
結晶多形・塩特許に関する

欧米の係争事例検討

特許業務法人原謙三国際特許事務所

弁理士 村橋 麻衣子

講義概要

I. 欧米での結晶多形・塩の特許取得

- ・ 結晶多形、塩の発明
- ・ クレームの記載
- ・ 明細書の記載
- ・ 新規性、非自明性（事例検討）
- ・ 開示要件（事例検討）

II. 欧米での結晶多形・塩の特許の権利行使

- ・ クレーム解釈（事例検討）
 - ・ 権利の有効性
-

1. 欧米での結晶多形・塩の特許取得

1. 1 結晶多形・塩の発明

結晶多形：同一分子でありながら結晶中での分子の配列の仕方が異なるもの

塩：酸に含まれている一つ以上の解離しうる水素イオンをカチオンで置換した化合物

①新規な結晶形または塩

②公知の化合物に比して有利な性質を有する

⇒結晶多形または塩の発明として権利取得

1. 欧米での結晶多形・塩の特許取得

1. 1 結晶多形・塩の発明

結晶多形・塩の特許取得により、

- ・ **実施品そのものの直接的保護**
- ・ **新規化合物の特許出願後、その塩または他の結晶形を権利化することによる、実質的な保護期間の延長**

が可能。

1. 欧米での結晶多形・塩の特許取得

1.2 クレームの記載

原則：公知の化合物との違いをクレームで明確に特定する

化合物の特定方法

①構造式による特定

②作用、機能、性質又は特性による特定

ex) 赤外線スペクトル、固体NMR、示差走査熱量分析(DSC)、
X線回折、融点、晶出条件等

③製法による特定

1. 欧米での結晶多形・塩の特許取得

1.3 明細書の記載

- ①他の発明と区別できるように明確に記載する
 - ②過度の実験なしに、その発明を製造し、使用できる程度に記載する
 - ③発明者が最良と信じる発明の態様(ベストモード)を記載する
 - ④発明がどのような用途に用いられるか(有用性)を記載する
-

1. 欧米での結晶多形・塩の特許取得

1. 4 新規性・非自明性

- ・ **新規性**

出願日(発明日)より前に公知となった発明は、特許を受けることができない

- ・ **非自明性 (進歩性)**

先行技術から自明な発明は、特許を受けることができない

1. 欧米での結晶多形・塩の特許取得

1. 4 新規性・非自明性

(i) ラニチジン塩酸塩事件

Glaxo, Inc. V. Novopharm Ltd. ,
(34 USPQ 2d 1565 CAFC 1995年4月21日判決)

1. 欧米での結晶多形・塩の特許取得

1.4 新規性・非自明性

Zantac[®]に関連するGlaxo社の特許

ラニチジン塩酸塩を有効成分として含む抗潰瘍剤

(1) 658特許(1995年満了)

ラニチジン塩酸塩、製造方法(実施例32)

(2) 431特許(2002年満了)

ラニチジン塩酸塩の2型結晶形(2型ラニチジン塩酸塩)

争点: Novopharm社のANDA申請が431特許を侵害するか否か

1. 欧米での結晶多形・塩の特許取得

1.4 新規性・非自明性

ANDA (Abbreviated New Drug Application) 申請制度

既知の薬剤と生物学的同等な薬剤の簡略新薬申請制度。生物学的同等性試験に関する資料の提出のみで、臨床試験等の報告書の提出は省略可能。先発医薬品メーカーおよび後発医薬品メーカーの利益を調整したハッチ・ワックスマン法において導入された。

1. 欧米での結晶多形・塩の特許取得

1. 4 新規性・非自明性

①NDA(新薬申請)申請時

新薬に関する特許情報のオレンジブックへの掲載義務

②ANDA申請時

新薬特許に対する特許証明書(以下の4項目)の添付義務

I :FDAに特許情報が提出されていない

II :特許満了

III :特許満了予定(特許満了後に実施予定)

IV :特許無効又は非侵害

③米国特許法第271(e)(2)

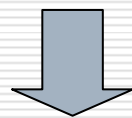
特許満了前のANDAまたはNDA申請は特許権侵害

1. 欧米での結晶多形・塩の特許取得

1.4 新規性・非自明性

Novopharm社 658特許の満了の日からの2型ラニチジン塩酸塩の使用を求めたANDA提出

⇒ Glaxo社 431特許の侵害訴訟提起



Novopharm社 431特許は658特許に記載されているので無効であり、431特許を侵害しないと主張

1. 欧米での結晶多形・塩の特許取得

1. 4 新規性・非自明性

判示:

Novopharm社は、658特許の実施例32によって常に2型ラニチジン塩酸塩が製造されることを証明する義務を果たしていないため、2型ラニチジン塩酸塩は658特許に開示されていない。

よって、431特許は無効ではなく、Novopharm社は431特許を侵害する。

1. 欧米での結晶多形・塩の特許取得

1. 4 新規性・非自明性

(ii) パロキセチン事件

SmithKline Beecham plc v.

Apotex Inc.

(CAFC No.03-1285,-1313 2005年4月8日判決)

1. 欧米での結晶多形・塩の特許取得

1.4 新規性・非自明性

Paxil[®]に関連するSmithKline Beecham社の特許

パロキセチン塩酸塩を有効成分として含む抗うつ剤

(1) 196特許

パロキセチンおよびその塩、パロキセチン塩酸塩・無水物の製造方法

(2) 723特許

パロキセチン塩酸塩・半水和物

(3) 944特許

パロキセチン塩酸塩・半水和物の製法限定

争点: Apotex社のANDA申請が723特許を侵害するか否か

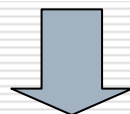
1. 欧米での結晶多形・塩の特許取得

1.4 新規性・非自明性

Apotex社 パロキセチン塩酸塩・無水物の使用を求めたANDA提出

⇒ SmithKline Beecham社 723特許の侵害訴訟提起

196特許に従ってパロキセチン塩酸塩・無水物を製造すると、必然的に半水和物が製造されるので、723特許を侵害することになる。



判示: 196特許に従ってパロキセチン塩酸塩・無水物を製造すると、必然的に半水和物が製造されるので、723特許は196特許により新規性はなく、無効である。よって、Apotex社は723特許を侵害しない。

1. 欧米での結晶多形・塩の特許取得

1. 4 新規性・非自明性

補足：944特許について（CAFC Docket No.04-1522
2006年2月24日判決）

SmithKline Beecham社は、944特許において、プロダクトバイプロセスクレームの各製造工程はクレームの限定にあたるとして、723特許にはこのクレームの限定が開示されていないので、944特許は、723特許により予期できないと主張した。

これに対し、控訴裁判所は一旦製品が完全に開示された以上、同一製品を対象とするクレームは、たとえ新規な製法による限定がされていても新規性を有さないとし、944特許は723特許により予期できたと判示した。

1. 欧米での結晶多形・塩の特許取得

1. 4 新規性・非自明性

(iii) ベシル酸アムロジピン事件

Pfizer, Inc. V. Apotex Inc.

(Fed. Cir. No. 2006-1261 2007年3月22日判決)

1. 欧米での結晶多形・塩の特許取得

1.4 新規性・非自明性

Norvasc[®]に関連するPfizer社の特許

ベシル酸アムロジピンを有効成分として含む、高血圧および慢性安定冠攣縮性狭心症の治療薬

(1)909特許

ジヒドロピリジン化合物、その酸付加塩

(2)303特許

ベシル酸アムロジピン

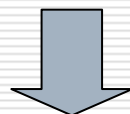
争点: Apotex社のANDA申請が303特許を侵害するか否か

1. 欧米での結晶多形・塩の特許取得

1.4 新規性・非自明性

Apotex社 ベシル酸アムロジピンの使用を求めたANDA提出

⇒ Pfizer社 303特許の侵害訴訟提起



Apotex社 303特許は909特許から自明であるので、無効であり侵害しないと主張

1. 欧米での結晶多形・塩の特許取得

1.4 新規性・非自明性

判示:

アムロジピンの薬学上取り得る塩は53通りに過ぎず、この53通り全てを試してよりよい特性を有するベシル酸アムロジピンに対象を絞ることは、当業者であれば、成功の合理的な期待をもって行うことである。

よって、303特許は909特許から自明であるため無効であり、Apotex社は303特許を侵害しない。

1. 欧米での結晶多形・塩の特許取得

1.5 開示要件

- ・ **記述要件**

発明を他の発明や技術と区別できるように明確に記載しなければならない

- ・ **実施可能要件**

当業者がその発明を製造し、使用できる程度に記述しなければならない

- ・ **ベストモード要件**

発明者が最良と信じる発明の態様を記載しなければならない

1. 欧米での結晶多形・塩の特許取得

1.5 開示要件

(iv) メタンサルホン酸塩事件

Synthon BV v.

SmithKline Beecham plc

(England and Wales High Court Case No: HC 01 C01034

2002年12月3日判決)

1. 欧米での結晶多形・塩の特許取得

1. 5 開示要件

パロキセチン塩酸塩を有効成分として含むうつ病およびパーキンソン病治療薬

(1) Smithkline Beecham社の特許

パロキセチン塩酸塩

(2) Synthon社の出願

パロキセチン塩酸塩を含む4-フェニルピペエリジン

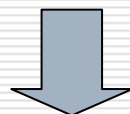
争点: Smithkline Beecham社の特許が、Synthon社の出願により無効であるか否か

1. 欧米での結晶多形・塩の特許取得

1.5 開示要件

Synthon社の出願 : Smithkline Beecham社の優先日前に出願されたが、優先日に未公開

- ・ Smithkline Beecham社の化合物(パロキセチンメシル酸)は Synthon社の化合物に含まれる。
- ・ Synthon社の出願はパロキセチンメシル酸について言及している。



- Synthon社の実施例は再現性があるか？
- Synthon社の明細書はパロキセチンメシル酸の結晶を作ることができるよう記載されているか？
- どの結晶を作ることができるのか？

1. 欧米での結晶多形・塩の特許取得

1.5 開示要件

判示:

Synthon社の出願は、当業者がパロキセチンメシル酸を作ることができるように記載されている。Synthon社の出願に記載により作製したパロキセチンメシル酸結晶は、Smithkline Beecham社の特許で得られるものと同一である。

Synthon社の出願は十分に開示されており、Smithkline Beecham社の特許はこの出願を超える新しい情報が記載されていない。

Smithkline Beecham社の特許は、Synthon社の出願から予期できたものであるため無効である。

II. 欧米での結晶多形・塩の特許の権利行使

2. 1 クレーム解釈

- **文言侵害**
対象がクレームの構成要件または限定の全てを含む場合に侵害成立
 - **均等侵害**
対象がクレームの構成要件の全てを含まない場合であっても、その差異が本質的なものではない場合に侵害成立
-

II. 欧米での結晶多形・塩の特許の権利行使

2. 1 クレーム解釈

- ・ 文言侵害**

- 1) クレーム解釈**

明細書の記載を参照

審査経過書類・外部証拠の参照

- 2) クレームの構成要件の全てが対象に存在するか**

オール・エレメント・ルール

II. 欧米での結晶多形・塩の特許の権利行使

2. 1 クレーム解釈

- ・ **均等侵害（US均等要件）**

- 1) FWRテスト**

機能、方法、結果の3要素が実質的に同一

- 2) 本質性テスト**

相違点が非本質的

- 3) 代替可能性**

機能、方法、結果が同一であり、要素の代替が可能

- 4) 置換自明性**

要素を置換することが自明

- 5) 禁反言**

特許性のためにクレーム減縮された部分ではない

II. 欧米での結晶多形・塩の特許の権利行使

2. 1 クレーム解釈

(v) セフチン事件

**Glaxo Group Limited V.
Ranbaxy Pharmaceuticals Inc.**
(Fed. Cir. No. 01-1151 2001年8月20日判決)

II. 欧米での結晶多形・塩の特許の権利行使

2. 1 クレーム解釈

Ceftin®に関連するGlaxo社の特許

セフロキシムアキセチルを有効成分として含む抗生物質

(1) 320特許

セフロキシムアキセチル

(2) 181特許

非晶質セフロキシムアキセチル

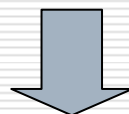
争点：Ranbaxy社のANDA申請が181特許を侵害するか否か

II. 欧米での結晶多形・塩の特許の権利行使

2.1 クレーム解釈

Ranbaxy社 結晶構造を10～15%含む、非晶質セフロキシムアキセチルについてANDA提出

⇒ Glaxo社 181特許の侵害訴訟提起



181特許クレームの "essentially free from crystalline material" の解釈が問題となる。

II. 欧米での結晶多形・塩の特許の権利行使

2. 1 クレーム解釈

判示:

181特許クレームの "essentially free from crystalline material" は、関連出願におけるGlaxo社の主張から、10%未満の結晶を含むと理解できる。また、181特許クレームの上記記載は、特許を受けるために減縮補正したものであり、当該補正要素について禁反言が生じ、均等論は適用されない。

Ranbaxy社はGlaxo社の181特許を侵害しない。

II. 欧米での結晶多形・塩の特許の権利行使

2. 2 権利の有効性

- **特許権の存続期間**
 - **存続期間の延長**
 - **特許無効**
-