

平成30年1月15日判決言渡

平成28年（行ケ）第10278号 特許取消決定取消請求事件

口頭弁論終結日 平成29年11月28日

判 決

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

被 告 特 許 庁 長 官  
同 指 定 代 理 人 中 田 と し 子  
木 村 敏 康  
真 鍋 伸 行  
守 安 智  
藤 原 浩 子

主 文

- 1 特許庁が異議2015-700094号事件について平成28年11月18日にした決定のうち、特許第5702494号の請求項2，4，6及び9に係る部分を取り消す。
- 2 原告のその余の請求を棄却する。
- 3 訴訟費用は、これを3分し、その1を被告の負担とし、その余は原告の負担とする。

事実及び理由

第1 請求

特許庁が異議2015-700094号事件について平成28年11月18日にした決定のうち、特許第5702494号の請求項1ないし7，9ないし13に係る部分を取り消す。

## 第2 事案の概要

### 1 特許庁における手続の経緯等

(1) 原告は、平成26年7月30日、発明の名称を「ピタバスタチンカルシウムの新規な結晶質形態」とする特許出願（特願2014-155001号）をした（以下「本件出願」といい、本件出願当初の明細書，特許請求の範囲及び図面（甲2）を「本件出願当初明細書等」という。甲2）。

本件出願は、平成16年2月2日（優先権主張：平成15年2月12日，欧州特許庁）にした特許出願（特願2006-501997号）の一部についてした特許出願（特願2011-127696号）の一部についてした特許出願（特願2013-264348号）の一部についてした特許出願である（以下，順に「第1出願」「第2出願」「第3出願」といい，第3出願当初の明細書，特許請求の範囲及び図面（甲48）を「第3出願当初明細書等」という。甲6，48）。

(2) 原告は、平成26年12月26日，本件出願の願書に添付した明細書及び特許請求の範囲について補正した（以下「本件補正」という。甲5）。

(3) 原告は，本件出願について特許をすべき旨の査定を受け，平成27年2月27日，設定の登録（特許第5702494号）を受け，同年4月15日，特許掲載公報が発行された（請求項の数13。以下，この特許を「本件特許」という。甲1。）。

(4) 本件特許について，平成27年10月15日，特許異議の申立てがされ，特許庁は，これを異議2015-700094号事件として審理した。

(5) 原告は，平成28年10月25日，本件特許の明細書及び特許請求の範囲について訂正を請求した（以下「本件訂正」という。甲40）。

(6) 特許庁は，平成28年11月18日，本件訂正を認めるとともに，請求項1ないし7，9ないし13に係る本件特許を取り消し，請求項8に係る本件特許を維

持するとの別紙異議の決定書（写し）記載の決定（以下「本件決定」という。）をし、その謄本は、同月29日、原告に送達された。

(7) 原告は、平成28年12月28日、本件決定のうち本件特許の請求項1ないし7、9ないし13に係る部分の取消しを求める本件訴訟を提起した。

## 2 特許請求の範囲の記載

(1) 本件補正で補正され、さらに本件訂正によって訂正された特許請求の範囲の記載は、次のとおりである（「/」は、原文の改行部分を示す（以下同じ。）。甲1、5、40）。以下、本件訂正後の請求項1ないし13に係る発明を「本件発明1」などといい、本件発明1ないし7及び9ないし13を併せて「本件各発明」という。また、本件訂正後の明細書（甲40）を、図面（甲1）を含めて「本件明細書」という。

【請求項1】 $2\theta$ で表して、 $5.0 \pm 0.2^\circ$ 、 $6.8 \pm 0.2^\circ$ 、 $9.1 \pm 0.2^\circ$ 、 $13.7 \pm 0.2^\circ$ 、 $20.8 \pm 0.2^\circ$ 、 $24.2 \pm 0.2^\circ$ に特徴的なピークを有し、 $20.2 \pm 0.2^\circ$ に特徴的なピークを有しない、特徴的なX線粉末回折図形を示し、FT-IR分光法と結合した熱重量法により測定した含水量が9～15%である（但し、 $10.5 \sim 10.7\%$ （w/w）の水を含むものを除く）、  
(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(E)-ヘプテン酸ヘミカルシウム塩の結晶多形A。/但し、 $2\theta$ で表して、 $5.0 \pm 0.2^\circ$  (s)、 $6.8 \pm 0.2^\circ$  (s)、 $9.1 \pm 0.2^\circ$  (s)、 $10.0 \pm 0.2^\circ$  (w)、 $10.5 \pm 0.2^\circ$  (m)、 $11.0 \pm 0.2^\circ$  (m)、 $13.3 \pm 0.2^\circ$  (vw)、 $13.7 \pm 0.2^\circ$  (s)、 $14.0 \pm 0.2^\circ$  (w)、 $14.7 \pm 0.2^\circ$  (w)、 $15.9 \pm 0.2^\circ$  (vw)、 $16.9 \pm 0.2^\circ$  (w)、 $17.1 \pm 0.2^\circ$  (vw)、 $18.4 \pm 0.2^\circ$  (m)、 $19.1 \pm 0.2^\circ$  (w)、 $20.8 \pm 0.2^\circ$  (vs)、 $21.1 \pm 0.2^\circ$  (m)、 $21.6 \pm 0.2^\circ$  (m)、 $22.9 \pm 0.2^\circ$  (m)、 $23.7 \pm 0.2^\circ$  (m)、 $24.2 \pm 0.2^\circ$  (s)、 $25.2 \pm 0.2^\circ$  (m)。

2° (w), 27.1 ± 0.2° (m), 29.6 ± 0.2° (vw), 30.2 ± 0.2° (w), 34.0 ± 0.2° (w) [ここで, (vs) は, 非常に強い強度を意味し, (s) は, 強い強度を意味し, (m) は, 中間の強度を意味し, (w) は, 弱い強度を意味し, (vw) は, 非常に弱い強度を意味する] に特徴的なピークを有する特徴的なX線粉末回折図形を示し, FT-IR分光法と結合した熱重量法により測定した含水量が3~15%であるものを除く。

【請求項2】 2θで表して, 5.0 ± 0.2° (s), 6.8 ± 0.2° (s), 9.1 ± 0.2° (s), 13.7 ± 0.2° (s), 20.8 ± 0.2° (vs), 24.2 ± 0.2° (s) [ここで, (vs) は非常に強い強度を意味し, (s) は強い強度を意味する] に特徴的なピークを有する特徴的なX線粉末回折図形を示す, 請求項1に記載の結晶多形A。

【請求項3】 2θで表して, さらに, 10.5 ± 0.2°, 11.0 ± 0.2°, 18.4 ± 0.2°, 21.1 ± 0.2°, 21.6 ± 0.2°, 22.9 ± 0.2°, 23.7 ± 0.2°, 27.1 ± 0.2° に特徴的なピークを有する特徴的なX線粉末回折図形を示す, 請求項1に記載の結晶多形A。

【請求項4】 2θで表して, さらに, 10.5 ± 0.2° (m), 11.0 ± 0.2° (m), 18.4 ± 0.2° (m), 21.1 ± 0.2° (m), 21.6 ± 0.2° (m), 22.9 ± 0.2° (m), 23.7 ± 0.2° (m), 27.1 ± 0.2° (m) に特徴的なピークを有する特徴的なX線粉末回折図形を示す, 請求項2に記載の結晶多形A。

【請求項5】 2θで表して, さらに, 10.0 ± 0.2°, 14.0 ± 0.2°, 14.7 ± 0.2°, 16.9 ± 0.2°, 19.1 ± 0.2°, 25.2 ± 0.2°, 30.2 ± 0.2°, 34.0 ± 0.2° に特徴的なピークを有する特徴的なX線粉末回折図形を示す, 請求項3に記載の結晶多形A。

【請求項6】 2θで表して, さらに, 10.0 ± 0.2° (w), 14.0 ± 0.2° (w), 14.7 ± 0.2° (w), 16.9 ± 0.2° (w), 19.1 ±

0. 2° (w), 25. 2 ± 0. 2° (w), 30. 2 ± 0. 2° (w), 34. 0 ± 0. 2° (w) に特徴的なピークを有する特徴的なX線粉末回折図形を示す, 請求項4に記載の結晶多形A。

【請求項7】2θで表して, さらに, 13. 3 ± 0. 2°, 15. 9 ± 0. 2°, 17. 1 ± 0. 2°, 29. 6 ± 0. 2° に特徴的なピークを有する特徴的なX線粉末回折図形を示す, 請求項5に記載の結晶多形A。

【請求項9】示差走査熱量測定により測定した融点が95°Cである, 請求項1乃至8のいずれか1項に記載の結晶多形A。

【請求項10】(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(E)-ヘプテン酸ヘミカルシウム塩の総量を基準にして, 75~100重量%の請求項1乃至9のいずれか1項に記載の結晶多形Aを含む前記ヘミカルシウム塩。

【請求項11】(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(E)-ヘプテン酸ヘミカルシウム塩の総量を基準にして, 95~100重量%の請求項1乃至9のいずれか1項に記載の結晶多形Aを含む前記ヘミカルシウム塩。

【請求項12】請求項1乃至11のいずれか1項に記載の結晶多形Aの有効量と, 薬学的に許容され得る担体とを含む医薬組成物。

【請求項13】請求項1乃至11のいずれか1項に記載の結晶多形Aの有効量と, 薬学的に許容され得る担体とを用いた医薬組成物。

(2) 特許請求の範囲【請求項1】及び本件明細書の記載の略称

ア 本件訂正後の特許請求の範囲【請求項1】記載の発明特定事項を, 次のとおり分説し, それぞれの記号に従い「構成要件A」などということがある。

A 2θで表して, 5. 0 ± 0. 2°, 6. 8 ± 0. 2°, 9. 1 ± 0. 2°, 13. 7 ± 0. 2°, 20. 8 ± 0. 2°, 24. 2 ± 0. 2° に特徴的なピークを有し, 20. 2 ± 0. 2° に特徴的なピークを有しない, 特徴的なX線粉末回折

図形を示し、

B FT-IR分光法と結合した熱重量法により測定した含水量が9～15%である(但し、10.5～10.7% (w/w)の水を含むものを除く)、

C (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(E)-ヘプテン酸ヘミカルシウム塩の

D 結晶多形A。

E 但し、 $2\theta$ で表して、 $5.0 \pm 0.2^\circ$  (s),  $6.8 \pm 0.2^\circ$  (s),  $9.1 \pm 0.2^\circ$  (s),  $10.0 \pm 0.2^\circ$  (w),  $10.5 \pm 0.2^\circ$  (m),  $11.0 \pm 0.2^\circ$  (m),  $13.3 \pm 0.2^\circ$  (vw),  $13.7 \pm 0.2^\circ$  (s),  $14.0 \pm 0.2^\circ$  (w),  $14.7 \pm 0.2^\circ$  (w),  $15.9 \pm 0.2^\circ$  (vw),  $16.9 \pm 0.2^\circ$  (w),  $17.1 \pm 0.2^\circ$  (vw),  $18.4 \pm 0.2^\circ$  (m),  $19.1 \pm 0.2^\circ$  (w),  $20.8 \pm 0.2^\circ$  (vs),  $21.1 \pm 0.2^\circ$  (m),  $21.6 \pm 0.2^\circ$  (m),  $22.9 \pm 0.2^\circ$  (m),  $23.7 \pm 0.2^\circ$  (m),  $24.2 \pm 0.2^\circ$  (s),  $25.2 \pm 0.2^\circ$  (w),  $27.1 \pm 0.2^\circ$  (m),  $29.6 \pm 0.2^\circ$  (vw),  $30.2 \pm 0.2^\circ$  (w),  $34.0 \pm 0.2^\circ$  (w) [ここで、(vs)は、非常に強い強度を意味し、(s)は、強い強度を意味し、(m)は、中間の強度を意味し、(w)は、弱い強度を意味し、(vw)は、非常に弱い強度を意味する]に特徴的なピークを有する特徴的なX線粉末回折図形を示し、FT-IR分光法と結合した熱重量法により測定した含水量が3～15%であるものを除く。

イ 構成要件Cで特定されるカルシウム塩を、「ピタバスタチンカルシウム」ということがある。

ウ 構成要件Eに係る特許請求の範囲の記載のうち、「 $2\theta$ で表して…に特徴的なピークを有する特徴的なX線粉末回折図形」を、「26個偏差内相対強度図形」ということがある。また、 $2\theta$ で表して、本件明細書【表1】に記載された角度に

において、同記載のとおり相対強度でピークを有する特徴的なX線粉末回析図形を、「26個無偏差相対強度図形」ということがある。

### 3 本件決定の理由の要旨

(1) 本件決定の理由は、別紙異議の決定書（写し）のとおりである。要するに、①本件各発明に係る特許は、特許法17条の2第3項に規定する要件（新規事項の追加の禁止）を満たしていない本件補正をした本件出願に対してされたものであり、同法113条1号に該当する、②本件各発明に係る特許は、同法36条6項1号の規定（サポート要件）を満たしておらず、同法113条4号に該当する、③本件各発明に係る特許は、同法36条4項1号に規定する要件（実施可能要件）を満たしておらず、同法113条4号に該当する、④本件出願は、第3出願の一部を新たに特許出願とするものではないから、もとの特許出願の時にしたものとはみなされず、その出願日は平成26年7月30日となるところ、本件発明1、10及び11は、下記アの引用例1に記載された発明（以下「引用発明1」という。）であり、本件発明12及び13は、引用例1に記載された医薬組成物の発明（以下「引用発明1'」という。）であるから、本件発明1及び10ないし13に係る特許は、同法29条1項3号の規定に違反してされたものであり、同法113条2号に該当する、⑤i) 本件出願の出願日は平成26年7月30日となるところ、本件発明1、3、5、7、10及び11は、下記イの引用例2に記載された発明（以下「引用発明2」という。）及び技術常識に基づいて、本件発明12及び13は、引用例2に記載された薬剤の発明（以下「引用発明2'」という。）及び技術常識に基づいて、それぞれ当業者が容易に発明をすることができたものである、ii) なお、仮に本件出願が、もとの特許出願の時にしたものとはみなされたとしても、本件発明1、3、5、7及び10ないし13は、下記ウの引用例3に記載された発明（以下「引用発明3」という。）及び技術常識に基づいて、当業者が容易に発明をすることができたものであるから、本件発明1、3、5、7及び10ないし13に係る特許は、同法29条2項の規定に違反してされたものであり、同法113条2号に該当する、などというものであ

る。

ア 引用例 1 : 特表 2007-516952 号公報 (甲 26)

イ 引用例 2 : 特表 2005-520814 号公報 (甲 11)

ウ 引用例 3 : 特開平 5-148237 号公報 (甲 27)

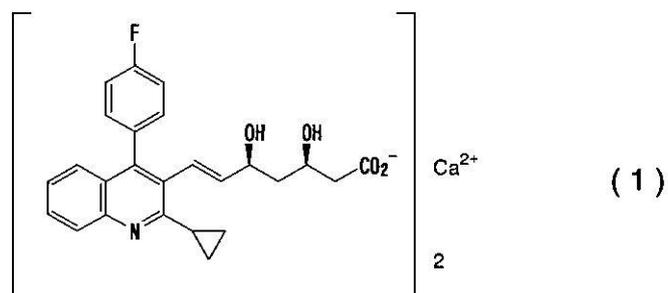
(2) 本件各発明と各引用発明との対比

本件決定は、各引用発明並びに本件各発明と各引用発明との一致点及び相違点(実質的相違点ではないと判断されたものを含む。)を以下のとおり認定した。

ア 引用例 1

(ア) 引用発明 1

式



(1)

で表される化合物 (ピタバスタチンカルシウム塩) であって、CuK $\alpha$ 放射線を使用して測定する X 線粉末回折において、以下の粉末 X 線回折パターンによって特徴付けられ、水分値 10% である結晶

回折角 (2 $\theta$ ) ( $^{\circ}$ )	相対強度 (>25%)
4.96	35.9
6.72	55.1
9.08	33.3

10.40	34.8
10.88	27.3
13.20	27.8
13.60	48.8
13.96	60.0
18.32	56.7
20.68	100.0
21.52	57.4
23.64	41.3
24.12	45.0
27.00	28.5
30.16	30.6

---

(イ) 引用発明1'

引用発明1と医薬的に許容し得る担体を含有する医薬組成物

(ウ) 本件発明1と引用発明1との一致点

「 $2\theta$ で表して、 $5.0 \pm 0.2^\circ$ 、 $6.8 \pm 0.2^\circ$ 、 $9.1 \pm 0.2^\circ$ 、 $13.7 \pm 0.2^\circ$ 、 $20.8 \pm 0.2^\circ$ 、 $24.2 \pm 0.2^\circ$ に特徴的なピークを有し、 $20.2 \pm 0.2^\circ$ に特徴的なピークを有しない、特徴的なX線粉末回折図形を示す「(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(E)-ヘプテン酸ヘミカルシウム塩の結晶多形A]であって、 $2\theta$ で表して、 $5.0 \pm 0.2^\circ$  (s)、 $6.8 \pm 0.2^\circ$  (s)、 $9.1 \pm 0.2^\circ$  (s)、 $10.0 \pm 0.2^\circ$  (w)、 $10.5 \pm 0.2^\circ$  (m)、 $11.0 \pm 0.2^\circ$  (m)、 $13.3 \pm 0.2^\circ$  (vw)、 $13.7 \pm 0.2^\circ$  (s)、 $14.0 \pm 0.2^\circ$  (w)、 $14.7 \pm 0.2^\circ$  (w)、 $15.9 \pm 0.2^\circ$  (vw)、 $16.9 \pm 0.2^\circ$  (w)、 $17.1 \pm 0.$

2° (vw), 18.4 ± 0.2° (m), 19.1 ± 0.2° (w), 20.8 ± 0.2° (vs), 21.1 ± 0.2° (m), 21.6 ± 0.2° (m), 22.9 ± 0.2° (m), 23.7 ± 0.2° (m), 24.2 ± 0.2° (s), 25.2 ± 0.2° (w), 27.1 ± 0.2° (m), 29.6 ± 0.2° (vw), 30.2 ± 0.2° (w), 34.0 ± 0.2° (w) [ここで, (vs) は, 非常に強い強度を意味し, (s) は, 強い強度を意味し, (m) は, 中間の強度を意味し, (w) は, 弱い強度を意味し, (vw) は, 非常に弱い強度を意味する] に特徴的なピークを有する特徴的なX線粉末回折図形を示し, FT-IR分光法と結合した熱重量法により測定した含水量が3~15%であるもの」である点

(エ) 本件発明1と引用発明1との相違点

本件発明1が「FT-IR分光法と結合した熱重量法により測定した含水量が9~15%である(但し, 10.5~10.7% (w/w)の水を含むものを除く)」のに対して, 引用発明1が「10%の水分値」のものである点

イ 引用例2

(ア) 引用発明2

(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(塩化カルシウム水溶液)を, 前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,

(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10.6% (w/w)の水を含む白色結晶性粉末

(イ) 引用発明2'

引用発明2を有効成分として含む薬剤

(ウ) 本件発明1と引用発明2との一致点

「(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 (E) -ヘプタン酸ヘミカルシウム塩」である点

(エ) 本件発明1と引用発明2との相違点

a 本件発明1は、「 $2\theta$ で表して、 $5.0 \pm 0.2^\circ$ 、 $6.8 \pm 0.2^\circ$ 、 $9.1 \pm 0.2^\circ$ 、 $13.7 \pm 0.2^\circ$ 、 $20.8 \pm 0.2^\circ$ 、 $24.2 \pm 0.2^\circ$ に特徴的なピークを有し、 $20.2 \pm 0.2^\circ$ に特徴的なピークを有しない、特徴的なX線粉末回折図形を示す「結晶多形A」であって、 $\diagup$ 「但し、 $2\theta$ で表して、 $5.0 \pm 0.2^\circ$  (s)、 $6.8 \pm 0.2^\circ$  (s)、 $9.1 \pm 0.2^\circ$  (s)、 $10.0 \pm 0.2^\circ$  (w)、 $10.5 \pm 0.2^\circ$  (m)、 $11.0 \pm 0.2^\circ$  (m)、 $13.3 \pm 0.2^\circ$  (vw)、 $13.7 \pm 0.2^\circ$  (s)、 $14.0 \pm 0.2^\circ$  (w)、 $14.7 \pm 0.2^\circ$  (w)、 $15.9 \pm 0.2^\circ$  (vw)、 $16.9 \pm 0.2^\circ$  (w)、 $17.1 \pm 0.2^\circ$  (vw)、 $18.4 \pm 0.2^\circ$  (m)、 $19.1 \pm 0.2^\circ$  (w)、 $20.8 \pm 0.2^\circ$  (vs)、 $21.1 \pm 0.2^\circ$  (m)、 $21.6 \pm 0.2^\circ$  (m)、 $22.9 \pm 0.2^\circ$  (m)、 $23.7 \pm 0.2^\circ$  (m)、 $24.2 \pm 0.2^\circ$  (s)、 $25.2 \pm 0.2^\circ$  (w)、 $27.1 \pm 0.2^\circ$  (m)、 $29.6 \pm 0.2^\circ$  (vw)、 $30.2 \pm 0.2^\circ$  (w)、 $34.0 \pm 0.2^\circ$  (w) [ここで、(vs)は、非常に強い強度を意味し、(s)は、強い強度を意味し、(m)は、中間の強度を意味し、(w)は、弱い強度を意味し、(vw)は、非常に弱い強度を意味する]に特徴的なピークを有する特徴的なX線粉末回折図形を示し、FT-IR分光法と結合した熱重量法により測定した含水量が3~15%であるものを除く。」ものであるのに対して、 $\diagup$ 引用発明2は、X線粉末回折図形において、どのような回折角( $2\theta$ )にピークを有するものであるかが明確でない「結晶性粉末」である点(以下「相違点2a」という。)

b 本件発明1が「FT-IR分光法と結合した熱重量法により測定した含水量

が9～15%である（但し、10.5～10.7%（w/w）の水を含むものを除く）」のに対して、引用発明2が「10.6%（w/w）の水を含む」ものである点（以下「相違点2b」という。）

（オ） 本件発明3，5，7と引用発明2との相違点

相違点2a，2bのほか，それぞれの請求項で限定された発明特定事項の点において相違する。

（カ） 本件発明10と引用発明2との相違点

相違点2a，2bのほか，本件発明10は，「（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(E)-ヘプテン酸ヘミカルシウム塩の総量を基準にして，75～100重量%の」本件発明1～9のいずれかの「結晶多形Aを含む前記ヘミカルシウム塩」であるのに対して，引用発明2は，含まれる結晶の割合が特定されていない点（以下「相違点2c」という。）において相違する。

（キ） 本件発明12と引用発明2'との相違点

相違点2a，2bのほか，本件発明12が「薬学的に許容され得る担体を含む」ものであるのに対して，引用発明2'はその点が明確でない点（以下「相違点2d」という。）において相違する。

ウ 引用例3

（ア） 引用発明3

（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・D（+）フェネチルアミン塩化合物 [（-）I・（+）II] に，水酸化ナトリウム水溶液，水を加え，攪拌溶解させ，この溶液中に，水に無水塩化カルシウムを溶解させた塩化カルシウム水溶液を滴下し，この反応液を一晩攪拌後，生じた白色沈殿をろ過して得られた（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・1/2カルシウム塩の白色結晶

(イ) 本件発明1と引用発明3との一致点

「(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(E)-ヘプタン酸ヘミカルシウム塩」である点

(ウ) 本件発明1と引用発明3との相違点

a 本件発明1は、「 $2\theta$ で表して、 $5.0 \pm 0.2^\circ$ 、 $6.8 \pm 0.2^\circ$ 、 $9.1 \pm 0.2^\circ$ 、 $13.7 \pm 0.2^\circ$ 、 $20.8 \pm 0.2^\circ$ 、 $24.2 \pm 0.2^\circ$ に特徴的なピークを有し、 $20.2 \pm 0.2^\circ$ に特徴的なピークを有しない特徴的なX線粉末回折図形を示す」「結晶多形A」であって、／「但し、 $2\theta$ で表して、 $5.0 \pm 0.2^\circ$  (s)、 $6.8 \pm 0.2^\circ$  (s)、 $9.1 \pm 0.2^\circ$  (s)、 $10.0 \pm 0.2^\circ$  (w)、 $10.5 \pm 0.2^\circ$  (m)、 $11.0 \pm 0.2^\circ$  (m)、 $13.3 \pm 0.2^\circ$  (vw)、 $13.7 \pm 0.2^\circ$  (s)、 $14.0 \pm 0.2^\circ$  (w)、 $14.7 \pm 0.2^\circ$  (w)、 $15.9 \pm 0.2^\circ$  (vw)、 $16.9 \pm 0.2^\circ$  (w)、 $17.1 \pm 0.2^\circ$  (vw)、 $18.4 \pm 0.2^\circ$  (m)、 $19.1 \pm 0.2^\circ$  (w)、 $20.8 \pm 0.2^\circ$  (vs)、 $21.1 \pm 0.2^\circ$  (m)、 $21.6 \pm 0.2^\circ$  (m)、 $22.9 \pm 0.2^\circ$  (m)、 $23.7 \pm 0.2^\circ$  (m)、 $24.2 \pm 0.2^\circ$  (s)、 $25.2 \pm 0.2^\circ$  (w)、 $27.1 \pm 0.2^\circ$  (m)、 $29.6 \pm 0.2^\circ$  (vw)、 $30.2 \pm 0.2^\circ$  (w)、 $34.0 \pm 0.2^\circ$  (w) [ここで、(vs)は、非常に強い強度を意味し、(s)は、強い強度を意味し、(m)は、中間の強度を意味し、(w)は、弱い強度を意味し、(vw)は、非常に弱い強度を意味する]に特徴的なピークを有する特徴的なX線粉末回折図形を示し、FT-IR分光法と結合した熱重量法により測定した含水量が3～15%であるものを除く。」ものであるのに対して、／引用発明3は、X線粉末回折図形において、どのような回折角( $2\theta$ )にピークを有するものであるかが明確でない「白色結晶」である点(以下「相違点3a」という。)

b 本件発明1は、「FT-IR分光法と結合した熱重量法により測定した含水量が9～15%である（但し、10.5～10.7%（w/w）の水を含むものを除く）」のに対して、引用発明3の含水量が明確でない点（以下「相違点3b」という。）

(エ) 本件発明10と引用発明3との相違点

相違点3a, 3bのほか、本件発明10は、「(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(E)-ヘプテン酸ヘミカルシウム塩の総量を基準にして、75～100重量%の」本件発明1～9のいずれかの「結晶多形Aを含む前記ヘミカルシウム塩」であるのに対して、引用発明3は、含まれる結晶の割合が特定されていない点において相違する。

(オ) 本件発明12と引用発明3との相違点

相違点3a, 3bのほか、本件発明12が、本件発明1～11のいずれかの「結晶多形Aの有効量と、薬学的に許容され得る担体とを含む医薬組成物」であるのに対して、引用発明3は、単なる「白色結晶」である点において相違する。

#### 4 取消事由

- (1) 本件補正が新規事項の追加に当たるとした判断の誤り（取消事由1）
- (2) サポート要件の判断の誤り（取消事由2）
- (3) 実施可能要件の判断の誤り（取消事由3）
- (4) 引用発明1又は1'に基づく新規性の判断の誤り（取消事由4）
- (5) 引用発明2又は2'に基づく進歩性の判断の誤り（取消事由5）
- (6) 引用発明3に基づく進歩性の判断の誤り（取消事由6）

### 第3 当事者の主張

1 取消事由1（本件補正が新規事項の追加に当たるとした判断の誤り）

〔原告の主張〕

本件決定は、本件出願時の特許請求の範囲【請求項1】（後記第4の2(3)ア【請

求項1】参照)に、構成要件Eを追加する本件補正は、新たな技術的事項を導入するものであると判断した。

しかし、本件出願当初明細書等には、具体的な結晶多形Aとして、26個無偏差相対強度図形を示す結晶多形Aが記載されているところ、後記4〔原告の主張〕(1)イのとおり、当業者であれば、粉末X線回折法によって結晶多形Aを特定するために、この26個のピークの全てが必要になるとは理解しない。結晶多形Aを特定するためには、【表1】の中の強いピーク、具体的には構成要件Aのピークで十分であると理解する。

したがって、本件出願当初明細書等には、当業者の技術常識を前提とした場合、構成要件Aで特定される結晶多形Aが、開示されていると理解できるから、本件補正は、新たな技術的事項を導入するものではない。

よって、本件補正は、補正要件を充足する。

〔被告の主張〕

後記4〔被告の主張〕(1)イと同様に、本件出願当初明細書等に記載された結晶多形Aを、26個のピークの回折角 $2\theta$ 及びその相対強度で特定しなくても、6個のピークの回折角 $2\theta$ 等によって特定し得るということは技術常識ではない。本件出願当初明細書等に、構成要件Aで特定される結晶多形Aは、開示されていない。

また、本件決定は、本件出願当初明細書等には、「結晶多形A」として、26個のピークで特定される「結晶多形A」と、その上位概念に当たる6個のピーク及び1個のピークの不存在で特定される「結晶多形A」の双方が記載されていることは認めた上で、本件出願当初明細書等には、上位概念に含まれる結晶多形Aとして、26個のピークで特定される結晶多形A以外のものが一切記載されていないから、補正後の「結晶多形A」は、実体のない「結晶多形A」が残ることになり、結晶多形Aの技術的意義が変わると判断したものである。

したがって、本件補正は、新たな技術的事項を導入するものである。

よって、本件補正は、補正要件を充足しない。

## 2 取消事由 2 (サポート要件の判断の誤り)

### [原告の主張]

本件決定は、本件明細書には、26個無偏差相対強度図形を示すもの以外の結晶多形Aが記載されているとはいえないし、そのような結晶多形Aをどのようにして製造することができるかも記載されていないから、本件各発明の特許請求の範囲の記載は、サポート要件に適合しないと判断した。

しかし、前記1 [原告の主張]と同様に、本件明細書には、当業者の技術常識を前提とした場合、構成要件Aで特定される結晶多形Aが、記載されている。本件明細書【0009】では、26個無偏差相対強度図形を示す結晶多形Aを、「一つの具体的形態」として説明しているにすぎない。また、その製造方法は、【0047】に記載されている。

よって、本件各発明の特許請求の範囲の記載は、サポート要件に適合する。

### [被告の主張]

前記1 [被告の主張]と同様に、本件明細書に、構成要件Aで特定される結晶多形Aは、記載されていない。また、【表1】で示される26個の $2\theta$ と相対強度の要件を満たしていない結晶多形Aがどのようにして得られるかについては、一切記載されていない。

よって、本件各発明の特許請求の範囲の記載は、サポート要件に適合しない。

## 3 取消事由 3 (実施可能要件の判断の誤り)

### [原告の主張]

本件決定は、本件明細書には、26個無偏差相対強度図形を示すもの以外の結晶多形Aの製造方法は記載されていないから、本件各発明に係る本件明細書の発明の詳細な説明の記載は、実施可能要件に適合しないと判断した。

しかし、前記1 [原告の主張]と同様に、本件明細書には、当業者の技術常識を前提とした場合、構成要件Aで特定される結晶多形Aが記載されており、その製造方法も【0047】に記載されている。

よって、本件各発明の特許請求の範囲の記載は、実施可能要件に適合する。

〔被告の主張〕

前記1〔被告の主張〕と同様に、本件明細書には、構成要件Aで特定される結晶多形Aが記載されておらず、【表1】で示される $2\theta$ と相対強度の要件を満たさない結晶多形Aについて、【表1】に示される $2\theta$ と相対強度を満たす結晶多形Aの実施例の製造条件をどのように変更することで、別に作り分けることができるのかは、当業者といえども過度の試行錯誤を要する。

よって、本件各発明の特許請求の範囲の記載は、実施可能要件に適合しない。

#### 4 取消事由4（引用発明1又は1'に基づく新規性の判断の誤り）

〔原告の主張〕

##### (1) 引用例1の公知性（分割要件の充足の有無）

ア 本件決定は、第3出願当初明細書等には、X線粉末回析において26個偏差内相対強度図形を示す結晶多形Aしか記載されていなかったから、6個のピーク及び1個のピークの不存在で結晶多形Aを特定する本件発明1は、第3出願当初明細書等に記載された事項の範囲を拡大するものであるとして、出願日が遡及しないと判断し、引用例1が公知の刊行物であるとした。

しかし、本件発明1は、第3出願当初明細書等に記載された事項の範囲内のものである。

イ X線粉末回析法によって結晶多形Aを特定するためには、回折図形における26個のピークの、全てが必要になるものではない。当業者であれば、第3出願当初明細書等に、6個のピークを有し、1個のピークを有しないという構成要件Aにより特定される結晶多形Aが記載されていると理解できる。

なぜなら、同じ結晶多形Aでも、①測定条件や結晶の状態によって、相対強度の弱いピークは測定できないこともあり、また、②相対強度は相当に変動するため、ピーク間の相対強度の順位が入れ替わることもある。そして、【表1】の中で、比較的相対強度の強い、 $v_s$ 及び $s$ の6個のピーク（構成要件Aの6個のピーク）が

確認できれば、それは結晶多形Aであると確認できるというのが、当業者の技術常識であったからである。

このことは、ピークの数について、医薬品の基準書である第十六改正日本薬局方（甲16）において、回折パターンによって、結晶の同一性を判断する場合、必ずしもチャート上の全部のピークを比較する必要はなく、同一のピークと判断されるものが10本あれば十分であり、場合によっては、より少ないピークでも同一性が確認できることが説明されていることから裏付けられる。また、寺田勝英教授の鑑定書（甲18）においても、粉末X線回折法による結晶形の同定は、10本の強いピークが確認できれば十分であり、7本のピークでも同定は可能であるとされている。粉末X線回折法の技術的な原理に関する説明（甲15）は、結晶形を同定するために、回折パターンをどのような条件で比較すればよいかについて説明するものではない。なお、本件明細書における各結晶形は、再結晶操作により得られたものであって、単一相であるから、多数の相からなる試料が同定されているものではない。

また、ピークの相対強度についても、第十六改正日本薬局方（甲16）において、「試料と基準となる物質間の相対的強度は選択配向効果のためかなり変動することがある」旨説明されている。また、粉末X線回折法の回折図形上の各ピークの相対強度は、化合物による配向の性質・程度の相違、再結晶化・粉砕の条件の相違、測定装置の相違、晶癖の相違からも大きく影響を受けるものである。

さらに、明細書の発明の詳細な説明において、結晶多形のX線粉末回折図形における多数のピークの存在が説明されていても、請求項においては、それらのピークの一部のみによって結晶多形を定義する結晶形の特許は、多数存在する。本件決定の分割要件に関する前記判断は、従前の特許査定実務に明らかに反するものである。

ウ そして、第3出願当初明細書等に記載された結晶多形Aについての当業者の理解は前記のとおりであり、これは、第3出願当初明細書等の記載から離れて、第

3 出願当初明細書等に記載されていた結晶多形Aの意味を解釈するものではない。

エ よって、本件出願は、第3出願の一部を新たに特許出願とするものであって、分割要件を充足するから、もとの特許出願の時にしたものとみなされ、その出願日は第1出願の優先日である平成15年2月12日になる。

(2) 小括

以上によれば、引用例1は、本件出願の出願日前に頒布された刊行物ではないから、引用発明1又は1'に基づいて、本件発明1及び10ないし13の新規性を否定することはできない。

〔被告の主張〕

(1) 引用例1の公知性（分割要件の充足の有無）

ア 分割要件の充足の有無を判断するに当たり、原出願の出願当初明細書等の全ての記載を総合することにより導かれる技術的事項について、技術常識であるからといって同記載から離れて別の意味として解釈することは許容されない。

そして、第3出願当初明細書等には、26個のピークの回折角 $2\theta$ 及びその相対強度で特定された結晶多形Aが記載されている。

これに対し、本件発明1の結晶多形Aは、6個のピークの回折角 $2\theta$ 等に反映された結晶の格子定数を有する結晶構造（ただし、結晶多形Eは除かれる）であればよく、構成原子の配列（座標）はどのようなものでもよくなったのであるから、その結晶多形Aの技術的意味は異なったものとなり、その範囲が拡大したことは明らかである。

イ 以上の点を措くとしても、原告は、同じ結晶多形Aでも、①測定条件や結晶の状態によって、相対強度の弱いピークは測定できないこともあり、②相対強度は相当に変動するため、ピーク間の相対強度の順位が入れ替わることもあるから、粉末X線回折法によって結晶多形Aを特定するために、構成要件Aの6個のピーク及び1個のピークの不存在で十分である旨主張する。

しかし、粉末X線回折法で測定される結晶の回折図形上の回線角 $2\theta$ の位置及び

回折強度は、結晶構造の単位格子における原子の種類及びその配列（原子座標）によって決まるものであるから、結晶構造の同定に必要なものである（甲15）。

ピークの数（回線角 $2\theta$ の位置）について、第十六改正日本薬局方（甲16）は、データベースに収載されている「単一相試料」の回折パターンにおける10本以上の強度の大きなピークの回折角と強度を、測定試料のそれらと対比することで、結晶を同定することが十分できると説明するにとどまる。試料が多数の相からなる場合は、X線粉末回折法による結晶法の同定は困難又は不可能となることがある。

また、ピークの相対強度（回折強度）について、選択配向効果、「晶癖」の違い、測定する試料の粉碎の有無によって相対強度が変化することはある。しかし、粉末X線回折法では、これらの要因による相対強度の変動が結晶形の同定という目的に適合する許容範囲となるように試料を調製して測定することを前提としている。

なお、従前の特許査定実務をもって、当業者の技術常識を認定することはできない。

したがって、第3出願当初明細書等に記載された結晶多形Aを、26個のピークの回折角 $2\theta$ 及びその相対強度で特定しなくても、6個のピークの回折角 $2\theta$ 等によって特定し得るということは技術常識ではない。

ウ よって、本件出願は、第3出願の一部を新たに特許出願とするものではないから、その出願日は平成26年7月30日になる。

## (2) 小括

以上によれば、原告の主張は失当であり、本件決定のとおり、引用発明1又は1'に基づき、本件発明1及び10ないし13は、新規性がない。

## 5 取消事由5（引用発明2又は2'に基づく進歩性の判断の誤り）

### 〔原告の主張〕

前記4〔原告の主張〕のとおり、本件出願の出願日は、第1出願の優先日である平成15年2月12日となり、引用例2は、本件出願の出願日前に頒布された刊行物ではないから、引用発明2又は2'に基づいて、本件発明1、3、5、7及び1

0ないし13の進歩性を否定することはできない。

〔被告の主張〕

前記4〔被告の主張〕のとおり、本件出願の出願日は平成26年7月30日になるから、原告の主張は失当であり、本件決定のとおり、引用発明2又は2'及び技術常識に基づき、本件発明1、3、5、7及び10ないし13は、進歩性がない。

6 取消事由6（引用発明3に基づく進歩性の判断の誤り）

〔原告の主張〕

(1) 本件発明1の容易想到性

本件決定は、引用発明3（引用例3の実施例3の記載に基づくもの）について、引用例3の実施例3を基に追試実験（甲38）を行えば、本件発明1の結晶多形Aを得ることができるから、当業者は、引用発明3から本件発明1を容易に想到し得ると判断した。

しかし、引用例3の実施例3の開示から、上記追試実験（甲38）を行うのは、当業者にとって容易に想到可能なものではない。すなわち、結晶多形Aを得るためには、室温減圧乾燥という、最も温和な乾燥条件においてすら、なお水分量が安定せず、乾燥が進行中と考えざるを得ない水分約10%の状態の化合物について、恒量乾燥せずとその水分量で乾燥を止めた上で、その安定性を検討する必要があるが、引用発明3について、このようなことを行う動機付けは存しない。引用発明3は、単に白色の粉末状の物質（恒量になるまで乾燥させたアモルファス）である。

そして、より安定な結晶多形を探索する動機付けを開示する各文献は存するものの、これらは、結晶多形Aのように水分量が容易に減少してアモルファス化するような不安定な結晶多形を、探索の対象とするものではない。

このように、上記追試実験が適用した実験条件（特に乾燥条件）は、結晶多形Aの性質（水分量は10%程度だが、容易に乾燥して水分量が4%以下になるとアモルファス化する）を知らずに容易に設定し得たものではない。

なお、上記追試実験における、100mlを30分かけて滴下するという滴下時

間は、非常に遅く、通常選択される条件ではない。

(2) 小括

よって、本件発明 1, 3, 5, 7 及び 10 ないし 13 は、引用発明 3 及び技術常識に基づいて、当業者が容易に発明をすることができたものではない。

[被告の主張]

(1) 本件発明 1 の容易想到性

引用発明 3 (引用例 3 の実施例 3 の記載に基づくもの) について、引用例 3 の実施例 3 を基に追試実験 (甲 38) を行えば、本件発明 1 の結晶多形 A を得ることができる。

すなわち、引用発明 3 の白色結晶を得るために、引用例 3 に明示されていない実験条件について技術常識等を参酌して必要な試行錯誤によって適宜設定することは通常の追試の手法といえる。そして、引用例 3 の実施例 3 は水溶液中で反応が実施されていることからすれば、水和物結晶となり得る条件で実施されているといえ、当業者が乾燥状態を適宜設定して結晶の水分量を調整し、水和物結晶の存在を調査する。そうすると、上記追試実験のように、乾燥条件を適宜設定し、水分量を変化させて、水和物結晶が得られる範囲を探索してみることは、これらの乾燥条件が特殊であるといえない以上、引用発明 3 の結晶化の検討において、当業者が通常行う試行錯誤の範囲内で得ることができたものである。

これに対し、水から析出させた粉体を乾燥する場合、生成物の重量が恒量に達するまで乾燥して生成物を評価するのが当業者の技術常識であるということとはできない。また、引用例 3 の実施例 3 には「白色結晶」が得られたことが明記され、実施例 1, 2 にも具体的に結晶化されることが記載されているから、実施例 3 も結晶を得ることを前提として記載されていると考えるのが自然である。

(2) 小括

よって、本件発明 1, 3, 5, 7 及び 10 ないし 13 は、引用発明 3 及び技術常識に基づいて、当業者が容易に発明をすることができたものである。

#### 第4 当裁判所の判断

##### 1 本件発明1について

本件発明1に係る特許請求の範囲は、前記第2の2(1)【請求項1】のとおりであるところ、本件明細書によれば、本件発明1の特徴は、以下のとおりである。なお、本件明細書には、別紙本件明細書図表目録のとおり、【表1】【図1】が記載されている。

(1) 本件発明1は、高コレステロール血症の患者の処置に用いられるピタバスタチンカルシウムの新規な結晶多形に関するものである(【0001】【0004】)。

(2) 薬学的物質は、異なる二つ以上の結晶構造を有し得るところ、異なる多形は物理的特性が異なり、薬学的特性にも影響を与える(【0006】)。

本件発明1は、ピタバスタチンカルシウムの新規な結晶多形、すなわち構成要件AないしEで特定されるピタバスタチンカルシウムの結晶多形を見いだしたものである(【請求項1】【0007】【0008】)。

(3) 本件発明1の一つの具体的形態は、 $2\theta$ で表して、【表1】に記載された角度において、同記載のとおり相対強度でピークを有する特徴的なX線粉末回折図形を示す(【0009】【0010】)。

ピタバスタチン *tert*-ブチルエステルから製造した生成物である本件発明1は、【図1】で示すX線粉末回折図形を特徴とする(【0047】)。

2 取消事由1(本件補正が新規事項の追加に当たるとした判断の誤り)について

(1) 明細書、特許請求の範囲又は図面について補正をするときは、願書に最初に添付した明細書、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しなければならないところ(特許法17条の2第3項)、補正が、当業者によって、願書に最初に添付した明細書、特許請求の範囲又は図面の全ての記載を総合することにより導かれる技術的事項との関係において、新たな技術的事項を導入しないものであるときは、当該補正は、願書に最初に添付した明細書、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したものということができる。

(2) 本件決定は、本件出願時の特許請求の範囲【請求項1】に、構成要件Eを追加する本件補正は、新たな技術的事項を導入するものであると判断した。

構成要件Eを追加する本件補正は、本件出願時の特許請求の範囲【請求項1】で特定される結晶多形Aから、構成要件Eで特定される結晶多形Aを除くものである。そこで、本件出願時の特許請求の範囲【請求項1】で特定される結晶多形Aから、構成要件Eで特定される結晶多形Aを除くものが、本件出願当初明細書等の全ての記載を総合することにより導かれるかについて、検討する。

(3) 本件出願当初明細書等から導かれる技術的事項

ア 本件出願当初明細書等の記載

結晶多形Aについて、本件出願当初明細書等には、おおむね、次のとおり記載がある。

【請求項1】 $2\theta$ で表して、 $5.0 \pm 0.2^\circ$ 、 $6.8 \pm 0.2^\circ$ 、 $9.1 \pm 0.2^\circ$ 、 $13.7 \pm 0.2^\circ$ 、 $20.8 \pm 0.2^\circ$ 、 $24.2 \pm 0.2^\circ$ に特徴的なピークを有する特徴的なX線粉末回折図形を示し、FT-IR分光法と結合した熱重量法により測定した含水量が3～15%であるピタバスタチンカルシウムの結晶多形A

【0007】…本発明者らは、ピタバスタチンカルシウムの、本明細書では形態A、B、C、D、EおよびFと名付けた新規な結晶質形態…を、驚異的にも見出した。

【0008】本発明は、ピタバスタチンカルシウム塩(2:1)の結晶多形を対象とし、下記の(1)～(10)に記載の本明細書で形態Aと名付けた結晶多形A…にある。

(1)  $2\theta$ で表して、 $5.0 \pm 0.2^\circ$ 、 $6.8 \pm 0.2^\circ$ 、 $9.1 \pm 0.2^\circ$ 、 $13.7 \pm 0.2^\circ$ 、 $20.8 \pm 0.2^\circ$ 、 $24.2 \pm 0.2^\circ$ に特徴的なピークを有する特徴的なX線粉末回折図形を示し、FT-IR分光法と結合した熱重量法により測定した含水量が3～15%であるピタバスタチンカルシウムの結晶多形A。

…

(5)  $2\theta$ で表して、 $5.0 \pm 0.2^\circ$ 、 $6.8 \pm 0.2^\circ$ 、 $9.1 \pm 0.2^\circ$ 、 $10.0 \pm 0.2^\circ$ 、 $10.5 \pm 0.2^\circ$ 、 $11.0 \pm 0.2^\circ$ 、 $13.3 \pm 0.2^\circ$ 、 $13.7 \pm 0.2^\circ$ 、 $14.0 \pm 0.2^\circ$ 、 $14.7 \pm 0.2^\circ$ 、 $15.9 \pm 0.2^\circ$ 、 $16.9 \pm 0.2^\circ$ 、 $17.1 \pm 0.2^\circ$ 、 $18.4 \pm 0.2^\circ$ 、 $19.1 \pm 0.2^\circ$ 、 $20.8 \pm 0.2^\circ$ 、 $21.1 \pm 0.2^\circ$ 、 $21.6 \pm 0.2^\circ$ 、 $22.9 \pm 0.2^\circ$ 、 $23.7 \pm 0.2^\circ$ 、 $24.2 \pm 0.2^\circ$ 、 $25.2 \pm 0.2^\circ$ 、 $27.1 \pm 0.2^\circ$ 、 $29.6 \pm 0.2^\circ$ 、 $30.2 \pm 0.2^\circ$ 、 $34.0 \pm 0.2^\circ$ に特徴的なピークを有する特徴的なX線粉末回折図形を示し、FT-IR分光法と結合した熱重量法により測定した含水量が3～15%であるピタバスタチンカルシウムの結晶多形A。…

【0009】上記結晶多形Aの一つの具体的形態は、例1に示されるピタバスタチンカルシウムの結晶多形Aであり、d間隔値(Å)および $2\theta$ 角度値、について、表1(判決注：別紙【表1】に同じ。)に示したとおりの特徴的なピークを有するX線粉末回折図形を有するものである。なお、表1において、v s =非常に強い強度、s =強い強度、m =中間の強度、w =弱い強度、v w =非常に弱い強度を表す。

【0021】実験的詳細中の少々の変更は、X線粉末回折図形の特徴的なピークのd値および $2\theta$ に小さな偏差を生じる可能性がある。

【0023】粉末X線回折は、Cuのk( $\alpha$ 1)放射線(1.54060 Å)を用いて、Philips 1710という粉末X線回折計で実施し、 $2\theta$ の角度が $\pm 0.1 \sim 0.2^\circ$ の実験誤差で記録される。…

【0047】形態Aの製造 / (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-ジヒドロキシー-6(E)-ヘプテン酸tert-ブチルエステル(ピタバスタチンtert-ブチルエステル) 4.15 gを、メチルtert-ブチルエーテルおよびメタノールの混合物(10 : 3) 52 mlに懸濁させた。…約16時間乾燥した。得られた生成物は結晶形

態Aであって、図1（判決注：別紙【図1】に同じ。）に示したようなX線粉末回折図形を特徴とする。得られた形態AのFT-IR分光法と結合した熱重量法による更なる特徴付けは、約10%の含水量を明らかにした。示差走査熱量測定は、95℃の融点を明らかにした。…

イ 本件出願当初明細書等に関示された結晶多形Aに関する技術的事項

(ア) 本件出願当初明細書等という結晶多形Aは、本件出願当初明細書等において名付けられたものである（【0007】）。

(イ) そして、本件出願当初明細書等【0008】には、結晶多形Aに該当する具体的な結晶多形として、【0008】(1)は、本件出願時の特許請求の範囲【請求項1】で特定される結晶多形を挙げるほか、【0008】(5)は、 $2\theta$ で表して、構成要件Eで特定されるのと同様の26個の角度において、ピークを有する特徴的なX線回折図形を示し、FT-IR分光法と結合した熱重量法により測定した含水量が3～15%であるピタバスタチンカルシウムの結晶多形を挙げており、後者の結晶多形は、構成要件Eで特定される結晶多形を含むものである。このように、本件出願当初明細書等【0008】の記載は、結晶多形Aには、構成要件Eで特定される結晶多形だけではなく、本件出願時の特許請求の範囲【請求項1】で特定される結晶多形も、該当する旨説明するものである。

(ウ) また、本件出願当初明細書等【0009】は、「結晶多形Aの一つの具体的な形態」として、 $2\theta$ で表して、構成要件Eで特定されるのと同様の26個無偏差相対強度図形を示す結晶多形を例示しており、この結晶多形は、構成要件Eで特定される結晶多形を含むものである。そうすると、本件出願当初明細書等【0009】の記載は、構成要件Eで特定される結晶多形は、結晶多形Aの具体的な態様の一つである旨説明するものである。

(エ) さらに、本願出願当初明細書等【0047】には、【0047】に記載された製造方法によって、結晶多形Aが得られること、当該結晶多形AのX線粉末回折図形は、構成要件Eと同様の26個無偏差相対強度図形を示したことが記載され

ている。本件出願当初明細書等【0047】の記載は、特定の製造方法によって生成された結晶多形AのX線粉末回析図形を説明するにとどまり、構成要件Eで特定される結晶多形のみが結晶多形Aである旨説明するものではない。

(オ) したがって、本件出願当初明細書等の記載を総合すれば、構成要件Eで特定される結晶多形Aだけではなく、本件出願時の特許請求の範囲【請求項1】で特定される結晶多形Aも、導くことができる。

#### (4) 新規事項の追加の有無

本件出願当初明細書等の記載を総合すれば、構成要件Eで特定される結晶多形Aだけではなく、本件出願時の特許請求の範囲【請求項1】で特定される結晶多形Aも、導くことができるから、本件出願時の特許請求の範囲【請求項1】で特定される結晶多形Aから、構成要件Eで特定される結晶多形Aを除くものを、本件出願当初明細書等の全ての記載を総合することにより導くことができるというべきである。

したがって、本件出願時の特許請求の範囲【請求項1】に、構成要件Eを追加する本件補正は、新たな技術的事項を導入するものではなく、本件出願当初明細書等に記載した事項の範囲内においてしたものというべきである。

#### (5) 被告の主張について

被告は、本件出願当初明細書等に記載された結晶多形Aを、26個のピークの回折角 $2\theta$ 及びその相対強度で特定しなくても、6個のピークの回折角 $2\theta$ 等によって特定し得るということは技術常識ではないと主張する。

しかし、本件出願当初明細書等の記載を総合すれば、26個のピークの回折角 $2\theta$ 及びその相対強度で特定される結晶多形Aだけではなく、6個のピークの回折角 $2\theta$ 等によって特定される結晶多形Aも導くことができる。本件補正は、26個のピークの回折角 $2\theta$ 及びその相対強度で特定される結晶多形を、6個のピークの回折角 $2\theta$ 等によって特定することを前提としてなされたものではないから、被告の上記主張は、前提を欠く。

#### (6) 小括

以上のとおり、本件出願時の特許請求の範囲【請求項1】に、構成要件Eを追加する本件補正は、新たな技術的事項を導入するものではない。そして、本件補正のその余の部分について、被告は、新たな技術的事項を導入するものではなく、本件出願当初明細書等に記載した範囲内においてしたものであることを争わない。したがって、本件補正は、特許法17条の2第3項に規定する要件を満たす。

よって、取消事由1は理由がある。

### 3 取消事由2（サポート要件の判断の誤り）について

(1) 特許請求の範囲の記載がサポート要件に適合するか否かは、特許請求の範囲の記載と発明の詳細な説明の記載とを対比し、特許請求の範囲に記載された発明が、発明の詳細な説明に記載された発明で、発明の詳細な説明の記載により当業者が当該発明の課題を解決できると認識できる範囲のものであるか否か、また、その記載や示唆がなくとも当業者が出願時の技術常識に照らし当該発明の課題を解決できると認識できる範囲のものであるか否かを検討して判断すべきである。

#### (2) 本件明細書の記載

本件明細書には、おおむね、次のとおり記載がある。

【0007】本件出願当初明細書等【0007】に同じ。

【0008】本発明は、ピタバスタチンカルシウム塩（2：1）の結晶多形を対象とし、下記の(1)～(13)に記載の結晶多形A…にある。

(1)  $2\theta$ で表して、 $5.0 \pm 0.2^\circ$ 、 $6.8 \pm 0.2^\circ$ 、 $9.1 \pm 0.2^\circ$ 、 $13.7 \pm 0.2^\circ$ 、 $20.8 \pm 0.2^\circ$ 、 $24.2 \pm 0.2^\circ$ に特徴的なピークを有し、 $20.2 \pm 0.2^\circ$ に特徴的なピークを有しない、特徴的なX線粉末回折図形を示し、FT-IR分光法と結合した熱重量法により測定した含水量が9～15%である（但し、FT-IR分光法と結合した熱重量法により測定した含水量が10.5～10.7%（w/w）の水を含むものを除く）、ピタバスタチンカルシウムの結晶多形A。

但し、26個偏差内相対強度図形を示し、FT-IR分光法と結合した熱重量法

により測定した含水量が3～15%であるものを除く。

(2)  $2\theta$ で表して、 $5.0 \pm 0.2^\circ$  (s),  $6.8 \pm 0.2^\circ$  (s),  $9.1 \pm 0.2^\circ$  (s),  $13.7 \pm 0.2^\circ$  (s),  $20.8 \pm 0.2^\circ$  (vs),  $24.2 \pm 0.2^\circ$  (s) [ここで、(vs)は非常に強い強度を意味し、(s)は強い強度を意味する]に特徴的なピークを有する特徴的なX線粉末回折図形を示す、上記(1)に記載の結晶多形A。…

(4)  $2\theta$ で表して、さらに、 $10.5 \pm 0.2^\circ$  (m),  $11.0 \pm 0.2^\circ$  (m),  $18.4 \pm 0.2^\circ$  (m),  $21.1 \pm 0.2^\circ$  (m),  $21.6 \pm 0.2^\circ$  (m),  $22.9 \pm 0.2^\circ$  (m),  $23.7 \pm 0.2^\circ$  (m),  $27.1 \pm 0.2^\circ$  (m)に特徴的なピークを有する特徴的なX線粉末回折図形を示す、上記(2)に記載の結晶多形A。…

(6)  $2\theta$ で表して、さらに、 $10.0 \pm 0.2^\circ$  (w),  $14.0 \pm 0.2^\circ$  (w),  $14.7 \pm 0.2^\circ$  (w),  $16.9 \pm 0.2^\circ$  (w),  $19.1 \pm 0.2^\circ$  (w),  $25.2 \pm 0.2^\circ$  (w),  $30.2 \pm 0.2^\circ$  (w),  $34.0 \pm 0.2^\circ$  (w)に特徴的なピークを有する特徴的なX線粉末回折図形を示す、上記(4)に記載の結晶多形A。…

(8)  $2\theta$ で表して、さらに、 $13.3 \pm 0.2^\circ$  (vw),  $15.9 \pm 0.2^\circ$  (vw),  $17.1 \pm 0.2^\circ$  (vw),  $29.6 \pm 0.2^\circ$  (vw)に特徴的なピークを有する特徴的なX線粉末回折図形を示す、上記(6)に記載の結晶多形A。…

【0009】、【0021】、【0023】及び【0047】は、本件出願当初明細書等【0009】、【0021】、【0023】及び【0047】と同じである。

(3) 本件明細書に記載された発明

本件明細書にいう結晶多形Aは、本件明細書において名付けられたものである(【0007】)。そして、本件明細書【0008】の記載は、結晶多形Aには、構成要件Eで特定される結晶多形(【0008】(1)(2)(4)(6)(8))だけではなく、構成要件

件AないしEで特定される結晶多形（【0008】(1)）も、該当する旨説明するものである。また、本件明細書【0009】の記載は、構成要件Eで特定される結晶多形は、結晶多形Aの具体的な態様の一つである旨説明するものである。さらに、本件明細書【0047】の記載は、特定の製造方法によって生成された結晶多形AのX線粉末回析図形を説明するにとどまり、構成要件Eで特定される結晶多形のみが結晶多形Aである旨説明するものではない。

したがって、本件明細書には、構成要件Eで特定される結晶多形Aだけではなく、構成要件AないしEで特定される結晶多形Aも記載されている。よって、本件発明1は、本件明細書に記載された発明である。

#### (4) 課題の解決

##### ア 本件発明1の課題

前記1のとおり、本件明細書には、ピタバスタチンカルシウムは高コレステロール血症の患者の処置に用いられ、その異なる多形は、薬学的特性に影響を与えるところ、本件発明1は、構成要件AないしEで特定されるピタバスタチンカルシウムの新規な結晶多形を見出したものであると説明されている。

したがって、本件発明1の課題は、構成要件AないしEで特定されるピタバスタチンカルシウムの結晶多形を提供するものといえることができる。

##### イ 課題解決手段

本件明細書【0047】には、【0047】に記載された製造方法によって、26個無偏差相対強度図形を示し、FT-IR分光法と結合した熱重量法により測定した含水量が約10%であるピタバスタチンカルシウムの結晶多形を製造した旨記載されている。そして、本件明細書【0021】【0023】には偏差に関する記載がある。

そうすると、当業者は、本件明細書の記載から、26個偏差内相対強度図形を示し（構成要件Aに相当）、FT-IR分光法と結合した熱重量法により測定した含水量が約10%（構成要件Bに近似）であるピタバスタチンカルシウム（構成要件

Cに相当)の結晶多形(構成要件Dに相当)を製造できると認識することができる。

そして、【0047】に記載された製造方法の乾燥条件を変更することで、含水量が約10%の上記結晶多形ではなく、10.5%(w/w)を下回る結晶多形や、10.7%(w/w)を上回る結晶多形を製造できることを、当業者は、技術常識に照らして認識することができる。

また、粉末X線回折法において、各ピークの相対強度の変動幅が比較的大きく、このため、相対強度が比較的小さいピークについては明確には測定できない場合もあり得ることは、本件出願当時の当業者の技術常識である(甲16,45)。したがって、当業者は、X線粉末回折図形について、【0047】に記載された製造方法によっても、構成要件Eの26個偏差内相対強度図形を示すとは限らないことを、技術常識に照らして認識することができる。

したがって、本件明細書の記載及び技術常識に照らし、当業者は、構成要件AないしEで特定されるピタバスタチンカルシウムの結晶多形を製造できると認識することができる。

ウ よって、当業者は、本件明細書の記載及び技術常識に照らし、構成要件AないしEで特定されるピタバスタチンカルシウムの結晶多形を提供するという本件発明1の課題を解決できると認識できるというべきである。

#### (5) 小括

以上によれば、本件発明1は、本件明細書に記載された発明で、本件明細書の記載及び技術常識に照らし、本件発明1の課題を解決できると認識できる範囲のものであるから、本件発明1の特許請求の範囲の記載は、サポート要件に適合するものである。そして、本件発明2ないし7,9ないし13の特許請求の範囲のうち、本件発明1の特許請求の範囲で特定される部分を除く発明特定事項の記載について、被告は、サポート要件に適合することを争わない。したがって、本件各発明の特許請求の範囲の記載は、サポート要件に適合する。

よって、取消事由2は理由がある。

#### 4 取消事由3（実施可能要件の判断の誤り）について

(1) 物の発明について実施可能要件を充足するためには、明細書の発明の詳細な説明に、当業者が、明細書の発明の詳細な説明の記載及び出願当時の技術常識とに基づいて、過度の試行錯誤を要することなく、その物を製造し、使用することができる程度の記載があることを要する。

#### (2) 実施可能要件の適合

前記3(4)イのとおり、本件明細書の記載及び技術常識に照らし、当業者は、構成要件AないしEで特定されるピタバスタチンカルシウムの結晶多形を製造できると認識できる。したがって、当業者は、本件明細書の記載及び技術常識とに基づいて、構成要件AないしEで特定されるピタバスタチンカルシウムの結晶多形を、過度の試行錯誤を要することなく、製造することができる。

また、本件明細書【0004】には、ピタバスタチンカルシウムは「安全であり、高コレステロール血症の患者の処置に十分に許容される」と記載されており、本件発明1は、その新規な結晶形態であるから、当業者は、本件明細書の記載及び技術常識とに基づいて、本件発明1を、過度の試行錯誤を要することなく、使用することができる。

#### (3) 小括

以上によれば、本件発明1に係る本件明細書の発明の詳細な説明は、当業者が本件発明1の実施をすることができる程度に明確かつ十分に記載されているものであるから、実施可能要件を満たす。そして、本件発明2ないし7、9ないし13の特許請求の範囲のうち、本件発明1の特許請求の範囲で特定される部分を除く発明特定事項に係る本件明細書の発明の詳細な説明の記載について、被告は、実施可能要件に適合することを争わない。したがって、本件各発明に係る本件明細書の発明の詳細な説明の記載は、実施可能要件に適合する。

よって、取消事由3は理由がある。

#### 5 取消事由5（引用発明2又は2'に基づく進歩性の判断の誤り）について

(1) 引用例2の公知性（分割要件の充足の有無）について

ア 分割出願が適法であるための実体的要件としては、①もとの出願の明細書、特許請求の範囲の記載又は図面に二以上の発明が包含されていたこと、②新たな出願に係る発明はもとの出願の明細書、特許請求の範囲の記載又は図面に記載された発明の一部であること、③新たな出願に係る発明は、もとの出願の当初明細書等に記載された事項の範囲内であることを要する。なお、本件出願が第1出願の出願時にしたものとみなされるためには、本件出願、第3出願及び第2出願が、それぞれ、もとの出願との関係で、上記分割の要件①ないし③を満たさなければならない。

イ 本件決定は、第3出願当初明細書等には、X線粉末回析において26個偏差内相対強度図形を示す結晶多形Aしか記載されていなかったから、6個のピーク及び1個のピークの不存在で結晶多形Aを特定する本件発明1は、第3出願当初明細書等に記載された事項の範囲を拡大するものであると判断した。

そこで、本件発明1は、第3出願当初明細書等に記載された事項の範囲内にあり、上記分割の要件③を満たすかについて検討する。

ウ 第3出願当初明細書等に記載された事項

(ア) 第3出願当初明細書等の記載

結晶多形Aについて、第3出願当初明細書等には、おおむね、次のとおり記載がある。

【0009】…本発明者らは、ピタバスタチンカルシウムの、本明細書では形態A、B、C、D、EおよびFと名付けた新規な結晶質形態…を、驚異的にも見出した。／本発明は、ピタバスタチンカルシウム塩（2：1）のアモルファス形態を対象とし、下記と特徴とする要旨を有するものである。

【0010】(1)  $2\theta$  で表して、5.0 (s), 6.8 (s), 9.1 (s), 10.0 (w), 10.5 (m), 11.0 (m), 13.3 (vw), 13.7 (s), 14.0 (w), 14.7 (w), 15.9 (vw), 16.9 (w), 17.1 (vw), 18.4 (m), 19.1 (w), 20.8 (vs), 21.1 (m),

21.6 (m), 22.9 (m), 23.7 (m), 24.2 (s), 25.2 (w), 27.1 (m), 29.6 (vw), 30.2 (w), 34.0 (w) [ここで、(vs)は、非常に強い強度を意味し、(s)は、強い強度を意味し、(m)は、中間の強度を意味し、(w)は、弱い強度を意味し、(vw)は、非常に弱い強度を意味する]に特徴的なピークを有する特徴的なX線粉末回折図形を示す、ピタバスタチンカルシウムの結晶多形A。

(2) 実質的に図1(判決注:別紙【図1】に同じ。)に示したとおりのX線粉末回折図形を有する、ピタバスタチンカルシウムの結晶多形A。…

【0013】粉末X線回折は、Cuのk( $\alpha$ 1)放射線(1.54060 Å)を用いて、Philips 1710という粉末X線回折計で実施し; 2 $\theta$ の角度が $\pm 0.1 \sim 0.2^\circ$ の実験誤差で記録される。…

【0014】なお、本発明のピタバスタチンカルシウムのアモルファス形態ではない、かかる化合物の結晶形態としては、以下のA, B, C, D, EおよびFと名付けた結晶形態がある。/形態A:ピタバスタチンカルシウムの、本明細書で形態Aと名付けた結晶多形であって、d値(Å)および2 $\theta$ で表して、表1(判決注:別紙【表1】に同じ。)に示したとおりの特徴的なピークを有する特徴的なX線粉末回折図形を示す(vs=非常に強い強度, s=強い強度, m=中間の強度, w=弱い強度, vw=非常に弱い強度)。

【0025】…実験的詳細中の少々の変更は、X線粉末回折図形の特徴的なピークのd値および2 $\theta$ に小さな偏差を生じる可能性がある。

【0026】次に、ピタバスタチンナトリウムの形態A, B, C, D, EおよびFとともに、本発明のアモルファス形態の製造方法について説明する。

【0027】形態Aは、一般的には、ピタバスタチンナトリウムから、水性反応媒体中でCaCl<sub>2</sub>と反応させて製造することができる。これに代えて、本発明の形態Aは、好都合にはやはり水性反応媒体中で、遊離酸((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

ージヒドロキシ-6 (E)-ヘプテン酸) または対応するラクトンとCa(OH)<sub>2</sub>から、*in situ*で得てもよい。

【0049】 [例1] (参考例) /形態Aの製造/ (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 (E)-ヘプテン酸 *tert*-ブチルエステル (ピタバスタチン *tert*-ブチルエステル) 4.15gを, メチル *tert*-ブチルエーテルおよびメタノールの混合物 (10:3) 52mlに懸濁させた。…得られた生成物は結晶形態Aであって, 図1 (判決注: 別紙【図1】に同じ。) に示したようなX線粉末回折図形を特徴とする。得られた形態AのFT-IR分光法と結合した熱重量法による更なる特徴付けは, 約10%の含水量を明らかにした。示差走査熱量測定は, 95°Cの融点を明らかにした。

(イ) 第3出願当初明細書等に記載された結晶多形Aに関する事項

a 第3出願当初明細書等にいう結晶多形Aは, 第3出願当初明細書等において名付けられたものである (【0009】 【0014】)。

b そして, 第3出願当初明細書等【0010】は, 結晶多形Aに該当する具体的な結晶多形として, 【0010】(1)は, 26個無偏差相対強度図形を示す, ピタバスタチンカルシウムの結晶多形を挙げ, また, 【0010】(2)は, 「実質的」に別紙【図1】に示したとおりのX線粉末回折図形を有する, ピタバスタチンカルシウムの結晶多形を挙げるにとどまる。

ここで, 【0010】(2)に挙げられた結晶多形は, 「実質的」に別紙【図1】で示したとおりのX線粉末回折図形を示すピタバスタチンカルシウムの結晶多形であるところ, 「実質的」とは, 対象をより抽象化する場合に用いられる表現であること, 第3出願当初明細書等【0013】 【0025】には偏差に関する記載があることからすれば, 【0010】(2)に挙げられた結晶多形は, 別紙【図1】で示したとおりのX線粉末回折図形を示すピタバスタチンカルシウムの結晶多形及び別紙【図1】に若干の偏差を有するX線粉末回折図形を示すピタバスタチンカルシウムの結

晶多形を意味するというべきである。

そうすると、第3出願当初明細書等【0010】の記載は、結晶多形Aに該当する具体的な結晶多形として、26個無偏差相対強度図形、別紙【図1】で示したとおりのX線粉末回析図形又は別紙【図1】に若干の偏差を有するX線粉末回析図形を示すピタバスタチンカルシウムの結晶多形を説明するにとどまるということができる。

c また、第3出願当初明細書等【0014】の記載は、結晶多形Aの具体的な形態として、26個無偏差相対強度図形を示すピタバスタチンカルシウムの結晶多形を特定して説明するものである。

d さらに、第3出願当初明細書等には、本件出願当初明細書【0009】や本件明細書【0009】のように、26個無偏差相対強度図形等を示すピタバスタチンカルシウムの結晶多形が、第3出願当初明細書等において規定される結晶多形Aの具体的な態様の一つであることを窺わせる記載はない。

e したがって、第3出願当初明細書等には、結晶多形Aとして、26個無偏差相対強度図形、別紙【図1】又はそれに若干の偏差を有するX線粉末回析図形を示すピタバスタチンカルシウムの結晶多形しか記載されていないというべきである。

エ 前記分割の要件③の充足の有無

本件発明1は、 $2\theta$ で表して、 $5.0 \pm 0.2^\circ$ 、 $6.8 \pm 0.2^\circ$ 、 $9.1 \pm 0.2^\circ$ 、 $13.7 \pm 0.2^\circ$ 、 $20.8 \pm 0.2^\circ$ 、 $24.2 \pm 0.2^\circ$ に特徴的なピークを有し、 $20.2 \pm 0.2^\circ$ に特徴的なピークを有しない、特徴的なX線粉末回折図形を示すこと等により特定されるピタバスタチンカルシウムの結晶多形であるところ、第3出願当初明細書等には、結晶多形Aとして、このような結晶多形は記載されておらず、結晶多形Aと名付けられた結晶多形以外の結晶多形としても、このような結晶多形が記載されているということとはできない。

したがって、本件発明1は、第3出願当初明細書等に記載された事項の範囲内にあるということとはできず、前記分割の要件③は満たさない。

オ 原告の主張について

原告は、当業者であれば、第3出願当初明細書等に、6個のピークを有し、1個のピークを有しないという構成要件Aにより特定される結晶多形Aが記載されると理解できる旨主張する。

しかし、第3出願当初明細書等にいう結晶多形Aは、第3出願当初明細書等において名付けられたものであって、第3出願当初明細書等に結晶多形Aとして説明される結晶多形は、26個無偏差相対強度図形等を示すピタバスタチンカルシウムの結晶多形である。26個無偏差相対強度図形のうち、比較的相対強度の強い6個においてピークを確認できる結晶多形が、第3出願当初明細書等に開示された結晶多形Aであると同定できたとしても、第3出願当初明細書等において開示された結晶多形Aは、26個無偏差相対強度図形のうち、比較的相対強度の強い6個においてピークを確認できる結晶多形ではない。原告の主張は、第3出願当初明細書等の記載に基づくものではなく、採用できない。

カ 小括

以上によれば、本件発明1は、第3出願当初明細書等に記載された事項の範囲内であるということはできず、前記分割の要件③を満たさない。したがって、本件発明1に係る本件出願は、第3出願の一部を新たに特許出願とするものではないから、その出願日は平成26年7月30日となる。

したがって、引用例2は、本件出願の出願日前に頒布された刊行物である。原告は、引用発明2及び2'に基づく進歩性欠如について具体的に取消事由を主張しないが、念のため、以下において検討する。

(2) 引用発明2について

引用例2には、おおむね、次のとおり、記載がある。

【0001】本発明はエナンチオマーとして純粋なHMG-C<sub>o</sub>A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。

【0004】好適なHMG-C<sub>o</sub>A還元酵素阻害剤はすでに市場に出された薬剤

であり、最も好ましいのはフルバスタチン、アトルバスタチン、ピタバスタチン、とりわけそのカルシウム塩、またはシンバスタチンまたはその医薬上許容される塩である。

【0135】… (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：… (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-ヘプテン酸を白色固体として得る。

【0136】カルシウム塩形成のために、該酸 (2.55 g, 6.05ミリモル) を水 (40.5 mL) に懸濁し、水酸化ナトリウム (0.260 g, 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 (2 mL) 中塩化カルシウム (0.399 g, 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。…

### (3) 引用発明2の認定及び本件発明1と引用発明2との対比

引用例2に、前記第2の3(2)イ(ア)のとおり引用発明2が記載されていることは当事者間に争いが無い。また、本件明細書及び引用例2の記載によれば、本件発明1と引用発明2との一致点及び相違点は、前記第2の3(2)イ(ウ)、(エ)のとおりであると認められる。相違点2aは、本件発明1の構成要件A、D及びEに係る相違点であり、相違点2bは、本件発明1の構成要件Bに係る相違点である。

### (4) 相違点2aの容易想到性

ア 引用発明 2 は、引用例 2 【0 1 3 6】に記載された白色結晶性粉末であるところ、当該段落には、当該白色結晶性粉末の製造方法が記載されているから、当業者であれば、引用例 2 【0 1 3 6】に記載された白色結晶性粉末の製造方法に基づく追試を行うことは容易に想到し得るものである。そして、同記載の条件を基に夏莉英昭博士が行った実験（以下「本件実験」という。）により得られた白色粉末は、本件発明 1 の構成要件 A, D 及び E に含まれるものであったと認められる（甲 3 6, 3 7）。

イ 引用例 2 【0 1 3 6】記載の条件と本件実験の条件の相違

（ア） 引用例 2 【0 1 3 6】記載の条件と本件実験の条件（ただし、実験工程 1 回目のも。甲 3 6 の 2・4 頁）を比較するに、前者における（E）－（3 R, 5 S）－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－ヘプテン酸は、後者におけるピタバスタチンフリー体に相当する。そして、引用例 2 【0 1 3 6】記載の条件は、①水中塩化カルシウムの溶液（塩化カルシウム水溶液）の滴下時間が不明であり、②減圧下乾燥を、どのように行うのか不明であるのに対し、本件実験の条件は、①塩化カルシウム水溶液の滴下時間を 1 0 分とする点、②減圧下乾燥を、生成物の一部を抜き取って水分量をモニタリングしながら、水分量 1 0. 7% になるまで合計 1 4 0 分かけて行う点で相違する。

（イ） 滴下条件

芦澤一英編「医薬品の多形現象と晶析の科学」と題する文献（甲 3 5 の 4 3 5 頁。平成 1 4 年発行）に、「結晶化においては溶媒の滴下時間…を検討する。」と記載されていることからすれば、滴下時間は、結晶化において当業者が当然に検討する事項であるといえる。したがって、引用例 2 【0 1 3 6】に記載された製造方法の追試を行う場合、滴下時間を設定することは、当業者が通常行うことであるといえる。

そして、本件実験のように、滴下時間を 1 0 分と設定することは、その余の反応

時間と比較して短く、かつ懸濁液を形成するための相当の時間を設定することを考慮すれば、不自然なものとはいえない。

よって、引用例2【0136】に記載された製造方法の追試を行うに当たり、本件実験のように滴下時間を10分と設定することは、当業者が、滴下時間として適宜設定する範囲内のものといえることができる。

(ウ) 乾燥条件

上記文献(甲35の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…等基礎的検討を実施する。」と記載されていることからすれば、水分量は、結晶化において当業者が当然に検討する事項であるといえる。したがって、引用例2【0136】に記載された製造方法の追試を行う場合、乾燥条件を設定することは、当業者が通常行うことであるといえる。

そして、引用例2【0136】には、水分量10.6%の結晶性粉末を得る旨記載されているところ、生成物の一部を抜き取って水分量をモニタリングしながら乾燥させることは普通の乾燥方法であって、本件実験のように、減圧下乾燥を、生成物の一部を抜き取って水分量をモニタリングしながら、水分量10.7%になるまで合計140分かけて行うことは、不自然なものとはいえない。

よって、引用例2【0136】に記載された製造方法の追試を行うに当たり、本件実験のように減圧下乾燥を、生成物の一部を抜き取って水分量をモニタリングしながら、水分量10.7%になるまで合計140分かけて行うよう設定することは、当業者が、乾燥条件として適宜設定する範囲内のものといえることができる。

(エ) したがって、本件実験の実験条件は、当業者が、引用例2【0136】に記載された白色結晶性粉末の製造方法に基づく追試を行う際に、技術常識を参酌することにより適宜設定可能なものであったといえる。

ウ 以上のとおり、引用発明2に接した当業者であれば、引用例2【0136】に記載された白色結晶性粉末の製造方法に基づく追試を、技術常識を参酌することにより適宜設定可能な範囲で実験条件を加えて行うことは、容易に想到し得るもの

であり、その結果得られた白色粉末は、本件発明1の構成要件A、D及びEに含まれる。

したがって、相違点2 aに係る本件発明1の構成（構成要件A、D及びE）は、引用発明2及び技術常識に基づき当業者が容易に想到し得たものというべきである。

#### (5) 相違点2 bの容易想到性

厚生労働省が平成13年5月1日に発出した通知（甲39）には、「新原薬が吸湿性である場合、水分により分解される場合あるいは原薬が化学量論的な水和物である場合には、水分含量の試験が重要である。その判定基準については、水和や水分の吸収が原薬に及ぼす影響を考慮して、妥当なレベルに設定するとよい。」と記載されていることからすれば、医薬品の水分含量について、水和や水分の吸収が原薬に及ぼす影響を考慮して決定することは、当業者の技術常識であったといえる。

そうすると、引用例2【0136】に記載された製造方法によって得られた結晶の含水量を10.6%から多少変化させて、その影響を調べることは、当業者が当然に行うことであるといえる。そして、乾燥条件を適宜設定することにより、含水量を10.5～10.7%の範囲を超えて含水量を変化させることは当業者が容易になし得たことといえる。また、「FT-IR分光法と結合した熱重量法」により測定した場合と、それ以外の方法で測定した場合とで、含水量の値が実質的に異なることは考え難いことから、引用発明2の含水量は、「FT-IR分光法と結合した熱重量法」により測定した場合であっても同様の値を採るものと解される。

以上によれば、引用発明2に接した当業者であれば、引用例2【0136】に記載された白色結晶性粉末の製造方法において、乾燥条件を適宜設定することにより、引用発明2の含水量を、構成要件Bの範囲内の含水量とすることは容易に想到し得る。

したがって、相違点2 bに係る本件発明1の構成（構成要件B）は、引用発明2及び技術常識に基づき当業者が容易に想到し得たものというべきである。

#### (6) 本件発明1の進歩性について

以上によれば、本件発明 1 は、引用発明 2 及び技術常識に基づき、当業者が容易に発明をすることができたものである。

(7) 本件発明 3, 5 及び 7 の進歩性について

本件明細書及び引用例 2 の記載によれば、本件発明 3 と引用発明 2 との相違点は、相違点 2 a 及び 2 b のほか、本件発明 3 が、さらに、 $2\theta$  で表して 8 個の角度において特徴的なピークを有する特徴的な X 線粉末回析図形を示すのに対し、引用発明 2 は、X 線粉末回析図形において、そのような回析角 ( $2\theta$ ) にピークを有するものであるかが明確でない点（以下「相違点 2 e」という。）であると認められる。

また、本件明細書及び引用例 2 の記載によれば、本件発明 5 と引用発明 2 との相違点は、相違点 2 a, 2 b 及び 2 e のほか、本件発明 5 は、さらに、 $2\theta$  で表して 8 個の角度において特徴的なピークを有する特徴的な X 線粉末回析図形を示すのに対し、引用発明 2 は、X 線粉末回析図形において、そのような回析角 ( $2\theta$ ) にピークを有するものであるかが明確でない点（以下「相違点 2 f」という。）であると認められる。

さらに、本件明細書及び引用例 2 の記載によれば、本件発明 7 と引用発明 2 との相違点は、相違点 2 a, 2 b, 2 e 及び 2 f のほか、本件発明 7 は、さらに、 $2\theta$  で表して 4 個の角度において特徴的なピークを有する特徴的な X 線粉末回析図形を示す結晶多形であるのに対し、引用発明 2 は、X 線粉末回析図形において、そのような回析角 ( $2\theta$ ) にピークを有するものであるかが明確でない点（以下「相違点 2 g」という。）であると認められる。

これに対し、本件実験により得られた白色粉末は、相違点 2 e, 2 f 及び 2 g に係る本件発明 3, 5 及び 7 の各構成を有するものと認められるところ（甲 36, 37）、前記(4)イのとおり、本件実験の実験条件は、当業者が、引用例 2【0136】に記載された白色結晶性粉末の製造方法に基づく追試を行う際に、技術常識を参酌することにより適宜設定可能なものであったといえる。

そうすると、相違点 2 e に係る本件発明 3 の構成、相違点 2 f に係る本件発明 5

の構成及び相違点 2 g に係る本件発明 7 の構成は、いずれも引用発明 2 及び技術常識に基づき当業者が容易に想到し得たものというべきである。

以上によれば、本件発明 3、5 及び 7 は、いずれも引用発明 2 及び技術常識に基づき、当業者が容易に発明をすることができたものである。

(8) 本件発明 10 及び 11 の進歩性について

本件明細書及び引用例 2 の記載によれば、本件発明 10 と引用発明 2 との相違点は、前記第 2 の 3 (2) イ(カ)のとおりであると認められる。そして、特定の結晶多形の純度を高めることは、本件出願の出願日前から当業者に周知の課題であり、また、再結晶化等の手法によって特定の結晶多形の純度を高めることも当業者によく知られた手段であったといえるから、相違点 2 c に係る本件発明 10 の構成は、引用発明 2 及び技術常識に基づき当業者が容易に想到し得たものというべきである。

さらに、本件明細書及び引用例 2 の記載によれば、本件発明 11 と引用発明 2 との相違点は、相違点 2 a 及び 2 b のほか、本件発明 11 は、ピタバスタチンカルシウムの総量を基準にして、95～100 重量%の本件発明 1～9 のいずれかの結晶多形 A を含むピタバスタチンカルシウムであるのに対して、引用発明 2 は、含まれる結晶の割合が特定されていない点（以下「相違点 2 h」という。）であると認められる。もっとも、相違点 2 c と同様に、相違点 2 h に係る本件発明 11 の構成は、引用発明 2 及び技術常識に基づき当業者が容易に想到し得たものというべきである。

以上によれば、本件発明 10 及び 11 は、いずれも引用発明 2 及び技術常識に基づき、当業者が容易に発明をすることができたものである。

(9) 本件発明 12 及び 13 の進歩性について

引用例 2 に、前記第 2 の 3 (2) イ(イ)のとおり引用発明 2' が記載されていることは当事者間に争いが無い。また、本件明細書及び引用例 2 の記載によれば、本件発明 12 と引用発明 2' との相違点は、前記第 2 の 3 (2) イ(キ)のとおりであると認められる。そして、医薬品として使用する場合に、「薬学的に許容され得る担体を含」ませることは技術常識であるといえるから、相違点 2 d に係る本件発明 12 の構成

は、引用発明 2' 及び技術常識に基づき当業者が容易に想到し得たものというべきである。

また、本件明細書及び引用例 2 の記載によれば、本件発明 1 3 と引用発明 2' との相違点は、相違点 2 a 及び 2 b のほか、本件発明 1 3 が「薬学的に許容される得る担体を用いた」ものであるのに対して、引用発明 2' はその点が明確でない点（以下「相違点 2 i」という。）であると認められる。もつとも、相違点 2 d と同様に、相違点 2 i に係る本件発明 1 3 の構成は、引用発明 2' 及び技術常識に基づき当業者が容易に想到し得たものというべきである。

以上によれば、本件発明 1 2 及び 1 3 は、いずれも引用発明 2' 及び技術常識に基づき、当業者が容易に発明をすることができたものである。

#### (10) まとめ

以上のとおり、本件発明 1, 3, 5, 7 及び 1 0 ないし 1 3 は、いずれも引用発明 2 又は 2' 及び技術常識に基づき、当業者が容易に発明をすることができたものである。

よって、取消事由 5 は理由がない。

#### 6 結論

以上検討したとおり、取消事由 1 ないし 3 はいずれも理由があり、取消事由 5 は理由がないから、取消事由 4 及び 6 を検討するまでもなく、本件決定のうち、請求項 1, 3, 5, 7 及び 1 0 ないし 1 3 に係る本件特許を取り消した部分に誤りはなく、請求項 2, 4, 6 及び 9 に係る本件特許を取り消した部分は誤りである。

よって、主文のとおり判決する。

知的財産高等裁判所第 4 部

裁判長裁判官 高 部 眞 規 子

裁判官 山 門 優

裁判官 片 瀬 亮

別紙

本件明細書図表目録

【表 1】

表 1 : 形態Aに関するd間隔および $2\theta$ の角度

d間隔 [Å]	角度 [ $2\theta$ ]	相対強度
17.6	5.0	s
13.0	6.8	s
9.7	9.1	s
8.8	10.0	w
8.4	10.5	m
8.1	11.0	m
6.7	13.3	vw
6.5	13.7	s
6.3	14.0	w
6.0	14.7	w
5.57	15.9	vw
5.25	16.9	w
5.17	17.1	vw
4.82	18.4	m
4.64	19.1	w
4.27	20.8	vs
4.20	21.1	m
4.10	21.6	m
3.87	22.9	m
3.74	23.7	m
3.67	24.2	s
3.53	25.2	w
3.29	27.1	m
3.02	29.6	vw
2.95	30.2	w
2.63	34.0	w

【図1】

