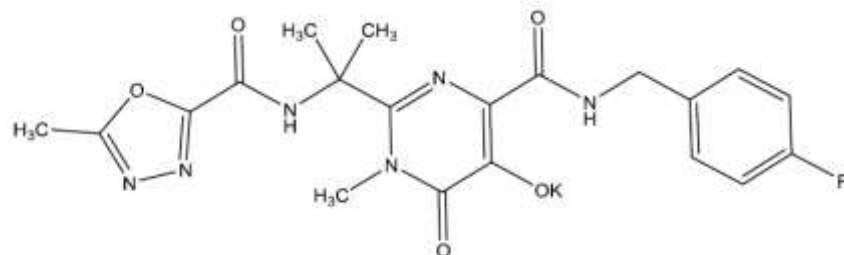


(別紙) 本件訂正発明 1～3 と被告製品の対比

1 被告製品

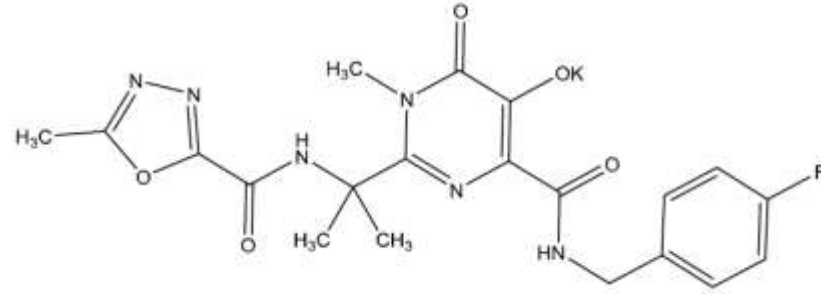
有効成分としてラルテグラビルカリウム（以下の構造式）を含有するインテグラーゼ阻害剤である医薬組成物（甲 3）。



ラルテグラビルカリウム

2 対比

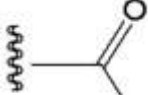
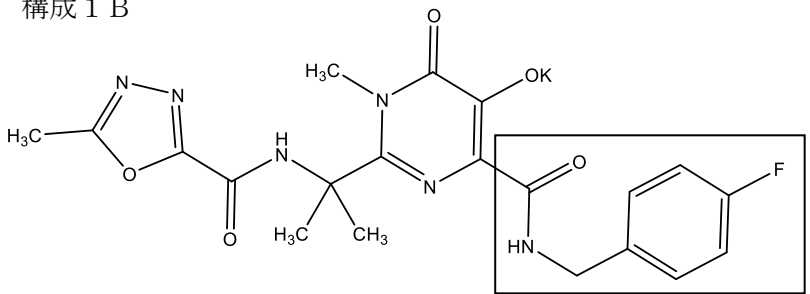
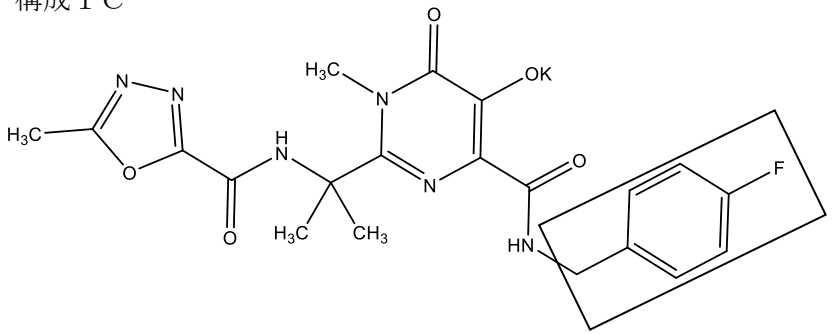
本件訂正発明 1～3 との対比が理解しやすいように、以下では上記構造式を本件訂正発明 1～3 の構成要件の式（I）の向きと合わせて記載しなおした上で、本件訂正発明 1～3 の構成要件に対応するラルテグラビルカリウムの構造部分を四角で囲んだ。なお、構成要件 1 A～1 I、2 A～2 I、2 A～3 I は有効成分に関する構成であり、構成要件 1 J、2 J、3 J が当該有効成分を含んだインテグラーゼ阻害剤である医薬組成物としての構成である。また、それぞれの構成要件に対応する被告製品の構成をそれぞれ「構成 1 A」などとする（「請求項の記載」の下線は、平成 29 年 4 月 13 日付の訂正箇所である（甲 73））。

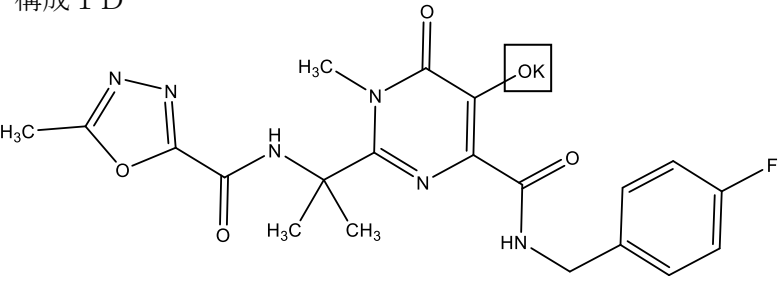
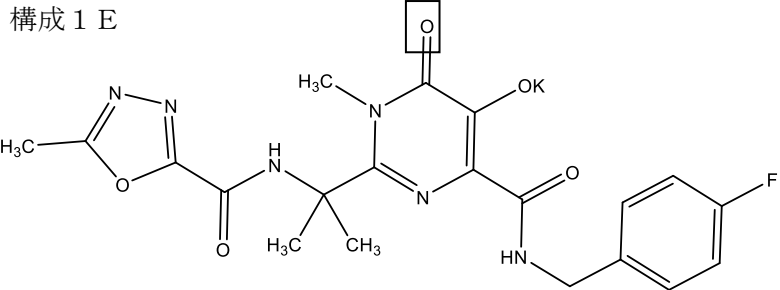
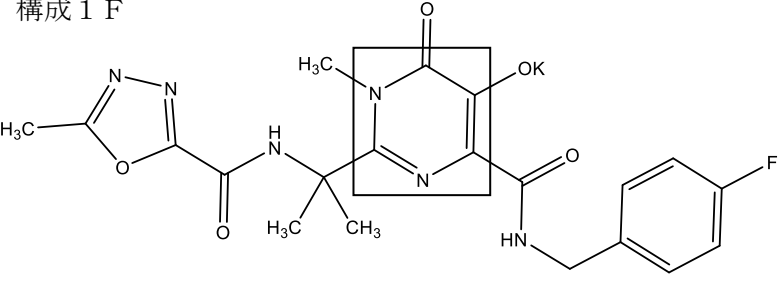


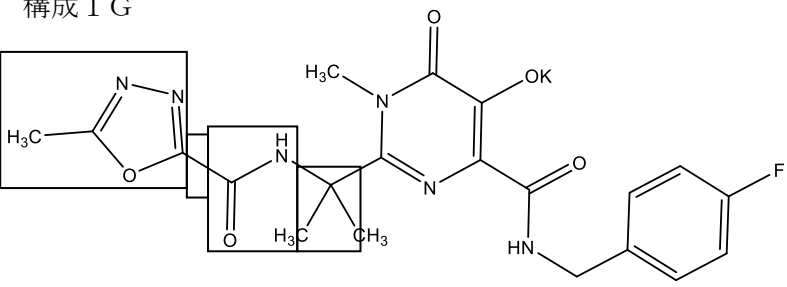
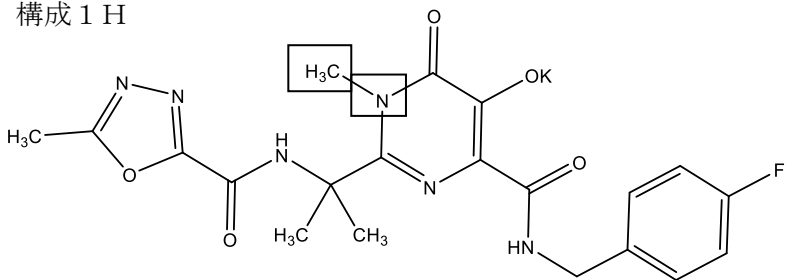
ラルテグラビルカリウム

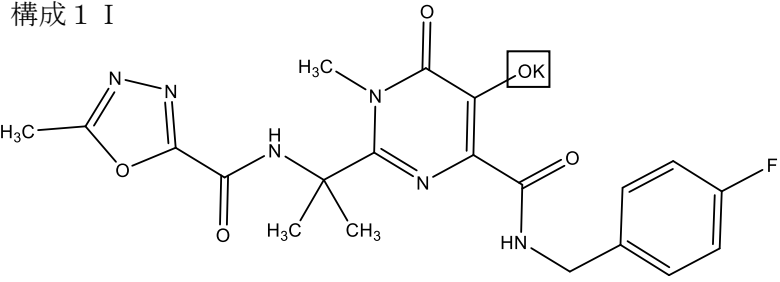
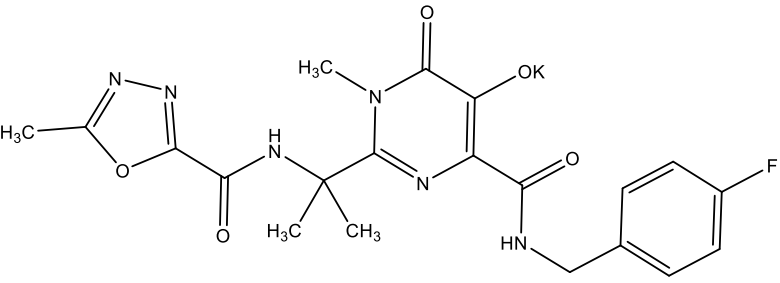
(1) 本件訂正発明 1

構成要件	請求項の記載	ラルテグラビルカリウム	備考
1 A	式 (I) : (I)	構成 1 A 	充足

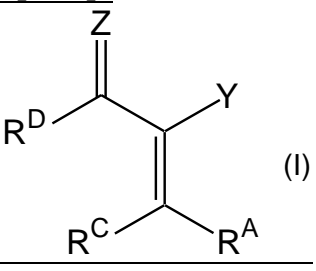
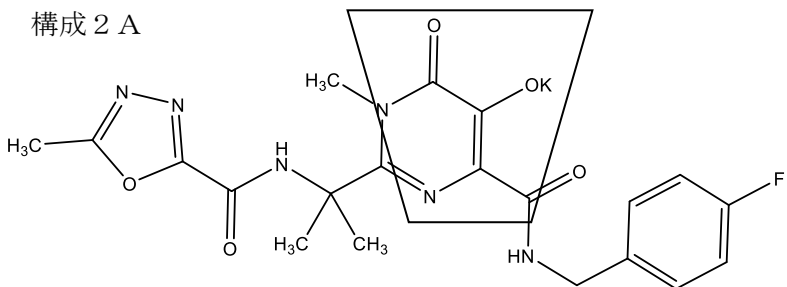
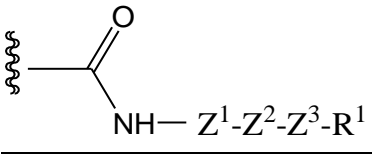
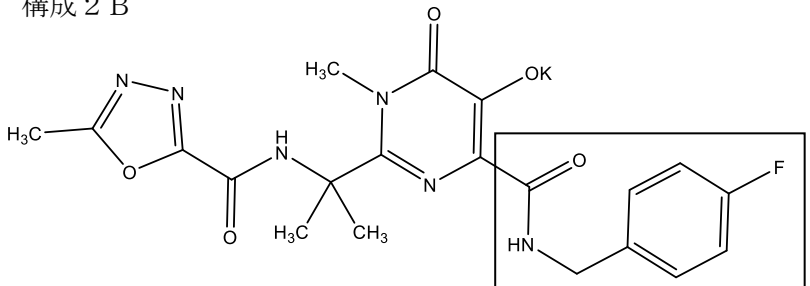
構成要件	請求項の記載	ラルテグラビルカリウム	備考
1 B	(式中、 $R^A$ は式：  $NH-Z^1-Z^2-Z^3-R^1$	構成 1 B 	充足
1 C	(式中、式： <u><math>-Z^1-Z^2-Z^3-R^1</math></u> で示される基は、4-フルオロベンジル)；	構成 1 C 	充足

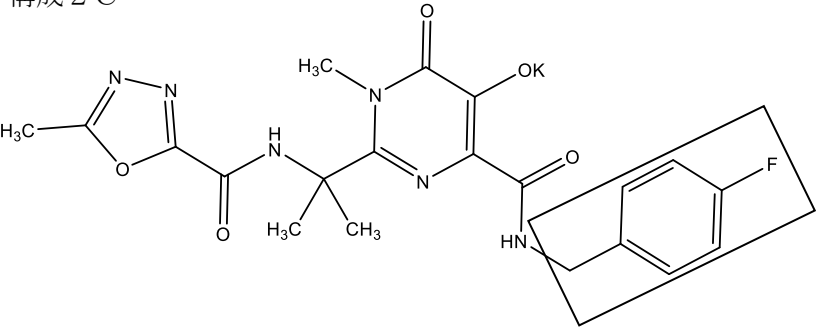
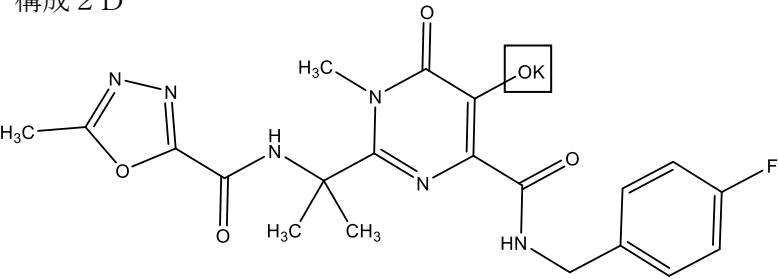
構成要件	請求項の記載	ラルテグラビルカリウム	備考
1 D	Yはヒドロキシ；	構成 1 D 	充足 （構成要件 I 「その製薬上許容される塩」も参照）
1 E	Zは酸素原子；	構成 1 E 	充足
1 F	$R^C$ 及び $R^D$ は一緒になって隣接する炭素原子と共に5員又は6員のヘテロ原子を含んでいてもよい環を形成し、該環はベンゼン環との縮合環であってもよい；	構成 1 F 	充足

構成要件	請求項の記載	ラルテグラビルカリウム	備考
1 G	<p>R<sup>C</sup> 及び R<sup>D</sup> が形成する環は、式：<u>—Z<sup>1</sup>—Z<sup>2</sup>—Z<sup>3</sup>—R<sup>1</sup></u>（式中、<u>Z<sup>1</sup> 及び Z<sup>3</sup> はそれぞれ独立して単結合又は炭素数 1～6 の直鎖状若しくは分枝状のアルキレン；Z<sup>2</sup> は単結合、—S—、—SO—、—NHSO<sub>2</sub>—、—O—又は—NHCO—；R<sup>1</sup> は置換されていてもよいフェニル、置換されていてもよい 5～8 員の芳香族複素環式基、置換されていてもよい炭素数 3～6 のシクロアルキル又は置換されていてもよいヘテロサイクル（「置換されていてもよい」の各置換基は、それぞれ独立して、アルキル、ハロアルキル、ハロゲンおよびアルコキシから選択される））で示される基で置換されていてもよく；</u></p>	<p>構成 1 G</p> 	充足
1 H	<p>さらに、R<sup>C</sup> 及び R<sup>D</sup> が形成する環は、式：<u>—Z<sup>1</sup>—Z<sup>2</sup>—Z<sup>3</sup>—R<sup>1</sup></u>（式中、Z<sup>1</sup>、Z<sup>2</sup>、Z<sup>3</sup> 及び R<sup>1</sup> は前記と同意義である）で示される基で置換されている以外の位置で、かつ、<u>=Z が結合している炭素原子の隣接位でアルキルにより置換されていてもよい。</u></p>	<p>構成 1 H</p> 	充足

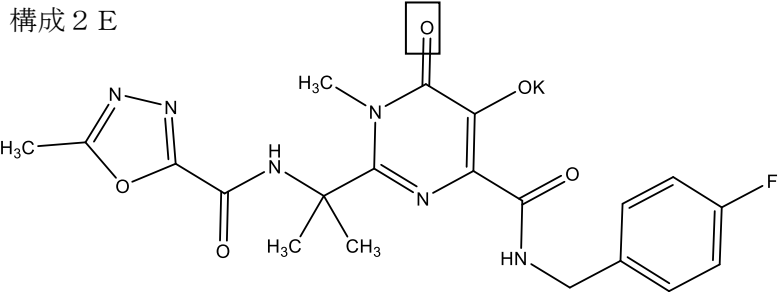
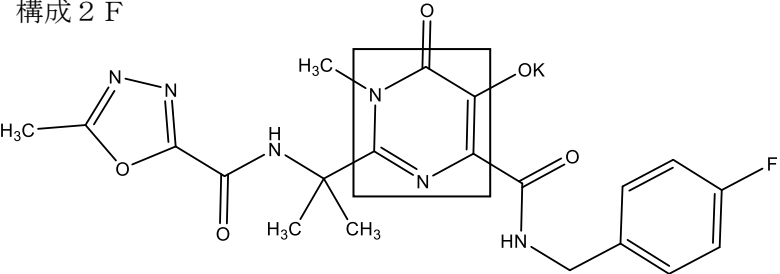
構成要件	請求項の記載	ラルテグラビルカリウム	備考
1 I	<p>で示される化合物、その製薬上許容される塩又はそれらの溶媒和物を</p>	<p>構成 1 I</p> 	<p>充足          (「本発明化合物の製薬上許容される塩としては、塩基性塩として、例えば、ナトリウム塩、カリウム塩等のアルカリ金属塩；・・・が挙げられる。」(甲2第68頁第1~10行)参照)</p>
1 J	<p>有効成分として含有する、インテグラーゼ阻害剤である医薬組成物。</p>	<p>構成 1 J          構成 A ~ I までで説明した有効成分であるラルテグラビルカリウム(以下の構造式)を含有するインテグラーゼ阻害剤である医薬組成物</p> 	<p>充足          (甲3【組成・性状】及び【薬効薬理】「1.作用機序」参照)</p>

(2) 本件訂正発明2

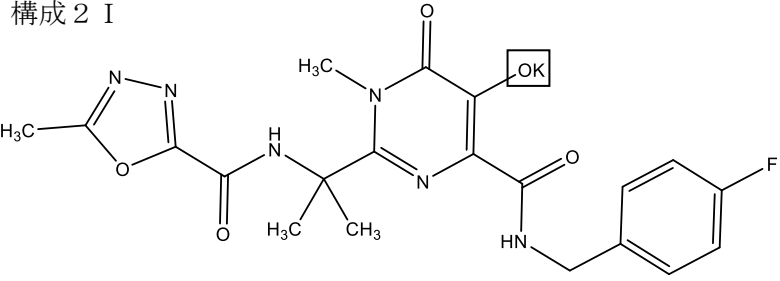
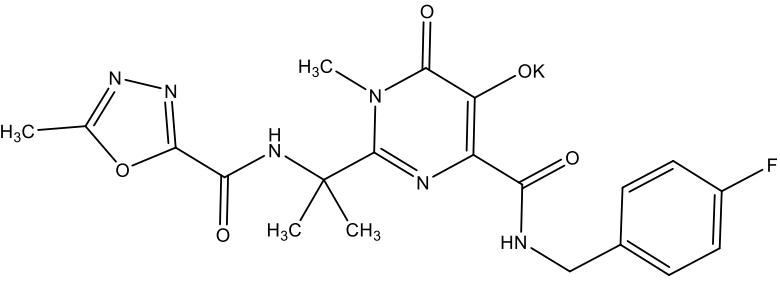
構成要件	請求項の記載	ラルテグラビルカリウム	備考
2 A	<p>式 (I) :</p> <p><u>【化1】</u></p>  <p>(I)</p>	<p>構成 2 A</p> 	充足
2 B	<p>(式中、 R<sup>A</sup> は式 :</p> <p><u>【化3】</u></p> 	<p>構成 2 B</p> 	充足

構成要件	請求項の記載	ラルテグラビルカリウム	備考
2 C	(式中、式： $-Z^1-Z^2-Z^3-R^1$ で示される基は、4-フルオロベンジル)；	構成 2 C 	充足
2 D	<u>Yはヒドロキシ；</u>	構成 2 D 	充足 (構成要件 I 「その製薬上許容される塩」も参照)

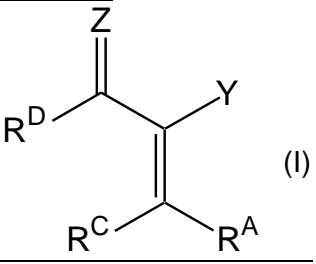
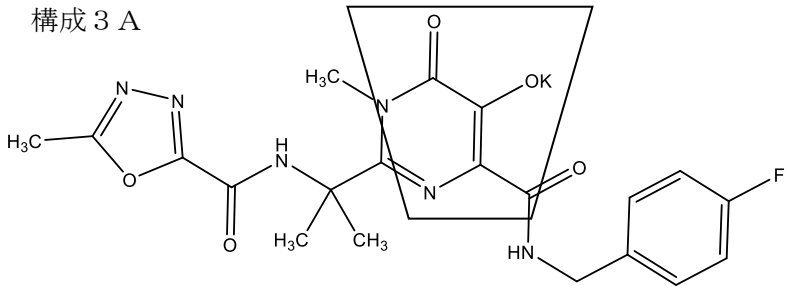
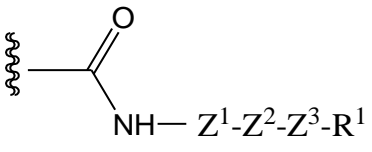
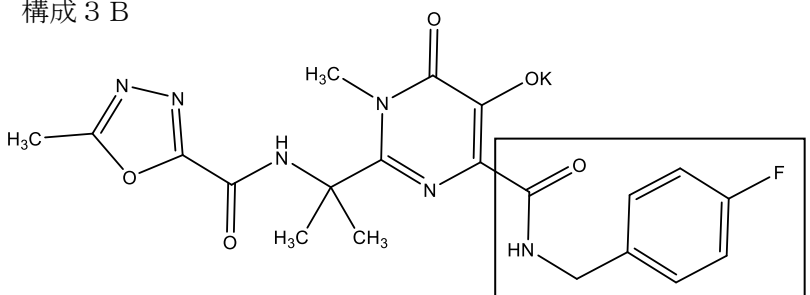


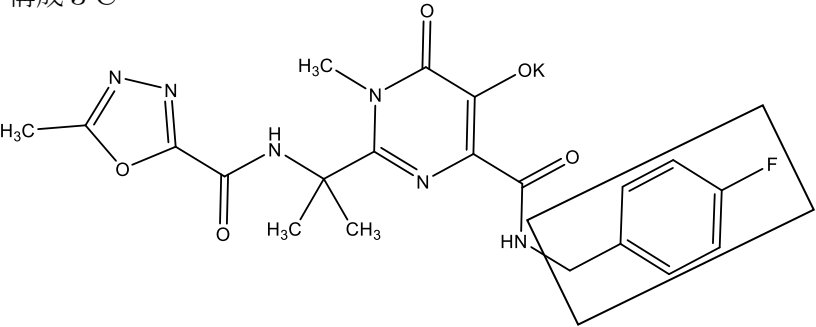
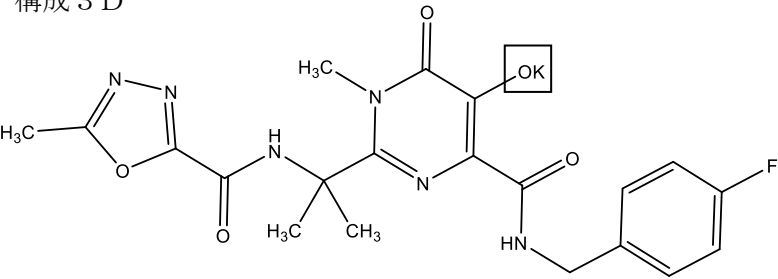
構成要件	請求項の記載	ラルテグラビルカリウム	備考
2 E	Zは酸素原子；	構成 2 E 	充足
2 F	R <sup>C</sup> 及び R <sup>D</sup> は一緒になって隣接する炭素原子と共に5員又は6員のN原子を含む環を形成し；	構成 2 F 	充足

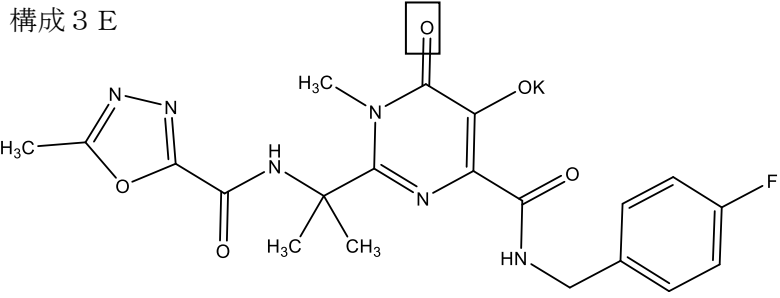
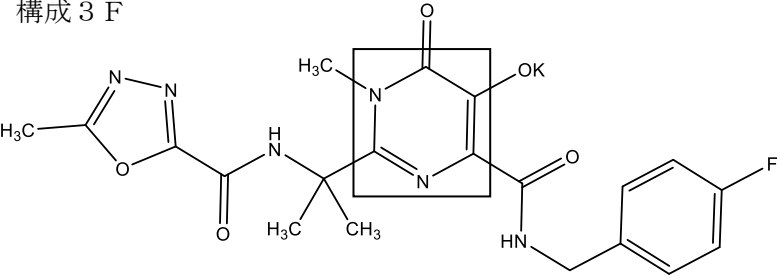
構成要件	請求項の記載	ラルテグラビルカリウム	備考
2 G	<p><u>R<sup>C</sup> 及び R<sup>D</sup> が形成する環は、式： -Z<sup>1</sup> - Z<sup>2</sup> - Z<sup>3</sup> - R<sup>1</sup> (式中、Z<sup>1</sup> 及び Z<sup>3</sup> はそれぞれ独立して単結合又は炭素数 1~6 の直鎖状若しくは分枝状のアルキレン；Z<sup>2</sup> は単結合、-S-、-SO-、-NHSO<sub>2</sub>-、-O-又は-NHCO-；R<sup>1</sup> は置換されていてもよいフェニル、置換されていてもよい 5~8 員の芳香族複素環式基、置換されていてもよい炭素数 3~6 のシクロアルキル又は置換されていてもよいヘテロサイクル (「置換されていてもよい」の各置換基は、それぞれ独立して、アルキル、ハロアルキル、ハロゲンおよびアルコキシから選択される) ) で示される基で置換されていてもよく；</u></p>	<p>構成 2 G</p>	充足
2 H	<p><u>さらに、R<sup>C</sup> 及び R<sup>D</sup> が形成する環は、式： -Z<sup>1</sup> - Z<sup>2</sup> - Z<sup>3</sup> - R<sup>1</sup> (式中、Z<sup>1</sup>、Z<sup>2</sup>、Z<sup>3</sup> 及び R<sup>1</sup> は前記と同意義である) で示される基で置換されている以外の位置で、アルキルにより置換されていてもよい。)</u></p>	<p>構成 2 H</p>	充足

構成要件	請求項の記載	ラルテグラビルカリウム	備考
2 I	<p>で示される化合物、その製薬上許容される塩又はそれらの溶媒和物を</p>	<p>構成 2 I</p> 	<p>充足          (「本発明化合物の製薬上許容される塩としては、塩基性塩として、例えば、ナトリウム塩、カリウム塩等のアルカリ金属塩；・・・が挙げられる。」(甲2第68頁第1~10行)参照)</p>
2 J	<p>有効成分として含有する、インテグラーゼ阻害剤である医薬組成物。</p>	<p>構成 2 J          構成 2 A ~ 2 I までで説明した有効成分であるラルテグラビルカリウム(以下の構造式)を含有するインテグラーゼ阻害剤である医薬組成物</p> 	<p>充足          (甲3【組成・性状】及び【薬効薬理】「1.作用機序」参照)</p>

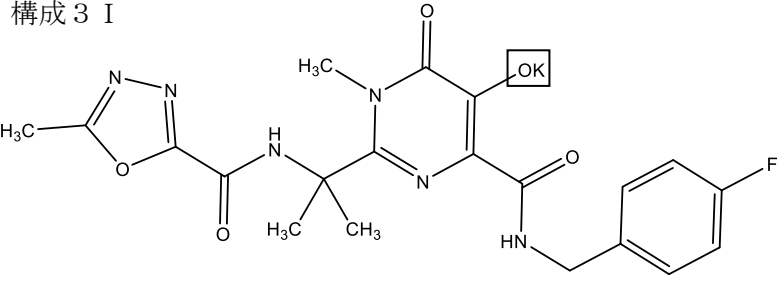
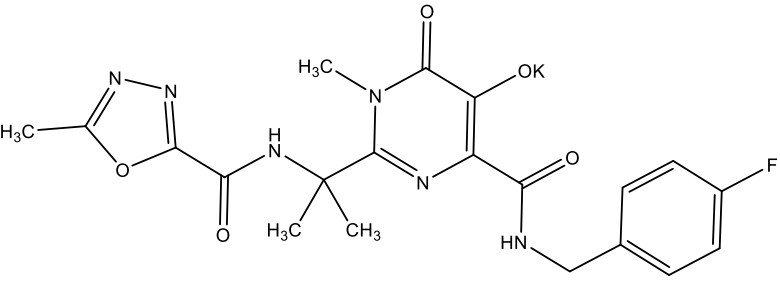
(3) 本件訂正発明3

構成要件	請求項の記載	ラルテグラビルカリウム	備考
<p>3 A</p>	<p>式 (I) : 【化1】</p>  <p>(I)</p>	<p>構成 3 A</p> 	<p>充足</p>
<p>3 B</p>	<p>(式中、 R<sup>A</sup> は式 : 【化3】</p> 	<p>構成 3 B</p> 	<p>充足</p>

構成要件	請求項の記載	ラルテグラビルカリウム	備考
3 C	(式中、式： $-Z^1-Z^2-Z^3-R^1$ で示される基は、4-フルオロベンジル)；	構成 3 C 	充足
3 D	<u>Yはヒドロキシ；</u>	構成 3 D 	充足 (構成要件 I 「その製薬上許容される塩」も参照)

構成要件	請求項の記載	ラルテグラビルカリウム	備考
3 E	<u>Zは酸素原子；</u>	構成 3 E 	充足
3 F	<u>R<sup>C</sup> 及び R<sup>D</sup> は一緒になって隣接する炭素原子と共に6員のヘテロ原子を含む環を形成し；</u>	構成 3 F 	充足

構成要件	請求項の記載	ラルテグラビルカリウム	備考
3 G	<p><math>R^C</math> 及び <math>R^D</math> が形成する環は、式：<math>-Z^1 - Z^2 - Z^3 - R^1</math> (式中、<math>Z^1</math> 及び <math>Z^3</math> はそれぞれ独立して単結合又は炭素数 1~6 の直鎖状若しくは分枝状のアルキレン；<math>Z^2</math> は単結合、<math>-S-</math>、<math>-SO-</math>、<math>-NHSO_2-</math>、<math>-O-</math> 又は <math>-NHCO-</math>；<math>R^1</math> は置換されていてもよいフェニル、置換されていてもよい 5~8 員の芳香族複素環式基、又は置換されていてもよい炭素数 3~6 のシクロアルキル (「置換されていてもよい」の各置換基は、それぞれ独立して、アルキル、ハロアルキル、ハロゲンおよびアルコキシから選択される)；ただし、<math>Z^1</math>、<math>Z^2</math> 及び <math>Z^3</math> は同時に単結合ではない) で示される基で、<math>=Z</math> が結合している炭素原子を 1 位とした場合の 3 位で置換されていてもよく；</p>	<p>構成 3 G</p>	充足
3 H	<p>さらに、<math>R^C</math> 及び <math>R^D</math> が形成する環は、式：<math>-Z^1 - Z^2 - Z^3 - R^1</math> (式中、<math>Z^1</math>、<math>Z^2</math>、<math>Z^3</math> 及び <math>R^1</math> は前記と同意義である) で示される基で置換されている以外の位置で、かつ、<math>=Z</math> が結合している炭素原子の隣接位でアルキルにより置換されていてもよい。)</p>	<p>構成 3 H</p>	充足

構成要件	請求項の記載	ラルテグラビルカリウム	備考
3 I	<p>で示される化合物（ただし、N-(4-フルオロベンジル)-5-ヒドロキシ-1-メチル-6-オキソ-1,6-ジヒドロピリミジン-4-カルボキサミドを除く）、その製薬上許容される塩又はそれらの溶媒和物を</p>	<p>構成 3 I</p> 	<p>充足  （「本発明化合物の製薬上許容される塩としては、塩基性塩として、例えば、ナトリウム塩、カリウム塩等のアルカリ金属塩；・・・が挙げられる。」（甲2第68頁第1~10行）参照）</p>
3 J	<p>有効成分として含有する、インテグラーゼ阻害剤である医薬組成物。</p>	<p>構成 3 J  構成 3 A ~ 3 I までで説明した有効成分であるラルテグラビルカリウム（以下の構造式）を含有するインテグラーゼ阻害剤である医薬組成物</p> 	<p>充足  （甲3【組成・性状】及び【薬効薬理】「1.作用機序」参照）</p>