

平成21年度
知的財産教育セミナー開催事業
大学生向け知的財産セミナー

医薬関連発明の特許について

弁理士 黒田 敏朗
特許業務法人原謙三国際特許事務所

目次

- 1) 医薬関連発明の特徴について
- 2) 最近の医薬関連発明における知財環境
- 3) 医薬関連発明の特許取得とその活用について

1) 医薬関連発明の特徴について

1) 医薬関連発明の特徴

医薬関連発明（医薬品、医療機器等）



国民の**生命・健康の維持**に直結

他の産業分野（自動車、薄型テレビ等）



国民の**より快適な生活**に貢献

1) 医薬関連発明の特徴

医薬関連発明（医薬品、医療機器等）

製品の基本特許は、**原則として1つ**であり、導入する場合には高額なライセンス料が発生する。

他の産業分野（自動車、薄型テレビ等）

自動車や家電などの場合、1製品当たり、**数百から数千の特許**が存在する。

1) 医薬関連発明の特徴

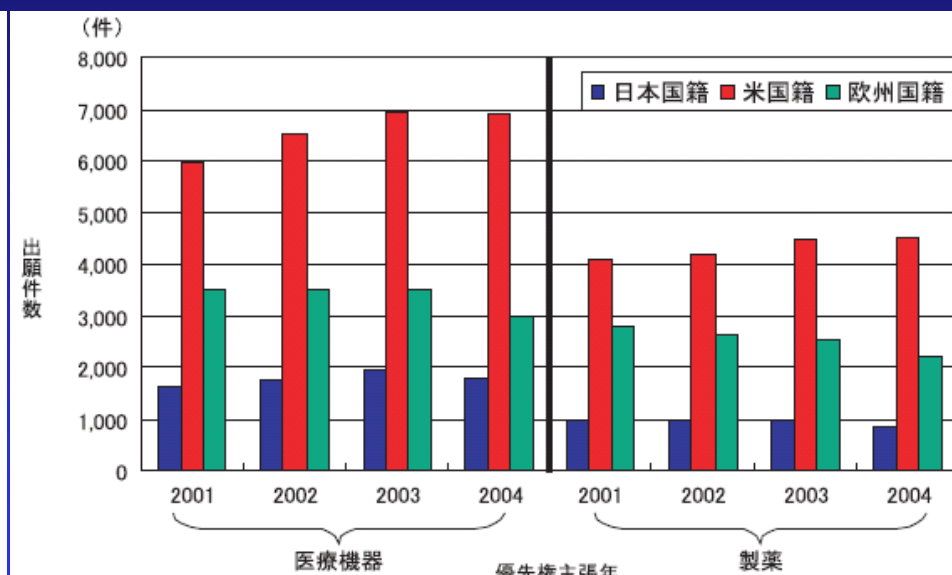
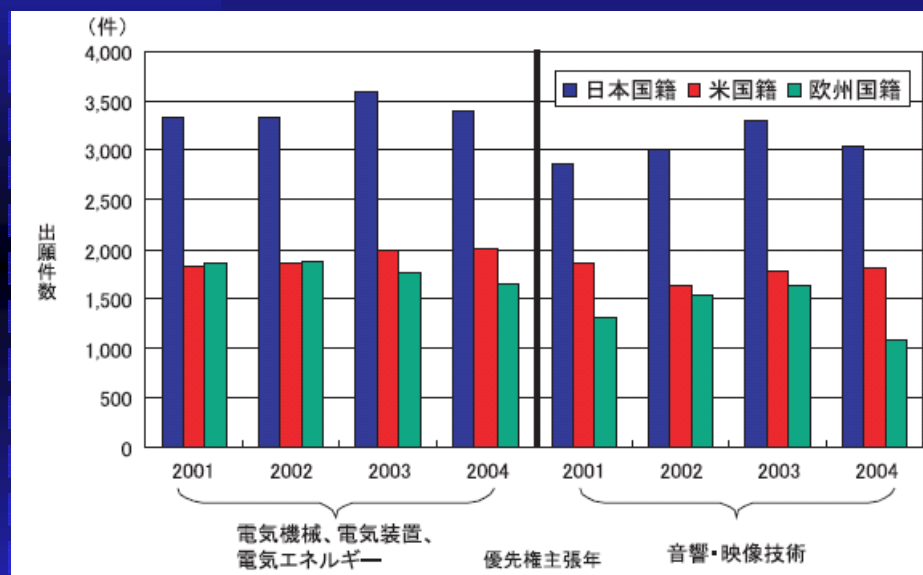
我が国の製薬産業の国際競争力

	企業名	医療用医薬品売上高	研究開発費	研究開発比率		企業名	医療用医薬品売上高	研究開発費	研究開発比率
1	ファイザー(米国)	44,619	8,089	16.64%	11	ブリストルMS(米国)	15,622	3,282	16.96%
2	グラクソ・スミスクライン(英)	38,466	6,654	14.65%	12	アムジェン(米国)	14,771	3,266	22.11%
3	サノフィ・アベンティス(仏)	34,120	6,125	16.17%	13	アボット(米国)	14,632	2,506	9.67%
4	ロシュ(スイス)	30,162	6,875	18.17%	14	バイエル(独)	13,861	-	-
5	アストラゼネカ(英)	29,559	5,162	17.46%	15	ジェネンテック(米国)	11,724	2,446	20.86%
6	ジョンソン&ジョンソン(米国)	24,868	7,680	12.57%	16	ベーリンガーインゲルハイム(独)	11,691	2,336	15.80%
7	メルク(米国)	24,198	4,883	20.18%	17	武田薬品(日本)	10,616	2,419	20.06%
8	ノバルティス(スイス)	24,025	6,430	16.89%	18	シエリングプラウ(米国)	10,173	2,926	23.06%
9	ワイス(米国)	18,622	3,257	14.54%	19	テバ(イスラエル)	8,847	581	6.18%
10	イーライリリー(米国)	17,639	3,487	18.71%					

(単位:百万ドル) 2007年度

1) 医薬関連発明の特徴

我が国の製薬産業の国際競争力



特許年次報告2009(特許庁)

1) 医薬関連発明の特徴

我が国の製薬産業の国際競争力

- (i) 国内市場の新薬は欧米製品が半分以上
- (ii) 日本企業の医薬品の研究開発費は、欧米企業に比べて1/3~1/4
- (iii) 日本企業の特許件数は、欧州企業に比べて約半分、米国企業の約1/4

 弱いといえる

1) 医薬関連発明の特徴

創薬の研究開発スキームと知的財産



1) 医薬関連発明の特徴

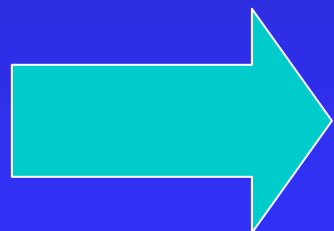
創薬の研究開発スキームと知的財産

(1) 研究開発期間が長い

(2) 研究開発費用が高い

(3) 一製品少数特許

※基本的には物質特許、その他の特許で延命



**グローバルに販売して投資回収
特許でグローバルに保護**

2) 最近の医薬関連発明 における知財環境

2) 最近の医薬関連発明における知財環境

医薬関連発明の保護に関する課題:

(1) 多額の開発コスト、研究開発のリスクが高い

- ・基礎研究:100万化合物 → 臨床試験:3化合物 → 申請:1化合物
- ・研究開発期間:10~20年
- ・コスト:150~1000億円(最近は、800億~1300億とも)

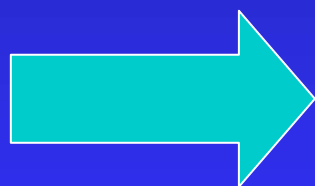
(2) 急速に発展する医療技術への保護

- ・技術の進歩に法的な保護が追いついていない

2) 最近の医薬関連発明における知財環境

医薬関連発明の保護に関する課題:

- (1) 多額の開発コスト、研究開発のリスクが高い
- (2) 急速に発展する医療技術への保護



医薬関連発明についての
保護対象を拡大すべき

(技術の進歩や産業界の要望を踏まえて継続的に見直していく)

2) 最近の医薬関連発明における知財環境

課題への対応: 保護対象の拡大

(1) 投与間隔・投与量等の治療の態様により特定される医薬

投与間隔・投与量等の治療の態様が異なり、かつ以下の(a)または(b)に該当する場合は、特許の対象

(a) 患者群が明確に異なる場合

(例: 特殊な遺伝子型を保有する患者に特に有効なことが明らかになった場合)

(b) 適用部位が異なる場合

(例: 特に適した適用部位が発見された場合)

2) 最近の医薬関連発明における知財環境

課題への対応: **保護対象の拡大**

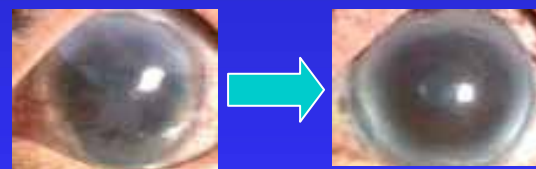
(2) 細胞等の生体由来材料の用途に特徴のある発明

細胞自体や培養細胞シート等の生体由来材料、およびその用途に特徴のある発明についても特許の対象

口腔粘膜上皮細胞
の培養シート



角膜の再生治療



食道ガン摘出後の
閉塞予防治療



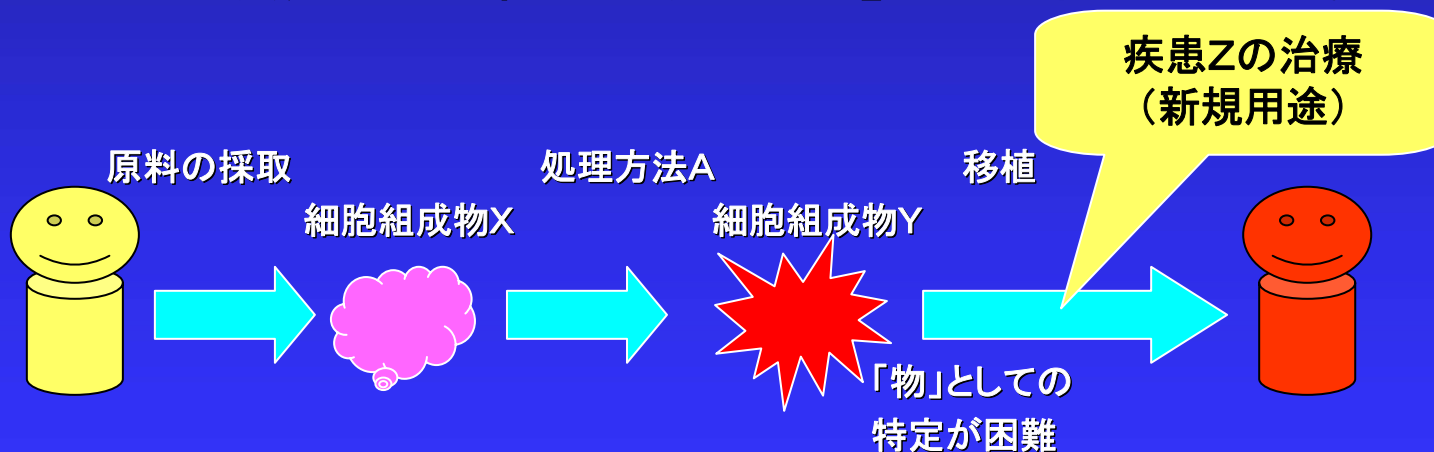
(先端医療分野における特許保護の在り方について(案) 知的財産戦略本部 先端医療特許検討委員会より抜粋)

2) 最近の医薬関連発明における知財環境

課題への対応: **保護対象の拡大**

(3) 細胞の特定の困難性がある発明

原料、処理方法及び用途が明確であり、かつ用途のみが新規である場合には、細胞が特定できていなくとも、「用途限定付の薬の生産方法」として特許の対象



(先端医療分野における特許保護の在り方について(案) 知的財産戦略本部 先端医療特許検討委員会より抜粋)

2) 最近の医薬関連発明における知財環境

課題への対応: **保護対象の拡大**

(3) 細胞の特定の困難性がある発明

「用途限定付の薬の生産方法」とは…?

例:「人間から採取した細胞組成物Xに処理方法Aを施して組成物を取得することからなる、該組成物を有効成分とする疾患Z治療剤の製造方法。」

※スイス・タイプ・クレームとして、欧州で使用されてきた発明特定形式

2) 最近の医薬関連発明における知財環境

課題への対応: 保護対象の拡大

(4) 細胞や薬剤の用法・用量に特徴のある発明 (案)

現在、我が国では先述した(1)以外の「時間、手順、投与量、移植場所等の薬剤や細胞の用法・用量に特徴のある発明」については、新規性がないとして特許対象外。

その一方で、医薬の用法・用量に特徴のある発明は、米国及び豪州においては治療方法の発明として特許対象。欧州では、特許対象となるか現在審議中。

(先端医療分野における特許保護の在り方について(案) 知的財産戦略本部 先端医療特許検討委員会より抜粋)

2) 最近の医薬関連発明における知財環境

課題への対応: **保護対象の拡大**

(4) 細胞や薬剤の用法・用量に特徴のある発明
(案)

(i) 医薬における「用法・用量」の重要性

事例: 骨粗鬆症治療薬(フォサマック)

下痢型過敏性腸症候群治療剤(イリボー)

感染症治療用抗生物質(キュビシン注)

(ii) 国民のニーズとインセンティブ付与の重要性

etc.

(先端医療分野における特許保護の在り方について(案) 知的財産戦略本部 先端医療特許検討委員会より抜粋)

2) 最近の医薬関連発明における知財環境

課題への対応: **保護対象の拡大**

(4) 細胞や薬剤の用法・用量に特徴のある発明
(案)

細胞や薬剤の用法・用量に特徴のある発明のうち、専門家の予測を超える効果を示す新用法・用量の医薬の発明を特許対象とする

(先端医療分野における特許保護の在り方について(案) 知的財産戦略本部 先端医療特許検討委員会より抜粋)

2) 最近の医薬関連発明における知財環境

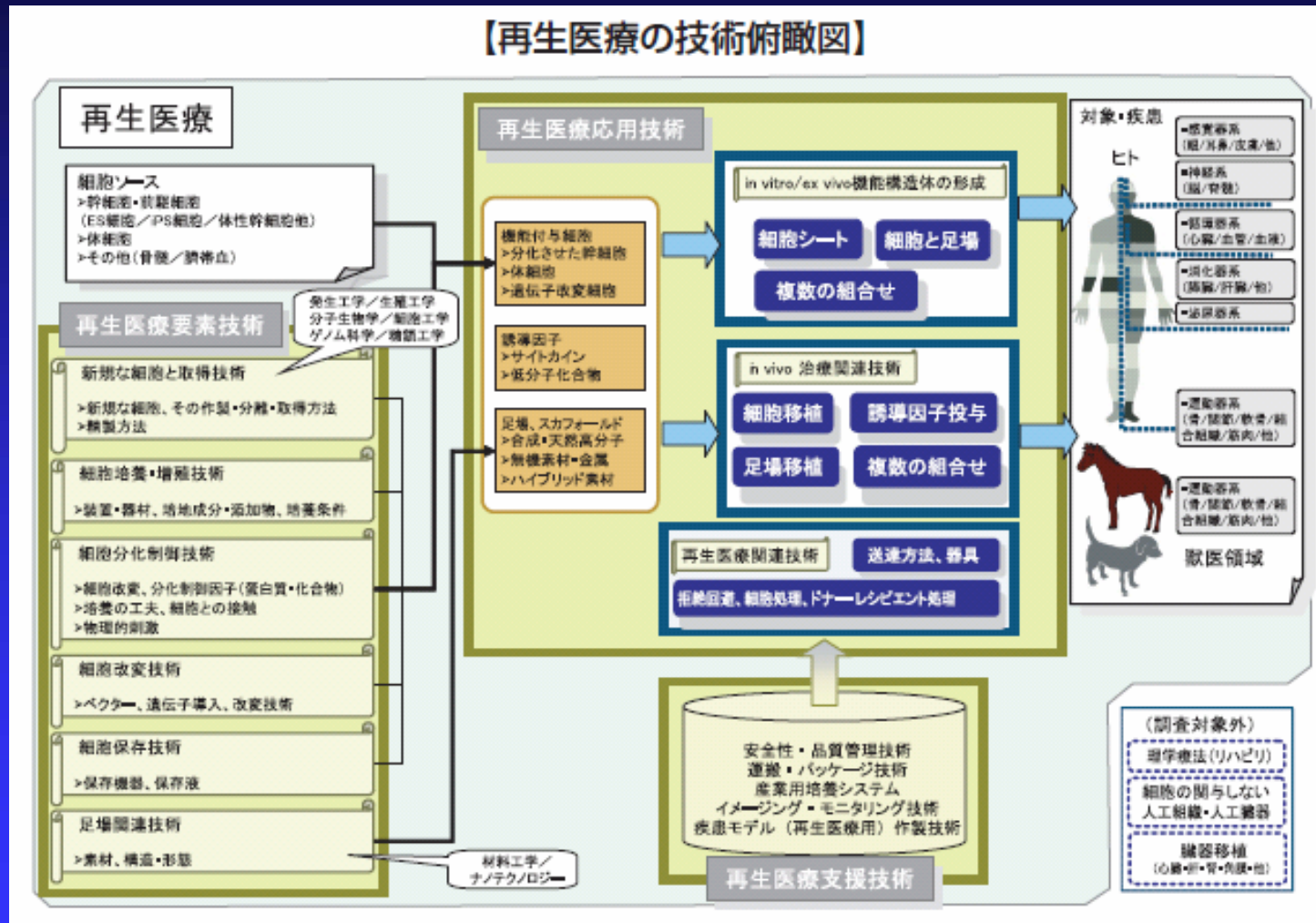
特定技術分野の動向:

再生医療

再生医療とは、疾病や事故により損傷あるいは機能不全を起こした組織・器官・臓器に対して、これらの形成を人為的に再現することにより、修復・再生を図り、機能を回復させる医療。再生医療に用いられる細胞には、近年注目されている、組織・器官・臓器を構成する全ての細胞に分化できる多能性幹細胞(ES細胞やiPS細胞)の他、体細胞などが含まれる。また、再生医療製品の例としては、培養表皮、培養皮膚、培養軟骨などがある。

(特許行政年次報告2009より抜粋)

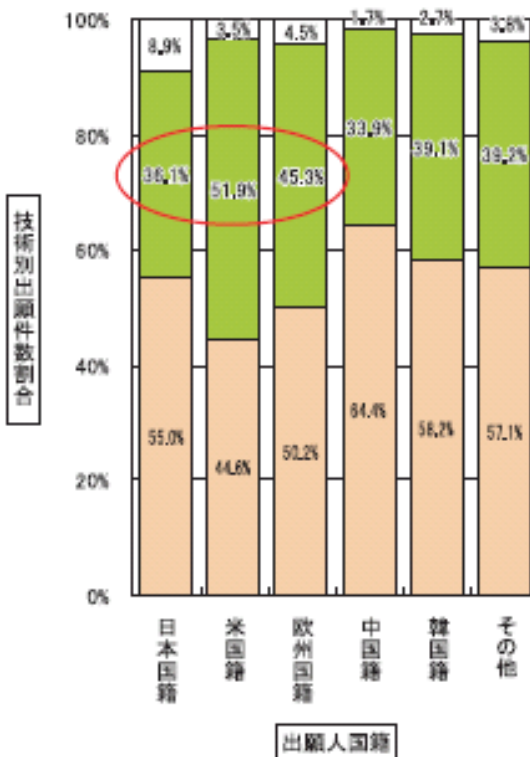
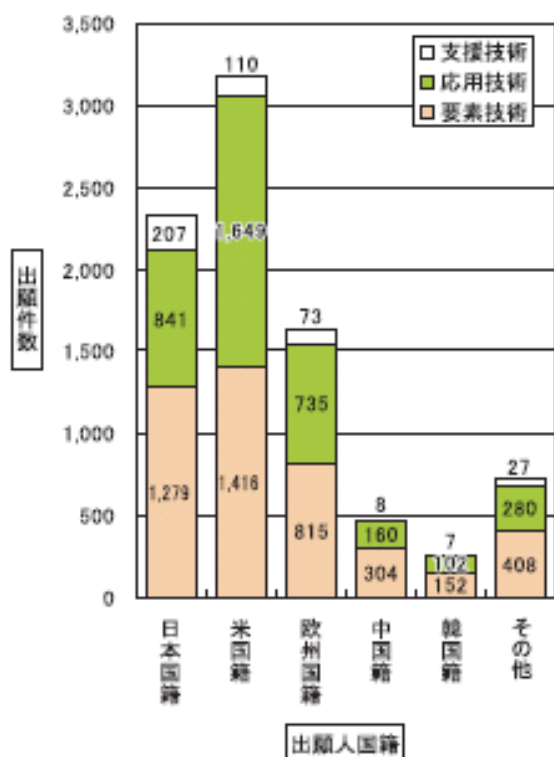
2) 最近の医薬関連発明における知財環境



(特許行政年次報告2009)

2) 最近の医薬関連発明における知財環境

【技術区分別－出願人国籍別出願件数とその比率（出願先：日米欧中韓、2002－2006年の出願）】



※要素技術：新規な細胞と取得技術、細胞培養・増殖技術、細胞分化制御技術、足場関連技術など

※応用技術：細胞シート、細胞移植などの治療関連技術、細胞治療のための器具など

※支援技術：運搬・パッケージ、安全性・品質管理、治療効果の解析・評価するためのシステムなど

(再生医療の技術俯瞰図を参照)

(特許行政年次報告2009)

2) 最近の医薬関連発明における知財環境

特定技術分野の動向:

再生医療

- ・米国籍が再生医療の研究開発では先行しており、特許出願・論文発表件数ともに米国の企業・大学・研究機関によるものが多数を占めている。
- ・日本国籍は特許出願、論文発表で米国籍に次ぐ出願・発表件数を有しており、十分な研究開発力を有しているが、応用分野への展開、再生医療関連企業数、治験実施数などが見劣りし産業化につながっていない。
- ・研究開発の担い手である大学・研究機関からの研究成果を応用分野へ展開し、知的財産として確保し、また、産業の担い手であるベンチャー企業の育成を進めるなど、今後、再生医療技術をいかに普及させ、産業化を促進させていくかが課題である。

(特許行政年次報告2009)

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

記載例 (原則として、薬効や対象疾患を明確に！)

例1: 有効成分Aを含有することを特徴とする疾患Z治療剤

例2: 有効成分Bを含有することを特徴とする疾患Y治療用組成物

例3: 有効成分Cと有効成分Dとを組み合わせたことを特徴とする
疾患W治療薬

例4: 有効成分Eからなる注射剤、有効成分Fからなる経口剤及び
補助成分Gからなる剤とからなる疾患V治療用キット

(特許審査基準より抜粋)

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

医薬発明に特有の注意事項:

i) 医薬用途を方法で記載することはできない

→治療方法や診断方法は産業上利用できない

ii) 薬理効果、有効量、投与方法、製剤化等の

記載が必須

→出願時点で必要(後提出不可)。薬理効果は臨床試験が原則。ただし、場合によっては動物実験やin vitro試験でも可

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

医薬発明の記載要件(実施可能要件)

薬理試験結果についての記載

→請求項に記載の医薬発明に薬理作用があるか否か

(i) どの化合物を、(ii) どのような薬理試験系において適用し、
(iii) どのような結果が得られたのか、(iv) データと医薬発明との
関連性について記載。

我が国では後で提出することは不可

米国では後出し可能。

欧州では一部後出し可能。

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

医薬発明の新規性判断

- i) 化合物又は化合物群に関して判断
→物質として新規かどうか
- ii) 特定疾病への適用に関して判断
→医薬用途について判断
物質が公知でも適用疾患が新規ならOK

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

医薬発明の新規性判断 (特許審査基準より抜粋)

医薬用途判断における注意事項

a) 公知の作用機序から医薬用途が導き出せるとき

例: (引例) 気管支拡張剤 → (本願発明) 喘息治療剤

(引例) 血管拡張剤 → (本願発明) 血圧降下剤

(引例) 冠血管拡張剤 → (本願発明) 狭心症治療剤

(引例) ヒスタミン遊離抑制剤 → (本願発明) 抗アレルギー剤

(引例) ヒスタミンH-2 受容体阻害剤 → (本願発明) 胃潰瘍治療剤

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

医薬発明の新規性判断 (特許審査基準より抜粋)

医薬用途判断における注意事項

b) 密接な薬理効果から必然的に生じるものであるとき

例: (引例) 強心剤 → (本願発明) 利尿剤
(引例) 消炎剤 → (本願発明) 鎮痛剤

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

医薬発明の新規性判断(特許審査基準より抜粋)

医薬用途判断における注意事項

c) 医薬用途の下位概念が公知であるとき

例: (引例)抗精神病剤 → (本願発明)中枢神経作用剤
(引例)肺癌治療剤 → (本願発明)抗癌剤

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

医薬発明の新規性判断 (特許審査基準より抜粋)

医薬用途判断における注意事項

- d) 公知の医薬用途の作用機序を発見したに過ぎないとき

例: (引例) 抗菌剤 → (本願発明) 細菌細胞膜形成阻止剤

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

医薬発明の新規性判断 (特許審査基準より抜粋)

医薬用途判断における注意事項

- e) 公知の薬剤と成分、用途が同じで、作用機序を限定したに過ぎないとき

例: (引用例) インドメタシンとトウガラシエキスを含む皮膚
消炎鎮痛剤



(本願発明) インドメタシン及び、トウガラシエキスからなるイン
ドメタシンの長期安定性改善剤を含む皮膚消炎鎮痛剤

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

医薬発明の新規性判断 (特許審査基準より抜粋)

iii) 投与間隔・投与量等の治療の態様

- 例 (1) 投与間隔・投与量等の治療の態様で、本願発明と引例とを明確に区別できるとき
- (2) 投与間隔・投与量等が特定された「～治療用キット」としたとき、本願発明と公知技術とが明確に区別できるとき

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

医薬発明の進歩性判断 (特許審査基準より抜粋)

i) 医薬用途と作用機序との関連

→本願発明と引用発明との間で医薬用途が異なっている場合、公知技術から作用機序の関連性を導き出せる場合

ii) 非ヒト動物用医薬からヒト用医薬への転用

→単なる転用であれば、原則進歩性なし

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

医薬発明の進歩性判断 (特許審査基準より抜粋)

iii) 2以上の医薬成分を組合せた医薬

→例えば

- ①主作用が同じ公知成分同士の組合せ
- ②副作用を有することが公知の主成分と、その副作用を減弱させることができる公知の副成分との組合せ
- ③主疾患から生じる種々の症状のそれぞれに治療効果を有することが公知の成分の組合せ

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

医薬発明の進歩性判断 (特許審査基準より抜粋)

iii) 2以上の医薬成分を組合せた医薬
ただし、



前記①～③に該当する場合でも、組合せが新規で、その組合せにより、顕著な効果ある場合は進歩性有。

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

医薬発明の進歩性判断 (特許審査基準より抜粋)

iv) 投与間隔・投与量等の治療の態様

→ 医薬の使用態様を好適化するのは当業者であれば当然
よって、投与間隔・投与量等の治療の態様の差異により、
顕著な効果がなければ進歩性なし

逆に言えば、顕著な効果があれば進歩性あり

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

〔事例1〕(特許審査基準より抜粋)

特許請求の範囲

【請求項1】化合物Aと化合物Bとを組み合わせる癌治療薬。

【請求項2】化合物Aが静脈及び皮下からなる群より選択される投与経路により、化合物Bが経口による投与経路により、毎日又は毎週3回の割合で、それぞれ10～50mg/kg、1～30 mg/kg の量にて投与されることを特徴とする、請求項1に記載の癌治療薬。

発明の詳細な説明の概要

本発明では、化合物Aと化合物Bを組み合わせる用いることにより、相乗的な抗癌効果が奏されることを見出した。また、化合物Aと化合物Bは両者が混合された配合剤の状態、あるいは両者を混合しないキットの状態で使用することが可能であること、及び、化合物Aと化合物Bとは同時にまたは一定の間隔をおいて服用することにより相乗的な抗癌作用が奏されることが示されている。実施例において、相乗的な抗癌効果が奏されることを示す薬理試験結果が記載されている。

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

〔事例1〕続き (特許審査基準より抜粋)

先行技術調査の結果

化合物Aと化合物Bが、それぞれ抗癌効果を奏することは公知であるが、化合物Aと化合物Bを組み合わせて用いた抗癌剤はいずれの先行技術文献にも記載されておらず、その示唆もない。また、出願時の技術水準からは、上記両成分を組み合わせて用いることにより相乗的な抗癌効果が奏されることは予測できない。

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

〔事例2〕(特許審査基準より抜粋)

特許請求の範囲

【請求項1】化合物Aと化合物Bとを含有する糖尿病治療用組成物。

発明の詳細な説明の概要

本発明では、化合物Aと化合物Bを組み合わせて用いることにより、従来、化合物Aを単独で用いた場合に生じていた、体重増加等の副作用を低減することを見出した。

実施例において、副作用が低減されることを示す薬理試験結果が記載されている。

先行技術調査の結果

化合物Aと化合物Bを、それぞれ糖尿病治療薬として用いることは公知であるが、化合物Aと化合物Bを組み合わせて用いた糖尿病治療用医薬組成物はいずれの先行技術文献にも記載されていない。また、出願時の技術水準からは、化合物Aと化合物Bを組み合わせて用いることにより体重増加等の副作用が低減されることは予測できない。

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

〔事例3〕(特許審査基準より抜粋)

特許請求の範囲

【請求項1】食物繊維1～30gに対してYY菌 $1 \times 10^6 \sim 1 \times 10^8$ 個の割合で含有することを特徴とする液状整腸剤。

発明の詳細な説明の概要

本発明では、共に整腸作用を有する食物繊維とYY菌を組み合わせ、整腸作用を増強させた整腸剤を作製した。また、明細書には、この組合せを有する整腸剤を用いた場合の薬理試験結果が示されている。しかし、相乗効果については何ら具体的に主張されていない。

先行技術調査の結果

食物繊維を1～30g服用した場合やYY菌を $1 \times 10^6 \sim 1 \times 10^8$ 個服用した場合に整腸作用を有することは公知である。また、整腸作用を有する細菌の体内活性を維持し、整腸作用を増強させるために、当該細菌と食物繊維を共存させることは公知である。

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

〔事例3〕続き(特許審査基準より抜粋)

拒絶理由の概要

整腸作用を有する細菌の体内活性を維持し、整腸作用を増強させるために、当該細菌と食物繊維を共存させることが公知であるから、整腸作用を有するYY菌を、同じく整腸作用を有する食物繊維と組み合わせて1つの整腸剤とすることは当業者が容易になし得たことである。また、その際に服用しやすさなどから液状製剤とすることも当業者が適宜なし得ることである。そして、その効果も格別なものとする事はできない。

拒絶理由に対する対処

通常、上記拒絶理由を解消することはできない。なお、相乗効果について具体的に記載されていない場合、明細書又は図面の記載から当業者がその引用発明と比較した有利な効果を推論できるときには、出願人が、意見書等において実験結果を示して主張・立証した効果が参酌される。

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

〔事例4〕(特許審査基準より抜粋)

特許請求の範囲

【請求項1】パクリタキセルと、パクリタキセル投与により生じる嘔吐を抑えるために効果的な量の化合物Xとを組み合わせるパクリタキセル応答性腫瘍用治療剤。

発明の詳細な説明の概要

本発明では、パクリタキセルと化合物Xとを併用することにより、パクリタキセル投与時に生じる副作用である嘔吐を抑えながら、パクリタキセル応答性の腫瘍を治療できることを見出した。

先行技術調査の結果

パクリタキセルは優れた抗腫瘍剤であるが、投与時に副作用として嘔吐が生じることが公知である。一方、化合物Xは一般に嘔吐を減弱させることがよく知られている。

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

〔事例4〕続き(特許審査基準より抜粋)

拒絶理由の概要

パクリタキセルと、パクリタキセル投与による副作用である嘔吐を減弱させる副成分とを併用することが知られており、また、一般に嘔吐を減弱させる成分として化合物Xはよく知られているから、パクリタキセル投与による副作用である嘔吐を減弱させるために、化合物Xを組み合わせ使用することは、当業者が容易になし得ることである。また、そうすることにより、予想外に格別な効果も奏されていない。

拒絶理由に対する対処

通常、上記拒絶理由を解消することはできない。

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

〔事例5〕(特許審査基準より抜粋)

特許請求の範囲

【請求項1】ジクロフェナクまたはその塩類とアセトアミノフェンの合計量に対して、カフェインとビタミンB1活性型誘導体が、それぞれ1～100重量%および0.2～20重量%配合されてなる、配合消炎鎮痛剤。

発明の詳細な説明の概要

本発明では、ジクロフェナクまたはその塩類とアセトアミノフェンを組み合わせてなる配合消炎鎮痛剤において、カフェインとビタミンB1活性型誘導体を配合することにより、鎮痛作用試験における疼痛閾値を上昇させ、かつ作用持続時間を延長することができることが示された。

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

〔事例5〕続き(特許審査基準より抜粋)

先行技術調査の結果

ジクロフェナクまたはその塩類とアセトアミノフェンの組合せからなる配合消炎鎮痛剤は公知であり、また、一般に、これらの非ステロイド系消炎鎮痛薬においては、一定量以上増量しても、鎮痛効果は増加せず、副作用のみ増加する、いわゆる天井効果があることも知られている。非ステロイド系消炎鎮痛薬にカフェインとビタミンB1活性型誘導体を加えることにより、鎮痛作用試験において疼痛閾値を本願発明と同程度に上昇させることができ、作用持続時間についても本願発明と同程度に延長することができることは公知である。

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

〔事例5〕続き(特許審査基準より抜粋)

拒絶理由の概要

ジクロフェナクまたはその塩類とアセトアミノフェンの組合せからなる非ステロイド系消炎鎮痛薬が公知であり、非ステロイド系消炎鎮痛薬にカフェインとビタミンB1活性型誘導体を加えることにより、鎮痛作用試験において疼痛閾値を上昇させることができ、作用持続時間を延長することができることが知られている。これらより、ジクロフェナクまたはその塩類とアセトアミノフェンの組合せからなる非ステロイド系消炎鎮痛薬の作用を増大させるために、カフェインとビタミンB1活性型誘導体を組み合わせることは当業者が容易に想到し得たことであり、かつ、配合成分の配合量の範囲は当業者が実験的に最適化することができたものであると認められる。そして、その効果も格別なものとすることはできない。

拒絶理由に対する対処

通常、上記拒絶理由を解消することはできない。

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

〔事例6〕(特許審査基準より抜粋)

特許請求の範囲

【請求項1】抗HIV薬アジドチミジン(AZT)と、ペニシリンとの組合せからなることを特徴とするエイズ治療剤。

発明の詳細な説明の概要

本発明では、HIV感染後に発症するエイズを治療するために、抗HIV薬AZTとエイズの一態様として生じる肺炎の治療に有効なペニシリンを組み合わせ、エイズ治療に有効な効果が奏されることが示された。しかし、相乗効果については何ら具体的に主張されていない。

先行技術調査の結果

アジドチミジン(AZT)がエイズ治療薬として使用できることは公知である。また、エイズの一態様として肺炎が生じることも公知である。

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

〔事例6〕続き(特許審査基準より抜粋)

拒絶理由の概要

アジドチミジン(AZT)がエイズ治療薬として有用であることが知られており、エイズの一態様として肺炎を生じやすいことも知られている。また、ペニシリンをはじめとするペニシリン系抗生物質を用いて、肺炎を治療することもよく行われている。したがって、エイズ患者を治療する際に、エイズの原因となるHIV感染を抑制しつつ、エイズの一態様として生じる肺炎をも治療することを目的として、抗HIV薬AZTとペニシリンを組み合わせて使用しようとすることは、当業者が通常発揮し得る創作能力に過ぎない。また、両者を併用することにより、予想外に格別の効果は奏されていない。

拒絶理由に対する対処

通常、上記拒絶理由を解消することはできない。なお、相乗効果について具体的に記載されていない場合でも、明細書又は図面の記載から当業者がその引用発明と比較した有利な効果を推論できるときには、出願人が、意見書等において実験結果を示して主張・立証した効果が参酌される。

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

〔事例7〕(特許審査基準より抜粋)

特許請求の範囲

【請求項1】化合物Aを有効成分とするアルツハイマー病治療薬。

発明の詳細な説明の概要

本発明では、抗菌剤の有効成分として知られていた化合物Aが、アセチルコリンエステラーゼを可逆的に阻害して、アセチルコリンの分解を抑制することを見出した。実施例において、化合物Aを有効成分とするアルツハイマー病治療薬が、優れたアセチルコリンエステラーゼ阻害活性を有すること、及び、アルツハイマー病の症状を軽減させたことを示す薬理試験結果が示されている。

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

〔事例7〕続き (特許審査基準より抜粋)

先行技術調査の結果

化合物Aは、抗菌剤の有効成分として既に知られた化合物であるが、化合物Aを有効成分とするアルツハイマー病治療薬はいずれの先行技術文献にも記載されていない。また、化合物Aとアセチルコリンエステラーゼ阻害活性を有する化合物との間に構造類似性が存在すること、及び、化合物Aが抗菌剤として作用する際のメカニズムとアルツハイマー病の治療との関係については、いずれの先行技術文献においても明らかにされておらず、示唆もない。

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

〔事例8〕(特許審査基準より抜粋)

特許請求の範囲

【請求項1】初回に5.0mg/kg～10.0mg/kg の量で投与し、その後一回当たり0.3mg/kg～0.5mg/kg の量で隔日投与されることを特徴とする、 α 型の遺伝子型を有する患者を治療するための、化合物Aを含有するC型肝炎治療薬。

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

〔事例8〕続き(特許審査基準より抜粋)

発明の詳細な説明の概要

化合物Aは、C型肝炎ウイルスの増殖作用を示すヒトの酵素Zの発現を血中濃度に依存して抑制することから、C型肝炎の治療に効果を示すことが知られていたが、化合物Aの血中濃度を急激に上昇させると呼吸困難等の症状を示すことも知られていたため、化合物AをC型肝炎患者に対しC型肝炎治療薬として使用する場合には、ヒトの酵素Zの発現を抑制でき、かつ、呼吸困難等の症状を発生させないよう、一回当たり0.3mg/kg～0.5mg/kgという低用量での週一回投与により血中濃度を上昇させ、この投与形態で一定のC型肝炎治療作用を示すことが確認されていた。

一方、出願人は、特殊な遺伝子型である α 型の遺伝子型を有するC型肝炎患者では他の患者に比べて酵素Zの発現量が十倍以上高く、従来の投与間隔・投与量による場合はある程度のC型肝炎治療作用を示すものの、他の患者に投与した場合よりもその作用は弱いこと、及び、化合物Aを種々の用量で用いた場合でも呼吸困難等の症状がほとんど発生しないことをはじめて確認した。

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

〔事例8〕続き(特許審査基準より抜粋)

発明の詳細な説明の概要(続き)

本発明では α 型の遺伝子型を有するC型肝炎患者の有する特徴に着目して、効果的なC型肝炎治療作用を示す化合物Aの投与量及び投与間隔を検討したところ、当該C型肝炎患者に対し初回に化合物Aを5.0mg/kg～10.0mg/kgという高用量で投与しても、他の患者のように呼吸困難等の症状を生じることはなく、また、その後0.3mg/kg～0.5mg/kgの量で隔日投与とすることで、化合物Aの血中濃度を治療効果を有する一定幅の高濃度で維持することが可能であり、このような投与間隔・投与量の下では α 型の遺伝子型を有するC型肝炎患者においても酵素Zの発現を効果的に抑制できることから、従来の投与間隔・投与量で α 型の遺伝子型を有するC型肝炎患者や他のC型肝炎患者に投与した場合と比較して、C型肝炎ウイルスの増殖が効果的に抑制され、顕著なC型肝炎治療作用を示すことが薬理試験結果とともに示されている。

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

〔事例8〕続き (特許審査基準より抜粋)

先行技術調査の結果

C型肝炎ウイルスの増殖作用を示すヒトの酵素Zの発現抑制作用を有する化合物Aを、C型肝炎治療薬として一回当たり0.3mg/kg～0.5mg/kgの量にて週一回投与という投与間隔・投与量で用いることは公知であるが、 α 型の遺伝子型を有するC型肝炎患者の存在はいずれの先行技術文献にも記載されておらず、その示唆もない。また、 α 型の遺伝子型を有するC型肝炎患者に対し化合物Aを高用量で用いても呼吸困難等の症状を示さないことやC型肝炎ウイルスの増殖が効果的に抑制され顕著なC型肝炎治療作用を示すことについては、出願時の技術水準からは予測できない。

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

〔事例9〕(特許審査基準より抜粋)

特許請求の範囲

【請求項1】化合物Z又はその製剤学的に認容性の塩を、1投与単位あたり550mg～650mg含有するように製剤化したことを特徴とする経口用免疫増強剤。

【請求項2】製剤化した経口用免疫増強剤が錠剤の形態である、請求項1に記載の経口用免疫増強剤。

発明の詳細な説明の概要

本発明では、免疫増強剤である化合物Zの経口投与時における体内吸収速度を高めて、治療効果を向上させるために、化合物Zの1投与単位あたりの含有量を特定の範囲で製剤化することが示されている。明細書の薬理試験結果においては、化合物Zの含有量が550mg、600mg、650mgの錠剤である場合についてのみ、経口投与時の体内吸収速度が高まり顕著な免疫増強作用を示すことが具体的に裏付けられている。

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

I. 医薬発明の特許の取得

〔事例9〕続き(特許審査基準より抜粋)

先行技術調査の結果

化合物Zを免疫増強剤として錠剤の形態により使用することが公知であり、その1回の投与量は10 mg～30mg であり、それは投与方法や症状などにより決定されることが知られている。しかし、出願時の技術水準からは、本発明のように製剤化された免疫増強剤を経口投与した場合に、体内吸収速度が高まり顕著な免疫増強作用が示されることは予測できない。

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

II. 医薬発明の特許の活用

後発医薬品と特許

後発医薬品:

特許権が消滅した新薬について、特許権者以外の医薬品メーカー(いわゆる後発医薬品メーカー)が製造販売する医薬品であって、新薬と同じ有効成分を含んだ医薬品。近年「ジェネリック医薬品」とも呼ばれる。

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

II. 医薬発明の特許の活用

後発医薬品と特許

後発医薬品は、新薬と治療学的に同等なものであるとして製造販売が承認され、一般的に、開発費用が安く抑えられることから、新薬に比べて薬価が安く設定される。しかし、我が国では、後発医薬品の数量シェアは16.9%（平成18年度）に過ぎず、欧米諸国と比較してそれほど普及が進んでいない。

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

II. 医薬発明の特許の活用

後発医薬品と特許(米国)

・Hatch-Waxman法

後発医薬品が新薬と生物学的に同等であることを示すデータを添付してFDAに簡略型医薬品申請(ANDA)可能

・米国特許法271条(e)項(1)(Bolar条項)

後発医薬品メーカーが特許権存続期間中に上記データを取得する行為は、特許権侵害行為から除外

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

II. 医薬発明の特許の活用

後発医薬品と特許(米国)

・ paragraph IVの証明

新薬に係る特許権が無効であるか、または自らの後発医薬品の製造等行為が特許権を侵害しないことの証明を行うことにより、特許権消滅前においても適法に後発医薬品を製造販売可能
さらに、最初にANDAを申請した者には、後発医薬品販売において180日間の市場の独占が認められる

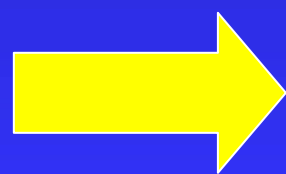
3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

II. 医薬発明の特許の活用

後発医薬品と特許(米国)

- ・米国特許法271条(e)項(2)

新薬の特許権者は、ANDAの申請者を相手として
合衆国連邦地裁に特許侵害訴訟を提訴可能



後発医薬品メーカーと新薬メーカー
との間で訴訟合戦

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

II. 医薬発明の特許の活用

後発医薬品と特許(米国)

- ・ 武田薬品工業とAlphapharm社らの2型糖尿病治療薬の後発品を巡る特許訴訟(アクトス事件)
- ・ 塩野義製薬が高コレステロール血症治療薬のANDAを行ったCobalt Pharmaceuticals社を含む後発品メーカー7社を相手取った特許訴訟(クレストール事件)
- ・ エーザイとTeva社とのアルツハイマー型認知症治療剤のアセチルコリンエステラーゼ阻害剤の後発医薬品を巡る特許訴訟(アリセプト事件)

など多数

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

II. 医薬発明の特許の活用

後発医薬品と特許(日本)

・特許法69条1項

後発医薬品メーカーが、新薬の特許権存続期間満了後に販売することを目的として、薬事承認に必要な情報を提出するために必要な範囲において特許権存続期間中に特許発明を実施する行為は、『にいう試験又は研究のためにする特許発明の実施』に当たり、特許権の効力は及ばないとされている。

(最高裁平成11年4月16日第二小法廷判決一瞬臓疾患治療剤事件)

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

II. 医薬発明の特許の活用

後発医薬品と特許(日本)

我が国には、米国における「paragraph IVの証明」のような特許権の存続期間中に「適法」に後発医薬品を販売することを認める明示の規定はない。

ただし、後発医薬品メーカーが新薬を購入した後にこれを破砕・精製・再結晶化を行い後発医薬品として販売する行為は、当該有効成分が変化していないことを前提として消尽論により適法に認められ得る。

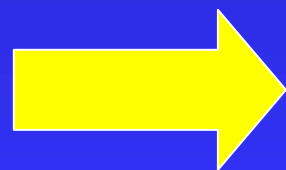
(東京高裁平成13年11月29日判決ーアシクロビル事件)

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

II. 医薬発明の特許の活用

後発医薬品と特許(日本)

新薬メーカーが新薬の形態・成分・構造の一部を変更し、後続特許を出願・登録することで、医薬品の独占期間を延長する戦略(いわゆるエバーグリーン戦略)。



我が国でも後発医薬品メーカーと
新薬メーカーとの間で特許等の
知財を巡る訴訟が頻発

3) 医薬関連発明の特許取得 とその活用について

II. 医薬発明の特許の活用

後発医薬品と特許(日本)

- ・ ファモチジン事件(「リヒターゲテオン v. ジェネリックメーカー16社」東京高裁平成15(ネ)3034 2004.04.28判決)
- ・ ニカルジピン事件(「山之内製薬 v. 大正製薬」大阪高裁平成14(ネ)1567 2003.02.18判決)
- ・ セフジニル事件(「アステラス v. 大洋薬品」知財高裁平成19(ネ)10034 2007.09.10判決、2007.12.27上告棄却)
- ・ セルベックスカプセル事件(「エーザイ v. 大洋薬品」平成18年(ネ)第10009号不正競争行為差止等請求控訴事件)
- ・ クラビット事件(「第一三共 v. 沢井製薬等ジェネリックメーカー13社」、2008.12.24、特許無効の審決取消訴訟を知財高裁へ提訴 継続中)

本日はありがとうございました

ご質問などございましたら、
お気軽にご連絡ください。

特許業務法人

原謙三国際特許事務所

〒530-0041

大阪市北区天神橋2丁目北2番6号

大和南森町ビル

電話: 06-6351-4384

FAX: 06-6351-5664

E-mail: kenzopat@mars.dti.ne.jp

URL: <http://www.harakenzo.com>