

●国際活動センターからのお知らせ
【米 国 情 報】

担当:外国情報部 和田 等

Altana Pharma AG et al. v. Teva Pharmaceutical USA, Inc. et al.

CAFC判決 2009年5月14日、No.2008-1039

- ・対象特許：米国特許第4,758,579号
- ・原告（控訴人、特許権者）：Altana Pharma AG et al.（Altana社）
- ・被告（被控訴人）：Teva Pharmaceutical USA, Inc. et al.（Teva社）

1. 事件の概要

Altana社は、抗潰瘍薬“Protonix”の有効成分であるパントプラゾール（プロトンポンプ阻害剤：PPI）に関するUS4,758,579（’579特許）に基づき、Teva社をニュージャージー地区地方裁判所（地裁）に提訴し、予備差止命令を申請したが、’579特許は自明の疑いがあるとして、地裁は認容しなかった。

地裁の判決を不服として、Altana社はCAFCに控訴したが、CAFCは地裁の判断を支持した。

2. 事件の背景

・Altana社は、引例となるUS4,555,518（’518特許）と本件特許（’579特許）とをそれぞれ無関係に出願した。’518特許（引例）は、2002年11月26日で特許期間満了により失効していた。一方、’579特許（本件特許）は2005年7月19日まで有効であったが、2004年1月4日に5年の特許期間延長が認められ、2010年7月19日まで有効となった。

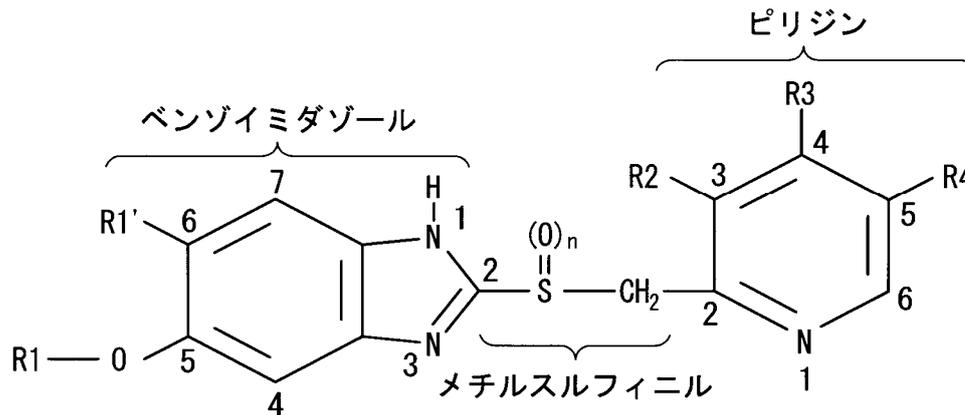
・’579特許は、’518特許でクレームされた化合物と構造的に類似のパントプラゾールをクレームしていた。また、侵害訴訟で問題となったパントプラゾール（ジェネリック品）は、’518特許に記載された18種の薬効試験用化合物（ヒットコンパウンド）の内の化合物12と構造的に酷似していた。

・2004年4月6日（’579特許の特許期間中）にTeva社は、Altana社の抗潰瘍薬“Protonix”のジェネリック品を米国食品医薬品局（FDA）に簡略承認申請（ANDA）を行った。

・Altana社は、Teva社の上記簡略承認申請行為に対して、地裁に提訴した。

3. ’579特許の内容

下記は’579特許のクレーム1に記載されたパントプラゾールの一般構造式である。



上記一般構造式において、R3は炭素数1~3のアルコキシ基（アルキル基が酸素原子に結合した置換基：-OR）であり、R2及びR4の一方は炭素数1~3のアルコキシ基、他方は水素原子又は炭素数1~3のアルキル基（一価の鎖状飽和炭化水素基：-C_nH_{2n+1}）である。

4. '518特許（引例）に記載された化合物12の内容

'518特許に記載された化合物12の化学式は下記のとおりである。

5-difluoromethoxy-2-[(4-methoxy-3-methyl-2-pyridyl)-methylsulfanyl]-1H benzimidazole

5. 侵害訴訟で問題となったジェネリック品と化合物12との相違点

侵害訴訟で問題となったパントプラゾール（ジェネリック品）と、'518特許の化合物12との構造的相違点は、ピリジン環の第3位（上記一般構造式ではR2の位置）における置換基の種類のみであった。即ち、ジェネリック品のR2がメトキシ基（-OCH₃）であるのに対し、化合物12のR2がメチル基（-CH₃）である点でのみ相違していた。

6. 地裁での経過

・ Altana社は、2007年6月22日に予備差止命令を申請した。これに対して、Teva社は、侵害の事実を認めた上で、'579特許は先行技術に基づき自明であるとして、特許無効を主張した。主な無効理由は下記のとおりである。

(1) '518特許の化合物12は、'579特許のパントプラゾールに対してリードコンパウンドである。

(2) 胃酸抑制剤と胃潰瘍に関するSachsの文献には、PPIのpKa（酸解離定数）が小さいほど酸性が高まり、PPIの患者の体内での安定性が向上するとの記載がある。

(3) 第3位置換のピリジンの酸解離定数に関するBrysonの文献には、第3位をメトキシ基で置換したピリジンは、第3位をメチル基で置換したピリジンより、pKaが低下するとの記載がある。

(4) 最初に商品化されたPPIに関するUS4,255,431（'431特許）には、PPIにおいてピリジン環の第3位にメチル基に代えてメトキシ基を置換することができることを示した記載がある。

・ Altana社は、上記Teva社の特許無効の主張に対して有効な反論ができなかった。

- ・ Altana社は、差止が認められない場合には回復できない損害が発生することについても主張したが、認められなかった。
- ・ 以上より、地裁はAltana社の予備差止命令の申請を認容しなかった。

7. CAFCでの判断

・ 被告が一旦特許の有効性について実質的な疑問を挙げた場合、原告（特許権者）が有効な反論を行わない限り、予備差止は認められないという、地裁の判断基準は違法なものではない。

・ 化合物に関する特許の自明性は、クレーム化合物と公知化合物との構造上の類似点と相違点に基づき判断される[Eisai Co. Ltd. v. Dr. Reddy's Labs., Ltd., 533 F.3d 1353, 1356-57 (Fed. Cir. 2008)]。

・ 新規化合物に関連する侵害訴訟において、一応の自明 (prima facie obviousness) を認定するためには、化学者が特定の方法で公知化合物に変更を加える理由を明らかにしなければならない[Yamanouchi Pharm. Co., Ltd. v. Danbury Pharmacal, Inc., 231 F.3d 1339, 1344 (Fed. Cir. 2000)]。この基準は、KSR最高裁判決で示された法的原則と矛盾しない。即ち、KSR判決以降、化合物の一応の自明を示すためには、リードコンパウンド（公知化合物）の合理的な特定から始めるべきである[Takeda Chem. Indus., Ltd. v. Alphapharm Pty., Ltd., 492 F.3d 1350, 1356 (Fed. Cir. 2007); Eisai, 533 F.3d 1359]。

・ 本件において、上記リードコンパウンド（公知化合物）として、' 518特許に記載された薬効が確認された化合物（ヒットコンパウンド）の中から化合物12を選択することは自然である。

・ また、上記変更を加える理由として、Brysonは、PPIのpKaを低下させてPPIの安定性を向上させるために、ピリジン環の第3位のメチル基をメトキシ基に変更することの有効性を教示している。

・ 以上より、CAFCは地裁の判断を支持した。

<参考サイト> 米国連邦巡回控訴裁判所
<http://www.cafc.uscourts.gov/opinions/08-1039.pdf>

以上