

平成27年7月31日判決言渡 同日原本領収 裁判所書記官
平成26年(ワ)第688号 特許権侵害差止等請求事件
口頭弁論終結日 平成27年6月3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
同	橋	口 尚 幸
同	齋	藤 誠 二 郎
同	北	原 潤 一
同	梶	並 彰 一 郎

東京都町田市<以下略>

被	告	相模化成工業株式会社
---	---	------------

富山県富山市<以下略>

被	告	日医工株式会社
---	---	---------

長野県埴科郡<以下略>

被	告	壽製薬株式会社	
上記3名訴訟代理人弁護士	新	保 克 芳	
同	洞		敬
同	酒	匂 禎 裕	
上記訴訟復代理人弁護士	西	村 龍 一	

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 被告相模化成工業株式会社は、別紙物件目録記載1のピタバスタチンカルシウム原薬を製造し、販売し、又は販売の申出をしてはならない。
- 2 被告相模化成工業株式会社は、別紙物件目録記載1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 被告日医工株式会社は、別紙物件目録記載1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。
- 4 被告日医工株式会社は、別紙物件目録記載1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。
- 5 被告日医工株式会社は、別紙物件目録記載2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。
- 6 被告壽製薬株式会社は、別紙物件目録記載1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。
- 7 被告壽製薬株式会社は、別紙物件目録記載1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。
- 8 被告壽製薬株式会社は、別紙物件目録記載3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

- 1 本件は、名称を「ピタバスタチンカルシウム塩の結晶」とする発明についての特許権（特許第5186108号）及び「ピタバスタチンカルシウム塩の保存方法」とする発明についての特許権（第5267643号）を有する原告が、被告らが別紙物件目録記載1ないし3の原薬又は製剤を製造、販売等する行為が上記各特許権を侵害すると主張して、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。

2 争いのない事実等（証拠等を掲げていない事実は当事者間に争いが無い。）

(1) 当事者

ア 原告

原告は、基礎化学品、ディスプレイ材料や半導体材料などの機能性材料、農業化学品及び医薬品の製造・販売を業とする株式会社である。

イ 被告ら

被告相模化成工業株式会社（以下「被告相模化成工業」という。）は、医薬品原薬の製造及び輸入販売を業とする株式会社であり、被告日医工株式会社（以下「被告日医工」という。）は、医薬品、医薬部外品その他各種薬品の製造、販売及び輸出入等を業とする株式会社であり、被告壽製薬株式会社（以下「被告壽」という。）は、医療用医薬品の製造・販売を業とする株式会社である。

(2) 原告の有する特許権

ア 原告は、次の内容の特許権の特許権者である（以下、この特許権を「本件結晶特許権」という。）。〔甲1の1、甲2の1〕

特許番号	第5186108号
出願番号	特願2006-520594
発明の名称	ピタバスタチンカルシウム塩の結晶
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

イ 原告は、次の内容の特許権の特許権者である（以下、この特許権を「本件方法特許権」といい、本件結晶特許権と併せて「本件各特許権」という。）。

〔甲1の2、甲2の2〕

特許番号	第5267643号
------	-----------

発明の名称 ピタバスタチンカルシウム塩の保存方法
 出 願 日 平成23年11月29日
 分割の表示 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

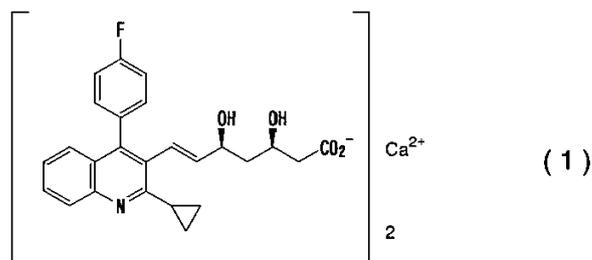
(3) 本件結晶特許権に係る発明の内容

本件結晶特許権の特許請求の範囲における請求項の数は2であり，請求項1及び2の記載はそれぞれ次のとおりである（以下，本件結晶特許権の請求項1及び2記載の特許発明をそれぞれ「本件結晶発明1」及び「本件結晶発明2」といい，両者を併せて「本件各結晶発明」という。）。

ア 請求項1（本件結晶発明1）

「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する

ことを特徴とする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）。」

イ 請求項2（本件結晶発明2）

「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医薬組成物。」

(4) 本件各結晶発明の構成要件

ア 本件結晶発明1の構成要件

本件結晶発明1を構成要件に分説すると、次のとおりである。（なお、式(1)の構造式は上記(3)アの【化1】のとおりであり、以下、構造式の記載を省略する。）

A 式(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(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

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 本件結晶発明2の構成要件

本件結晶発明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。

(5) 本件方法特許権に係る発明の内容

本件方法特許権に係る特許請求の範囲における請求項の数は5であるが、そのうち、請求項1の記載は次のとおりである（以下、請求項1の特許発明を「本件方法発明」とい、本件各結晶発明と本件方法発明を併せて「本件各発明」という。）。

「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7重量%～13重量%の水分を含む、式（1）で表される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）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ことを特徴とするピタバスタチンカルシウム塩の保存方法。」

(6) 本件方法発明の構成要件

本件方法発明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。

(7) 訂正請求

ア 原告は、本件結晶特許権に係る特許無効審判請求（無効2013-800211）において、平成26年8月22日付け訂正請求書（甲55）により、訂正請求をした（以下、この訂正請求による訂正を「本件訂正」という。）。

イ 本件訂正による特許請求の範囲の請求項1に記載された発明（以下「本件訂正発明」という。）を構成要件に分説すると次のとおりである（訂正箇所の下線を付した。）。

A 式（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（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、

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）。

(8) 被告らの製品及び被告らの行為

ア 被告日医工及び被告壽は、平成25年12月の販売開始を予定して、同年8月15日、興和株式会社（以下「興和」という。）が製造・販売して

いるリバロ錠，リバロOD錠の後発医薬品としてのピタバスタチンカルシウム製剤について，厚生労働省から医薬品製造販売承認を得た。なお，原告は，リバロ錠，リバロOD錠に用いられているピタバスタチンカルシウム原薬を製造し，興和に対し，販売している。

イ 被告日医工は別紙物件目録記載2の製剤（以下「被告日医工製品」という。）を製造し，販売しているか又はその準備をしている。

また，被告壽は，同記載3の製剤（以下「被告壽製品」という。）を製造し，販売しているか又はその準備をしている。

ウ 被告相模化成工業は，別紙物件目録記載1の原薬（以下「被告相模化成製品」といい，被告日医工製品及び壽製品と併せて「被告ら製品」という。）を製造し，販売する準備をしている。被告日医工及び被告壽は，被告日医工製品ないし被告壽製品を製造するに当たり，その原薬として被告相模化成製品を用いている。

エ 被告ら製品は，構成要件A，B及びDを充足し，被告日医工製品及び被告壽製品は，構成要件Gを充足する。

(9) 本件各特許の出願日以前の公知文献等

ア 上記(8)ア記載の興和が製造・販売するリバロ錠1mg及び2mgに関する平成15年7月作成にかかる医薬品インタビューフォーム（乙1。以下「乙1文献」という。）

イ 国際公開日を2003年（平成15）年8月7日とするWO03/064392国際公開公報〔乙3の1〕及びそれに対応する国内出願である特表2005-520814公表特許公報（乙3の2。以下，両者併せて「乙3公報」といい，同公報に記載された発明を「乙3発明」という。）

ウ 出願日を平成16年2月2日，国際公開日を平成16年8月26日とする特許第5192147号特許公報（甲9。以下「甲9公報」といい，同公報に記載された発明を「甲9発明」という。）

3 争点

(1) 被告ら製品が本件各発明の技術的範囲に属するか否か

- ア 構成要件C及びC'の充足性
- イ 構成要件Eの充足性
- ウ 構成要件Hの充足性
- エ 構成要件Iの充足性

(2) 本件各特許権が特許無効審判により無効にされるべきものか否か

- ア 本件各特許について、リバロ錠及び乙1文献による進歩性欠如
- イ 本件各特許について、甲9発明と同一発明
- ウ 本件各特許について、乙3公報による新規性又は進歩性欠如
- エ 本件各特許について、明確性要件違反及びサポート要件違反
- オ 本件方法特許について、補正要件違反
- カ 本件方法特許について、分割要件違反

(3) 本件訂正による対抗主張の成否

第3 争点に関する当事者の主張

1 争点(1)ア（構成要件C及びC'の充足性）について

[原告の主張]

(1) 結晶多形の識別

ピタバスタチンカルシウム塩の結晶には、分子の配列が異なる複数の形態（結晶多形）があり、本件各特許の明細書において結晶形態A、B、Cと称されているもの（以下それぞれ「結晶形態A、B、C」という。）が存在するところ、本件各発明は、結晶形態Aが医薬品の原薬として最も優れていることを見いだしたものである。なお、ピタバスタチンカルシウム塩の結晶形態には、上記の他に、特許第5192147号（甲9。以下「チバ特許」という。）において、結晶形態C、D、Eと称されているものがある。なお、有機化合物の場合、エネルギー的に安定となる構造は、一つの化合物に

つき、多くて7、8個である。

上記六つの結晶形態は、粉末X線回折測定による回折角ピークのパターンにより識別することができる。

(2) 測定方法について

被告壽製品のうち、別紙物件目録記載3(2)の製剤(以下「K O錠」という。)について、結晶形態の測定を行った。製剤に含まれるピタバスタチンカルシウム原薬の結晶形態を製剤の錠剤を破壊することなく直接測定するためには、通常の粉末X線回折装置のX線では強度が不十分であることから、Spring-8(公益財団法人高輝度光科学研究センター)及びAichi SR(公益財団法人科学技術交流財団あいちシンクロトロン光センター)という大型放射光施設を利用し、シンクロトロン放射により強度の大きなX線を用いて粉末X線回折測定を行った。X線源として放射光を使用することは、錠剤中の原薬の結晶形の測定方法として有用である。

Cu K α 放射線の波長は1.54 Åであるが、上記測定では、波長が0.75 ÅのX線を用いたから、それに応じて回折角(2 θ)の値も変わるが、この変化は、ブラッグの条件[$2d\sin\theta = n\lambda$](d = 結晶格子面間隔、 λ = 波長)により、一義的に算定できる。

(3) 測定結果及びその解釈

結晶とは、原子が規則的に三次元的に周期配列した固体物質である。結晶にX線を照射すると、結晶中のいずれかの格子面に対してブラッグの条件を満たす角度で入射したX線から、回折X線のピークが得られる。回折X線のピークが測定される回折角(2 θ)及び各ピークの強度は、X線の波長 λ と結晶中の格子面の間隔により定まり、各結晶形態に固有の値となる。

もっとも、現実の粉末X線回折測定においては、測定装置に起因する誤差及び試料の不完全性により、ピークが見られる回折角(2 θ)及び各ピークの強度は、測定ごとに若干のずれを生ずる。第十六改正日本薬局方〔甲20〕

によれば、粉末X線回折測定による未知試料中の各相の同定は、通例、基準となる物質の回折パターンと、上記未知試料の回折パターンとの視覚的あるいはコンピューターによる比較に基づいてされるものであり、また、同一結晶形の試料と基準となる物質のピークの回折角（ 2θ ）は、 0.2° 以内で一致し、相対的強度は、選択配向効果（試料中の結晶粒が、選択的にある特定の方向にのみ多く配向する現象）のため、かなり変動することがあり、一般的には、単一相試料の粉末X線回折データベースに収載されている10本以上の強度の大きな反射を測定すれば十分であるとされている。

そうすると、結晶の同一性は、特徴的な10本以上のピークが、 0.2° 以内で一致しており、かつ、全体的なパターンとして同一性が認められるかによって判断される。そして、低角側の数本のピークの同一性が特に重要であり、低角側で比較的強度の大きなピークが数本確認できれば、結晶形を同定することが可能である。

本件では、K O錠について、Spring-8及びAichi SRを用いて、低角（ $2\theta = 0 \sim 9^\circ$ ）の測定をしたところ、7本のピークが確認され〔甲5〕、その後、Aichi SRを用いて、上記の低角の測定に加え、高角（ $2\theta = 6 \sim 22^\circ$ ）の測定をしたところ、11本のピークが確認され〔甲25〕、これらのピークの回折角は、いずれも、対照試料であった結晶形態Aのピークの回折角と $\pm 0.2^\circ$ の範囲で一致した。さらに、K O錠に用いられている主な添加剤である水溶性のD-マンニトールを取り除くために、K O錠をピタバスタチンカルシウム塩の飽和水溶液に溶解し、その残渣（K O錠の原薬であるピタバスタチンカルシウム塩及び不溶性の添加剤のみが含まれる。）に対し、粉末X線回折測定を行ったところ、構成要件C、C'の15本のピークがすべて確認された〔甲63〕。また、Aichi SRを用いてK O錠を非破壊で測定し、その結果得られたK O錠のピークの回折角から格子定数を算出したところ、結晶形態Aの格子定数と一致した〔甲27、64〕。

そうすると、K O錠の原薬からは、構成要件C、C'の15本の回折角のピークが認められる。

- (4) 被告らは、結晶形態Aについて Spring-8 で測定した回折ピーク位置〔甲5：図5，表3〕が、チバ特許の明細書が開示している結晶形態E（以下「チバ結晶E」という。）のピーク位置ともほぼ同じであるから、K O錠の原薬が結晶形態Aであることの証明がされていない旨主張するが、甲25の図1（本件各特許の明細書に記載された粉末X線回折測定装置と同等の装置を用いて測定した結果の比較）のとおり、結晶形態Aとチバ結晶Eの回折ピークのパターンは一見して異なっており、結晶形態Aでは観測されなかったが、チバ結晶Eでは観測されたピークが10本あった。そして、甲25記載の実験結果によれば、K O錠の原薬は、チバ結晶Eとは異なるものであり、また、アモルファスでもないことが明らかである〔甲87〕。
- (5) 本件結晶発明1の構成要件Cには、15本の回折角が記載されているが、これは、本件結晶特許の明細書の段落【0016】に、同明細書の【図1】（結晶形態Aの粉末X線回折図）にみられるピークのうち比較的強いピークを15本選んで記載されていたものが、そのまま記載されたものにすぎず、結晶形態Aを特定するために、15本のピーク全てが必要であることを意味するものではないことは技術常識である。そのため、本件以外の医薬品として用いられる化合物の特定の結晶形に係る特許において、10本に満たない数のピークによって結晶形が特定されている例が多数存在する。
- (6) 原告は、原薬である被告相模化成製品を入手することができず、製剤であるK O錠を測定に用いたことから、測定結果においては、添加剤に由来するピークが大きく見えてしまい、原薬に由来するピークが十分にクリアに見える条件ではなかった。しかしながら、上記(3)からすれば、原薬そのものを用いて測定した場合には、構成要件C又はC'記載の15本の回折角について、全てピークが確認される蓋然性が極めて高い。

また、原告の測定では 30.16° のピークの相対強度が測定できていないが、結晶形態Aでは、 30.16° と 20.7° のピークの強度比率（理論値）が25.3%であることから〔甲27〕、原薬を測定することができれば、構成要件Cを充足する相対強度が確認される蓋然性が極めて高い（なお、構成要件C'については相対強度は要件ではない。）。原告が製造した結晶形態Aの未粉碎品では、上記相対強度は約13%であったが、原薬に適するように数 μm から $10\mu\text{m}$ 程度まで粉碎したところ、25%となった。そして、被告日医工製品及び被告壽製品は、ピタバスタチンカルシウムの含有量が1錠当たり1mg又は2mgと極めて少量であり、微細な粉末に粉碎された原薬を用いているはずであるから、被告日医工製品及び被告壽製品の原薬の上記相対強度は25%を超えるものと考えられる。

〔被告らの主張〕

- (1) 原告は、ピタバスタチンカルシウム塩の結晶形態が既に知られている6種のみであることを前提としているが、そもそも、その前提が正しいか不明である。
- (2) 原告が提出した二つの測定機関による測定結果をみると、ピークの相対的な強度が逆転するなどしており、これは、放射光（シンクロトロン光）を使用する測定方法が、CuK α 放射線を使用するX線粉末解析を代替し得ないことを示すものである。そして、原告が、結晶形態AについてSpring-8で測定したものとして示すピークの回折角〔甲5：図5，表3〕は、計算により求められるチバ結晶Eのピークの回折角ともほぼ同じであり、結晶形態Aとチバ結晶Eは、区別できない。

ピークの回折角が $\pm 0.2^\circ$ の範囲にあれば、同一の回折ピークであることを否定する理由にはならないという原告の主張は争わないが、一部の回折ピークのみが一致すれば足りる旨の主張は争う。

- (3) 原告は、特許庁での審査過程や無効審判請求における答弁において、結晶

形態Aについて、①示差走査熱量測定で測定した融点が95℃ではないこと、及び②30.16°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によって、他の結晶形態と異なるものであるかのように主張していたのであるから、この点の立証をしなければならない。

(4) 原告は、甲25記載の測定結果について、K O錠を用いたものである旨主張するが、実際にK O錠を用いたかは不明であり、また、同測定の精度が不明である上、ノイズがピークと区別できない。

そして、結晶多形の結晶は、水分の影響で変容し、乾燥条件や方法などによって得られる結晶が異なるところ、甲63記載の実験は、K O錠を水に入れ、再度乾燥させるという過程を経ており、K O錠中の結晶形態がそのまま維持されているとはいえない。また、同実験結果は、ピークとは判別できないものをピークと認定しており、不正確である。

したがって、被告ら製品は、構成要件CないしC'を充足しない。

2 争点(1)イ(構成要件Eの充足性)について

[原告の主張]

結晶形態Aは、約190℃以上で熱分解する。原告が製造しているピタバスタチンカルシウム原薬(本件結晶特許を充足する製品)を用いた興和の製剤であるリバロ錠は、インタビューフォーム〔甲4〕にあるように、融点を示さずに分解する。

そして、被告日医工製品及び被告壽製品は、リバロ錠の後発医薬品であるところ、被告日医工製品のインタビューフォーム〔甲29:3頁〕には、「融点(分解点)、沸点、凝固点」について「該当資料なし」と記載されている。そうすると、被告相模化成製品は、融点のない原薬であり、構成要件Eを充足する。

[被告らの主張]

争う。

3 争点(1)ウ（構成要件Hの充足性）について

〔原告の主張〕

ピタバスタチンカルシウム塩の結晶は、水分が4重量%以下になると、アモルファス化し、安定性が極めて悪くなる。そして、被告相模化成製品の水分量は7～13%である。

そうすると、被告相模化成工業が、被告相模化成製品を、他の被告らに販売するまで、また、被告日医工及び被告壽が、被告相模化成工業から購入した被告相模化成製品を、自らの製剤に利用するまで、水分量を4重量%より多く15重量%以下に保持した結晶形態Aとして保存していることは明らかであるから、被告らのピタバスタチンカルシウム塩の保存方法は、構成要件Hを充足する。

〔被告らの主張〕

構成要件Hは、一定の水分量を維持することを特徴とするものであるが、原告は、これについて主張・立証していない。

4 争点(1)エ（構成要件Iの充足性）について

〔原告の主張〕

前記3〔原告の主張〕のとおり、被告らは、ピタバスタチンカルシウム塩である被告相模化成製品を保存しており、構成要件Iを充足する。

〔被告らの主張〕

争う。

5 争点(2)（本件各特許権が特許無効審判により無効にされるべきものか否か）について

〔被告らの主張〕

(1) 本件各特許について、リバロ錠及び乙1文献による進歩性欠如

ピタバスタチンカルシウム塩を有効成分とする「リバロ錠」は、本件各特

許の優先日（平成15年12月26日）の前から販売されていた。同年7月発行の乙1文献には、「有効成分の各種条件下における安定性」を示す表が掲載されているが、同表には「結晶性低下」「水分減少」「水分増加」という記載があることから、リバロ錠の有効成分ピタバスタチンカルシウム塩が結晶であること及び一定の水分を含有し、その水分量の維持が課題となっていることがわかる。そして、保存形態を「ポリエチレン製アルミラミネート袋」にした場合、36か月（長期保存試験）又は6か月（加速試験）の保存期間において「変化なし」と記載されているから、安定である。また、乙1文献の3頁には「融点を示さずに分解した」と記載されている。そして、上記優先日当時、ピタバスタチンカルシウム塩について、結晶多形は存在しないと認識されていたところ、リバロ錠の製造開始当時に知られていた唯一の形態は結晶形態Aである。そうすると、リバロ錠の原薬であるピタバスタチンカルシウム塩は結晶形態Aに他ならない。

そして、結晶の存在がわかっているならば、当業者は、通常その結晶を確認するものであり、そのためにX線回折測定を実施してピークがみられる回折角を特定することは技術常識である。さらに乙3文献には10.3%のピタバスタチンカルシウム塩が得られることが開示されており、構成要件Bの水分量は容易に想到できる。

そうすると、本件各結晶発明は、リバロ錠から、乙1文献の記載に基づいて容易に想到し得るものである。

したがって、本件各発明は、進歩性に欠け、特許法29条2項により、特許を受けることができないから、本件各特許は、同法123条1項2号により無効にされるべきものである。

(2) 本件各特許について、甲9発明と同一発明

甲9公報は、チバ特許の特許公報であるが、チバ特許の請求項1記載の発明は、本件結晶特許の各構成要件を満たすものであり、両者は同一である。

そして、チバ特許は本件各特許の優先日（平成15年12月26日）よりも前の同年2月12日を優先日とするから、本件各発明は、特許法39条1項により、特許を受けることができない。

したがって、本件各特許は、同法123条1項2号により無効とされるべきものである。

(3) 本件各特許について、乙3公報による新規性又は進歩性欠如

乙3公報のうち国際公開公報〔乙3の1〕は、本件各特許の優先日より前の平成15年8月7日に頒布された。乙3広報の段落【0136】に記載された実験を、アクティブファーマ株式会社研究部所属のAが追試した結果は平成26年6月16日付け「ピタバスタチンカルシウムの先行技術文献に基づく再現実験の結果報告書」と題する書面（乙6。以下「乙6報告書」という。）のとおりであり、本件結晶発明1の構成要件を全て満たす結晶が得られた（以下、乙6報告書に記載された追試を「乙6追試」という。）。

そうすると、本件各結晶発明は、乙3発明と同一であるか、少なくとも、乙3公報の記載から容易に想到できる。

したがって、本件各発明は、新規性ないし進歩性を欠き、特許法29条1項又は2項により特許を受けることができないから、本件各特許は、同法123条1項2号により無効とされるべきものである。

(4) 本件各特許について、明確性要件違反及びサポート要件違反

本件各特許の特許請求の範囲には、構成要件Eの「融点」の定義がされていないから、本件各特許は不明確である。

また、本件各特許の明細書には、示差走査熱量測定の実験条件の記載がないため、同明細書の記載からは「示差走査熱量測定による融点95℃を有しないピタバスタチンカルシウム塩の結晶」の存在を確認することができず、構成要件Eは、発明の詳細な説明に記載されていない。

よって、本件各特許の特許請求の範囲の記載は、特許法第36条6項1号

及び同 2 号に規定する要件に違反するから、本件各特許は、同法 1 2 3 条 1 項 4 号により無効とされるべきである。

(5) 本件方法特許について、補正要件違反

ア 本件方法特許の出願当初の特許請求の範囲〔乙 5 の 1 の 3〕における請求項 1 に記載された発明は、次のとおりであった。

「式 (1) で表されるピタバスタチンカルシウム塩の保存方法であり、7 ~ 15 % の水分を含み、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結晶形態にて保存する方法。」

イ また、本件方法特許の出願当初の明細書〔乙 5 の 1 の 2〕の発明の詳細な説明には、次のとおり記載されていた。

「本発明者らは、・・・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、Cu K 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【0011】)

「即ち、本発明は、下記の要旨を有するものである。」 (段落【0012】)

「1. 式 (1)

(省略)

で表される化合物であり、・・・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 (結晶性形態 A)。」 (段落【0013】)

ウ その後、平成24年9月27日付手続補正書〔乙5の2〕による補正、同年11月28日付手続補正書〔乙5の4の2〕による補正、平成25年3月8日付手続補正書〔乙5の6の2〕による補正があり、現在の特許請求の範囲の記載に至っている。

出願時に記載のあった相対強度の要件は、いずれの補正でも削除されており、本件方法発明の特許請求の範囲の補正は、「願書に最初に添付した明細書、出願時の特許請求の範囲又は図面に記載した事項の範囲内」においてされたものではない。

エ したがって、本件方法特許は、特許法17条の2第3項に規定する要件に違反した補正をした特許出願に対してされたものであるから、同法123条1項1号により無効とされるべきものである。

(6) 本件方法特許について、分割要件違反

仮に、上記(5)の本件方法特許に係る補正が適法であったとしても、補正後の請求項1では、相対強度の要件が削除されており（構成要件C'）、構成要件Cにおいて規定されていた相対強度の要件を満たさないものを発明の対象に含んでいる。

ところが、分割前の原出願である本件結晶特許の特許請求の範囲及び明細書の記載は、相対強度を不可欠の要件としている。

したがって、本件方法発明の分割出願は、特許法44条1項の分割要件を満たさないものであって同条2項の規定の適用がないから、新規性や進歩性の判断は、分割出願時である平成23年11月29日を基準に行うこととなる。

そして、上記分割出願時点では、原出願の出願公表公報（乙4の2。特表2007-516952号公報、公表日平成19年6月28日）が公開されており、本件方法特許の内容が開示されている。

よって、本件方法特許は、新規性若しくは進歩性を欠く発明に対し、特許

法 29 条 1 項 3 号もしくは同条 2 項に違反してされたものであるから、同法 123 条 1 項 2 号により無効とされるべきものである。

[原告の主張]

(1) リバロ錠及び乙 1 文献による進歩性欠如につき

乙 1 文献には、結晶形態 A に関する具体的記載は存在しないし、リバロ錠の製造承認申請における審査報告〔乙 2 の 3〕には、結晶形態 A を得る方法や水分量が、化学的安定性に影響することの示唆もない。

そして、リバロ錠は、製剤製造において、比較的高い温度で乾燥する工程を含むため含有水分が大幅に減少している。また、リバロ錠について、粉末 X 線回折測定を実施しても、結晶形態 A を特定するピークは認められないから〔甲 39〕、リバロ錠を分析することによって、結晶形態 A が使用されているか否かを知ることはできない。したがって、本件結晶発明が公然実施されたことはないし、また、リバロ錠及び乙 1 文献から本件各発明を容易に想到することはできない。

(2) 甲 9 発明と同一発明につき

甲 9 公報に記載されているチバ特許の請求項 1 には、「結晶多形 A」と呼ばれる結晶の粉末 X 線回折測定におけるピークと水分量が記載されているだけであって、結晶多形 A を取得する方法は記載されていない。また、本件結晶特許の結晶形態 A と、チバ特許の結晶多形 A は、構成要件 C、C' の 15 本の回折角にピークが確認される点は同じであるが、チバ特許の請求項 1 には、20.8° 付近のピーク強度を 100% とした場合の 30.2° 付近のピークの相対強度が 25% より大きいことは記載されていない。そして、甲 9 公報に記載されたチバ特許の実施例の結晶多形 A の「X 線粉末回折図形」【図 1】をみると、30.2° 付近の回折ピークの相対強度は、25% を超えていない。

また、甲 9 公報において「結晶多形 A」の製造方法を記載している実施例

(段落【0045】)をみると、「示差走査熱量測定は、95℃の融点を明らかにした。」と明記されており、「95℃の融点」を有しないことを要件とする本件結晶発明の結晶形態Aとは異なる。

そうすると、甲9公報に記載されたチバ特許の結晶多形Aは、本件各発明の結晶形態Aと同一ではない。

(3) 乙3公報による新規性又は進歩性欠如につき

ア 相違点について

乙3公報には、「10.6% (w/w)の水を含む白色結晶性粉末」との記載があり、形式的には、本件各結晶発明の構成要件Bと一致するものの、「結晶性」が結晶を意味するのか不明である。

また、乙3公報には、構成要件Cの15本の回折角のピークについて記載がないこと及び本件各結晶発明の構成要件Eの「95°に融点がない」という点について記載がないことにおいて、乙3発明と本件各結晶発明は相違する。

イ 被告らの追試について

被告らは、乙3発明を追試した結果であるとして乙6報告書を提出しているが、乙6追試は適正な追試ではない。すなわち、まず、①乙3公報では、塩化カルシウム溶液とピタバスタチンナトリウム塩溶液を混合する操作の条件につき、混合後の攪拌温度と時間のみが記載されているが、乙6追試では、析出時の温度、混合速度（滴下する成分の滴下速度）、攪拌の強さなどの乙3公報に規定されていない条件を根拠なく用いている。そして、②乙3公報では、乾燥温度が20ないし25℃とされているものの、乾燥時間や減圧時の圧力は特定されていないところ、恒量に達するまでかなりの長時間乾燥するのが通常であり、また、水分量がコントロールされていたとは考えがたいにもかかわらず、乙6追試では、水分量をモニタリングしながら、水分量が10.6%になるまで乾燥している。これは、本

件各特許の明細書から、水分量の厳密な管理が重要であることの教示を得ない限り、行うはずがない実験方法である。

このように、乙6追試は、乙3公報に示されていない条件を付加して実施されており、追試として適切ではない。さらに、出発物質である「ピタバスタチンフリー体（酸型）」が、乙3公報の段落【0129】以下に説明されている方法で製造されているか否か不明である点においても、正確な追試とはいえない。

平成22年8月23日付け特許庁への刊行物提出書に添付された2010年（平成22年）8月19日付け実験報告書（甲48。以下「甲48報告書」という。）は、第三者が実施した乙3発明の追試であるが、この追試では、結晶形態Aではなく、チバ結晶Eが生じており、実験条件によっては結晶形態Aとはならないことがあり得ることを示している。

ウ 以上からすると、本件各特許は、乙3公報に照らし新規性を欠くとはいえないし、乙3公報の開示から当業者が容易に想到可能であるともいえないから、進歩性を欠くともいえない。

(4) 明確性要件違反及びサポート要件違反につき

示差走査熱量測定による融点の測定方法は周知技術であるから、本件各特許の明細書の記載は不明確ではないし、サポートもされている。

したがって、この点に関する被告らの主張は失当である。

(5) 本件方法特許に関する補正要件違反につき

原告は、本件方法特許権を本件結晶特許権から分割出願した際、その請求項1には、本件結晶特許の請求項1と同じ15本の回折角ピーク及び相対強度を記載していたが〔乙5の1の3〕、一回目の手続補正書（平成24年9月27日付け）〔乙5の2〕において、結晶形態Aに特徴的である3本の回折角ピークのみを記載するものへと補正した。その後、原告は、特許庁の拒絶理由通知を受け、15本の回折角ピークを記載するものへと戻す補正をし

たが、相対強度の記載をしていないことについては、特許庁から何ら指摘がなかった。原告は、特許庁に提出した平成25年3月8日付け意見書〔乙5の6の1〕に、「本願の親出願では、ピタバスタチンカルシウム塩の結晶について、X線粉末回折における回折角（ 2θ ）のピーク位置（パターン）とともに、特定の回折角（ 30.16° ）のピーク強度（相対強度）もあわせて記載していましたが、元来、結晶の特定（差異）は、結晶格子の構造を反映する、X線粉末回折における回折角（ 2θ ）のピーク位置（パターン）で規定すれば十分」である旨記載していたが、特許庁はこれが技術常識であると認めたのである。

技術常識によれば、結晶形の特定に重要なのは回折角のピーク位置であり、10本以上のピーク位置が特定されれば、結晶形の同定は十分に可能である。他方、同一の結晶形であっても、製造条件や粉碎条件の相違により、ピークの相対強度が変動する。たとえば、織田寿久作成にかかる平成26年8月8日付け「ピタバスタチンカルシウム塩（結晶A）の粉碎による粉末X線回折の比較」と題する書面〔甲53〕記載の結晶形態Aを用いた実験においては、 20.68° のピークの強度を100%とした場合の 30.16° のピークの相対強度について、未粉碎品では約13%であったが、粉碎品では25%であった。ところで、粉碎品は表面積が広く、水分量が不安定な性質を有する結晶形態Aにおいては、保存上不利であり、未粉碎品の安定性は粉碎品より優れていると考えられるから、未粉碎の結晶に本件方法発明が適用できることは明らかである。また、未粉碎品でも開放状態では水分を失いやすく不安定であるから、本件方法発明を適用する必要性がある。

したがって、補正により、本件方法特許の保存方法が、実施例記載の結晶とは、 30.16° 付近の相対強度が異なる状態の結晶形態Aにも適用されるようにすることは、出願当初の明細書の記載と技術常識により当業者が容易に理解できることであるから、新規事項は導入されていない。

以上の理由により、相対強度要件を削除した補正は、特許法17条の2第3項の補正要件に反しない。

(6) 本件方法特許に関する分割要件違反につき

結晶形の特定に重要なのはピーク位置であり、10本以上のピーク位置が特定されれば結晶形の同定は十分に可能であるというのが技術常識である。他方、同一の結晶形においても、結晶粒子の大きさなどの外見形状が相違することなどにより、ピークの相対強度は変動するところ、未粉砕で、「30.16°のピークの相対強度が25%を下回る」結晶粒子が、粉砕した場合よりも安定性が劣る理由はないから、このような未粉砕の結晶粒子についても、本件方法発明の方法が適用できることは、当業者に容易に理解できる。

したがって、相対強度の要件を満たさない結晶に対する本件方法発明についても、分割前の原出願の特許請求の範囲及び明細書の記載に含まれていると当業者は理解できるから、本件方法特許に分割要件違反はない。

6 争点(3) (本件訂正による対抗主張の成否) について

[原告の主張]

(1) 本件訂正により、被告らの主張する無効理由のうち、前記5(3)[乙3公報による新規性又は進歩性欠如]の無効理由が解消される。

すなわち、本件訂正は、本件結晶特許明細書記載の実施例の方法で製造した結晶形態Aが、粉砕した状態で医薬品の原薬として十分な安定性を示すという特徴を明確化したものであるが、本件訂正発明と乙3公報とは、①乙3公報の実施例の「結晶性粉末」が、粉砕された状態で安定性を保持するか否か不明である点、②乙3公報の実施例の方法では、1-フェニルエチルアミン、tert-ブチル-メチルエーテル若しくは塩酸又はそれによる分解物等が結晶形態Aに混入する可能性があり、この不純物が安定性に影響する可能性がある点、及び③乙3公報には、実施例で得られたビタバスタチンカルシウムを原薬として使用することや粉砕することは記載されていない点にお

いて、相違する。

そして、乙3公報の実施例の追試により結晶形態Aが得られたとしても、安定性試験を行うことなしに、本件訂正発明の安定性を容易に想到することはできない。また、水分量と結晶形態Aの安定性を知らない当業者は、結晶形態Aを不安定なものと認識するから、これを、より不安定であることが明らかでない微粒子へと粉碎した上で安定性試験を試みる動機付けがない。そうすると、乙3公報と比較し、本件訂正発明の進歩性はより明らかである。

なお、本件各結晶特許の明細書には、粉碎された結晶形態Aの粉末X線回折図が【図1】として、その保存安定性が【表1】として記載されていたから、本件各結晶発明は、粉碎された結晶形態Aの発明であったのであり、本件訂正は適法である。

(2) この点に関して被告らは、本件訂正発明には、新たに、明確性要件違反及びサポート要件違反の無効理由があると主張する。

しかし、当業者であれば、本件訂正発明に記載された「医薬品の原薬として安定性を保持する」について、技術常識に基づき、特別な保存手段を講じることなく、3年以上類縁物質（分解物）の総量が1.0%以下に保たれることを意味すると理解するから、明確性要件違反はない。

また、本件結晶特許明細書に開示された方法により製造された結晶形態Aは、同明細書の段落【0009】の【表1】に示されたとおり、非常に高純度であり、また、水分量を一定範囲に維持することによって高い安定性を有するから、不純物などの影響を受けていない結晶形態Aは、医薬品の原薬として安定性を有する。すなわち、本件結晶特許明細書の開示によれば、本件各結晶発明の課題が、粉末X線回折測定の数値と水分量によって特定された結晶形態Aの本来の性質によって解決されることを理解することができる。したがって、サポート要件違反もない。

〔被告らの主張〕

(1) 乙3発明を追試した結果（乙6追試）によれば、本件各結晶特許が規定する結晶形態Aが得られ、その安定性は良好であった〔乙6，9〕。これは、本件訂正発明の結晶形態に他ならない。

そうすると、本件訂正発明は、乙3公報との相違点を生じることにはならない。

この点に関して原告は、粉末X線回折パターンが同じであっても、製造方法によって安定なものと不安定なものがあるところ、本件訂正により安定なものに限定した旨の主張をするが、本件訂正発明は、「物」の発明であるし、特定の不純物の有無を要件とするものでもないから、原告の主張は失当であり、進歩性欠如の無効理由は解消されない。

さらに、本件結晶特許明細書の段落【0033】には、粉碎された状態で粉末X線回折測定をした旨の記載はない。仮に粉碎によって物が変わるのであれば、訂正の前後で発明の対象が異なることとなるから、本件訂正は不適法である。

(2) 本件訂正発明には、新たに、①明確性要件違反及び②サポート要件違反という特許法36条6項1号，2号所定の無効理由がある。

すなわち、本件訂正発明の「医薬品の原薬として安定性を保持する」という発明特定事項は不明確である。また、本件訂正発明は、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、実施例1に記載される特定の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。そして、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ない。

第4 当裁判所の判断

1 本件各発明の概要

(1) 本件結晶特許明細書等の発明の詳細な説明には、次の記載がある。〔甲2の1〕

- ・「本発明は、HMG-C o A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】）
- ・「詳細には、5～15%（W/W）の水分を含有することを特徴とし、安定性などの面から医薬品原薬として有用な結晶性形態のピタバスタチンカルシウム塩及びそれを含む医薬組成物に関する。」（段落【0002】）
- ・「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】）
- ・【表1】

表1 原薬安定性データ（水分の影響）

保存条件	測定項目	保存期間			
		開始時	30日	60日	90日
40℃気密	水分(%)	7.89	7.85	7.88	7.81
	類縁物質(%)	0.179	0.208	0.189	0.211
	ピタバスタチンカルシウム(%)	99.38	99.42	99.79	99.64
40℃開放	水分(%)	7.89	2.45	1.99	1.77
	類縁物質(%)	0.179	0.742	1.347	2.099
	ピタバスタチンカルシウム(%)	99.38	99.26	97.19	96.49

- ・「本発明が解決しようとする課題は、特別な貯蔵条件でなくとも安定なピタバスタチンカルシウムの結晶性原薬を提供することであり、さらに工業的大量製造を可能にすることである。」（段落【0009】）
- ・「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。

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

装置

粉末X線回折測定装置：MX Labo（マックサイエンス製），線源：
Cu，波長：1.54056 Å，ゴニオメータ：縦型ゴニオメータ，モ
ノクロメータ：使用，補助装置：なし，管電圧：50.0 kV，管電流：
30.0 mA

測定方法：測定前に，シリコン（標準物質）を用いてX線管アライメントを検査する。試料約100mgをガラス試料板にのせ平坦にした後，以下の条件にて測定する。

データ範囲：3.0400～40.0000deg，

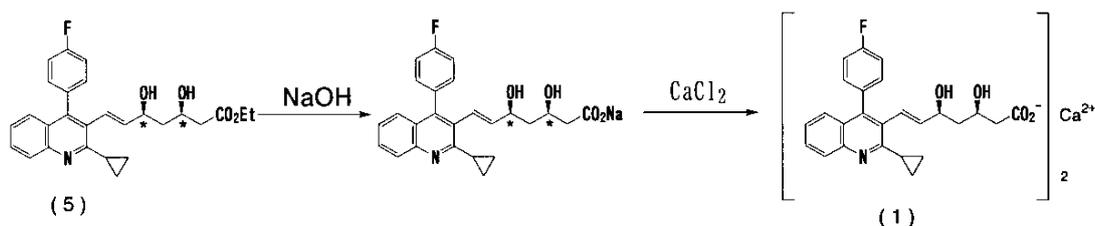
データ点数：925，

スキャン軸：2θ/θ，θ軸角度：設定なし，

サンプリング間隔：0.0400deg，

スキャン速度：4.800deg/min」（段落【0016】）

・【化8】



（段落【0031】）

・「2.71kg（6.03mol）の化合物（5）を，50kgのエタノールに攪拌しながら溶解し，均一溶液であることを確認した上で，58.5kgの水を加えた。-3～3℃に冷却した後，2mol/リットル（L）水酸化ナトリウム水溶液の3.37Lを滴下した後，続けて同温度で3時間攪拌し，加水分解反応を完結させた。全量の水酸化ナトリ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。」（段落【0032】）

・「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℃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】)

- ・「【図1】水分値が8.78%である結晶性形態Aの粉末X線回折図である。」
- ・「【図2】図1で使用した結晶を乾燥し、水分値を3.76%とした際の粉末X線回折図である。」

【図1】

【図2】

Fig. 1

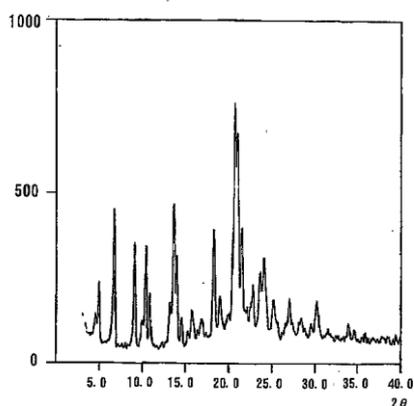
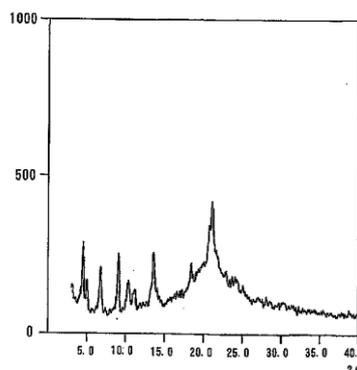


Fig. 2



(段落【0035】)

(2) 本件方法特許明細書等の発明の詳細な説明には次の記載がある。〔甲2の2〕

- ・「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 Monocalciumbis [(3R, 5S, 6E) - 7 - (2-cyclopropyl-4-(4-fluorophenyl)

- 3 - q u i n o l y l) - 3 , 5 - d i h y d r o x y - 6 - h e p t e n o a t e] 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を特別な貯蔵条件でなくとも長期間にわたって安定して保存する方法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。

本発明が解決しようとする課題は、特別な貯蔵条件でなくとも、ピタバスタチンカルシウムの結晶性原薬を安定的に保存する方法を提供することにある。」（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、この結晶性原薬を安定的に保存する方法として、本発明を完成させた。」（段落【0009】）

(3) 本件各特許明細書等の記載によれば、医薬品の原薬は、安定な結晶形態を有することが望ましいところ、従来のピタバスタチンカルシウムの製造法においては、安定な水分値や結晶形に関する記載がなかったことから、本件各発明は、ピタバスタチンカルシウム塩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安定性が向上すること及びピタバスタチンカルシウム塩の3つの結晶形態（結晶形態A、B、C）のうち、結晶形態Aが最も医薬品の原薬として好ましいことを見いだしたもので、本件各結晶発

明は、特別な貯蔵条件でなくとも安定なピタバスタチンカルシウムの結晶性原薬を提供し、また、工業的大量製造を可能とするものであること及び本件方法発明は、同原薬を安定的に保存する方法を提供するものであることが認められる。

2 争点(2) (本件各特許権が特許無効審判により無効にされるべきものか否か) について

事案に鑑み、争点(2)ウ、オ及びカについて判断する。

(1) 争点(2)ウ (本件各特許に関する乙3公報による新規性又は進歩性欠如) について

ア 乙3発明の内容

(ア) 乙3公報には、次の各記載がある。

- ・「別法として、(E) - (3R, 5S) - 7 - [2-シクロプロピル-4-(4-フルオロフェニル)キノリン-3-イル] - 3, 5-ジヒドロキシ-6-ヘプテン酸およびそのカルシウム塩は、それぞれ、以下のようにして製造し得る：(以下略)」(段落【0135】)
- ・「カルシウム塩形成のために、該酸(2.55g, 6.05ミリモル)を水(40.5mL)に懸濁し、水酸化ナトリウム(0.260g, 6.5ミリモル)を加えて、相当するナトリウム塩の澄明な溶液を得る。水(2mL)中塩化カルシウム(0.399g, 3.49ミリモル)の溶液をナトリウム塩の溶液に滴下する。塩化カルシウムの添加後、直ちに懸濁液が形成される。懸濁液は20~25℃で4時間、15~17℃で2時間、攪拌する。生成物を濾過単離し、濾過ケーキを冷水で洗い、20~25℃で減圧下乾燥して(E) - (3R, 5S) - 7 - [2-シクロプロピル-4-(4-フルオロフェニル)キノリン-3-イル] - 3, 5-ジヒドロキシ-6-ヘプテン酸カルシウム塩を、10.6%(w/w)の水を含む白色結晶性粉末として得る。 $[\alpha]_D^{20} = +2$

2.92° (1:1アセトニトリル/水, C=1)。X線解析は結晶変形Aの存在を明らかにした。(以下略)」(段落【0136】)

(イ) 上記からすると、乙3公報の段落【0136】の「該酸」は、段落【0135】で説明されている「(E) - (3R, 5S) - 7 - [2-シクロプロピル-4-(4-フルオロフェニル)キノリン-3-イル]-3, 5-ジヒドロキシ-6-ヘプテン酸」を指すことが明らかである。そうすると、乙3公報の段落【0136】には、次の内容の発明(乙3発明)が記載されているといえる。

「(E) - (3R, 5S) - 7 - [2-シクロプロピル-4-(4-フルオロフェニル)キノリン-3-イル]-3, 5-ジヒドロキシ-6-ヘプテン酸を水に懸濁し、水酸化ナトリウムを加えて、相当するナトリウム塩の溶液を得、水中塩化カルシウムの溶液を、上記ナトリウム塩の溶液に滴下し、形成された懸濁液を20~25℃で4時間、15~17℃で2時間攪拌し、生成物を濾過単離し、濾過ケーキを冷水で洗い、20~25℃で減圧下乾燥して得られた10.6% (w/w)の水を含む(E) - (3R, 5S) - 7 - [2-シクロプロピル-4-(4-フルオロフェニル)キノリン-3-イル]-3, 5-ジヒドロキシ-6-ヘプテン酸カルシウム塩の白色結晶性粉末。」

なお、乙3公報の段落【0131】、【0132】において、「(E) - (3R, 5S) - 7 - [2-シクロプロピル-4-(4-フルオロフェニル)キノリン-3-イル]-3, 5-ジヒドロキシ-6-ヘプテン酸カルシウム塩」は、式(1)の構造式で表されるものとされており、ピタバスタチンカルシウム塩と同義である。

イ 本件各結晶発明と乙3発明との対比

(ア) 上記アのとおり、乙3発明は、10.6% (w/w)の水分を含む式(1)で表される化合物であるピタバスタチンカルシウム塩の結晶性粉

末であり、結晶性粉末は、結晶からなる粉末を意味するというべきであるから、本件各結晶発明の構成要件A, B, Dは、乙3発明と一致する。

(イ) 本件各結晶発明は、乙3発明と次の点で相違する。

① 相違点 a

本件各結晶発明は、「CuK α 放射線を使用して測定するX線粉末解析において、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」(構成要件C)のに対し、乙3公報の段落【0136】には、「X線解析は結晶変形Aの存在を明らかにした。」と記載されており、乙3発明の結晶について、どのような回折角(2 θ)にピークがみられるのか不明であり、また、仮に上記構成要件Cの回折角においてピークがみられたとしても、20.68°の回折角(2 θ)のピーク強度を100%とした場合の30.16°の回折角(2 θ)の相対強度が不明である点

② 相違点 b

本件各結晶発明は、「示差走査熱量測定による融点95°Cを有するものを除く」(構成要件E)のに対し、乙3発明では、結晶の融点が不明である点

③ 相違点 c

本件結晶発明2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」「医薬組成物」(構成要件F, G)であるが、乙3発明は、医薬組成物であることは要件とはされて

いない点

ウ 新規性及び進歩性の判断

(ア) 相違点 a 及び b について

被告らは、乙3公報の段落【0136】に記載された実験を、アクティブファーマ株式会社研究部が追試した結果を記載したものとして、乙6報告書を提出したが、そこに記載された乙6追試では、3回の追試が行われているところ、これらの追試により得られた結晶について粉末X線回折測定をした結果、構成要件Cの回折角に対応するとみられる15の回折角においてピークが観測され、その回折角はいずれも、構成要件Cの15の回折角と、 $\pm 0.2^\circ$ の範囲で一致した〔表5〕。なお、結晶を同定するための粉末X線回折測定におけるピークの回折角は、 $\pm 0.2^\circ$ の範囲にあれば、同一の回折角のピークであることを否定する理由がないことは、当事者間に争いが無い。そして、乙6追試における粉末X線回折測定において観測された 20.68° に相当する回折角(2θ)のピーク強度を100%とした場合の、 30.16° に相当する回折角(2θ)の相対強度は、34%、30%、25%であり、いずれも25%以上であった〔表6〕。さらに、乙6追試により得られた結晶の融点は、 84.8°C 、 78.5°C 、 78.0°C であったから〔図4、5、6〕、同結晶の融点は、 95°C ではなかった。

そうすると、乙6追試が、本件結晶特許の出願時の技術常識に従ったものであれば、本件結晶発明1は乙3公報に記載されているに等しいといえることができる。

(イ) 乙6追試では、「(E)-3(R)-5(S)-ジヒドロキシ-7-[4'-(4''-フルオロフェニル)-2'-シクロプロピルキノリン-3'-イル]ヘプト-6-エン酸」2.55gを、水40.5mlに懸濁し、水酸化ナトリウム0.260gを加えて、相当するナトリウム塩の澄明な溶液を

得、水 2 m l 中無水塩化カルシウム 0. 3 9 9 g の溶液を、3 分間又は 3 6 分間で滴下し、直ちに 2 0 ないし 2 5 °C で 4 時間、1 5 ないし 1 7 °C で 2 時間攪拌し、生成物を濾過単離し、濾過ケーキを冷水で洗い、2 0 ないし 2 5 °C で減圧下乾燥して白色結晶性粉末を得るという方法がとられた。塩化カルシウム水溶液の滴下時間を 3 分として 2 度、3 6 分として 1 度の実験が行われ、乙 3 公報の段落【0 1 3 6】に明確な記載がされていない温度及び圧力条件は、第 1 6 改正日本薬局方通則に則って実施された〔乙 6〕。

(ウ) 乙 6 追試の条件の適切性

乙 3 公報の段落【0 1 3 6】には前記ア(ア)のと通りの記載があるが、乙 3 公報には、塩化カルシウム水溶液の滴下時間及び乾燥条件が開示されていない。そこで、以下、乙 6 追試における上記各条件の選択が技術常識に従ったものといえるか検討する。

① 滴下時間について

証拠〔甲 4 9 の 1 ・ 2〕によれば、結晶化の実験を行うに当たり、当業者は、当然に滴下時間の検討をすると認められるから〔甲 4 9 の 1 : 4 3 5 頁、甲 4 9 の 2 : 3 3 頁〕、乙 3 発明の追試をする場合に、乙 3 発明の結晶が得られるよう試行錯誤して滴下時間を決定することは当業者が通常行うべきことである。

そして、乙 6 追試において、滴下時間を 3 分又は 3 6 分としたことは、当該分野の技術常識からみて、不自然に長時間又は短時間であるとは考えられず、適切というべきである。また、乙 6 追試において、滴下時間を 3 分とした場合と 3 6 分とした場合のいずれにおいても、同一とみられる結晶が得られていることから、滴下時間が 3 分であるか 3 6 分であるかは、得られる結晶形に影響を与えないものであるといえ、当該事実も、乙 6 追試で採用された滴下時間が適切であったこ

とを裏付けるというべきである。

② 乾燥条件について

この点に関して原告は、乙3公報に接した当業者は、恒量まで乾燥することが通常であり、乙6追試のように10.6%で乾燥を止めることはないと主張する。

しかし、「医薬品の多形現象と晶析の化学」（芦澤一英編著、平成14年9月20日発行。甲49の1：435頁）に、「結晶化の検討に際して、結晶水と付着水、溶媒和と残留溶媒、純度（不純物、無機物）と結晶形等基礎的検討を実施する。」と記載されていることからすると、結晶化実験において、水分量は基礎的な検討事項であると認められる。そうすると、乙3公報の段落【0136】に乾燥後の結晶の水分量が10.6%である旨記載されている以上、乙3発明を追試しようとする当業者が、結晶が水和物結晶である可能性をも考慮しつつ、生成物の水分量をモニタリングして、温度や時間を調節し、水分量が10.6%になるように乾燥させることは、当業者が通常行う試行錯誤の範囲の行為と認められる。

(エ) 原告の主張について

この点に関して原告は、乙6追試が適切な追試ではないと主張し、甲48報告書記載の乙3発明の追試ではチバ結晶Eが得られたこと及びB作成にかかる平成26年9月30日付け「特表2005-520814記載の方法で合成したピタバスタチンカルシウム塩の安定性」と題する書面（甲61。以下「甲61報告書」という。）記載の乙3発明の追試では、安定ではない結晶形態Aが得られたことを指摘する。

しかし、甲48報告書には、得られた白色結晶性粉末の水分量が8.03%であったと記載されており、乙3発明の水分量（10.6%）とは相当程度に異なるから、甲48報告書記載の追試が、適切な条件で行

われたと認めるに足りない。そして、甲61報告書記載の追試によって得られた結晶は、粉末X線回折測定の結果、本件結晶発明1の構成要件Cの15本の回折角と±0.04°以内で一致する回折角においてピークが観測され、さらには、20.7°付近のピークの強度を100%とした場合の30.2°付近の相対強度が28%であったから、むしろ、甲61報告書は、乙3発明が、本件結晶発明1と同一であることを裏付けるものであるというべきである。なお、安定性は、本件結晶発明1の構成要件ではないから、乙3発明の追試により得られた結晶が安定性を欠いていたとしても、乙3発明と本件結晶発明1の同一性を否定することはできない。

(オ) そして、原告の主張するその余の点を考慮しても、乙6追試に、乙3発明の追試として不適切な点があることはうかがえない。

そうすると、乙6追試は、乙3発明を、技術常識を参酌して追試した結果を示していると認めるのが相当である。

(カ) 本件結晶発明1の新規性

以上によれば、本件結晶発明1は、乙3公報に記載されているに等しい事項というべきであるから、特許法29条1項3号により、特許を受けることができない。

(キ) 相違点cについて

次に、本件結晶発明2について検討するに、本件結晶発明2は、乙3発明とは、相違点cの点で相違するから、乙3公報に照らし、新規性を欠くとまではいえない。

しかし、乙3公報は、段落【0001】において、乙3公報記載の発明が「エナンチオマーとして純粋なHMG-C₆A還元酵素阻害剤の製造法、製造工程、および新規中間体に関する」ものであるとした上で、段落【0004】に「好適なHMG-C₆A還元酵素阻害剤はすでに市

場に出された薬剤であり、最も好ましいのは、[中略]ピタバスタチン、とりわけそのカルシウム塩」という記載があるから、技術常識に照らし、乙3公報から、当業者が、乙3発明の結晶を含有する医薬組成物を製造することは容易に発明することができたと認めるのが相当である。

したがって、本件結晶発明2は、進歩性が欠如しているというべきであり、特許法29条2項により、特許を受けることができない。

エ 本件方法発明について

(ア) 本件方法発明は、構成要件B、A、Dにおいて、乙3発明と一致するが、次の相違点がある。

① 相違点 a'

本件方法発明は、「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°、27.00°及び30.16°の回折角(2 θ)にピークを有」する(構成要件C')のに対し、乙3公報の段落【0136】では、「X線解析は結晶変形Aの存在を明らかにした。」と記載されているのみであり、乙3発明の結晶が、どのような回折角(2 θ)にピークを有するか不明である点

② 相違点 b

本件方法発明は、その対象となる結晶として「示差走査熱量測定による融点95°Cを有するものを除く」(構成要件E)のに対し、乙3発明では、結晶の融点が不明である点

③ 相違点 d

本件方法発明は、「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」「ピタバスタチンカルシウム

塩の保存方法」(構成要件H, I)であるが、乙3発明では、そのような特定はされていない点

(イ) 容易想到性の判断

相違点 a' 及び b は、前記ウのとおり、乙3発明の適切な追試である乙6追試により得られた結晶においても見られる特徴である。

そして、相違点 d については、化合物の保存を密栓したビンなどの容器中の気密条件下で行うことは、化合物に係る技術分野における技術常識といえるところ、乙3発明の10.6重量%の水分を含む結晶性粉末を上記のような気密条件下で保存した場合には、含有水分量はほとんど変化しないと考えられる。

そうすると、当業者であれば、乙3発明の結晶の含有水分を、4重量%より多く、15重量%以下の水分の範囲に維持することは、容易に想到できるといえる。

したがって、本件方法発明は、当業者が、乙3発明に基づいて容易に発明をすることができたというべきであるから、特許法29条2項により、特許を受けることができない。

(2) 争点(2)オ(本件方法特許に関する補正要件違反)について

ア 本件方法特許の出願当初、特許請求の範囲における請求項1に記載された発明は次のとおりであった〔乙5の1の3〕。

「式(1)で表されるピタバスタチンカルシウム塩の保存方法であり、7～15%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する結晶形態にて保存する方法。」

イ 原告は、その後、補正により構成要件Cの相対強度の発明特定事項を削除し、次のとおりの請求項1として特許（本件方法特許）を受けた。

「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7重量%～13重量%の水分を含む、式（1）で表される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）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ことを特徴とするピタバスタチンカルシウム塩の保存方法。」

ウ 上記ア及びイからすると、本件方法特許の出願当初は、保存方法の対象となる結晶について、20.68°の回折角（2 θ ）のピーク強度を100%とした場合の30.16°の回折角ピークの相対強度が25%よりも大きなもののみとしていたにもかかわらず、上記イの補正により、上記相対強度が25%以下のものを含むものへと拡大されたものと認められる。そして、出願当初の特許請求の範囲、明細書及び図面には、構成要件Cの相対強度の発明特定事項を満たさない結晶形態であっても安定に保存できることについての記載はない。

そうすると、上記イの補正は、新たな技術的事項を導入するものであって、特許法17条の2第3項の補正要件に違反するから、本件方法特許は、同法123条1項1号により無効とされるべきものである。

(3) 争点(2)カ（本件方法特許に関する分割要件違反）について

特許出願が特許法44条1項に従って適法に分割出願されたときは、新た

な特許出願は、もとの特許出願の時にしたものとみなされる（特許法44条1項）。そして、本件方法特許は、本件結晶特許の分割出願であるところ、上記(2)のとおり、構成要件Cの相対強度の発明特定事項を削除する補正をしたことによって、新たな技術的事項を導入するものとなったから、適法に分割出願がされたということができない。そうすると、本件方法特許について、もとの特許である本件結晶特許の出願日に出願したとみなすことができないから、本件方法特許の出願日は、分割出願がされた平成23年11月29日である。

そして、本件方法発明は、保存方法の対象となる結晶の態様として、構成要件Cの相対強度が特定された結晶を含むものであって、そのような結晶の保存方法は、本件結晶特許権の出願の公報に記載されており、平成17年7月14日に国際公開されている〔乙4の2〕。そうすると、本件方法発明は、特許出願前に、日本国内又は外国において、頒布された刊行物に記載された発明又は電気通信回線を通じて公衆に利用可能となった発明にあたるから、特許法29条1項3号により特許を受けることができない。

(4) 小括

以上のとおり、本件各特許は、いずれも、乙3公報により新規性又は進歩性を欠くものであり、また、本件方法特許は、補正要件に違反し、さらに、分割要件に違反するものであって新規性を欠くものである。

3 争点(3)（本件訂正による対抗主張の成否）について

(1) 原告は、本件結晶特許権に係る無効審判（無効2013-800211）において、訂正請求をしており、本件訂正により前記2(1)の無効理由が解消されると主張しているので、以下検討する。

(2) 本件訂正の適法性

ア 本件訂正は、本件結晶特許権の請求項1に、構成要件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」を追加し（以下「訂

正事項 1」という。），構成要件Dに、「粉碎された」を挿入して（以下「訂正事項 2」という。），構成要件D' 「粉碎されたピタバスタチンカルシウム塩」とするものである。

イ 訂正事項 1 について

本件結晶特許権の出願当初の明細書，特許請求の範囲又は図面（乙 4 の 1 の 2・3。以下「本件出願当初明細書等」という。）には，「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。（中略）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（結晶形態A）が，最も医薬品の原薬として好ましい」（段落【0010】），「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】）と記載されていることからすると，「結晶形態A」は，医薬の原薬に適した安定性を有するものであると認められる。そして，本件出願当初明細書等には，結晶の「水分値は，最終的に5～15%（W/W）の範囲になるよう調整されるが，好ましくは7～15%（W/W），より好ましくは7～13%（W/W），最も好ましくは9～13%（W/W）の範囲である。」（段落【0023】）と記載されていることからすると，結晶形態Aを安定に保持するには，その水分を7～13%に調製する必要があると認められる。よって，結晶形態Aが「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」（構成要件X）という性質を有することは，本件出願当初明細書等の記載から導き出すことができる。

ウ 訂正事項 2 について

(ア) 本件出願当初明細書等には，「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。」（段落【0023】）と記載されているが，そのほかに「粉碎」に関する記載はなく，実施例 1 で得られた結晶形態Aが粉碎されたものである旨の記載はないし，【表

1】及び【図1】に示された結晶形態Aが粉砕されたものであることの記載もない。

(イ) そして、証拠〔甲52, 53〕によれば、結晶を粉砕すると、粉末X線回折測定における相対強度が影響を受けることが認められるから〔甲52：B-379頁, 甲53〕, 粉砕されたピタバスタチンカルシウム塩の結晶が構成要件Cの相対強度に係る要件を満たすものであることについて、本件出願当初明細書等から導くことができるとはいえない。

(ウ) そうすると、本件出願当初明細書等には、「粉砕されたピタバスタチンカルシウム塩」については記載されているといえても、訂正後の請求項1の「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 $^{\circ}$, 6.72 $^{\circ}$, 9.08 $^{\circ}$, 10.40 $^{\circ}$, 10.88 $^{\circ}$ 13.20 $^{\circ}$, 13.60 $^{\circ}$, 13.96 $^{\circ}$, 18.32 $^{\circ}$, 20.68 $^{\circ}$, 21.52 $^{\circ}$, 23.64 $^{\circ}$, 24.12 $^{\circ}$ 及び27.00 $^{\circ}$ の回折角(2 θ)にピークを有し、かつ、30.16 $^{\circ}$ の回折角(2 θ)に、20.68 $^{\circ}$ 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ピタバスタチンカルシウム塩の結晶」であって、かつ、「粉砕されたピタバスタチンカルシウム塩」について記載されているということとはできない。

(エ) そして、その余の本件出願当初明細書等のすべての記載を総合しても、訂正事項2に係る技術的事項を導くことができるということとはできない。

エ したがって、本件訂正は、特許法134条の2第9項の準用する同法126条5項所定の要件を満たさないから、訂正は認められない。

(3) 本件訂正により無効理由が解消するか

なお、仮に本件訂正が認められたとすると、本件訂正により新たな相違点(本件訂正発明は、乙3発明とは異なり、①7~13%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及び②粉砕されたものであること)

が生じるが、乙3発明の適切な追試である乙6追試の結果得られた結晶が安定性を保持していること〔乙9〕からすると、上記①は実質的な相違点とはいえないし、医薬品の原薬を製剤化する際に、原薬である結晶を粉碎すること（上記②）は通常行われる操作であることを考慮すると、医薬品原薬として適切な粒度にするために、ピタバスタチンカルシウム塩の結晶を「粉碎されたもの」にすることは、技術常識に照らし、当業者が容易になし得るといふべきであるから、本件訂正発明は、進歩性を欠くといふべきである。

そうすると、本件訂正によっても、前記2の無効理由は解消されない。

(4) したがって、いずれにしても、原告による訂正の対抗主張は理由がない。

4 結論

以上によれば、本件各特許は特許無効審判により無効にされるべきものと認められるから、原告は、特許法104条の3第1項により、被告らに対しその権利を行使することができない。

したがって、その余の争点について判断するまでもなく、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40部

裁判長裁判官

東 海 林 保

裁判官

廣 瀬 孝

裁判官

勝 又 来 未 子

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°)
5.10°	(10.50°)
5.29°	(10.89°)
6.44°	(13.26°)
6.62°	(13.63°)
6.82°	(14.05°)
8.92°	(18.40°)
10.00°	(20.64°)
10.38°	(21.43°)
11.44°	(23.65°)
11.62°	(24.02°)
13.02°	(26.96°)
14.59°	(30.26°)

2 下記商品名のピタバスタチンカルシウム製剤

- (1) ピタバスタチンカルシウム錠1mg 「日医工」
- (2) ピタバスタチンカルシウム錠2mg 「日医工」
- (3) ピタバスタチンカルシウム錠4mg 「日医工」

3 下記商品名のピタバスタチンカルシウム製剤

- (1) ピタバスタチンカルシウム錠 1 m g 「K O」
- (2) ピタバスタチンカルシウム錠 2 m g 「K O」