ARTICLES

ライフサイエンス研究のための知財戦略

The Intellectual Property Strategy for the Life Science Research

第8回

特許戦略に資するための研究開発 —実例，判例の特許戦略への活用—

Research and development to contribute to a patent strategy
—Utilization of examples and precedents for a patent strategy—

高島国際特許事務所
弁理士
高島　一，山本健二
Patent Attorney
HAJIME TAKASHIMA, KENJI YAMAMOTO
TAKASHIMA International Patent Office

はじめに

医薬品の新薬開発研究は他の産業と比べものにならないほど長期かつ多岐にわたるものであり，その間製薬企業は数百億円という莫大な研究開発投資に耐えなければならない。しかしながら，近年，新薬の開発は困難になってきており，開発の後期段階，あるいは販売後の再審査期間に至ってさえ，開発中断，販売中止を余儀なくされるケースが増加してきている。

また，主要医薬品の基本特許の多くが2010年前後に満了期を迎えるという，いわゆる2010年問題が医薬品業界で大きな問題となっており，後発医薬品（ジェネリック医薬品）を牽制するためのライフサイクルマネージメント戦略により製品寿命の最大化を図る重要性が増してきている。

このような背景から，医薬品開発に従事する研究者には，開発スケジュールに支障を来さないように開発研究を効率的に進める要求が従来にも増して求められるようになってきていると思われる。一方，開発研究の各段階で取得される成果物のひとつひとつが特許の対象となるものであり，製薬企業が同業他社との競争に勝ち抜き，また，ジェネリック医薬品を牽制するためのライフサイクルマネージメント戦略の源泉になるものである。ここで注意が必要なことは，開発を効率的に進めるための研究開発戦略と強い特許を取得するための知財戦略はかなりの部分で重複するものの必ずしも一致しないということであり，研究開発を効率的に進めると同時に，強く有効な特許を取得するために，特許戦略を融合した研究開発戦略を立てることが重要である。

一方，2010年問題の裏返しとして，近年，ジェネリック医薬品の開発が活況を呈してきている。しかし，ジェネリック医薬品というのは先発医薬品メーカーの特許による参入障壁が特許期間の満了で取り払われたことにより参入可能になったものであるから，大型の医薬品であればあるほど，当然に数多くの後発医薬品メーカーが殺到し，さらには，近年，先発医薬品メーカーの中にもジェネリック医薬品に参入する動きがあり，熾烈な競争

に巻き込まれるのは必至である。また，先発医薬品メーカーのライフサイクルマネージメント戦略の強化により特許攻撃に晒されるリスクは増してきている。したがって，ジェネリック医薬品メーカーにおいても，開発研究において単に生物学的同等性等を確保するのみならず，開発研究から得られた知見を特許戦略に活用していくことが重要になってくると思われる。

本稿では，「特許戦略に資するための研究開発」と題して，強く広い特許を取得するために研究者がどのような思考をもって医薬品の研究開発に従事すべきかについて，考察してみたい。

なお，医薬品特許は他の分野とは比べものにならないほどグローバルに特許を取得することが求められ，各国の法制度や運用によりその戦略も当然変わってくるが，特許を取得する段階の戦略は各国において相違点が少ないことから，誌面の関係上，特に断らないかぎり，日本の法制，ガイドラインに従って説明することにする。

1．特許を取得するための要件

医薬品の特許戦略を有効に活用していくためには，単に特許出願するのみでは不十分であり，できるだけ広い権利を特許化して他社の参入を排除，牽制する必要がある。

ところで，特許を取得するためには，さまざまな要件(特許要件)をクリアしなければならず，その要件は特許庁の審査官によって審査される。特許戦略においては「特許請求の範囲」に広い範囲を記載することが基本となってくるが，実際の審査においては特許要件をクリアするためにその範囲を減縮することを余儀なくされる場合が多々あり，時には，特許を取得することさえ困難になる場合もある。かかる事態に至ることを極力避けるために，特許(出願)戦略が必要となる。

当該戦略の立案上，特に考慮すべきは「特許されるための要件」，すなわち，特許要件であるため，まず主たる特許要件について以下に説明する。

(1) 新規性(特許法第29条第1項第1～3号)

出願時において公知(第1号)，公然実施(第2号)，刊行物記載(第3号)の発明には特許は与えられない。審査のときに問題になるのはほとんどが刊行物記載の発明である。出願時に起案する「特許請求の範囲」は広く記載する戦略がとられる場合が多く，調査もれのため新規性のない範囲を含むことがある。その場合は，当該重複範囲を含まないように「特許請求の範囲」を減縮する補正を行うことになる。

ところで，臨床試験は医薬品に特有のものであり，かつ臨床試験と新規性との関係についての審決，判決はなく，さらにこの点について論じた例はないので，臨床試験について新規性の観点から配慮すべき事項について特記したい。

医薬用途特許，例えば「化合物Xを有効成分とする○○治療剤」の特許においては，○○治療の臨床試験データを特許出願時の明細書に記載しなければならない(あくまで原則である)。ただし，ヒトと動物データがパラレルならば，動物試験でもよいというのが特許庁の運用である。したがって，通常は動物試験データを明細書に記載して特許出願する。

一方，特許出願前にヒトの臨床試験を行うことは，「公然実施された発明」として，新規性を欠如することになりかねないので十分なる配慮が必要である。

随分以前に，この点を無効理由の1つとして無効審判の代理をしたことがある。

本件においては，臨床試験を行った大学病院の医師が，特許出願前の特定の期間に，外来患者に対して臨床試験を行ったこと，そして特許明細書に記載したものとまったく同じデータを当時の該臨床試験のデータであるとして，特許出願後に頒布された文献に発表した。

本無効審判において，この出願前の臨床試験を根拠に当該発明は，特許出願前に公然実施されたないしは公然知られた発明に該当し，新規性を欠如することを無効理由の1つとした。

本件は外来患者に対する臨床試験を，特許出願前に行った事案であり，外来患者は自己の疾病を熟知している。また，医師はインフォームドコンセント上，患者に対して疾病の説明，有効成分に関する説明等を要するはずである。仮に医師が自発的に説明しなくとも，患者から求められれば，該臨床試験の内容，有効成分の説明を要する立場にある。さらに，外来患者に薬剤を持ち帰らせているのであるから，患者または患者から薬剤を入手した者は容易にその有効成分を分析することができたはずである。したがって，当該発明は少なくとも，公然実施され，また少なくとも公然知られうる状態に至っているので，新規性欠如ということになろう。

結果として，本件においては，他の文献に基づいて進

歩性がないということで特許は無効とされた。このため，残念なことに上記の公然実施の主張については審理されなかった。したがって，かかる争点についての判例は日本にはない。

ちなみに，アメリカではこの点に関連した事例が存する。L社が行った臨床試験（ただし，Phase I）がPublic use（公然実施）にあたるか否かが争われた事件である。

裁判所は，L社のPhase I の臨床試験は患者の治療目的ではなく安全性，有効性試験を目的としてL社内で秘密裏に行われたものであるから，Public useではなくPublic useの適用除外であるExperimental useに該当するとして新規性を阻害しないとした。この判断には格別問題はないと思料される。

先の筆者の事件のように患者へ投与し，しかも大学病院において公然と，疾患名を知っている外来患者に対して臨床試験を行った場合には，多分にPublic useとされた可能性があると推察される。特に，インフォームドコンセントを考慮すれば，医師は患者に十分な説明をすることが要求されているので，新規性阻却されているとするのが妥当と考える。

かかる点を考慮すれば，開発部門と，知的財産部門との連携を密にし，適切な時点において速やかに特許出願を行うことが必要である。先に述べたように，特許庁は一般的に動物試験による立証を認めているので，臨床試験前には特許出願を完了しておくべきである。

(2) 進歩性（特許法第29条第２項）

公知，公然実施，または刊行物記載の発明に基づいて，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（当業者）が容易に発明することができる発明は特許を受けることができない。特許取得の可否において最も多く争われる要件である。

進歩性の審査においては，「特許請求の範囲」に記載された発明の発明特定事項の一部が刊行物（主引例）に記載されており，記載されていない発明特定事項が他の刊行物（副引例）に記載されており組み合わせることが容易であるか，あるいは副引例に記載されていなくとも出願時の技術常識から容易に導けるか否かが審査される。その結果，「特許請求の範囲」に記載された発明を想到することが容易ではないと判断された場合は進歩性が肯定される。また，「特許請求の範囲」に記載された発明の構成（例えば，構造式）を想到することが容易であると認定された場合であっても，その効果が刊行物に記載された発明から当業者が予測できない顕著なものである場合も進歩性が肯定される。**図１**に進歩性の判断手法のフローチャートを示す。

審査において，進歩性欠如が指摘された場合には，発明特定事項を刊行物に記載されていない範囲に減縮するか（例えば，図１において発明特定事項Cを刊行物に記載されていない下位概念のｃに限定する），刊行物に記載されていない発明特定事項を追加する補正を行ったりして（例えば，図１において，刊行物に記載されていない発明特定事項Dを追加してA＋B＋C＋Dに限定する），構成を刊行物から容易に想到することができない範囲に限定することを検討する*1。あるいは，特許請求の範囲に記載された発明について刊行物記載の先行技術から予測できない有利な効果*2が主張できるときには，補正を行わず，または補正した上で有利な効果を主張する。なお，有利な効果の根拠となるデータは明細書に記載されることが好ましいが，明細書に記載がなくとも，審査段階において比較データを提出（後出し）することが可能である*3。

なお，有利な効果を主張するためには，「特許請求の範囲」に記載された発明のデータのみならず，刊行物に記載された最も近い態様のデータ（比較例）との比較が必要な場合が多く，時には追加実験を行って比較データを取得することが必要になる場合もある。

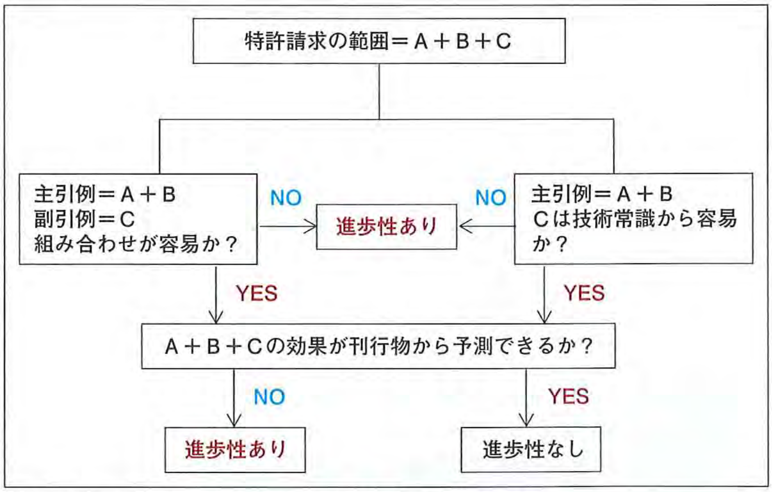

図１　進歩性の判断手法（Ａ，ＢおよびＣは発明特定事項）

*1補正を行う場合には，補正の根拠が明細書に記載されている必要があり，根拠がない場合には新規事項の追加が別途拒絶理由になる。
*2特許・実用新案の審査基準には，有利な効果について「請求項に係る発明が，引用発明と比較した有利な効果であって引用発明が有するものとは異質な効果を有する場合，あるいは同質の効果であるが際だって優れた効果を有し，これらを技術水準から当業者が予測することができたものではない場合には，この事実により進歩性の存在が推認される。」と記載されている。
*3知財高裁平成21年(行ケ)10238号(日焼け止め剤組成物事件)では，進歩性と追加実験結果の参酌の関係に関し裁判所は，「進歩性の判断において，…当初明細書に，「発明の効果」に関し，何らの記載がない場合はさておき，当業者において「発明の効果」を認識できる程度の記載がある場合やこれを推論できる記載がある場合には，記載の範囲を超えない限り，出願の後に補充した実験結果等を参酌することは許されるというべきであり，許されるか否かは，前記公平の観点に立って判断すべきである。」と判示している。

(3) 明細書記載要件―実施可能要件(特許法第36条第４項第１号)およびサポート要件(特許法第36条第６項第１号)

「発明の詳細な説明」の記載は，当業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したものであることが要求される(特許法第36条第４項第１号)。また，「特許請求の範囲」の記載は，特許を受けようとする発明が発明の詳細な説明に記載したものでなければならない(特許法第36条第６項第１号)。

これらは記載要件と呼ばれるものであり，医薬品特許においては「発明の詳細な説明」に記載した実施例および出願時の技術常識から「特許請求の範囲」の記載が広すぎて，当業者が実施できないと考えられる態様や実施例から拡張ないし一般化できないと考えられる範囲を含む場合には，当該範囲を削除して減縮する必要がある。なお，記載要件違反に対処するために審査段階で出願当初に記載されていない追加試験データを後で提出することは日本においては原則として認められない*4。

*4知財高裁平成17年(行ケ)第10042号(偏光フィルム事件)では，「発明の詳細な説明に，当業者が当該発明の課題を解決できると認識できる程度に，具体例を開示せず，本件出願時の当業者の技術常識を参酌しても，特許請求の範囲に記載された発明の範囲まで，発明の詳細な説明に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のに，特許出願後に実験データを提出して発明の詳細な説明の記載内容を記載外で補足することによって，その内容を特許請求の範囲に記載された発明の範囲まで拡張ないし一般化し，明細書のサポート要件に適合させることは，発明の公開を前提に特許を付与するという特許制度の趣旨に反し許されないというべきである。」と判示している。なお，米国，欧州においては記載要件違反に対処するために審査段階の追加データの提出は認められる。

2.「特許請求の範囲」のドラフティドラフティング

ここで，「特許請求項」のドラフティングの重要性を教示する事件について紹介する。

「アシクロビル事件」(東京地裁(ワ)27944号)・東京高裁(ネ)959号)である。

本事件は，特許明細書において，種々のカテゴリーの「特許請求の範囲」を設けていなかったがために，先発医薬品メーカーがジェネリック医薬品を排除できなかった事例である。

特許権者から，いったん販売された特許製品は，特許権は消尽*5し，何人でもその特許製品を使用，販売などをすることができる。本件は消尽について争われた数少ないケースであり，化学物質のみの「特許請求の範囲」しかない先発特許は消尽しているので，ジェネリック医薬を排除できなかったのである。

*5消尽とは？
特許製品について，一度これを製造販売等して，いったん特許権を行使すると，その特許製品については特許権の目的を達成し尽したことになる。したがって，その製品に対して再度特許権を行使することはできないという理論である。
特許権者は，独占，排他的に特許に関わる製品などを製造，販売，使用する権利を専有することができる。これをそのまま文字どおりに解釈すると，特許権者から購入した製品を使用すること，これを転売することなど，それぞれがすべて特許権の侵害になる。例えば，卸業者から小売業者に，小売業者から消費者に商品を転売することの１つひとつが特許権の侵害になるという不合理が生じ，経済活動を阻害することになる。このような不合理を解消するための理論である。

(1) 事件の概要

被告は，原告のアシクロビル錠剤(これには製剤化に必要な賦形剤，崩壊剤，結合剤などを含む)を購入し，該錠剤からアシクロビルを抽出，精製し，これを用いて再び被告独自の錠剤を製造，販売した。

被告の行為は，採算が合わないので通常は行わないが，本件では原告のアシクロビルの化学物質特許が存在している間にジェネリック医薬品の承認を得てしまったために，厚生労働省が要求する承認後一定期間内の上市義務を履行するためにやむなく行った行為である。

(2) 判決

被告が，原告が製造，販売する錠剤からアシクロビルを抽出，精製，再結晶させた行為が，原告が販売した製

剤に含まれるアシクロビルを単に使用し譲渡する行為とみられる限り，特許権の効力は消尽しているため，原告の行為に特許権の効力は及ばない。特許権の効力が及ぶのは被告の行為が，本件特許発明の対象であるアシクロビルを生産した場合である。

しかし，被告錠剤に含まれるアシクロビルは，原告錠剤に含まれる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産されたものではないのであるから，被告の行為についてみると，本件特許発の実施対象であるアシクロビルを新たに生産したものではない。

したがって，(特許権は消尽しているので)該特許権の効力は及ばない。

アシクロビル事件に鑑みて，「特許請求の範囲」のドラフティングにおける次のごとき教訓が考えられる。

本事件は，特許の与えられた対象が，「何か」ということが最大の問題である。

原告は有効成分であるアシクロビル(化学物質)のみを「特許請求の範囲」に記載していたのであり，例えば製剤等は特許の対象とはなっていなかったのである。これが最大の敗因であり，異なるカテゴリーの「特許請求の範囲」を設けておくべきであった。

もし，特許権者が「アシクロビルを含有する医薬組成物」という「特許請求の範囲」を設けていれば，被告は特許権者の錠剤から得たアシクロビルを使用して，例えば添加剤の違う，また成分純度の違う錠剤を製造する行為をなしており，「アシクロビルを含有する医薬組成物」という当該特許権を侵害することになる。また，「結晶の態様であるアシクロビル」を特許の対象としていれば，被告は再結晶を行っているので，この点でも侵害行為となることが考えうる。

本件は，「特許請求の範囲」のドラフティングがいかに重要であるかについての教訓を与えていると言える。

3. 医薬品開発研究戦略と特許戦略の異同

医薬品研究開発の一義的な目的は言うまでもなく，医薬品開発候補化合物の創出とそれに続く製品化研究(製法，製剤化等)により，医薬品開発パイプラインのロードマップにいち早く乗せることである。そのような目的

のみの観点から研究開発を進めると，最終的に開発されると予想される製品(化合物，製剤)の周辺のみを集中的に検討することが効率的であるということになる。研究者としては，背景技術や培ってきた経験からある程度目星がつく場合には，あまり広い範囲の検討は行いたくないという傾向があると推察される。しかしながら，そのような考え方から研究開発計画を立てて得られるデータは，広い特許を取得するための実施例としては不適切である場合がある。他社排除の観点からはできるだけ広い範囲の権利化が望まれ，そのためには広い範囲をサポートする実施例が必要である。

図2において，最終製品を中心の黒点，それを決定するために最低限必要な検討範囲を黒色実線の円とした場合，特許化できる範囲は黒色実線の円から技術常識に基づいて拡張・一般化できる黒色点線の円ということになる。

しかし，本来特許化したい範囲は黒色点線の円よりも広い赤色点線の円であった場合には，それに拡張しうるであろう(サポートがあるとされるであろう)赤色実線の円の範囲にまで実施例を明細書に記載しておく必要がある。

また，進歩性の根拠として有利な効果を主張するための比較例として赤色点線の外側(図2の白抜点)も実験しておく必要がある場合もある。比較例としてどのような実験を行うべきかについては，従来技術を調査の上で決定することになる。

図2において，黒色実線の円の外側から赤色実線の円の内側，および赤色点線の外側の白抜点は，開発候補化合物を決定するためには本来必要がない部分であろうが，特許化できる範囲を見極めるために特許戦略上必要な範囲ということになろう。しかしながら，人員，時間，予算等の制約から実験できるキャパシティーが限られることから，そこまで手が回らない場合も多いと推察する。

ところが，広い特許を取得するために必要な実験の割り振りを工夫することにより必要な実験数を効率化することができる。

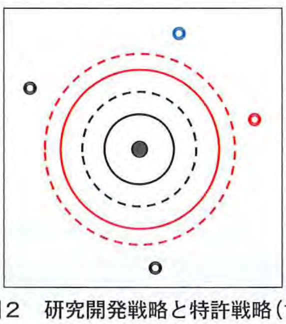

図2　研究開発戦略と特許戦略(1)

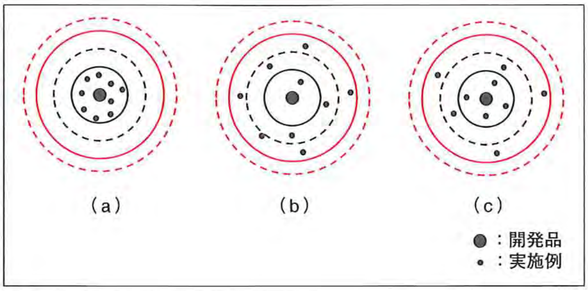

図3　研究開発戦略と特許戦略(2)

例えば，10個の実験を行うキャパシティーがあった場合に，**図3**の(a)のように狭い範囲で密度高く実験を行った場合には数の割には特許化できる範囲は狭いということになる。一方，図3の(b)のように特許化できる範囲である赤色点線の円に拡張できる赤色実線の円の全体をカバーできるように割り振った場合には最小限の実験(実施例)の数で最大限(赤色点線の円)の範囲で権利化できることになる。

しかし，図3の(b)のようにした場合には本命の周辺が手薄になり，最適な候補物質を取り逃がすリスクが高くなるというデメリットがある。したがって，図3の(c)のように本命と予想される周辺を比較的手厚くし，かつ特許化できると予想できる範囲にまんべんなく実験を割り振っていくことが現実的な戦略になると思われる。

4．研究開発における特許戦略

研究開発の最上流では遺伝子機能の解析，創薬のターゲットになる酵素や受容体などのいわゆるリサーチツール，スクリーニング方法などが特許の対象となりうる。

ところで，医薬分野における特許出願例としては，例えば下記のごとき順序の出願戦略が一例として考えられる。

①スクリーニング方法特許

②リード化合物の物質特許および医薬組成物特許(用途特許)

③最適化化合物(開発候補化合物)の物質特許

④最適化合物(開発化合物)の物質特許

⑤製剤特許，第2用途特許(効能追加)，結晶特許，併用特許(例：糖尿病薬と血圧降下剤との併用による糖尿病の治療の相乗効果)等

本稿では中流に位置する開発研究について述べてみたい。

(1) 化合物特許

化合物特許は医薬における有効成分自体についての特許であり，極めて強力な権利である。すなわち，その化合物に関しては，どのような用途（たとえ，その化合物特許の明細書には記載されていない用途であっても）に使用される場合であれ，またいかなる製法によって製造された化合物であれ，その特許権の権利が及ぶという強力なものである。

現在の創薬においては，化合物ライブラリーの整備とハイスループットスクリーニングの発達により，創薬のターゲットになるリサーチツールが決定すれば，ライブラリーの中からシード化合物は見つかるという体制になっており，医薬候補化合物のスクリーニングに従事する合成研究者は，シーズ化合物の最適化を図るという任務が課せられることになる。

シーズ化合物から展開する最初の段階は，なるべく広い範囲をカバーする特許をまず取得するため，図3でいえば(b)のような展開が好ましいであろう。より少ない実施例で広い特許を取るためには，例えば，置換基としてハロゲン原子をクレームするのであれば，塩素原子を置換基として1つ合成しておけば十分である。しかし，同じハロゲン原子でもフッ素原子や臭素原子は塩素原子とは電気的，立体的に異なるため，その効果（薬理活性）が大きく変化することがある。したがって，他の置換基を固定してフッ素原子や臭素原子も最低限1例は合成しておいたほうがよいであろう。この過程で，構造活性相関が把握されることになる。

次に，最初の特許の周辺をさらにカバーするために化合物の母核を少し改変して当初の展開とは重複しない化合物を別出願する場合，あるいは最初の特許にカバーされる範囲で開発候補剤をさらに探るための選択発明を別出願する場合には，先の展開で得られた知見を活かして活性に重要である箇所については広い展開を行わない（極端な場合には固定する）のが効率的である。しかし，特許庁の審査においてはそのような事情は考慮されず，ある程度の広い展開を行わなければ特許化できる範囲が狭くなる事態になりかねないので，図3でいえば(c)のような展開が好ましいであろう。

次に，極めて強い物質特許を獲得した事例を紹介する。

3位のR_2として，当時セファロスポリン化合物の3位の置換基として，常套の基として知られていた基を網羅するという極めて広範囲な物質特許である。なお，3位は常套の基であるから，少ない実施例でも許容される。

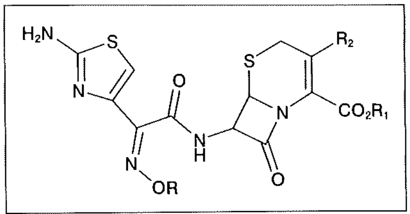

図4　特許第1279958号「セファロスポリン誘導体」

それゆえ，本件特許の「特許請求の範囲」に包含される製品が多く存在し（セフォタキシム，セフメノキシム，セフトリアキソン，セフタジジム，セフェタメット等の12製品），また，それらのほとんどは選択発明として他社特許が成立している。本件特許は極めて広範囲な権利を有するので，選択発明の成立はやむを得ないところであるが，しかし，選択発明は本件特許の利用するものであるから権利侵害になるので，実施料を支払わなければ選択発明の実施をすることができない。その結果，本件特許によって多額の実施料を獲得できたのである。

(2) 結晶特許

結晶特許（塩，水和物，溶媒和物，アモルファスを含む）は，化合物特許に準ずる非常に強い権利になりうるものであり*6，ライフサイクルマネージメント戦略において非常に重要な特許の１つである。しかしながら，特に化合物自体が公知になっている場合には，医薬品分野で結晶多形の存在を検討することは，当業者が通常行うものであったといえ，また，溶解度などの結晶多形間で異なることが予想される物性の相違は予想できるとして*7，結晶特許の取得は難しくなってきている。

現状，結晶特許を取得するためには，結晶自体の取得，すなわち製法が通常の方法と異なり困難性が認められるか，あるいは結晶自体の効果の顕著性が必要になると思われる。

*6大阪高裁平14（ネ）1567号（無定形塩酸ニカルジピン事件）では，「製剤中の無定形塩酸ニカルジピ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，無定形塩酸ニカルジピンの含有量や生成方法の観点からの限定を受けることはないものと判断する。」と判示され，全ニカルジピンのうち少なくとも16％の無定形塩酸ニカルジピンを含むと認定された被告製品の侵害が認められた。

*7知財高裁平成18（行ケ）10271号では，「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，結晶多形がそのような性質を有するからこそ，医薬化合物の製剤設計においては，結晶多形の存在を考慮すべきであるとされているのであり，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。」と判示し，1.4倍の溶解度比を有利な効果として認めなかった。

(3) 製剤特許

従来，日本においては化合物特許の特許存続期間の延長登録が認められた後に当該化合物に関する製剤特許の特許存続期間の延長登録は認められなかったが，平成23年４月28日に言い渡された最高裁判所判決平成21年（行ヒ）第326号において製剤特許においても特許存続期間の延長を認める旨の判決が出て以来，製剤特許のライフサイクルマネージメント戦略上の重要度が増してきている。簡潔に説明すると，従来は，化合物特許の特許存続期間の延長が最大の５年間認められたとすれば，化合物特許の出願から５年以内に製剤特許を出願したとしても延長後の化合物特許の満了前に製剤特許が満了してしまい，ライフサイクルマネージメント戦略上有効な特許とはならなかった。しかしながら，本判決により，例えば，先行して承認された医薬品の剤形変更に関する製剤特許においては，先行医薬品の製剤をカバーするものではないかぎり，延長することが可能になった（**図５**を参照）。これにより今後，先行して承認された医薬製剤の剤形変更に関する製剤特許を戦略的に取得することがライフサイクルマネージメントにおいて重要になってくるものと思われる。

製剤特許の特徴としては，重要度が高い割には，一般的にはジェネリック医薬品メーカーの参入を完全に阻止することが難しいということ，また，広い特許の取得が難しいか，あるいは特許取得自体も困難な場合があるということである。特許の取得が難しいことは，その裏返しとして無効にすることが困難である場合も少なくない。

ここで，製剤特許の重要性を理解しうる成功例を紹介したい。

武田薬品工業の「リュープリン製剤」（特許第2653255号）である。リュープリンの活性成分である酢酸リュープロレリンはペプチドであるため，消化管内で分解されるので経口投与剤としては不適当である。

発売当初は毎日投与の注射剤であったため，利便性に欠けることから市場は小さいものであった。ところが，化学物質特許の存続期間満了の７年前に埋め込み型製剤の特許権を取得した。この製剤は月１回投与であるため，利便性が大幅に向上し市場は100倍にも拡大した。当該製剤特許のおかげで，リュープリンのライフサイクルは大幅に延びたのである。

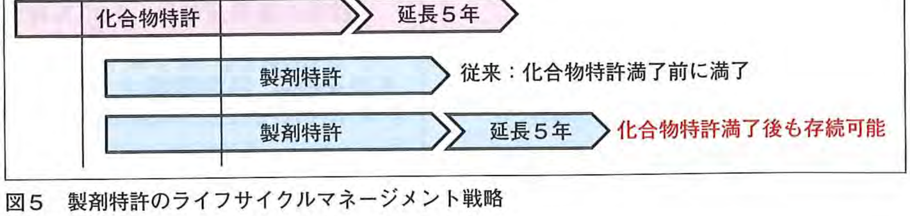

図５　製剤特許のライフサイクルマネージメント戦略

おわりに

上記で紹介した特許のほかに，製法，用途，併用，用量などの特許があげられるが，広く強い特許を取得するための研究開発戦略の基本的な考え方は同じである。

最後に，進歩性を主張するための効果を立証する比較データが審査段階で後出し可能であるのに，実際には提出される場合が少ないということについて提言したい。拒絶理由通知は不定期に発行され，しかも比較的短期間（日本においては２カ月）のうちに応答することが必要なため，比較データの取得を計画的に行うことは一般には困難である。また，審査段階では出願から数年が経過しており，発明者はその時点で別のテーマの開発研究に従事している，あるいは異動しており，比較データを取るための時間が取れない；評価系がすでに止まっており，それを今さら立ち上げることは困難であるなどの理由で比較データを取ることが困難である事情もあるであろう。さらには，思いもよらない先行技術文献を引用され，比較データをあらかじめ用意しておくこともできない場合も多々ある。

しかしながら，そうであっても比較データを取得し，有利な効果を立証することが広い特許を取得することに有利であることは間違いないことであり，特許戦略にも資することになる。したがって，上記のような事情があっても，例えば，外部委託機関などを利用するなどして比較データを取得する体制を整えておくことも重要であることを付言させていただく。

以上，広い特許を取得するための医薬品開発研究者が留意すべき点についての考察を綴らせていただいた。本稿が，強く広い特許を得るための一助になることができれば幸甚である。