなかったとしても，外形的にこう解されることは否定されない。

したがって，本件特許の審査経緯に照らしても，本件発明は，ナルフラフィン塩酸塩を有効成分とする本件医薬品を含むものではないといえる。

(ｴ) 原告は，本件発明の「一般式（Ｉ）で表されるオピオイドκ受容体作動性化合物」が，止痒の薬効となる薬理作用を奏する成分（有効成分）でありさえすればよく，「止痒剤」に「一般式（Ｉ）で表されるオピオイドκ受容体作動性化合物」がどのような形態で含有されるかは問わないと主張する。

しかし，「成分」とは，一般に，混合物を構成する各物質のことを意味し，医薬

品の場合，その「有効成分」とは，医薬品という混合物を構成する各物質のうち，薬効を示す物質をいうことが技術常識である（甲１５～１７，２７，「広辞苑　第二版増訂版」１２３０頁「成分」の項，「廣川薬科学大辞典」８５５頁「成分」の項及び１５８４頁「有効成分」の項）。したがって，本件発明１における「止痒剤」の「有効成分」とは，医薬品という混合物である「止痒剤」に含有され，「止痒剤」を構成する物質であって，一般式（Ｉ）で表される，塩の付加していない化合物を意味すると解するべきである。

ウ　以上からすると，無効理由１は理由がある。

⑶　無効理由２

ア　本件発明１のうち，「血液透析患者及び慢性肝疾患患者」を対象とする場合については，先行処分によって実施できるようになっていたといえる。

本件処分は，先行処分の後，「腹膜透析患者」にも効能・効果が認められ，既に承認を取得している効能・効果と合わせて「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）　透析患者，慢性肝疾患患者」として平成２９年９月２２日にされた承認である。そして，本件延長登録は，この本件処分に基づき，「処分の対象となった医薬品について特定された用途」を「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）　透析患者（血液透析患者を除く），慢性肝疾患患者」として登録され，先行処分により実施できるようになった「血液透析患者」については本件延長登録の対象から除いて認められた。

しかし，慢性肝疾患患者を対象とする場合についても，先行処分によって実施できるようになっていたのであるから，慢性肝疾患患者を対象とする場合の実施に本件処分を受けることが必要であったとは認められない。

したがって，本件延長登録のうち，「処分の対象となった医薬品について特定された用途」が「慢性肝疾患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）」の部分は，その実施に旧特許法６７条２項の政令で定める処分を受けることが必要であったとは認められない。

イ　以上のとおりであるから，無効理由２は，本件延長登録のうち「処分の対象となった医薬品について特定された用途」が「慢性肝疾患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）」の部分について理由がある。

⑷　むすび

以上のとおり，本件延長登録は，その全体が旧特許法１２５条の２第１項１号に該当し，無効とすべきものである。

４　原告主張の審決取消事由

⑴　取消事由１（本件医薬品の有効成分に関する事実認定の誤り）

⑵　取消事由２（本件発明１の解釈の誤り）

⑶　取消事由３（法令解釈の誤り）

⑷　取消事由５（延長登録要件を充足する部分を除外せずに延長登録全部無効判断をしたことの法解釈の誤り）

第３　当事者の主張

１　被告ニプロが被告適格を有するかどうかについて

上記の点についての被告ニプロの主張は中間判決に記載のとおりである。

２　取消事由１（本件医薬品の有効成分に関する事実認定の誤り）について

（原告の主張）

⑴　本件審決の事実認定の誤り

本件医薬品は，本件発明１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」であるナルフラフィン（フリー体）を有効成分とする医薬品であり，本件発明１の発明特定事項を備えているものであるが，本件審決は，本件医薬品の有効成分がナルフラフィン塩酸塩であると誤って認定している。

以下で詳述するとおり，医薬品の有効成分に関する技術常識，ナルフラフィン塩酸塩の有効成分に関する科学的・客観的な理解，本件医薬品の製造販売承認書の記載等からすると，本件医薬品がナルフラフィンを有効成分とする止痒剤であることは明らかである。

⑵　医薬品における「有効成分」の意義についての技術常識

医薬分野の当業者において，「有効成分」の用語は，以下のとおり，薬効を生じる薬理作用を奏する成分を意味するものとして理解されて用いられており，それが技術常識となっている。

すなわち，「有効成分」との用語は，ドイツ人薬剤師であるＣによって，生薬において薬効を生じさせる物質（フリー体）を指す用語として用いられ始めたものである（甲６１～６３）。

その後も，「有効成分」の語は，医療分野の当業者において，血中に吸収されて生体内で薬効を生じる薬理作用を奏する成分を指す用語として一貫して使用されてきて，それが技術常識となっていた（甲６４～７５）。

薬事行政を担う厚生労働省（旧厚生省。以下，単に「厚労省」という。）でも，「有効成分」について，薬効となる薬理作用を奏する成分を意味する用語としてこれを用い，医薬品の有効成分を測定・評価するためのガイドラインを作成してきた（甲７６）。また，厚労省では，所轄する国家試験である「医薬品の登録販売者試験」の「試験問題作成に関する手引き」において，「有効成分」について，消化管から吸収されて血液中に移行して薬効となる薬理作用を奏する成分を意味する用語として一貫して用いている（甲７７，７８）。上記試験の実際の試験問題は，上記手引きの記載に準拠して出題されており（甲７９），上記試験対策の参考書にも同旨の記載がある（甲８１）。

⑶　塩を付加する意義について

一般に，医薬品に用いられる原薬の開発は，初期段階として薬効及び当該薬効に係わる薬理作用を奏する化合物が見いだされ，次に，化合物の酸化・分解の防止や水に対する溶解度の向上などを期待して塩や結晶形などのスクリーニングが行われる（甲８２～８７）。

もっとも，スクリーニングによって選択される塩の形態いかんによって，化合物における薬効となる薬理作用が失われるものではなく，化合物が製剤中において塩

の形態をとったとしても，薬効となる薬理作用を奏するのは，塩が付加されない化合物（＝生体内において塩から遊離する化合物）であることは，当業者には技術常識になっていた（甲８２，８８～９０）。

⑷　ナルフラフィン塩酸塩の製造過程及び有効成分に関する科学的･客観的な理解

ナルフラフィン塩酸塩は，●●●であり，ナルフラフィン塩酸塩はヒトに投与されると直ちにナルフラフィンと塩化物イオンに解離し，ナルフラフィンが薬効となる薬理作用を奏する（甲２９，３０）。

⑸　本件医薬品の製造販売承認書等の記載

本件医薬品の先行処分に係る製造販売承認書（甲３６，１０４）では，●●●●●●●●●●●●●●●●●●●

れる」ものとされ（甲３４），また，世界保健機関（以下「WHO」という。）のガイダンスにおいても，薬効を発揮する部分の名称が付与されるルールとなっている（甲３５）から，この記載は，本件医薬品の有効成分がナルフラフィンであるとの理解に基づき本件インタビューフォームが作成されていることを示すものである。

⑹ 当業者において本件医薬品がナルフラフィンを有効成分とする止痒剤であると理解されていること

各文献（甲９３～１０３）には，本件医薬品及び本件医薬品のカプセル製剤（以下「本件カプセル製剤」という。）における有効成分がナルフラフィンであることが記載されており，当業者において，本件医薬品はナルフラフィンを有効成分とする止痒剤であると理解されていることが分かる。

⑺ 本件審決の認定について

本件審決は，本件添付文書（甲２５），本件インタビューフォーム（甲９）及び本件処分の対象となった医薬品の有効成分の記載を根拠として，本件医薬品の有効成分が，「ナルフラフィン塩酸塩」であると認定している。これらの記載は，本件医薬品の先行処分に係る製造販売承認申請書（甲３６，１０４。以下「本件承認申請書」という。）の有効成分欄に基づいて記載されたものである。

薬機法においては，「有効成分」の用語は，効能・効果と直接の関係のない賦形剤，安定剤，溶剤等の製剤補助剤を含まない，「効能，効果を薬理的に生ぜしめる有効な成分」であると定義されており，効能・効果とは関係しない他の「成分」と区別するために用いられるものであり（甲３１，１０５），本件承認申請書においても，他の成分（添加剤）と区別する形で，有効成分欄「０００（有効成分）」に原薬の「ナルフラフィン塩酸塩」が記載されている。

もっとも，前記⑵のとおり，厚労省も有効成分とは薬効を生じる薬理作用を奏する成分という意味であるとの理解を当然の前提としているから，上記のような本件承認申請書の有効成分欄の記載から直ちに有効成分が「ナルフラフィン塩酸塩」であって，①生体内で薬効となる薬理作用を奏する成分を有効成分とはしない，又は，

②生体内で薬効となる薬理作用を奏する成分を有効成分から除外していると理解されることにはならない。本件承認申請書の有効成分欄に原薬である「ナルフラフィン塩酸塩」が記載されているのは，それが薬理作用を有する有効成分を含んでいるので，他の成分と区別するために記載されているのである。

⑻　Ｄ意見書について

以上のような「有効成分」の意義及び本件医薬品の有効成分に係る理解は，長年にわたり医薬品の製造販売承認実務を含む薬事行政に関与してきた元昭和薬科大学学長のＤ名誉教授（以下「Ｄ名誉教授」という。）の鑑定意見書（甲１０６。以下「Ｄ意見書」という。）においても述べられている。

⑼　アミン及びモルヒナン骨格を有する化合物に関する技術常識

ア　アミンを有する化合物に関する技術常識

本件一般式（Ｉ）の化合物のように，アミンを有する化合物は，遊離塩基であり，水溶液中で塩基性を示す（甲１１７）ところ，遊離塩基は，一般に，空気酸化や光で分解されたり，空気中の二酸化炭素と塩を形成したりして不安定であるため，塩化して（何らかの酸との塩にして）用いられるが，塩化した場合にも，投与後の生体内においては，塩のまま存在するわけではなく遊離塩基が遊離し，粘膜からは遊離塩基が吸収される（甲１１８）。このことは，本件優先日当時の技術常識であった。

イ　モルヒナン骨格を有する化合物に関する技術常識

本件一般式（Ｉ）の化合物のように，モルヒナン骨格を有する化合物を有効成分とし，オピオイド受容体に作用する本件優先日当時の公知の医薬品は，いずれも，当該有効成分を酸付加塩の形態で含有する医薬品であり，本件優先日当時，モルヒナン骨格を有する化合物を医薬品の有効成分として用いる場合，塩化することが技術常識であった（甲１２０～１２９）。

また，モルヒナン骨格の環構造が一部除去されたベンゾモルファン骨格又はフェニルピペリジン骨格を有する化合物は，モルヒネ則と呼称される共通の構造的特徴を有し（甲１１９），いずれも３級アミン（第三級窒素）を有するものであるところ，

このベンゾモルファン骨格又はフェニルピペリジン骨格を有する化合物を有効成分とし，オピオイド受容体に作用する本件優先日当時の公知医薬品の多くも当該有効成分を酸付加塩の形態で含有する医薬品である（甲１３０～１３７）。

ウ　上記ア，イのとおり，本件優先日当時，本件一般式（Ｉ）の化合物のようなアミン及びモルヒナン骨格を有する化合物を有効成分とする医薬品を製造するに当たっては，当該化合物を塩酸等の酸で塩を形成して用いるのが通常であるとの技術常識が存在した。

⑽　被告らの主張に対する反論

ア　特許発明と医薬品製造販売承認書・承認申請書の記載事項は，規律する法令も異なる全く別個のものであるから，医薬品製造販売承認書・承認申請書の記載事項をもって，特許発明との関係における「有効成分」を特定するという被告ニプロの主張は，失当である。本件発明が医薬用途発明であることを踏まえて本件発明との関係で本件医薬品を特定すると，注目されるべきは当該用途（止痒）に係る作用効果を奏する成分が何であるかであって，医薬品中に含有される有効成分の存在形態は問題となり得ず，当業者は，本件医薬品の「有効成分」を止痒効果を奏する成分であるナルフラフィン（フリー体）であると一義的に理解する。

イ　被告らは，医薬品としての安定性，生体内における溶解性に差異があると，その薬効にも影響があるなどと主張する。

しかし，本件発明は有効成分となる化合物について止痒剤としての新たな医薬用途を見いだした医薬用途発明であり，被告らの主張は，本件発明の性質等を無視したもので失当である。

（被告沢井製薬の主張）

⑴　薬機法５２条は，「添付文書等の記載事項」について規定しており，これに関する「医療用医薬品添付文書の記載要領について（通知）」（甲８。昭和５８年５月１８日厚生省薬務局長　薬発第３８５号）には，「第２　記載要領」「７　組成有効成分の名称（一般的名称など。・・・）及びその分量を記載すること。」とされ

ており，本件での「ナルフラフィン塩酸塩」が一般的名称（ＪＡＮ）である（甲９）から，この点から「ナルフラフィン塩酸塩」が本件延長登録出願上の「有効成分」であることが裏付けられている。

原告は，医薬化合物一般の議論をしているが，本件発明１におけるクレーム上の「有効成分」の意義と，本件延長登録出願の対象としての「有効成分」の意義は別であって混同してはならない。

ナルフラフィンのフリー体とナルフラフィン塩酸塩は化学構造も異なり，医薬品にとって重要な作用効果である「止痒剤」として使用される場面での溶解性等も異なるものである（甲１０）。酸付加塩の有無は，投与時における有効成分として理解されなければならない。「ナルフラフィン塩酸塩を有効成分とする本件医薬品は，３（被告沢井製薬の主張）で後述するとおり，「ナルフラフィン」を有効成分とする本件発明１の発明特定事項を備えておらず，本件発明２～３６の発明特定事項も備えていないから，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は認められない。

⑵　本件処分の対象となった本件医薬品は，本件延長登録出願や本件延長登録，本件インタビューフォーム（甲９）及び本件医薬品の添付文書（甲１１，２５）においても，一貫して「ナルフラフィン塩酸塩」を有効成分としていることが明白であり，実際の「止痒剤」（そう痒症の改善）を用途とする本件医薬品もナルフラフィン塩酸塩である。

（被告ニプロの主張）

⑴　原告が提出した証拠に記載された「有効成分」との用語の意義は，いずれも医薬品をヒトに投与した後，「生体内」において薬効を生じる時点における成分を意味するものであり，「医薬品」として製造され，販売される場合における成分を意味するものではない。

一般に医薬品の特許発明の実施において問題とされるべきものは，「物」としての医薬品が製造され，販売される場合における有効成分の存在形態である。それは，

医薬品の医薬品製造販売承認書において「成分名」として記載されている。その医薬品がヒトに投与され，生体内においてどのような存在形態をとるかが問題となるわけではない。

本件医薬品についていうと，本件発明との関係において問題となるのは，本件承認申請書において「成分名」として記載されている「ナルフラフィン塩酸塩」である。それが「生体内」において「フリー体」の意味における「ナルフラフィン」となるかどうかは問題とはならない。

本件特許の特許請求の範囲に記載の「有効成分」としては，請求項１の「フリー体」としての「化合物」，請求項１０の「対イオン付加塩」が配位した「化合物」，請求項１５の「フリー体」としての「化合物」又はその「化合物」の「酸付加塩」などがあるが，いずれも「医薬品」である「止痒剤」における有効成分の存在形態を問題としているものであり，ヒトに投与された後の生体内における存在形態を問題としていない。そして，本件特許の特許請求の範囲において，医薬品としての止痒剤における有効成分の存在形態としての「フリー体」と「酸付加塩」は明確に区別されている。

医薬品において有効成分を「フリー体」とするか「塩」とするかは，医薬品としての安定性，生体内における溶解性などに差異があることによる。医薬品としての安定性，生体内における溶解性に差異があると，その薬効にも影響があるから，本件特許においても，「フリー体」のものと「酸付加塩」のものとでは，医薬品としての安定性，生体内における溶解性などに差異が生じ，その薬効にも影響があるというべきである。

なお，原告が提出する研究者の意見書（甲２９，３０）における見解もまた，ヒトに投与した後の生体内において薬効が作用する機構を明らかにしたにすぎず，医薬品として製造し，販売される状態における有効成分の存在形態とは関係のない議論である。

以上，検討したところより，本件審決が，本件特許の特許請求の範囲の記載など

を踏まえて，本件医薬品の有効成分について，本件承認申請書の記載のとおり，「ナルフラフィン塩酸塩」と認定したことに誤りはなく，原告が主張する取消事由１には理由がない。

⑵　原告は，「本件一般式（Ｉ）の化合物」が塩酸等の塩で塩を形成して用いるのが通常であり，ヒトに投与したときは，塩酸塩を形成している有効成分（化合物）が生体内において塩基として遊離して薬理作用を奏する旨を主張するが，本件医薬品，すなわち，「ナルフラフィン塩酸塩」が，生体内において遊離塩基として薬効を奏するとしても，それはあくまで本件医薬品をヒトに投与した後のことであり，本件医薬品の有効成分の存在形態とは無関係である。

また，「フリー体」である「ナルフラフィン」の製造後，その「ナルフラフィン」に塩酸を添加して「ナルフラフィン塩酸塩」とするかどうかは，技術的にも任意に選択し得ることである。原告は，本件特許の特許請求の範囲の補正をするに当たり，「本件一般式（Ｉ）の化合物」については，あえて「塩酸塩」の形態を選択せず，「フリー体」の形態を選択して特許請求をしたにすぎない。このような特許請求の範囲における選択は，いずれの有効成分の存在形態が通常であるかという問題とは関係のないことである。

３　取消事由２（本件発明１の解釈の誤り）について

（原告の主張）

⑴　本件発明１における「有効成分」の意義

ア　本件発明１の技術的意義

本件発明１が，一般式（Ｉ）で表されるオピオイドκ受容体作動性化合物に止痒の薬理作用を見いだした医療用途発明であることからすると，薬理作用を奏する成分がフリー体であるか，酸付加塩の形態をとっているかは，医薬用途発明の作用効果とは無関係であり，何ら重要ではなく，本件特許の請求項１の「有効成分」は薬効となる薬理作用を奏する成分を意味するものと一義的に理解されるし，少なくとも，本件特許の請求項１の「有効成分」が製剤中に含有される形態の化合物を特定

したものとは理解されない。

イ　本件明細書（甲２）の記載

以下のように，本件明細書の記載からも，本件発明１の「有効成分」が「薬効を生じる薬理作用を奏する成分」であると解釈することができる。

(ｱ) 本件明細書の総論部分では，オピオイド系作動薬とオピオイド系拮抗薬のいずれについても，製剤中に含有される化合物が塩の形態を取っているかなどは一切注目されておらず，各医薬の薬理作用及び薬理作用を奏する成分が直接的に注目されている。本件明細書においては，このような技術分野及び背景技術の記述を踏まえ，「発明の開示」において本件発明を「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。」と特定している。

(ｲ) 本件明細書においては，各論の具体例・実施例として，薬理作用を奏するオピオイドκ受容体作動性化合物を有効成分とする止痒剤について，酸付加塩等の様々な実施形態についても記載されているが，その場合であっても，当業者は，上記(ｱ)の総論部分の理解を踏まえ，当該止痒剤はオピオイドκ受容体作動性化合物（フリー体）を有効成分とするものと理解するのであって，各論における具体例・実施例の記載は，医薬用途発明の文脈における有効成分に関する当業者の理解を何ら変更するものではない。

なお，実施例９，１０及び１２においては，投与対象物として酸付加塩が選択されているが，それらは，生理食塩水又は１０％ジメチルスルホキシド（ＤＭＳＯ）に溶解させてから投与されている。酸付加塩は，概ね中性溶液である生理食塩水等の溶液中で塩酸塩等の付加された塩が解離するから，投与対象物の形態を厳密にとらえると，実施例９，１０及び１２において，生体中に投与されているのは，酸付加塩ではなく，塩が解離した化合物である。しかし，実施例９，１０及び１２の各記述は，そのような投与対象物の形態の違い，すなわち，生理食塩水等に溶解させることにより，投与対象物が，塩が付加されていない化合物となったことに，一切触れておらず，投与対象物の形態に注目していないから，本件明細書に接した当業

者は，実施例が，（溶液等中で解離した）オピオイドκ受容体作動性化合物が薬効を生じる薬理作用を奏する成分として作用していることを示すものであると理解する。

(ｳ) 前記２（原告の主張）(2),(3)でみたような，「有効成分」の意義についての当業者や厚労省の理解，化合物が製剤中において塩の形態をとったとしても，薬効となる薬理作用を奏する成分が塩を付加しない化合物（＝塩から遊離する化合物）であることといった技術常識を踏まえて，本件明細書をみると，本件明細書には溶解度や溶解速度の向上等，塩を付加することの意義に関する記述は皆無であって，このことからすると，本件発明１は，塩の付加の有無について何ら注目しておらず，塩の付加の有無は，本件発明１の作用効果とも技術的特徴とも無関係であることが理解できる。

ウ　本件審決が説示する辞書における「有効成分」

(ｱ) 本件審決が援用する「廣川薬科学大辞典　第５版」（甲６５）は，「有効成分」を「１つの医薬品の意図された作用を起こす物質。また，成分の中で薬効を示す成分。」と記載しており，製剤中に含有される形態を何ら問題としておらず，単に薬効となる薬理作用を奏する成分との理解を示している。

また，廣川薬科学大辞典では，「有効濃度〔薬物の〕」について，「薬効を発現するに十分な濃度で，多くは血中濃度を対象」，「薬物の薬効発現，持続には有効濃度に到達し，その維持が必要で，有効濃度の最小限度を最小有効濃度といい，それ以上の濃度が必要。」として，成分の「血中濃度」と薬効（薬理作用）との関係性を説明しているが，前記のとおり，生体内（血中を含む）において塩酸塩は遊離し，血中濃度はフリー体の濃度を意味する。したがって，「有効濃度〔薬物の〕」の説明を踏まえると，廣川薬科学大辞典が「有効成分」について，製剤中に含有される形態を何ら問題とせず，単に薬理作用を奏する成分と理解していることがより一層明らかである。

(ｲ) 本件審決は，「医薬実務用語集 第９版」（甲１５），「医薬実用英語ハ

ンドブック」（甲１６）及び「医学書院　医学大辞典」（甲１７）を引用する。各辞典における「有効成分」の意義（「薬効を示す成分」（甲１５），「薬効となる薬理作用をもつ成分」（甲１７））は，原告が主張する有効成分の意義（薬効となる薬理作用を奏する成分）と何ら矛盾しない。

(ｳ) 本件審決は，「広辞苑　第２版増訂版」及び「大辞林　第３版」（甲２７）に記載された「成分」の項の記載を参照して，「廣川薬科学大辞典」の「有効成分」の意義に組み合わせて，「有効成分」とは，医薬品という混合物を構成する各物質のうち，薬効を示す物質をいうことが技術常識である旨説示する。

特定の用語の意義を検討するに当たって，単純に当該用語を構成している用語の意義を組み合わせて理解を試みること自体妥当ではない上，本件審決は，異なる辞書の異なる用語の意義を組み合わせて「有効成分」の意義を理解しようとしているのであって，本件審決が説示する「有効成分」の意義は何ら技術常識とはなり得ない。

⑵　本件特許の出願経過

原告は，本件拒絶理由通知の理由２，３（実施可能要件違反，明確性要件違反）に対応するために，出願時の請求項１及び２を削除し，本件特許の請求項１を一般式（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。」とする本件補正を行ったが，この補正は，上記理由２，３の拒絶理由を解消するために，オピオイドκ受容体作動性化合物（モルヒナン誘導体を含む。）の基本骨格を明らかにしてその構成を特定する趣旨で行われたものであり，オピオイドκ受容体作動性化合物（フリー体）を酸付加塩とは異なるものとして限定したものでなく，本件審決が指摘するような「一般式（Ｉ）で表されるオピオイドκ受容体作動性化合物の酸付加塩を有効成分とする止痒剤」を除外したものではない。

なお，原告が本件補正について出願時の請求項１及び２を削除し，出願時の請求項３の記載を修正するという方法を採用したのは，「一般式（Ｉ）」の記載が長文であることから，出願時の請求項１に「一般式（Ｉ）」の記載を追加するのではな

く，出願時の請求項１及び２を削除した上で，元々「一般式（Ｉ）」が記載されていた出願時の請求項３を修正したほうが全体の修正量を抑えることができるという，単なる補正の実務的・技術的な理由に基づくものである。

⑶　被告らの主張に対する反論

ア　被告沢井製薬の主張について

(ｱ) 被告沢井製薬は，本件特許と関係のない他の特許（特許第２５２５５５２号。甲７）の請求項を引用するが，それ自体失当であるし，甲７の請求項１９などの「有効成分として・・・含んで成る医薬組成物」などの文言は，その有効成分の製剤中の含有形態に着目した文言であって，本件発明の「有効成分とする」との文言とは使い分けられている。

(ｲ) 被告沢井製薬は，本件特許の対応外国特許（ＥＰ０８９７７２６Ｂ１。甲２３の１。以下「本件対応外国特許」という。）における平成１７年９月３０日付け意見書（甲２３の２）について主張するが，各国の特許制度や特許出願方針の観点から，出願国によってクレームの内容や記載方法が異なることは当然であるから，被告沢井製薬の指摘は失当である。

また，本件対応外国特許のクレーム１は，本件発明の「有効成分」のような構成要件をもって発明を特定するものではなく，医薬の製造に「使用」される化合物をもって発明を特定するものである。本件対応外国特許のクレーム１の医薬においても薬効を生じる成分は，一般式（Ｉ）で特定される化合物であり，同クレーム１は，当該成分をフリー体（一般式（Ｉ）で特定される化合物）又はその薬理学的に許容される酸付加塩の形態の化合物として医薬の製造に「使用」することをクレームしているのである。

したがって，本件対応外国特許のクレーム及び出願経過は，本件発明の「有効成分」の解釈が原告主張のとおりであることと矛盾せず，むしろ，本件発明の「有効成分」の解釈に関する原告の主張が合理的であることを示すものといえる。

イ　被告ニプロの主張について

(ｱ) 本件発明が，医薬用途発明であることを踏まえてクレーム解釈をすることは，特許法７０条１項に反するものではなく，特許請求の範囲や明細書の記載から理解される発明の技術的意義・特徴を無視してクレーム解釈を行うことはあり得ない。

(ｲ) また，請求項１５に係る発明である本件発明１５は，改善多項制の下で本件発明１と異なる特許発明であるから，被告ニプロが主張するように請求項１５の記載をもって請求項１の意義を断じる解釈が適切であるとはいえない。

(ｳ) 被告ニプロは，本件明細書の「技術分野」や「背景技術」における「これを含んでなる止痒剤」との記載は，酸付加塩を意図したものである旨主張するが，そのように理解することは，本件発明の意義や日本語の論理構成を無視した解釈である。本件明細書の「技術分野」及び「背景技術」には，オピオイドκ受容体作動性化合物の止痒作用（医薬用途）が記載されているのみであり，オピオイドκ受容体作動性化合物の製剤中における存在形態の相違がもたらす治療効果の相違や製剤の安定性といった化合物の製剤中における存在形態に着目する記載はない。被告ニプロの解釈によると，「技術分野」及び「背景技術」の記載全体において，製剤中に含有される化合物の存在形態の違いがもたらす効果等について一切注目されていないのに，「これを含んでなる」という箇所においてのみ突如として化合物の存在形態が問題とされることになり，「技術分野」及び「背景技術」の一連の記述が論理的に極めて不自然なものとなり，本件明細書の解釈として失当である。

(ｴ) 被告ニプロは，手続補正における出願人の主観的な意図は，当業者においては認識しようがないなどと主張するが，一般に，手続補正の経過を確認するに際しては，拒絶理由通知や意見書の内容を確認するのが通常であり，本件拒絶理由通知や意見書（甲２１）の内容に照らすと，「基本骨格を明らかにしてその構成を特定する趣旨」で手続補正が行われたことは容易に理解できる。

（被告沢井製薬の主張）

⑴ 本件発明にはナルフラフィンの酸付加塩を有効成分とする止痒剤は含まれ

ないこと

ア　本件特許について，本件明細書においてオピオイドκ受容体作動性化合物について明確な定義付けがされていないこと，特許請求の範囲においては，フリー体とそれに対する酸付加塩を明確に区別して定義していることから，文言解釈として，本件発明１における（酸付加塩の文言のない）医薬組成物としての「（有効成分としての）オピオイドκ受容体作動性化合物」に含まれるナルフラフィンは，ナルフラフィン（フリー体）のみと解され，ナルフラフィン酸付加塩は含まれないこととなり，本件審決の判断は正当である。

イ　オピオイドκ受容体作動性化合物をAとしその酸付加塩をBとした場合，

本件特許の特許請求の範囲には，

Aを有効成分とする止痒剤（現請求項１等）

A又はBを有効成分とする止痒剤（例えば，現請求項１０以下〔式中に対イオン付加塩の記載がある〕，現請求項１５等，旧請求項２等）

の２パターンが記載されており，止痒剤の有効成分としては，Aだけでもよく，A又はBでもよいようになっており，本件明細書からも，止痒剤について，酸付加塩の有無について，どちらとも特定されていない。

したがって，止痒剤に着目すると，特許請求の範囲の各請求項において，酸付加塩の文言のない場合はナルフラフィン（フリー体）の止痒剤に特定され，酸付加塩の文言のある場合はナルフラフィン塩酸塩（酸付加塩の一形態）の止痒剤と特定される。

その結果，本件発明１ではナルフラフィン（フリー体）に特定され，酸付加塩は含まれないと解するのが，ごく普通の文言解釈となる。

ウ　出願経過をみても，原告は，本件補正により，もともと旧請求項３に含まれていた旧請求項２の構成は取り入れず，旧請求項１の構成のみを現在の請求項１の要素として取り入れるという補正をしている（甲１９～２２）。原告は，フリー

体と酸付加塩を明確に区別しながらも，拒絶理由を回避し特許登録を得るために，本件補正により，請求項１から酸付加塩を削除したのであり，外形上，本件発明にナルフラフィンの酸付加塩を有効成分とする場合が含まれないことを明らかにしたものといえるから，本件発明の技術的範囲から，ナルフラフィンの酸付加塩を意識的に除外したものと解するほかない。

本件対応外国特許についても，原告は，請求項３を請求項１に書き直す際に酸付加塩を不注意により書き落としたことを自認して補正していた（甲２３の１・２）。ファミリー外国出願における出願人の対応は信義則上考慮されるべきである。

本件では，客観的，外形的にみて，本件発明１の特許請求の範囲に酸付加塩を記載しなかったことを表示しているものと評価されるのであり，マキサカルシトール最高裁判決（最高裁平成２８年（受）第１２４２号同２９年３月２４日第二小法廷判決・民集７１巻３号３５９頁）のいう「特段の事情」が存するというべきである。

エ　原告が出願した特許第２５２５５５２号（甲７）は，本件発明と同じナルフラフィンからなる物質発明と医薬用途発明に関するものであるが，請求項において，医薬組成物の「有効成分」について，モルヒナン誘導体のフリー体と酸付加塩とが明確に区別されて統一的に使用されている。

⑵　クレーム解釈上の「有効成分」との用語の意義と延長登録出願の対象との相違

前記２（被告沢井製薬の主張）のとおり，延長登録出願の対象となったのは，「ナルフラフィン塩酸塩」を「有効成分」とする本件医薬品である。本件発明についても，ナルフラフィンのフリー体に特定（限定）されているのに，本件発明を実施できなかった期間を回復するための延長登録制度を利用する場面では，今度はナルフラフィンのフリー体とナルフラフィン塩酸塩の両方を含む解釈をしてその範囲を拡張することは許されない。

また，酸付加塩の有無は，前記２（被告沢井製薬の主張）のとおり，作用効果として重要な溶解特性等に影響を与えるから，投与時における有効成分として理解さ

れなければならない。

⑶　「剤」について

「普通の意味」における「止痒剤」は，人体等に投与される前の薬剤そのものを指していると解されるのであって（甲１８，６８，７１，７３，７４，７９），体内での効果を強調しようとする原告の主張は失当である。

（被告ニプロの主張）

以下のとおり，本件特許の特許請求の範囲の請求項１の「化合物」に本件医薬品の「ナルフラフィン塩酸塩」が含まれ得るとする原告の解釈には理由がない。

⑴　医薬用途発明における発明特定事項のあるべき理解について

本件特許の特許請求の範囲では,「有効成分」について,「フリー体」としての「化合物」とその「酸付加塩」とは明確に書き分けられている。このような特許請求の範囲の記載において明確に特定されている成分の形態が「発明の技術的特徴となり得ない」というのは，特許法７０条１項の規定から離れた独自の見解である。特許請求の範囲の記載はいわば特許権の内容を公示するものであり，本件特許の特許請求の範囲の記載に接する当業者においても，このように明確に「フリー体」としての「化合物」とその「酸付加塩」とが書き分けられていることを前提としてその技術的範囲が画定されているものと信頼することになる。そのような信頼を無視した公示の範囲を逸脱するような解釈はあり得ない。

また，成分の形態により医薬品の安定性や溶解性にも影響することは，原告自身が認めていることであり，成分の形態は技術的特徴を構成するものである。

⑵　本件特許の特許請求の範囲の記載の理解について

本件特許の特許請求の範囲の記載における「有効成分」は,「フリー体」としての「化合物」とその「酸付加塩」とに明確に書き分けられており，例えば，請求項１５においては,「下記一般式（III）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学的に許容される酸付加塩を有効成分とする止痒剤。」と記載されているとおり,「酸付加塩」もまた「有効成分」であると明確に記載されている。すな

わち，本件医薬品がヒトに投与された後，生体内で有効成分として薬効を奏するものが「ナルフラフィン」であるとしても，本件医薬品における「有効成分」の存在形態としては,「フリー体」としての「化合物」と「酸付加塩」とは明確に区別され，いずれも「有効成分」として特定されている。

このような特許請求の範囲の記載を無視して，本件医薬品の「ナルフラフィン塩酸塩」と「フリー体」としての「ナルフラフィン」とが同一であるとする原告の解釈は，本件特許の特許請求の範囲の記載に基づかない解釈であり，理由がない。

⑶　本件明細書の記載について

ア　本件明細書の「技術分野」の「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。」（本件明細書１２頁９行～１０行）との記載の「これを含んでなる止痒剤」とは,「酸付加塩」などを意図した記載と理解される。また,「背景技術」の末尾にも,「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。」（本件明細書１３頁２２行～２３行）と記載されていて，本件明細書上，有効成分の存在形態は問題とされている。

イ　なお,「背景技術」の説明における「オピオイド系拮抗薬」に係る記載（本件明細書１３頁１９行以下）は，薬理に関する記載で，ヒトに投与したときの作用機序についての説明であるから，医薬品としての有効成分の存在形態に触れることは，かえって不自然である。

また，原告は，当業者は本件発明がオピオイドκ受容体作動性化合物（フリー体）を有効成分とするものと理解し，本件明細書の「発明を実施するための最良の形態」における具体例及び実施例の記載は，このような理解を何ら変更するものではないかのような主張をしているが，この主張もまた，ヒトに投与した後の生体内において薬効を奏する有効成分が何かという点と，本件特許に係る「物」の発明としての医薬品において有効成分の存在形態がどのように特定されているかという点とを混

同するものであり，理由がない。

⑷　技術常識について

前記２（被告ニプロの主張）のとおり，原告は，ヒトに投与した後の生体内において薬効を奏する有効成分が何かという点と，本件特許に係る「物」の発明としての医薬品における有効成分の存在形態がどのように特定されているかという点とを混同して主張している。

⑸　本件審決の「有効成分」の認定と本件審決が引用する辞典類の記載との整合性について

本件審決は，ヒトに投与した後の生体内において薬効を奏する「有効成分」が何かという問題と，本件特許において「有効成分」の存在形態がどのように特定されているかという問題とを区別した上で，本件医薬品の「有効成分」が何かを論じているにすぎない。原告の主張は，これらの問題をあえて混同して本件審決の認定が本件審決の引用する辞典類の記載と整合しないとするものであり，理由がない。

⑹　本件特許に係る審査経過の理解

本件補正に接した当業者は，原告である出願人が「化合物」と「酸付加塩」とが記載された旧請求項３を補正して「酸付加塩」を削除し「化合物」のみとした以上は，当該補正前後の請求項を客観的に対比して，本件審決と同様に，「その薬理学的に許容される酸付加塩」が削除されたと理解する。原告が主張するような出願人の主観的な意図は，当業者においては認識しようがなく，このような主観的な意図により，当該補正を踏まえた特許請求の範囲の客観的な解釈が左右される理由はない。

４　取消事由３（法令解釈の誤り）について

（原告の主張）

⑴　仮に，本件発明１がナルフラフィン（フリー体）を有効成分とする止痒剤であり，本件医薬品はナルフラフィン塩酸塩を有効成分とする止痒剤であるとしても，本件医薬品と本件発明１の止痒剤とは実質的に同一であると評価されるものであるから，延長登録制度の趣旨に照らすと，本件延長登録出願は，旧特許法６７条の３第

１項１号における「その特許発明の実施に第６７条第２項の政令で定める処分を受けることが必要であった」に当たると解すべきであり，延長登録が認められるべきものである。

⑵　本件審決は，「処分の対象となった医薬品が特許発明の実施に当たらない」ときに該当すると判断しているところ，「処分の対象となった医薬品が特許発明の実施に当たらない」ことに関しては，①「特許発明の実施」の法解釈，②「処分の対象となった医薬品」の法解釈が問題となる。

ア　上記①について，拡大先願（特許法２９条の２）や先願（特許法３９条）についての審査基準における実質的同一の考え方からすると，延長登録要件充足性における発明の同一性に関しても，特許発明と実質的に同一といえる場合には，「処分の対象となった医薬品が特許発明の実施に当たらない」とはいえず，延長登録の拒絶事由該当性は否定されるものと解すべきである。

また，上記②に関し，「処分の対象となった医薬品」の同一性の観点から見ても，存続期間延長登録の制度趣旨（法意）に鑑み，処分で定められた審査事項のうち，医薬品としての実質的同一性に直接関わることとなる審査事項に係る構成の一部について，処分対象物と異なる構成（差異）を有する医薬品であっても，それが僅かな差異又は全体的にみて形式的な差異にすぎない場合には，当該医薬品は「処分の対象となった医薬品」との実質的同一性が肯定されるとの考え方は承認されている。僅かな差異又は全体的にみて形式的な差異にすぎないか否かは，特許発明の内容に基づき，その内容との関連で，政令処分において定められた審査事項のうち，医薬品としての実質的同一性に直接関わることとなる審査事項によって特定された「物」と当該医薬品との技術的特徴及び作用効果の同一性を比較検討して，当業者の技術常識を踏まえて判断されるべきである。アバスチン最高裁判決（最高裁平成２６年（行ヒ）第３５６号同２７年１１月１７日第三小法廷判決・民集６９巻７号１９１２頁）が示した政令で定める処分対象物の同一性について実質的に判断するとする考え方やオキサリプラチン大合議判決（知財高裁平成２８年（ネ）第１００４６号

同２９年１月２０日特別部判決）が示した実質的同一の判断要素等によって実質的同一物に保護を及ぼす考え方は，原告の上記主張を支持するものである。

イ　上記①について，前記３（原告の主張）(1)で検討した本件発明１の技術的意義や本件明細書の記載からすると，本件発明１の有効成分をフリー体（ナルフラフィン）と解し，かつ，本件医薬品の有効成分をナルフラフィン塩酸塩であると解したとしても，両医薬品の有効成分の相違は，課題解決（止痒）のための具体化手段における微差にすぎず，本件医薬品と本件発明１に係る止痒剤とは発明として実質的に同一である。この点に関し，特許庁薬品化学審査長等を歴任した特許庁担当者らが執筆した文献(甲１１０)には，単剤医薬でその医薬用途が同一である場合には，有効成分（物質）の同一性の幅は，広めに認めてよい旨が記載されている。

また，上記②について，本件医薬品の有効成分をナルフラフィン塩酸塩であると解した場合にも，本件医薬品において止痒作用を発揮する成分はナルフラフィンであるから，本件医薬品は，ナルフラフィンにより止痒効果を生じさせる医薬品（止痒剤）である点で，本件発明１の止痒剤と，技術的特徴及び作用効果を同一とし，既述の薬効を奏する成分に関する当業者の技術常識を踏まえると，処分対象物として実質的に同一である。また，前記２（原告の主張）(3)のとおり，原薬開発過程のスクリーニングによって選択される塩の形態いかんによって，化合物における薬効となる薬理作用が失われるものではなく，化合物が製剤中において塩の形態をとったとしても，薬効となる薬理作用を奏するのは塩が付加されない化合物（＝生体内において塩から遊離する化合物）であることには何ら変わりはないことは，当業者における技術常識であり，独立行政法人医薬品医療機器総合機構（ＰＭＤＡ）も，塩違いについては，承認申請資料の添付資料省略の扱いを柔軟に認める運用としており，処分対象物としての医薬品の実質的同一性に直接影響を与えるものではないとの立場をとっている（甲１１１）。医薬品の実質的同一性を厳格に審査する厚労省の通知においても，塩違いは実質的同一性に直接影響を与えないことが示されている（甲１１２）。

ウ　以上のとおり，本件発明１の止痒剤と本件医薬品とは，①発明としても，②処分対象物としても，実質的に同一である。したがって，本件延長登録出願は，旧特許法１２５条の２第１項１号に該当しない。

⑶　米国の特許存続期間延長制度では，ＦＤＡ（食品医薬品局）の審査を受けた医薬品の有効成分及びその塩又はエステルを含めて延長制度の対象とすることが明文で定められており，塩違いについて，延長制度の対象となる医薬品該当性に何ら影響を与えず，保護対象とすることが明らかにされていて，有効成分がフリー体又はその塩形態をとっているか否かは，延長許否に際して何ら問題とされないとの考え方が一般に承認されている（甲１１３～１１５）。

⑷　被告沢井製薬の主張に対する反論

ア　原告は，「処分の対象となった医薬品が特許発明の実施に当たらない」という要件の該当性を判断するに当たって，処分対象医薬品の同一性を実質的に判断するアバスチン最高裁判決やオキサリプラチン大合議判決の考え方に沿い，処分対象医薬品と延長登録の対象特許に係る特許発明とが実質同一と評価できる場合には「処分の対象となった医薬品が特許発明の実施に当たらない」ときに該当しないと主張するものであって，処分対象物の同一性を検討しているわけではない。

イ　被告沢井製薬が根拠として提示するフリー体と酸付加塩の両方で承認取得した事例において，被告沢井製薬が主張する化合物（エリスロマイシンとエリスロマイシンステアリン酸塩及びジソピラミドとリン酸ジソピラミド）に係る各製剤において，添付文書（乙２，４），「麻酔薬および麻酔薬関連薬使用ガイドライン 第３版」（甲１４４）によると，薬効となる薬理作用を奏するのは，塩が付加されない化合物（フリー体）であり，ステアリン酸塩，リン酸塩等の酸付加塩部分は薬効・薬理作用の存否には影響を及ぼさないことが明らかである。いかなる効能・効果，用法・用量により薬機法上の製造販売承認を取得するかは，申請者の裁量・選択によるものであるから，効能・効果，用法・用量の差異は，処分対象医薬品の客観的性質が異なることを意味しない。

（被告沢井製薬の主張）

本件では，延長登録（出願）の対象が問題となっているのであるから，本件発明１で特定・限定されているナルフラフィン（フリー体）が，延長登録によって酸付加塩にまで広がることは，どのような理屈を持ってきてもあり得ない。

しかも，本件発明と延長登録の対象となった本件医薬品との比較の問題であるから，発明同士を比較した場合の同一性の問題はここでは関係がない。

また，「処分対象物の同一性」についても，本件発明と延長登録の対象となった本件医薬品との比較の問題であるから，その論理展開も誤っている。

なお，原告は，フリー体であっても塩が付いていても処分対象物が実質的に同一であると主張するが，「フリー体と酸付加塩の両方で承認取得した事例」や「フリー体と酸付加塩で効能効果が違う事例」（乙１～４）が存在するので，原告のようにいい切れず，また，医薬品にとって溶解特性等はその作用効果として重要であるから，原告の主張は当業者の技術常識に反する。

原告は，米国の特許存続期間延長制度について主張しているが，両国の延長登録制度は大きく異なることは当業者にはよく知られているので，解釈上の参考にはならない。

（被告ニプロの主張）

原告が主張する「実質的同一」が意味するところが，ある医薬品が特許発明の技術的範囲には属さないが，特許発明と「実質的同一」であるという趣旨であるとしても，どうして特許発明の技術的範囲に属さない医薬品に係る政令で定める処分を受けることが特許発明の実施に必要であるのか，理解できない。

また，特許発明の技術的範囲に属する医薬品を実施するために政令で定める処分を受けることができたにもかかわらず，あえて特許発明の技術的範囲に属さない「実質的同一」の医薬品について政令で定める処分を受けたのであれば，そのような処分について「その特許発明の実施に・・・政令で定める処分を受けることが必要であった」と認める必要はない。本件医薬品についていうと，本件特許の特許請求の

範囲の請求項１の発明の技術的範囲に属する「フリー体」である「化合物」について政令で定める処分を受けることができたにもかかわらず，あえて「フリー体」である「化合物」には該当しない「ナルフラフィン塩酸塩」について政令で定める処分を受けたときには，本件特許の特許請求の範囲の請求項１の発明の実施について「ナルフラフィン塩酸塩」に係る政令で定める処分を受けることが必要であったと認める必要はない。

原告が援用するアバスチン最高裁判決やオキサリプラチン大合議判決は，特許発明の技術的範囲内において，政令で定める処分の対象とされた物との同一性を論じているにすぎず，これらの判決は，特許発明の技術的範囲に属さないものについては，政令で定める処分の対象とされた物と特許発明との同一性を論ずる余地はないことを前提としている。本件医薬品は，本件特許の特許請求の範囲の請求項１の発明の技術的範囲に属さないから，本件医薬品の政令で定める処分が本件発明の実施のために必要であったと認める余地はない。

なお，原告は米国における議論を援用しているが，米国では「塩」に係る特別の規定があり，そのような規定がない我が国においては制度の前提が異なる。

５　取消事由５（延長登録要件を充足する部分を除外せずに延長登録全部無効判断をしたことの法解釈の誤り）について

（原告の主張）

⑴　本件延長登録が慢性肝疾患患者におけるそう痒症の改善の効能･効果を含むものと解される場合，本件延長登録は，①延長登録要件を充足する部分（腹膜透析患者におけるそう痒症の改善の効能・効果）と，②延長登録要件を充足しない部分（慢性肝疾患患者におけるそう痒症の改善の効能・効果）についてされたものと整理されるが，そのような場合には，（ｉ）延長登録無効理由があると解すべきではなく（主位的主張），少なくとも，（ⅱ）延長登録要件を充足する部分について延長登録無効理由はなく，当該部分の延長登録無効審判請求不成立審決をすべきであって，本件審決のように本件延長登録全体を無効とすべきではない。

本件審決は，上記②の部分が存することをもって，本件延長登録の全体が旧特許法１２５条の２第１項１号に該当し，延長登録の全体を無効にすべきと判断した。しかし，そのような判断は，以下のとおり，特許法の解釈としても，行政処分の一般原則である比例原則との関係においても，誤りである。

⑵　旧特許法１２５条の２第１項１号の解釈について

ア　延長登録の判断の誤り

本件延長登録出願が，腹膜透析患者におけるそう痒症の改善の効能・効果についてのみ延長登録を求めたものであるのに，審査官は，誤って慢性肝疾患患者におけるそう痒症の改善の効能・効果についても延長登録を認めた。

また，仮に，本件延長登録出願に慢性肝疾患患者におけるそう痒症の改善の効能・効果を内容として含まれていたとしても，審査官は，先行処分と本件処分を適切に比較検討することなく，結果として，過大かつ延長登録要件非充足部分を含む範囲で延長登録を認めていたといえる。

イ　本件において，旧特許法１２５条の２第１項１号所定の無効理由は存しないこと（主位的主張）

延長登録制度においては，特許法上，出願人が延長登録を受けた後に延長登録の内容及び範囲を適切に調整するための訂正等の手続が規定されておらず，権利者は，行政の誤りによりされた過大な延長登録の範囲を適切に調整することができない。特に，本件では，上記アのとおり，行政の誤りによって過大な範囲で延長登録がされているところ，その誤りによる不利益を出願人が甘受しなければならないいわれはない。

旧特許法１２５条の２第１項１号の文言を素直に読む限り，過大な延長登録がされた場合でも，当該延長登録が政令で定める処分を受けることが必要であったと認められる部分を含む場合には，「その延長登録がその特許発明の実施に第６７条第２項の政令で定める処分を受けることが必要であったとは認められない場合の出願に対してされたとき」とはいえず，当該無効事由には該当しないと解される。実質

的にも，上記のとおり，延長登録を受けた者が事後に延長登録の範囲を調整することによって行政の誤りを是正する手段を有しない場合に，旧特許法１２５条の２第１項１号の解釈として，過大な延長登録を無効にしないことにより適法な延長登録部分に係る権利者の利益を保護することには妥当性が認められる。このように理解したとしても，仮に延長登録を受けた者が過大に延長登録を受けた部分について延長登録の効力を主張して権利行使に及んだときは，権利濫用法理によりこれを制限すれば，適切な利益調整を行うことができるのであって何ら不都合は生じない。

ウ　少なくとも延長登録要件を充足する部分について延長登録無効理由はなく，当該部分の延長登録を有効と解すべきであること（予備的主張）

仮に，上記イの解釈が採用されないとしても，行政処分である審決には，行政法上，達成されるべき目的とそのために取られる手段としての権利・利益の制約との間に均衡を要求する比例原則が通用している。この比例原則によると，延長登録の有効性を判断するに際しても，延長登録（行政処分）を是正する目的（瑕疵ある部分を取り除く目的）とそのために取られる手段としての権利・利益の制約（延長登録の権利性をどの程度制限するか）との間に均衡が要求されなければならない。この理は，問題となっている行政処分が，いくつかの部分から構成されており，それらが可分である場合には一層妥当する。さらに，延長登録制度においては，上記のとおり，出願人が延長登録を受けた後に延長登録の内容及び範囲を適切に調整するための訂正等の手続が規定されておらず，権利者は，行政の誤りによりされた過大な延長登録の範囲を適切に調整することができないのであるから，より一層比例原則を遵守した法解釈に基づく適切な行政処分（審決）がされなければならない。

本件において，上記のような比例原則，慢性肝疾患患者におけるそう痒症の改善の効能・効果と，腹膜透析患者におけるそう痒症の改善の効能・効果に関する各延長登録は可分であること，延長登録を受けた後に訂正等を請求する制度がないことや，延長登録無効審判において一部無効の審決をする手続が法定されていないことなどからすると，延長登録の全部を無効とすることは，「実効的な権利救済」の要

請に反し，許されない。

しかし，本件審決は法解釈を誤り，本件延長登録の全体が旧特許法１２５条の２第１項１号に該当し，無効であると判断したものであり，結論に影響を及ぼす法解釈の誤りがある。

（被告沢井製薬の主張）

本件審決は，「無効理由２は，本件延長登録のうち『処分の対象となった医薬品について特定された用途』が『慢性肝疾患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）』の部分について理由がある。　・・・本件発明のうち慢性肝疾患患者を対象とする部分の実施に旧特許法６７条２項の政令で定める処分を受けることが必要であったとは認められないから，本件延長登録は，その全体が旧特許法１２５条の２第１項１号に該当し，無効とすべきもの」と判断しており，本件審決は，延長登録出願は特許出願の一種であって，出願の一体不可分性で特許出願と共通しているから，一部に瑕疵があったとしても，全体を無効にするという判断をし，部分的な無効理由の存在を根拠として，本件延長登録全体を無効にしたものである。このように全体の無効審決がされたとしても，その審決全体を取り消したり，部分的に審決を取り消したりすることはできない。

すなわち，延長登録出願に対する登録査定等は，一つの不可分な行政処分である。例えば，無効審判は今日では請求項ごとに請求できるが，それは明文で定められている例外だから認められるのである（特許法１２３条柱書）。請求項内の一部に無効理由があった場合は，その請求項全体が行政処分（無効審決）の対象となる。また，延長登録により延長された期間がその特許発明の実施をすることができなかった期間を超えているときは，その超えている期間は部分的に延長されなかったこととみなされるが，それも明文で例外を定めているから認められるのである（同法１２５条の２第４項）。

原告が指摘するように，延長登録の無効審判手続では訂正請求できる手続がないのは事実である。しかし，延長登録出願手続においては拒絶理由通知がされて出

願人に補正できる機会が付与されている。

原告は，「行政による度重なる誤りによって過大な範囲で延長登録がされた」と主張するが，それは感情論であり，仮にそうであったとしても，原告はこのナルフラフィンについて多数の延長登録出願をし，多数の延長登録を獲得しているのであり，先発医薬品メーカーとして延長登録制度に習熟しているのであるから，他社から法的手続をとられるまでは，特許権者として排他的権利を行使し得る立場にあったのであり，行政のみのせいにすることはできない。

上記のような考え方は，２件の最高裁判決（最高裁平成１９年（行ヒ）第３１８号同２０年７月１０日第一小法廷判決・民集６２巻７号１９０５号，同昭和５３年（行ツ）第２７号，第２８号同５５年５月１日第一小法廷判決・民集３４巻３号４３１頁）の趣旨にも合致するものである。

（被告ニプロの主張）

特許又は特許権については請求項ごとの可分的な扱いがされていること（特許法１８５条）とは異なり，特許権存続期間の延長登録出願については，そのような可分的な扱いはされていない。そして，「処分の対象となった医薬品について特定された用途」が複数あるときは，それぞれの用途ごとに特許権存続期間の延長登録出願が可能であるにもかかわらず，原告は，あえて「透析患者におけるそう痒症の改善」と「慢性肝疾患患者におけるそう痒症の改善」とを併せて本件延長登録出願をすることにより，可分的な扱いを求めない選択をしているのであるから，本件延長登録全体が無効とされてもやむを得ない。

また，原告は，先行処分について十分な認識があり，かつ，知的財産に関する専門家であり，延長登録制度にも明るい弁理士が代理して本件延長登録出願をしているのであるから，当初から「次の患者におけるそう痒症の改善（・・・）腹膜透析患者」とのみ記載して出願をするか，又は「血液透析患者」及び「慢性肝疾患患者」を除いて「次の患者におけるそう痒症の改善（・・・）透析患者（血液透析患者を除く）」とのみ記載して出願をすべきであり，そのような出願をすべきことについて

期待可能性があった。しかし，原告は，本件医薬品の医薬品製造販売承認事項一部変更承認書（甲１４３）の別紙申請書の【効能又は効果】の欄に記載された処分の内容である「次の患者におけるそう痒症の改善（・・・）　透析患者，慢性肝疾患患者」との記載の内容について，先行処分との関係を十分に検討することなく，特許権存続期間延長登録願（甲１１６）の「６（４）処分の対象となった医薬品について特定された用途」の欄にそのまま記載し，その後の補正の機会にも十分に再検討をしなかったことにより無効理由を生じさせてしまっている。そうすると，当該無効理由が生じたことについては，原告に責任があるというべきであり，審査官が拒絶理由を看過したことに責任を転嫁することはできず，過大な範囲で延長登録されたことにより，本件延長登録が全体として無効とされてもやむを得ないというべきである。

第４　当裁判所の判断

１　被告ニプロの被告適格について

中間判決で判断したとおり，本件において，被告ニプロは，被告適格を有するものと認められ，被告適格が欠けることを理由とする被告ニプロの本案前の抗弁は理由がない。

２　本件発明について

⑴　本件明細書（甲２）には,以下のような記載がある。

ア　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。」（１２頁９行～１０行）

イ　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。

痒みは主観的な感覚であるため数量的に客観的に評価することが難しく，痒みの発現メカニズムはまだ十分に解明されていない。

現在のところ，痒みを引き起こす刺激物質としては，ヒスタミン，サブスタンスＰ，ブラジキニン，プロテイナーゼ，プロスタグランジン，オピオイドペプチドなどが知られている。痒みとしての知覚は，これらの痒み刺激物質が表皮－真皮境界部に存在する多刺激対応性の神経終末（痒み受容器）に作用し，生じたインパルスが脊髄視床路→視床→大脳皮質の順に達することで起こると考えられている(･･･)。

・・・そう痒が治療対象となる具体的な皮膚疾患としては，アトピー性皮膚炎，神経性皮膚炎，接触皮膚炎，脂漏性皮膚炎，自己感作性皮膚炎，毛虫皮膚炎，皮脂欠乏症，老人性皮膚そう痒，虫刺症，光線過敏症，蕁麻疹，痒疹，疱疹，膿痂疹，湿疹，白癬，苔癬，乾癬，疥癬，尋常性座瘡などが挙げられる。また，そう痒を伴う内臓疾患としては，悪性腫瘍，糖尿病，肝疾患，腎不全，腎透析，妊娠が特に問題となる。

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。β－エンドルフィンやエンケファリンのような内因性オピオイドペプチドが痒みを起こすことが報告され

た（・・・）のを始めとして，モルヒネやオピオイド化合物を硬膜外や髄腔内に投与した場合も副作用として痒みが惹起されることが明らかとなった（・・・）。その一方で，モルヒネの髄腔内投与によって惹起された痒みがモルヒネ拮抗薬であるナロキソンによって抑制されたこと（・・・）や肝障害の胆汁鬱血患者で内因性オピオイドペプチドの上昇によって惹起された強い痒みが，オピオイド拮抗薬であるナルメフェンによって抑制されたこと（・・・）も明らかとなり，統一的見解として，オピオイド系作動薬は痒みを惹起する作用があり，逆にその拮抗薬には止痒作用があるとされた。・・・

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されてきた。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。」（１２頁１２行～１３頁２１行）

ウ　発明の目的

「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。」（１３頁２２行～２３行）

エ　発明を実施するための最良の形態

「オピオイド受容体には，μ，δ，およびκ受容体の存在が知られており，それぞれを選択的に刺激する内因性オピオイドペプチドが既に発見されている。即ち･･･μおよびδ受容体作動薬として同定されたβ－エンドルフィンやエンケファリン，およびκ受容体作動性の内因性オピオイドペプチドとして同定されたダイノルフィンである。しかし，ダイノルフィン自体を含め，κ受容体作動薬の痒みに対する作用は何ら明らかにされておらず，本発明によって初めて明らかにされた。

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特異性にとらわ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学的に許容される酸付加塩が挙げられ，中でも一般式（Ｉ）

(I)

［式中，

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NR^4，ＳまたはＯを表し，R^4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R^4は同一または異なっていてもよい）を表し，Ｂは原子価結合，炭素数１から１４の直鎖もしくは分岐アルキレン（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１４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，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１４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，R^5は水素または下記の基本骨格：

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のアルコキシまたは炭素数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，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またはその薬理学的に許容される酸付加塩であり，・・・これらκ受容体作動薬は一種のみならず数種を有効成分として使用され得る。

治療対象となる具体的なそう痒を伴う皮膚疾患としては，アトピー性皮膚炎，神経性皮膚炎，接触皮膚炎，脂漏性皮膚炎，自己感作性皮膚炎，毛虫皮膚炎，皮脂欠乏症，老人性皮膚そう痒，虫刺症，光線過敏症，蕁麻疹，痒疹，疱疹，膿痂疹，湿疹，白癬，苔癬，乾癬，疥癬，尋常性座瘡などが挙げられる。また，そう痒を伴う内臓疾患としては，悪性腫瘍，糖尿病，肝疾患，腎不全，腎透析，妊娠に起因するそう痒が特に対象として挙げられる。さらに，眼科や耳鼻咽喉科の疾患に伴うで痒みにも適用し得る。」（１３頁２９行～１７頁２０行）

「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学的に好ましい酸付加塩としては，塩酸塩，硫酸塩，硝酸塩，臭化水素酸塩，ヨウ化水素酸塩，リン酸塩等の無機酸塩，酢酸塩，乳酸塩，クエン酸塩，シュウ酸塩，グルタル酸塩，リンゴ酸塩，酒石酸塩，フマル酸塩，マンデル酸塩，マレイン酸塩，安息香酸塩，フタル酸塩等の有機カルボン酸塩，メタンスルホン酸塩，エタンスルホン酸塩，ベンセンスルホン酸塩，ｐ－トルエンスルホン酸塩，カンファースルホン酸塩等の有機スルホン酸塩等があげられ，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。

これらκ受容体作動薬は，医薬品用途にまで純化され，必要な安全性試験に合格した後，そのまま，または公知の薬理学的に許容される酸，担体，賦形剤などと混合した医薬組成物として，経口または非経口的に投与することができる。

経口剤として錠剤やカプセル剤も用いるが，皮膚疾患治療用としては外用剤が好

ましい。・・・

医薬組成物中のκ受容体作動薬の含量は特に限定されないが，経口剤では１服用あたり通常０．１μｇ～１０００ｍｇ，外用剤では１回塗布あたり通常０．００１ｎｇ／m^2～１０ｍｇ／m^2となるように調製される。」（５１頁２５行～５２頁１５行）

オ　実施例

「実施例９

選択的なκ受容体作動性オピオイド化合物である（－）－１７－（シクロプロピルメチル）－３，１４β－ジヒドロキシ－４，５α－エポキシ－６β－［Ｎ－メチル－トランス－３－（３－フリル）アクリルアミド］モルヒナン塩酸塩７

Ｚ

を生理食塩水に溶解し，４０μｇ／ｍｌ濃度の水溶液を調製した。この水溶液を成人男子下肢に生じた蕁麻疹の発赤部位３か所に，薬物濃度０．２μｇ／ｃm^2で塗布した。

その結果，塗布前，中等度の痒み（グレードとして＋＋と設定）を感じていたが，塗布５分で痒みを全く感じなくなった（グレードとして－と設定）。痒みのない状態は約５時間持続した。

実施例１０

女性アトピー性皮膚炎患者の腕および脚で強い痒み（グレードとして＋＋＋と設定）を感じる皮膚表面病巣に化合物７水溶液を塗布した。塗布部位は５ヶ所で，１０ｃm^2に約５０μｌ溶液で，塗布薬物濃度は０．２μｇ／ｃm^2であった。また比

較として，インドメタシン・クリーム（薬物濃度７．５ｍｇ／ｇ）を同様に７５μｇ／ｃｍ^{2}で塗布した。

その結果，表５のように，全塗布部分において，化合物７水溶液では塗布後５分で痒みは完全になくなり，強力な止痒作用を有することが判明した。また，痒みのない状態は少なくとも３時間は持続した。一方，インドメタシン・クリームでは痒みが残る感じがあり，止痒作用は化合物７の方が優れていることが判明した。

表５．アトピー性皮膚炎の痒みに対するκ受容体作動薬（化合物７）とインドメタシンの止痒作用

使用薬剤	痒みの程度（最大程度「＋＋＋」～なし「－」）			
	塗布前	塗布後５分	塗布後１０分	塗布後３時間
化合物７水溶液	＋＋＋	－	－	－
インドメタシンクリーム	＋＋＋	＋＋＋	＋	±

・・・

実施例１２

ｄｄＹ系雄性マウスを日本ＳＬＣより４週齢で入荷し，予備飼育をした後５週齢で使用した。・・・被験薬物あるいは溶媒のいずれかをマウスの吻側背部皮下に投与し，その３０分後に生理食塩水に溶解したCompound48/80（100μg/site）を５０μＬの用量で除毛部位に皮内投与した。その後直ちに観察用ケージ（１０×７×１６ｃｍ）に入れ，以後３０分間の行動を無人環境下にビデオカメラで撮影した。ビデオテープを再生し,マウスが後肢でCompound48/80投与部位の近傍を引っかく行動の回数をカウントした。１群８匹から１０匹で実験を行った。

各被検化合物による引っかき行動の抑制率は下式で計算した。引っかき行動を減らす作用をもって被験化合物の止痒効果の指標とした。

引っかき行動抑制率（％）＝｛１－（Ａ－Ｃ／Ｂ－Ｃ）｝×１００

Ａ＝被験薬物投与群の平均引っかき行動回数

Ｂ＝被験薬物の代わりに溶媒を投与した群の平均引っかき行動回数

Ｃ＝起痒剤の代わりに溶媒を投与した群の平均引っかき行動回数

・・・

8

9

10

11

12

13

14

15

16

17

18

19

20
(VII)

21
(VI)

22 (IV)

23 (IV)

結果を表６にまとめる。試験に用いた化合物は用いた用量で止痒効果を示した。

表6．各種オピオイドκ作動薬の止痒効果

被験薬物	用量（mg/kg）	抑制率（%）
化合物 2	1.0	41
化合物 3	0.0057	64
化合物 5	0.016	55
化合物 6	0.005	45
化合物 7	0.005	58
化合物 8	0.01	72
化合物 9	1.8	52
化合物 10	0.46	14
化合物 11	0.0018	45
化合物 12	0.07	39
化合物 13	0.07	47
化合物 14	0.31	46
化合物 15	1.88	56
化合物 16	0.0046	14
化合物 17	0.0066	90
化合物 18	0.03	92
化合物 19	0.03	40
化合物 20	0.006	62
化合物 21	0.0003	23
化合物 22	1.2	70
化合物 23	0.0069	46

」（５８頁１８行～６３頁２７行）

カ　産業上の利用可能性

「本発明の止痒剤は，オピオイドκ受容体作動薬を有効成分とすることを特徴とし，各種の痒みを伴う皮膚疾患，例えばアトピー性皮膚炎，神経性皮膚炎，接触皮膚炎，脂漏性皮膚炎，自己感作性皮膚炎，毛虫皮膚炎，皮脂欠乏症，老人性皮膚そう痒，虫刺症，光線過敏症，蕁麻疹，痒疹，疱疹，膿痂疹，湿疹，白癬，苔癬，乾癬，疥癬，尋常性座瘡など，および，痒みを伴う内臓疾患，例えば悪性腫瘍，糖尿病，肝疾患，腎不全，腎透析，妊娠などの痒みの治療に有用である。」（６３頁２９行～３４行）

⑵　前記(1)の記載からすると，本件発明は，以下のとおりのものであると認められる。

ア　皮膚疾患や内科系疾患，妊娠などが原因で起こる痒み（そう痒）の治療には，抗ヒスタミン剤，抗アレルギー剤などの内服剤，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などの外用剤が用いられているが，内服剤の場合は，作用発現までに時間のかかることや中枢神経抑制作用や副作用が問題となっており，外用剤の場合は，止痒効果が十分でないことやステロイド外用剤の長期使用による副作用が問題となっていた（背景技術）。

また，オピオイドと痒みについて，オピオイド系作動薬は痒みを惹起する作用があり，逆にその拮抗薬には止痒作用があるとされていたが，オピオイド系拮抗薬を止痒剤として応用することは実用化されていなかった（背景技術）。

イ　μ，δ及びκの３種類があるオピオイド受容体には，それぞれを選択的に刺激する内因性オピオイドペプチドが既に発見されていたが，κ受容体作動性の内因性オピオイドペプチドとして同定されたダイノルフィンを含め，オピオイドκ受容体作動薬（以下「κ作動薬」という。）の痒みに対する作用は何ら明らかにされておらず，本件発明によってκ作動薬に止痒作用があることが初めて明らかにされた（発明を実施するための最良の形態）。

本件発明は，止痒作用が極めて速くて強いκ作動薬及びこれを含んでなる止痒剤を提供することを目的としたものであり，下記式で示される化合物７（実施例９のもの。ナルフラフィン塩酸塩に相当する。）などを含むオピオイドκ受容体作動性化合物（以下「κ作動性化合物」ともいう。）又はその薬理学的に許容される酸付加塩を有効成分とする，アトピー性皮膚炎等の皮膚疾患，悪性腫瘍等の内科系疾患，及び，妊娠などにおける痒みの治療に有用な止痒剤（ただし，一般式（Ｉ）で示される化合物の酸付加塩を有効成分とする止痒剤が本件発明の技術的範囲に属するかについては前記第３でみたように争いがある。）に関するものである（発明の目的，発明を実施するための最良の形態，実施例，産業上の利用可能性）。

Z

ウ　選択的なκ作動性化合物である化合物７は，アトピー性皮膚炎患者において，インドメタシン・クリームと比べて，優れた止痒効果を示し（実施例１０），痒みを引き起こす刺激物質であるCompound48/80をマウスの皮内に投与した動物実験において，化合物７を含む各種のκ作動性化合物は，止痒効果を示す（実施例１２）。

３　取消事由１（本件医薬品の有効成分に関する事実認定の誤り）について

⑴　事実関係

証拠及び弁論の全趣旨によると，以下の事実が認められる。

ア　製造販売承認書（甲３６，１０４）及び製造販売承認事項一部変更承認書（甲１４３）の記載

(ｱ) 先行処分に係る製造販売承認書（甲３６，１０４）には，「平成２８年３月３１日付けで申請のあった医薬品の製造販売を,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（・・・）第１４条第１項の規定により,別添申請書のとおり承認する。」と記載されており，本件承認申請書には①「販売名」として「レミッチＯＤ錠２．５μｇ」と記載され，②「成分」として「配合目的：０００（有効成分）」，「成分名：ナルフラフィン塩酸塩」と記載され，③「標準物質及び類縁物質の一覧」及び④●●●●●●として，以下の記載がされている（なお，下線は原告が付したものである。）。

標準物質及び類縁物質の一覧

名称	構造式	化学名	用途
ナルフラフィン塩酸塩標準物質		(2*E*)-*N*-[(5*R*,6*R*)-17-(シクロプロピルメチル)-4,5-エポキシ-3,14-ジヒドロキシモルヒナン-6-イル]-3-(フラン-3-イル)-*N*-メチルプロパ-2-エンアミド・一塩酸塩	[redacted]

[redacted]

（省略）

(ｲ) 本件処分に係る製造販売承認事項一部変更承認書（甲１４３）の記載

本件処分に係る製造販売承認事項一部変更承認書には，「平成２９年４月１２日付けで申請のあった医薬品の製造販売の承認事項の一部変更を，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（・・・）第１４条第９項の規定により，別添申請書のとおり承認する。」と記載されており，同申請書には，①「販売名」として「レミッチＯＤ錠２．５μｇ」，②「効能又は効果」として「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）　透析患者，慢性肝疾患患者」と記載され，さらに，「本申請は，先に申請中の「レミッチカプセル２．５μｇ」（・・・）ならびに「ノピコールカプセル２．５μｇ」（・・・）の『腹膜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）』の効能追加申請（・・・）と同一内容の効能追加申請である。」と記載され，以下のような【効能又は効果】の変更前後の新旧対照表が記載されていた。

イ　本件添付文書（甲２５）の記載

原告により作成された本件添付文書には，以下のような記載がある。

(ｱ)【組成・性状】の「有効成分・含量（１カプセル中）」の欄には，「ナルフラフィン塩酸塩２．５μｇ（ナルフラフィンとして２．３２μｇ）」と記載されている。

(ｲ)【薬物動態】の欄には，ナルフラフィン塩酸塩を経口投与や静脈内投与した場合のナルフラフィンの血漿中濃度推移や薬物動態パラメータなどが記載されている。

なお，本件添付文書には，上記血漿中濃度推移等がナルフラフィンを測定したものであることについて，明示されていないが，甲１１８（太田俊作「薬品製造学」さんえい出版　２３４頁～２４４頁，１９９０年）に，「塩化された薬物について，服用または投与後の生体内で，塩ではなくなり，遊離塩基が分離する」旨が記載されており，後述するとおり，ナルフラフィン塩酸塩についても同様にヒトの体内でナルフラフィンと塩化物イオンに分離するものであるから，本件添付文書に記載された，ナルフラフィン塩酸塩を経口投与又は静脈内投与されることで得られる上記血漿中濃度推移等は，ナルフラフィンを測定して得られたものと認められる。

(ｳ)【薬効薬理】の「１．そう痒に対する作用」として「既存の止痒薬である抗ヒスタミン薬が有効なヒスタミン皮内投与誘発マウス引っ掻き行動及び抗ヒスタミン薬が効き難いサブスタンスＰ皮内投与誘発マウス引っ掻き行動を抑制した。また，抗ヒスタミン薬が無効な中枢性のかゆみモデルであるモルヒネ大槽内投与誘発マウス引っ掻き行動も抑制した。」と記載され，「２．作用機序」の欄には，「ヒトオピオイド受容体発現細胞を用いたin vitroの受容体結合試験及び受容体作動性試験の結果から,選択的なオピオイドκ受容体作動薬であることが示されている。」と記載されている。

(ｴ)【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ナルフラフィン塩酸塩　Nalfurafine Hydrochloride

化学名：（2E）-N-［（5R,6R）-17-（Cyclopropylmethyl）-4,5-epoxy-3,14-dihydroxymorphinan-6-yl］-3-（furan-3-yl）-N-methylprop-2-enamide monohydrochloride

分子式：$C_{28}H_{32}N_2O_5$・HCl

構造式：

性状：白色～ごくうすい黄色の粉末である。吸湿性が高く，光にやや不安定である。溶解性は，水，メタノールに対して溶けやすく，エタノール（95）に対しては溶けにくく，酢酸エチルとジエチルエーテルにはほとんど溶けない。

ウ　本件インタビューフォーム（甲９）の記載

(ｱ) インタビューフォームとは，「添付文書等の情報を補完し，薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な，医薬品の品質管理のための情報，処方設計のための情報，調剤のための情報，医薬品の適正使用のための情報，薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として，日本病院薬剤師会が記載要領を策定し，薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」である（甲９）。

(ｲ) 本件インタビューフォームは，本件医薬品であるレミッチＯＤ錠２．５μｇと本件カプセル製剤であるレミッチカプセル２．５μｇについてのものであって，以下のような記載がある。

ａ　「ＩＩ．名称に関する項目」に，本件医薬品及び本件カプセル製剤の「２．一般名」として，「(1)和名（命名法）　ナルフラフィン塩酸塩（ＪＡＮ）」，

「(2)洋名(命名法)　Nalfurafine Hydrochloride(ＪＡＮ) nalfurafine(ＩＮＮ)」と記載されている。

ｂ　「III.有効成分に関する項目」として，本件添付文書の「性状」（前記イ(ｴ)）と同様の記載がある。

ｃ　「ＩＶ.製剤に関する項目」として「２．製剤の組成　(1)有効成分（活性成分）の含量　カプセル：１カプセル中ナルフラフィン塩酸塩２．５μｇ（ナルフラフィンとして２．３２μｇ）含有　ＯＤ錠：１錠中ナルフラフィン塩酸塩２．５μｇ（ナルフラフィンとして２．３２μｇ）含有」と記載されている。

ｄ　「ＶＩ．薬効薬理に関する項目」として，本件添付文書の「薬効薬理」（前記イ(ｳ)）と同様の記載がある。

ｅ　「ＶＩＩ．薬物動態に関する項目」として，本件添付文書の「薬物動態」（前記イ(ｲ)）と同様の記載がある。なお，前記イ(ｲ)で認定したのと同様に，血漿中濃度推移などは，ナルフラフィンを測定して得られたものと認められる。

(ｳ) 医薬品について，日本薬局方における原薬の日本名は，我が国における医薬品の一般的名称（ＪＡＮ）の日本語名及び国際一般的名称（ＩＮＮ）を参考に命名されるとされており，ＪＡＮは水和物や塩などの形態で実際に流通している医薬品に対して命名され，ＩＮＮは原薬の活性部分本体に対して命名されることとされていて，医薬品がアミン類の無機酸塩又は有機酸塩の場合の医薬品の日本名は，「○○○＊＊＊塩」（○○○アミン類に対応するＩＮＮ，＊＊＊は無機酸又は有機酸）と命名することとされている（甲３４，３５）。

なお，ＩＮＮについては，ＷＨＯによりガイダンスが出されており，医薬物質又は医薬有効成分を特定するものとして定義されている（甲３５）。

エ　ナルフラフィンとナルフラフィン塩酸塩との関係等について

(ｱ) 一般に，医薬品の開発は，医薬品探索初期の段階では，基本的にフリー体を用いて薬理，物性，安全性の評価が実施され，リード化合物の最適化が完了し，候補化合物が数化合物に絞られてきた段階で，原薬形態のスクリーニングを開

始する（下記図２）。それにより見いだ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一般的である。市販又は開発されている低分子医薬品の原薬形態の種類は，下記の図１に示すとおりに分類されるが，実際に利用されている原薬形態は，フリー体又は水和物若しくは塩が大勢を占めている。（甲８２，弁論の全趣旨）

図１　医薬品に用いられる原薬形態の分類

図２　医薬品の探索ステージにおける物性・安定性検討項目

(ｲ) 塩基性化合物の溶解性や安定性を向上させるために塩酸等により付加塩を形成すること，生体内では，酸付加塩から遊離塩基（フリー体）が解離し，遊離塩基（フリー体）の形態で粘膜に吸収され，薬効及び薬理作用を奏することは，医薬品分野における技術常識である（甲８３～９０，１１８，弁論の全趣旨）。

(ｳ) 本件医薬品のナルフラフィンのようなモルヒナン骨格を有する化合物（モルヒナン化合物），モルヒナン骨格の環構造が一部除去されたベンゾモルファン骨格を有する化合物（ベンゾモルファン化合物），フェニルピペリジン骨格を有する化合物（フェニルピペリジン化合物）などの３級アミン（第三級窒素）を含む塩基性化合物については，塩酸等で酸付加塩を形成して水溶性を高め，安定性を増したものが多数知られていた（甲１２０～１３７，弁論の全趣旨）。

(ｴ) ナルフラフィン塩酸塩も，ヒトに投与されると体内で直ちにフリー体であるナルフラフィンと塩化物イオンに解離し，ナルフラフィンが吸収され，作用部位である中枢神経系に到達してオピオイドκ受容体と結合して薬効及び薬理作用を奏するのであって，ナルフラフィン塩酸塩の塩酸部分は，薬効の存否や薬理作用には影響を及ぼさず，原薬の溶解性や安定性といった物性の改善のために付されたものである。これらのことは，平成２８年３月３１日に先行処分に係る本件医薬品の製造販売の承認申請がされた時までには，当業者には広く知られており，本件医薬品の製造販売の承認に当たってされた審査もそのことを前提にしている。（甲２９，３０，甲１０６［Ｄ意見書］，弁論の全趣旨）

オ　「有効成分」という用語についての当業者の理解を推認させる事情

当業者が，「有効成分」についてどのように理解しているのかを推認させるものとして，以下のような各種文献の記載がある。

(ｱ) 薬科学大辞典編集委員会編「廣川薬科学大辞典　第５版」廣川書店，平成２５年（甲６５）

「有効成分［医薬品の］　単体又は１種類以上の他の成分と組み合わせ，１つの医薬品の意図された作用を起こす物質。また，成分の中で薬効を示す成分，例えば

生薬の薬効をもつ成分をいうことが多く，生薬中の有効成分の分離は新薬開発の一方法。」

(ｲ) 塩路雄作「続・医薬品工業と粉体工学」粉体工学研究会誌１４巻７号４０９頁，昭和５２年（甲６６）

「医薬品の有効性とは治療効果であり，治療効果は医療品の臨床試験結果より評価されるのが通常であるが，臨床試験の前段階として，製剤より有効成分がどの程度生体内へ利用されているかを測定する必要がある。・・・・この生体への医薬品有効成分の利用率をBioavailabilityと称し， 通常は投薬後一定時間おきに血液や尿を採取し，血清中や尿中に存在する（吸収され，代謝をうけ，また排泄された）有効成分の含量の時間的推移をしらべることにより測定され，いろいろのパラメーターを用いて，もっとも吸収されやすい形で投与した場合（一般には，水溶液）や他の剤形との相対的比較で評価される。」

(ｳ) 石崎高志ほか「３.新薬の開発と臨床薬理」ファルマシアレビューＮｏ．１　３９頁，昭和５３年（甲６７）

「米国ＦＤＡの定義では，「生物学的利用能とは，活性を有する薬物成分あるいは治療有効成分が医薬品製剤から吸収され，薬の作用部位で利用されるようになる速さや量である」とされている。具体的には，有効成分の血中濃度，尿中排泄あるいは薬理効果を測定することが定められている・・・」

(ｴ) 緒方宏泰「先発医薬品と臨床上の有効性・安全性が『同等』であるジェネリック医薬品の評価～生物学的同等性を考える～」後発医薬品品質情報Ｎｏ．２　３頁～４頁，平成２６年（甲７３）

「製剤中に含まれている有効成分は，投与された後に，製剤から放出あるいは溶出される必要があります。そのため，試験管内での放出速度や溶出速度を比較検討することで，それら製剤を投与後の有効成分の血中濃度や作用発現部位中の濃度は推定でき，ヒト試験の代わりになるのではと期待される面があります。」

(ｵ) 井上勝央「医薬品の吸収機構の解明とその吸収性改善・予測への応用

を目指して」Tokyo University of Pharmacy and Life Sciences １２４号　５頁，平成２８年（甲７４）

「飲み薬は，きちっと服用すれば，有効成分がすべて腸で吸収されて，すべて全身を巡る。」

(ｶ) その他，佐久間昭「薬の効果・逆効果　臨床薬理学入門」講談社　２１頁，昭和５６年（甲６８）及び當瀬規嗣「よくわかる薬理学の基本としくみ」秀和システム　４３頁，平成２０年（甲７１）並びに賀川義之「飲み方守って効果発揮」静岡新聞夕刊５頁，平成２５年（甲７２）には，人体内部で血液中に取り込まれるのが「有効成分」であるとする趣旨の記載がある。

カ　ナルフラフィン塩酸塩を含む医薬品について記載した各種の文献の記載

ナルフラフィン塩酸塩を含む本件医薬品及び本件カプセル製剤について記載した各種の文献では，「有効成分であるナルフラフィン」（甲９３［成川衛「革新的医薬品 審査のポイント」日経ＢＰ社　３３８頁～３４１頁，平成２７年]），「ナルフラフィン２．５μｇ」，「ナルフラフィン５μｇ」，「ナルフラフィン１０μｇ」（甲９４［熊谷裕生ほか「新しいかゆみ治療薬ナルフラフィン（レミッチ）の臨床開発と有効性」透析療法ネクストⅫ　９４頁～１０８頁，平成２３年]，甲９５［熊谷裕生ほか「血液透析患者のかゆみの病態生理とナルフラフィンの臨床効果」週刊日本医事新報４５３８号７２頁～８０頁，平成２３年]，甲９６［熊谷裕生ほか「血液透析患者のかゆみの病態とナルフラフィンの効果」モダンフィジシャン３２巻４号　４４２頁～４４５頁，平成２４年]，甲９７［深川雅史ほか「ＥＢＭ透析療法」中外医学社　２３２頁，平成２２年]），「レミッチＯＤ錠２．５μｇ　成分（・・・）ナルフラフィン（２．５μｇ／錠）」（甲１０２［大館市立総合病院薬剤科「薬局ニュース」２８巻４号，平成２９年]）などとして，ナルフラフィン塩酸塩とナルフラフィンを必ずしも区別することなく記載している例がある。

キ　薬事行政における「有効成分」の取扱い等

(ｱ) 厚生省薬務局が編纂した「逐条解説　薬事法」（ぎょうせい，昭和５

８年）は，平成１８年法律第６９号による改正前の薬事法５０条７号（薬機法５０条１０号）に記載された「有効成分」の解釈について，「『有効成分』とは，医薬品の目的たる効能,効果を薬理的に生ぜしめる有効な成分を意味する。したがって,効能,効果と直接の関係のない賦形剤,安定剤,溶剤等の製剤補助剤は含まれない。」と記載している（甲３１）。

(ｲ) 厚生省薬務局審査第一課長及び生物製剤課長が，各都道府県衛生主管部(局)長あてに，昭和６３年３月１１日付けで通知した，承認申請の目的で実施される徐放性製剤（経口投与製剤）の設計及び評価に関するガイドラインである「徐放性製剤（経口投与製剤）の設計及び評価に関するガイドライン」（薬審―第五号）には，以下のような記載がある（甲７６）。

「医薬品の徐放化は有効成分の血中濃度を適正水準に維持することに主要な意義がある。従つて，薬物あるいは活性代謝物を含めた有効成分の血中濃度と薬効との関係について検討し，平均的な最低有効濃度，最適治療濃度等を明らかにしておくことが望ましい。」

「原則として健康人を対象とし，速放性製剤あるいは原薬と比較し，当該製剤の薬物速度論的特性を評価すること。薬物速度論的評価は，作用部位における有効成分の濃度測定が可能で，且つその有効濃度が明らかになつている場合を除いて，原則として血液データに基づいて行う。尿，唾液等の血液以外の体液データは，有効成分の作用部位濃度または血中濃度とそれらの体液中濃度との間に関連性が認められる場合に用いることができる。」

ク　専門家の意見書

Ｄ名誉教授，神戸学院大学薬学部のＥ教授及び熊本大学薬学部のＦ教授は，本件医薬品や本件カプセル製剤について,フリー体であるナルフラフィンが「有効成分」であると鑑定意見書（甲２９，３０，１０６）に記載している。

Ｄ名誉教授は，Ｄ意見書（甲１０６）において，「医薬品における「有効成分」とは，消化管から吸収され，循環血液に移行し，受容体などのタンパク質と結合す

ることで薬理作用を発揮する化学物質を表すことが昭和４９年から現在に至るまでの技術常識です。」と記載している。

(2) 検討

前記(1)で認定した事実関係をもとにして，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かどうかについて検討するが，前記第２の１のとおり，本件処分は，薬機法１４条９項に基づく医薬品製造販売承認事項一部変更承認であるから，本件処分においては，前記(1)ア(ｱ)で認定した「有効成分」をはじめとする先行処分に係る製造販売承認書の記載に基づくものであると認められる。

ア　特許権の存続期間の延長登録の制度は，政令処分を受けることが必要であったために特許発明の実施をすることができなかった期間を回復することを目的とするものであるから，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かどうかは，このような特許法の存続期間延長の制度が設けられている趣旨に照らして判断されるべきであり，その場合における本件処分の内容の認定についても，このような観点から実質的に判断されるべきであって，承認書の「有効成分」の記載内容から形式的に判断すべきではない。このように解することは，最高裁平成２６年（行ヒ）第３５６号同２７年１１月１７日第三小法廷判決・民集６９巻７号１９１２頁の趣旨にも沿うものということができる。

イ　前記(1)エで認定した事実からすると，医薬品について，良好な物性と安定性の観点からフリー体に酸等が付加されて，フリー体とは異なる化合物（付加塩）が医薬品とされる場合があること，そのような医薬品が人体に取り込まれたときには，付加塩からフリー体が解離し，フリー体が薬効及び薬理作用を奏すること，ナルフラフィンとナルフラフィン塩酸塩についても同様の関係にあり，ナルフラフィンとナルフラフィン塩酸塩で薬効及び薬理作用に違いがないことは，平成２８年３月３１日に先行処分に係る製造販売の承認申請がされた時までに，当業者に広く知られていたものと認められる。

ウ　上記イで述べたところに，前記(1)オ，カ，キで認定した事実や前記(1)

クの専門家の意見書の内容を総合すると，医薬品分野の当業者は，医薬品の目的たる効能,効果を生ぜしめる作用に着目して,医薬品に配合される付加塩だけでなく，そのフリー体も「有効成分」と捉えることがあるものと認められる。

エ　前記(1)ア～ウのとおり，先行処分に係る製造販売承認書には，「成分」として「ナルフラフィン塩酸塩」と記載されており，本件添付文書にも「有効成分に関する理化学的知見」として，「ナルフラフィン塩酸塩」と記載され，その構造式や性状などが記載されているが，これは，賦形剤などの製剤補助剤と区別する観点から，実際に医薬品に配合されている原薬（付加塩）を有効成分として捉えていることに基づく記載であると解される。これに対し，本件添付文書の「有効成分・含量（１カプセル中）」の欄に，「ナルフラフィン塩酸塩２．５μｇ（ナルフラフィンとして２．３２μｇ）」と記載されており，本件インタビューフォームには，和名は「ナルフラフィン塩酸塩」と記載されているものの，洋名については「ナルフラフィン塩酸塩」と「ナルフラフィン」が併記されているし，「有効成分（活性成分）の含量」として，「カプセル：１カプセル中ナルフラフィン塩酸塩２．５μｇ（ナルフラフィンとして２．３２μｇ）含有　ＯＤ錠：１錠中ナルフラフィン塩酸塩２．５μｇ（ナルフラフィンとして２．３２μｇ）含有」と記載されている。そして，前記(1)アのとおり，先行処分に係る製造販売承認書では，●●●

ると認めるのが相当である。

したがって，「ナルフラフィン塩酸塩」のみを本件医薬品の有効成分と解し，「ナルフラフィン」は，本件医薬品の有効成分ではないと認定して，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はいえないと判断した本件審決の認定判断は誤りであり，取消事由１は理由がある。

⑶　被告らの主張について

被告らは，①ナルフラフィン塩酸塩が，有効成分の一般的名称（ＪＡＮ）とされていること，②ナルフラフィンのフリー体とナルフラフィン塩酸塩は化学構造も異なり，「止痒剤」として使用される場面での溶解性等も異なるが，医薬品にとって溶解性等はその作用効果として重要であるから，酸付加塩の有無は，投与時における有効成分として理解されるべきであること，③本件特許との関係では，生体内における存在形態ではなく，販売される場合の有効成分の存在形態が問題とされるべきであること，④「フリー体と酸付加塩の両方で承認取得した事例」や「フリー体と酸付加塩で効能効果が違う事例」（乙１～４）が存在するなどと主張する。

ア　上記①について

前記⑴ウ(ｲ)，(ｳ)で認定したとおり，本件医薬品の「一般名」のうち，「和名」はナルフラフィン塩酸塩であるが，他方で，「洋名」のうち，国際一般的名称（ＩＮＮ）は，「nalfurafine」であるから，「一般名」のみで有効成分を特定することができるというものではなく，被告沢井製薬の主張するところが，前記⑵の認定判断を左右するものとはいえない

イ　上記②，③について

溶解性や安定性の向上などのために，本件医薬品の原薬形態が，ナルフラフィン塩酸塩とされていることは，前記⑴エ(ｴ)で認定したとおりであるが，前記⑴で認定した事実からすると，前記⑵で認定判断したとおり，投与時の原薬形態であるナルフラフィン塩酸塩のみならず，本件医薬品の承認審査で，効能，効果を生ぜしめる成分として着目されていた，ヒトに投与した後の形態であるフリー体のナルフラフ

ィンも，本件医薬品の「有効成分」と認定すべきである。

前記２で認定したように，本件発明は，一般式（Ｉ）で示される化合物をはじめとする特定のオピオイドκ受容体作動性化合物を有効成分とした止痒剤に関する発明であり，本件発明の技術的意義が，販売される場合のオピオイドκ受容体作動性化合物の存在形態にあるものとは認められないから，そのような販売される場合の存在形態の違いによって，本件処分における本件医薬品の有効成分の認定が左右されるとは解されない。

ウ　上記④について

薬機法上，医薬品の製造販売承認において，フリー体と酸付加塩で異なる承認が得られる場合があったとしても（乙１～４），本件医薬品の処分の内容は，特許法において存続期間の延長登録制度が設けられている趣旨に照らし，特許法の観点から実質的に，認定判断されるべきものであるから，それらの事例の存在が，本件処分の内容を前記(2)のように認定することを妨げるものということはできない。

エ　その他，前記(2)の認定判断に反する被告らの主張を採用することができないことは，既に判示したところから明らかである。

４　取消事由５（延長登録要件を充足する部分を除外せずに延長登録全部無効判断をしたことの法解釈の誤り）について

(1)　本件審決について

ア　前記第２の１(3)のとおり，慢性肝疾患患者を対象とする場合については，先行処分により既に実施可能となっていたのであるから，慢性肝疾患患者を対象とする場合の実施について，本件処分を受けることが必要であったとはいえないことは明らかである。

本件審決は，前記第２の３(3)のとおり，慢性肝疾患患者を対象とする場合については，先行処分により既に実施可能となっていたことを認定した後，引き続き，「本件延長登録のうち，『処分の対象となった医薬品について特定された用途』が『慢性肝疾患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

部分は，旧特許法１２５条の２第１項１号に該当し，無効にすべきものと認められる。」，「無効理由２は，本件延長登録のうち『処分の対象となった医薬品について特定された用途』が『慢性肝疾患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）』の部分について理由がある。」と判断しているのであり，このことからすると，本件審決は，無効理由２に基づいて本件延長登録のうち「処分の対象となった医薬品について特定された用途」を「慢性肝疾患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）」とする部分のみについて無効理由があると判断したものと解され，本件審決のこの判断は，正当なものとして是認することができる。

イ　なお，本件審決は，「第６　むすび」として，「上記第５の１のとおり無効理由１は理由があり，本件発明の実施に旧特許法６７条２項の政令で定める処分を受けることが必要であったとは認められず，上記第５の２のとおり無効理由２も理由があり，本件発明のうち慢性肝疾患患者を対象とする部分の実施に旧特許法６７条２項の政令で定める処分を受けることが必要であったとは認められないから，本件延長登録は，その全体が旧特許法１２５条の２第１項１号に該当し，無効とすべきものである。」と判断している。しかし，この判断は，無効理由１と無効理由２を総括する「第６　むすび」に記載されているものである上，無効理由２については，本件発明のうち慢性肝疾患患者を対象とする部分の実施についてのみ旧特許法６７条２項の政令で定める処分を受けることが必要であったとは認められないと記載している。

そうすると，本件審決は，無効理由２については本件延長登録が部分的に無効になるにすぎないが，無効理由１があることにより，結局，本件延長登録全体が無効となることから，「第６　むすび」で「その全体が」と判断したものと解される。

すなわち，本件審決は，無効理由１に基づいて本件延長登録全体を無効にするとともに，無効理由２に基づいて本件延長登録のうち「処分の対象となった医薬品について特定された用途」を「慢性肝疾患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）」とする部分のみを無効にしたものであると解される。

⑵　原告の主張について

原告は，本件審決が，無効理由２に基づいても本件延長登録全部を無効にしたとの前提に立って，取消事由５について主張するが，前記(1)のとおり，本件審決は，無効理由２に基づいて本件延長登録全体を無効にしたものではないから，原告の主張は，その前提において失当である。

また，原告は，本件のように，延長登録の一部について無効理由がある場合，無効理由がある部分を含めて無効にすべきではないと主張している。しかし，延長登録を全体として不可分と解すべき根拠はなく，延長登録がされた「用途」の一部については，旧特許法６７条２項の政令で定める処分を受けることが必要であったとは認められない場合には，その部分のみを無効審判において無効にすることができ，そのようにすべきであると解される。この点について特に明文の規定はないが，明文の規定がないからといって，上記のように可分と解することが妨げられる理由は見いだし難い。したがって，原告の上記主張を採用することはできない。

⑶　被告らの主張について

被告らは，①２件の最高裁判決からすると，延長登録を部分的に無効にできるのは，特許法に明文で規定された場合に限られる，②最初から慢性肝疾患を除外して，腹膜透析患者に対する用途についてのみ延長登録の出願をすることができたのに，それをしなかったのは原告の責任であるから，本件延長登録全体が無効となることはやむを得ないなどと主張する。

しかし，被告沢井製薬が指摘する２件の最高裁判決は，特許出願に対する特許査定の不可分性を説示したものであり，延長登録出願に関するものではなく，本件とは事案を異にするものであって，前記(1)の判断を左右するものとはいえない。

また，特許法では，延長登録出願は，審査官により審査が行われ，当該出願が，旧特許法６７条の３第１項各号のいずれかに該当するとされた場合に，拒絶理由通知が発せられ（旧特許法６７条の４，特許法５０条），出願人はそれに応じて補正（特

許法１７条１項）などの応答をするとされているのであるから，出願人が，拒絶理由を全く含まずに延長登録出願をすることは必ずしも特許法の予定するところではないといえる。そうすると，本件の延長登録出願において，出願人である原告が，本件延長登録出願の願書において，旧特許法６７条２項の「政令で定める処分の内容」（平成２９年経済産業省令第３号による改正前の特許法施行規則３８条の１５）として，先行処分との関係を考慮した記載を行わなかったとしても，それをもって，本件延長登録全体が無効となることはやむを得ないということはできないというべきであって，前記(1)の判断を左右するものではない。

その他，被告らの主張を採用することができないことは，既に判示したところから明らかである。

(4) 小括

原告が主張する取消事由５については，以上のとおりである。

第５　結論

以上の次第で，取消事由１は理由があり，本件審決にはその結論に影響を及ぼす違法があるものの，本件審決が，無効理由２に基づき，本件延長登録のうち「処分の対象となった医薬品について特定された用途」を「慢性肝疾患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）」とする部分を無効にしたことは正当であるから，本件審決のうち「本件延長登録のうち『処分の対象となった医薬品について特定された用途』が『慢性肝疾患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）』との部分は無効とする」部分以外を取り消し，その余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２部

裁判長裁判官

森　　義　　之

裁判官

眞　　鍋　　美　穂　子

裁判官

熊　　谷　　大　　輔