

# 結晶多形に関わる 特許実務における知識

特許業務法人 原謙三国際特許事務所

弁理士 青野 直樹

# 結晶多形・塩の特許取得

結晶多形：同じ化学組成をもつ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り、別の結晶形を示すもの

すでに物質そのものが公知であっても、

( i ) 結晶形が新規であり、

( ii ) 当該物質に比して有利な性質を有する場合には、結晶多形の発明として**権利取得可能**

# 結晶多形・塩の特許取得

結晶多形の特許取得により

- ・ 実施品そのものの**直接的保護**
- ・ 物質特許の特許出願後、そ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。

# 結晶多形・塩の特許取得

物質特許（基本特許）の権利消滅後に、結晶特許に基づき侵害訴訟を提起した事例。

## （１）セフジニル結晶事件

平成19年（ネ）第10034号 特許権侵害差止請求控訴事件  
知財高裁 平成19年9月10日判決

## （２）フロモックス事件

（平成22年6月17日現在 係争中）

平成21年（ワ）第2208号 特許権侵害差止等請求事件  
大阪地裁 平成22年4月15日判決

# 結晶多形・塩の特許取得

## (1) セフジニル結晶事件（結晶特許が有効に働いた例）

- アステラス製薬社（A社）が呼吸器感染症などに有効な「セフジニル」の物質特許および結晶特許を保有。  
物質特許の権利存続期間は、2003年9月まで  
結晶特許の権利存続期間は、2008年8月まで
- セフジニルの物質特許消滅後（2005年）、大洋薬品社がセフジニルを有効成分とする後発医薬品を製造・販売。
- A社が結晶特許に基づいて権利侵害訴訟を東京地裁に提起。地裁は**権利侵害を認定**。  
知財高裁、最高裁は、それぞれ控訴、上告を棄却。

# 結晶多形・塩の特許取得

## (2) フロモックス事件（結晶特許が有効でなかった例）

- 塩野義製薬社が咽頭・喉頭炎等の感染症に有効なセフカペンピボキシル塩酸塩の物質特許および結晶特許を保有（製品名：フロモックス）。  
物質特許の権利存続期間は、2008年10月まで  
結晶特許の権利存続期間は、2011年 3月まで
- 伊藤忠ケミカルフロンティア社が物質特許の消滅後（2009年）、「フロモックス」の後発医薬品を販売。
- 塩野義製薬社が結晶特許に基づいて権利侵害訴訟を大阪地裁に提起。地裁は権利を侵害していないとして原告の請求を棄却。原告は控訴。

# 特許請求の範囲の記載

# 特許請求の範囲の記載

特許法第70条第1項

「…特許発明の技術的範囲は、願書に添付した特許請求の範囲の記載に基づいて定めなければならない。」

特許法第36条第5項

「特許請求の範囲には、…各請求項ごとに特許出願人が特許を受けようとする発明を特定するために必要と認める事項のすべてを記載しなければならない。…」

# 特許請求の範囲の記載

原則：公知の化合物との違いを請求項で  
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、性質または特性による特定  
*ex)* 赤外線スペクトル、個体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

# 特許請求の範囲の記載

特許法第70条第1項

「…特許発明の技術的範囲は、願書に添付した特許請求の範囲の記載に基づいて定めなければならない。」

特許法第36条第5項

「特許請求の範囲には、…各請求項ごとに特許出願人が特許を受けようとする発明を特定するために必要と認める事項のすべてを記載しなければならない。…」

請求項に記載した発明特定事項の全てが含まれていなければ、侵害ではない！

⇒どの構成によって発明を特定するかを検討。

# 特許請求の範囲の記載

## フロモックス事件

平成21年（ワ）第2208号 特許権侵害差止等請求事件  
大阪地裁 平成22年4月15日判決 （知財高裁にて係争中）

争点：発明とは関係のないことが明らかである構成が含まれている場合に、その構成は発明の認定に必要なか。

# 特許請求の範囲の記載

## フロモックス事件

特許第2960790号

### 【請求項1】

下表のX線回折像を示す $\beta$ -[(Z)-2-(2-アミノ-4-チアゾリル)-2-ペンテノイルアミノ]-3-カルバモイルオキシメチル-3-セフェム-4-カルボン酸ピバロイルオキシメチルエステル塩酸塩（以下、単に本件エステル）一水和物の結晶。

【表1】

2 $\theta$	強度						
8.38	189	19.82	745	25.02	332	33.90	203
9.56	227	20.08	608	25.78	421	35.28	159
10.34	141	20.48	226	27.18	409	36.56	178
11.72	252	21.26	251	28.52	174	37.64	122
13.56	242	21.80	278	29.22	231	39.54	301
17.38	250	22.66	350	29.48	210	46.02	322
18.90	372	23.64	125	32.74	144		
19.32	488	24.06	319	33.22	101		

# 特許請求の範囲の記載

## フロモックス事件

### 問題点

表1の30のピークには、結晶由来ではない白金ホルダー由来の2つのピークが含まれていた。

2 $\theta$	強度						
8.38	189	19.82	745	25.02	332	33.90	203
9.56	227	20.08	608	25.78	421	35.28	159
10.34	141	20.48	226	27.18	409	36.56	178
11.72	252	21.26	251	28.52	174	37.64	122
13.56	242	21.80	278	29.22	231	39.54	301
17.38	250	22.66	350	29.48	210	46.02	322
18.90	372	23.64	125	32.74	144		
19.32	488	24.06	319	33.22	101		

# 特許請求の範囲の記載

## フロモックス事件

「物質のX線回折像中には、強度や形状の異なる多くのピークが存在するところ、…当該物質を特許出願するにあたり、個々のピークをクレームするか、何個のピークをクレームするか、どの回折角をクレームするか、強度までクレームするか、数値を記載するか、数値に幅を持たせるかなどは、**出願人の判断に委ねられている**ものである。…出願人である原告は、…X線回折像そのものではなく、それを形成する**30のピーク（回折角と強度）を個別に特定して、特許請求の範囲を示すために必要な要素と判断して抽出し、これが最終的に特許請求の範囲として登録されるに至ったのである。**

したがって、…「下表のX線回折像を示す」とは、結局、本件発明のX線回折像の中に、本件【表1】の**30のピークが全て存在**することを意味すると解される。」

# 特許請求の範囲の記載

## フロモックス事件

「…以上の事実を総合すれば、本件2ピークは、…白金ホルダーピークであると考えるのが合理的である。

…出願時において要件とした事項であっても、後に、実際には不要であったことが判明することは、一般に生じ得る事態であるが、**特許請求の範囲の記載を前提とする第三者の行為は、このような出願人の調査不足や不注意によって規制されるべきではない。**」

「…特許権侵害の有無は客観的に判断されるべきものであって、第三者の認識により左右されるべきものではない。」

**必要不可欠な事項のみの記載となっているか検討。**

# 結晶多形・塩の特許取得

## 特許取得の際の問題点

- 物質特許（基本特許）の実施例にすでに記載されていると認定されやすい（新規性欠如）
- 物質特許の明細書に開示された内容から、当業者であれば容易に発明することができる（進歩性欠如）
- 引例に記載されている化合物が必ずしも明確ではない。

# 明細書の記載

## ～新規性～

# 結晶多形・塩の新規性

## 審査基準第Ⅱ部第2章

「機能・特性等により表現された発明特定事項以外の発明特定事項が共通しており、しかも当該機能・特性等により表現された発明特定事項の有する課題若しくは有利な効果と同一又は類似の課題若しくは効果を引用発明が有しており、引用発明の機能・特性等が請求項に係る発明の機能・特性等に含まれる蓋然性が高い場合」には、拒絶理由を通知する。

同一の結晶体でなくても、審査基準上、新規性違反が通知され得る。

# 結晶多形・塩の新規性

特許第4177883号

## 【請求項1】

CuK $\alpha$ 1X線（波長=1.5406オングストローム）を用いて得られる2 $\theta$ 角で14.0、18.9、21.3、21.9及び25.7度（ $\pm 0.1$ 度）で表されるピークを含む粉末X線回折パターンを有する、4-〔5-（4-フルオロフェニル）-3-（トリフルオロメチル）-1H-ピラゾール-1-イル〕-ベンゼンスルホンアミド（以下、ベンゼンスルホンアミドA）の形態Iの結晶形。

# 結晶多形・塩の新規性

特許第4177883号の審査段階で通知された拒絶理由

「引用文献1には、4-スルホンアミドフェニルヒドラジン塩酸塩と4, 4, 4-トリフルオロメチルー1-(4-フルオロフェニル)-ブタン-1, 3-ジオンを無水エタノール中で反応させ、これに水を添加して、ベンゼンスルホンアミドAの結晶を得ることが記載されている。

引用文献1には、上記結晶の粉末X線回折パターンは記載されていないが、上記製造方法、特にエタノールに溶解されたベンゼンスルホンアミドAに水を添加して結晶を得ていることからみて、上記結晶は、本願請求項1に規定する粉末X線回折パターンを有するものと認められる。」

# 結晶多形・塩の新規性

## 拒絶理由通知に対する対応

引用文献1の方法により結晶を製造し、得られた結晶のX線回折パターンと本願発明のパターンとが明確に異なることを示して、引用文献1に記載された発明でないことを立証。

引用文献に基づいて、自身の発明を製造することができるかを検討。

# 結晶多形・塩の新規性

## セフジニル結晶事件

平成19年（ネ）第10034号 特許権侵害差止請求控訴事件  
知財高裁 平成19年9月10日判決

アステラス製薬社が呼吸器感染症などに有効な「セフジニル」の物質特許（先願）および結晶特許（先願公開後に出願）を保有。

争点：後願のセフジニル結晶が、先願のセフジニル物質特許の明細書に記載されていたか。

# 結晶多形・塩の新規性

セフジニル結晶事件

引用実施例（先願特許）の記載

「20%アセトン水溶液による溶出画分を集め、**減圧濃縮し**、10%塩酸によりpH2.0に調整する。生成する沈澱を濾取、真空乾燥して、…」  
（どのように減圧濃縮したかの記載がない）

## 問題点

原告、被告ともに、引用実施例を忠実に再現できなかった（引用実施例におけるピークを示すセフジニルを得ることができなかった）。

# 結晶多形・塩の新規性

## セフジニル結晶事件

「そもそも、引用実施例 16 の記載に基づいて同実施例記載の…セフジニルを得ることができないとするならば、引用実施例 16 は引用発明として適格性を欠くというべきであって、これをもって本件特許発明に新規性がないと判断する理由とはなり得ない。」

「上記実施例においては、当業者において容易に実施し得る程度にセフジニルの A 型結晶の製造方法が開示されているとはいえない。そうすると、本件特許発明は、…引用実施例 16 の記載内容から容易に実施することができるとはいえず、…」

# 結晶多形・塩の新規性

## 結晶性アジスロマイシン事件

平成19年（行ケ）第10120号 審決取消請求事件  
知財高裁 平成20年4月21日判決

争点：アジスロマイシン2水和物が、引用例  
に開示されていたか。

# 結晶多形・塩の新規性

## 結晶性アジスロマイシン事件

「当該物が、例えば新規の化学物質である場合には、新規の化学物質は、一般に製造方法その他の入手方法を見出すことが困難であることが少なくないから、刊行物にその技術的思想が開示されているというために、製造方法を理解し得る程度の記載があることを要することもあるといわなければならない」

「ところで、…（引用文献に）結晶Aがアジスロマイシン2水和物であることについて明示的な記載がなく、また、…結晶学的データからも結晶Aがアジスロマイシン2水和物であることが特定されないとしても、…優先権主張日当時における当業者の技術常識ないし技術水準に基づいて、（引用文献の）結晶Aの製造方法に関する記載から実際に結晶Aを製造することが可能であり…その結晶Aが現時点における客観的な資料に基づき、アジスロマイシン2水和物と認められるのであれば、（引用文献は）…優先権主張日当時において、…製造方法によりアジスロマイシン2水和物という物そのものを特定していたということが出来る」

# 明細書の記載

## ～進歩性～

# 結晶多形・塩の進歩性

…当業者が、引用発明に基づいて、**通常の創作能力を発揮することにより**、請求項に係る発明に容易に想到できたことを意味する。

## 有利な効果の参酌

引用発明に基づき本願発明のようなモチリン誘導体を製造することは当業者が容易になし得ることであるとみることも可能である。しかしながら、本願モチリンが引用発明モチリンと同質の効果を有するものであったとしても、それが**極めて優れた効果を有しており、当時の技術水準から予測される範囲を超えた顕著なもの**であれば、進歩性があるものとして特許を付与することができるかと解するのが相当である。

# 結晶多形・塩の進歩性

## 典型的な拒絶理由例

「医薬の分野では、溶解性や安定性等において最適な物理化学的性質を示す結晶形を選定するために、**溶媒や晶出条件等の結晶化工程を種々検討し、最適化することは当業者によく知られた技術的事項であるから、…**」

「…さらに、本願明細書の記載を検討しても、本願発明における結晶形の化合物Aが**当業者の予測を超える有用性や顕著な効果**を奏するものであるとも認められない。」

# 結晶多形・塩の進歩性

## フロモックス事件

平成21年（ワ）第2208号 特許権侵害差止等請求事件

大阪地裁 平成22年4月15日判決

物質特許の権利消滅後に、結晶特許に基づき侵害訴訟を提起した例。

争点：後願のエステル結晶が、先願の物質特許の明細書から容易に発明することができたか（進歩性）。

# 結晶多形・塩の進歩性

フロモックス事件

引用実施例（先願特許）

本件エステル塩酸塩の製造方法が記載されている。  
結晶性残渣が生じることが記載されている。

「医薬品の分野において、『結晶性』との知見が得られれば、当業者であれば、当然に結晶化（再結晶）を試みるといえ、結晶化についての動機付けは存在する。」

「メタノールと水の混合溶液は、混合溶媒の代表的なものである。」

# 結晶多形・塩の進歩性

## メチルモルホリンの多形結晶事件

平成18年（行ケ）第10271号 審決取消請求事件  
知財高裁 平成19年7月4日判決

争点：後願の多形結晶が、先願の結晶特許の明細書から容易に発明することができたか（進歩性）。

# 結晶多形・塩の進歩性

## メチルモルホリンの多形結晶事件

### 【請求項1】

化合物 2-(R)-(1-(R)-(3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル)エトキシ)-3-(S)-(4-フルオロ)フェニル-4-(3-(5-オキソ-1H,4H-1,2,4-トリアゾロ)メチルモルホリン)の多形結晶であって、12.0, 15.3, 16.6, 17.0, 17.6, 19.4, 20.0, 21.9, 23.6, 23.8及び24.8° (2シータ)に主要な反射を有するX線粉末回折パターンを特徴とする、I形と称される多形結晶。

### 〔引用発明〕

2-(R)-(1-(R)-(3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル)エトキシ)-3-(S)-(4-フルオロ)フェニル-4-(3-(5-オキソ-1H,4H-1,2,4-トリアゾロ)メチルモルホリン)の結晶。

※赤色部分は共通で化合物名

# 結晶多形・塩の進歩性

## メチルモルホリンの多形結晶事件

原告（特許権者）の主張

- ・ 引用例の結晶が多形結晶であることは知られていない。
- ・ 多形結晶を得るにあたって、どのような溶媒を使えばよいか、どのような温度範囲で再結晶化を行えばよいかは、全く予測性がない。
- ・ I型結晶とII型結晶の溶解度比である1.4は無視することができない。

# 結晶多形・塩の進歩性

## メチルモルホリンの多形結晶事件

「医薬化合物である引用発明において、結晶多形の存在を検討することは、通常、行う程度のことであっただけでなく、引用例に示唆されている再結晶化の際の溶媒の種類等も考慮すると、本願のⅠ型結晶は、結晶多形の存在を検討するに当たって、当業者がごく普通に試みるような方法、条件によって、得ることができるものであり…」

「Ⅰ型結晶とⅡ型結晶においては、溶解度が異なり、本件明細書に記載された条件においては、溶解度比が1.4であることが認められる。しかし、…結晶多形において、相互の溶解度が異なることは、予想外のものではなく、…結晶多形において、溶解度が異なることが、直ちに、予想外の顕著な効果を奏するものであると認めることはできない。」

# 結晶多形・塩の進歩性

メチルモルホリンの多形結晶事件

しかしながら、US、EPでは対応する出願が特許許可されている。

- US6096742
- EP0994867

結晶多形に関して、日米欧で進歩性の判断が異なっている。

# 結晶多形・塩の進歩性

他の事例

特許第4308263号

【請求項1】（出願時）

結晶質の1- {[( $\alpha$ -イソブタノイルオキシエトキシ)カルボニル]アミノメチル} -1-シクロヘキサン酢酸（以下、シクロヘキサン酢酸A）。

## 拒絶理由

「刊行物1には、シクロヘキサン酢酸Aが記載されている。そして、…一般に常温で固体の化合物であれば、酢酸エチル、ヘプタン等の溶媒を適宜選択して、晶析を行うことにより、その化合物を結晶化させることは当業者が通常行うことであるから、…このような晶析操作を行ってその結晶形を得ることは、当業者が容易になし得たことである。また、…結晶形にすることにより、格別優れた効果を有しているとは認められない。」

# 結晶多形・塩の進歩性

他の事例

特許第4308263号

一般的な結晶化条件では結晶化できないことを、実験して証明。

⇒結晶化には、一般的には行われない特別な工程が必要であることを示す。

一般的には行われない特別な工程があれば、その点を明細書に十分に記載しておく。

# 明細書の記載 ～実施可能要件～

# 結晶多形・塩特許の実施可能要件

特許法第36条第4項第1号

「発明の詳細な説明は、その発明の属する技術の分野における通常の知識を有する者が**その実施をすることができる程度に明確かつ十分に、記載…**」

審査基準

「『その（発明の）実施をすることができる』とは、請求項に記載の発明が物の発明にあっては**その物を作ることができ**、かつ、その物が使用できることであり、…」

# 結晶多形・塩特許の実施可能要件

審査基準 実施可能要件違反の類型

「請求項中の発明を特定するための事項に対応する技術的手段が・・・単に抽象的、機能的に記載してあるだけで、それを具現すべき材料、装置、工程（条件）などが不明瞭であり、しかもそれらが出願時の技術常識に基づいても当業者が理解できないため、当業者が請求項に係る発明の実施をすることができない場合」

# 結晶多形・塩特許の実施可能要件

## 結晶ラクチュロース三水和物事件

平成17年（行ケ）第10205号 審決取消訴訟事件  
知財高裁 平成18年2月16日判決

争点：材料の取得方法の記載は必要か。

# 結晶多形・塩特許の実施可能要件

結晶ラクチュロース三水和物事件

## 【請求項1】

$C_{12}H_{22}O_{11} \cdot 3H_2O$ の分子式を有する結晶ラクチュロース三水和物。

## 〔発明の詳細な説明〕

実施例1～3として、ラクチュロース三水和物を種晶としてラクチュロース三水和物を製造する方法が具体的に記載

しかし種晶とするラクチュロース三水和物の製造方法について記載がない

# 結晶多形・塩特許の実施可能要件

## 結晶ラクチュロース三水和物事件

「実施例として、ラクチュロース三水和物を種晶としてラクチュロース三水和物を製造する方法が具体的に記載されているから、種晶となるべきラクチュロース三水和物を製造することができれば、当業者は、これを用いて実施例に記載された手法によりラクチュロース三水和物を製造することができ、本件発明を容易に実施することができる」と認められる。しかし、**種晶となるべきラクチュロース三水和物をどのようにして製造するのかについて、具体的な記載は存在しない**」

**出発原料が入手困難であって、その取得方法が明確でない場合には、製造方法の記載があっても実施可能要件を満たしているとは言えない。**

# 権利の有効性

# 結晶多形・塩特許の権利の有効性

## 塩酸ニカルピジン事件

平成14年（ネ）第1567号 損害賠償請求控訴事件  
大阪高裁 平成15年2月18日判決

争点：請求項において濃度の言及がない場合に、別の結晶形を含んでいてもよいか。

# 結晶多形・塩特許の権利の有効性

塩酸ニカルギピン事件

## 〔塩酸ニカルギピンの特許〕

### 1. 結晶塩酸ニカルギピンの特許

(昭和48年4月17日出願)

### 2. 無定形塩酸ニカルギピンの特許

(昭和55年3月22日出願)

無定形塩酸ニカルギピンは腸管粘膜からの吸収性に富み優れた持続性効果を有する。

# 結晶多形・塩特許の権利の有効性

## 塩酸ニカルピジン事件

特許第1272484号(無定形塩酸ニカルジピンの特許)

### 【請求項1】

無定形2, 6 - ジメチル - 4 - (3' - ニトロフェニル) - 1, 4 - ジヒドロピリジン - 3, 5 - ジカルボン酸 - 3 - メチルエステル - 5 -  $\beta$  - (N - ベンジル - N - メチルアミノ) エチルエステル (ニカルジピン) またはその塩を含有することを特徴とするニカルジピン含有持続性製剤用組成物。

非権利者は、製剤中の無定形塩酸ニカルジピンの含有量が、製剤中における全塩酸ニカルジピンの20%程度である製剤を製造、販売。

本特許の明細書には、製剤の全塩酸ニカルジピン中にどの程度の無定形物が含有されている必要があるのかについての記載はない。

# 結晶多形・塩特許の権利の有効性

塩酸ニカルピジン事件

「本件発明が塩酸ニカルピジンにつき無定形のを100%含む場合に限定することを明示又は示唆するような記載は見当たらない。」

「製剤中の無定形塩酸ニカルピジンの含有量が極微量で本件発明の作用効果を生じないことが明らかであるような場合を除いて、当該製剤は本件発明の技術的範囲に含まれ…」

出願人側： **不必要な効果の記載は避ける。**

# 結晶多形・塩特許の権利の有効性

非権利者側：効果の検討。

「医薬の発明の分野においては、特許発明の構成要件の全部を有しながら、当該特許発明の作用効果を奏せず、従前開示されていない別途の作用効果を奏するものがあり、このようなものは、当該特許発明の技術的範囲に属しない新規なものといえる。」

(参考：平成13年(ネ)第3840号 大阪高裁)

# 結晶多形・塩特許の権利の有効性

## 結晶ファモチジン事件

平成15年（ネ）第3034号 特許権侵害差止請求控訴事件  
知財高裁 平成16年4月28日判決

争点：請求項において特定の結晶形に限定している場合に、別の結晶形を含んでいてもよいか。

# 結晶多形・塩特許の権利の有効性

結晶ファモチジン事件

特許第2708715号

## 【請求項1】

その融解吸熱最大がDSCで159℃にあり、その赤外スペクトルにおける特性吸収帯が3506, 3103及び777  $\text{cm}^{-1}$ にあり、及びその融点が159～162℃であることを特徴とする、再結晶により析出された形態学的に均質な「B」型のファモチジン。

非権利者は、約15%以下の「A」型のファモチジンが混在する再結晶により析出された形態学的に均質な「B」型のファモチジンを原薬とする「H<sub>2</sub>受容体拮抗剤」を製造、販売。

# 結晶多形・塩特許の権利の有効性

結晶ファモチジン事件

出願人は、明細書の記載によれば、出願時に、ファモチジンには、「A」型のファモチジン、「B」型のファモチジンおよび両者の混合物が存在することを認識していた。

出願人は、ファモチジンの混合物が記載された文献を引用して進歩性を否定した拒絶理由の通知に対して、「B」型ファモチジンの純品を得ることの有効性を主張した。

# 結晶多形・塩特許の権利の有効性

結晶ファモチジン事件

「発明の詳細な説明の記載及び出願経過を参酌して解釈すれば、本件明細書の特許請求の範囲【請求項1】の「『B』型のファモチジン」との記載は、ファモチジンには、A型ファモチジン、B型ファモチジン及び両者の混合物が存在することを前提とした上で、特定の結晶形である「『B』型のファモチジン」に限定したものであることが明らかであるから、A型とB型の混合物を排除する意味を有するものというべきである。」

# 結晶多形・塩特許の権利の有効性

## アシクロビル事件

平成13年（ネ）第959号 損害賠償請求控訴事件  
東京高裁 平成13年11月29日判決

争点： 特許権が消尽しているか。

# 結晶多形・塩特許の権利の有効性

アシクロビル事件

消尽論 最高裁平成9年7月1日判決

「特許権者等が、我が国の国内において、当該特許発明の実施対象を用いた製品である特許製品を譲渡したときは、その特許製品については、**特許権はその目的を達成したものとして消尽**し、その実施対象が実施対象としての**同一性の範囲にとどまる限り**、**当該特許権の効力は**、その特許製品を業として使用等する行為には**及ばない**」

# 結晶多形・塩特許の権利の有効性

アシクロビル事件

## 本事件概要

- ・ 被告（非権利者）は、特許権延長期間中に、原告（特許権者）製剤を購入。
- ・ 錠剤から一体不可分な賦形剤等を分離して有効成分であるアシクロビルを抽出。
- ・ 抽出したアシクロビルを用いて、原告製剤と大きさ、重量、成分等が異なる製剤を製造・販売。

## 問題点

- ・ 特許権は、アシクロビルの物質特許のみ。
- ・ アシクロビル含有製剤についての特許はない。

# 結晶多形・塩特許の権利の有効性

## アシクロビル事件

「特許製品を適法に購入した者といえども、特許製品を構成する部品や市場で新たに購入した第三者製造の部品等を利用して、**新たに別個の実施対象を生産**するものと評価される行為をすれば、特許権を侵害することになるのは当然というべき」

しかし、「（被告人の行為は）原告製剤の崩壊、アシクロビル粗固体の精製、再結晶行為を行っているだけであり、**被告製剤に含まれるアシクロビルは、原告製剤に含まれていたアシクロビルそのもの**であって、アシクロビルについて何らかの化学反応が生じたり、何らかの化学反応によりアシクロビルが新たに生成されたりしたわけではないのであるから、…本件特許発明の実施対象であるアシクロビルを新たに生産したものと評価することはできない」

**「アシクロビルを含有する医薬組成物」等の特許があれば、権利行使が可能であったと推定される。**

# 医薬発明における 審査基準の改訂

# 医薬発明における審査基準の改訂

- 平成21年11月～  
改訂審査基準運用開始

特許・実用新案審査基準

第Ⅱ部 特許要件

- ・産業上利用することができる発明

第Ⅶ部 特定技術分野の審査基準

第3章 医薬発明

# 医薬発明における審査基準の改訂

## 改訂前

医薬発明とは、「第Ⅱ部第2章 新規性・進歩性」において定義された用途発明のうち、医薬分野に属する「物の発明」を意味する。

## 改訂後

医薬発明とは、ある物（注1）の未知の属性の発見に基づき、当該物の新たな**医薬用途**（注2）を提供しようとする「物の発明」である。

# 医薬発明における審査基準の改訂

(注1) 「物」とは有効成分として用いられるものを意味し、化合物、細胞、組織、及び天然物からの抽出物・・それらを組み合わせたもの。

(注2) 「医薬用途」とは、(1) 特定の疾病への適用、又は、(2) 投与時間・投与手順・投与量・投与部位等の用法又は用量が特定された、特定の疾病への適用を意味する。

# 医薬発明における審査基準の改訂

## 改訂前

請求項に係る発明と引用発明とが、投与間隔・投与量等の治療の態様の点で相違する場合には、化合物の属性に基づき特定の疾病に適用するという医薬用途が相違すると認められる場合は、請求項に係る医薬発明は新規性を有し得る。

## 改訂後

化合物が相違せず、かつ適用する疾病において相違しない場合であっても、その化合物の属性に基づき、特定の用法又は用量で特定の疾病に適用するという医薬用途において相違する場合には、請求項に係る医薬発明の新規性は否定されない。

# 医薬発明における審査基準の改訂

- 基本特許（物質特許）の権利期間満了後も、後発医薬品に対して権利行使が可能となる。
- 結晶特許の発明が、物質特許に基づいて新規性・進歩性が否定された場合に、用法、用量等で差別化を図ることができ、権利化できる。

# 医薬発明の改訂審査基準 事例

## 【請求項1】

30~40  $\mu\text{g}/\text{kg}$ 体重の化合物Aが、ヒトに対して3ヶ月あたり1回経口投与されるように用いられることを特徴とする、化合物Aを含有する喘息治療薬。

## 発明の詳細な説明

30~40  $\mu\text{g}/\text{kg}$ 体重の化合物Aを1回経口投与するたびに、喘息症状が少なくとも3ヶ月にわたり軽減されたこと、副作用Bの発現がほとんど認められなかったことが薬理試験結果として記載。

## 先行技術調査の結果

1  $\mu\text{g}/\text{kg}$ 体重の化合物Aを毎日経口投与することで、喘息の症状が軽減されること、その場合に副作用Bが高頻度で発現することは公知。

## 拒絶理由

化合物Aを1回経口投与することにより、喘息症状が少なくとも3ヶ月にわたり軽減され、さらに、副作用Bの発現率が有意に低減することは、技術水準から予測される範囲を超えた顕著な効果。

# 医薬発明の改訂審査基準 事例

## 【請求項1】

1回あたり400~450  $\mu\text{g}/\text{kg}$ 体重の化合物Aが、ヒトに対して1日1回経口投与されるように用いられることを特徴とする、化合物Aを含有する鎮咳薬。

## 発明の詳細な説明

1回あたり160  $\mu\text{g}/\text{kg}$ 体重の化合物Aを1日3回経口投与するよりも、鎮咳効果が向上することを示す薬理試験結果が記載。また、1日あたりの投与回数が減少するため、服薬コンプライアンスが向上することも記載。

## 先行技術調査の結果

1回あたり160  $\mu\text{g}/\text{kg}$ 体重の化合物Aを1日3回経口投与することで、鎮咳効果が得られることは公知。

## 拒絶理由

本願の発明の詳細な説明に記載されている鎮咳効果や服薬コンプライアンスの向上の程度は、**出願時の技術水準から予測可能な範囲内**。