

中国における 医薬用途発明の保護制度

中原信達知識産権代理有限責任公司
(China Sinda Intellectual Property
Limited)
(中国特許法律事務所)



Mr. Qing YANG
シニアパートナー
特許弁理士
化学部門長



Dr. Yongmei
GONG
特許技術者
化学部門

中原信達知識産権代理有限責任公司は1993年に北京において創設された中国におけるIP事務所である。Yang氏は、2001年に中原信達知識産権代理有限責任公司に加入し、特許権の取得、再審査、無効手続、訴訟及びカウンセリングにおいて豊富な経験を有する。Dr. Gongは2012年に中原信達知識産権代理有限責任公司に入所、ライフサイエンス、バイオマテリアル、製薬、医療機器、化粧品および一般化学を含む多岐の技術分野における特許権の取得、再審査、無効手続及びカウンセリングに携わる。

中国の特許実務において、医薬分野の発明は、基本的に2種類のクレームカテゴリー、すなわち製品クレームと方法クレームにより保護される。製品には化合物および医薬組成物（投薬形態、キットなどを含む）が含まれ、方法には製造方法および医薬用途が含まれる。

1. 製品の保護

まず初めに、化合物、化合物を含む医薬組成物およびこれらの製造方法は、特許を受けることができる主題であることに疑いはない。したがって、化合物の製薬学的に許容可能な塩、溶媒和物、異性体および多形も、同様に特許を受けることができる主題である。

本項目では、既知の化合物の特定の塩または多形の特許性について説明していく。新規な医薬製品の保護は、ここでは取り上げない。

(1) 既知の化合物の特定の塩（とりわけ製薬学的に許容可能な一般的な塩）に関する発明は、選択発明とみなすことができる。中国の特許審査指南（GPE）によれば、明細書に記載された実験データが、クレームに記載された発明の予期せぬ

技術的効果を証明している場合に限り、選択発明は進歩的とみなされる（GPE 第 II 部第 4 章第 4.3 項）。

(2) 既知の化合物の新規な結晶形に関する発明は、やはり特許を受けることができるものの、より多くの問題に直面する。

第一の問題として、クレームに記載の結晶形が、先行技術と比較できない異なるパラメーターにより特徴づけられている場合、審査官は通常、クレームに記載の結晶形は先行技術の結晶形と同一であるため新規性がないと推定する（GPE 第 II 部第 10 章第 5.3 項）。

事例：

特許出願第 99801366.8 号の行政訴訟に関して Teijin Pharma Ltd.により特許審判部（Patent Reexamination Board: PRB）を相手取り提起された上訴

「本件出願のクレームに記載の結晶 A は XPRD パラメーターにより定義されているが、引例 D1 に開示された結晶は IR スペクトルと融点により定義されている。双方の結晶は異なるパラメーターにより定義づけられているため、当業者は直接的に区別することができない。さらに本件出願の結晶 A の IR スペクトルに示された、当該結晶を識別する上で重要な意味を持つ特性ピークは、引例 D1 の IR スペクトルに示された特性ピークと近似であり、残りのピークは、誤差の範囲内と思われるわずかな差異しか示していない。したがって、双方の結晶は本質的に同じであると当業者は推定できる。PRB は、クレーム 1 には新規性がないと推定している。この推定は的確である。」（北京高級法院（2013）Gaoxingzhongzi No. 45）

第二の問題として、既知の化合物と類似の構造を持つ化合物は、予期せぬ技術的効果をもたらすことが立証されない限り、自明とみなされる（GPE 第 II 部第 10 章

第6.1項)。さらに「保護を受けるための明細書の開示」の原則に基づき、明細書に記載されている技術的効果のみが、進歩性の判断の根拠となり得る。

事例：

特許第 CN ZL01817143.5 号の無効の行政訴訟に関して Boehringer Ingelheim Pharma GMBH & Co.により PRB を相手取り提起された再審請求

「最高法院は次のように判示する：結晶化合物の微細構造は著しく変化する可能性がある。その固体状態の化合物は、複数の種類の異なる分子配列に基づく異なる結晶化構造を示すことがある。しかし、結晶微細構造の全ての変化が必ずしも傑出した実質的特徴および顕著な進歩に結びつくとは限らない。それゆえ化合物の結晶微細構造が類似していないという事実だけにに基づき、これらの化合物の構造が類似していないと推定することはできない。つまり GPE における『類似の構造を持つ化合物』は、同じコア部分または必須の環を有する化合物だけを具体的に指しており、結晶微細構造自体の比較は無関係である。結晶の進歩性を判断する場合、その結晶微細構造およびそれにより生み出された予期せぬ技術的効果を合わせて検討しなければならない。さらに、当業者は明細書および薬局方（2010年版）における『加速試験』の仕様を読んだ後に、その技術的効果、すなわち反証1に言及された『粒子サイズ安定性』が明細書に開示されていると結論づけることはできない。したがって、クレーム1の進歩性を評価する際に、反証1に言及された技術的効果を考慮してはならない。」

（最高法院の行政通達書（2011）Zhixingzi No. 86）

上記に照らし、既知物質の特定の塩または新規の結晶形の新規性および進歩性を判断する際は、予期せぬ技術的効果が極めて重要であり、かかる予期せぬ技術的効果が出願時の出願書類に記載されていないなければならない。

2. 方法および医薬用途の保護

化合物の新規の医薬用途は、「疾患 Y の治療のための化合物 X の使用」または「化合物 X を使用する疾患 Y の治療方法」という形式で記載されている場合には、疾病の治療方法とみなされ、中国特許法第 25 条に従い特許を受けることができない。ただし、薬剤およびその製造方法は、特許を受けることができる。それゆえ医薬用途は、特許不適格性の問題を克服するために、「薬剤の製造における化合物 X の使用」（第一医薬用途）、または「疾患 Y の治療のための薬剤の製造における化合物 X の使用」（第二医薬用途）などの形式による、薬剤の製造方法を対象とする医薬用途クレーム（より具体的には、薬剤の製造における使用クレーム）として記載されることが多い（GPE 第 II 部第 10 章第 4.5.2 項）。

実務上の問題として、医薬用途クレームに対する、投与特徴（治療対象患者、投与方法、経路、用量、時間間隔を含む）および化合物の作用機序の限定効力については、今も物議を醸している。対立する意見の根底にあるのは、どのような方法で医薬用途クレームを評価すべきかという問題である。以前は、医薬用途クレームの内容は薬剤の使用方法であるため、薬剤の使用に関連する投与特徴は明らかに当該クレームに対して限定効力を有するという意見があった。しかし、ここ数年における主流の意見によれば、医薬用途クレームは薬剤の使用ではなく、薬剤の製造方法クレームと実質的に同じであり、その保護範囲は、「化合物 X が使用されることを特徴とする、疾患 Y の治療のための薬剤の製造方法」といったクレームと同等であると理解されている（LIU, Feng et al. 著、Chinese Journal of New Drugs 2016, 25(15), 1703-1707）。実際、後者の意見は、上記に示した GPE の規定とも一致する。

医薬用途クレームは所定の薬剤を製造する業者の行為を制限することが多いため、かかるクレームの技術的特徴を薬剤の製造方法と関連づけて分析するのが合理的である。かかるクレームを実質的に限定すると考えられている主な技術的特徴として、原材料、製造工程、工程条件、製品形態または成分および機器などが挙げられる。用量および用法など、薬剤の使用時のみに関与する技術的特徴の場合、当該特徴は本来、製造方法により薬剤が得られた後における薬剤の具体的な投与方法に

関連しているため、製造方法との直接的または必然的な関連性はない。したがって、投与行為においてのみ実施される当該特徴は、医薬製造方法に関連した技術的特徴ではないため、医薬用途クレームを実質的に限定するとはみなされない。

以上から分かるように、薬剤の製造と薬剤の投与は2つの異なる概念である。投与特徴は、薬剤の製造ではなく薬剤の使用に関連した、治療処置時における医師の行為であり、通常は特許性評価の際に考慮されない。また、既知の物質の新規な作用機序は、必ずしもクレームに新規性を与えるとは限らない。治療対象となる疾患が同じであれば、たとえ薬剤の作用機序が異なっても、医薬用途クレームは新規とはみなされない。GPE に従い、審査官は医薬用途発明の新規性を審査する際に、投与の対象患者、形態、経路、用量、間隔などの使用に関連する特徴が薬剤の製造方法を定義できるかどうか、さらに投与の過程にのみ存在する顕著な特徴は用途に新規性を与えることはできないという側面を考慮に入れなければならない（GPE 第 II 部第 10 章第 5.4 項）。

事例：

特許第 CN ZL99812498.2 号の無効の行政訴訟に関して Cubist Pharmaceuticals, Inc.により PRB を相手取り提起された再審請求
最高法院の判決は以下のとおりである。

(1) 「本件特許における『骨格筋毒性を生じない』という定義は、骨格筋毒性を軽減するためにダプトマイシンの悪影響を改善するだけであって、治療患者またはダプトマイシン自体の適応症を変えるものではなく、ましてや本薬剤の新規の特性を認定するものでもない。それゆえ、本件特許における『骨格筋毒性を生じない』という定義は、先行技術における既知の用途との区別化をもたらすものではなく、医薬用途自体を限定するものでもない。」

(2) 「本件特許のクレーム 1 における治療用量が 3-75 mg/kg であるという定義は、一般的に当業者により投与量として理解される。医薬製品の最適な治療効果の達成を目的とした特定の個人に対する投与方法の変更および用量の選択は、医薬製品の使用過程における疾病治療薬の使用行為に属するもので

ある。投与量の変更は、必ずしも薬剤の製造方法に影響を及ぼす、または有効成分の含有量に変更を生じるとは限らない。同様に、投与間隔により特徴づけられた本件特許の用法は、投与時における薬剤の使用方法に関する方法特徴であって、製造方法ではなく、投与を示す医療行為である。この投与方法の特徴は、必ずしも薬剤の製造方法に関連しているとは限らず、ダプトマイシンの製造方法を変更する、または当該薬剤自体に影響を及ぼすものでもない。この特徴は、薬剤の製造方法を限定しないため、クレームに記載された医薬用途に進歩性を与えることはできない。」（最高法院の行政通達書（2012）Zhixingzi No. 75）

3. 当所の提案

当所では、投与経路または投与量が用途クレームに関して考慮されない事態を回避するため、出願人に以下のようなクレームの作成を提案している。すなわち、出願人は、投薬形態クレーム（すなわち、投与経路を投薬形態に変更する）、または有効成分およびその含有量により定義された医薬組成物クレーム（すなわち、投与量に対応含有量もしくは単位用量に変更する）として、あるいは複数の薬剤を連続的または断続的に投与すべき場合はキットクレームとして、クレームを作成することができる。

最後に重要な点として、中国は判例法の国ではないが、初めて最高法院により判示された医薬用途発明に関する上記事例は、下級法院に対して一定の指針としての意味を有する。中国における現在の特許実務および司法実務に従えば、進歩性が薬剤の投与特徴にしか存在しない医薬用途発明の特許取得は、比較的難しいのが現状である。

出典

1. 中国特許法
2. 2010年特許審査指南

3. 北京高級法院（2013）Gaoxingzhongzi No. 45
4. 最高法院の行政通達書（2011）Zhixingzi No. 86
5. LIU, Feng et al.著、Chinese Journal of New Drugs 2016, 25(15),1703-1707
6. 最高法院の行政通達書（2012）Zhixingzi No. 75

(編集協力：日本技術貿易株式会社)