

平成27年4月28日判決言渡 同日原本領収 裁判所書記官

平成26年(ワ)第5187号 特許権侵害差止等請求事件

口頭弁論の終結の日 平成27年2月27日

判 決

東京都千代田区<以下略>

原 告	日 産 化 学 工 業 株 式 会 社
同訴訟代理人弁護士	増 井 和 夫
	橋 口 尚 幸
	齋 藤 誠 二 郎
	北 原 潤 一
	梶 並 彰 一 郎

大阪市<以下略>

被 告	沢 井 製 薬 株 式 会 社
同訴訟代理人弁護士	高 橋 隆 二
	生 田 哲 郎
	佐 野 辰 巳

主 文

- 1 原告の請求をいずれも棄却する。
- 2 訴訟費用は原告の負担とする。

事 実 及 び 理 由

第1 請求

- 1 被告は、別紙物件目録(1)記載のピタバスタチンカルシウム原薬を使用してはならない。
- 2 被告は、別紙物件目録(1)記載のピタバスタチンカルシウム原薬を、その含有水分が4重量%より多く、15重量%以下の量に維持して保存してはならない。

- 3 被告は、別紙物件目録(2)記載のピタバスタチンカルシウム製剤を製造し、販売し、又は販売の申出をしてはならない。

## 第2 事案の概要

本件は、発明の名称を「ピタバスタチンカルシウム塩の結晶」とする特許権及び発明の名称を「ピタバスタチンカルシウム塩の保存方法」とする特許権を有する原告が、被告において、ピタバスタチンカルシウム原薬を使用してピタバスタチンカルシウム製剤を製造し販売する行為が前者の特許権を侵害し、同製剤の製造に使用するピタバスタチンカルシウム原薬の保存行為が後者の特許権を侵害する旨主張して、被告に対し、特許法100条1項に基づき、その差止めを求める事案である。

- 1 前提事実（証拠等を掲げた事実以外は、当事者間に争いが無い。）

### (1) 原告の特許権

ア(ア) 原告は、発明の名称を「ピタバスタチンカルシウム塩の結晶」とする特許第5186108号（出願日・平成16年12月17日，優先日・平成15年12月26日，登録日・平成25年1月25日。以下「本件特許1」という。）に係る特許権（以下「本件特許権1」という。）を有している。

本件特許1の特許出願の願書に添付した明細書（以下「本件明細書1」という。）の特許請求の範囲の請求項1及び2の記載は、本判決添付の本件特許1に係る特許公報の該当項記載のとおりである（以下、この請求項1に係る発明を「本件発明1-1」といい、請求項2に係る発明を「本件発明1-2」という。）。

(イ) 原告は、本件特許1に係る無効審判（無効2013-800211）の手續において、平成26年8月22日付けで訂正請求をした（以下、この訂正を「本件訂正」という。）。本件訂正は、上記のとおり記載されていた特許請求の範囲の請求項1を別紙「訂正後の請求項1の記載」の

とおり訂正する内容を含むものである（以下、訂正後の請求項 1 に係る発明を「本件訂正発明 1-1」といい、同請求項を引用する請求項 2 に係る発明を「本件訂正発明 1-2」という。）。

イ 原告は、発明の名称を「ピタバスタチンカルシウム塩の保存方法」とする特許第 5 2 6 7 6 4 3 号（出願日・平成 2 3 年 1 1 月 2 9 日（特願 2 0 0 6 - 5 2 0 5 9 4 の分割）、原出願日・平成 1 6 年 1 2 月 1 7 日、優先日・平成 1 5 年 1 2 月 2 6 日、登録日・平成 2 5 年 5 月 1 7 日。以下「本件特許 2」という。）に係る特許権（以下「本件特許権 2」という。）を有している。

本件特許 2 の特許出願の願書に添付した明細書（以下「本件明細書 2」という。）の特許請求の範囲の請求項 1 の記載は、本判決添付の本件特許 2 に係る特許公報の該当項記載のとおりである（以下、この発明を「本件発明 2」という。また、本件発明 1-1、本件発明 1-2、本件訂正発明 1-1、本件訂正発明 1-2、及び本件発明 2 を併せて「本件各発明」という。）。

## (2) 被告の行為

被告は、他社から調達したピタバスタチンカルシウム原薬（以下「被告原薬」という。）を用いて、別紙物件目録(2)記載のピタバスタチンカルシウム製剤（以下「被告製剤」という。）を製造、販売している。

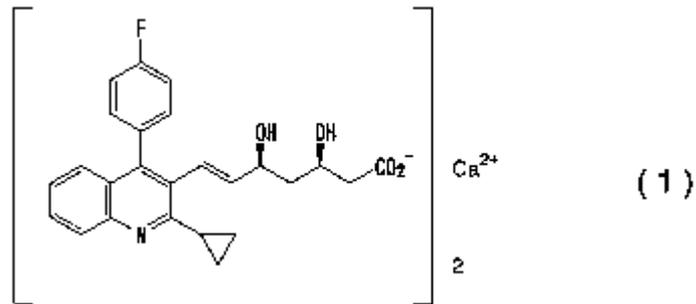
被告は、他社から調達した被告原薬を、被告製剤を製造するまでの間、原材料倉庫で保管している（以下、被告原薬を保管する方法を「被告方法」という。）。(乙 4 5)

## (3) 本件各発明の構成要件（以下、分説した構成要件をそれぞれの符号に従い「構成要件 A」のようにいう。）

ア 本件発明 1-1 を構成要件に分説すると、次のとおりである。

A 式(1)

【化1】



で表される化合物であり、

B 7～13%の水分を含み、

C1 CuK $\alpha$ 放射線を使用して測定するX線粉末解析において、4.96°、6.72°、9.08°、10.40°、10.88°、13.20°、13.60°、13.96°、18.32°、20.68°、21.52°、23.64°、24.12°及び27.00°の回折角(2 $\theta$ )にピークを有し、

C2 かつ、30.16°の回折角(2 $\theta$ )に、20.68°の回折角(2 $\theta$ )のピーク強度を100%とした場合の相対強度が25%より大きなピークを有することを特徴とする

D ピタバスタチンカルシウム塩の結晶

E (但し、示差走査熱量測定による融点95℃を有するものを除く)。

イ 本件発明1-2を構成要件に分説すると、次のとおりである。

F 請求項1に記載のピタバスタチンカルシウム塩の結晶を含有することを特徴とする

G 医薬組成物。

ウ 本件訂正発明1-1を構成要件に分説すると、次のとおりである(なお、式(1)の構造式【化1】は、上記アと同じであるため、記載を省略する。以下同様。)

A 式(1)で表される化合物であり、

- B 7～13%の水分を含み、
- C1 CuK $\alpha$ 放射線を使用して測定するX線粉末解析において、4.96°、6.72°、9.08°、10.40°、10.88°、13.20°、13.60°、13.96°、18.32°、20.68°、21.52°、23.64°、24.12°及び27.00°の回折角(2 $\theta$ )にピークを有し、
- C2 かつ、30.16°の回折角(2 $\theta$ )に、20.68°の回折角(2 $\theta$ )のピーク強度を100%とした場合の相対強度が25%より大きなピークを有し、
- X 7～13%の水分量において医薬品の原薬として安定性を保持することを特徴とする
- D' 粉碎されたピタバスタチンカルシウム塩の結晶
- E (但し、示差走査熱量測定による融点95℃を有するものを除く)。
- エ 本件訂正発明1-2を構成要件に分説すると、次のとおりである。
- F 請求項1に記載のピタバスタチンカルシウム塩の結晶を含有することを特徴とする
- G 医薬組成物。
- オ 本件発明2を構成要件に分説すると、次のとおりである。
- C' CuK $\alpha$ 放射線を使用して測定するX線粉末解析において、4.96°、6.72°、9.08°、10.40°、10.88°、13.20°、13.60°、13.96°、18.32°、20.68°、21.52°、23.64°、24.12°、27.00°及び30.16°の回折角(2 $\theta$ )にピークを有し、かつ、
- B 7重量%～13重量%の水分を含む、
- A 式(1)で表される、
- D ピタバスタチンカルシウム塩の結晶

- E (但し、示差走査熱量測定による融点 95℃を有するものを除く)を、
- H その含有水分が4重量%より多く、15重量%以下の量に維持することを特徴とする
- I ピタバスタチンカルシウム塩の保存方法。

## 2 争点

- (1) 被告原薬の使用及び被告製剤の製造・販売が本件特許権1を侵害するか
  - ア 本件発明1-1について
    - (ア) 被告原薬(被告原薬を含有する被告製剤を含む。)が本件発明1-1の技術的範囲に属するか(争点(1))
    - (イ) 本件発明1-1に係る特許の無効理由の有無(争点(2))
    - (ウ) 本件訂正により上記(イ)の無効理由が解消したか(争点(3))
  - イ 本件発明1-2について
    - (ア) 被告製剤が本件発明1-2の技術的範囲に属するか(争点(4))
    - (イ) 本件発明1-2に係る特許の無効理由の有無(争点(5))
    - (ウ) 本件訂正により上記(イ)の無効理由が解消したか(争点(6))
- (2) 被告方法の使用が本件特許権2を侵害するか
  - ア 被告方法が本件発明2の技術的範囲に属するか(争点(7))
  - イ 本件特許2の無効理由の有無(争点(8))

## 3 争点に関する当事者の主張

- (1) 争点(1)(被告原薬(被告原薬を含有する被告製剤を含む。)が本件発明1-1の技術的範囲に属するか)について

[原告の主張]

- ア 本件発明1-1は、結晶形態Aのピタバスタチンカルシウム塩を対象とする発明である。構成要件C1、C2の15本の回折角の数値は、結晶形態Aを特定するためのものである。あるピタバスタチンカルシウム塩の結晶が結晶形態Aであるか否かは、その結晶の粉末X線回折測定で得られた

X線チャートにおいて、上記15個のピークのいずれかに相当すると考えられるピークが結晶形態を特定するのに十分な数だけ測定されたか否かで判断される。具体的には、結晶の同一性は、回折角が±0.2°程度であれば同一と判断できる。また、10本以上のピークが確認されれば十分であり、場合によっては、それより少なくても同一と判断できることもある。

イ 被告製剤から回収した被告原薬を波長 0.75 Å の放射光を用いて解析したところ、別紙物件目録(1)記載のとおり、4.98°、6.79°、9.13°、10.39°、10.87°、13.20°、13.61°、14.03°、18.36°、20.64°、21.58°、23.56°、24.17°、26.98°、30.30°の回折角(2θ)にピークがあり、これは、「結晶形態A」の回折角とほぼ同一であるから、被告原薬は、「結晶形態A」であると推定される。したがって、被告原薬(被告原薬を含有する被告製剤を含む。)は、本件発明1-1の技術的範囲に属する。

ウ 個別の構成要件について説明する。

(ア) 構成要件Aについて

被告原薬は、ピタバスタチンカルシウム塩の結晶形態Aであるから、構成要件Aを充足する。

(イ) 構成要件Bについて

平成26年2月28日付け厚生労働省告示第47号で告知された第16改正日本薬局方第2追補(以下「16局」という。)において、ピタバスタチンカルシウム水和物が日本薬局方に収載された。16局に収載されたピタバスタチンカルシウム水和物は、結晶形態Aと同じ5水和物であり、水分量は9~13%である。したがって、被告原薬は、結晶形態Aである以上、構成要件Bを充足する。

(ウ) 構成要件C1について

上記アのとおり，結晶形態Aは，構成要件C 1，C 2の回折角のピークを有する結晶である。被告原薬は，結晶形態Aである以上，構成要件C 1を充足する。

(エ) 構成要件C 2について

本件発明1-1において30.16°のピークの相対強度を規定した理由は，アモルファスと区別するためである。結晶形態Aは，その構造解析から，理論的に算定したピーク強度は25.3%であるから（甲23），アモルファスではない結晶形態Aであれば，この相対強度の要件が充足されることが強く推定される。結晶形態Aの「未粉碎品」の相対強度は約13%であったが，「粉碎品」の相対強度は25%である（甲53）。被告製剤の製造に際して，被告原薬は数μmから10μm程度まで細かく機械粉碎することが必須であり，そのように粉碎すれば，結晶形態Aである被告原薬の30.16°の相対強度は25%を超える。したがって，被告原薬は，結晶形態Aである以上，構成要件C 2を充足する。

(オ) 構成要件Dについて

被告原薬は，ピタバスタチンカルシウム塩の結晶形態Aであるから，構成要件Dを充足する。

(カ) 構成要件Eについて

被告製剤はリバロ錠の後発医薬品として発売されているところ，リバロ錠には融点は存在せず，また，被告製剤のインタビューフォームには融点の記載がない。したがって，被告製剤は，リバロ錠と同様に，融点のない原薬を用いているものと推定され，構成要件Eを充足する。

[被告の主張]

ア 原告は，本件発明1-1の結晶が「結晶形態A」の結晶であると主張する。しかし，特許請求の範囲の記載には「結晶形態A」なる文言はなく，

明細書における発明の詳細な説明においても「結晶形態A」の正確な定義はないから、本件発明1-1の結晶を「結晶形態A」に置き換えることは失当であり、原告の主張は、本件発明1-1の構成要件と被告原薬の対比を明確に行っていない。したがって、被告原薬が構成要件A, B, C1, C2, D, Eを充足するとの原告の主張は争う。

イ 少なくとも、被告原薬が構成要件C2を充足することの立証はない。

ウ したがって、被告原薬（被告原薬を含有する被告製剤を含む。）は、本件発明1-1の技術的範囲に属しない。

(2) 争点(2)（本件発明1-1に係る特許の無効理由の有無）について

ア 乙1に基づく新規性又は進歩性の欠如について

[被告の主張]

本件特許1の優先日より前に頒布された刊行物である国際公開公報(WO2003/064392号)、特表2005-520814号公報(乙1の1・2。以下「文献1」という。)には、ピタバスタチンカルシウム塩に係る発明であること、10.6%(w/w)の水を含む白色結晶性粉末を得たことが記載されている。文献1にはX線粉末回折ピーク及び融点が記載されていないが、文献1に記載された発明を忠実に追試した結果、構成要件C1, C2, Eを満たす結晶を得ることができた。したがって、本件発明1-1は、文献1に記載された発明と同一であるか、これに基づいて当業者が容易に発明できたものである。

[原告の主張]

文献1に記載された発明は、ピタバスタチンカルシウム塩の発明であり、融点が95℃でないものであるが、その余の点は本件発明1-1と相違する。被告の行った追試は本件発明1-1の開示を知って可能となったものである。したがって、本件発明1-1は、文献1に記載された発明と同一でないし、これに基づいて当業者が容易に発明できたものでもない。

イ 乙2に基づく進歩性の欠如について

[被告の主張]

本件特許1の優先日よりも前に頒布された刊行物である特開平5-148237号公報(乙2。以下「文献2」という。)には、ピタバスタチンカルシウム塩に係る発明であること、白色結晶を得たことが記載されている。文献2には水分量、X線粉末回折ピーク及び融点が記載されていないが、文献2に記載された発明を忠実に追試した結果、構成要件B、C1、C2、Eを満たす結晶を得ることができた。したがって、本件発明1-1は、文献2に記載された発明に基づいて当業者が容易に発明できたものである。

[原告の主張]

文献2に記載された発明は、ピタバスタチンカルシウム塩の発明であり、融点が95℃でないものであるが、その余の点は本件発明1-1と相違する。被告の行った追試は本件発明1-1の開示を知って可能となったものである。したがって、本件発明1-1は、文献2に記載された発明に基づいて当業者が容易に発明できたものでもない。

ウ 乙7に基づく先願主義違反(特許法39条1項)について

[被告の主張]

本件特許1の優先日よりも前の優先日を有する特許第5192147号公報(乙7。以下「文献3」という。)の請求項1に記載された発明はピタバスタチンカルシウム塩に係る発明であり、含水量が3~12%であり、構成要件C1に対応するX線粉末回折ピークを有し、回折角20.68°に対応するピークの強度に対する回折角30.16°に対応するピークの相対強度が25%以下に限定されていない。また文献3の請求項3に記載された発明は請求項1の結晶多形のうち融点が95℃のものであるから、その上位発明である請求項1の発明は融点が95℃でないものを含む。そ

うであるから、本件発明 1-1 は文献 3 の請求項 1 に記載された発明と同一であり、本件発明 1-1 は最先の特許出願ではない。

[原告の主張]

文献 3 の請求項 1 に記載された発明と本件発明 1-1 とは、回折角の相対強度、融点について相違するので、同一の発明ではない。

(3) 争点(3) (本件訂正により本件発明 1-1 に係る特許の無効理由が解消したか) について

[原告の主張]

ア 本件訂正により無効理由は解消する。

本件訂正により、本件訂正発明 1-1 は、「7～13%の水分量において医薬品の原薬として安定性を保持する」という要件が追加され、さらに、医薬品の原薬として、「粉碎されたピタバスタチンカルシウム塩」に限定された。したがって、仮に文献 1 に本件発明 1-1 が開示されているとしても、本件訂正発明 1-1 は新規なものである。

また、本件訂正発明 1-1 の明細書に記載された実施例の方法で製造した結晶は、粉碎した状態で医薬品の原薬として十分な安定性を示すことを見いだしたものであるから、文献 1 及び 2 記載の発明から容易に想到し得ない発明である。

イ 被告原薬 (被告原薬を含有する被告製剤を含む。) は、本件訂正発明 1-1 の技術的範囲に属する。

(ア) 本件訂正発明 1-1 は、訂正前の請求項に、構成要件 X 及び構成要件 D' を付加したものである。そして、被告原薬が構成要件 A, B, C 1, C 2, E を充足することは上記(1) [原告の主張] のとおりである。

(イ) また、「7～13%の水分量」については、構成要件 B と同じ要件であり、被告製剤に用いられている原薬であるから「医薬品の原薬」であり、上記の水分量であれば、粉碎された状態であっても、医薬品の原

薬として実用上問題がない程度に高純度を維持することが可能になるから、「医薬品の原薬として安定性を保持することを特徴とする」ということができる。したがって、被告原薬は、構成要件Xを充足する。

さらに、被告原薬は被告製剤を製造するに当たり、1mg、2mgという微量な原薬を製剤化するためには、原薬を粒子に粉砕する必要があるから、被告製剤に含まれる原薬が粉砕されたピタバスタチンカルシウム塩の結晶であることは明らかである。したがって、被告原薬は、構成要件D'を充足する。

(ウ) 以上のとおり、被告原薬（被告原薬を含有する被告製剤を含む。）は、本件訂正発明1-1の技術的範囲に属する

ウ 本件訂正発明1-1に記載要件違反はない。

(ア) 明確性要件（特許法36条6項2号）について

「7～13%の水分量において医薬品の原薬として安定性を保持することを特徴とする」という特許請求の範囲の記載は、当業者の技術常識からしてその内容を明確に理解することができるから、特許を受けようとする発明は明確である。

(イ) サポート要件（特許法36条6項1号）について

a 本件訂正発明1-1の結晶を製造する方法について、不適切な不純物を生ずるためにその結晶の品質を低下せしめる製造方法が存在することが見いだされたとしても、そのことにより、本件訂正発明1-1が、明細書の発明の詳細な説明に記載された発明ではないとはいえない。

b 本件明細書1には、結晶の粉砕を行った実施例の記載はないが、実施例の記載をもって、本件明細書1に記載されたデータが、未粉砕品を測定したものだとする根拠はない。したがって、本件訂正発明1-1は、明細書の発明の詳細な説明に記載された発明でないとはいえない。

い。

[被告の主張]

ア 本件訂正により無効理由は解消しない。

本件訂正により追加された「医薬品の原薬として安定性を保持」する点は、文献1ないし文献2記載の発明との相違点ということとはできず、また、本件明細書1には、結晶を粉砕して原薬に用いることの格別優れた効果が記載されていないから、結晶を粉砕することは設計事項に過ぎない。そうであるから、本件訂正発明1-1は、文献1ないし文献2記載の発明及び技術常識に基づいて当業者が容易に発明できたものである。

イ 被告原薬（被告原薬を含有する被告製剤を含む。）は、本件訂正発明1-1の技術的範囲に属しない。

(ア) 被告原薬が構成要件A, B, C1, C2, X, D', Eを充足するとの原告の主張は争う。被告原薬は、少なくとも、構成要件C2, X及びD'を充足しない。すなわち、被告原薬が構成要件C2を充足することの立証がないことは前記(1)[被告の主張]のとおりである。また、「医薬品の原薬として安定性を保持」するとは、特別な保存手段を講じることなく3年間安定であるという意味であるが、この点の立証はないし、被告は、被告製剤の製造承認に際して、被告製剤の保存安定性の試験を行ったが、原薬の安定性は確認していないから、被告原薬は構成要件Xを充足しない。さらに、原告は、被告製剤を製造するためには被告原薬を粉砕する必要があると主張するが、結晶化の際に微細な結晶が析出した場合は粉砕工程を経なくても小さい粒径の結晶となるため、粉砕工程は不要であるから、被告原薬は構成要件D'を充足しない。

(イ) よって、被告原薬（被告原薬を含有する被告製剤を含む。）は、本件訂正発明1-1の技術的範囲に属しない。

ウ 本件訂正発明1-1には記載要件違反がある。

(ア) 明確性要件違反（特許法 36 条 6 項 2 号）について

「7～13%の水分量において医薬品の原薬として安定性を保持することを特徴とする」という特許請求の範囲の記載は、特許を受けようとする発明が明確でない。

(イ) サポート要件違反（特許法 36 条 6 項 1 号）について

a 本件訂正発明 1-1 は、製造方法を限定していない発明であるにもかかわらず、本件明細書 1 には実施例 1 以外の製造方法で製造したピタバスタチンカルシウム塩結晶が原薬として安定であることは記載されていない。したがって、本件訂正発明 1-1 は、明細書の発明の詳細な説明に記載された発明ではない。

b 本件訂正発明 1-1 は、粉砕されたピタバスタチンカルシウム塩の結晶が医薬品の原薬として安定性を保持することを構成要件としているが、本件明細書 1 には、結晶の粉砕を行った実施例の記載はない。したがって、本件訂正発明 1-1 は、明細書の発明の詳細な説明に記載された発明ではない。

(4) 争点(4)（被告製剤が本件発明 1-2 の技術的範囲に属するか）について

[原告の主張]

上記(1)[原告の主張]のとおり、被告原薬は本件発明 1-1 の技術的範囲に属するものであり、被告製剤は、被告原薬を含有する医薬組成物であるから、構成要件 F、G を充足する。

[被告の主張]

被告製剤が、構成要件 F、G を充足するとの原告の主張は争う。

(5) 争点(5)（本件発明 1-2 に係る特許の無効理由の有無）について

ア 乙 1 に基づく新規性又は進歩性の欠如について

[被告の主張]

前記(2)ア[被告の主張]のとおり、本件発明 1-1 は文献 1 記載の発明

と同一であるか、これに基づいて容易に発明できたものである。また、医薬の薬効成分を含む医薬組成物は周知技術である。したがって、本件発明 1-2 は、文献 1 記載の発明と同一であるか、これに基づいて当業者が容易に発明できたものである。

[原告の主張]

前記(2)ア[原告の主張]のとおり、本件発明 1-1 は、文献 1 記載の発明と同一でないし、これに基づいて当業者が容易に発明できたものでもないから、当然、本件発明 1-2 も文献 1 記載の発明と同一でないし、これに基づいて当業者が容易に発明できたものでもない。

イ 乙 2 に基づく進歩性の欠如について

[被告の主張]

前記(2)イ[被告の主張]のとおり、本件発明 1-1 は文献 2 記載の発明に基づいて容易に発明できたものである。また、医薬の薬効成分を含む医薬組成物は周知技術である。したがって、本件発明 1-2 は、文献 2 記載の発明に基づいて当業者が容易に発明できたものである。

[原告の主張]

前記(2)イ[原告の主張]のとおり、本件発明 1-1 は、文献 2 記載の発明に基づいて当業者が容易に発明できたものではないから、当然、本件発明 1-2 も文献 2 記載の発明に基づいて当業者が容易に発明できたものではない。

ウ 乙 7 に基づく先願主義違反（特許法 39 条 1 項）について

[被告の主張]

文献 3 の請求項 6 に記載された発明は、「請求項 1～3 のいずれか一項に記載の結晶多形 A の有効量と、薬学的に許容され得る担体とを含む医薬組成物。」である。また、文献 3 の請求項 1 に記載された発明は前記(2)ウ [被告の主張]のとおり本件発明 1-1 と同一である。そうであるから、本

件発明 1 - 2 は文献 3 の請求項 6 に記載された発明と同一であり、本件発明 1 - 2 は最先の特許出願ではない。

[原告の主張]

被告の主張は争う。

(6) 争点(6) (本件訂正により本件発明 1 - 2 に係る特許の無効理由が解消したか) について

[原告の主張]

ア 本件訂正により無効理由は解消する。

前記(3)[原告の主張]アのとおり、本件訂正発明 1 - 1 は、新規であり、かつ、文献 1、文献 2 記載の発明から容易に想到し得ない発明であるから、本件訂正発明 1 - 2 も同様である。

イ 被告製剤は、本件訂正発明 1 - 2 の技術的範囲に属する。

前記(3)[原告の主張]イのとおり、被告原薬は、本件訂正発明 1 - 1 の技術的範囲に属するから、これを用いて製造した被告製剤は、本件訂正発明 1 - 2 の技術的範囲に属する。

ウ 本件訂正発明 1 - 2 に記載要件違反はない。

明確性要件 (特許法 36 条 6 項 2 号) 及びサポート要件 (特許法 36 条 6 項 1 号) のいずれについても、本件訂正発明 1 - 1 の場合 (前記(3)[原告の主張]ウ) と同様である。

[被告の主張]

ア 本件訂正により無効理由は解消しない。

本件訂正発明 1 - 2 は、本件訂正発明 1 - 1 の場合 (前記(3)[被告の主張]ア) と同様に、文献 1 ないし文献 2 記載の発明及び技術常識に基づいて当業者が容易に発明できたものである。

イ 被告原薬は本件訂正発明 1 - 2 の技術的範囲に属しない。

本件訂正発明 1 - 1 の場合 (前記(3)[被告の主張]イ) と同様に、被告

製剤が本件訂正発明 1 - 2 の技術的範囲に属するとの原告の主張は争う。

ウ 本件訂正発明 1 - 2 には記載要件違反がある。

本件訂正発明 1 - 2 には、本件訂正発明 1 - 1 の場合（前記(3)[被告の主張]ウ）と同様に、明確性要件違反（特許法 3 6 条 6 項 2 号）及びサポート要件違反（特許法 3 6 条 6 項 1 号）がある。

(7) 争点(7)（被告方法が本件発明 2 の技術的範囲に属するか）について

[原告の主張]

ア 前記(1)[原告の主張]のとおり、被告原薬は本件発明 1 - 1 の技術的範囲に属するから、被告方法は、構成要件 A, B, C', D, E を充足する。

イ 被告製剤に用いられる被告原薬は、結晶形態 A であるから、製剤化する前の水分量は 4 重量%より多く 1 5 重量%以下に維持して保存していることは確実である。また、被告製剤中に結晶形態 A がその結晶形態のまま含まれている。したがって、被告方法は、構成要件 H, I を充足する。

ウ よって、被告方法は、本件発明 2 の技術的範囲に属する。

[被告の主張]

ア 被告方法が、構成要件 A, B, C', D, E, H, I を充足するとの原告の主張は争う。

イ 本件発明 2 の構成要件 H は、ピタバスタチンカルシウム塩の結晶の含有水分量を測定して、その含有水分量に応じて、下限値の 4 重量%を超え、上限値の 1 5 重量%以下になるように、水分量調節の操作を加える行為と解釈すべきである。被告は、被告原薬の含有水分量を測定していないから、水分量調節の操作をしていない。したがって、被告方法は、少なくとも構成要件 H を充足しない。

ウ よって、被告方法は、本件発明 2 の技術的範囲に属しない。

(8) 争点(8)（本件特許 2 の無効理由の有無）について

ア 乙 1 に基づく新規性又は進歩性の欠如について

[被告の主張]

前記(2)ア[被告の主張]のとおり、本件発明1-1は文献1記載の発明と同一であるか、これに基づいて容易に発明できたものである。

また、本件発明2のうち本件発明1-1にない構成要件Hについては、化合物の製造後の保存が通常、密閉した瓶などの容器の中の気密条件下で行われることは当業者の技術常識であるところ、7～13重量%の水分を含むピタバスタチンカルシウム塩の結晶が気密条件下で維持されると、その含有水分量に変化がない。

したがって、本件発明2は、文献1記載の発明と同一であるか、これに基づいて当業者が容易に発明できたものである。

[原告の主張]

前記(2)ア[原告の主張]のとおり、本件発明1-1は、文献1記載の発明と同一でないし、これに基づいて当業者が容易に発明できたものでもない。また、化合物の製造後の保存を密閉した瓶などの容器の中の気密条件下で行うことは当業者の技術常識ではない。したがって、本件発明2は、文献1記載の発明と同一でないし、これに基づいて当業者が容易に発明できたものでもない。

イ 乙2に基づく進歩性の欠如（特許法29条2項）について

[被告の主張]

前記(2)イ[被告の主張]のとおり、本件発明1-1は文献2記載の発明に基づいて容易に発明できたものである。また、構成要件Hについても、上記アのとおりである。したがって、本件発明2は、文献2記載の発明に基づいて当業者が容易に発明できたものである。

[原告の主張]

上記ア[原告の主張]と同様に、本件発明2は、文献2記載の発明に基づいて当業者が容易に発明できたものではない。

ウ 乙7に基づく先願主義違反（特許法39条1項）について

[被告の主張]

前記(2)ウ[被告の主張]のとおり，本件発明1-1は文献3の請求項1記載の発明と同一である。また，構成要件Hについても，上記ア[被告の主張]のとおりである。そうであるから，本件発明2は文献3の請求項1記載の発明と同一であり，本件発明2は最先の特許出願ではない。

[原告の主張]

文献3の請求項1記載の発明と本件発明2とは相違点があるので，同一の発明ではない。

エ 補正要件違反（特許法17条の2第3項）について

[被告の主張]

平成25年3月8日付け手続補正により，本件発明2は，「7重量%～13重量%の水分を含み」との構成及び「その含有水分が4重量%より多く，15重量%以下の量に維持する」との構成を含む構成となった。しかし，かかる構成は，願書に最初に添付した明細書（乙35。以下「当初明細書」という。），特許請求の範囲又は図面に記載した事項の範囲内でない。

[原告の主張]

当初明細書の記載（段落【0002】，【段落0009】）をみれば，当業者は，水分量を4%より多く，15%以下に維持すれば，ピタバスタチンカルシウム塩を安定して保存し得ることが開示されていると理解する。したがって，本件発明2の「7重量%～13重量%の水分を含み」との構成及び「その含有水分が4重量%より多く，15重量%以下の量に維持する」との構成は，当初明細書に記載された事項である。

オ 分割要件違反（特許法44条1項）に基づく進歩性欠如について

[被告の主張]

本件特許2の特許出願は，本件特許1の特許出願の一部を新たな特許出

願としたものである。しかし、本件明細書1には、水分値を5～15%に調整する結晶の原薬の製造方法が記載されているが、結晶の保存方法に関する記載は一切なく、「維持」及び「保存方法」の各文言の記載もない。したがって、本件特許2の分割出願は不適法であるから、その出願日は現実の出願日である平成23年11月29日となる。

そうすると、本件発明2は、その出願前に頒布された本件特許1の特許出願の公表特許公報（乙34）記載の発明から当業者が容易に発明することができたものである。すなわち、上記公表特許公報には、保存方法であることの記載、水分量を「4重量%より多く、15重量%以下に維持する」旨の記載がない点において本件発明2と相違し、他は同一であるところ、これらの相違点は、上記公表特許公報記載の発明から容易に推考することができた。

[原告の主張]

本件明細書1の記載（段落【0008】、【0010】、【0023】）をみれば、構成要件Bの水分量の結晶形態Aを、4～15%の水分量に維持することで保存中の安定性が向上することが開示されている。したがって、本件特許2の特許出願は、分割要件を満たすものである。

カ サポート要件違反（特許法36条6項1号）について

[被告の主張]

本件発明2には、保存開始時に水分量が7重量%でありながら、保存期間中に含有水分量が当初の2倍以上となる15重量%で維持する保存方法が含まれているが、本件明細書2には、保存開始時よりも水分量が多くなる保存に関する記載がない。そうであるから、本件発明2は、発明の詳細な説明に記載されていないものである。

[原告の主張]

本件明細書2には、保存開始時よりも水分量が多くなる保存に関する記

載がある（段落【0001】、【0009】、【0025】、【0035】）。そうであるから、本件発明2は、発明の詳細な説明に記載されているものである。

### 第3 当裁判所の判断

#### 1 被告原薬の使用及び被告製剤の製造・販売が本件特許権1を侵害するか

(1) 争点(1)（被告原薬（被告原薬を含有する被告製剤を含む。）が本件発明1-1の技術的範囲に属するか）について

ア まず、本件発明1-1の構成要件C1、C2の充足性を検討する。

(ア) 上記の構成要件は次のとおりである（前記前提事実）。

C1 CuK $\alpha$ 放射線を使用して測定するX線粉末解析において、4.96°、6.72°、9.08°、10.40°、10.88°、13.20°、13.60°、13.96°、18.32°、20.68°、21.52°、23.64°、24.12°及び27.00°の回折角（2 $\theta$ ）にピークを有し、

C2 かつ、30.16°の回折角（2 $\theta$ ）に、20.68°の回折角（2 $\theta$ ）のピーク強度を100%とした場合の相対強度が25%より大きなピークを有することを特徴とする

(イ) 本件明細書1の「発明の詳細な説明」欄には、次の各記載がある（甲2の1）。

「本発明は、HMG-CoA還元酵素阻害剤として高脂血症の治療に有用な、化学名 Monocalcium bis[(3R,5S,6E)-7-(2-cyclopropyl-4-(4-fluorophenyl)-3-quinolyl)-3,5-dihydroxy-6-heptenoate]によって知られている結晶性形態のピタバスタチンカルシウム塩及びこの該化合物と医薬的に許容し得る担体を含有する医薬組成物に関するものである。」（段落【0001】）

「医薬品の原薬としては、高品質及び保存上から安定な結晶性形態を有

することが望ましく，さらに大規模な製造にも耐えられることが要求される。ところが，従来のピタバスタチンカルシウムの製造法においては，水分値や結晶形に関する記載が全くない。本発明のピタバスタチンカルシウム塩の結晶（以下，結晶性形態Aともいう。）に，一般的に行なわれるような乾燥を実施すると，乾燥前は，図1で示すような粉末X線回折図示したものが，水分が4%以下になったところで図2に示すようにアモルファスに近い状態まで結晶性が低下することが判明した。さらに，アモルファス化したピタバスタチンカルシウムは表1に示す如く，保存中の安定性が極めて悪くなることも明らかとなった。」（段落【0008】）

「本発明者らは，水分と原薬安定性の相関について鋭意検討を行なった結果，原薬に含まれる水分量を特定の範囲にコントロールすることで，ピタバスタチンカルシウムの安定性が格段に向上することを見出した。さらに，水分が同等で結晶形が異なる形態を3種類見出し，その中で，CuK $\alpha$ 放射線を使用して測定した粉末X線回折図によって特徴づけられる結晶（結晶性形態A）が，最も医薬品の原薬として好ましいことを見出し，本発明を完成させた。」（段落【0010】）

「結晶形態A以外の2種類を結晶形態B及び結晶形態Cと略記するが，これらはいずれも結晶形態Aに特徴的な回折角10.40°，13.20°及び30.16°のピークが存在しないことから，結晶多形であることが明らかにされる。これらは，ろ過性が悪く，厳密な乾燥条件が必要であり（乾燥中の結晶形転移），NaClなどの無機物が混入する危険性を有し，更に結晶形制御の再現性が必ずしも得られないことが明らかであった。したがって，工業的製造法の観点からは欠点が多く，医薬品の原薬としては結晶形態Aが最も優れている。」（段落【0014】）

「結晶性形態Aのピタバスタチンカルシウムは，その粉末X線回折パタ

ーンによって特徴付けることができる。」続いて、別紙「結晶性形態Aの粉末X線回折パターン」のとおり記載がある。(段落【0016】)

「反応混合物を減圧下に蒸留して溶媒を留去し、52.2kgのエタノール/水を除去後、内温を10~20°Cに調整した。得られた濃縮液中に、別途調製しておいた塩化カルシウム水溶液(95%CaCl<sub>2</sub> 775g/水 39.3kg, 6.63mol)を2時間かけて滴下した。全量の塩化カルシウム水溶液を反応系に送り込むため、4.70kgの水を使用した。滴下終了後、同温度で12時間攪拌を継続し、析出した結晶を濾取した。結晶を72.3kgの水で洗浄後、乾燥器内で減圧下40°Cにて、品温に注意しながら、水分値が10%になるまで乾燥することにより、2.80kg(収率95%)のピタバスタチンカルシウムを白色の結晶として得た。粉末X線回折を測定して、この結晶が結晶形態Aであることを確認した。」(段落【0033】)

(ウ) 以上にに基づき、構成要件C1, C2の回折角について検討する。

まず、特許請求の範囲の請求項1の記載によれば、本件発明1-1は構成要件C1, C2において小数点以下2桁まで規定された回折角により15本のピークが特定されており、その数値に一定範囲の誤差が許容される旨の記載や、15本のうちの一部のピークのみによって特定が可能である旨の記載は一切ない。したがって、特許請求の範囲の記載に基づけば、本件発明1-1の構成要件C1, C2を充足するためには、そこに規定された15本のピーク全てについて回折角の数値が小数点以下2桁まで一致することを要すると解するのが自然な理解である。

このような解釈は、本件明細書1の記載からも裏付けられる。すなわち、同明細書の発明の詳細な説明の記載をみると、本件発明1-1は、ピタバスタチンカルシウム原薬に含まれる水分量を特定の範囲にコントロールすることでその安定性が格段に向上すること、及び、水分が同等で結晶形が異なる形態を3種類見だし(結晶形態A, B, C)、この

中でCuK $\alpha$ 放射線を使用して測定した粉末X線回折図によって特徴付けられる結晶形態Aが医薬品の原薬として最も好ましいことを見いだしたものとされ、そして、結晶形態B及びCは、結晶形態Aに特徴的な3本のピーク（10.40°、13.20°及び30.16°の回折角のピーク）が存在しないことによって結晶形態Aと区別されるものとされる（段落【0010】【0014】）。そうすると、構成要件C1、C2の小数点以下2桁の数値で特定される15本のピークのうち上記の3本のみが結晶形態B、Cとの区別の根拠とされていることになる。そして、本件明細書1には、上記のように、結晶形態Aは構成要件C1、C2に小数点以下2桁まで規定される15本の回折角の粉末X線回折パターンによって特徴付けられるとされるほかに、結晶形態Aを特定する記載はなく（段落【0008】、【0010】、【0016】、【0033】参照）、上記特許請求の範囲の記載について述べたのと同様に、回折角の数値に一定範囲の誤差が許容される旨の記載や、15本のうちの一部のピークのみによって特定が可能である旨の記載は見当たらない。

このように、特許請求の範囲及び明細書の記載によれば、本件発明1-1の技術的範囲に属するというためには、構成要件C1、C2に規定された15本のピーク全てについて回折角の数値が小数点以下2桁まで一致することを要すると解すべきである。

(エ) しかるところ、原告は、被告原薬に含まれるピタバスタチンカルシウム塩における15本のピークの回折角（ $2\theta$ ）は、別紙物件目録(1)記載のとおり4.98°、6.79°、9.13°、10.39°、10.87°、13.20°、13.61°、14.03°、18.36°、20.64°、21.58°、23.56°、24.17°、26.98°、30.30°である旨主張するが、仮に、原告の主張を前提としても、そのうち14本のピークの数値は構成要件C1、C2の回

折角の数値と小数点第2位まで一致してはいないから、被告原薬は構成要件C1、C2を充足せず、これを含有する被告製剤も構成要件C1、C2を充足しない。

(オ) この点につき、原告は、被告原薬が結晶形態Aに当たるから本件発明1-1の構成要件C1、C2を充足する旨主張する。しかし、特許発明の技術的範囲は特許請求の範囲の記載に基づいて定められるのであるから（特許法70条1項）、構成要件C1、C2の回折角の充足性は、特許請求の範囲において記載のない結晶形態Aを介在させることなく、直接、構成要件C1、C2の回折角の数値を全て充足するか否かにより判断すべきものである。したがって、原告の上記主張は採用することができない。

また、原告は、日本薬局方及び日本薬局方技術情報の記載によれば、X線回折法において $\pm 0.2^\circ$ 以内の誤差で一致するピークが10本以上確認されれば、結晶が同一であると判断することができるため、被告原薬は結晶形態Aと同一であるから、本件発明1-1の構成要件C1、C2を充足する旨主張する。しかし、上記のとおり、特許請求の範囲に記載のない結晶形態Aを介在させて被告原薬と本件発明1-1の構成要件C1、C2を対比させることは相当でないし、特許請求の範囲や明細書には、回折角の数値に一定範囲の誤差が許容される旨の記載や、15本のうちの一部のピークのみによって特定が可能である旨の記載は見当たらないのであるから、原告の上記主張も、特許請求の範囲や明細書の記載に基づかないものであり、採用することができない。

イ したがって、他の構成要件について検討するまでもなく、被告原薬（被告原薬を含有する被告製剤を含む。）は本件発明1-1の技術的範囲に属しない。

(2) 争点(4)（被告製剤が本件発明1-2の技術的範囲に属するか）について

本件発明 1 - 2 の構成要件 F は、「請求項 1 に記載のピタバスタチンカルシウム塩の結晶を含有することを特徴とする」というものであり、本件発明 1 - 2 は、本件発明 1 - 1 を引用する発明である。しかるところ、上記説示のとおり、被告製剤に用いられている被告原薬は、本件発明 1 - 1 の技術的範囲に属さないから、被告原薬を含有する被告製剤は、構成要件 F を充足しない。

したがって、他の構成要件について検討するまでもなく、被告製剤は本件発明 1 - 2 の技術的範囲に属しない。

(3) 以上によれば、争点(2)、(3)、(5)及び(6)について判断するまでもなく、被告原薬の使用及び被告製剤の製造・販売行為は、本件特許権 1 を侵害しない。

## 2 被告方法の使用が本件特許権 2 を侵害するか

(1) 争点(7) (被告方法が本件発明 2 の技術的範囲に属するか) について

本件発明 2 の構成要件 C' は、本件発明 1 - 1 の構成要件 C 2 における相対強度の点を除いて、本件発明 1 - 1 の構成要件 C 1 及び C 2 と共通するものである (前記前提事実)。また、本件明細書 2 の「発明の詳細な説明」欄には、上記 1 で検討した本件明細書 1 の記載と概ね同趣旨の記載がある (甲 2 の 2)。そうであるから、前記説示のとおり、被告原薬が本件発明 1 - 1 の構成要件 C 1 を充足すると認められないのと同様に、被告原薬を保存する方法である被告方法は、本件発明 2 の構成要件 C' を充足しない。したがって、被告方法は、本件発明 2 の技術的範囲に属するとは認められない。

(2) 以上によれば、争点(8)について検討するまでもなく、被告方法の使用行為は、本件特許権 2 を侵害しない。

## 3 結論

よって、原告の請求は、いずれも理由がないから、これを棄却することとし、主文のとおり判決する。

東京地方裁判所民事第47部

裁判長裁判官 沖 中 康 人

裁判官三井大有及び裁判官藤田壮は、転補につき署名押印することができない。

裁判長裁判官 沖 中 康 人

(別紙)

物件目録 (1)

放射光粉末回折法 (0.75 Å放射線使用) において, 下記回折角 (括弧内に CuK $\alpha$ 放射線における粉末回折法の場合の対応する回折角を示す) にピークの認められる  
ピタバスタチンカルシウム原薬

2.42°	(4.98°)
3.30°	(6.79°)
4.44°	(9.13°)
5.05°	(10.39°)
5.28°	(10.87°)
6.41°	(13.20°)
6.61°	(13.61°)
6.81°	(14.03°)
8.90°	(18.36°)
10.00°	(20.64°)
10.45°	(21.58°)
11.40°	(23.56°)
11.69°	(24.17°)
13.03°	(26.98°)
14.61°	(30.30°)

(別紙)

物件目録 (2)

下記商品名のピタバスタチンカルシウム製剤

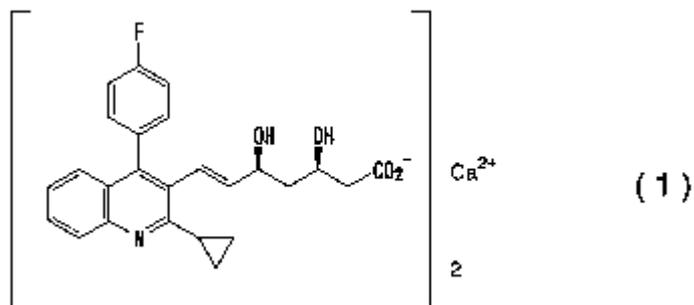
- (1) ピタバスタチンC a 錠 1 m g 「サワイ」
- (2) ピタバスタチンC a 錠 2 m g 「サワイ」
- (3) ピタバスタチンC a 錠 4 m g 「サワイ」

(別紙)

訂正後の請求項 1 の記載 (訂正箇所を下線を付した。)

式(1)

【化 1】



で表される化合物であり，7～13%の水分を含み，CuK $\alpha$ 放射線を使用して測定するX線粉末解析において，4.96°，6.72°，9.08°，10.40°，10.88° 13.20°，13.60°，13.96°，18.32°，20.68°，21.52°，23.64°，24.12°及び27.00°の回折角(2 $\theta$ )にピークを有し，かつ，30.16°の回折角(2 $\theta$ )に，20.68°の回折角(2 $\theta$ )のピーク強度を100%とした場合の相対強度が25%より大きなピークを有し，7～13%の水分量において医薬品の原薬として安定性を保持することを特徴とする粉砕されたピタバスタチンカルシウム塩の結晶(但し，示差走査熱量測定による融点95℃を有するものを除く)。

【10.88°と13.20°の間に「,」がないのは原文のまま】

(別紙)

結晶性形態Aの粉末X線回折パターン

---

回折角 ( $2\theta$ ) ( $^{\circ}$ )	d-面間隔	相対強度 ( $>25\%$ )
4.96	17.7999	35.9
6.72	13.1423	55.1
9.08	9.7314	33.3
10.40	8.4991	34.8
10.88	8.1248	27.3
13.20	6.7020	27.8
13.60	6.5053	48.8
13.96	6.3387	60.0
18.32	4.8386	56.7
20.68	4.2915	100.0
21.52	4.1259	57.4
23.64	3.7604	41.3
24.12	3.6866	45.0
27.00	3.2996	28.5
30.16	2.9607	30.6

---