

平成29年9月29日判決言渡 同日原本領収 裁判所書記官

平成27年(ワ)第30872号 特許権侵害差止請求事件

口頭弁論終結日 平成29年3月24日

判 決

5 原 告 興 和 株 式 会 社
同 訴 訟 代 理 人 弁 護 士 北 原 潤 一
同 佐 志 原 将 吾
同 補 佐 人 弁 理 士 中 嶋 俊 夫
同 鈴 木 智 久
10 同 見 澤 茂 樹
被 告 東 和 薬 品 株 式 会 社
同 訴 訟 代 理 人 弁 護 士 新 保 克 芳
同 洞 敬
同 酒 匂 禎 裕

15 主 文

- 1 被告は、別紙物件目録記載の製品を製造し、販売し、又は販売の申出
をしてはならない。
- 2 被告は、前項の製品を廃棄せよ。
- 3 この判決は、第1項に限り、仮に執行することができる。
- 20 4 訴訟費用は、被告の負担とする。

事 実 及 び 理 由

第1 請求

主文第1項及び第2項と同旨

第2 事案の概要等

25 1 事案の要旨

本件は、発明の名称を「医薬」とする特許第5190159号の特許権（以下「本

件特許権」といい、その特許を「**本件特許**」という。また、本件特許の願書に添付した明細書を「**本件明細書**」という。）を有する原告が、別紙物件目録記載の名称（販売名）の医薬品（錠剤とその包装からなる。以下「**被告製品**」という。）は、本件特許の願書に添付した特許請求の範囲（以下「**本件特許請求の範囲**」という。）の請求項2記載の発明（以下「**本件発明2**」といい、本件特許のうち同発明に係るものを「**本件発明2についての特許**」という。）の技術的範囲に属するから、被告が被告製品を製造し、販売し、販売の申出をすることは、本件特許権を侵害する行為であると主張して、被告に対し、特許法100条1項に基づき、被告製品の製造、販売及び販売の申出の差止めを求めるとともに、同条2項に基づき、被告製品の廃棄を求める事案である（なお、原告は、請求原因として、被告製品が本件特許請求の範囲の請求項1記載の発明〔以下「**本件発明1**」という。〕の技術的範囲に属することも主張していたが、平成29年3月24日の第9回弁論準備手続期日において、「請求項1に基づく請求は撤回する」旨述べ、被告は、同期日において、これについては「異議はない」旨述べた。）。

被告は、被告製品が本件発明2の技術的範囲に属することを認めた上で、①被告が被告製品につき先使用权（特許法79条）を有すること、②本件発明2が進歩性を欠き（同法29条2項）、本件発明2についての特許が特許無効審判により無効にされるべきものであること（同法104条の3第1項）を主張し、争っている。

2 前提事実等（当事者間に争いが無いが、後掲の証拠及び弁論の全趣旨により容易に認められる事実関係。なお、書証番号は、特記しない限り枝番の記載を省略する。）

(1) 当事者

原告及び被告は、いずれも医薬品の製造、販売等を業とする株式会社である。

(2) 本件特許権

ア 原告は、次の事項により特定される本件特許権を有している（甲1、2）。

特 許 番 号 特許第5190159号

発明の名称 医薬

出願日 平成24年8月8日（以下「**本件出願日**」という。）

出願番号 特願2012-546269号

国際出願番号 PCT/JP2012/070163

5 登録日 平成25年2月1日

特許請求の範囲 別紙特許公報写しの【特許請求の範囲】欄記載のとおり

イ(ア) 本件発明1（本件特許請求の範囲の請求項1記載の発明）は、次のとおり、構成要件に分説することができる（以下、分説に係る各構成要件を符号に対応して「**構成要件A**」などという。）。

10 A： 次の成分（A）及び（B）：

（A）ピタバスタチン又はその塩；

（B）カルメロース及びその塩，クロスポビドン並びに結晶セルロースよりなる群から選ばれる1種以上；

を含有し，かつ，

15 B： 水分含量が2.9質量%以下である固形製剤が，

C： 気密包装体に収容して

D： なる医薬品。

(イ) 本件発明2（本件特許請求の範囲の請求項2記載の発明）は、構成要件Aないし同D（引用に係る本件特許請求の範囲の請求項1記載の発明の構成要件）と，

20 次のEのとおり，構成要件に分説することができる。

E： 固形製剤の水分含量が1.5～2.9質量%である，

(3) 被告の行為

ア 被告は，被告製品の製造，販売及び販売の申出をしている。

25 イ 被告製品は，有効成分であるピタバスタチンカルシウム水和物（ピタバスタチンカルシウムとして4mg）のほか，クロスポビドンを含有する錠剤（口腔内崩壊錠〔OD錠〕）をPTP包装してなる医薬品であり（甲3，4，5の2），構成

要件A、C及びDを充足する。被告製品を構成する錠剤（包装を含まない。以下「**被告錠剤**」という。なお、被告錠剤と被告製品の製造販売承認申請のために実施された各種試験に供する目的で製造された錠剤を総称して「**本件4mg錠剤**」という。）の水分含量は、1.5～2.9質量%の範囲内にあり（この範囲内にあるとの限度で、争いが無い。）、被告製品は、構成要件B及びEを充足する。したがって、被告製品は、本件発明2の構成要件を全て充足し、同発明の技術的範囲に属する（なお、被告は、被告錠剤の水分含量につき、被告の依頼した株式会社住化分析センターの測定結果では2.30重量%であった〔乙16〕として、原告の測定結果1.58～2.02質量%〔甲6〕については争っているものの、被告製品が本件発明2の技術的範囲に属することについては、認めている。）。

ウ 被告は、ピタバスタチンカルシウム水和物及びクロスポピドンを含有する錠剤（口腔内崩壊錠〔OD錠〕）をPTP包装してなる医薬品として、被告製品のほか、「ピタバスタチンCa・OD錠1mg『トーワ』」なる名称（販売名）の医薬品及び「ピタバスタチンCa・OD錠2mg『トーワ』」なる名称（販売名）の医薬品（以下「**本件2mg製品**」といい、本件2mg製品を構成する錠剤〔包装を含まない。〕と同製品の製造販売承認申請のために実施された安定性試験、生物学的同等性試験、その他の試験〔以下、これらを併せて「**治験**」という。〕に供する目的で製造された錠剤とを総称して「**本件2mg錠剤**」という。なお、本件2mg錠剤又は本件4mg錠剤であって、上市された製品を構成するものを「**実生産品**」と、治験に供されたものを「**サンプル薬**」という。）を製造販売している。

3 争点

(1) 被告は先使用権を有するか（争点1）

(2) 本件発明2についての特許は特許無効審判により無効とされるべきものか（争点2）

第3 争点に対する当事者の主張

1 争点1（被告は先使用権を有するか）について

【被告の主張】

(1) 被告の先使用权について

ア 被告は、後記(2)のとおり、本件出願日（平成24年8月8日）前から本件2 m g 製品に係る事業（同製品の製造販売）の準備を行っており、同製品に係る事業
5 について先使用权（特許法79条）を有する。そして、先使用权の範囲は、現に事業の準備をしていた特定の実施形式に限定されるものではなく、単なる設計変更など通常想定される実施形式にも及ぶところ、被告製品を構成する被告錠剤は、本件2 m g 製品を構成する本件2 m g 錠剤と成分（有効成分、添加物）及び剤形が全て
10 同一であって、同錠剤における各成分の量を単に2倍にしたものにすぎず、水分含量についても差がないから、被告製品は、本件2 m g 製品に関して被告が有する先使用权の範囲に属するものである。

イ 被告は、後記(3)のとおり、本件出願日前から被告製品それ自体に係る事業（被告製品の製造販売）の準備を行っているから、この点からも、被告製品に係る事業
15 について先使用权を有する。

(2) 本件2 m g 製品について

ア 被告は、本件2 m g 製品の製造販売に必要となる厚生労働大臣の承認を得るため、本件出願日（平成24年8月8日）までに、本件2 m g 錠剤の処方を決定し、
20 同処方に従ってサンプル薬を製造したものであるから、上記サンプル薬の製造を開始した時点において、事業（製造販売）の対象となる医薬品の内容が一義的に確定していたといえる。そして、被告は、本件2 m g 製品の承認申請のため、本件2 m g 錠剤のサンプル薬を使用して治験を実施し、安定性試験の一つである長期保存試験を除き、全て本件出願日までに完了した。被告の上記一連の行為は、特許法79
25 条にいう「事業の準備」に該当するから、被告は、本件2 m g 製品に関して先使用权を有するといえる。

イ 本件2 m g 錠剤の実生産品は、本件2 m g 錠剤のサンプル薬と成分及び剤形
30 が同一であり、以下のとおり、錠剤の水分含量にも違いがない。

(ア) 本件 2 m g 錠剤の実生産品（ロット番号：B 0 6 2）の水分含量（カールフイッシャー法による測定値）は、2. 2 4 %である（乙 1 6）。

本件 2 m g 錠剤のサンプル薬（ロット番号：P T V D - 2 0 3。錠剤製造後、P T P 包装とアルミピロー包装がされ、その状態のまま被告の中央研究所の検体倉庫で保存され、製造当時の水分含量が保持されていたもの。）の水分含量（カールフイッシャー法による測定値）は、2. 6 7 %である（乙 3 2）。

(イ) 本件 2 m g 錠剤のサンプル薬（ロット番号：P T V D - 2 0 3）は、●（省略）●その製造に用いられた A 顆粒及び B 顆粒（本件 2 m g 錠剤及び本件 4 m g 錠剤の製造に際しては、2 つの顆粒〔被告において、有効成分を含む一方の顆粒を「A 顆粒」、もう一方の顆粒を「B 顆粒」とそれぞれ呼んでいる。〕を別途製造し、両者を混合した上で打錠して錠剤としている。）の製造時の各水分含量（乾燥減量試験法による測定値）は、本件 2 m g 錠剤の実生産品（ロット番号：B 0 6 2）の製造に用いられた A 顆粒及び B 顆粒の製造時の各水分含量（乾燥減量試験法による測定値）と同等である。すなわち、本件 2 m g 錠剤のサンプル薬（ロット番号：P T V D - 2 0 3）及び本件 2 m g 錠剤の実生産品（ロット番号：B 0 6 2）の A 顆粒の乾燥減量は、同じ条件●（省略）●また、本件 2 m g 錠剤のサンプル薬（ロット番号：P T V D - 2 0 3）及び本件 2 m g 錠剤の実生産品（ロット番号：B 0 6 2）の B 顆粒の乾燥減量も、同じ条件で測定されており、●（省略）●したがって、本件 2 m g 錠剤のサンプル薬（ロット番号：P T V D - 2 0 3）及び本件 2 m g 錠剤の実生産品（ロット番号：B 0 6 2）の水分含量（乾燥減量試験法による A 顆粒及び B 顆粒の測定値に基づいて算出される値）は、●（省略）●同等であるといえる。

(3) 本件 4 m g 製品に関する先使用権の成立について

ア 被告は、被告製品（本件 4 m g 製品）の製造販売に必要となる厚生労働大臣の承認を得るため、本件出願日（平成 2 4 年 8 月 8 日）までに、本件 4 m g 錠剤の処方₂₅を決定し、同処方に従ってサンプル薬を製造したものであるから、上記サンプル薬の製造を開始した時点において、事業（製造販売）の対象となる医薬品の内容

が一義的に確定していたといえる。そして、被告は、被告製品（本件4mg製品）の承認申請のため、本件4mg錠剤のサンプル薬を使用して治験を実施し、本件出願日までに、安定性試験につき一定の結果を得ており、生物学的同等性確認のための溶出試験の本試験も完了していた。被告の上記一連の行為は、特許法79条にいう「事業の準備」に該当するから、被告は、被告製品（本件4mg製品）に関して先使用権を有するといえる。

イ 本件4mg錠剤の実生産品（被告錠剤）は、本件4mg錠剤のサンプル薬と成分及び剤形が同一であり、以下のとおり、錠剤の水分含量にも違いがない。

(ア) 本件4mg錠剤の実生産品（ロット番号：B012）の水分含量（カールフイッシャー法による測定値）は、2.30%である（乙16）。

本件4mg錠剤のサンプル薬（ロット番号：PTVD-303。錠剤製造後、PTP包装とアルミピロー包装がされ、その状態のまま被告の中央研究所の検体倉庫で保存され、製造当時の水分含量が保持されていたもの。）の水分含量（カールフイッシャー法による測定値）は、2.12%である（乙32）。

(イ) 本件4mg錠剤のサンプル薬（ロット番号：PTVD-303）は、平成24年3月27日の製造時には、錠剤としての水分含量の測定は行われていないが、その製造に用いられたA顆粒及びB顆粒の製造時の各水分含量（乾燥減量試験法による測定値）は、本件4mg錠剤の実生産品（ロット番号：B012）の製造に用いられたA顆粒及びB顆粒の製造時の各水分含量（乾燥減量試験法による測定値）

と同等である。すなわち、本件4mg錠剤のサンプル薬（ロット番号：PTVD-303）及び本件4mg錠剤の実生産品（ロット番号：B012）のA顆粒の乾燥減量は、同じ条件（本件2mg錠剤の場合と同じ）で測定されており、●（省略）

●また、本件4mg錠剤のサンプル薬（ロット番号：PTVD-303）及び本件4mg錠剤の実生産品（ロット番号：B012）のB顆粒の乾燥減量も、同じ条件で測定されており、●（省略）●）。したがって、本件4mg錠剤のサンプル薬（ロット番号：PTVD-303）及び本件4mg錠剤の実生産品（ロット番号：B0

1 2) の水分含量 (乾燥減量試験法による A 顆粒及び B の測定値に基づいて算出される値) は, ● (省略) ● 同等であるといえる。

【原告の主張】

(1) 被告の主張は, 否認し又は争う。

5 (2) 以下のとおり, 被告が提出した証拠によっては, 本件 2 m g 錠剤のサンプル薬及び本件 4 m g 錠剤のサンプル薬が, その製造当時, 本件発明 2 の構成要件 E を備えていたことが立証されたとはいえない。

10 そもそも, 実生産品とサンプル薬とは少なくとも B 顆粒の水分含量の管理範囲が異なっているから, サンプル薬が実生産品と同じ工程により製造されているとはいえない。

15 また, 本件 2 m g 錠剤のサンプル薬 (ロット番号: P T V D - 2 0 3) 及び本件 4 m g 錠剤のサンプル薬 (ロット番号: P T V D - 3 0 3) について被告が主張する水分含量 (カールフィッシャー法による測定値) は, これらのサンプル薬が製造された当時のものではないところ, P T P 包装やアルミピロー包装をしていても吸湿性があることは, 多くの医薬品について確認されているところであって (甲 1 5, 1 9), 上記サンプル薬についても, 保存中に水分含量が増加している可能性が高く, 製造時に本件発明 2 の構成要件 E を備えていたことが立証されたとはいえない。

20 被告は, 本件 2 m g 錠剤のサンプル薬 (ロット番号: P T V D - 2 0 3) 及び本件 4 m g 錠剤のサンプル薬 (ロット番号: P T V D - 3 0 3) の製造に用いられた A 顆粒及び B 顆粒の製造時の各水分含量 (乾燥減量試験法による測定値) 並びにこれに基づいて算出されるサンプル薬の水分含量に基づく主張もするが, 被告の主張するカールフィッシャー法による測定値との間に大きな乖離がある。日本薬局方が水分測定法としてカールフィッシャー法と乾燥減量試験法を挙げている (甲 2 0) のは, 両者の測定値に大きな乖離がないことを前提とするものと理解できるし, 25 実際にもほとんど異ならないこと (甲 1 3) からすれば, 上記サンプル薬が, その製造時に本件発明 2 の構成要件 E を備えていたことが立証されたとはいえない。

(3) 仮に、本件 2 m g 錠剤のサンプル薬（ロット番号：P T V D - 2 0 3）及び本件 4 m g 錠剤のサンプル薬（ロット番号：P T V D - 3 0 3）が、その製造当時、構成要件 E を備えていたと認定されたとしても、被告が本件出願日までに製造していた他のロットについても、同様に構成要件 E を備えていたか否かは明らかでなく、
5 本件出願日までに、本件 2 m g 製品又は本件 4 m g 製品（被告製品）の内容が、本件発明 2 の構成要件 E を備えるものとして、一義的に確定していたことが立証されたとはいえない。

(4) 被告製品（本件 4 m g 製品）と本件 2 m g 製品とは、含量が異なることに起因して、疾患治療における位置付けが大きく異なること、溶出性についての規格及び試験方法が異なることからすれば、両者は、医薬品としての実質的な内容が異なるものというべきであるから、仮に、本件 2 m g 製品に関して先使用権が成立するとしても、被告製品（本件 4 m g 製品）にまで及ぶものではない。

2 争点 2（本件発明 2 についての特許は特許無効審判により無効とされるべきものか）について

15 【被告の主張】

(1) 被告主張の要旨

本件発明 2 は、以下のとおり、当業者が、本件出願日前に頒布された刊行物である特許第 4 9 8 1 1 9 4 号公報（乙 7。以下「**乙 7 公報**」という。）記載の発明（以下「**乙 7 発明**」という。）及び周知の技術事項（乙 8 ないし 1 4 参照）に基づいて、
20 容易に発明をすることができたものであって、進歩性を欠く。したがって、本件発明 2 についての特許は、特許無効審判により無効とされるべきものと認められるから、原告は、被告に対し、本件特許権を行使することができない（特許法 1 0 4 条の 3）。

(2) 乙 7 発明

25 乙 7 公報において、乙 7 発明は、ラクトン体の生成を抑制することを目的とし（【0 0 1 1】，【0 0 1 2】），口腔内崩壊型錠剤として所望の添加剤を加えて成形さ

れるものであって（【0055】）、製造例として、ピタバスタチンカルシウムと、クロスポピドン又は結晶セルロースを含む製剤として開示されている（【0089】、【表4】）。

(3) 乙7発明と本件発明2との一致点及び相違点

5 乙7発明は、ピタバスタチンカルシウムと、クロスポピドン又は結晶セルロースを含む医薬組成物である点で本件発明2と一致し、ラクトン体生成を抑制する目的を有している点でも同発明と共通するが、次の3点で相違する。

乙7発明は、塩化カルシウムなどのアルカリ土類金属塩化物を必須成分としているのに対し、本件発明2は、これを必須成分としていない点（以下「**相違点1**」という。）

10 本件発明2では、医薬組成物が気密包装体に収容されているのに対して、乙7発明では、この点が明示されていない点（以下「**相違点2**」という。）

本件発明2では、「固形製剤の水分含量が1.5～2.9質量%である」のに対し、乙7発明では、固形製剤の水分含量の数値範囲が限定されていない点（以下「**相違点3**」という。）

(4) 容易想到性について

ア 相違点1について

乙7発明は、塩化カルシウムなどのアルカリ土類金属塩化物を必須成分としており、本件発明2は、本件特許請求の範囲の記載ではこれを必須成分としていないが、
20 本件明細書に記載された処方例（【表2】、【表5】ないし【表7】）は、その多くが塩化カルシウムを含んでいることからすれば、相違点1は、実質的なものではない。

イ 相違点2について

本件発明にいう「気密包装体」は、日本薬局方にも規定されているような通常の
25 気密包装を行ったものにすぎない（本件明細書【0046】）ところ、乙7発明では、医薬組成物が気密包装体に収容されていることが明示されていないものの、医

薬組成物が気密包装されることは、技術常識であるから、当業者であれば、相違点2に係る本件発明2の構成に容易に想到し得たものである。

ウ 相違点3について

5 (ア) 相違点3に係る本件発明2の構成（固形製剤の水分含量の数値範囲）は、次のとおり、本件出願日における周知の技術事項（乙8ないし14参照）を参酌することにより、当業者が適宜設定し得る範囲であった。

(イ) 本件出願日において、次の事項が周知であった。

まず、医薬組成物一般において薬物の分解をもたらす水分が製剤中に存在しないように乾燥させることは、技術常識であった（乙8ないし10）。

10 そして、特表2010-533210号公報（乙11）には、HMG-C_oA還元酵素（レダクターゼ）阻害剤と、クロスポビドンからなり、水分含量を5%未満、好ましくは3%未満とする医薬組成物が開示されている（【請求項3】，【0015】，【0016】など）。同公報には、「本発明の第一の態様の別の実施形態は、5%未満の水分・・・を含む」（【0015】），「5%未満の水分を含む」（【請求項3】）との記載があり、その効果も開示されている（【0041】）から、当業者は、これらの記載のとおり、水分含量のコントロールを試みるのであって、水分含量が具体的な裏付けをもって開示されているといえる。なお、「HMG-C_oAレダクターゼ阻害剤」には、ピタバスタチンが含まれる（本件明細書【0002】など）。

20 また、中国特許出願公開第1969849号明細書（乙12）には、ピタバスタチンと微結晶セルロースを含む、乾燥後の粒子の水分が0.73%又は0.51%である医薬組成物が開示し、その作用効果として、ラクトン体の生成抑制も確認している（訳文6頁）。

さらに、特表2013-536219号公報（乙13。なお、同公報は、2012年3月1日の国際公開第2012/025939号公報と同内容である。）には、25 水分量を約5% w t / w t 未満としてラクトン体等の生成を防止した、安定なピタ

バスタチンカルシウムが開示されており、その作用効果として、ラクトン体や5-オキソ（本件明細書にいう「5-ケト体」と同じ。）の抑制も確認している（【請求項1】，【0020】，【表1】など）。

加えて、中国特許出願公開第101195603号明細書（乙14）には、「含水率0.5～3%である請求項1に記載のピタバスタチンカルシウム新結晶形」として、含水率0.5～3%（実施例1～3は、含水率1.5%、2.7%、0.6%）の安定なピタバスタチンカルシウムの結晶形が示されている。

(ウ) 以上のとおり、本件出願日当時、①医薬組成物において薬物の分解をもたらす水分が製剤中に存在しないように乾燥させることは、技術常識であったこと（乙8ないし10）、②ラクトン体等の生成を抑制して安定にするため、HMG-CoA還元酵素阻害剤とクロスポビドンを含有して製剤としての水分量を5%未満（好ましくは3%未満）としたものが知られており（乙11）、ピタバスタチンと微結晶セルロースを含有して製剤としての水分量を0.73%、0.51%としたものも知られており（乙12）、ピタバスタチンカルシウム原薬について、含水量を低減させるとラクトン体等の不純物の生成が抑制され安定となることから、結晶形態にかかわらず（乙13）あるいは特定の結晶形態（乙14）において、知られていたことからすれば、乙7発明に接した当業者は、ラクトン体の生成を可能な限り少なくするため、上述した周知の技術事項に基づき、水分量を低減させて「1.5～2.9質量%」と適宜規定することができた。また、その効果も、医薬品として不純物が少ないという以上に、格別のものではない。

なお、本件発明2は、固形製剤の水分含量の下限値を「1.5%」としているが、本件明細書を見ても、1.5%の実験値があるほかは、当該下限値とすることの意義は記載も示唆もされておらず、むしろ、実際には、製剤の水分量をあまり低くできないことが知られている（乙10）ことからすれば、乙12号証記載の製剤の水分量と実質的な相違があるとはいえない。

したがって、相違点3に係る本件発明2の構成は、当業者が容易に想到し得たも

のである。

【原告の主張】

(1) 以下のとおり、本件出願日当時、被告主張の理由により、当業者が相違点3に係る本件発明2の構成に容易に想到することができたとはいうことはできないから、同発明が進歩性を欠くという被告主張は、失当である。

(2) 本件発明2は、それ自体は安定な物質であるピタバスタチンについて、カルメロースやクロスポピドンといった特定の崩壊剤を混合することに伴って水分に対して不安定になるという課題を見だし、それを解決するために、当該混合によって得られた混合物の水分含量を減少させたものである。

これに対し、乙7発明は、アルカリ土類金属塩化物を必須の解決手段としており、ピタバスタチンの安定化（すなわち、ラクトン体の生成の抑制）という課題が未解決のものとして存在するものではないから、乙7発明について、ラクトン体の生成を抑制しようという動機付けがない。

(3) 乙8号証ないし乙10号証に記載された知見は、アスピリンやビタミンなど水分に対して不安定な物質に当てはまるにすぎず、ピタバスタチン又はその塩のように水分に対して安定な物質について水分含量を減少させることを動機付けるものではない。

乙11号証には、ピタバスタチンについての記載がなく、水分含量を規定することによる記載もないから、同号証は、水分含量を限定することによる効果につき、裏付けをもって開示するものではない。

乙12号証は、水分含量に着目したものでなく、水分含量を限定することによる作用効果として、ラクトン体の生成抑制を確認したものではない。

乙13号証は、ピタバスタチンカルシウム原薬の水分含量について記載したもので、本件発明2が対象とするピタバスタチンカルシウムを含有する医薬品（錠剤）に関する水分量とは無関係であり、含水率が5% w t / w t 未満で特定の結晶性形態のピタバスタチンの原薬が安定であったことを開示するにすぎない。

乙14号証は、単に、特定の水分値を有するピタバスタチンの結晶性形態を見いだしたことを開示するものにすぎない。

(4) 被告は、本件明細書に固形成分の水分量の下限を1.5%とする意義が記載も示唆もされていない旨主張するが、本件明細書には、固形成分の水分含量を1.5%以上とした場合、ラクトン体とは別の分解物である5-ケト体の生成を抑制できることが明確に記載されている（【0025】、【0068】、【0069】）。

また、乙12号証記載のものは、水分含量がいずれも1.5%を下回っているから、同号証の開示に基づいて相違点3に係る本件発明の2の構成に想到し得るものではない。

第4 当裁判所の判断

1 争点1（被告は先使用权を有するか）について

(1) 先使用权の成否について

被告は、先使用权の成立を基礎付ける事実として、本件出願日（平成24年8月8日）までに、本件2mg錠剤のサンプル薬を製造して本件2mg製品の製造販売承認の申請に必要な治験を実施したことや、本件4mg錠剤のサンプル薬を製造して被告製品（本件4mg製品）の製造販売承認の申請に必要な治験を実施したことを主張する。

しかしながら、後記(2)のとおり、本件出願日（平成24年8月8日）までに、被告の社内において、本件発明2の内容を知らないでこれと同じ内容の発明がされていた（被告が被告の従業員等から当該発明を知得していた）と認めることは困難であるし、この点を措くとしても、後記(3)のとおり、本件出願日までに、本件2mg製品及び被告製品（本件4mg製品）の内容が、本件発明2の構成要件Eを備えるものとして、一義的に確定していたと認めることはできず、本件発明2を用いた事業について、被告が即時実施の意図を有し、かつ、その即時実施の意図が客観的に認識される態様、程度において表明されていたとはいえないから、被告に先使用权が成立したということとはできない。

(2) 被告において本件発明2と同じ内容の発明がされていたか否かについて

ア 被告は、本件2mg製品及び被告製品（本件4mg製品）が本件発明2の技術的範囲に属することを前提とした上、本件2mg錠剤のサンプル薬が本件2mg錠剤の実生産品と同一処方、同一工程により製造され、また、本件4mg錠剤のサンプル薬が被告錠剤（本件4mg錠剤の実生産品）と同一処方、同一工程により製造されていた旨主張し、それゆえ、本件2mg錠剤のサンプル薬及び本件4mg錠剤のサンプル薬がそれぞれ本件発明2の構成要件Eを備えていたものである旨主張する。

しかし、被告の提出に係る書証からは、実生産品とサンプル薬が同一の工程により製造されたものであると直ちに認めることは困難である。すなわち、本件で問題となるのは、「PTP包装してなる医薬品」を構成する「錠剤」の「水分含量」が「1.5～2.9質量%」の範囲となるよう管理されていたか否かであるところ、水分は、有効成分でないばかりか、積極的な添加物でもなく、不純物として扱われるものでもないため、錠剤が製造された後、PTP包装された状態で、錠剤の水分含量がいかなる値となるかという観点から工程の同一性を論じるためには、被告の提出に係る全ての書証をもってしても、情報が不足しているというほかはない（少なくとも、打錠工程の湿度環境や打錠後の保管条件は、PTP包装された錠剤の水分含量に影響するといわざるを得ないが、被告の提出にかかる書証では、これらの条件は明らかにされていない。）。

イ 被告は、本件2mg錠剤のサンプル薬（ロット番号：PTVD-203）及び本件4mg錠剤のサンプル薬（ロット番号：TVD-303）の水分含量について、いずれも本件発明2の構成要件Eの数値範囲内にあったと主張し、乙32号証（以下「**乙32実験報告書**」という。）を提出する。

しかし、乙32実験報告書に示される本件2mg錠剤のサンプル薬（ロット番号：PTVD-203）及び本件4mg錠剤のサンプル薬（ロット番号：TVD-303）の水分含量の測定値は、これらの錠剤が製造されたとされる日から4年以上が

経過した時点のものである。そして、被告ないし同報告書の説明するところによれば、これらの錠剤は、その製造後、PTP包装とアルミピロー包装がされ、その状態により、被告の中央研究所の検体保管庫に温度20℃、成り行き湿度（実測値：75%RH）で保存されていたものであり、検体1錠をPTP包装から取り出して、
5 乳鉢で粉砕してカールフィッシャー法により水分測定を行ったというのであるが、上記の条件下で4年以上が経過しても、錠剤の水分含量がそのまま保持されることを直接裏付ける証拠はない。

かえって、①本件2mg製品の使用期限が2年6か月とされ、本件4mg製品（被告製品）の使用期限が3年とされていること（甲4〔52頁〕）からすれば、4年
10 以上という期間は、予定されている保存期間を大きく超えるものであって、水分含量を含む錠剤の状態に影響を及ぼす可能性を否定できないこと、②ピタバスタチンからラクトンが生成する反応は、脱水縮合であって、水が脱離することから、水分含量増加の原因となり得ること、③アルミピロー包装に使用される材料の防湿性が高いことがうかがわれる（乙33）としても、PTP包装された上記サンプル薬を
15 収納したアルミピロー包装には、チャックがついていて（乙32, 39）、当該材料のみでは構成されてはおらず、また、湿気等の影響を受けやすい商品の包装には十分に注意する必要があるとされていること（甲18）、④PTP包装やアルミピロー包装が施された他の医薬品について、所定の保存期間経過後に水分含量が増加していると思われる例があること（甲15, 19）などからすれば、PTP包装と
20 アルミピロー包装により、直ちに上記サンプル薬の水分含量の増加が完全に抑えられていたと断ずることは、困難である。

被告は、上記サンプル薬の水分含量がそれぞれ本件2mg錠剤の実生産品（ロット番号：B062）及び本件4mg錠剤の実生産品（ロット番号：B012）とほぼ
25 同じ値であることから、保存期間中の吸湿の可能性が否定される旨主張するようであるが、かかる被告の立論は、本件2mg錠剤のサンプル薬が本件2mg錠剤の実生産品と同一の工程により製造され、また、本件4mg錠剤のサンプル薬が被告

錠剤（本件 4 m g 錠剤の実生産品）と同一の工程により製造されていたことを前提とするものであるところ、既に説示したとおり、本件 2 m g 錠剤のサンプル薬及び本件 4 m g 錠剤のサンプル薬が、それぞれ本件 2 m g 錠剤の実生産品や本件 4 m g 錠剤の実生産品（被告錠剤）と同一の工程により製造されたと認めるに足りる証拠はないものというべきである。

ウ 被告は、A 顆粒と B 顆粒の水分含量がほぼそのまま錠剤の水分含量となるとした上、実生産品とサンプル薬とは、A 顆粒と B 顆粒の乾燥減量試験法による水分含量（乾燥減量）と両顆粒の混合比をもとに算出した水分含量（乾燥減量）が同程度である旨の主張もする。

しかし、本件 2 m g 錠剤の実生産品（ロット番号：B 0 6 2）及び本件 4 m g 錠剤の実生産品（ロット番号：B 0 1 2）につき、製造指図書（乙 2 4，2 6 の 1）に示される A 顆粒と B 顆粒の水分含量（乾燥減量）●（省略）●これらの値は、被告がカールフィッシャー法で測定したとする水分含量（前者につき 2. 2 4，後者につき 2. 3 0〔乙 1 6〕）の半分程度という不可解な値となっているにもかかわらず、被告は、この点につき合理的な説明をしていない（被告は、原告が本件 2 m g 錠剤の実生産品〔ロット番号：B 0 8 7〕及び本件 4 m g 錠剤の実生産品〔ロット番号：B 0 2 3〕につき乾燥減量試験法とカールフィッシャー法により水分含量を測定したところ、同程度の値となったとしていること〔甲 1 3〕について、測定条件が不明であるなどと主張しているが、被告自身におけるカールフィッシャー法と乾燥減量試験法による結果の齟齬について、合理的に説明できていない。）。

エ 以上より、本件 2 m g 錠剤のサンプル薬（ロット番号：P T V D - 2 0 3）及び本件 4 m g 錠剤のサンプル薬（ロット番号：T V D - 3 0 3）の水分含量が、製造後、P T P 包装された状態で、1. 5 質量%を下回るものであった可能性を直ちに否定することは困難であり、他に本件 2 m g 錠剤のサンプル薬及び本件 4 m g 錠剤のサンプル薬（いずれも上記のロット番号に限らない）の P T P 包装された状態での水分含量が、本件発明 2 の構成要件 E の数値範囲内にあったものと認めるに

足りる証拠はない。

したがって、本件出願日（平成24年8月8日）までに、被告の社内において、本件発明2の内容を知らないでこれと同じ内容の発明がされていた（被告が被告の従業員等から当該発明を知得していた）と認めることはできない。

5 (3) 本件2mg製品及び本件4mg製品（被告製品）の内容が一義的に確定していたか否かについて

仮に、本件2mg錠剤のサンプル薬であるPTVD-203及び本件2mg錠剤のサンプル薬であるPTVD-303の水分含量が、その製造当時、本件発明2の構成要件Eの数値範囲内にあったとしても、以下のとおり、直ちに本件2mg製品
10 及び本件4mg製品（被告製品）の内容が一義的に確定していたということはできない。

すなわち、成分及び工程それ自体が同様であったとしても、A顆粒及びB顆粒の各水分含量が管理範囲の上限付近にあるか、下限付近にあるか、また、これらの顆粒や混合され、打錠された錠剤が、PTP包装されるまでどのように保管されるか
15 により、PTP包装された錠剤の水分含量は、相違し得るものというべきであるから、特定のロット番号のサンプル薬（PTVD-203、PTVD-303）が本件発明2の構成要件Eを備えていたとしても、他のロットの錠剤がどのような水分含量であったかは明らかでなく、同構成要件を備えているか否かは不明であるという
20 ほかはない（なお、被告は、乾燥減量試験法による測定値であるとして、本件2mg錠剤のサンプル薬〔ロット番号：PTVD-203〕の治験薬製造指図書〔乙23〕に示されるA顆粒及びB顆粒の水分含量（乾燥減量）に加え、本件2mg錠剤のサンプル薬〔ロット番号：PTVD-201及びPTVD-202〕についても、治験薬製造指図書〔乙41〕に示されるA顆粒及びB顆粒の水分含量（乾燥減量）を開示し、これらの値及び両顆粒の混合比をもとに算出した水分含量（乾燥減
25 量）が、●（省略）●である旨説明する。被告が、乾燥減量試験法による測定値とカールフィッシャー法による測定値の不自然な乖離について、合理的な説明をして

いないことは、前記(2)ウのとおりであるが、この点をひとまず措いて、仮に、上記被告の説明に係る値を前提とするならば、PTVD-201は、本件発明2の構成要件Eを備えていなかったものと考えられる。この点、被告は、PTVD-201のB顆粒の水分含量（乾燥減量）が測定エラーであるとするのであるが、被告は、
5 そのように判断することができる客観的な根拠を示しているとはいえない。）。

したがって、本件出願日までに、本件2mg製品及び本件4mg製品（被告製品）の内容が、本件発明2の構成要件Eを備えるものとして、一義的に確定していたと認めることはできず、本件発明2を用いた事業について、被告が即時実施の意図を有し、かつ、その即時実施の意図が客観的に認識される態様、程度において表明さ
10 れていたとはいえない。

(4) 小括

上記検討したところによれば、被告について先使用権の成立を認めることはできない。

2 争点2（本件発明2についての特許は特許無効審判により無効とされるべき
15 ものか）について

(1) 被告は、本件発明2は、当業者が乙7発明及び周知の技術事項（具体的には、乙8ないし14に示される技術事項）に基づいて容易に発明をすることができたものであって、進歩性を欠く旨主張する。

しかし、以下のとおり、被告の上記主張は採用することができない。

(2) 乙7公報によれば、乙7発明は、「スタチン類のラクトン体生成を抑制する新たな手段を提供することを目的とする」（【0011】）ものであり、「塩化カルシウム、塩化マグネシウムなどのアルカリ土類金属塩化物が、スタチン類をはじめとする・・・HMG-CoA還元酵素阻害活性を有する化合物のラクトン体生成を抑制する作用を有することを見出し」（【0012】）たことに基づくものであ
25 った。同発明の「医薬組成物は、剤形に応じて、日本薬局方、米国薬局方、欧州薬局方等に記載の公知の方法により、製造することができ・・・口腔内崩壊型錠剤（以

下、「OD錠」と称する。）」（【0055】）の製造例として、【表4】記載の成分及び分量（mg）を1錠中に含有する口腔内崩壊型錠剤を得たというものである（【0088】）。

そうすると、乙7発明は、ピタバスタチンカルシウムと、クロスポピドン又は結晶セルロースを含む医薬組成物であって、塩化カルシウムなどのアルカリ土類金属塩化物を必須成分とするものであることが認められる。

(3) 本件発明2と乙7発明とを対比すると、両発明は、ピタバスタチンカルシウムと、クロスポピドン又は結晶セルロースを含む医薬組成物である点で一致するものの、①本件発明2では医薬組成物が気密包装体に収容されているのに対して、乙7発明では医薬組成物が気密包装体に収容されているか否かが明らかでない点（以下「**相違点①**」という。）、②本件発明2では「固形製剤の水分含量が1.5～2.9質量%である」のに対し、乙7発明では固形製剤の水分含量が「1.5～2.9質量%」の数値範囲にあるか否かが明らかでない点（以下「**相違点②**」という。）において相違するものと認められる（なお、本件発明2は、本件特許請求の範囲の記載上、塩化カルシウムなどのアルカリ土類金属塩化物を含有することを排除していないばかりか、本件明細書の【0089】、【表4】などの記載によれば、これを含有しても構わないことが明らかであるから、被告主張の相違点1は、本件発明2と乙7発明との相違点とはならない。）。

(4) 相違点②について検討する。

本件発明2は、固形製剤の「水分含量が2.9質量%以下である」こと（構成要件B）に加え、「固形製剤の水分含量が1.5～2.9質量%である」（構成要件E）と規定しており、固形製剤の水分含量が上記の数値範囲内にあることが相違点②に係る本件発明2の構成であるところ、本件明細書の【0010】、【0025】、【0057】ないし【0070】、【表1】ないし【表4】などの記載に照らせば、本件発明2は、ラクトン体（ピタバスタチン又はその塩の脱水縮合物）の生成抑制の観点から上記数値範囲の上限（2.9質量%）を規定し、5-ケト体（ラクトン

体とは別の分解物)の生成抑制の観点から上記数値範囲の下限(1.5質量%)を規定したものと理解される。

他方、乙7公報に接した当業者において、同公報の【表4】記載の各製造例に係る固形製剤(口腔内崩壊型錠剤〔OD錠〕)を追試するなどして、(A)ピタバスタチン又はその塩と(B)カルメロース及びその塩、クロスポビドン並びに結晶セルロースよりなる群から選ばれる1種以上とを含有する固形製剤を得た上、これを気密包装体に収容してなる医薬品を得ることが容易であったとしても、乙7公報の記載上、上記追試等において固形製剤の水分含量が本件発明2の数値範囲に含まれる値となるべきものと認めるべき根拠はなく、また、固形製剤の水分含量(殊にその下限値)と5-ケト体の生成抑制との関係についての示唆等は見当たらない。

また、被告が無効理由を裏付けるものとして提出したその余の書証(乙8ないし14)の記載上、ピタバスタチン又はその塩を含有する医薬製剤の水分含量(殊にその下限値)と5-ケト体の生成抑制との関係についての示唆等は見当たらない。

当業者であれば、一般論としては、当該固形製剤の水分含量を低く調整することを試みることが容易であるといえるとしても、上記各書証に、ピタバスタチン又はその塩を含有する医薬製剤の水分含量をあえて本件発明2の数値範囲の下限である「1.5質量%」を下回らないようにすることの動機付けとなる記載があるとはいえない。すなわち、乙7公報に接した当業者が当該固形製剤の水分含量を低く調整しようとした場合には、当然に「1.5~2.9質量%」の数値範囲内となるものとはいえない(例えば、乙12号証記載のものでは、水分含量が本件発明2における下限値を下回っている。)ばかりか、その値が「1.5質量%」を下回る可能性を否定することができないのであって、当該固形製剤の水分含量を「1.5~2.9質量%」の数値範囲内とすることが容易であったとは認めることは、困難である。

したがって、当業者といえども、乙7発明から出発して、相違点②に係る本件発明2の構成に想到することは、容易ではなかったものというべきである。

なお、被告は、本件明細書の【表4】には、水分含量が1.5質量%未満のデー

タが存在しないから、本件発明2における水分含量の数値範囲の下限値の意義が不明である旨主張するが、本件明細書において当該下限値の臨界的意義が具体的な技術的裏付けを伴って明らかにされているとはいえないとしても、そのことによって、当業者であつても相違点②に係る本件発明2の構成に想到することは容易でなかつたとする上記認定判断が直ちに左右されるものとはいえない。

(5) 上記検討したところによれば、本件発明2についての特許は、被告主張の理由及び証拠によっては、無効とされるべきものとは認めることができない。

第5 結論

以上によれば、原告の本件請求は理由があるから、これを認容することとし、主文のとおり判決する。なお、主文第2項については、仮執行の宣言は相当でないから、これを付さないこととした。

東京地方裁判所民事第29部

裁判長裁判官

嶋 末 和 秀

裁判官

天 野 研 司

裁判官鈴木千帆は、転補のため、署名押印することができない。

裁判長裁判官

嶋 末 和 秀

5

(別紙)

物件目録

ピタバスタチンCa・OD錠4mg「トーワ」