

平成27年6月25日判決言渡 同日原本領収 裁判所書記官

平成26年(ワ)第3344号 特許権侵害差止等請求事件(以下「甲事件」という。)

同年(ワ)第3345号 特許権侵害差止等請求事件(以下「乙事件」という。)

口頭弁論の終結の日 平成27年4月24日

判 決

東京都千代田区<以下略>

甲・乙事件原告	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

東京都千代田区<以下略>

甲事件被告	日本ケミフア株式会社
-------	------------

山形県天童市<以下略>

乙事件被告	日新製薬株式会社
上記2名訴訟代理人弁護士	大野聖二
	飯塚暁夫
	金本恵子
上記2名訴訟代理人弁理士	松任谷優子
	佐藤俊彦

主 文

- 1 甲・乙事件原告の請求をいずれも棄却する。
- 2 訴訟費用は、甲・乙事件を通じ、甲・乙事件原告の負担とする。

事 実 及 び 理 由

第1 請求

- 1 甲事件被告(以下「被告ケミファ」という。)及び乙事件被告(以下「被告日新」といい、被告ケミファと併せて「被告ら」という。)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 被告らは、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 被告ケミファは、別紙物件目録(2)記載(1)又は(2)の各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。
- 4 被告日新は、別紙物件目録(2)記載(3)又は(4)の各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甲・乙事件原告(以下「原告」という。)が、被告らにおいて、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を保存する行為が後者の特許権を侵害する旨主張して、被告らに対し、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(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が（以下、この訂正を「本件訂正」という。）、特許庁は、平成 27 年 3 月 27 日、「特許第 5186108 号の請求項 1 ないし 2 に係る発明についての特許を無効とする。」との審決をした。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」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 5267643 号（出願日・平成 23 年 11 月 29 日（特願 2006－520594 の分割）、原出願日・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 5 月 17 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) 被告らの行為

被告らは、ピタバスタチンカルシウム原薬（以下「被告ら原薬」という。）を用いたピタバスタチンカルシウム製剤の製造をそれぞれ第三者に委託し、製造された別紙物件目録(2)記載の各ピタバスタチンカルシウム製剤（以下これらを併せて「被告ら製剤」という。）のうち、被告ケミファにおいて同目録記載(1)及び(2)の各ピタバスタチンカルシウム製剤を、被告日新において同目録記載(3)及び(4)の各ピタバスタチンカルシウム製剤を、それぞれ販売している。

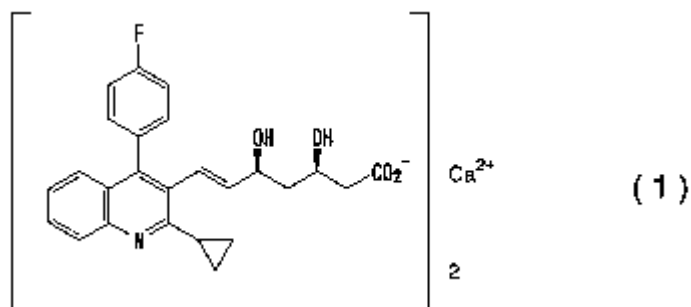
被告らから被告ら製剤の製造委託を受けた第三者は、それぞれ、被告ら原薬を、被告ら製剤を製造するまでの間、保管しており、また、被告らは、製造された被告ら製剤を、販売するまでの間、保管している（以下、被告ら原薬及び被告ら製剤を保管する方法を併せて「被告ら方法」という。）。

(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、

C CuK α 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
(2θ) にピークを有し、かつ、30.16° の回折角 (2θ) に、
20.68° の回折角 (2θ) 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、

C CuKα放射線を使用して測定するX線粉末解析において、4.9
6° , 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
(2θ) にピークを有し、かつ、30.16° の回折角 (2θ) に、
20.68° の回折角 (2θ) 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 α 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 θ)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

本件の争点は、以下のとおりである。なお、被告らは、上記構成要件のうち、構成要件B, C, C', D, F及びHの充足性を争う。

(1) 被告ら原薬の使用及び被告ら製剤の製造・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) 被告ら原薬(被告ら原薬を含有する被告ら製剤を含む。)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) 被告ら製剤が本件発明 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) 被告ら方法の使用が本件特許権 2 を侵害するか

ア 被告ら方法が本件発明 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) (被告ら原薬 (被告ら原薬を含有する被告ら製剤を含む。) 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 C は 15 本のピークの位置が回折角の数値として表現された構成要件となっており、この回折角の数値は、結晶形態 A を特定するためのものである。

イ そして、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、上記構成要件 C の 15 本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が、ピークの具体的な回折角の数値が小数点以下数桁のレベルまで厳密に一致している必要はないし、15 本のピークのうち相当数のピークが確認されれば、結晶形態 A と判断される。同じ結晶を測定した場合でも厳密にピークの回折角や強度の数値が一致するものではないから、ある程度の「幅」が存在するとしても結晶の同一性を認定することの障害にならない

ことは当業者の技術常識である。具体的には、日本薬局方及び日本薬局方技術情報の記載にあるように、回折角が $\pm 0.2^\circ$ 以内であれば同一のピークと判断し得るのであり、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、それより少なくとも同一の結晶と判断できることもある。

ウ なお、原告の出願経過における補正の趣旨は、「1点のピークではなく、より多くのピークで発明の対象を特定」して、引用文献（乙3の1，2，乙14[書証はいずれも甲事件のものである。以下同様]）に開示された発明からの新規性を明確にすることにあり、本件発明1-1の対象たる結晶を、構成要件Cの15本の全てのピークについて、小数点以下2桁まで一致する結晶に限定する趣旨でないことは明らかである。

エ 被告ら製剤を波長 0.75 \AA の放射光及び 1.54 \AA のCuK α 放射線を用いて解析したところ、結晶形態Aの15本のピークのうち7本ないし10本のピークが確認された。また、別紙物件目録(2)記載(2)のピタバスタチンカルシウム製剤（以下「ケミファ錠」という。）から回収した原薬を波長 0.75 \AA 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、15本のピーク全てが確認され、その回折角（ 2θ ）は、 4.98° ， 6.81° ， 9.09° ， 10.45° ， 10.89° ， 13.24° ， 13.65° ， 14.05° ， 18.36° ， 20.64° ， 21.58° ， 23.67° ， 24.11° ， 27.04° ， 30.14° であって、結晶形態Aの回折角とほぼ同一である。さらに、格子定数が同じならば同じ結晶形であるところ、ケミファ錠の原薬と結晶形態Aとは結晶の格子定数がほぼ同一である。したがって、被告ら原薬は、結晶形態Aであることが立証されたから、被告ら原薬（被告ら原薬を含有する被告ら製剤を含む。）は、本件発明1-1の技術的範囲に属する。

なお、粉末X線解析について、用いるX線をCuK α 線とすることに

本質的な意味はない。粉末X線回折角（ 2θ ）の値は波長によって変動するが、ブラッグの式（ $2d\sin\theta = n\lambda$ ）により一義的に換算できる。したがって、直接CuK α 線を使用した測定を行わなくても、換算によりCuK α 線による測定の場合の数値が得られる方法によって立証することは、立証方法として十分な合理性を有する。

オ 個別の構成要件の充足性について説明する。

(ア) 構成要件A及びDについて

構成要件Aは被告ら自身が充足性を認めている。構成要件Dも、被告ら製剤に含まれる原薬がいずれも結晶形態Aであることが立証されたので充足している。

(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、被告ら原薬についても水分量はこの範囲内とならざるを得ないから、構成要件Bを充足する。

(ウ) 構成要件Cについて

a 上記アのとおり、結晶形態Aは、構成要件Cの回折角のピークを有する結晶である。

b また、構成要件Cの相対強度の要件は、アモルファスとの区別を明確にするための要件である。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

砕品」の相対強度は25%である(甲48)。被告ら製剤の製造に際して、被告ら原薬は数 μm から10 μm 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である被告ら原薬の30.16°の相対強度は25%を超える。

そうすると、結晶形態Aは、構成要件Cの相対強度を有する結晶である。

c 以上によれば、被告ら原薬は、いずれも結晶形態Aである以上、構成要件Cを充足する。

(エ) 構成要件Eについて

被告ら製剤はリバロ錠の後発医薬品として販売されているところ、リバロ錠には融点は存在せず、また、被告ら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、被告ら製剤は、リバロ錠と同様に、融点のない原薬を用いているものと強く推定され、構成要件Eを充足する。

[被告らの主張]

ア 原告は、本件特許1も本件特許2も、その請求項1の対象となる物は結晶形態Aのピタバスタチンカルシウム塩であり、被告ら製剤に含まれる被告ら原薬は結晶形態Aであることが確認されているとして、侵害の主張及び立証を行っている。しかしながら、原告が文言侵害を主張している以上、侵害の有無は、構成要件の文言上の充足性の有無により判断されるのであり、これを離れて、結晶形態Aに該当するかどうかにより侵害を主張している原告の主張は失当である。

しかも、本件発明1-1の対象がピタバスタチンカルシウムの結晶形態Aであるという原告の主張は、ピタバスタチンカルシウムの結晶形態が本件明細書1において説明された結晶A、B、C及びチバ特許におけるチバ結晶C、D、Eの6種類に限定されるということを論理的に前提とするも

のであるが、その前提自体が何ら立証されていない。

したがって、被告ら原薬（被告ら原薬を含有する被告ら製剤を含む。）は、構成要件B（水分含量の要件）、C（回折角の要件）、D（結晶であることの要件）を充足せず、明らかに本件特許1を侵害していない。

イ 構成要件Cの充足性は、その要件の文言の充足性により判断されるものである。構成要件Cにおいて、ピーク15本を規定している以上、ピーク15本の全ての充足性を主張する必要がある。

仮に原告が主張するように、同じ結晶を測定した場合でもピークの回折角や強度の数値にある程度の「幅」が存在するという技術常識が存在したのであれば、原告は、本件発明1-1を、10本あるいはそれ以下のピークで±0.2°の許容幅を指定して特定することが十分できたはずである。それにもかかわらず、原告は自ら、小数点以下2桁で特定された15本のピークと相対強度で発明を特定したのであるから、「特許請求の範囲」の記載を無視して結晶形態Aとの同一性のみで侵害を主張することは許されない。

ウ しかも、原告は、出願当初、30.16°の回折角1本（許容誤差のない小数点以下2桁の数値）とその相対強度をもって発明を特定していたところ、構成要件Cに係る他の14本の回折角を追加する補正を行い、これにより新規性違反及び拡大先願に係る拒絶理由が解消すると述べたのであるから、当該補正により、発明の技術的範囲は字義どおり小数点以下2桁の15本の回折角全てによって特定される結晶に限定されたとみるべきである。

エ 原告は、ケミファ錠の残渣から結晶形態Aに由来すると認められる15本のピークが全て確認されたから、構成要件Cの充足が立証されたと主張するが、専門家が見てピークと確認できるのは2～6本程度であり、被告らが主張するように15本のピークを確認することはできない。しかも、

確認されたのは「結晶形態Aに由来すると認められるピーク」であって、構成要件Cに規定されるピークではなく、構成要件Cの充足性は何ら立証されていない。

原告は、被告ら製剤の測定において、本件明細書1及び2に説明されている通常の粉末X線解析装置ではなく、シンクロトン光による強度の強い入射X線（0.75 Å）を用いているが、特許請求の範囲に「CuK α 放射線を使用して測定するX線粉末解析」における回析角が要件となっている以上、原告の主張は構成要件の記載を無視するもので、失当である。

原告によるケミファ錠の追加測定（甲33）についても、残渣を結晶化した測定試料に飽和水溶液中のピタバスタチンカルシウム塩由来の結晶が含まれている可能性や、一連の実験過程において結晶形態が変化する可能性もあるから、測定結果が結晶形態Aと一致したからといって被告ら製剤に含まれる被告ら原薬が結晶形態Aであると結論づけることはできない。

オ 構成要件Cの30.16°のピークの相対強度に関する原告の主張は、被告ら製剤に含まれる被告ら原薬が数 μ m～10 μ m程度まで細かく機械粉砕されていること、被告ら原薬が結晶形態Aであり、アモルファスや他の結晶形態でないことが前提となるが、そのいずれも原告は現実に立証してはいない。

カ したがって、被告ら原薬（被告ら原薬を含有する被告ら製剤を含む。）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3文献に基づく新規性の欠如について

[被告らの主張]

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（W02003/064392号）、特表2005-520814号公報（乙3の1、2。以下、これらを併せて「乙3文献」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。乙3文献にはX線粉末回折ピーク及び融点が記載されていないが、乙3文献記載の発明の追試実験の結果得られたピタバスタチンカルシウム塩の結晶は、構成要件Cに定める回折角(2θ)にピークを有し、相対強度要件も満たしていた上、95℃の融点を有することは確認できなかった。したがって、本件発明1-1は、乙3文献記載の発明と実質的に同一である。

[原告の主張]

被告らによる追試実験は、乙3文献に基づかない条件(塩化カルシウムの滴下時間、乾燥時間等)を適用しており、乙3文献記載の発明を忠実に追試したものとはいえない。しかも、同追試実験で適用された乾燥時間は、本件明細書1が開示した水分量コントロールの重要性に基づいている。したがって、本件発明1-1は、乙3文献記載の発明と同一でない。

イ 乙3文献に基づく進歩性の欠如について

[被告らの主張]

乙3文献記載の発明の結晶は、CuKα放射線を使用して測定するX線粉末解折において本件発明1-1で特定される回折角(2θ)にピークを有し、かつ、30.16°の回折角(2θ)に20.68°の回折角(2θ)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か否かが明確でない(相違点1)。また、本件発明1-1は「示差走査熱量測定による融点95℃を有するものを除く」ものであるのに対して、乙3文献記載の発明では、融点が明確でない(相違点2)。

しかしながら、医薬品化合物において、安定な結晶形態の取得には強い動機付けが存在し、かつ、結晶化された医薬化合物において、安定性を確認するために、結晶化条件を検討したり、結晶多形を調べたりすることは、当業者がごく普通に行うことであり、乙3文献記載の発明の結晶について、

結晶多形を調べるためにX線粉末解析を行うことは、当業者がごく普通に行うことである。そして、X線粉末解析を行えば、相違点1に係る事項に到達することは極めて容易である。また、融点は結晶に固有のものであるから、相違点1に係る事項に到達すれば、通常、相違点2に係る事項にも当然に到達するし、示差走査熱量測定（DSC）による融点の測定に格別の困難性はなく、測定を行えば当業者は相違点2に係る事項に到達することが極めて容易である。

さらに、本件発明1-1の効果が安定性の高いものであったとしても、それは当業者が予測し得ないほどの顕著な効果とはいえない。

したがって、本件発明1-1は、乙3文献記載の発明及び技術常識に基づき、当業者が容易に発明することができたものである。

[原告の主張]

本件発明1-1の結晶形態Aは、相対湿度の変化に対し、吸湿するだけでなく、水分を失って結晶構造を維持することができないという、不安定な形態である。乙5ないし10のような技術常識を参照するなら、上記結晶形態Aは、医薬品の原薬として使用できるような結晶ではないと評価されたはずである。

全ての公知文献を参照しても、水分量が容易に変動する不安定な結晶であって、水分量を所定範囲に維持しないと変質して医薬品の原薬に使用できないのに、水分量を維持することにより、医薬品の原薬として使用可能な貯蔵安定性（化学的安定性）を示すような水和物結晶の示唆は得られない。結晶形態Aの水分量についての不安定性は、この形態を医薬品の原薬の用途に使用することの阻害事由あるいは原薬としての貯蔵安定性などを検討することについての阻害事由となる。この阻害事由を乗り越えて見出された本件発明1-1の医薬品の原薬としての安定性は、特許発明に値するものである。

したがって、乙3文献に公知文献を組み合わせても、本件発明1-1に係る特許に想到することは容易ではなく、本件発明1-1の進歩性は明らかである。

ウ 乙14文献に基づく新規性の欠如について

[被告らの主張]

本件特許1の優先日より前に頒布された刊行物である特開平5-148237号公報(乙14。以下「乙14文献」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。乙14文献にはX線粉末回折ピーク及び回折角(2θ)のピーク強度、水分量が記載されていないが、乙14文献記載の発明の追試実験により、乙14文献記載の発明に係る結晶は構成要件Cを全て充足することが判明した。また、追試実験により、10.0%(w/w)の水分を含むピタバスタチンカルシウムの白色結晶及び水分含量12.14%のピタバスタチンカルシウム結晶が得られた。これは、本件発明1-1に係る特許の「7~13%の水分を含み」(構成要件B)に相当する。

したがって、本件発明1-1と乙14文献記載の発明とは、実質的には相違点が認められず、同一の発明である。

[原告の主張]

被告らの追試実験で適用されている反応条件および乾燥条件は、乙14文献の記載に基づかず、また他の公知技術を参照して容易に想到されるものでもない。本件発明1-1を知って設定可能となった条件である。

したがって、被告らの追試実験に基づいて、本件発明1-1が乙14文献記載の発明と同一の発明であるという主張は成り立たない。

エ 乙14文献に基づく進歩性の欠如について

[被告らの主張]

乙14文献記載の発明の結晶は、CuKα放射線を使用して測定するX

線粉末解析において本件発明 1-1 で特定される回折角 (2θ) にピークを有し、かつ、 30.16° の回折角 (2θ) に 20.68° の回折角 (2θ) 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か否かが明確でない (相違点 3)。また、本件発明 1-1 は「7~13% の水分を含む」ものであるのに対して、乙 14 文献記載の発明の結晶は、水分をどれだけ含んでいるか不明である (相違点 4)。

しかしながら、上記イ [被告らの主張] のとおり、医薬品化合物において、安定な結晶形態の取得には強い動機付けが存在し、かつ、結晶化された医薬品化合物において、安定性を確認するために、結晶化条件を検討したり、結晶多形を調べたりすることは、当業者がごく普通に行うことと認められ、乙 14 文献記載の結晶について、結晶多形を調べるために X 線粉末解析を行うことは、当業者がごく普通に行うものと認められる。そして、X 線粉末解析を行えば、相違点 3 に係る事項に到達することは極めて容易である。また、本件特許 1 の優先日前の技術常識として、結晶を得たのであれば水和物結晶かどうかを確認するために水分含量を確認したはずであり、水溶液中から得られた結晶であればなおのこと、水和物結晶である可能性を考慮して、結晶を構成する水分の含有量を確認することは、当業者がごく普通に行うことであつたといえる。そして、水分量の測定を行えば、相違点 4 に係る事項に到達することは極めて容易である。また、本件発明 1-1 には格別顕著な効果が認められないことについては、上記イ [被告らの主張] のとおりである。

したがって、本件発明 1-1 は、乙 14 文献記載の発明及び技術常識に基づき、当業者が容易に発明することができたものである。

[原告の主張]

上記イ [原告の主張] のとおり、安定性を保持するピタバスタチンカルシウム塩の結晶形態 A に到達するためには、単に約 10% の含水量の結晶

形態Aを取得すれば足りるものではなく、水分量と安定的な保存の相関関係にまで想到しなければならない。乙14文献に基づき、結晶多形についての一般的な開示から、本件発明1-1に想到することが容易であるとはいえない。

- (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 本件訂正は適法である。

本件発明1-1では、乙3文献及び乙14文献の実施例の製造方法で得られるような、不純物のために医薬品の原薬としての安定性を保持しないような結晶形態Aも、文言上、その範囲に含む記載となっていた。構成要件Xを付加した本件訂正発明1-1は、本件発明1-1の結晶形態Aを、本件明細書1に記載した程度の十分な安定性を有するような結晶形態Aに限定した訂正であり、特許法134条の2第1項1号の請求項の減縮に該当する適法な訂正である。また、本件発明1-1の対象物である結晶形態Aについて、医薬品の原薬としての安定性を有する結晶であることを明確にした訂正でもあり、その意味で同項3号の明瞭でない記載の釈明という面も有する訂正である。

さらに、構成要件D'の「粉碎された」という点は、願書に最初に添付した本件明細書1に記載されていたものであるから、本件訂正は本件発明1-1の範囲を実質上変更するものでもない。

イ 本件訂正により無効理由は解消する。

乙3文献の実施例の開示に従い、当業者が適宜条件を補って(仮に)結晶形態Aを得ることができたとしても、それは不純物のために不安定であるから、乙3文献の開示からは、結晶形態Aが「医薬品の原薬として安定性を保持する」結晶であることを容易に見出すことができないのであり、

本件訂正発明 1-1 は、乙 3 文献に対して進歩性を有する発明である。結晶多形の間で安定性が異なることが知られていたとしても、乙 3 文献の実施例の開示から、「医薬品の原薬として安定性を保持する」結晶形態 A に想到することは、当業者にとって容易ではない。

乙 1 4 文献の実施例の開示に従い、当業者が適宜条件を補って（仮に）結晶形態 A を得ることができたとしても、それは不純物のために不安定であるため、乙 1 4 文献からは、結晶形態 A が「医薬品の原薬として安定性を保持する」結晶であることを容易に見出すことができないのであり、本件訂正発明 1-1 は、乙 1 4 文献記載の発明に対して進歩性を有する発明である。

ウ 被告ら原薬（被告ら原薬を含有する被告ら製剤を含む。）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、被告ら原薬が構成要件 A, B, C, E を充足することは前記(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、前記(1)[原告の主張]のとおり、被告らが販売している各被告ら製剤の原薬は、16局に記載されたピタバスタチンカルシウム水和物の水分量にならざるを得ず、被告ら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、粉碎された状態であっても、水分量が上記の範囲（7～13%）に収まっていれば、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（安定性を保持する）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、被告ら原薬は、構成要件 X を充足する。

さらに、被告ら原薬は、1mg 又は 2mg という微量な原薬を製剤

化するために、原薬を微細な粒子に粉碎する必要があるから、被告ら製剤に含まれる原薬が「粉碎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、被告ら原薬は、構成要件D'を充足する。

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

エ 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

構成要件Xの「医薬品の原薬として安定性を保持する」という性質は、結晶形態Aそのものの性質であって、結晶形態Aについては、粉末X線回折図におけるピークの位置でその結晶形が特定されているので、「どのような結晶であれば当該発明の課題を解決できるのか」も本件明細書1に明確に記載されている。したがって、「医薬品の原薬として安定性を保持する」という文言は、当業者の技術常識に照らしてその意味するところは明確である。

(イ) サポート要件（特許法36条6項1号）について

新規な結晶形についての発明の明細書で、安定性を阻害する不純物の種類や量を特定することは必要でない。本件訂正発明1-1は物の発明であって、製造方法の発明ではない。新規な物の発明は、その物を入手可能にする製造方法を1つ示せば十分であり、その物の特徴が得られる製法と得られない製法を、解明し特定する必要はない。また、別の製造方法では特性の劣る結晶が得られ、その理由が不明であるとしても、結論は変わらない。

[被告らの主張]

ア 本件訂正は不適法であり認められない。

本件訂正に係る訂正事項1は、単に結晶形態Aのピタバスタチンカル

シウム塩の性質ないし効果を記述したものにすぎない。本件訂正の前後で、物の発明である請求項1の技術的範囲に何ら変わりはなく、本件訂正は、訂正前の特許請求の範囲を減縮するものではなく、その他、特許法134条の2第1項各号のいずれにも該当せず、不適法である。

次に、本件明細書1には、粉碎されたピタバスタチンカルシウム塩の結晶形態Aが構成要件Cの粉末X線回折パターンを備えることについての記載が一切なく、本件訂正に係る訂正事項2は、本件明細書1に記載した事項の範囲内においてされたものではないので、訂正事項2に係る訂正請求も不適法である。また、そうである以上、本件訂正前の請求項1に開示されているのは粉碎される前のピタバスタチンカルシウム塩の結晶であることが明らかであり、これを「粉碎されたピタバスタチンカルシウム塩の結晶」と変更するのは、実質上特許請求の範囲を変更するものであり、やはり不適法である。

イ 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、乙3文献ないし乙14文献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中には、「得られたピタバスタチンカルシウムは粉碎された後、医薬品用の原薬として使用される。」との記載があるのみであり、粉碎されたピタバスタチンカルシウム塩の結晶の安定性については、原告自身、全く記載していない。本件訂正発明1-1は、乙3文献ないし乙14文献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。

ウ 被告ら原薬（被告ら原薬を含有する被告ら製剤を含む。）は、本件発明1-1の場合と同様に、本件訂正発明1-1の技術的範囲に属しない。

エ 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

本件明細書1の記載のみならず、出願時の技術常識を参酌したとしても、「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」との発明特定事項を含む請求項1の特許を受けようとする発明が明確であるということとはできない。

(イ) サポート要件違反（特許法36条6項1号）について

本件訂正発明1-1のピタバスタチンカルシウム塩の結晶は、達成すべき結果のみを記載することで、課題を解決しようとするものであって、その課題を解決するための手段である、本件明細書1の実施例1に記載される特定の製造方法で製造されたピタバスタチンカルシウム塩の結晶であることが、特許を受けようとする発明の発明特定事項として記載されていないこととなる。

そして、本件出願時の技術常識を参酌しても、実施例1で製造されたピタバスタチンカルシウム塩の結晶以外に、どのような結晶であれば当該発明の課題を解決できるといえるのか、当業者に理解できるように発明の詳細な説明に記載されていると認めることはできない。

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ものではない。

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

[原告の主張]

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

[被告らの主張]

被告ら製剤が構成要件F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3文献に基づく新規性の欠如について

[被告らの主張]

前記(2)ア[被告らの主張]のとおり，本件発明1-1は乙3文献記載の発明と実質的に同一であるから，本件発明1-2も，乙3文献記載の発明と実質的に同一である。

[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，乙3文献記載の発明と同一でないから，当然，本件発明1-2も乙3文献記載の発明と同一でない。

イ 乙3文献に基づく進歩性の欠如について

[被告らの主張]

前記(2)イ[被告らの主張]のとおり，本件発明1-1は乙3文献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も，乙3文献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，乙3文献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も乙3文献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14文献に基づく新規性の欠如について

[被告らの主張]

前記(2)ウ[被告らの主張]のとおり，本件発明1-1と乙14文献記載の発明とは，実質的には相違点が認められず，同一の発明であるから，本件発明1-2も，乙3文献記載の発明と実質的に同一である。

[原告の主張]

前記(2)ウ[原告の主張]のとおり、被告らの追試実験で適用されている反応条件および乾燥条件は、乙14文献の記載に基づかず、また他の公知技術を参照して容易に想到されるものでもない。本件発明1-1を知って、設定可能となった条件である。

したがって、被告らの追試実験に基づいて、本件発明1-1が乙14文献と同一の発明であるという主張は成り立たず、本件発明1-2も乙14文献記載の発明と同一の発明ではない。

エ 乙14文献に基づく進歩性の欠如について

[被告らの主張]

前記(2)エ[被告らの主張]のとおり、本件発明1-1は、乙14文献記載の発明及び技術常識に基づき、当業者が容易に発明することができたものであるから、本件発明1-2も、乙14文献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)エ[原告の主張]のとおり、乙14文献に基づく結晶多形についての一般的な開示から、本件発明1-1に想到することが容易であるとはいえないから、本件発明1-2も乙14文献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。

(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 本件訂正は適法である。

前記(3)[原告の主張]アのとおり、本件訂正発明1-1について行われた訂正は適法であるから、本件訂正発明1-2も同様である。

イ 本件訂正により無効理由は解消する。

前記(3)[原告の主張]イのとおり、本件訂正発明1-1は、新規であり、

かつ、乙 3 文献、乙 1 4 文献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。

ウ 被告ら製剤は、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]ウのとおり、被告ら原薬は、構成要件 X 及び構成要件 D' をいずれも充足するから、これを用いて製造された被告ら製剤は本件訂正発明 1 - 2 の技術的範囲に属する。

エ 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 3 6 条 6 項 2 号）及びサポート要件（同項 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。

[被告らの主張]

ア 本件訂正は不適法であり認められない。

前記(3)[被告らの主張]アのとおり、本件訂正発明 1 - 1 について行われた訂正は不適法であるから、本件訂正発明 1 - 2 も同様である。

イ 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)[被告らの主張]イ）と同様に、乙 3 文献ないし乙 1 4 文献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。

ウ 被告ら製剤は本件訂正発明 1 - 2 の技術的範囲に属しない。

エ 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)[被告らの主張]エ）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（同項 1 号）がある。

(7) 争点(7)（被告ら方法が本件発明 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、被告ら原薬は本件発明 1 - 1 の技術的

範囲に属するから、被告ら方法は、構成要件A, B, C', D, Eを充足する。

イ 構成要件H及びIの、水分量を4～15重量%に維持する保存方法については、被告ら製剤に用いられている原薬が結晶形態Aである以上、製剤化する前の原薬の水分量を、この範囲に維持して保存していることは確実であるし、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ことから、製剤中の原薬について、この保存方法を実施しているといえる。

したがって、被告ら方法は、構成要件H, Iを充足する。

ウ よって、被告ら方法は、本件発明2の技術的範囲に属する。

[被告らの主張]

ア 前記(1)[被告らの主張]のとおり、被告ら方法は、構成要件B, C' (回折角の要件), D (結晶の要件)を充足しない。

イ 被告ら方法は、構成要件Hを充足しない。

原告は構成要件Hの充足性について何ら立証していない。被告らは、製剤化された被告ら製剤の譲渡を受けて販売しているだけであり、製剤化する前の原薬の水分量を問題とすること自体、失当である。

ウ よって、被告ら方法は、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 公然実施に基づく新規性欠如

[被告らの主張]

本件特許2の優先日前に発売されたリバロ錠(1mg, 2mg)の原薬には結晶形態Aが使用されていたと考えられ(構成要件A～E), そのインタビューフォーム及び審査報告書から、原薬は室温で「気密保存」されるべきものであったことが明らかであるから、原薬製造元である原告から興和株式会社(以下「興和」という。)に譲渡された原薬は、興和において含水量も適切に維持されて保存されていた(構成要件H及びI)。したが

って、本件発明 2 は、その優先日前に公然実施された発明に該当し、無効とすべきものである。

[原告の主張]

リバロ錠に関する粉末 X 線回折の測定結果によれば、リバロ錠に含まれるピタバスタチンカルシウム塩は結晶形態 A ではないことが確認された。また、興和は、本件特許 2 の独占的实施権者としてリバロ錠を製造販売しているのであり、契約により秘密保持義務を負っているから、興和による貯蔵・使用行為は「公然知られたる状況又は公然知られるおそれのある状況」での実施に該当しない。

イ 乙 3 文献に基づく新規性の欠如について

[被告らの主張]

前記(2)ア[被告らの主張]のとおり、本件発明 1 - 1 は乙 3 文献記載の発明と実質的に同一であるから、乙 3 文献には本件発明 2 の構成要件 C' B, A, D, E を充足するピタバスタチンカルシウム塩の結晶が記載されている。

また、乙 3 文献記載の発明の結晶は 10.6% の含水量を有する結晶であり、水和物結晶である可能性がある。水和物結晶の可能性があれば、当業者であれば、当該結晶が水分を失って化学的に不安定なアモルファスとならないように当然気密保存したはずである。

したがって、乙 3 文献には、構成要件 H 及び I を含む本件発明 2 の構成要件を全て充足する保存方法が記載されており、又は、記載されているに等しいから、本件発明 2 は、乙 3 文献記載の発明と実質的に同一である。

[原告の主張]

前記(2)ア[原告の主張]のとおり、被告らによる追試実験は、乙 3 文献の正確な追試実験であるとは言い難く、乙 3 文献に本件特許 2 の結晶形態

Aが開示されていることは立証されていない。また、乙3文献の実施例に、開示されていない条件を適宜補って結晶形態Aを得ることができたとしても、その保存安定性は本件明細書2に基づいて製造した結晶形態Aのレベルにはほど遠いものであり、この点でも、乙3文献に本件発明2が開示されているとはいえない。

さらに、乙3文献には「結晶性粉末」の保存については一切記載がなく、また、当業者であれば10.6%の水分を含む「結晶性粉末」を気密保存するなどという技術常識も存在しないので、構成要件H及びIの保存方法について、乙3文献が開示されているに等しいという被告らの主張は成り立たない。

ウ 乙14文献に基づく新規性の欠如について

[被告らの主張]

前記(2)ウ[被告らの主張]のとおり、本件発明1-1は乙14文献記載の発明と実質的に同一であるから、乙14文献には本件発明2の構成要件C', B, A, D, Eを充足するピタバスタチンカルシウム塩の結晶が記載されている。

また、当業者であれば、乙14文献記載の発明の結晶が、その後の分析や使用のために、当該分野の技術常識に従い、気密容器に入れるなどして、その含水量(12.14%)を維持するように保存されたことを把握できる。すなわち、乙14文献には、構成要件H及びIを含む本件発明2の構成要件を全て充足する保存方法が記載されており、又は、記載されているに等しい。

したがって、本件発明2は、乙14文献記載の発明と実質的に同一である。

[原告の主張]

前記(2)ウ[原告の主張]と同様に、本件発明2は、乙14文献記載の発

明に基づいて当業者が容易に発明できたものではない。

エ 乙17に基づく新規性欠如（拡大先願）について

[被告らの主張]

(ア) 特表2006-518354公報（乙17）は、ピタバスタチンカルシウム塩の新規な結晶形態に関する本願優先日前の未公開先願に係るものであり、ピタバスタチンカルシウム塩の6つの結晶多形A～Fが記載されている。本件特許2の図1に記載されたピタバスタチンカルシウム塩の「結晶形態A」（構成要件D）のX線粉末回折図形は、乙17の図1のX線粉末回折図形と酷似し、本件特許2の図1に係る15のピーク回折角は、全て乙17の図1のピーク回折角と $\pm 0.2^\circ$ 以内で一致するから、両者は同一の結晶である（構成要件C'）。また、乙17の実施例には、「結晶形態A」が「約10%の含水量」を有することが記載されている（構成要件B）。

よって、乙17には、本件発明2の構成要件C' B, A, D, Eを充足する結晶が記載されている。

(イ) 乙17には、請求項2の結晶多形Aについて、「好ましくは約3～12%、より好ましくは9～11%までの水を含有することができる」と記載され（段落【0023】）、結晶の保存について「生成物が、特殊化された貯蔵条件を必要とせずに長期にわたって安定的であることも、経済的に望ましい。」と記載されている（段落【0005】）。

そして、当業者であれば、乙17の記載から、請求項2の結晶は、その後の分析や使用のために、当該分野の技術常識に従い、気密容器に入れるなどして、その含水量（好ましくは約3～12%、より好ましくは9～11%）を維持するように保存されたこと（構成要件H）を把握できる。

[原告の主張]

先願記載の発明として後願を排除し得る発明とは、先願に当業者が入手可能に開示された発明でなければならないが、乙17の請求項2は請求項1の従属項であるところ、請求項1には複数の粉末X線解析におけるピークが記載されているだけであって、請求項1にも、「結晶多形A」のチャートである図1にも、「結晶多形A」として記載されている物を取得する方法は全く記載されていない。

また、乙17の実施例に「95℃の融点」と明記されている以上、特許法29条の2の無効理由としては、この実施例の記載しているピタバスタチンカルシウム塩の結晶は、この融点を有する結晶であると理解せざるを得ない。そうである以上、「95℃の融点」を有しないことを要件とする本件特許2の結晶形態Aと、乙17の実施例の「結晶多形A」は、同一性が認められない。

オ 乙18文献等に基づく進歩性欠如について

[被告らの主張]

本件発明2と「リバロ錠インタビューフォーム（改訂第2版）」（乙18。以下「乙18文献」という。）記載の発明を対比すると、両者は、示差走査熱量測定による融点95℃を有しない（構成要件E）ピタバスタチンカルシウム塩の結晶（構成要件A、D）の保存方法（構成要件I）であるという点で一致するが、他方、①本件発明2には、上記結晶が、CuK α 放射線を使用して測定するX線粉末解析において特定の15の回折角（2 θ ）にピークを有し（構成要件C'）、7重量%～13重量%の水分を含む（構成要件B）結晶であるのに対し、乙18文献記載の発明に係る結晶にはそのような特定が明記されていない点（相違点1）、②本件発明2には、上記結晶をその含有水分が4重量%より多く、15重量%以下の量に維持する（構成要件H）との限定があるのに対し、乙18文献記載の発明にはそのような限定が明記されていない点（相違点2）で相違する。

しかしながら、前記(2)イ及びエの各[被告らの主張]のとおり、相違点1につき、乙3文献及び乙14文献には、本件発明2に係る結晶の製法と同じく塩化カルシウム水溶液の滴下による塩交換反応を用いた結晶の製造方法が開示されているから、本件発明2に係る結晶を取得するための方法はごく一般的なものであり、本件発明2に係る結晶を取得することは乙3文献及び乙14文献の記載に基づいて当業者が極めて容易になし得たことといえる。また、相違点2につき、医薬化合物は、一定の規格を満たすよう維持・保存することが求められるから、医薬品の原薬である本件発明2に係る結晶を安定に保存することについては強い動機付けがあり、水分量維持のような適切な保存条件を検討することは、当業者が通常行う努力にすぎないのであって、本件発明2に係る水分量の設定（これが当然のものであることは、「リバロ錠審査報告書」（乙19。以下「乙19文献」という。）からも明らかである。）に格別の困難性を要するとは認められない。

したがって、本件発明2は、乙18文献、乙3文献、乙14文献及び乙19文献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)イ及びエの各[原告の主張]のとおり、安定性を保持するピタバスタチンカルシウム塩の結晶形態Aに到達するためには、水分量と安定的な保存の相関関係にまで想到しなければならないのであって、相違点1及び2については、乙3文献、乙14文献、乙18文献及び乙19文献から当業者が容易に想到し得るものではなく、本件特許2が進歩性を有していることは明らかである。

カ 明確性要件違反について

[被告らの主張]

本件発明2は、回析角 30.16° のピーク強度（相対強度）に関する規定を欠くため、対象とするピタバスタチンカルシウム塩の結晶が、本

件発明 2 では保存できない他の結晶形態と区別できるように特定されておらず、明確性要件（特許法 36 条 6 項 2 号）に違反する。「結晶形態 A」を結晶形態 B 及び C と区別する「特徴的な回折角 10.40° 、 13.20° 及び 30.16° のピーク」とは、相対強度 ($> 25\%$) の特徴的なピークであって、これより小さなピークではない。しかしながら、本件発明 2 には、回折角 10.40° 、 13.20° 及び 30.16° のピークの相対強度に関する記載はなく、相対強度 ($> 25\%$) より小さなピークも含むものであるから、本件発明 2 の対象とはならない結晶形態 B 及び C と区別できるように結晶が特定されていない。

[原告の主張]

結晶形態 A を特定した 15 本のピーク中には、結晶形態 B 及び C では存在しないことが明らかな 10.40° 、 13.20° 及び 30.16° のピークが含まれているので、結晶形態 A の特定は十分である。また、形態 D～F の回折データ (2θ 値) と、本件特許 2 の結晶形態 A の 15 本のピークの 2θ 値を比較すれば、区別できることは明らかである。

キ 実施可能要件・サポート要件違反について

[被告らの主張]

(ア) 実施可能要件違反

本件発明 2 には、水分量の維持だけでは安定に保存することができない他の結晶形態も含まれるから、本件明細書 2 の発明の詳細な説明は、本件発明 2 を当業者が実施し得る程度に明確かつ十分に記載するものではない。

(イ) サポート要件違反

本件発明 2 は、保存対象である結晶がピタバスタチンカルシウム塩の他の結晶形態と区別できるように特定されておらず、したがって、本件明細書 2 の発明の詳細な説明に、本件発明 2 の方法（水分量の維持）で

安定に保存できる結晶として開示された結晶以外の結晶形態をも含む。

すなわち、本件発明 2 は発明の詳細な説明に記載されたものではない。

[原告の主張]

(ア) 実施可能要件

本件明細書 2 の段落【0017】において結晶形態 A は特定されており、段落【0029】～【0033】には結晶形態 A の製造方法が実施例として具体的に記載されている。当業者であれば、本件発明 2 の作用効果を有する結晶形態 A を得ることは、これらの記載に基づいて容易に可能である。

(イ) サポート要件

本件特許 2 の結晶形態 A は 15 本の回折ピークで特定されており、他の結晶形態やアモルファスとの区別は可能であるから、被告らの主張は、前提を欠き、成り立たない。

ク 本件発明 1-1 との同一性について

[被告らの主張]

本件発明 2 は、その親出願に係る本件発明 1-1 を単に方法として表現したものにとすぎず、両者は同日に出願された同一発明である。したがって、本件特許 2 は無効とされるべきである。

[原告の主張]

本件発明 2 は、結晶形態 A につき、特定の水分量に維持して保存するという手段を適用する保存方法の発明であるところ、この保存手段の発明特定事項は、本件発明 1-1 に係る請求項には全く存在しないから、両者の同一性は認められない。

第 3 当裁判所の判断

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

(1) 争点(1) (被告ら原薬 (被告ら原薬を含有する被告ら製剤を含む。) 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 C 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)。

C Cu K α 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 θ) にピークを有し、かつ、30.16° の回折角 (2 θ) に、20.68° の回折角 (2 θ) 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 α 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%CaCl₂ 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℃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) 本件特許1の出願経過は、以下のとおりである(乙33, 34)。

本件特許1の出願当初の特許請求の範囲の請求項1の記載は、「CuK α 放射線を使用して測定するX線粉末解析において、30.16°の回折角(2 θ)に、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結晶(結晶形態A。)」というものであった。

特許庁審査官は、本件特許1に係る出願(特願2006-520594)に対し、平成23年8月30日付け拒絶理由通知書(以下「本件拒絶理由通知」という。)において、出願人たる原告に対し、同出願は、特許法29条1項、2項又は29条の2等により拒絶すべきものである旨を通知した。

出願人たる原告は、本件拒絶理由通知を受けて、平成23年11月29日付けの補正書で、本件特許1の特許請求の範囲に従来の1本のピークの回折角に加えて14本のピークの回折角の数値を加筆し、合計15本の数値(構成要件Cの数値)を記載するなどの補正をした上、同日付けで意見書を提出し、その中で「補正後の本願請求項1に係る発明では、X線粉末解析において相対強度が25%より大きい、回折角(2 θ)が30.16°のピークに加えて、回折角(2 θ)が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°のピークをもって、本願発明の結晶を特定しましたので、もはや、1点

のみのピークにより特定しているとの認定には該当しないものであります。」、「この補正は、特許請求の範囲に限定的減縮に相当することから許容されるものと思量します。」などと主張した。なお、同意見書中には、これら回折角の数値について一定の誤差が許容されることや15本のうち一部のピークのみでの対比によっても発明が特定されることをうかがわせる記載は一切存在しない。

(エ) 以上に基づき、構成要件C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C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本のうち一部のピークのみによっても特定が可能である旨の記載は一切ない。したがって、かかる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C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、本件明細書1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種類見いだし（結晶形態A、B、C）、この中でCuK α 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C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C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、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。

さらに、原告は、本件特許1の出願当初、特許請求の範囲を「CuK α 放射線を使用して測定するX線粉末解析において、30.16°の回折角（2 θ ）に、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結晶（結晶形態A。）」として特定していたが、特許庁審査官の拒絶理由通知書を受けて、従来の1本のピークの回折角に加えて14本のピークの回折角の数値を加筆し、合計15本の数値（構成要件Cの各ピークの数値）とするなどの補正をした上、同補正が限定的減縮に相当する旨の意見を表明した一方、同意見書中には、これら回折角の数値について一定の誤差が許容されることや15本のうち一部のピークのみでの対比によっても発明が特定されることを示唆する記載は一切なかったものである。かかる出願経過に照らせば、原告は、上記補正によって、本件発明1-1の技術的範囲を、15本のピークの回折角が小数点以下2桁まで全て一致する結晶形態に限定したものとみるほかない。

以上のとおり、特許請求の範囲及び本件明細書1の記載並びに出願経過によれば、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C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。

(オ) しかるところ、原告は、被告ら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(2θ)は、別紙物件目録(1)記載のとおり4.98°、6.81°、9.09°、10.45°、10.89°、13.24°、13.65°、14.05°、18.36°、20.64°、21.58°、23.67°、24.11°、27.04°、30.14°である旨主張するが、仮に、原告の主張を前提としても、これら15本のピークの数値は構成要件Cの回折角の数値と小数点第2位までいずれも一致してはいないから、被告ら原薬はいずれも構成要件Cを充足せず、これを含有する被告ら製剤もいずれも構成要件Cを充足しない。

(カ) この点につき、原告は、被告ら原薬が結晶形態Aに当たるから本件発明1-1の構成要件C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C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C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±0.2°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、被告ら原薬は結晶形態Aと同一であるから、本件発明1-1の構成要件C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を介在させて被告ら原薬と本件発明1-1の構成要件Cを対比させることは相当でない上、本件明細書1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。そうすると、

原告の上記主張も、特許請求の範囲その他の本件明細書1の記載に基づかないものといわざるを得ないし、そもそも、構成要件Cにおける回折角の数値が、いずれも小数点第2位まで特定されていることに鑑みれば、小数点第1位である±0.2°までを誤差として許容すべき旨の原告の主張は、それ自体不合理というほかなく、採用することはできない。

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、被告ら原薬（被告ら原薬を含有する被告ら製剤を含む。）は、いずれも本件発明1-1の技術的範囲に属しない。

(2) 争点(4)（被告ら製剤が本件発明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、被告ら製剤に用いられている被告ら原薬は、いずれも本件発明1-1の技術的範囲に属さないから、被告ら原薬を含有する被告ら製剤は、いずれも構成要件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、被告ら製剤はいずれも本件発明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、被告ら原薬の使用及び被告ら製剤の製造・販売行為は、本件特許権1を侵害しない。

2 被告ら方法の使用が本件特許権2を侵害するか

(1) 争点(7)（被告ら方法が本件発明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，被告ら原薬が本件発明 1 - 1 の構成要件 C を充足すると認められないのと同様に，被告ら原薬を保存する方法である被告ら方法は，いずれも本件発明 2 の構成要件 C' を充足しない。したがって，被告ら方法は，いずれも本件発明 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，被告ら方法の使用行為は，いずれも本件特許権 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，これら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 4 7 部

裁判長裁判官 沖 中 康 人

裁判官 矢 口 俊 哉

裁判官 廣 瀬 達 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 α 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°)
3.31°	(6.81°)
4.42°	(9.09°)
5.08°	(10.45°)
5.29°	(10.89°)
6.43°	(13.24°)
6.63°	(13.65°)
6.82°	(14.05°)
8.90°	(18.36°)
10.00°	(20.64°)
10.45°	(21.58°)
11.45°	(23.67°)
11.66°	(24.11°)
13.06°	(27.04°)
14.53°	(30.14°)

(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

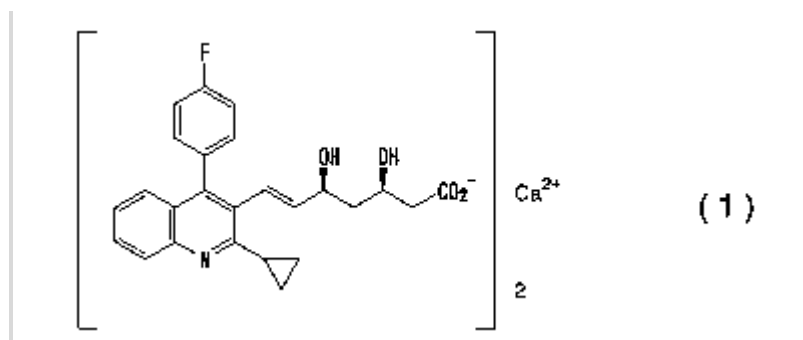
- (1) ピタバスタチンC a 錠 1 m g 「ケミファ」
- (2) ピタバスタチンC a 錠 2 m g 「ケミファ」
- (3) ピタバスタチンC a 錠 1 m g 「日新」
- (4) ピタバスタチンC a 錠 2 m g 「日新」

(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 α 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 θ)にピークを有し，かつ，30.16°の回折角(2 θ)に，20.68°の回折角(2 θ)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 (2θ) ($^{\circ}$)	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
