

～世界から期待され、世界をリードするJIPA～



一般社団法人日本知的財産協会



ライフサイエンス分野における明細書の 開示要件に関する多極間比較研究

2015年度 医薬・バイオテクノロジー委員会
第1小委員会



第1小委員会メンバー

小委員長	湯本和宏（キョーリン製薬ホールディングス）
小委員長補佐	黒崎文枝（日本メジフィジックス）
小委員長サポート	山西了（アステラス製薬）
委員	池上廣（田辺三菱製薬）
委員	海津新（日立製作所）
委員	川畑早苗（エーザイ）
委員	木ノ村尚也（大日本住友製薬）
委員	迫敏史（中外製薬）
委員	龍田美幸（ファイザー）
委員	早川いちご（ソニー）
委員	宮武正彦（サントリー）
委員	山本光（旭化成）

以上12名





活動の背景

当委員会ではこれまでに、日米欧の主要3カ国についてサポート要件と実施可能要件に関する審査・審判の事例比較調査を行い、その結果を報告してきたが、BRICSについては、中国以外に調査を行ったことがない。

そこで、5大特許庁（日米欧中韓）とロシアにおけるサポート要件と実施可能要件に関する審査事例を調査比較することを目的として、本研究テーマを立ち上げた。





発表の概要

ライフサイエンス分野における最も典型的な発明である、**化合物発明**、**医薬用途発明**および**製剤発明**について、実施可能要件およびサポート要件がどのように判断されているか、日本、米国、欧州、中国、韓国、およびロシアの審査事例を比較した。



明細書の開示要件に関する拒絶/無効理由

	実施可能要件			サポート要件		
	法律/規則	拒絶理由	無効/異議理由	法律/規則	拒絶理由	無効/異議理由
日本	特許法36条6項1号	○	○	特許法36条4項1号	○	○
米国	合衆国法典35巻112条(a)	○	○	合衆国法典35巻112条(a)	○	○
欧州	欧州特許条約83条	○	○	欧州特許条約84条	○	×
中国	専利法26条3項	○	○	専利法26条4項	○	○
韓国	特許法42条3項1号	○	○	特許法42条4項1号	○	○
ロシア	<ul style="list-style-type: none"> 連邦民法4法典7編1375条2項2号 行政規則10.7.1 	○	○	<ul style="list-style-type: none"> 連邦民法4法典7編1375条2項3号 行政規則10.8.(2) 	○	○

○ : 該当 × : 非該当





調査方針

化合物発明、医薬用途発明および製剤発明に関して
6極すべてに出願されているケースから、以下の方針で母集団を抽出した。

- ① 2005年1月1日以降に出願され、日本において特36条4項1号または36条6項1号の拒絶理由が通知されているもの：231件
- ② 中国出願の包袋が電子的に入手可能であり、ロシアで登録されているもの(①との重複除く)：435件

上記2つの母集団から、発明のカテゴリー(化合物、用途、製剤)ごとに検討方針に適した事例を任意に抽出し、6極比較を行った。





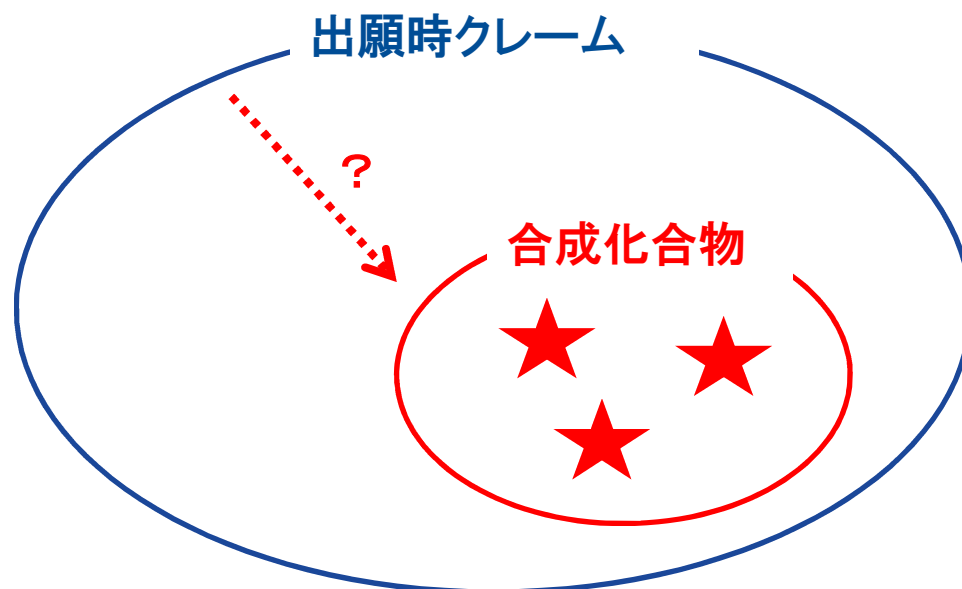
化合物発明に関する事例比較





検討方針 ～化合物発明～

a) 合成化合物と成立クレームとの関係

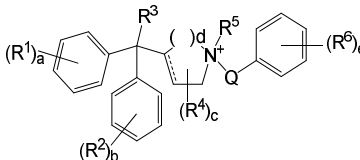
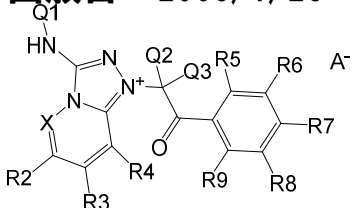
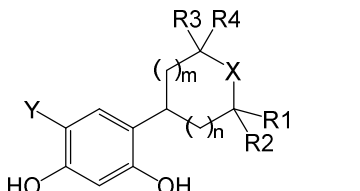


- b-1) クレーム化合物の**薬理データの開示**を要求するか否か。
- b-2) 薬理データの開示としては、**クレーム化合物全体の薬理活性の概括的記載**（例：本発明化合物の有する…受容体阻害活性のIC50値は XX nM未満である）で足りるのか、それとも**クレーム化合物個々の薬理活性の具体的記載**が必要か。





事例比較の概要 ～化合物発明～

事例	明細書等の記載内容				出願審査の結果			
	出願の概要	合成化合物数	薬理活性		国	実施可能要件	サポート要件	登録クレーム
			具体的記載	概括的記載				
1	WO2008/103426 出願日：2008/2/21 	109	hM3Mスクリン受容体 に対するKi値： 4化合物	本発明化合物のhM3M スクリン受容体に対する <u>Ki値は約120nM未満</u> ； より典型的には約 50nM未満	JP	○	×	●
					US	○	○	●
					EP	×	○	●
					CN	○	×	●
					KR	○	×	●
					RU	×	○	●
2	WO2009/097971 出願日：2009/1/23 	86	血小板凝集阻害 活性： 8化合物 PAR1阻害活性： 11化合物	なし	JP	○	○	●
					US	○	○	●
					EP	○	○	●
					CN	○	×	●
					KR	○	×	拒絶
					RU	×	○	●
3	WO2010/063733 出願日：2009/12/2 	16	5-HT _{2A} 阻害活 性： 2化合物 メラニン形成阻害活 性： 1化合物	本発明化合物の5-HT _{2A} 阻害活性の <u>IC₅₀</u> <u>値は10uM以下</u> 、さら に1uM以下を有する ものもある	JP	○	○	●
					US	○	○	●
					EP	○	○	●
					CN	○	×	●
					KR	×	○	●
					RU	包袋未入手		●

○：満たす
 ×：満たさない

●：合成化合物の範囲より広い
 ●：合成化合物の範囲と同等
 ●：薬理データ的具体記載の範囲と同等





まとめ ～化合物発明～

- 全事例において、日本、米国、欧州と比較して、中国、韓国、ロシアでは、実施可能要件・サポート要件が厳格に判断される傾向にあった。
- 登録クレーム範囲に関しては、中国では全事例において、明細書の開示要件違反に基づき、合成例として開示のある化合物範囲以下に限定させられていた。韓国とロシアでも2事例において、合成例として具体的に開示されている範囲及びその周辺の狭い範囲のみでしか実施可能要件・サポート要件が満たされないと判断された場合があった。
- 中国では全事例において薬理データの開示を要求されていた。そのうち、1事例では概括的な記載があることで認められていたが、2事例では薬理データの具体的記載まで要求され、具体的な記載のある化合物範囲まで限定させられていた。
- 韓国でも、1事例について薬理データの開示を要求されていたが、概括的な記載があること（+補充データ）を主張することで認められていた。



医薬用途発明に関する事例比較





検討方針 ～医薬用途発明～

化合物発明とその化合物の医薬用途発明とを請求の範囲に含む出願であって、明細書で概括的に薬理データを記載する出願について、医薬用途発明の実施可能要件・サポート要件が審査においてどのように判断されているか、6極の審査事例を比較した。





事例比較の概要 ～医薬用途発明～

事例	明細書等の記載内容		出願審査の結果			
	出願の概要	薬理データの記載	国	実施可能要件	サポート要件	薬理データの後出し
1	W02008/133896 出願日：2008/4/23 哺乳動物においてAT1受容体をアンタゴニストするのには有用な所定の化合物に関する。	本発明化合物の概括的記載 AT1受容体でのpKiまたはNEP酵素のpIC ₅₀ が5.0以上 実施例1の化合物 AT1受容体でのpKiまたはpIC ₅₀ が7.0以上	JP	×	×	不可
			US	○	○	—
			EP	○	○	—
			CN	○	×	可
			KR	○	×	可
			RU	×	○	可
2	W02011/027289 出願日：2010/8/31 神経・精神疾患等治療のためのクロモン誘導体化合物に関する。	本発明化合物の概括的記載 DRD3受容体活性試験におけるKi値： 0.1～30nM/L マウスの機能亢進試験におけるED ₅₀ 値： 0.01～6mg/kg	JP	×	×	可
			US	×	×	—
			EP	○	○	—
			CN	×	○	—
			KR	拒絶理由通知前		
			RU	○	○	—
3	W02012/034526 出願日：2011/9/15 癌を治療するための医薬品の製造における、縮合ヘテロアールの使用に関する。	本発明化合物(184化合物)の概括的記載 PI3Kαキナーゼ受容体をIC ₅₀ <1.0μMで阻害 mTOR受容体をIC ₅₀ <10.0μMで阻害 特定の実施例の化合物(167化合物) PI3Kαキナーゼ受容体をIC ₅₀ <100nMで阻害 特定の実施例の化合物(64化合物) mTOR受容体をIC ₅₀ <100nMで阻害	JP	×	×	可
			US	○	○	—
			EP	○	○	—
			CN	○	×	—
			KR	○	○	—
			RU	○	○	—

○：満たす ×：満たさない





まとめ ～医薬用途発明～

- 日本では、原則的には薬理データを個々の化合物ごとに具体的に示すことが必要とされることが明らかとなった。
事例1では、後出した薬理データが参酌されなかったが、出願日が比較的新しい事例2、3では、明細書に記載された薬理データを根拠としつつ具体的な薬理データを後出しすることで拒絶理由が解消していた。
- 中国や韓国では、薬理データの概括的な記載を根拠に用途クレームに対し実施可能要件・サポート要件違反が指摘される場合があった。
これに対し、中国では明細書中の薬理データの概括的な記載を根拠に反論することで拒絶理由が解消しており、韓国においても薬理データの後出しとともに反論することで拒絶理由が解消していた。
- 米国、ロシアでは、薬理データと疾患の関係が不明であることを理由に実施可能要件違反とされた事例があったが、これに対しては化合物の生物学的活性と疾患との関係を示す文献を提出することで、拒絶理由は解消した。
- なお、疾患非限定の医薬組成物クレームは、韓国では明確性要件違反となり、ロシアではクレームの記載要件違反となることがわかった。





製剤発明に関する事例比較





検討方針 ～製剤発明～

製剤発明の実施可能要件・サポート要件の審査に関し、製剤構成成分についてどのような限定が要求されたかに着目し、6極の審査事例を比較した。





事例比較の概要 ～製剤発明～

事例	明細書の記載内容		出願審査の結果							
	クレーム	実施例	国	実施可能	クレームの記載要件		製剤構成成分の限定要求			
					サポ'ート	クレームの構成	種類	含量	用途	
1	WO2010/118888 親水性ポリマー、多価アルコールと糖 類化合物との重量比が2:1～ 5:1 (wt-%) の混合物、及び 界面活性剤 からなり、 安定化タンパク質を含まないこ とを特徴とする製剤。	親水性ポリマー：PVP、ヒアルロン酸 多価アルコール：マンニトール 糖類化合物：スクロース 界面活性剤：ポリソルベート80 タンパク質・ヘパ'チン：ポリリヌ毒素タイプA	JP	×	×	—	あり	なし	なし	
			US	○	○	—	—	—	—	
			EP	○	○	—	—	—	—	
			CN	○	×	—	あり	なし	なし	
			KR	拒絶理由通知前						
			RU	○	○	×	あり	なし	あり	
2	WO2010/124837 肝細胞刺激量の エリスロポ'エチ ンと物理的に接触した治 療有効量の肝細胞の懸濁 液をカ'プセル化しているカ' プセルを含むマイクロカ'プセル。	肝細胞刺激量： $5 \times 10^{-3} \text{U/ml}$	JP	×	×	—	なし	あり	なし	
			US	○	○	—	—	—	—	
			EP	○	○	—	—	—	—	
			CN	○	○	—	—	—	—	
			KR	○	○	—	なし	なし	なし	
			RU	包装確認不可				なし	なし	あり
3	WO2010/149772 インスリン化合物、 ニコチン化合物、及び アルキ'ンを含有する インスリン製剤。	インスリン化合物：B28Aspヒトインス リン ニコチン化合物：ニコチンアミド ニコチン化合物の含有量：0.6mM のB28Aspヒトインスリンに対し、 80-260mMのニコチン化合物	JP	○	×	—	あり	あり	なし	
			US	○	○	—	—	—	—	
			EP	○	○	—	—	—	—	
			CN	○	×	—	あり	なし	なし	
			KR	拒絶理由通知前						
			RU	○	○	×	なし	なし	あり	

○：満たす ×：満たさない





事例 3 : W02010/149772

審査開始時 クレーム	インスリン化合物、ニコチン化合物、及びアルギニン を含有するインスリン製剤。
日本 登録クレーム	<u>B28Aspヒトインスリン、 ニコチンアミド、ニコチン酸、ナイアシン、ナイアシンアミド、 ビタミンB3及びそれらの塩からなる群から選択されるニコチン化 合物、及びアルギニンを含有するインスリン製剤であって、 0.6モルのB28Aspヒトインスリンに対し、40-260モルの前記ニコ チン化合物、及び、10-60モルの前記アルギニンが存在するインス リン製剤。</u>
中国 登録クレーム	<u>B28ASPヒトインスリン、ニコチンアミド、アルギニン、および リン酸緩衝液</u> を含有するインスリン製剤。
ロシア 登録クレーム	インスリン化合物、ニコチン化合物、及びアルギニンを含有する、 患者の血中グルコースを低下させるための注射可能なインスリン 製剤。



まとめ ～製剤発明～

- 米国と欧州では全事例において、実施可能要件・サポート要件違反を通知されていなかった。
- 日本では全事例で少なくともサポート要件違反が通知されており、2事例は実施可能要件違反も併せて通知されていた。
1事例では製剤構成成分の「種類」の限定が、2事例では製剤構成成分の「含量」の限定が求められていた。特に、発明の効果から、製剤構成成分の「含量」の限定を求める点が特徴的と思われる。
- 中国では2事例でサポート要件違反が通知されており、製剤構成成分の「種類」を「実施例に開示された範囲」まで限定することを求められていた。
- ロシアでは、クレームの記載要件として、製剤発明においても医薬用途または機能の記載が求められることがわかった。



全体まとめ

➤ 化合物発明について、中国、韓国、ロシアでは、合成例として具体的に開示されている範囲及びその周辺の狭い範囲のみでしか実施可能要件・サポート要件が満たされないと判断される傾向にあった。さらに中国では、化合物発明であっても、化合物の薬理データ（少なくとも概括的な記載）の開示を要求されることがわかった。

➤ 医薬用途発明について、明細書に概括的に記載された薬理データを根拠としつつ、具体的な薬理データを後出しすることで拒絶理由が解消する可能性が示唆された。

➤ 製剤発明について、日本と中国はサポート要件の観点から、製剤構成成分およびその含量の限定を求められる傾向が見受けられた。

事例No	低分子			用途			製剤			合計				
	1	2	3	1	2	3	1	2	3	○	×			
JP	実施可能	○	○	○	×	×	×	×	×	○	4	5		
	サポート	×	○	○	×	×	×	×	×	×	2	7		
US	実施可能	○	○	○	○	×	○	○	○	○	8	1		
	サポート	○	○	○	○	×	○	○	○	○	8	1		
EP	実施可能	×	○	○	○	○	○	○	○	○	8	1		
	サポート	○	○	○	○	○	○	○	○	○	9	0		
CN	実施可能	○	○	○	○	×	○	○	○	○	8	1		
	サポート	×	×	×	×	○	×	×	○	×	2	7		
KR	実施可能	○	○	×	○	-	○	-	○	-	5	1		
	サポート	×	×	○	×	-	○	-	○	-	3	3		
RU	実施可能	○	○	拒絶理由未確認	○	○	○	○	拒絶理由未確認	○	7	0		
	実施例	×	×		×	○	○	○		○	○	4	3	
	サポート	○	○		○	○	○	○		○	○	○	7	0
	クレーム構成	○	○		○	○	○	×		○	×	×	5	2
	物質クレーム	○	○		×	○	×	○		○	○	○	5	2
	産業上利用	○	○		×	×	×	○		○	○	○	4	3

○：満たす； ×：満たさない； -：拒絶理由未通知前



ご清聴有難うございました

～世界から期待され、世界をリードするJIPA～



一般社団法人日本知的財産協会

