

医薬特許について

一般財団法人工業所有権協力センター

小柳 正之 (24 期 1981 年卒)

1. はじめに

最近、抗アミロイドβプロトフィブリル抗体を有効成分とする医薬品が初期のアルツハイマー病の画期的な治療薬となることが期待されるとの報道が度々なされています。これまで有力な治療薬がなかったアルツハイマー病に対して、ようやく一筋の明るい光が射されたものであり、患者及びその家族の方々に大きな希望を与えるものだと思います。また、日本をはじめとして高齢化がすすむ社会に対して、大きな貢献があると期待されます。

この例でも言えることですが、医薬品の開発には、長い研究開発期間と多額の研究開発費がかかるため、その研究開発費を回収し、将来の医薬品の開発に研究開発費を投資するというサイクルを回していくことができる仕組みが必要であり、特許制度はその仕組みの一つといえます。特許権によって、医薬品(医薬品)を適切に保護することにより、このサイクルを回していく駆動力が与えられ、新たな医薬品が開発され、これまで効果的な治療薬のなかった疾病の治療が可能となるというような正のスパイラルを構築していくことが理想です。

2. 特許として保護される医薬品

それでは、どのような医薬品(医薬品)が特許として保護されるのでしょうか？

特許庁の審査基準によれば、医薬品は、ある物の未知の属性の発見に基づき、当該物の新たな医薬用途を提供しようとする「物の発明」と定義することができるかとされています。

ここでいう「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のような化学構造が特定されていない化学物質(又は化学物質群)、並びに、それらを組み合わせたものが含まれます。

また、上記の定義における「医薬用途」とは、以下の①又は②を意味します。

①特定の疾病への適用

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

例えば、①の医薬品発明の例としては、化学物質 X に降圧作用があることを発見し、「有効成分 X を含有することを特徴とする高血圧治療剤」として提供するものがあげられます。

また、②の医薬品発明の例としては、従来から疾患 Z の治療薬として知られていたが、用法・用量は $\bigcirc \mu\text{g}/\text{kg}$ 体重、1日 \bullet 回として用いられていたものを、「用法・用量を $\Delta \mu\text{g}/\text{kg}$ 体重、1日 Δ 回に変更して用いるもの」として提供するものがあげられます。

3. 特許出願のための申請書類(願書、明細書、特許請求の範囲等)の作成

医薬品発明を特許で保護するためには、特許出願のための申請書類(願書、明細書、特許請求の範囲等)を作成し、特許庁に申請する必要があります。そして、申請書類の記載内容が、特許法等に則り、作成されている必要があります。

特許庁では、審査基準や審査ハンドブックを作成し、特許の審査がどのように行われるかを一般に公表しています。以下の URL をご参照ください。

<https://www.jpo.go.jp/system/laws/rule/guideline/patent/index.html>

したがって、審査基準や審査ハンドブックを参考にしながら、申請書類を作成することにより、より効果的に特許を取得することが可能となります。

特許法では、明細書(の発明の詳細な説明)及び特許請求の範囲の記載要件を規定しています。これらの記載要件のうち、審査官から指摘されることが多いものとして、発明の詳細な説明の記載要件としては実施可能要件があり、特許請求の範囲の記載要件としては、サポート要件、明確性要件があります。

(1) 実施可能要件

特許法第36条第4項第1号は、明細書が技術文

献としての役割を果たすために必要な事項を規定しています。同号のうち、「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(以下、「当業者」といいます)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したものであること」を実施可能要件といえます。

医薬発明は、一般に物の構造や名称からその物をどのように作り、どのように使用するかを理解することが比較的困難な技術分野に属する発明といえます。そのため、申請書類の作成に当たっては、出願時の技術常識から、化合物等を製造又は取得することができ、かつ、医薬用途を裏付ける一つ以上の代表的な実施例を記載することが必要です。そして、医薬用途を裏付ける実施例として、通常、薬理試験結果の記載が求められます。

薬理試験結果は、医薬発明における化合物等に薬理作用があることを確認するためのものです。したがって、①どの化合物等を、②どのような薬理試験系において適用し、③どのような結果が得られたのかに加え、④その薬理試験系が医薬発明の医薬用途とどのような関連性があるのか、の全てが明らかにされなくてはなりません。

通常は、化合物等の構造・名称だけから特定の医薬用途に使用し得るかどうかを予測することは困難です。そのため、当初の明細書に有効量、投与方法、製剤化方法が記載されていても、薬理試験結果の記載がない場合には、化合物等が実際にその医薬用途に使用し得るかどうかにについて予測することは困難であるとして、通常、審査官から拒絶理由が通知されます。

また、当初の明細書に記載されている薬理試験系に用いられた化合物等が、具体的にどの化合物等を用いるのが特定されていない場合は、医薬発明における化合物等に薬理作用があることが確認できないとして、審査官から拒絶理由が通知されることが多いと思います。

審査官からの拒絶理由に対し、意見書、実験成績証明書等を提出し、反論、釈明ができます。ただし、当初の明細書の記載が不足していると、実験成績証明書を提出しても、拒絶理由は解消しないこともあるので、当初の明細書の記載が重要となります。

○実施可能要件に関する仮想事例
(医薬発明)

「10～100 μ g/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を有効成分として含有する喘息治療薬」

(説明)

本事例では、1日1回投与とされていた喘息治療薬について、投与間隔を3ヶ月とした場合にも同程度の用量で薬効が持続すると予測することは困難であるという技術常識に基づき、100 μ g/kg 体重(当初の明細書には具体的な実施例として記載されている)よりも少ない用量(例えば、10 μ g/kg 体重。ただし、当初の明細書には具体的な実施例として記載されていない)で、3ヶ月あたり1回経口投与した場合の有効性に疑義が生じていました。一方、医薬の有効成分については、投与量が10倍程度異なる場合であっても、治療効果が全く期待できないものでもないというのもまた技術常識であり、10～100 μ g/kg 体重の用量における治療薬としての有効性も認めるところでした。

これらの技術常識のうち、いずれが妥当かを判断するにあたり、出願人が、後者の技術常識を示しつつ、実験成績証明書を提出することにより、後者の技術常識の妥当性が裏付けられたため、実施可能要件を満たしていると考えられる例です。ただし、当初の明細書に上限値に対応する 100 μ g/kg 体重の実施例等が記載されていない場合は、上記主張は認められず、実施可能要件を満たされないと判断される可能性が高いことに留意してください。(2) サポート要件

特許法第36条第6項第1号は、(特許請求の範囲の)請求項に記載された発明が(明細書の)発明の詳細な説明に記載した範囲を超えるものであってはならない旨を規定しています。これは、発明の詳細な説明に記載していない発明を特許請求の範囲に記載することになれば、公開されていない発明について権利が発生することになるからであり、同号の要件(サポート要件)は、これを防止するためのものです。

請求項に記載された発明が、「発明の課題が解決できることを当業者が認識できるように記載された範囲」を超えていると判断される場合には、特許請求の範囲の記載はサポート要件を満たしていないと判断されます。

ここで留意すべき点は、(特許請求の範囲の)請

求項は、発明の詳細な説明に記載された一つ又は複数の具体例に対して拡張ないし一般化した記載とすることができるということです。ただし、発明の詳細な説明に記載した範囲を超えないものとして拡張ないし一般化できる程度は、各技術分野の特性により異なりますので、注意が必要です。

○サポート要件に関する仮想事例

請求項に、R 受容体活性化化合物の発明が包括的に記載されている事例を考えてみます。この事例の発明の詳細な説明には、具体例として、新規な R 受容体活性化化合物 X、Y、Z の3つの化学構造及び製造方法が記載されているのみであり、出願時の技術常識に照らしても、請求項に記載された発明の範囲まで、発明の詳細な説明において開示された内容を拡張ないし一般化できるとはいえないとして、サポート要件を満たしていないと判断されます。

(3) 明確性要件

特許法第36条第6項第2号は、特許請求の範囲の記載について、特許を受けようとする発明が明確でなければならないこと(明確性要件)を規定しています。特許請求の範囲の記載は、これに基づいて新規性、進歩性等が判断され、これに基づいて特許発明の技術的範囲が定められるという点において、重要な意義を有するものであり、一の請求項から発明が明確に把握されることが必要です。

請求項に記載された発明が明確に把握されるためには、ある具体的な物や方法が請求項に記載された発明の範囲に入るか否かを当業者が理解できるように記載されていることが必要です。

○明確性要件に関する仮想事例

明細書に、「R 受容体」は出願人が初めて発見したものであることが記載されている事例を考えてみます。この事例における出願時の技術常識は、この新たに見いだされた受容体を活性化する作用のみで規定された化合物が具体的にどのようなものであるかを理解することは困難というものでした。したがって、このような技術常識を考慮すると、上記作用を有するために必要な化学構造等が何ら規定されず、上記作用のみで規定された「化合物」は、技術的に十分に特定されていないことが明らかであり、明細書の記載を考慮しても、請求項の記載から発明を明確に把握することができないと判断されます。

4. 特許要件

そして、医薬発明が特許として認められるためには、これまで説明をしてきた記載要件に加えて、産業上の利用可能性、新規性、及び、進歩性の特許要件を満たす必要があります。以下、3つの要件を簡単にみていきます。

(1) 産業上の利用可能性

特許法第29条第1項柱書は、特許を受けようとする発明は、産業上利用できる発明でなければならないことを規定しています。ここで、特許法上、「人間を手術、治療又は診断する方法の発明」は産業上の利用可能性の要件を満たさないとされていますが、医薬発明は、上記2. の定義のとおり、「方法の発明」ではなく、「物の発明」です。したがって、「人間を手術、治療又は診断する方法の発明」には該当せず、「産業上利用できる発明」に該当します。

(2) 新規性

次に、新規性については、医薬発明は、上記2. のとおり定義されることから、医薬発明の新規性は、以下の二つの観点から判断されます、

- ①特定の属性を有する化合物等
- ②その属性に基づく医薬用途

ここで先行技術文献(刊行物等)に医薬発明が記載されているというためには、①特定の属性を有する化合物等、及び、②その属性に基づく医薬用途、の両者が記載されていることが必要です。

刊行物等の記載及び出願時の技術常識に基づいて、①の特定の属性を有する化合物等を製造又は取得できることが明らかであるように、刊行物等に記載されていない場合は、医薬発明が記載されているとはいえません。

また、同様に、刊行物等の記載及び出願時の技術常識に基づいて、②のその属性に基づく医薬用途に使用できることが明らかであるように刊行物等に記載されていない場合は、医薬発明が記載されているとはいえません。

例えば、刊行物等に何の裏付けもなく医薬用途が単に列挙されている場合は、刊行物等に医薬発明が記載されているとはいえません。

一方、医薬発明の新規性の判断については、以下のような留意点がありますので、注意が必要です。

医薬発明の医薬用途と刊行物等に記載されて

いる発明の医薬用途とが表現上異なっている場合、出願時の技術常識を参酌して、以下の①又は②と判断される場合は、医薬発明の新規性は否定されず。

①その作用機序から医薬用途を導き出せるとき

②密接な薬理効果により必然的に生じるものであるとき

例えば、①の例としては、

(刊行物等の発明) 気管支拡張剤

→ (医薬発明) 喘息治療剤

(刊行物等の発明) 血管拡張剤

→ (医薬発明) 血圧降下剤

(刊行物等の発明) ヒスタミン遊離抑制剤

→ (医薬発明) 抗アレルギー剤

があり、

また、②の例としては、

(刊行物等の発明) 強心剤

→ (医薬発明) 利尿剤

(刊行物等の発明) 消炎剤

→ (医薬発明) 鎮痛剤

があり、医薬発明の新規性が否定されます。ただし、上記②の例に関しては、第一の医薬用途を有する化合物等の全てが第二の医薬用途を有するというわけでもないこともよく知られていることに留意して判断されます。

また、刊行物等に記載されている発明の医薬用途が、医薬発明の医薬用途の下位概念で表現されているときは、医薬発明の新規性は否定されず。

例えば、

(刊行物等の発明) 抗精神病剤

→ (医薬発明) 中枢神経作用剤

(刊行物等の発明) 肺癌治療剤

→ (医薬発明) 抗癌剤

などの例があります。

さらに、刊行物等に記載されている発明の医薬用途が、医薬発明の医薬用途の上位概念で表現されており、出願時における技術常識に基づいて、刊行物等に記載されている発明の医薬用途から、下位概念で表現された医薬発明の医薬用途が導き出せるときは、医薬発明の新規性は否定されず。ただし、概念上、下位概念で表現された医薬用途が、上位概念で表現された医薬用途に含まれる、あるいは上位概念で表現された医薬用途から

下位概念で表現された医薬用途を列挙することができるのみでは、下位概念で表現された医薬用途を導き出せるとは判断されません。

医薬発明の医薬用途が、刊行物等に記載されている発明の医薬用途を新たに発見した作用機序で表現したにすぎないものであるときは、医薬発明の新規性は否定されます。

例えば、

(刊行物等の発明) 抗菌剤

→ (医薬発明) 細菌細胞膜形成阻止剤

が例としてあげられます。

(3) 進歩性

最後に、進歩性については、一般的な進歩性の判断に加え、以下の観点(①～④)から判断が行われることに留意する必要があります。

①医薬用途と作用機序との関連

医薬発明の医薬用途が、刊行物等に記載されている発明の医薬用途と異なっている場合、出願時の技術水準から両者間の作用機序の関連性が導き出せる場合は、通常、医薬発明の進歩性は否定されず。

②ヒト以外の動物用医薬からのヒト用医薬への転用

ヒト以外の動物用の同種又は近位の疾病用である刊行物等に記載されている発明の化合物等を、ヒト用の医薬へ単に転用したにすぎない医薬発明は、通常、進歩性が否定されず。

③二以上の医薬成分を組み合わせた医薬

薬効増大、副作用低減といったよく知られた課題を解決するために、二以上の公知の医薬成分を組み合わせたにすぎない場合には、通常、医薬発明の進歩性は否定されず。

例えば、

- ・主作用が同じである公知の成分同士の組合せ
- ・公知の主成分の効能に係る問題を解消することができる公知の副成分との組合せ

- ・主疾病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などの例がありますが、以下に事例を用いて説明します。

○主作用が同じである公知の成分同士の組合せの仮想事例

(医薬発明)

「食物繊維 1～30g とYY菌 $1 \times 10^6 \sim 1 \times 10^8$ 個を含むことを特徴とする液状整腸剤」

(説明)

本事例では、当初の明細書の発明の詳細な説明において、本発明の食物繊維とYY菌とを組み合わせさせた整腸剤についての薬理試験結果が示され、整腸作用が増強されることも記載されていました。したがって、実験成績証明書等により、引用例に記載の食物繊維、YY菌をそれぞれ単独で服用した場合の実験結果を示した上で、食物繊維とYY菌を組み合わせさせた整腸剤について、引用発明と比較した有利な効果の存在を主張・立証することができれば、進歩性が肯定される可能性があります。その効果が出願時の技術水準から予測される範囲を超えない場合は、進歩性は否定されます。

④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特徴を有する医薬

特定の疾病に対して、薬効増大、副作用低減、服薬コンプライアンスの向上といったよく知られた課題を解決するために、用法又は用量を好適化したにすぎない場合には、通常、医薬発明の進歩性は否定されます。

しかし、刊行物等に記載されている発明と比較した有利な効果が、出願時の技術水準から予測される範囲を超えた顕著なものがある場合には、医薬発明の進歩性は肯定されます。

○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特徴を有する医薬の仮想事例 (医薬発明)

「1回あたり 100～120 μ g/kg 体重の化合物Aが、ヒ

トの脳内の特定部位Zに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を有効成分として含有する卵巣癌治療薬」

(説明)

本事例では、卵巣癌治療における化合物Aの用法・用量として、本発明の用法・用量(脳内の特定部位Zへの投与)は、従来知られていた用法・用量(静脈投与)と相違するので、新規性を有すると判断されます。

そして、化合物Aが脳内の特定部位Zへ投与されることにより、肝毒性という副作用がなく、また、静脈投与による治療に比して卵巣癌がより縮小することは、出願時の技術水準から予測される範囲を超えた顕著な効果であると認められるので、進歩性を有すると判断されます。

5. おわりに

私は、大学を卒業後、特許庁に入庁し、医薬分野をはじめとする、化学分野の審査・審判業務に携わってきました。現在は、特許庁を退職し、一般財団法人工業所有権協力センターにおいて、特許庁の審査を支援する業務に携わっています。今回、特許の話を「芳香」に掲載する機会を頂戴したので、特許庁の審査基準及び審査ハンドブックを参考にして、医薬発明の特許権を取得するに際しての注意点をまとめてみました。何かしらご参考になる点がございましたら幸いです。

同窓会 HP: 2023年7月28日公開