

平成30年10月11日判決言渡

平成29年(行ケ)第10160号 審決取消請求事件

口頭弁論終結日 平成30年8月21日

判 決

原 告 エルメッドエーザイ株式会社

同訴訟代理人弁護士 田 中 克 郎

中 村 勝 彦

根 本 浩

鈴 木 優

石 堂 瑠 威

中 野 亮 介

同訴訟代理人弁理士 内 藤 和 彦

山 田 拓

被 告 大日本住友製薬株式会社

同訴訟代理人弁理士 細 田 芳 徳

細 田 芳 弘

主 文

- 1 原告の請求を棄却する。
- 2 訴訟費用は原告の負担とする。

事 実 及 び 理 由

第1 請求

特許庁が無効2016-800114号事件について平成29年6月20日

にした審決を取り消す。

第2 前提となる事実（証拠を掲記した以外の事実は、当事者間に争いがない。）

1 特許庁における手続の経緯等

(1) 被告は、平成26年2月21日、発明の名称を「光安定性の向上した組成物」とする特許出願（特願2014-31177号。以下「本件出願」という。）をし、平成27年2月6日、特許権の設定の登録（特許第5689192号。請求項の数は17。）を受けた（以下、この特許を「本件特許」といい、本件特許に係る明細書を「本件明細書」という。甲30）。

本件出願は、平成17年4月27日にされた特許出願（特願2005-129150号。以下「本件原出願」といい、この出願に係る願書に添付された明細書を「本件当初明細書」という。）、当該出願の一部について平成20年10月6日にされた特許出願（特願2008-260095号）、当該出願の一部について平成23年12月26日にされた特許出願（特願2011-283072号）を経て、当該出願の一部についてされた分割出願である。

(2) 原告は、平成28年9月30日、本件特許の請求項1, 3, 14～16に係る発明につき無効審判を請求した（無効2016-800114号。甲91）。

被告は、平成28年12月16日付けで、本件特許の特許請求の範囲について訂正請求をした（訂正後の請求項は、請求項1～14及び17～37。以下「本件訂正」という。乙2）。

特許庁は、平成29年6月20日、被告の本件訂正請求を認めた上、「本件審判の請求は、成り立たない。」との審決をし、その謄本は、同月30日、原告に送達された。

(3) 原告は、平成29年7月28日、審決の取消しを求めて、本件訴訟を提起した。

2 特許請求の範囲の記載

本件特許につき、本件訂正後の特許請求の範囲は、請求項1～14及び17～37からなるところ（以下、本件訂正後の各請求項に記載された発明を、請求項の番号に従って「本件訂正発明1」、「本件訂正発明2」などといい、これらを総称して単に「本件訂正発明」ということがある。）、無効審判において審理の対象となった請求項1、3、14、18～28（本件訂正前の請求項1、3、14～16に対応。）の記載は次のとおりである。

【請求項1】（a）ベシル酸アムロジピン、（b）酸化鉄、（c）炭酸カルシウム及び結晶セルロースからなる群より選ばれる少なくとも一つの賦形剤、並びに（d）デンプンを含有し、デンプンの含有量が30重量%以下であり、かつ被覆層を有しない経口固形組成物（但し、マンニトールを含まない組成物である）。

【請求項3】口腔内崩壊型製剤である、請求項1又は2記載の経口固形組成物。

【請求項14】（a）ベシル酸アムロジピン、（b）酸化鉄、（c）炭酸カルシウム及び結晶セルロースからなる群より選ばれる少なくとも一つの賦形剤、並びに（d）デンプンを含有し、デンプンの含有量が30重量%以下であり、かつ被覆層を有しない経口固形組成物（但し、マンニトールを含まない組成物である）の調製における、光による変色が抑制された組成物とするための酸化鉄の使用。

【請求項18】経口固形組成物が酸化チタンを含有しない経口固形組成物である、請求項14に記載の使用。

【請求項19】経口固形組成物が口腔内崩壊型製剤である、請求項14又は18に記載の使用。

【請求項20】経口固形組成物における（d）デンプンの含有量が1～30重量%である、請求項14、18又は19記載の使用。

【請求項21】経口固形組成物における（d）デンプンがトウモロコシデンプ

ンである，請求項 1 4 及び 1 8 ～ 2 0 いずれか 1 項記載の使用。

【請求項 2 2】経口固形組成物が，さらに，（e）フマル酸ステアリルナトリウムを含有する，請求項 1 4 及び 1 8 ～ 2 1 いずれか 1 項記載の使用。

【請求項 2 3】（a）ベシル酸アムロジピンの経口固形組成物中含量がアムロジピンとして 2 ～ 5 重量%であり，

（b）酸化鉄の経口固形組成物中含量が 0. 0 3 ～ 2 重量%であり，

（d）デンプンの経口固形組成物中含量が 2 ～ 3 0 重量%であり，かつ

（e）フマル酸ステアリルナトリウムの経口固形組成物中含量が 1 ～ 3 重量%である，請求項 2 2 に記載の使用。

【請求項 2 4】酸化鉄が黄色三二酸化鉄である，請求項 1 4 及び 1 8 ～ 2 3 いずれか 1 項記載の使用。

【請求項 2 5】経口固形組成物が，（a）ベシル酸アムロジピン，および（b）酸化鉄の混合物を含有する，請求項 1 4 及び 1 8 ～ 2 4 いずれか 1 項記載の使用。

【請求項 2 6】経口固形組成物が，（a）ベシル酸アムロジピン，および（b）酸化鉄の混合物を造粒して得られる組成物を含有する，請求項 1 4 及び 1 8 ～ 2 5 いずれか 1 項記載の使用。

【請求項 2 7】経口固形組成物が口腔内崩壊型製剤である，請求項 1 4 及び 1 8 ～ 2 6 いずれか 1 項記載の使用。

【請求項 2 8】酸化鉄が黄色三二酸化鉄である，請求項 1 4 及び 1 8 ～ 2 7 いずれか 1 項記載の使用。

3 審決の理由

審決の理由は，別紙審決書の写しに記載のとおりであるところ，その概要は次のとおりである。

(1) 無効審判における原告の主張（甲 9 1）

ア 無効理由 1

(ア) 2003年8月付けのノルバスク錠に係る医薬品インタビューフォームの抜粋(表紙, 11, 12, 14及び16頁。甲1)には, 次の発明(以下「甲1発明〔原告〕」という。)が記載されている(「1-a」等の符号は, 原告が付したものである。以下同じ。)

1-a : ベシル酸アムロジピンと,

1-c : 結晶セルロース,

1-d-1 : カルボキシメチルスターチナトリウムを含有する,

1-e : フィルムコート錠(但し, マンニトールを含まない)。

(イ) 本件訂正発明1と甲1発明〔原告〕との相違点

<相違点1>

本件訂正発明1は, 酸化鉄を含有するのに対し, 甲1発明〔原告〕は, 酸化鉄を含有しない点。

<相違点2>

本件訂正発明1は, デンプンを含有するのに対し, 甲1発明〔原告〕は, デンプンを含有せず, カルボキシメチルスターチナトリウムを含有する点。

<相違点3>

本件訂正発明1は, デンプンの含有量が30重量%以下であるのに対し, 甲1発明〔原告〕は, そのような限定を有していない点。

<相違点4>

本件訂正発明1は, 被覆層を有しない経口固形組成物であるのに対し, 甲1発明〔原告〕は, 被覆層(フィルムコート部分)を有する点。

(ウ) 本件訂正発明3と甲1発明〔原告〕との相違点

<相違点5>

本件訂正発明3は, 被覆層を有しない口腔内崩壊型製剤であるのに対し, 甲1発明〔原告〕は, 被覆層(フィルムコート部分)を有し, 口腔

内崩壊錠でない点。

(エ) 本件訂正発明の容易想到性

本件訂正発明 1, 3, 14, 18～28 は, 甲 1 発明〔原告〕及び特開 2000-191516 号公報 (公開日:平成 12 年 7 月 11 日。甲 2) に記載された発明並びに本件特許の出願日当時の技術常識に基づいて当業者が容易に発明をすることができたものである。

イ 無効理由 2

(ア) 特開 2003-34655 号公報 (公開日:平成 15 年 2 月 7 日。甲 15) には, 次の発明 (以下「甲 15 発明〔原告〕」という。) が記載されている。

15-a : 塩酸マニジピンと,

15-b : 黄色三二酸化鉄,

15-c : 結晶セルロース,

15-d-1 : トウモロコシデンプンを含む,

15-d-2 : トウモロコシデンプンの含有量が 30 重量%以下であり

15-e : かつ, 被覆層を有しない口腔内崩壊錠である D-マンニトールを含む経口固形組成物。

(イ) 本件訂正発明 1 と甲 15 発明〔原告〕との相違点

<相違点 7>

本件訂正発明 1 は, ベシル酸アムロジピンを含むのに対し, 甲 15 発明〔原告〕は, ベシル酸アムロジピンを含むせず, 塩酸マニジピンを含む点。

<相違点 8>

本件訂正発明 1 は, D-マンニトールを含むのに対し, 甲 15 発明〔原告〕は, D-マンニトールを含む点。

(ウ) 本件訂正発明 1 4 と甲 1 5 発明〔原告〕との相違点

〈相違点 9〉

本件訂正発明 1 4 は、光による変色が抑制された組成物とするための酸化鉄の使用であるのに対し、甲 1 5 発明〔原告〕は、酸化鉄の使用が光による変色を抑制するためではない点。

(エ) 本件訂正発明の容易想到性

本件訂正発明 1, 3, 1 4, 1 8～2 8 は、甲 1 5 発明〔原告〕及び本件特許の出願日当時の技術常識に基づいて当業者が容易に発明をすることができたものである。

ウ 無効理由 3

本件訂正発明は本件当初明細書に含まれるものではないから、本件出願は適法な分割出願でなく、本件原出願の時にしたものとはみなされない。したがって、本件訂正発明 1, 3, 1 4, 1 8～2 8 は、本件原出願の公開公報に記載された発明であるか、当該発明に基づいて当業者が容易に発明をすることができたものである。

エ 無効理由 4

本件明細書の発明の詳細な説明に、具体的な実施態様として記載されているのは、マンニトールを含む組成物のみであるところ、このマンニトールを含む組成物は、本件訂正発明 1, 3, 1 4, 1 8～2 8 に該当しない。したがって、本件訂正発明は、本件明細書の発明の詳細な説明において裏付けられた範囲を超える発明を含むものであるから、サポート要件に適合しない。

オ 無効理由 5

本件原出願に係る発明におけるマンニトールを結晶セルロース等及び所定量のデンプンに置換することは、単なる周知慣用技術の転換にすぎない。したがって、本件訂正発明と本件原出願に係る発明とは同一のものである

から、本件訂正発明 1, 3, 14, 18～28 は、先願要件（特許法 39 条 2 項）に適合しない。

(2) 審決の理由

ア 無効理由 1 について

甲 1 には、1 錠中のベシル酸アムロジピンの含有量に限定を有しないフィルムコート錠や、添加物の限定を有しないフィルムコート錠は記載されていないから、甲 1 発明〔原告〕が甲 1 に記載されているとはいえない。無効理由 1 は、甲 1 に甲 1 発明〔原告〕が記載されていることを前提とするものであるところ、この前提が誤っているから、本件訂正発明 1 に係る特許は、無効理由 1 によって無効にすべきであるとはいえない。

仮に、甲 1 に甲 1 発明〔原告〕が記載されているとしても、当業者が相違点 1～4 に係る構成とする動機を格別の創意を要することなくもつものとはいえないし、本件訂正発明 1 の効果は当業者といえども予測し得たものとはいえない。

したがって、本件訂正発明 1, 3, 14, 18～28 は、甲 1 発明〔原告〕及び甲 2 に記載された発明並びに技術常識に基づいて当業者が容易に発明をすることができたものであるとはいえない。

イ 無効理由 2 について

甲 1 5 から認定できる発明は、必ず「a) 活性成分, b-1) 糖および／または糖アルコールおよび c-1) セルロース類を含有してなる群 1」と「b-2) 糖および／または糖アルコールおよび c-2) セルロース類を含有してなる群 2」を含有するものに限られるから、甲 1 5 発明〔原告〕が甲 1 5 に記載されているとはいえない。無効理由 2 は、甲 1 5 に甲 1 5 発明〔原告〕が記載されていることを前提とするものであるところ、この前提が誤っているから、本件訂正発明 1 に係る特許は、無効理由 2 によって無効にすべきであるとはいえない。

仮に、甲 1 5 に甲 1 5 発明〔原告〕が記載されているとすると、当業者が相違点 7 及び 8 に係る構成とすることに格別の創意を要したものとはいえないものの、本件訂正発明 1 の効果は当業者といえども予測し得たものとはいえない。

したがって、本件訂正発明 1, 3, 1 4, 1 8 ~ 2 8 は、甲 1 5 発明〔原告〕及び技術常識に基づいて当業者が容易に発明をすることができたものであるとはいえない。

ウ 無効理由 3 について

本件特許に係る出願は、分割要件に適合する。

エ 無効理由 4 について

本件特許の特許請求の範囲の記載は、サポート要件に適合する。

オ 無効理由 5 について

本件原出願に係る発明と本件訂正発明が、同一の発明であると認めることはできないから、先願要件（特許法 3 9 条 2 項）に適合する。

第 3 原告主張の取消事由

1 取消事由 1（甲 1 記載の発明に基づく容易想到性判断の誤り）

(1) 甲 1 記載の発明の認定の誤り

ア 審決は、甲 1 に、1 錠中のベシル酸アムロジピンの含有量に限定を有しないフィルムコート錠や、添加物の限定を有しないフィルムコート錠は記載されていないから、甲 1 発明〔原告〕が、甲 1 に記載されているとはいえないと判断した。しかし、次のとおり、この判断は誤りである。

イ そもそも、引用発明の認定に当たり、本件訂正発明の発明特定事項に関連しない技術事項まで敢えて認定する必要はない。

本件についてみると、審決が認定した本件訂正発明の奏する効果は、経口固形組成物にベシル酸アムロジピンと酸化鉄とを含有させることにより、被覆層を有さなくてもベシル酸アムロジピンの光安定化を実現するという

ものである。そして、本件明細書に、1錠中のベシル酸アムロジピンの含有量や、無水リン酸水素カルシウム、ステアリン酸マグネシウム、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、酸化チタン、タルク、カルナウバロウといった添加物等が、本件訂正発明の奏する効果に影響を及ぼす旨の記載はなく、かえって、これらの添加物は、「不活性な添加物」であり、「本発明の効果に影響を与えない、一般的に医薬品添加剤として添加されるもの」の具体例として列挙されている。

したがって、1錠中のベシル酸アムロジピンの含有量や添加物は、いずれも本件訂正発明の発明特定事項ではないから、甲1記載の発明の構成としても認定する必要はない。審決の判断は、本件訂正発明の発明特定事項とされていないアムロジピンの含有量や、発明特定事項以外の成分に敢えて着目し、殊更にこれを含むものとして甲1記載の発明を認定するもので、明らかに誤りである。

仮に、審決が指摘するこれらの事項が、甲1記載の発明の発明特定事項に該当するとしても、本件訂正発明1は、1錠中のベシル酸アムロジピンの含有量を限定していないし、審決が指摘する添加物を含有することを排除してもいないから、審決が指摘する事項は、容易想到性の判断に際し、本件訂正発明1との相違点にならない。

(2) 本件訂正発明1の容易想到性判断の誤り

ア 相違点1について

(ア) 審決は、①甲1に接した当業者において、甲1発明〔原告〕に甲2記載の発明を組み合わせる動機付けがあるとはいえない、②光による医薬品の変色防止に酸化鉄を用いることが、本件特許の出願日当時に周知技術又は技術常識であったとはいえないし、仮に、そのような周知技術又は技術常識があったとしても、当業者において、甲1発明〔原告〕に当該周知技術又は技術常識を組み合わせる動機付けがあるとはいえないと

判断した。しかし、次のとおり、この判断は誤りである。

(イ) 甲1の記載内容について

甲1には、固体状態の「ベシル酸アムロジピン」が「室内散光下の保存において…光曝表面は黄色に着色し」たこと、及び「わずかに分解物Iのスポットを認め」、分割錠の分割面が光照射により「わずかに淡黄色に着色」したことが記載されている。このように、甲1には、ベシル酸アムロジピンが光により分解、着色したこと、すなわち、ベシル酸アムロジピンが光に対し不安定である旨が明記されているから、この記載に接した当業者は、アムロジピンの光に対する安定化という課題を当然に把握、認識できる。そして、甲1は医薬品インタビューフォーム（医薬品の適正使用や評価のための情報あるいは薬剤情報提供の裏付けとなる情報等が集約された総合的な医薬品解説書）であって、医薬品の安全性の観点から医薬品に関する情報を医療従事者等の使用者に適切に提供するものであるから、アムロジピンが、少なくとも光に対して、固体状態及び錠剤の分割面において不安定性を有するとの情報を提供していると理解するのが自然である。

また、一般的な調剤方法の一つである一包化調剤の際に、用量調節等のためにニフェジピンやアムロジピン等のカルシウム拮抗薬の錠剤を粉砕すると、光に対して不利な包装状態になることが知られていた。甲1は、フィルムコーティング等により光に対する安定化が図られている市販の錠剤であっても、上記のような調剤によって光に対する防御のない状態にさらされる場合に備え、アムロジピンが光に対して不安定である旨を予め使用者に情報提供しているのである。

(ウ) アムロジピンが光に対し不安定であるとの課題が周知のものであったこと

アムロジピンが光に対し不安定な化合物であることは、多くの文献の

記載からも明らかである。すなわち、これらの文献には、①アムロジピンがジヒドロピリジン類に属し、光により酸化されること、②アムロジピンが光により変色すること、③ベシル酸アムロジピンは遮光が必要であること、④ベシル酸アムロジピンを有効成分とする市販薬であるノルバスク（錠剤）についても、光に対し不安定であることが記載されている。これらの記載から、ベシル酸アムロジピンには、光に起因する分解（酸化）及び変色という光に対する不安定性という課題があり、改善の余地があることが周知であったといえる。

(エ) 光に対して不安定な医薬品の課題解決のために酸化鉄を用いることが周知技術又は技術常識であったこと

本件特許の出願日当時、光に不安定な薬物を含む医薬品の課題解決のために酸化鉄を用いることが当業者に周知の技術であったことは、多くの文献にその旨が記載されていることから明らかである。例えば、甲2には、光に不安定な医薬品に酸化鉄を用いることが、甲3には、光による医薬品の変色防止に酸化鉄を用いることがそれぞれ開示されている。

また、酸化鉄を被覆層に混ぜるだけでなく、活性成分と混合してもよく、その使用形態に制限がないことも当業者によく知られていた。

(オ) 小括

上記(イ)から(エ)のとおり、甲1には、光による変色も含め、アムロジピンが光に不安定であるとの課題が記載されているところ、本件特許の出願日当時、このような課題が存在すること、及び光に不安定な薬物に酸化鉄を用いることは、いずれも当業者に周知な事項であった。

したがって、相違点1に係る構成は、実質的な相違点であるといえない。仮に、実質的な相違点であるとしても、当業者において、甲1発明〔原告〕に、甲2記載の光に対する不安定性の解決手段として酸化鉄を用いる発明を組み合わせる動機付けがあることは明らかであるから、少

なくとも当業者は当該構成を容易に想到できる。

イ 相違点 2～4 について

(ア) 審決は、相違点 2～4 に関し、これらは明らかな相違点であると判断した上で、甲 1 発明〔原告〕は医薬品として完成されたものといえるから、甲 1 に記載された配合成分や剤形を変更する動機は乏しいと判断した。しかし、次のとおり、この判断は誤りである。

(イ) 相違点 2 及び 3 について

デンプンとカルボキシメチルスターチナトリウムは、いずれも医薬品の添加物たる崩壊剤として医薬品添加物一覧等に同列に列挙されている物質である。そして、被告も、本件特許の審査過程において、デンプンが不活性な成分であることを自認している。そうすると、両者は、いずれも医薬品の添加物たる崩壊剤であって、不活性な成分として置換可能な同等なものとして一般に取り扱われていたことが明らかである。

また、デンプンの医薬品への添加量については、多くの文献において、含有量が 5～30% となるように調整されていることが記載されている。

したがって、相違点 2 及び 3 に係る構成は、当業者において周知な事項及び技術常識に基づく単なる設計変更にすぎず、実質的な相違点ではない。

(ウ) 相違点 4 について

薬剤を嚥下することが困難な患者、高齢者及び小児のために、通常の錠剤よりも服用しやすい剤形を更に追求することは、従来から周知の課題として存在している。その解決方法として、甲 1 発明〔原告〕のような被覆層を有するフィルムコーティング錠を、被覆層を有しない剤形である口腔内崩壊錠にすることは、当業者にとって周知の技術又は技術常識であった。

なお、口腔内崩壊錠は、口腔内での迅速な崩壊が求められるところ、

口腔内という比較的水分が少ない状況下でも，含有する崩壊剤と水分との接触を容易にし，膨潤を促進させるため，錠剤の表面に被覆層を設けないのが一般的である。

したがって，相違点 4 は実質的な相違点ではない。

ウ 本件訂正発明 1 の奏する効果について

審決は，本件訂正発明 1 の奏する効果は，甲 1～4 に記載も示唆もされていないし，当該効果が本件特許の出願日当時の当業者の周知の技術又は技術常識から予測し得たものともいえないとし，これを本件訂正発明 1 の容易想到性を否定する根拠とした。

しかし，多くの医薬品が，光エネルギーを吸収して分解，変色することは以前より知られており，こうした分解や変色を遮光手段により抑制できることは周知の技術又は技術常識である。

そして，①アムロジピンが，ニフェジピンとともに，光に不安定なジヒドロピリジン類に属し，光により分解，変色することは周知の事項であること，②光に不安定な薬物を含む医薬品に酸化鉄を使用することは，酸化鉄の使用形態にかかわらず周知の技術であることからすると，光に不安定なジヒドロピリジン誘導体であるベシル酸アムロジピンに，その光に対する不安定性を改善する目的で酸化鉄を使用すると，光安定化効果が得られることは，当然に予想し得る範囲内のものであり，当業者の周知の技術又は技術常識となっていたことは明らかである。

(3) 本件訂正発明 3，14，18～28 の容易想到性判断の誤り

ア 本件訂正発明 3 について

本件訂正発明 3 と甲 1 発明〔原告〕とは，上記相違点 1 から 3 に加え，相違点 5 において文言上相違する。

相違点 1 から 3 については上記(2)において主張したとおり，実質的な相違点ではないか，少なくとも容易想到である。

また、相違点5は、実質的には相違点4と同様であるから、上記(2)イ(ウ)において主張したとおり、実質的な相違点ではない。

イ 本件訂正発明14、18～28について

本件訂正発明14、18～28と甲1発明〔原告〕との各相違点は、相違点1から4と実質的に同様であるから、上記(2)において主張したとおり、実質的な相違点ではないか、少なくとも容易想到である。

(4) 小括

以上によれば、本件訂正発明1、3、14、18～28は、甲1発明〔原告〕及び甲2に記載された発明並びに本件特許の出願日当時における技術常識に基づいて当業者が容易に想到できたものであるから、これに反する審決の判断は誤りである。

2 取消事由2（甲15記載の発明に基づく容易想到性判断の誤り）

(1) 甲15記載の発明の認定の誤り

ア 審決は、甲15から認定できる発明は、請求項1記載の群1及び群2を含有するものであるところ、甲15発明〔原告〕には、これらの群1及び群2が発明特定事項として含まれていないから、原告が主張する甲15発明〔原告〕は、甲15に記載された発明であるとはいえないと判断した。しかし、次のとおり、この判断は誤りである。

イ 上記1(1)において主張したところと同様に、甲15の請求項1記載の群1及び群2に列挙された成分は、いずれも本件訂正発明1の発明特定事項ではないから、甲15記載の発明の構成として認定する必要はなく、この点において審決の判断には誤りがある。

仮に、審決が指摘するこれらの事項が、甲15記載の発明の発明特定事項に該当するとしても、本件訂正発明1は、当該発明に係る経口固形組成物について、審決が指摘する成分を含有することを排除していないから、審決が指摘する事項は、容易想到性の判断に際し、本件訂正発明1との相

違点にならない。

(2) 本件訂正発明 1 の容易想到性判断の誤り

審決は、相違点 7 及び 8 に係る構成を採用することに、当業者が格別の創意を要したものとはいえないとしたものの、本件訂正発明 1 の奏する効果は、甲 1 5 の記載から予測できたものとはいえないし、また、そのような予測ができたといえるような、本件特許の出願日当時の当業者の周知の技術又は技術常識も見出せないと判断した。

しかし、本件訂正発明 1 の奏する効果は、当業者が当然に予想しうる範囲内のものであり、当業者の周知の技術又は技術常識となっていたことは、上記 1 (2) ウにおいて主張したとおりである。

そうすると、審決が判断したとおり、相違点 7 及び 8 に係る構成を採用することは、当業者にとって容易想到であるから、本件訂正発明 1 は、甲 1 5 発明〔原告〕及び本件特許の出願日当時における技術常識に基づいて当業者が容易に想到できたものである。

(3) 本件訂正発明 3, 1 4, 1 8～2 8 の容易想到性判断の誤り

本件訂正発明 3, 1 4, 1 8～2 8 と甲 1 5 発明〔原告〕の相違点は、相違点 7 及び 8 と同様であるから、上記 (2) において主張したとおり容易想到である。

(4) 小括

以上によれば、本件訂正発明 1, 3, 1 4, 1 8～2 8 は、甲 1 5 発明〔原告〕及び本件特許の出願日当時における技術常識に基づいて当業者が容易に想到できたものであるから、これに反する審決の判断は誤りである。

3 取消事由 3 (分割要件適合性についての判断の誤り)

(1) 審決は、本件当初明細書に、マンニトールは添加が好ましいとされる賦形剤の一つとして記載されているものといえるから、マンニトールを含まない場合の口腔内崩壊型錠剤も、本件当初明細書の記載内容から除外されている

わけではなく、その内容に含まれているものといえるとして、本件出願は分割要件に適合すると判断した。

(2) しかし、本件訂正発明1は、積極的にマンニトールをその構成から除外しようとするものであるのに対し、本件当初明細書には、特に好ましい賦形剤の具体例としてマンニトールが挙げられ、かつ、実施例及び比較例の全例にマンニトールが等しく添加されている。

さらに、被告は、本件原出願の審査過程で提出した平成20年6月19日付け意見書において、自ら実施した実験結果の説明として、マンニトールを含有しない組成物では変色抑制効果が認められないと述べている。これは、酸化鉄の着色防止効果につき、マンニトールを配合することによって顕著な作用・効果が生ずる、すなわち、酸化鉄とマンニトールの組合せこそが課題解決に重要な必須の構成であるとの主張にほかならない。

上記のような本件当初明細書の記載及び審査過程における被告の主張内容を踏まえると、本件原出願に係る発明に、当該発明を構成する組成物の成分からマンニトールを積極的に除外しようという技術思想が含まれていなかったことは明らかである。

したがって、本件訂正発明は、本件当初明細書に含まれない新規事項に該当し、本件出願は分割要件に違反するものであるから、これに反する審決の判断は誤りである。

(3) そして、上記分割要件違反の結果、本件出願については出願日が遡及しないから、本件訂正発明は、本件原出願との関係において、新規性及び進歩性を有しない発明というべきである。

4 取消事由4（サポート要件適合性について判断の誤り）

上記3のとおり、本件原出願に係る発明には、当該発明を構成する組成物の成分からマンニトールを積極的に除去しようという技術思想が含まれていなかった。

したがって、本件明細書の記載に接した当業者は、マンニトールが添加されていない場合においても、アムロジピンに酸化鉄を配合することで、光安定化したアムロジピン含有経口固形組成物が得られることを認識できるとは到底いえない。

よって、本件特許は、サポート要件に適合しないものであるから、これに反する審決の判断は誤りである。

5 取消事由 5（先願要件適合性についての判断の誤り）

(1) 本件原出願の特許請求の範囲の請求項 1 の記載は次のとおりである。

(a) ベシル酸アムロジピン、(b) 酸化鉄、及び(c) マンニトールを含有し、かつ被覆層を有しない経口固形組成物（但し、ベシル酸アムロジピン 1 質量部に対して酸化鉄を 0.05～8 質量部含有する医薬組成物を除く）。

(2) 被告は、本件特許の審査過程において、「本発明に用いる『炭酸カルシウム』、『結晶セルロース』、『デンプン』は、製剤素材としては、一般にアミノ化合物および酸化鉄には反応しない不活性な成分と知られて」いるとか、「当業者であれば、本発明の実施例において、マンニトールに代えて、…同様に不活性な『炭酸カルシウム』、『結晶セルロース』を既に実施例で配合され、不活性であることが明白な『デンプン』と共に使用しても、これらが酸化鉄に対して作用を阻害するとは到底想定できない」と主張していた。この被告の主張を前提とすると、本件明細書記載のマンニトールは、デンプン、炭酸カルシウム及び結晶セルロース等と同様に不活性な添加剤の一つであるということになる。

本件訂正発明は、本件原出願に係る発明におけるマンニトールを結晶セルロース等に代え、所定量のデンプンを含むことを必須とするものであるところ、上記の被告の主張を踏まえると、本件原出願に係る発明におけるマンニトールを結晶セルロース等及び所定量のデンプンに置換することは、不活性な添加剤を単に置換するもの、すなわち単なる周知慣用技術の転換にすぎない

い。そして、本件訂正発明と本件原出願に係る発明の効果は同一であるから、結局、両発明は同一のものである。

- (3) したがって、本件出願は、本件原出願の請求項1に係る発明との関係で、先願要件に適合しないことが明らかであるから、これに反する審決の判断は誤りである。

第4 被告の反論

1 取消事由1（甲1記載の発明に基づく容易想到性判断の誤り）について

(1) 甲1記載の発明の認定について

発明の進歩性判断においては、引用発明を出発点として相違点の容易想到性を判断するから、引用発明を認定する際には、ひとまとまりの技術思想として把握すべきであり、一体となっている構成の中から一部のみを取り上げて認定することは適切でない。

本件についてみると、甲1は、ノルバスク錠という特定の医薬品の医薬品インタビューフォームで、特定成分と所定量からなる当該医薬品自体が開示されているものであって、それ以外のものは開示されていない。すなわち、甲1記載の組成物は、特定の複数成分が一体となって製剤を形成し、所定の薬効を発揮しているものであるから、一部の成分のみを選択して認定すると、ひとまとまりの技術思想として把握したものとはいえない上に、そのような認定は、甲1の開示を超えた認定や甲1の開示から一般化した認定となり、許されない。

さらに敷衍すると、甲1には、1錠中の含有量も所定のものしか開示されておらず（ベシル酸アムロジピンとして3.47mg又は6.93mg）、添加物も特定のものしか開示がないから、本件訂正発明の発明特定事項である「(a) ベシル酸アムロジピン」を含有することに相当する、甲1に開示されている事項を客観的、具体的に認定する際には、ベシル酸アムロジピンとして3.47mg又は6.93mg含有するものと認定すべきであって、

含有量を伴わない認定は、甲1の開示を超えたものとなり許されない。添加物についても同様である。

したがって、審決は、甲1に開示されている発明を客観的かつ具体的に、正確に認定しており、何ら誤りはない。

原告の主張は、ノルバスク錠という特定の医薬品に基づいて引用発明を認定しているという事情を見落とし、甲1の開示を超えた認定や、甲1に記載のないものへ一般化を図ろうとするものであり、失当である。

(2) 本件訂正発明1の容易想到性判断の誤りについて

ア 相違点1について

(ア) 甲1の記載内容について

a 原告が指摘する甲1の記載は、ベシル酸アムロジピンが光に不安定な医薬成分であることを示すものとまではいえない。すなわち、「わずかに黄色化」は、熱、湿度の苛酷試験でも同様に観察されているから、光に対する問題があると特に認識するものとはいえない。また、「わずかに分解物Iのスポットを認めた」との記載も、この分解物Iは、長期保存試験では認められないものであるから、検討を要しない程度であると理解できる。分割錠については、「分解物のスポットを認めず」とされているから、分割錠の「分割面がわずかに淡黄色に着色」したとしても光安定性が問題となる程ではないと理解できる。

そうすると、甲1に接した当業者は、甲1の記載から、アムロジピンには光に対する安定性の問題があると認識するとはいえない。

b また、甲1は医薬品インタビューフォームであって、医薬品に関する情報を医療従事者等に適切に提供するためのものであることは、原告が指摘するとおりである。そして、2003年8月付けのノルバスク錠に係る医薬品インタビューフォームの15頁に、製剤に関する安定性の評価結果が示されているところ、室内散光（500ルクス）で

6か月保存との条件下での光に対する苛酷試験では、外観変化はなく、分解物も認められていないことが明記されている。

ところで、医薬品の技術分野においては、当業者は原体自体よりも専ら製剤の安定性を問題とする。上記医薬品インタビューフォームの記載は、フィルムコーティングを施した製剤は、外観変化もなく分解もしないことを示すものであるから、医薬品に関する情報との観点からみれば、これこそが医療従事者等にとって重要な情報である。

c さらに、原告は、一包化調剤における問題について主張するが失当である。すなわち、一包化調剤の際にはPTP包装や瓶詰された錠剤を取り出して調剤するから、光、温度、湿度などへの影響を考慮すると、長期にわたる日数分の一包化調剤は、いかなる薬剤についても想定できない。

また、上記のとおり、ノルバスク錠は、6か月にわたる光に対する苛酷試験で外観変化も分解物も認められない、極めて安定なものであるから、仮に90日処方が一包化されたとしても何の問題も生じない。

d したがって、審決が、甲1にはベシル酸アムロジピンが光に対して不安定な薬物であるとの記載は見出せないと認定したことや、甲1記載の発明に、光に不安定な薬物に関する甲2記載の発明を組み合わせる動機付けがないと認定したことに、何ら誤りはない。

(イ) アムロジピンの光に対する不安定性についての課題が周知のものであったとの主張について

a 本件において問題となるのは、主引用例である甲1から認定された引用発明を出発点として本件訂正発明に至ることの容易想到性であるところ、甲1発明は、所定の成分を含有しフィルムコートされた製剤であって、原体としてのアムロジピンではない。したがって、問題とすべきなのは、原体であるアムロジピンについての課題ではなく、ア

ムロジピンを含有する製剤についての課題が周知のものであるか否かである。

しかし、原告が指摘する文献は、いずれも原体としてのアムロジピンに関するもので、アムロジピン製剤の課題について言及するものではない。

また、原告は、ノルバスク錠を粉砕した後の光安定性試験で光分解物が認められる旨の記載がある文献を指摘する。しかし、これは一包化調製時に錠剤を粉砕した場合を想定した試験であるところ、錠剤を包装から取り出して粉砕することは、医薬品の包装設計、製剤設計を破壊する行為であり、錠剤の通常の使用形態でないのは明らかであるから、この記載からノルバスク錠自体が光に不安定であるとはいえない。

したがって、甲1記載の発明を主引用発明とする進歩性判断において、光に対する不安定性という課題が入り込む余地は全くない。

b なお、本件特許の出願日当時、アムロジピンが光により分解され得ること、分解されると酸化体になることは知られていたものの、アムロジピンが光により変色するという課題は認識されていなかった。また、そもそも分解と変色とは異なる現象であるから、同列に扱うことはできない。

したがって、本件特許の出願日当時、ベシル酸アムロジピンの光に起因した変色が当業者に認識されていたとまではいえないし、ましてやそれが課題として周知であったとは到底いえない。

(ウ) 光に対する不安定性を有する医薬品の課題解決のために酸化鉄を用いることが周知技術又は技術常識であったとの主張について

当業者が「光に対する不安定性」として認識していた課題は、専ら光分解に起因するものであって、光による変色という課題の解決のために

酸化鉄を用いることは、周知技術又は技術常識ではなかった。また、酸化鉄は、着色剤であるとともに遮光剤としても知られていたところ、酸化鉄を遮光剤として使用する場合は、コーティング層を有する錠剤のコーティング層中に配合するというのが、最も一般的な方法であり、当業者における周知技術又は技術常識であった。

(エ) 小括

以上のとおり、甲1には、甲1記載の製剤に関する光に対する不安定性との課題は全く示されていない。また、甲1記載の製剤は、フィルムコーティングにより光安定性の問題が完全に解消されているものであるから、甲1記載の発明において、光に対する不安定性との課題は存在しない。

したがって、原告の主張は失当である。

イ 相違点2及び3について

医薬品の製剤設計においては、添加物といえども所定の目的に適ったものが選択されるのであり、添加物であれば何でも置き換えて使用できるというものではない。とりわけ、「カルボキシメチルスターチナトリウム」は“スーパー崩壊剤 (super disintegrant)”と呼ばれ、崩壊力に優れたもので、通常崩壊剤である「デンプン」とは異なる。そうすると、「デンプン」と「カルボキシメチルスターチナトリウム」とが、いずれも崩壊剤に分類されるからといって、フィルムコーティング錠である甲1記載の発明を、被覆層を有しない錠剤に変更した上で、「カルボキシメチルスターチナトリウム」を「デンプン」に置き換え、しかも、その量を「30重量%以下」とすることが単なる設計変更にすぎないとはいえない。

また、甲1は、フィルムコーティング錠であるノルバスク錠という特定の医薬品を説明する文書であるから、上記置換が容易に想到できるか否かは、当該製剤において崩壊剤を変更すべき事情が存在するか否かや、被覆

層を有しない錠剤に変更した場合に崩壊剤を変更すべき事情があるか否かという点から検討されなければならないところ、甲1に接した当業者において、そのような置換の動機付けとなる事情は何ら存在しない。

したがって、甲1記載の発明を主引用発明として、「カルボキシメチルスターチナトリウム」を「デンプン」に置き換え、かつ、その使用量を30%以下とする動機付けは全く存在しないというべきであるから、実質的な相違点ではないとの原告の主張は失当である。

ウ 相違点4について

(ア) 製剤との観点からみて、甲1記載の医薬品の特徴は、フィルムコーティング錠であるということである。

甲1の記載は、フィルムコーティング錠であることを前提に、臨床試験、薬効、安全性の評価、製剤学的な検討などを経てされているものであるから、甲1には、この製剤から被覆層を有しないものに変更するという事自体、開示も示唆もない。

したがって、甲1記載の製剤から被覆層を除去してフィルムコーティング錠でないものに変更すると、それはもはや甲1記載の製剤とはいえず、いわばその技術思想自体を否定するものであるから、かかる変更には明らかな阻害要因がある。

(イ) また、本件特許の出願日当時の技術水準に照らすと、ジヒドロピリジン系カルシウム拮抗薬であるアムロジピンは、ジヒドロピリジン系化合物の中では光分解されにくい化合物ではあるものの、曝光量が多い場合には分解され、活性物質としての効力が低下することがあるため、アムロジピン含有経口固形組成物には光に対する安定性を確保するための技術が必要とされていた。そして、甲1記載の製剤においては、被覆層を設けるフィルムコーティング錠とすることで、この問題を解決していた。

これに対し、本件訂正発明は、酸化鉄を配合することで、光安定化の

ために被覆層を設けることなく光安定化されたアムロジピン含有経口固形組成物が得られること、そして、その技術を応用して被覆層のない口腔内崩壊型製剤としても使用できることを見出したものである。

原告の主張は、口腔内崩壊錠とするには、錠剤の表面に被覆層を設けないのが一般的であるから、被覆層を有するか有しないかという相違点4は実質的な相違点ではないとの論理に基づくものであるが、肝心の光安定性の問題は全く検討されておらず、失当である。

(ウ) また、アムロジピンは苦味のある成分であり、フィルムコーティングを設けないと苦味の問題が生じる。その問題の解消には、多大な技術的検討が必要であり、アムロジピン製剤の苦味の課題を解決するための特許出願がされ、特許されている例もある。

さらに、フィルムコーティングを外すことで薬剤の溶出挙動が変動するから、その解決のために発明に値する程の技術的検討が必要となる。

(エ) 原告は、薬剤を嚥下することが困難な患者、高齢者及び小児のために、被覆層を有するフィルムコーティング錠を、被覆層を有しない口腔内崩壊錠にすることは、当業者における周知の技術又は技術常識であったと主張する。

確かに、原告が指摘する患者等にとって、口腔内崩壊錠は便利なものであるかもしれないが、そうであるからといって、錠剤の剤形を口腔内崩壊錠にすることが、本件特許の出願日当時、当業者にとって周知の技術又は技術常識であったとは到底いえない。

また、甲1記載のノルバスク錠2.5mgの形態は、直径6.0mmの円形錠剤、ノルバスク錠5mgの形態は、直径8.0mmの円形錠剤である。一般に高齢者が服用しやすい錠剤の大きさは、直径7～8mm程度、あるいは錠径 6 ± 2 mm程度とされているから、ノルバスク錠は、高齢者にとっても飲みやすく、摘まみやすい大きさで、服用しやすい最

適な錠剤であるといえる。これに対し、本件特許の出願日当時、ノルバスク錠の剤形では服用が困難であり、剤形変更が特に必要であったという特段の事情はうかがわれない。そして、ノルバスク錠について、小児への適用が承認されたのは、平成24年6月であり、平成19年の本件出願から7年も経った後のことであるから、小児が服用する観点からの主張は根拠とならない

エ 本件訂正発明1の奏する効果について

原告は、多くの医薬品が、光エネルギーを吸収して分解、変色することは以前より知られていると主張するが、単なる一般文献の記載の指摘にとどまるものである。また、原告が提出した証拠によっても、少なくともアムロジピンの光による変色が周知の事項であったとはいえない。

すなわち、本件訂正発明1の特徴的な効果である変色の抑制に関する原告の主張は、いずれも証拠に基づかないものであり、失当である。

オ 小括

したがって、当業者は甲1記載の発明に基づいて、本件訂正発明1を容易に想到することができない。

(3) 本件訂正発明3, 14, 18~28の容易想到性判断の誤りについて

ア 本件訂正発明3, 14, 18~28についても、上記(2)において本件訂正発明1について主張したところと同様である。

イ 本件訂正発明14, 18~28について

本件訂正発明1は「経口固形組成物」に関するものであるのに対し、本件訂正発明14, 18~28は「使用」に関するものであるから、前者と後者とはこの点において構成上異なる。

また、審決は認定していないものの、本件訂正発明14と甲1発明〔原告〕は、相違点1~4に加えて、次の相違点を有する。本件訂正発明14を引用する本件訂正発明18~28についても同様である。

<相違点 1 4 - 1>

本件訂正発明 1 4 が「経口固形組成物の調製における、光による変色が抑制された組成物とするための酸化鉄の使用」であるのに対し、甲 1 発明〔原告〕には光による変色が抑制された組成物とするための酸化鉄の使用がない点。

<相違点 1 4 - 2>

本件訂正発明 1 4 が「請求項 2 及び 4 ～ 1 0 に係る経口固形組成物」の調製に関するものであるのに対し、甲 1 発明〔原告〕は請求項 2 及び 4 ～ 1 0 で規定する成分を含むものではない点。

そして、相違点 1 4 - 1 及び 1 4 - 2 に係る構成は、当業者が容易に想到できたものではない。

(4) 小括

以上によれば、この点についての審決の判断に誤りはない。

2 取消事由 2（甲 1 5 記載の発明に基づく進歩性判断の誤り）について

(1) 甲 1 5 記載の発明の認定について

甲 1 5 記載の発明は、活性成分の溶出挙動及び吸収挙動の調整という特有な課題を解決するために、添加剤成分と製剤形態に着目してされた発明であり、群 1 と群 2 という 2 種の整粒物を調製し、更に各種添加剤と混合して錠剤にする、という特有な製剤形態にすることで、所望の効果を得たものである。そうすると、これらの特徴的要素である群 1 と群 2 とを悉く欠落させて甲 1 5 記載の発明として認定したのでは、甲 1 5 の開示に基づいて一体となった技術思想としての発明を認定したことにはならない。

したがって、甲 1 5 に甲 1 5 発明〔原告〕が記載されているとの原告の主張は誤りである。

(2) 本件訂正発明 1 についての容易想到性判断の誤りに関する主張について

ア 審決は、甲 1 5 に甲 1 5 発明〔原告〕が記載されていると仮定して、本

件訂正発明 1 と甲 1 5 発明〔原告〕との間に相違点 7 及び 8 が存在すると
して容易想到性を検討し、相違点 7 及び 8 について、当業者が格別の創意
を要したものとはいえないと判断した。

しかし、甲 1 5 記載の発明は、同じ活性成分について、速崩壊性固形製
剤でない製剤と同じ溶出挙動及び吸収挙動を示す速崩壊性固形製剤を提供
することを課題とするものであって、審決が認定したように、群 1 及び群
2 を含有するとの前提において初めて成立するものである。そうすると、
相違点 7 及び 8 に係る構成の容易想到性の検討は、群 1 及び群 2 を含有し、
塩酸マニジピンを含有する製剤に代えて、群 1 及び群 2 の含有を必須とし
ないが活性成分としてベシル酸アムロジピンを含有する製剤とすることに
ついてされるべきである。

したがって、甲 1 5 に甲 1 5 発明〔原告〕が記載されていると仮定して
された相違点 7 及び 8 についての審決の判断は誤りである。

イ 相違点 7 について

上記アのとおり、相違点 7 に係る構成の容易想到性判断は、群 1 及び群
2 を含有し塩酸マニジピンを含有する製剤に代えて、群 1 及び群 2 の含有
を必須としないがベシル酸アムロジピンを含有する製剤とすることを容易
に想到できるか否かで判断すべきである。

そして、当業者は、甲 1 5 の段落【0005】記載の膨大な化合物群の
中からベシル酸アムロジピンを選択、採用することは容易でないから、当
業者は相違点 7 に係る構成を容易に想到することができない。

ウ 相違点 8 について

相違点 7 と同様に、相違点 8 に係る構成の容易想到性判断は、群 1 及び
群 2 を含有し、塩酸マニジピンと D-マンニトールを含有する製剤に代え
て、群 1 及び群 2 の含有を必須としないがベシル酸アムロジピンを含有し、
D-マンニトールを含有しない製剤とすることを容易に想到できるか否か

で判断すべきである。

D-マンニトールは、甲15記載の発明の特徴的な構成である群1及び群2を構成し、発明の課題である同じ活性成分を含有する市販品と同じ溶出挙動及び吸収挙動を示す速崩壊性固形製剤にするための重要な成分であるといえる。そして、甲15発明〔原告〕から出発して、群1及び群2の含有を必須としないがベシル酸アムロジピンを含有する製剤とし、しかも甲15発明〔原告〕では課題とされていない光安定化（着色抑制）を課題とした場合に、D-マンニトールを全く含有しない構成とすることの動機付けとなり得る事情は存在しない。

したがって、当業者は相違点8に係る構成を容易に想到することができない。

エ 甲15記載の発明における群1及び群2を含有する構成について

原告は、群1及び群2が甲15記載の発明の発明特定事項に該当するとしても、本件訂正発明1は、それらの成分を含有することを排除していないから、本件訂正発明1との相違点にはなり得ないと主張する。

しかし、甲15記載の発明は、群1及び群2を含有し、群1及び群2の一方又は両方に溶出補助剤を含有することで、所望の崩壊性、溶出調節性及び製造性を達成した製剤とすることを特徴とする発明である。これに対し、本件訂正発明1では、群1及び群2という構成が必須とされていないだけでなく、そこで使用される成分も必須のものではない。そうすると、一方では必須とする構成を、他方では必須としないという点で明確な相違点が存在する。

そして、このような特有な構成を特徴とする甲15記載の発明を出発点として、それらを必須としない本件訂正発明1に至ることができるのは、当該甲15記載の発明を否定することにほかならないから、明白な阻害要因が存在するといえるべきである。

オ 本件訂正発明 1 の奏する効果について

審決は、甲 1 5 に接した当業者において、本件訂正発明 1 がベシル酸アムロジピンの光安定化という効果を奏し得ることを甲 1 5 の記載から予測できたとはいえないし、そのような予測ができたといえるような、本件特許の出願日当時の当業者の周知の技術又は技術常識も見出せないと判断した。

上記(1)のとおり、甲 1 5 記載の発明の課題は、活性成分の溶出挙動及び吸収挙動であって、光安定化ではないことからすると、この審決の判断は正当である。

カ 小括

したがって、当業者は甲 1 5 記載の発明に基づいて、本件訂正発明 1 を容易に想到することができない。

(3) 本件訂正発明 3, 1 4, 1 8 ~ 2 8 についての容易想到性判断の誤りに関する主張について

本件訂正発明 1 について主張したところと同様である。

(4) 小括

以上によれば、この点についての審決の判断は、結論において誤りはない。

3 取消事由 3 (分割要件適合性についての判断の誤り) について

(1) 本件当初明細書の記載について

本件当初明細書の実施例及び比較例では、いずれもマンニトールを含む組成物を用いているが、これは試験対象とした各種添加剤の光安定性の効果を客観的に対比、評価できるように、添加剤以外の成分の条件を揃えたためである。また、本件当初明細書には、マンニトールは水溶性糖アルコールの一つであって、好ましいものの例として記載されているにすぎず、マンニトール以外の成分の使用を排除していない。このことは、本件当初明細書に、好ましい水溶性糖アルコールとして、キシリトール、エリスリトールなどが挙

げられているほか、水溶性糖アルコール自体が好適な成分として記載されていることから明らかである。

(2) 本件原出願の審査過程における被告の主張について

本件原出願の審査過程において、平成20年4月21日付け（発送）で進歩性欠如の拒絶理由が通知されたことを受けて、被告が、特許請求の範囲を補正するとともに、同年6月19日付けの意見書により、賦形剤としてマンニトールを使用する態様において着色防止効果が優れているとの主張をしたことは認める。しかし、被告は、マンニトール以外の成分の使用を排除するとの主張は何ら行っていない。

また、明細書に記載された発明の範囲は、当該明細書の記載及び出願時の技術常識などを考慮して客観的に把握すべきものであって、出願人が、審査過程において、補正に伴い何らかの有利な効果を主張したとしても、それにより何らかの影響を受けることはない。したがって、本件原出願の審査過程における被告の主張を問題とする原告の指摘は、それ自体失当である。

さらに、原告は、本件原出願に係る発明には、当該発明を構成する組成物の成分からマンニトールを積極的に除去しようとする技術思想自体が含まれていなかったなどと主張する。この主張は、本件訂正発明に「(但し、マンニトールを含まない組成物である)」とのただし書の規定があることを根拠とするものであるところ、この表現は、マンニトールの含有を必須の要件とする本件原出願に係る特許とのダブルパテントを解消するために用いられる一般的なものにすぎず、この規定の存在により本件原出願の技術思想が何らかの影響を受けることはない。

(3) 小括

したがって、この点についての原告の主張はいずれも失当である。

4 取消事由4（サポート要件適合性について判断の誤り）について

(1) 本件明細書の実施例及び比較例の記載について

上記3(1)において主張したところと同様に、本件明細書においては、マンニトールは添加が好ましい賦形剤の一つとして使用されているにすぎない。

そもそも、サポート要件適合性は、請求項に係る発明が、発明の詳細な説明において発明の課題が解決できることを当業者が認識できるように記載された範囲を超えるものであるか否かによって判断されるべきであって、明細書の実施例及び比較例の記載のみに基づいて判断されるものではないから、原告の主張は前提において失当である。

また、本件訂正発明の課題は、被覆層を有しない製剤形態においても、アムロジピンの光による変色及び分解を簡便に防止することにあるところ、マンニトールを含む無毒性かつ不活性な賦形剤及び添加剤は、酸化鉄の作用に影響を与えない。

したがって、本件明細書には、実施例及び比較例の具体例として、マンニトールを含有しない製剤の記載はないものの、請求項の記載は、発明の詳細な説明において発明の課題が解決できることを当業者が認識できるように記載された範囲を超えるものではない。

(2) 本件原出願の審査過程での被告の主張について

上記3(2)において主張したとおりである。

(3) 小括

したがって、この点についての原告の主張はいずれも失当である。

5 取消事由5（先願要件適合性についての判断の誤り）について

(1) 原告が主張する本件原出願に係る特許請求の範囲の請求項1の記載は認める。

(2) しかし、本件訂正発明1と本件原出願の請求項1に係る発明とは、次の点において相違する。

<相違点A>

本件訂正発明1では、「マンニトールを含まない組成物」であるのに対

し、本件原出願に係る発明では、「マンニトールを含有する組成物」である点。

〈相違点B〉

本件訂正発明1では、「炭酸カルシウム及び結晶セルロースからなる群より選ばれる少なくとも一つの賦形剤と、デンプンを30重量%以下含有する」のに対し、本件原出願に係る発明では、そのような限定がない点。

〈相違点C〉

本件訂正発明1では、酸化鉄の量についての制限がないのに対し、本件原出願に係る発明では、「ベシル酸アムロジピン1質量部に対して酸化鉄を0.05～8質量部含有する医薬組成物」が除かれている点。

(3) 相違点Aにつき、本件原出願に係る発明では、マンニトールを含有するのに対し、本件訂正発明1では、マンニトールを含む組成物が除かれているから、この点で両発明は同一といえない。

相違点Bにつき、本件訂正発明1では、炭酸カルシウム及び結晶セルロースからなる群より選ばれる少なくとも一つの賦形剤と、更にデンプンを30重量%以下含有するのに対し、本件原出願に係る発明ではこのような限定がないから、この点で両発明は同一といえない。

相違点Cにつき、本件原出願に係る発明では、酸化鉄の量についての制限があるから、両発明は、少なくともベシル酸アムロジピン1質量部に対して酸化鉄を0.05～8質量部含有するとの範囲において重複していない。

(4) したがって、両発明は同一でないから、原告の主張は失当である。

第5 当裁判所の判断

1 本件訂正発明について

(1) 特許請求の範囲

本件訂正発明の特許請求の範囲は、上記第2の2に記載のとおりである。

(2) 本件明細書の記載内容

本件明細書には、概ね以下の記載がある（甲30）。

ア 技術分野

【0001】本発明はアムロジピンを含有する光安定性の向上した経口固形組成物及び製剤に関する。

イ 背景技術

【0002】ジヒドロピリジン系カルシウム拮抗薬であるアムロジピンは充分かつ恒常的な血管拡張作用と頻脈をきたし難い性質から、降圧療法の中心的な役割を果たしている。しかし、アムロジピンはジヒドロピリジン系化合物の中では光分解を受けにくい化合物ではあるが、曝光量が多い場合には分解を受け、活性物質としての効力が低下することがある。このため、アムロジピン含有経口固形組成物には光に対する安定性を確保するための技術が必要であった。

従来、光に対して不安定な薬物の製剤化に関しては、薬物の安定化を図るため種々の方法が知られている。例えば、特許文献1（判決注：特開昭55-22645号公報）には皮膜中に着色剤を分散した軟カプセルに光に不安定な薬物であるニフェジピンを封入した光による分解や変質を防止したニフェジピンの軟カプセルが開示されている。また、特許文献2（判決注：特開平4-46122号公報）にはタール系色素やベンガラ等を含有する硬カプセルにより活性型ビタミンD3類を安定化したカプセル製剤が開示されている。これらの技術はいずれも光に不安定な薬物を覆うカプセル皮膜中に着色剤を含有させたものであり、錠剤、顆粒剤、細粒剤、散剤等への適用は困難である。

【0003】一方、特許文献3（判決注：特開2003-104888号公報）にはジヒドロピリジン誘導体の錠剤に酸化鉄を配合したフィルムをコーティングしてなる光に対して安定化された錠剤が開示されている。しかしながら、この技術ではコーティングを実施することで工程が増え、こ

れに要する時間及び労力は多大となり、コストが高くなる。また、分割を必要とする錠剤ではコーティングによって割線が埋まるなどのトラブルが発生しやすく、分割後には分割面が剥き出しになる為光安定化効果は期待出来ない。更に何らかの理由でコーティングを施すことが出来ない製剤には応用できない。例えば、口腔内崩壊型製剤では、製剤全体にコーティングを施した場合には、口腔内での速崩壊性、速溶解性が損なわれ、その機能を発現できない。また、製剤中の原薬あるいは原薬を含有する粒子のみをコーティングすることで、製剤としては速崩壊性を保持させることは可能であるが、この場合口腔内でそれらコーティングされた製剤の一部が崩壊、溶解しないことから著しく服用し難くなることが予想される。また、特許文献4（判決注：特開2003-104887号公報）には遮光剤として酸化チタン並びに着色剤として食用黄色5号、三二酸化鉄、黄色三二酸化鉄を含有する光に安定なピリジン系化合物について開示されている。しかしこの文献で実際に開示されているのはアラニジピンを適切な賦形剤により固体分散化した製剤に着色剤及び遮光剤を含むコート液をスプレーすることを特徴とするものであるから、結局この文献も実質的には被覆層を有する製剤を開示するものである…。

【0004】コーティングを施さない錠剤、顆粒剤、細粒剤、散剤等の光安定化方法としては、特許文献5（判決注：特開2000-7583号公報）に光に不安定な脂溶性薬物に黄色及び赤色の着色剤から選ばれる1種以上の物質を配合してなる光安定性の向上した組成物が開示されている。また、特許文献6（判決注：特開2000-191516号公報）には光に不安定な薬物を含有した粉体に着色剤を添加し、湿式造粒してなる経口固形組成物が開示されている。さらに、非特許文献1（判決注：インターナショナル・ジャーナル・オブ・ファーマシューティクス(International Journal of Pharmaceutics), 103(1994)69-76) にはニフェジピンに黄色三

二酸化鉄を添加した際に光によって生じる酸化体の生成量の抑制及び主薬含量の低下の抑制ができたことが記載されている。しかしながら、これら文献にはアムロジピンに関する記載はない。

ウ 発明が解決しようとする課題

【0007】本発明が解決しようとする課題は、アムロジピンまたはその薬学上許容される塩の光による変色及び分解を簡便に防止し、光安定化した経口固形組成物を提供することである。

エ 課題を解決するための手段

【0008】アムロジピンはジヒドロピリジン系化合物としては光安定性が高いため、通常医薬品として使用する範囲での含量低下はほとんど問題とならない。本発明者らは、ニフェジピンとは異なり、アムロジピンにおいては光によって含量低下が検出されない範囲で変色が見られることに着目し、この着色の防止を課題とした。上記非特許文献1には変色については一切記載がないから、当然このような課題そのものの記載も示唆もない。同文献が課題としているのはニフェジピン錠剤を400フットカンデラの光を14日照射すると45%も分解物が生成することを改善することである。一方後述する試験例に示したようにアムロジピン錠剤での酸化体生成は1%程度であるから、分解の程度が全く異なる。従ってアムロジピンに於ける主な課題は着色の防止であり、ニフェジピンに於ける主な課題である含量低下とは全く異なった現象であることが明らかとなった。

【0012】本発明者らは鋭意検討を行った結果、アムロジピンまたはその薬学上許容される塩に酸化鉄を配合することで、光安定化のために被覆層を必要とすることなく非常に簡便に光安定化されたアムロジピン含有経口固形組成物が得られることを見出した。また当該技術の応用により、アムロジピンまたはその薬学上許容される塩に酸化鉄を配合することで、非常に簡便に、服用性に優れた口腔内崩壊型製剤の光安定化ができることを

見出し，本発明を完成した。

オ 発明の効果

【0014】本発明によって，非常に簡便に光に安定なアムロジピン含有の経口経口固形組成物（判決注：原文のまま）を提供することが可能である。また，これによってコーティングを施すことが出来ないアムロジピンの口腔内崩壊錠等の易服用性製剤の光安定化による品質維持が可能となり，高齢者等の嚥下困難な患者や多忙な社会生活を送る人々がどのような場面においても容易に服用することが可能な，光に対して安定なアムロジピン経口固形組成物を提供できる。

カ 発明を実施するための形態

【0015】アムロジピンの薬学上許容される塩としては，…ベンゼンスルホン酸…との塩が挙げられる。好ましくはベンゼンスルホン酸との塩，即ちベシル酸アムロジピンが挙げられる。

【0019】本発明における経口固形組成物としては，ゼリー剤，グミ剤，ドライシロップ，散剤，細粒剤，顆粒剤等の粒状製剤，錠剤，チュアブル製剤，口腔内崩壊型製剤等の剤形の製剤が挙げられる。…さらに好ましくは口腔内崩壊型製剤が，特に好ましくは口腔内崩壊錠が挙げられる。

【0020】本発明における被覆層とは直接経口投与される単位の最も外側を覆う層であり，PTPシート等の包装は含まない。

具体的には例えば主薬，賦形剤，崩壊剤，結合剤等を乾式造粒または湿式造粒等し，必要に応じて打錠等の成形をして得られる経口固形組成物にフィルム形成性の高分子溶液を噴霧，乾燥するなどして当該経口固形組成物の外側に施す当該経口固形組成物とは異なる組成で形成される外層が挙げられる。フィルム形成性高分子溶液には，通常フィルム形成を阻害しない範囲で各種添加剤が添加される。コーティングとはこのような被覆層の形成を指す。

その他の被覆層としては軟カプセルや硬カプセル等のカプセルが挙げられる。

【0022】本発明における口腔内崩壊型製剤とは、水なしで口腔内において速やかに溶解又は崩壊させて服用可能で、通常の製剤と同様に水とともに服用することも可能な製剤である。剤型としては散剤、細粒剤、顆粒剤等の粒状製剤と錠剤が挙げられる。…

本発明における口腔内崩壊型製剤においては、服用性の観点から賦形剤として水溶性賦形剤の添加が好ましい。水溶性賦形剤としては、服用の際良好な甘味を有する水溶性糖アルコール、糖類、甘味を有するアミノ酸類及びこれらの混合物が挙げられ、好ましくは水溶性糖アルコール、糖類、グリシン及びこれらの混合物が挙げられ、特に好ましくは水溶性糖アルコールが挙げられる。

【0023】…水溶性糖アルコールの例としてはソルビトール、マンニトール、マルチトール、還元澱粉糖化物、キシリトール、還元パラチノース、エリスリトールなどが挙げられ、これらはその2種以上を適宜の割合で混合して用いてもよい。好ましい水溶性糖アルコールとしてはマンニトール、キシリトール、エリスリトールが挙げられ、さらに好ましくはマンニトール、エリスリトールが挙げられ、特に好ましくはマンニトールが挙げられる。…

【0024】本発明における口腔内崩壊型製剤においては、特に崩壊性の観点から崩壊剤を含有することが好ましい。崩壊剤としては例えば、デンプン、…カルボキシメチルセルロースナトリウム、…低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、カルボキシメチルスターチナトリウム、…が挙げられ、これらはその2種以上を適宜の割合で混合して用いてもよい。好ましくはデンプン、…低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、カルボキシメチルスターチナトリウム、…が挙げられる。より好ましくはデンプン、低

置換度ヒドロキシプロピルセルロース，カルボキシメチルスターチナトリウム，…が挙げられ，さらに好ましくはデンプン，低置換度ヒドロキシプロピルセルロースが挙げられる。特に好ましくはデンプンが挙げられる。

【0025】本発明におけるデンプンとは医薬品に使用可能なあらゆる天然のデンプンに由来するすべてのデンプンを含む。例えば，…好ましくはトウモロコシデンプンが挙げられる。これらのデンプンの含有量としては例えば，1～50重量%，好ましくは2～30重量%，より好ましくは3～20重量%，さらに好ましくは5～15重量%配合する。

【0026】本発明における口腔内崩壊型製剤においては，結合剤は特に限定されないが，デンプン…等が挙げられる。崩壊性の観点からは実質的にデンプン以外は使用しないことが望ましい。実質的には，当該口腔内崩壊型製剤，特に口腔内での溶解または崩壊速度，および本発明の光安定化効果に影響を与えない量であればその他結合剤の配合を許容することを意味する。

【0027】本発明の経口固形組成物においては上記成分以外に，製剤分野において通常使用される無毒性かつ不活性な添加剤を添加することもできる。これらの添加剤としては，実質的に本発明の効果に影響を与えず，一般に医薬品添加剤として添加されるものが挙げられる。例えば，乳糖，トウモロコシデンプン，マンニトール，キシリトール，ソルビトール，エリスリトール，グリシン，タルク，カオリン，リン酸水素カルシウム，硫酸カルシウム，炭酸カルシウム，結晶セルロース等の賦形剤，ステアリン酸，ステアリン酸マグネシウム，ステアリン酸カルシウム，フマル酸ステアリルナトリウム等の滑沢剤，カルボキシメチルセルロースカルシウム，低置換度ヒドロキシプロピルセルロース，カルボキシメチルスターチナトリウム，クロスカルメロースナトリウム等の崩壊剤，ヒドロキシプロピルセルロース，ヒドロキシプロピルメチルセルロース，ポリビニルピロリド

ン、ゼラチン、メチルセルロース、アラビアゴム末、ポリビニルアルコール、アルキルヒドロキシエチルセルロース等の結合剤、その他着色剤、矯味剤、香料、吸着剤、防腐剤、安定化剤、湿潤剤、帯電防止剤、pH調整剤等が挙げられる。

キ 実施例

【0033】【表1】

| 組成 | 実施例1 | 実施例2 | 実施例3 | 比較例1 | 比較例2 | 比較例3 | 比較例4 | 比較例5 | 比較例6 | 比較例7 | 比較例8 |
|--------------------------------------|------|------|------|------|------|------|------|------|------|------|------|
| ペシ酸アロジピン | 7 | 7 | 7 | 7 | 7 | 7 | 7 | 7 | 7 | 7 | 7 |
| マンitol ¹ | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 |
| トキロシタン ² | 11 | 11 | 11 | 11 | 11 | 11 | 11 | 11 | 11 | 11 | 11 |
| アム酸ステアリル ³ | 2 | 2 | 2 | 2 | 2 | 2 | 2 | 2 | 2 | 2 | 2 |
| 黄色三酸化鉄 ⁴ | 0.12 | 1.2 | — | — | — | — | — | — | — | — | — |
| 三酸化鉄 ⁵ | — | — | 0.12 | — | — | — | — | — | — | — | — |
| 酸化チタン ⁶ | — | — | — | — | 1.2 | — | — | — | — | — | — |
| ブチル ⁷ キアノール ⁷ | — | — | — | — | — | 1.2 | — | — | — | — | — |
| ジブチル ⁸ ロキソリン ⁸ | — | — | — | — | — | — | 1.2 | — | — | — | — |
| 食用黄色5号 ⁹ | — | — | — | — | — | — | — | 0.12 | — | — | — |
| 食用黄色5号アルミニウム ¹⁰ | — | — | — | — | — | — | — | — | 1.2 | — | — |
| 食用赤色3号 ¹¹ | — | — | — | — | — | — | — | — | — | 0.12 | — |
| 食用赤色102号 ¹² | — | — | — | — | — | — | — | — | — | — | 0.12 |

【0035】【表2】

| 試料 | 直後 | | 4000ルクス×14日後 | |
|------|-------|---------|-------------------------|---------|
| | 外観(色) | 酸化体量(%) | 外観(色) | 酸化体量(%) |
| 実施例1 | 微黄色 | 0.0 | ほとんど変化なし(微黄色) | 0.7 |
| 実施例2 | 黄色 | 0.0 | 変化なし(黄色) | 0.3 |
| 実施例3 | 淡桃色 | 0.0 | ほとんど変化なし(淡桃色) | 0.7 |
| 比較例1 | 白色 | 0.0 | 著しい変化(微黄色) | 1.2 |
| 比較例2 | 白色 | 0.0 | 著しい変化(微黄色) | 1.7 |
| 比較例3 | 白色 | 0.0 | 著しい変化(微黄色) | 0.3 |
| 比較例4 | 白色 | 0.0 | 著しい変化(微黄色) | 0.8 |
| 比較例5 | 橙色 | 0.0 | (微かに黄色がかった薄い橙色) | 1.1 |
| 比較例6 | 橙色 | 0.0 | 著しい変化(くすんだ薄い橙色) | 0.7 |
| 比較例7 | 微桃色 | 0.0 | (微かに黄色がかったくすんだ微桃色) | 1.2 |
| 比較例8 | 淡桃色 | 0.0 | 著しい変化(微かに黄色がかったくすんだ微桃色) | 1.2 |

(3) 本件訂正発明の概要

ア 本件明細書の記載から、本件訂正発明について、次の事項が認められる。

イ ジヒドロピリジン系カルシウム拮抗薬であるアムロジピンは充分かつ恒常的な血管拡張作用と頻脈をきたし難い性質から、降圧療法の中心的な役割を果たしている。アムロジピンはジヒドロピリジン系化合物の中では光分解を受けにくい化合物ではあるが、曝光量が多い場合には分解を受け、活性物質としての効力が低下することがある。（【0002】）

本発明が解決しようとする課題は、アムロジピン又はその薬学上許容される塩の光による変色及び分解を簡便に防止し、光安定化した経口固形組成物を提供することである。（【0007】）

アムロジピン又はその薬学上許容される塩に酸化鉄を配合することで、光安定化のために被覆層を必要とすることなく非常に簡便に光安定化されたアムロジピン含有経口固形組成物が得られる。（【0012】）

本発明によって、コーティングを施すことができないアムロジピンの口腔内崩壊錠等の易服用性製剤の光安定化による品質維持が可能となり、高齢者等の嚥下困難な患者や多忙な社会生活を送る人々がどのような場面においても容易に服用することが可能な、光に対して安定なアムロジピン経口固形組成物を提供できる。（【0014】）

2 取消事由1（甲1記載の発明に基づく容易想到性判断の誤り）について

(1) 引用例等の記載

ア 甲1について

(ア) 甲1には、以下の記載がある。

a ベシル酸アムロジピンの固体状態における安定性試験では、室温長期保存において変化は認められず加熱並びに加湿化の保存において外観のわずかな黄色化傾向が認められたが、含量低下並びに分解物の生成は認められなかった。室内散光下の保存において、含量の低下はほ

とんど認められなかったものの、光曝表面は黄色に着色し、わずかに分解物が生成した。(11頁)

- b 固体状態における安定性と題する表には、光に対する苛酷試験につき、次の記載がある。(12頁)

保存条件：室内散光(500ルクス)

保存期間：6カ月

保存形態：無色透明ガラスシャーレ

結果〔性状〕：わずかに黄色化

〔残存率(%)〕：98.3~101.0

〔分解物の検索〕：わずかに分解物Iのスポットを認めた

- c 製剤に関し、剤形の区別、規格及び性状と題する表には、次の記載がある。(14頁)

| 販売名 | 色・剤形 |
|-------------|------------|
| ノルバスク®2.5mg | 白色フィルムコート錠 |
| ノルバスク®5mg | 白色フィルムコート錠 |

- d 製剤の組成(14頁)

- (a) 有効成分(活性成分)の含量

ノルバスク錠2.5mg, 5mgは1錠中にそれぞれベシル酸アムロジピン3.47mg, 6.93mg(アムロジピンとして2.5mg, 5mg)を含有する。

- (b) 添加物

結晶セルロース, 無水リン酸水素カルシウム, カルボキシメチルスターチナトリウム, ステアリン酸マグネシウム, ヒドロキシプロピルメチルセルロース, 酸化チタン, タルク, カルナウバロウを含有する。

- e 分割後の安定性と題する表には、光に対する苛酷試験につき、次の

記載がある。(16頁)

保存条件：白色蛍光灯1000ルクス・24時間/日

保存期間：60日

保存形態：無色透明ガラスシャーレ

結果〔外観〕：分割面がわずかに淡黄色に着色

〔含量(%)〕：103.5～103.9

〔分解物の検索〕：分解物のスポットを認めず

本試験での30日間での積算光照射量は720000ルクス・時間であり、JISの照明基準に適合した病院での室内散光下の120～300日間に相当する。

(イ) 以上によれば、甲1の記載事項の概要は次のとおりと認められる。

ノルバスク錠は、ベシル酸アムロジピンのフィルムコート錠である。有効成分のベシル酸アムロジピンにつき、固体状態での光に対する苛酷試験において、わずかに黄色化と分解物のスポットが認められた。製剤の分割後の安定性に関し、光に対する苛酷試験では、分割面がわずかに淡黄色に着色するが、分解物のスポットを認めないことが確認された。

イ 甲2について

(ア) 甲2には、以下の記載がある。

a 特許請求の範囲

【請求項1】光に不安定な薬物を含有した粉体を、着色剤を含む結合液で湿式造粒してなる経口固形組成物。

【請求項6】光に不安定な薬物がソファルコン、ニフェジピン、ビタミンD類、ビタミンK類、ビタミンE類、メシル酸ブロモクリプチン、ユビデカレノン、塩酸ブフェトロール、塩酸オクスブレノール、塩酸インデノロール、又はリボフラビン酪酸エステルである請求項1～5のいずれかに記載の経口固形組成物。

b 発明の属する技術分野

【0001】本発明は、光に対して色変、定量値の低下をおこす薬物含有し薬物の色変、定量値の低下が防止された経口固形組成物、および光に対して色変、定量値の低下をおこす薬物の光安定化に関する。

c 発明が解決しようとする課題

【0004】本発明の目的は、光に不安定な薬物含有する経口固形組成物の光に対する安定化を図ることにある。

d 課題を解決するための手段

【0005】…本発明は、光に不安定な薬物含有した粉体を、着色剤を含む結合液で湿式造粒すること、あるいは光に不安定な薬物含有した粉体に着色剤を添加し湿式造粒すること、あるいは光に不安定な薬物含有した粉体に着色剤を混合することを特徴とする経口固形組成物及び光に不安定な薬物の光安定化方法である。

e 発明の実施の形態

【0006】本発明における光に不安定な薬物は、例えば、ソファルコン、ニフェジピン、ビタミンD類、ビタミンK類、ビタミンE類、メシル酸ブロモクリプチン、ユビデカレノン、塩酸ブフェトロール、塩酸オクスブレノール、塩酸インデノロール、リボフラビン酪酸エステル等が挙げられ、その配合量は、製剤中に1～80重量%、好ましくは1～50重量%である。

【0007】本発明における着色剤は250～500nmの波長領域の光を吸収する性質を有する着色剤であり食用黄色4号、5号、食用赤色3号、102号、黄色三二酸化鉄、三二酸化鉄、β-カロチン、リボフラビン等が挙げられる。…

f 発明の効果

【0014】本発明により、光に不安定な薬物を含み、色変、含有量

の低下が防止された経口固形組成物を簡便に得ることが可能となった。また、本発明により、被覆工程を省くことができるので、これに要する時間及び労力と、それらに伴うコストの低減を図り、顆粒同士の凝集等により収率の低下及び品質の悪化を防止することが可能になった。

(イ) 以上によれば、甲2の記載事項の概要は次のとおりと認められる。

甲2は、光に不安定な薬物を含有する経口固形組成物の光に対する安定化を図るための技術に関する（【0001】，【0004】）。ソファルコン、ニフェジピン、ビタミンD類、ビタミンK類、ビタミンE類、メシル酸ブロモクリプチン、ユビデカレノン、塩酸ブフェトロール、塩酸オクスブレノール、塩酸インデノロール、リボフラビン酪酸エステル等の光に不安定な薬物を含有した粉体を、着色剤を含む結合液で湿式造粒する、光に不安定な薬物を含有した粉体に着色剤を添加し湿式造粒する、又は光に不安定な薬物を含有した粉体に着色剤を混合する。着色剤としては、250～500nmの波長領域の光を吸収する性質を有する食用黄色4号、5号、食用赤色3号、102号、黄色三二酸化鉄、三二酸化鉄、β-カロチン、リボフラビン等を用いる（【0005】～【0007】）。被覆工程を省くことができるので、コストの低減を図り、顆粒同士の凝集等による収率の低下及び品質の悪化を防止することが可能になる（【0014】）。

ウ アムロジピンに関する周知事項

本件特許の出願日当時、アムロジピンに関し、少なくとも以下の事項が広く知られていた。

アムロジピンは、ニフェジピンを基本薬とするジヒドロピリジン系カルシウム拮抗薬である。カルシウム拮抗薬は、高血圧、狭心症、不整脈などの循環器疾患の治療薬として処方されている。ジヒドロピリジン系カルシウム拮抗薬には、光に不安定なものが多く、光に曝されると酸化され、ピ

リジン類似体を生成する。特にニフェジピンは日光に当たると急速に分解される。アムロジピンやフェロジピンは比較的安定である。（甲20，22～24，35，45～47，87，89，90）

ベシル酸アムロジピンは，アムロジピンの薬学上許容される塩である。（乙16の段落【0010】参照）

なお，アムロジピンは苦みのある成分である。（乙16の段落【0002】，乙17の段落【0017】参照）

(2) 甲1記載の発明について

ア 甲1は，ノルバスク錠2.5mg及び同5mgの医薬品インタビューフォームの抜粋である。

そして，甲1には，これらの製剤はフィルムコート錠であり，有効成分としてベシル酸アムロジピンを，添加物として結晶セルロース及びカルボキシメチルスターチナトリウムをそれぞれ含有するものの，マンニトールを含有していない（医薬品インタビューフォームという文書の性質上，当該医薬品に添加物として含有されている物質は，その旨が明記されると解されるから，当業者は，医薬品インタビューフォームに有効成分又は添加物として記載されていない物質は，当該医薬品に含有されていないと理解するものというべきである。）ことが記載されているから，甲1には，次の発明（以下「甲1発明」という。）が記載されていると認めるのが相当である。

「ベシル酸アムロジピン，結晶セルロース，カルボキシメチルスターチナトリウムを含有するが，マンニトールを含有しないフィルムコート錠」

そうすると，上記甲1発明と甲1発明〔原告〕とは同一であるから，甲1には甲1発明〔原告〕が記載されていると認めるのが相当である。

イ 被告は，ベシル酸アムロジピンの含有量を伴わない認定や，添加物の一部の成分のみを選択した認定は，許されないと主張する。

そこで検討するに、引用発明は、特許出願に係る発明が進歩性を有しているか否かを判断するに当たり、特許出願に係る発明との対比により一致点及び相違点を抽出し、当該引用発明を出発点として、相違点に係る特定事項を備えた発明を当業者が容易に想到できたか否かを検討するための基礎となるものである。そうすると、このような引用発明の目的に照らせば、引用発明は、本件発明と引用発明との一致点及び相違点を抽出するための対比が可能な程度に特定されていれば足り、本件発明との対比に明らかに関係がない事項についてまで、引用例に記載されているとおりにそのまま認定しなければならないものではないと解される。また、審決が問題にしているベシル酸アムロジピンの含有量の限定や添加剤の限定は、課題解決のために必要な構成であるとはいえない。

本件において、甲1発明（したがって甲1発明〔原告〕）は、本件訂正発明1との一致点及び相違点を抽出するための対比が可能な程度に十分特定されたものというべきである。そして、甲1が医薬品インタビューフォームの抜粋であることは、上記判断を左右しないというべきである。

したがって、この点についての被告の主張を採用することはできない。

(3) 本件訂正発明1の容易想到性について

ア 本件訂正発明1と甲1発明との対比

甲1発明の錠剤は、経口投与されるものであるから、経口固形組成物に該当する。

したがって、本件訂正発明1と甲1発明との一致点及び相違点は、次のとおりと認めるのが相当である。

<一致点>

ベシル酸アムロジピンと結晶セルロースを含有する経口固形組成物であって、マンニトールを含有しない点。

<相違点1>

本件訂正発明 1 は、酸化鉄を含有するのに対し、甲 1 発明は、酸化鉄を含有しない点。

〈相違点 2〉

本件訂正発明 1 は、デンプンを含有するのに対し、甲 1 発明は、デンプンを含有せず、カルボキシメチルスターチナトリウムを含有する点。

〈相違点 3〉

本件訂正発明 1 は、デンプンの含有量が 30 重量%以下であるのに対し、甲 1 発明は、そのような限定を有していない点。

〈相違点 4〉

本件訂正発明 1 は、被覆層を有しない経口固形組成物であるのに対し、甲 1 発明は、被覆層（フィルムコート部分）を有する点。

イ 相違点 1 について

医薬品において、着色剤は、視覚的に医薬品の外観を変化させて、識別性を高めることなどを主目的として使用される添加物であるところ、酸化鉄は、医薬品の着色剤としてもよく知られた物質であるから、これを着色剤として医薬品に含有させることは、本件特許の出願日当時の周知慣用技術であったと認めるのが相当である（甲 2 の段落【0007】，甲 48，乙 6 の表 2）。

したがって、医薬品である甲 1 発明に係る組成物に酸化鉄を含有させること自体は、当業者が容易に想到できるものというべきである。

ウ 相違点 2 及び 3 について

(ア) デンプン及びカルボキシメチルスターチナトリウムが、いずれも医薬品において、賦形剤、結合剤及び崩壊剤などとして一般的に用いられる添加物であることは、本件特許の出願日当時の技術常識であったと認めるのが相当である（甲 4～6，8，乙 13）。

(イ) また、「新・薬剤学総論（改訂第 3 版）」（1987（昭和 62）年

4月発行。甲4)には、デンプンを錠剤、丸剤などにおける結合剤として用いる場合の常用濃度は4～10%であること、崩壊剤として用いる場合は製剤の10～30%とすることが記載されており、「Remington's Pharmaceutical Sciences 18」(1990(平成2)年発行。甲8)には、デンプンを崩壊剤として用いる場合、その添加量は5%が推奨され、より早い崩壊が望まれる場合には15%に増量してもよいこと記載がされている。

そうすると、医薬品である経口固形組成物にデンプンを30重量%以下の含有量で配合することは、本件特許の出願日当時の技術常識であったと認められる。

(ウ) 以上によれば、医薬品である甲1発明に係る組成物につき、カルボキシメチルスターチナトリウムに代えて、デンプンを30重量%以下の含有量で配合することは、当業者が容易に想到できるものというべきである。

エ 相違点4について

(ア) 甲2に記載されているとおり、酸化鉄は、光に対して不安定な薬物の安定性を高める成分であることが知られているとしても、甲1発明につき、相違点4に係る構成を備えるものとするとは、当業者が容易に想到できたものとはいえない。その理由は次のとおりである。

(イ) 甲1には、ベシル酸アムロジピンの固体状態における安定性に関し、「室内散光下の保存において、含量の低下はほとんど認められなかったものの、光曝表面は黄色に着色し、わずかに分解物が生成した。」との記載とともに、固体状態における安定性と題する表において、室内散光(500ルクス)の条件下で無色透明のガラスシャーレに6か月間保存したところ、残存率は98.3～101.0%、光曝表面がわずかに黄色化し、わずかに分解物Iのスポットが認められたことが記載されてい

る（甲1の11及び12頁）。

これに対し、甲1では割愛されている2003年8月付けのノルバス錠に係る医薬品インタビューフォームの15頁には、製剤の安定性に関し、光に対する苛酷試験につき、室内散光（500ルクス）の条件下で無色透明のガラスシャーレに6か月間保存したところ、外観に変化はなく、含量は2.5mg錠では98.5～99.9%，5mg錠では97.6～101.5%，分解物のスポットは認められなかったと記載されている（甲33）。一方、当該医薬品インタビューフォームの16頁には、製剤の分割後の安定性に関し、白色蛍光灯（1000ルクス・24時間/日）の条件下で無色透明のガラスシャーレに60日保存したところ、分割面がわずかに淡黄色に着色し、含量は103.5～103.9%，分解物のスポットは認められなかったと記載されている（甲1，33）。

(ウ) 錠剤のフィルムコーティングに関し、「製剤学（改訂第3版）」（1997（平成9）年4月1日発行。乙15）には、錠剤のコーティングの目的は、①外観の改善と商品価値の向上、②苦みや悪臭などのマスキング、③主薬の安定化、④腸溶化や徐放化による薬剤の吸収部位の調節、⑤薬剤からの消化管粘膜の保護、⑥薬効の発現の調節などにあるとの記載がある。

また、「経口投与製剤の処方設計」（平成10年4月15日発行。乙14）には、光によって外観変化、含量低下、類縁物質の増加が認められる場合には、フィルムコーティングあるいは遮光包装が考えられるが、開封後の保証まで考慮すると製剤処方耐候性の機能を付与することが望ましいとの記載がある。

上記各事項が市販の書籍に記載されていることや当該各書籍の発行時期に鑑みれば、これらの事項は本件特許の出願日当時における当業者の

技術常識であったと認められる。

(エ) そうすると、甲 1 及び甲 3 3 (刊行物に接した当業者が把握する事項を認定する際には、当該刊行物全体の記載内容を参酌すべきである。) の記載に接した当業者は、上記(1)ウのアムロジピンに関する周知事項及び上記(ウ)の技術常識に鑑みれば、アムロジピン原体は、光により着色し、外観変化と分解物の生成を生じ得るものであるところ、甲 1 記載のノルバスク錠では、フィルムコーティングを施すことで、光に起因する着色による外観変化と分解物生成を防止していることが理解できる。また、ノルバスク錠の分割後の安定性に関し、分割面がわずかに淡黄色に着色したとの記載は、フィルムコーティング錠を分割すると、分割面にはフィルムコーティングが存在しないため、その部分のみが着色してしまうことを示すものと理解するというべきである。

さらに、上記(1)ウにおいて認定したとおり、アムロジピンが苦みを有する成分であることは、本件特許の出願日当時における周知の事項であったから、上記(ウ)の技術常識を踏まえると、甲 1 記載のノルバスク錠が備えるフィルムコーティングは、苦みをマスキングする役割も果たしていることが理解できる。

加えて、フィルムコーティングを除去すると、薬剤の溶出挙動が変化する可能性があることは明らかである (なお、特開 2 0 0 3 - 1 0 4 8 8 8 号公報 (甲 2 4) の段落【0 0 0 4】には、「ジヒドロピリジン誘導体は、光に対する安定性が低く、水性溶媒への溶解度が非常に低いために経口投与の場合には消化管液中で薬物が製剤から溶出するような工夫が必要である。」との記載がある。))。

(オ) 原告が主張するとおり、医薬品の服用性、取扱いやすさや、生産性、コストといった観点からより良い剤形を模索することは、当業者であれば当然に検討すべき技術的事項であって (甲 9 ~ 1 7, 1 9, 乙 1 4),

実際にも、本件特許の出願日当時において、我が国で少なくとも22品目について口腔内崩壊錠の医薬品が販売されていたとの事情が認められる（甲84）。

しかし、上記(イ)～(エ)において検討したところによれば、甲1発明のベシル酸アムロジピンを含有するフィルムコート錠を、敢えてフィルムコートを有しない経口固形組成物に変更することには、光による変色・分解物の発生のおそれ、苦み、薬剤の溶出挙動の変化等の観点から阻害要因があるというべきである。

オ 原告の主張について

原告は、甲1には、ベシル酸アムロジピンが光に不安定である旨が明記されている上に、アムロジピンの光に対する不安定性についての課題は、本件特許の出願日当時の周知事項であったから、甲1に接した当業者は、アムロジピンの光に対する安定化という課題を当然に把握、認識でき、甲1発明〔原告〕に甲2記載の光に対する解決手段として酸化鉄を用いる発明を組み合わせる動機付けがあるのは明らかであると主張する。

甲1の記載から、ベシル酸アムロジピンの原体は、光によって変色したり、分解物が生成したりするものであることが理解できるのは、原告が主張するとおりである。しかし、甲1発明では、フィルムコーティング錠とすることで、光による変色と分解物の生成とを抑制していると理解できることは、上記エ(エ)において説示したとおりである。そして、甲1発明のフィルムコーティングは、変色及び分解物生成の抑制のほか、苦みのマスキングにも資するものであると理解されることから、甲1発明につき、フィルムコーティングを除去した構成に変更することには阻害要因があることも、上記エにおいて説示したとおりである。

したがって、甲2に、光に不安定な薬物の安定化の手段として、酸化鉄を包含する着色剤を混合するとの発明が記載されていると認められるもの

の、当該事実は上記エの判断を左右するものとはいえない。

カ 小括

以上によれば、本件訂正発明 1 は、甲 1 及び甲 2 に記載された発明並びに本件特許の出願日当時の技術常識に基づき、当業者が容易に発明をすることができたものであるとはいえない。

(4) 本件訂正発明 3 の容易想到性について

本件訂正発明 3 は、本件訂正発明 1 の発明特定事項を全て含み、更に限定を加えた発明であるから、本件訂正発明 1 について検討したところと同様に、甲 1 及び甲 2 に記載された発明並びに本件特許の出願日当時の技術常識に基づき、当業者が容易に発明をすることができたものであるとはいえない。

(5) 本件訂正発明 1 4, 1 8 ~ 2 8 の容易想到性について

本件訂正発明 1 4 は、経口固形組成物の調製における、光による変色が抑制された組成物とするための酸化鉄の使用の発明であるところ、本件訂正発明 1 4 の経口固形組成物は、本件訂正発明 1 の経口固形組成物と同じ組成物である。そうすると、本件訂正発明 1 について検討したところと同様に、本件訂正発明 1 4 は、甲 1 及び甲 2 に記載された発明並びに本件特許の出願日当時の技術常識に基づき、当業者が容易に発明をすることができたものであるとはいえない。

また、本件訂正発明 1 8 ~ 2 8 は、本件訂正発明 1 4 の発明特定事項を全て含み、更に限定を加えた発明であるから、本件訂正発明 1 4 について検討したところと同様に、甲 1 及び甲 2 に記載された発明並びに本件特許の出願日当時の技術常識に基づき、当業者が容易に発明をすることができたものであるとはいえない。

(6) 小括

以上によれば、この点についての審決の判断は、結論において誤りがないというべきであるから、原告主張の取消事由 1 は理由がない。

3 取消事由 2（甲 1 5 記載の発明に基づく容易想到性判断の誤り）について

(1) 甲 1 5 について

ア 甲 1 5 には、以下の記載がある。

(ア) 特許請求の範囲

【請求項 1】 a) 活性成分， b-1) 糖および／または糖アルコールおよび c-1) セルロース類を含有してなる群 1 と b-2) 糖および／または糖アルコールおよび c-2) セルロース類を含有してなる群 2 とを含有してなり， 群 1 および／または群 2 に d) 溶出補助剤を含有する速崩壊性固形製剤。

【請求項 1 2】 糖アルコールが D-マンニトール， エリスリトール， キシリトール， マルチトールおよびソルビトールから選ばれる 1 種又は 2 種以上である請求項 1 記載の製剤。

【請求項 2 0】 活性成分が塩酸マジピンである請求項 1 記載の製剤。

(イ) 発明の属する技術分野

【0 0 0 1】 本発明は、体液とりわけ口腔内の唾液または少量の水の存在下において速やかに崩壊し、活性成分の溶出が適正に調節されている固形製剤、とりわけ口腔内崩壊性固形製剤として有用な速崩壊性固形製剤に関する。

(ウ) 従来技術

【0 0 0 2】 従来より、薬剤の嚥下が困難な患者、高齢者あるいは小児のために、服用しやすい剤形として、口腔内で迅速に崩壊・溶解する固形製剤の開発が進められている。

(エ) 発明が解決しようとする課題

【0 0 0 3】 錠剤を経口投与した後、胃、小腸などの消化管内において、食事成分、消化管液と接触することにより、錠剤成分は各種イオン成分等と接触する。こうした作用により、錠剤中の添加剤の成分が適度に設

計されていないと、主薬成分の溶出が影響を受け、薬物の吸収挙動、ひいては、薬効の発現に影響を与えることがある。一般的に、難水溶性の活性成分の場合には溶出が遅いため十分な薬効が発現されず、水溶性の活性成分の場合には溶出が早いため過度の薬効発現を招きやすい。本発明は、特殊な製剤技術を必要とすることなく、一般的な設備で工業的な生産が可能であり、かつ、同じ活性物質を含有する市販品（速崩壊性固形製剤でない製剤；例えば、錠剤など）と同じ溶出挙動、吸収挙動を示す速崩壊性固形製剤、特に口腔内崩壊錠を提供するものである。

(オ) 課題を解決するための手段

【0004】本発明者らは、種々検討した後、活性成分と糖および／または糖アルコールとセルロース類を含有するグループと、糖および／または糖アルコールとセルロース類を含有するグループとを含有させ、一方あるいは両方のグループに溶出補助剤を含有させることにより低い乾式の圧縮圧でも実用上問題ない硬度を有し、かつ速やかな崩壊性、溶出調節性、製造性に優れる等の医薬として優れた性質を有する速崩壊性固形製剤、特に口腔内崩壊錠が得られることを見出し、これらに基づいて本発明を完成した。

【0005】本発明で用いられる活性成分としては…例えば滋養強壮保健薬、解熱鎮痛消炎薬、向精神薬、抗不安薬、抗うつ薬、催眠鎮静薬、鎮痙薬、中枢神経作用薬、脳代謝改善剤、脳循環改善剤、抗てんかん剤、交感神経興奮剤、胃腸薬、制酸剤、抗潰瘍剤、鎮咳去痰剤、鎮吐剤、呼吸促進剤、気管支拡張剤、アレルギー用薬、歯科口腔用薬、抗ヒスタミン剤、強心剤、不整脈用剤、利尿薬、血圧降下剤、血管収縮薬、冠血管拡張薬、末梢血管拡張薬、高脂血症用剤、利胆剤、抗生物質、化学療法剤、糖尿病用剤、骨粗しょう症用剤、抗リウマチ薬、骨格筋弛緩薬、鎮けい剤、ホルモン剤、アルカロイド系麻薬、サルファ剤、痛風治療薬、

血液凝固阻止剤，抗悪性腫瘍剤などから選ばれた1種または2種以上の成分が用いられる。…血圧降下剤としては，例えば塩酸デラプリル，カプトプリル，ペリンドプリルエルブミンなどのアンジオテンシン変換酵素阻害薬，塩酸ヒドララジンなどの血管拡張薬，塩酸ラベタロールなどの α ， β 遮断薬，塩酸ニカルジピン，ニルバジピン，ニフェジピン，塩酸ベニジピン，塩酸ジルチアゼム，ニソルジピン，ニトレンジピン，塩酸バルニジピン，塩酸エホニジピン，ベシル酸アムロジピン，フェロジピン，シルニジピン，アラニジピン，塩酸マニジピンなどのCa拮抗薬，ロサルタン，エプロサルタン，カンデサルタン，バルサルタン，テルミサルタン，イルベサルタン，オルメサルタン，タソサルタン，カンデサルタンシレキセチルなどのアンジオテンシンII受容体拮抗薬，メチルドパなどの交感神経中枢抑制薬などが挙げられる。…

【0006】本発明で用いられる糖としては，例えばブドウ糖，果糖，乳糖，蔗糖，トレハロースなどが挙げられ，乳糖などが好ましく用いられる。本発明で用いられる糖アルコールとしては，例えばD-マンニトール，エリスリトール，キシリトール，マルチトール，ソルビトールなどが挙げられ，D-マンニトールなどが好ましく用いられる。…

【0007】セルロース類としては，例えば結晶セルロース，粉末セルロース，低置換度ヒドロキシプロピルセルロース，カルメロース等（好ましくは低置換度ヒドロキシプロピルセルロース等）が用いられる。…溶出補助剤としては，例えばヒドロキシプロピルセルロース，ヒドロキシプロピルメチルセルロース，ポリビニルピロリドン，アラビアゴム末，ゼラチン，メチルセルロース，ポリビニルアルコール，プルラン等（好ましくはヒドロキシプロピルセルロース等）が用いられる。…また，本発明の製剤としては，群1および/または群2に低置換度ヒドロキシプロピルセルロースを含有する製剤が好ましく，群1および群2

に低置換度ヒドロキシプロピルセルロースを含有する製剤がより好ましい。ここで、群1および群2の低置換度ヒドロキシプロピルセルロースは同一であっても、異なってもよい。また、セルロース類として低置換度ヒドロキシプロピルセルロースを用いた場合、本発明の製剤においては低置換度ヒドロキシプロピルセルロースも溶出補助剤として働き得る。そのため、本発明の目的が達成される限り、上述した他の溶出補助剤の使用を省略することもできる。

【0008】その他、本発明の製剤は、発明の効果に支障のない限り、賦形剤としてのトウモロコシデンプン、馬鈴薯デンプン、コムギコデンプン、コメデンプン、部分アルファー化デンプン、アルファー化デンプン、有孔デンプン等のデンプン類や一般製剤の製造に用いられる種々の添加剤を適量含んでいてもよい。このような添加剤として、例えば賦形剤、酸味料、発泡剤、人工甘味料、香料、滑沢剤、着色剤、安定化剤、pH調整剤、界面活性剤などが挙げられる。

【0009】…着色剤としては、例えば食用黄色5号、食用赤色2号、食用青色2号などの食用色素、食用レーキ色素、三二酸化鉄などが挙げられる。安定化剤としては、例えばエデト酸ナトリウム、トコフェロール、シクロデキストリン等が挙げられる。…

(カ) 発明の効果

【0012】かくして得られる本発明の速崩壊性固形製剤、好ましくは口腔内速崩壊性固形製剤は、口腔内での速やかな崩壊性を示し、同じ活性物質を含有する市販品と同じ溶出挙動を示す。各種イオン成分が、主薬成分の溶出に与える影響が小さい。また、適度な製剤強度を示す。さらに、優れた製造性を示す。…

(キ) 発明の実施の形態

【0015】実施例1

塩酸マニジピン4480g, 乳糖造粒粉末(フロイント産業)13156g, トウモロコシデンプン660g, 低置換度ヒドロキシプロピルセルロース(信越化学工業:LH-31)3300gを流動造粒乾燥機(パウレック社,FD-S2型)に仕込み,ヒドロキシプロピルセルロース(日本曹達)440gおよび黄色三二酸化鉄44gを含む精製水9284gを噴霧し,造粒,乾燥工程を経て造粒物Aを得た。次に,造粒物Aをパワーミル(昭和化学機械工作所,P-3S)を用い,スクリーンサイズ(1.2mmφ)にて整粒し,整粒物Aを得た。一方,D-マンニトール(東和化成:マンニットS)8614g,D-マンニトール(メルク社:1.05980)4514g,低置換度ヒドロキシプロピルセルロース(信越化学工業:LH-11)1438gを流動造粒乾燥機(パウレック社,FD-S2型)に仕込み,D-マンニトール460g,無水クエン酸144gおよび黄色三二酸化鉄11.5gを含む精製水5215gを噴霧し,造粒,乾燥工程を経て造粒物Bを得た。次に,造粒物Bをパワーミルを用い,スクリーンサイズ(1.2mmφ)にて整粒し,整粒物Bを得た。整粒物A1800g,整粒物B2376g,結晶セルロース248g,アスパルテーム9.0g,ステアリン酸マグネシウム67.5gを混合した。この混合末を1錠当たり250mgで打錠した(菊水製作所,コレクト19KAWC,錠剤サイズ9.5mmφ,圧縮圧5.4kN/cm²)。

イ 以上によれば,甲15に記載された発明の概要は次のとおりと認められる。

錠剤を経口投与した後,錠剤成分は消化管液等の各種イオン成分等と接触する。錠剤中の添加剤の成分が適度に設計されていないと,主薬成分の溶出が影響を受け,薬物の吸収挙動,ひいては,薬効の発現に影響を与えることがある。本発明は,特殊な製剤技術を必要とすることなく,一般的

な設備で工業的な生産が可能であり、かつ、同じ活性物質を含有する市販品（速崩壊性固形製剤でない製剤）と同じ溶出挙動、吸収挙動を示す速崩壊性固形製剤、特に口腔内崩壊錠を提供することを目的とする（【0003】）。活性成分と糖及び／又は糖アルコールとセルロース類を含有するグループと、糖及び／又は糖アルコールとセルロース類を含有するグループとを含有させ、一方又は両方のグループに溶出補助剤を含有させることにより低い乾式の圧縮圧でも実用上問題ない硬度を有し、かつ速やかな崩壊性、溶出調節性及び製造性に優れる等の医薬として優れた性質を有する速崩壊性固形製剤、特に口腔内崩壊錠が得られる（【0004】）。本発明の速崩壊性固形製剤、好ましくは口腔内速崩壊性固形製剤は、口腔内の速やかな崩壊性を示し、同じ活性物質を含有する市販品と同じ溶出挙動を示すとともに、各種イオン成分が、主薬成分の溶出に与える影響が小さく、適度な製剤強度、優れた製造性を示す。（【0012】）

(2) 甲15記載の発明について

甲15記載の発明においては、活性成分と糖及び／又は糖アルコールとセルロース類を含有する群1と、糖及び／又は糖アルコールとセルロース類を含有する群2とを含有させ、群1及び群2の一方又は両方に溶出補助剤を含有させることが、低い乾式の圧縮圧でも十分な硬度を有し、崩壊性、溶出調節性及び製造性に優れる医薬品を得るとの課題を解決するための手段とされている。

したがって、甲15の段落【0015】の実施例1の記載から、甲15には、次の発明（以下「甲15発明」という。）が記載されていると認めるのが相当である（実施例1記載の各成分の含有量に照らせば、トウモロコシデンプンの含有量が30重量%以下であることは明らかである。）。

「塩酸マジピン、乳糖、トウモロコシデンプン、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、酸化鉄を含む組成物を造

粒，整粒した整粒物 A と，

D-マンニトール，低置換度ヒドロキシプロピルセルロース，酸化鉄含む組成物を造粒，整粒した整粒物 B と，

結晶セルロースとの混合末を打錠した，トウモロコシデンプンの含有量が 30 重量%以下である錠剤。」

(3) 本件訂正発明 1 の容易想到性について

ア 本件訂正発明 1 と甲 1 5 発明との対比

甲 1 5 発明におけるトウモロコシデンプンはデンプンの一種であり，D-マンニトールはマンニトールに該当する。また，甲 1 5 発明の錠剤は，経口固形組成物に該当するが，フィルムコーティングなどの被覆層を備えたものではない。

したがって，本件訂正発明 1（賦形剤として結晶セルロースを選択した場合。）と甲 1 5 発明との一致点及び相違点は，次のとおりと認めるのが相当である。

<一致点>

活性成分と，酸化鉄，結晶セルロース，デンプンを含有し，デンプンの含有量が 30 重量%以下であり，かつ，被覆層を有しない経口固形組成物。

<相違点 7>

本件訂正発明 1 は，活性成分としてベシル酸アムロジピンを含有するのに対し，甲 1 5 発明は，ベシル酸アムロジピンを含有せず，塩酸マニジピンを含有する点。

<相違点 8>

甲 1 5 発明は，活性成分，乳糖，トウモロコシデンプン，低置換度ヒドロキシプロピルセルロース，ヒドロキシプロピルセルロース及び酸化鉄を含み，マンニトールを含まない整粒物 A と，活性成分を含まず，マンニトール，低置換度ヒドロキシプロピルセルロース及び酸化鉄を含む整粒物 B

とを含有し、経口固形組成物としては、マンニトールを含むのに対し、本件訂正発明1は、複数の整粒物で構成するものとされておらず、経口固形組成物としては、マンニトールを含有せず、乳糖、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース及びヒドロキシプロピルセルロースについての限定がない点。

イ 相違点7について

(ア) 甲15は、活性成分、糖アルコール等及びセルロース類を含有する群1と、糖アルコール等及びセルロース類を含有する群2とを組み合わせ、更に群1及び群2の一方又は両方に溶出補助剤を含有する、速やかな崩壊性、溶出調節性及び製造性等に優れる速崩壊性固形製剤を主題とする特許公報である。

(イ) そして、甲15において、ベシル酸アムロジピンは、段落【0005】の「本発明で用いられる活性成分としては、…例えば滋養強壯保健薬、解熱鎮痛消炎薬、向精神薬、抗不安薬、抗うつ薬、催眠鎮静薬、鎮痙薬、中枢神経作用薬、脳代謝改善剤、脳循環改善剤、抗てんかん剤、交感神経興奮剤、胃腸薬、制酸剤、抗潰瘍剤、鎮咳去痰剤、鎮吐剤、呼吸促進剤、気管支拡張剤、アレルギー用薬、歯科口腔用薬、抗ヒスタミン剤、強心剤、不整脈用剤、利尿薬、血圧降下剤、血管収縮薬、冠血管拡張薬、末梢血管拡張薬、高脂血症用剤、利胆剤、抗生物質、化学療法剤、糖尿病用剤、骨粗しょう症用剤、抗リウマチ薬、骨格筋弛緩薬、鎮けい剤、ホルモン剤、アルカロイド系麻薬、サルファ剤、痛風治療薬、血液凝固阻止剤、抗悪性腫瘍剤などから選ばれた1種または2種以上の成分が用いられる。」との記載のうち、血圧降下剤についての記載である「血圧降下剤としては、例えば塩酸デラプリル、カプトプリル、ペリンドプリルエルブミンなどのアンジオテンシン変換酵素阻害薬、塩酸ヒドララジンなどの血管拡張薬、塩酸ラベタロールなどの α 、 β 遮断薬、塩酸ニカ

ルジピン，ニルバジピン，ニフェジピン，塩酸ベニジピン，塩酸ジルチアゼム，ニソルジピン，ニトレンジピン，塩酸バルニジピン，塩酸エホニジピン，ベシル酸アムロジピン，フェロジピン，シルニジピン，アラニジピン，塩酸マニジピンなどのCa拮抗薬，ロサルタン，エプロサルタン，カンデサルタン，バルサルタン，テルミサルタン，イルベサルタン，オルメサルタン，タソサルタン，カンデサルタンシレキセチルなどのアンジオテンシンII受容体拮抗薬，メチルドパなどの交感神経中枢抑制薬などが挙げられる。」との記載の中に挙げられている。しかし，これは，当該段落に列挙されている適応症も薬効も異なる100を超える多種多様な活性成分の一つとして紹介されているものにすぎず，甲15のその他の記載を参酌しても，これらの多数の活性成分の中から特にベシル酸アムロジピンに着目する動機付けとなり得る事情は見受けられない。

(ウ) また，甲15の段落【0008】及び【0009】によれば，酸化鉄は，発明の効果に関係がない任意成分の例として挙げられた賦形剤，酸味料，着色剤等の10種類の添加剤のうち，着色剤として例示された5種類の物質のうちの一つにすぎない。

(エ) そうすると，甲15に接した当業者において，甲15発明の組成物につき，多種多様な組合せがあり得る任意の添加剤としての酸化鉄は変更しない一方で，活性成分として，甲15の段落【0005】に挙げられた多数の化合物の中から，特にベシル酸アムロジピンを選択するとの動機付けがあるとは認め難い。

(オ) 以上によれば，甲15発明の塩酸マニジピンをベシル酸アムロジピンに変更することが，当業者において容易に想到できたことまでいうことはできない。

ウ 相違点8について

上記(1)のとおり、甲15記載の発明は、活性成分と糖及び／又は糖アルコールとセルロース類を含有する群1と、糖及び／又は糖アルコールとセルロース類を含有する群2とを含有させ、群1及び群2の一方又は両方に溶出補助剤を含有させることにより、低い乾式の圧縮圧でも実用上問題ない硬度を有し、かつ速やかな崩壊性、溶出調節性及び製造性に優れる等の医薬として優れた性質を有する速崩壊性固形製剤を提供するものであるところ、甲15発明における整粒物Bは、糖及び／又は糖アルコールとセルロース類を含有する群2に対応する。

そして、甲15の【請求項12】には、「糖アルコールがD-マンニトール、エリスリトール、キシリトール、マルチトールおよびソルビトールから選ばれる」と記載されているところ、この記載に接した当業者は、糖アルコールとして、マンニトールだけでなく、エリスリトール、キシリトール、マルチトール及びソルビトールが同様に使用可能であると理解できるから、甲15発明における整粒物Bについて、D-マンニトールをエリスリトール、キシリトール、マルチトール又はソルビトールのいずれかに置き換えることは、当業者が容易になし得るものというべきである。

しかし、甲15記載の発明においては、群1と群2とを含有させ、群1及び群2の一方又は両方に溶出補助剤を含有させることが、十分な硬度を有し、崩壊性、溶出調節性、製造性に優れる医薬を得るという課題を解決するための手段とされている。そうすると、甲15発明から、活性成分を含む整粒物Aと、活性成分を含まない整粒物Bとを含有させるとともに、その一方又は両方に溶出補助剤を含有させるとの構成を捨象することは、課題解決のために必要不可欠な構成を失わせることになる。

したがって、甲15発明から当該構成を捨象して本件発明1の経口医薬組成物とすることには阻害要因があるというべきである。

以上によれば、当業者が、相違点8に係る構成を容易に想到できたとい

うことはできない。

エ 原告の主張について

(ア) 原告は、審決が、甲 1 5 から認定できる発明は、請求項 1 記載の群 1 及び群 2 を含有するものであるところ、甲 1 5 発明〔原告〕には、当該群 1 及び群 2 が発明特定事項として含まれていないから、原告が主張する甲 1 5 発明〔原告〕は、甲 1 5 に記載された発明であるとはいえないと判断したことが誤りであると主張する。

しかし、上記(2)において説示したとおり、甲 1 5 記載の発明においては、群 1 と群 2 とを含有させ、群 1 及び群 2 の一方又は両方に溶出補助剤を含有させることが、低い乾式の圧縮圧でも十分な硬度を有し、崩壊性、溶出調節性及び製造性に優れる医薬を得るという課題を解決するための手段とされているから、甲 1 5 記載の発明を認定するに当たり、かかる構成を捨象することはできないというべきである。

(イ) また、原告は、本件訂正発明 1 の効果が、予想し得る範囲内のものであると主張するが、上記イ及びウにおいて説示したとおり、当業者は甲 1 5 発明を出発点として相違点 7 及び 8 に係る本件訂正発明 1 の構成に容易に想到することができないのであるから、既にその点において進歩性を肯定し得るものである。

(ウ) したがって、この点についての原告の主張はいずれも採用することができない。

オ 小括

以上によれば、本件訂正発明 1 は、甲 1 5 に記載された発明及び本件特許の出願日当時の技術常識に基づき、当業者が容易に発明をすることができたものであるとはいえない。

(4) 本件訂正発明 3, 1 4, 1 8 ~ 2 8 の容易想到性について

上記(3)のとおり、本件訂正発明 1 は、甲 1 5 に記載された発明及び本件特

許の出願日当時の技術常識に基づき、当業者が容易に発明をすることができたものであるとはいえないから、取消事由1において説示したところと同様に、本件訂正発明3, 14, 18～28についても当業者が容易に発明をすることができたものであるとはいえない。

(5) 小括

以上によれば、この点についての審決の判断は、結論において誤りがないというべきであるから、原告主張の取消事由2は理由がない。

4 取消事由3（分割要件適合性についての判断の誤り）について

(1) 原告は、本件当初明細書の実施例及び比較例の全てにマンニトールが等しく添加されている上に、被告が、本件原出願の審査過程において、進歩性欠如の拒絶理由に対して行った効果の顕著性に関する主張に鑑みれば、本件原出願に係る発明には、当該発明を構成する組成物の成分からマンニトールを積極的に除外しようという技術思想が含まれていなかったことが明らかであると主張する。

(2) そこで検討するに、本件当初明細書の実施例及び比較例では、いずれもマンニトールを含む組成物のみが用いられていることは当事者間に争いがない。しかし、本件当初明細書において、マンニトールは任意成分である賦形剤として記載されており、ソルビトール、マルチトール、還元澱粉糖化物、キシリトール、還元パラチノース及びエリスリトールなどの代替し得る成分も併せて記載されていることからすると（甲26の段落【0021】及び【0022】）、本件当初明細書の記載において、マンニトールを含有しない組成物が排除されているとはいえない。

また、原告は、本件原出願の審査過程における、効果の顕著性に関する被告の主張を問題とするが、分割出願に係る発明が原出願の当初の明細書等に記載された事項の範囲内であるか否かは、当該明細書及び出願時の技術常識等に基づいて客観的に判断するのが相当であるから、原告の主張はその前提

において失当である。

仮に、この点を措くとしても、本件原出願の審査過程において被告が提出した平成20年6月19日付けの意見書（甲31）には、「変色と酸化体生成量」と題する表において、保存条件10日の下で、

- ① マンニトールを賦形剤とし、酸化鉄を含有する場合、変色に関し、光照射面が「ほとんど変化なし（微黄色）」、酸化体生成量は0.85%、
- ② 乳糖を賦形剤とし、酸化鉄を含有する場合、変色に関し、光照射面が「明らかな変化（黄色）」、酸化体生成量は0.76%、
- ③ マンニトールを賦形剤とし、酸化鉄を含有しない場合、変色に関し、光照射面が「著しい変化（微黄色）」、酸化体生成量は1.07%、

との実験結果が記載されている（6頁。なお、甲26の比較例1、乙19参照。）。これは、賦形剤としてマンニトールを用いる場合と、乳糖を用いる場合とでは、酸化体の生成はいずれも抑制されるものの、着色防止については賦形剤としてマンニトールを用いる場合の方が優れた結果であったことを示すものといえるが、本件原出願に係る発明の課題である光による不安定化（変色、分解）の防止という観点からいえば、酸化鉄と乳糖の組合せも、少なくとも分解の防止という点では所期の成果を挙げているとみることも十分に可能である。そうすると、当該意見書に、「ベシル酸アムロジピンの場合、…酸化鉄+乳糖では着色を抑制できなかった。」（3頁）とか、「変色については、乳糖処方では外観上明らかな変化が見られ、医薬品の品質保持としては不十分な結果であった。」（7頁）との記載がされていることを考慮しても、当該意見書の全体の記載をみれば、マンニトールを含有しない組成物を完全に排除しているとはいい難い。

したがって、原告の上記主張はいずれも採用することができない。

(3) 以上によれば、原告主張の取消事由3は理由がない。

5 取消事由4（サポート要件適合性についての判断の誤り）について

- (1) 原告は、本件明細書の記載に接した当業者が、マンニトールが添加されていない場合においても、アムロジピンに酸化鉄を配合することで、光安定化したアムロジピン含有経口固形組成物が得られることを認識できるとは到底いえないから、本件特許はサポート要件に適合しないと主張する。
- (2) そこで検討するに、特許請求の範囲の記載がサポート要件に適合するか否かは、特許請求の範囲の記載と発明の詳細な説明の記載とを対比し、特許請求の範囲に記載された発明が、発明の詳細な説明に記載された発明で、発明の詳細な説明の記載又はその示唆により当業者が当該発明の課題を解決できると認識できる範囲のものであるか否か、また、その記載や示唆がなくとも当業者が出願時の技術常識に照らし当該発明の課題を解決できると認識できる範囲のものであるか否かを検討して判断すべきものと解される。
- (3) 本件についてみると、本件訂正発明の課題は、アムロジピン又はその塩の光による変色及び分解を簡便に防止し、光安定化した経口固形組成物を提供することである（本件明細書の段落【0007】）ところ、上記第2の2のとおり、本件訂正発明はマンニトールを含有しない組成物に限定されている。

確かに、マンニトールは、本件明細書において、服用性の観点から口腔内崩壊型製剤に添加することが好ましいとされた水溶性賦形剤である、水溶性糖アルコール、糖類、甘味を有するアミノ酸類（【0022】）のうちの、水溶性糖アルコールの一つとして、ソルビトール、マルチトール、還元澱粉糖化物、キシリトール、還元パラチノース及びエリスリトールなどとともに挙げられたもので、その中でも、特に好ましいものとされている（【0023】）。その一方で、本件明細書には、課題を解決するための手段として、アムロジピン又はその塩に酸化鉄を配合することにより、被覆層を必要とすることなく非常に簡便に光安定化された経口医薬組成物が得られる旨が記載されているところ（【0012】）、光安定化効果に対するマンニトールの作用については何ら記載がなく、かえって、マンニトールは実質的に本件訂

正発明の効果に影響を与えない添加剤として位置付けられている（【0027】）。また、ベシル酸アムロジピンに酸化鉄を配合することによる薬物の光安定化効果に、マンニトールが何らかの影響を与えるとの技術常識を認めるに足りる的確な証拠もない。

そうすると、本件明細書に接した当業者は、本件明細書の実施例の全てにおいて、マンニトールを含む組成物のみが示されているとしても（【0033】表1）、それは服用性向上のために含有されているものにすぎず、ベシル酸アムロジピンに酸化鉄を配合した組成物であれば、マンニトールを含まない組成物であっても光安定化効果が発揮されると理解すると認めるのが相当である。また、炭酸カルシウム、結晶セルロース及びデンプンについても、本件明細書には任意成分である賦形剤として記載されているところ（【0024】、【0027】）、当該各物質が、ベシル酸アムロジピンと酸化鉄とを含有する組成物における光安定化効果に対し、何らかの影響を与えるものであるとの技術常識が存在することを認めるに足りる証拠も見当たらない。

したがって、ベシル酸アムロジピン及び酸化鉄とともに、炭酸カルシウム、結晶セルロース及びデンプンを含む本件訂正発明も、当業者が発明の課題を解決できると認識可能な範囲内のものであるといえるから、上記原告の主張は採用することができない。

(4) また、原告は、取消事由3と同様に、本件原出願の審査過程における被告の主張を問題とするが、本件出願と本件原出願とは別個のものであるから、本件原出願の審査過程における被告の主張が本件特許のサポート要件適合性を左右するとはいえない。

(5) 以上によれば、原告主張の取消事由4は理由がない。

6 取消事由5（先願要件適合性についての判断の誤り）について

(1) 原告は、本件原出願の請求項1に係る発明におけるマンニトールを、結晶セルロース等及び所定量のデンプンに置換することは、不活性な添加剤を単

に置換するもので、単なる周知慣用技術の転換にすぎない上に、本件訂正発明と本件原出願に係る発明の効果は同一であるから、両発明は同一のものであって、本件出願は、本件原出願の請求項1に係る発明との関係で、先願要件に適合しないと主張する。

(2) そこで検討するに、本件原出願の特許請求の範囲の請求項1の記載については当事者間に争いが無い。

そして、本件訂正発明1と本件原出願の請求項1に係る発明とは、次の点において相違すると認められる。

〈相違点A〉

本件訂正発明1は、マンニトールを含有しないのに対し、本件原出願に係る発明は、マンニトールを含有する点

〈相違点B〉

本件訂正発明1は、炭酸カルシウム及び結晶セルロースからなる群より選ばれる少なくとも一つの賦形剤と、デンプンとを含有し、デンプンの含有量が30重量%以下であるのに対し、本件原出願に係る発明は、そのような限定がない点

〈相違点C〉

本件訂正発明1は、酸化鉄の含有量の制限がないのに対し、本件原出願に係る発明は、ベシル酸アムロジピン1質量部に対して酸化鉄を0.05～8質量部含有する医薬組成物を除いている点。

したがって、本件原出願の請求項1に係る発明と本件訂正発明とが同一であるとはいえない。

(3) 原告の主張について

原告は、本件原出願の請求項1に係る発明におけるマンニトールを、結晶セルロース等及び所定量のデンプンに置換することは、不活性な添加剤を単に置換するもので、単なる周知慣用技術の転換にすぎないと主張する。

しかし、マンニトール、炭酸カルシウム、結晶セルロース及びデンプンが医薬品の賦形剤として周知慣用されているものであるとしても、上記各物質の具体的な構造、特性及び用途等は異なっているから（例えば、甲4では、結晶セルロース及びデンプンは、結合剤及び崩壊剤、炭酸カルシウムは崩壊剤として挙げられている。）、添加剤として使用される際にも、所望の目的に合致するように選択されるものというべきである。

そして、本件原出願の請求項1に係る発明及び本件訂正発明に係る経口固体組成物において、マンニトールと、結晶セルロース、炭酸カルシウム及びデンプンとが、その特性や含有目的と無関係に等しく置換可能であると認めるに足りる的確な証拠は見当たらない。

そうすると、個々の各成分が賦形剤として周知慣用されているからといって、本件原出願の請求項1に係る発明におけるマンニトールを、炭酸カルシウム及び結晶セルロースからなる群より選ばれる少なくとも一つの賦形剤、並びに所定量のデンプンに置換することが、周知慣用技術の転換にすぎないとまでいうことはできない。

したがって、この点についての原告の主張を採用することはできない。

(4) 以上によれば、原告主張の取消事由5は理由がない。

第6 結論

よって、審決に取り消すべき違法があると認めることはできないから、原告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3部

裁判長裁判官

鶴 岡 稔 彦

裁判官

高 橋 彩

裁判官

間 明 宏 充