

ブラジル
化学分野における特許出願に関する審査指針
INPI 決議第 208 号(2017 年 12 月 27 日付)により制定

目次

1. 序論
2. 化合物
 - 2.1 新規性及び進歩性
 - 2.2 クレームの明確性及び正確性
 - 2.3 マーカッシュ形式の式によって定義された化合物
 - 2.4 塩, N-オキシド, エステル及びエーテル
 - 2.5 プロドラッグ
 - 2.6 反応中間体化合物
 - 2.6.1 主発明としての中間体化合物
 - 2.6.2 付属発明としての中間体化合物
 - 2.6.3 中間体化合物の取得方法
 - 2.7 自然界に存在する化合物
 - 2.8 化合物の選択に関する特許出願
3. 立体異性体
 - 3.1 記載の十分性
 - 3.2 明確性
 - 3.3 新規性
 - 3.4 進歩性
4. 多形
 - 4.1 記載の十分性
 - 4.2 クレームの明確性及び正確性
 - 4.3 新規性
 - 4.4 進歩性
5. 溶媒和物, クラスレート, 共結晶
6. 組成物, 製剤及び組成物の物理的形態
 - 6.1 クレームの明確性及び正確性
7. 化合物の組合せ
 - 7.1 クレームの記載の十分性, 明確性及び正確性
 - 7.1.1 「マーカッシュ式」によって定義された化合物を含む組合せ

- 7.1.2 1又は2以上のクラスの化合物を含む組合せ
- 7.1.3 任意選択で他の活性成分を含む組合せ
- 7.1.4 化合物が分離形態である組合せ

8. 類似方法

9. 既知製品の新規な使用

9.1 新規医薬用途

9.1.1 新規性

9.1.2 進歩性

9.1.3 明細書の十分性及びクレームの裏付け

9.1.4 クレームの明確性及び正確性

1. 序論

本審査指針は、INPIの特許出願に関する審査指針第1部(決議 INPI/PR 第124/2013号—RPI 第2241号, 2013年12月17日付け)及び第2部(決議 INPI/PR 第169/2016号—RPI 第2377号, 2016年7月26日)にある特許性及び手続の一般的側面を補足して、化学分野における特許出願に関する審査の特定の側面について述べる。これは INPI の審査指針を補足するものであることから、当該審査指針を併せて読まなければならない。本文の理解を助けるために、本審査指針全体を通じて、第1部及び第2部の章及び項を特定している。

2. 化合物

2.1 新規性及び進歩性

化合物をクレームする特許出願の特許性要件の技術的審査は、製品一般に適用される同一の手続に従い、特許出願に関する審査指針第 2 部に詳述されている。組成物、製剤及び/又は物理的形態もまたクレームされる化合物特許出願においては、化合物の新規性及び進歩性は、組成物(特許出願に関する審査指針第 2 部 7.6)、製剤及び/又は物理的形態(付属発明)に及ぶとみなされることのみ覚えておくべきである。

2.2 クレームの明確性及び正確性

化合物をクレームする最も正確な方法は、化合物をその化学構造(一般式)、(IUPAC 規則に従う)命名法又は化合物を明確に定義する別の名称によって定義する方法である。上記のように定義することができない場合に限り、特許出願に関する審査指針第 1 部 3.60 及び 3.61 並びに第 2 部 4.17 に定めるように、化合物をその製造方法によって特徴付けることができる。ただし、特許性要件を満たしていることを条件とする。

化合物をその取得方法によって定義するクレームは、それを別の方法で定義することができず、かつ、保護の対象について曖昧にならないようにするために当該方法自体が十分に正確である特別な場合に限り可能である。これは、当該方法から得られる製品が、例えばその副産物を含む故に、当該クレームは、それらが保護する物質について明確でない傾向があるからである。

化合物をその物理的、物理化学的又は生物学的特性のみによって定義する独立クレームは、受け入れられず、その理由は、当該特徴単独では、当該化合物を特定しておらず、請求された事項の明確性及び正確性が損なわれ、法律第 9,279/96 号(産業財産法, LPI)第 25 条に反するからである。例えば、「特性 Y を有することを特徴とする化合物」という種類の独立クレームは、受け入れられず、その理由は、「化合物」という用語は、未定義であり、Y 特性を有する任意の化合物を指すことができるからである。

同様に、化合物をその用途又は使用によって定義する独立クレーム、例えば、「X に使用されることを特徴とする化合物」は、保護されるべき主題について不明確性を示す故に受け入れられない、LPI 第 25 条(特許出願に関する審査指針第 2 部 4.16)。

化合物クレームの明確性はまた、保護範囲を化合物の誘導体を包含するように拡大するためにしばしば用いられる包括的表現の使用によって損なわれ得る。これは、化合物それ自体に加えて、その立体異性体、水和物、溶媒和物、プロドラッグ、エーテル及びエステル又は他の誘導体をクレームする化合物クレームの場合である。これらの表現単独では、誘導体をその化学的種類又は化学的機能によって定義しているにすぎないことから、化合物の誘導体を明確かつ正確に特定していない。特許出願の明細書がこれらの対象を十分に記載している場合には、クレームは、クレームされた主題をより明確に定義するように再構築することができる。

他方で、「薬学的に許容される塩」及び「農学的に許容される塩」などの包括的表現を含む化合物クレームは、受け入れることができ、その理由は、次の通りである。1) 化合物は、活性に関与し、塩は、化合物の活性画分の遊離剤であること、及び 2) 当該技術の熟練者は、その活動分野において一般的に使用される塩に関する知識を有すること

2.3 マーカッシュ形式の式によって定義された化合物

マーカッシュ形式の式によって定義された化合物クレームは、特許出願に関する審査指針第1部3.38及び3.126から3.128まで並びに第2部6.1から6.14までに従って審査される。

2.4 塩、N-オキシド、エステル及びエーテル

先行技術の既知化合物の塩、N-オキシド、エステル及びエーテルは、通常、その産業上の利用により適切な条件を可能にする特性、例えば、溶解度、溶解、安定性及び好適な官能特性を化合物に付与するために用いられる。

塩、N-オキシド、エステル及びエーテルをクレームする特許出願の技術的分析は、化合物一般に適用される同一の指針に従う。新規とみなされるためには、クレームされた塩/N-オキシド/エステル/エーテルは、先行技術において先に記載されてはならない。先行技術が既知化合物の塩/N-オキシド/エステル/エーテルを包括的に先に記載している場合には、クレームされた塩/N-オキシド/エステル/エーテルは、具体的に開示されてはならない(本審査指針2.8並びに特許出願に関する審査指針第2部4.16から4.25まで及び5.31から5.34まで参照)。例えば、本特許出願は、化合物Aのメシル酸塩の保護を請求している。先行技術文献は、化合物A及びその塩を開示しており、好ましい塩として、メシル酸塩、フマル酸塩及び塩酸塩を挙げている。この場合には、クレームされた化合物Aのメシル酸塩は、先行技術において具体的に開示されているとみなされ、したがって、新規でない。他方で、本特許出願が化合物Aのコハク酸塩をクレームしている場合には、前記塩は、先行技術文献の好ましい塩の中に具体的に言及されていないことから、新規とみなされる。

特定の塩、N-オキシド、エステル又はエーテルが基礎化合物の特性を当該技術の熟練者にとって自明でない方法で変化させることができる際には、この塩、N-オキシド、エステル又はエーテルは、進歩性を有するとみなされる。他方で、既知化合物の代替的な塩/N-オキシド/エステル/エーテルの単なる記載は、先行技術に対して自明でないか、又は予想外の技術的効果を有する特性を伴わない場合には、進歩性を有さない。

通常、塩、N-オキシド、エーテル又はエステルを取得する方法は、先行技術の既知の標準的な手順の組合せを伴い、その理由は、これらのクラスの化合物を取得するすべての反応は、文献に記載されており、したがって、当該技術の熟練者にとって自明であるからである。

しかしながら、塩、N-オキシド、エーテル又はエステルが特許性を有するとみなされる場合には、それを取得するための方法は、類似方法(本審査指針第8項)として分析することができ、その結果、当該方法もまた、特許性要件を有する。

化合物それ自体に関するクレームにおける「そのエーテル」及び/又は「エステル」という包括的表現の使用は、誘導体をその化学的クラス又は化学的機能によって定義しているにすぎないことから、化合物のエーテル及びエステル誘導体を明確かつ正確に特定していないと認識される。特許出願明細書がこれらの対象を十分に記載している場合には、クレームの範囲は、クレームされた主題をより明確に定義するように再構築することができる。

他方で、「薬学的に許容される塩」、「農学的に許容される塩」、「免疫学的に許容される塩」及び「N-オキシド」などの包括的表現を含む化合物クレームは、受け入れることができ、その理由は、次の通りである。1) 化合物は、活性に関与し、塩又はN-オキシドは、化合物の活性画分の遊離剤であること、及び2) 当該技術の熟練者は、その活動分野において一般

的に使用される塩に関する知識を有すること

2.5 プロドラッグ

化合物は、プロドラッグ、すなわち、その薬理効果を示すために事前の生体内変換を必要とする化合物として機能することができる。投与後に生体内変換を受けて薬理活性化合物を与える、不活性(又は薬物よりも実質的に低活性の)化合物もまた考えられる。

プロドラッグは、一般的に、薬理活性化合物の物理化学的、生物薬剤学的又は薬物動態学的特性を最適化して、製剤化及び薬物放出に関する障壁、例えば、低い水溶解度、化学的不安定性、低い経口吸収性、前全身性代謝、不適当な中枢神経系透過性、毒性及び局所刺激性を克服するために、特定の化合物の一定の官能基の誘導體から開発される。

この対象の技術的分析は、化合物一般に適用される同一の指針に従う。とりわけ進歩性要件の分析に関しては、一定の場合には、薬物の薬理学的又は薬物技術的特性を改善するための既知の方策が、当該技術の熟練者にとって自明でない効果をもたらし得ることに留意することが重要である。

化合物それ自体に関するクレームにおける「そのプロドラッグ」という包括的用語の使用は、化合物のプロドラッグを明確かつ正確に特定していないことを強調しておく。特許出願明細書がこれらの対象を十分に記載している場合には、クレームの範囲は、クレームされた主題をより明確に定義するように再構築することができる。

2.6 反応中間体化合物

中間体は、狭義には、別の化合物(又は化合物群)の製造経路において使用され、化学的及び/又は物理的変換によって、その同一性を失う化合物(又は化合物群)である。簡略化のために、「化合物」への言及は、「化合物群」を包含する。本審査指針の文脈において、中間体は、中間体それ自体又は出発物質(前駆体)であり得る。

当然ながら、特定の化合物の前駆体(中間体)として機能することに加えて、殺虫剤、医薬品、染料などの最終用途も有する化合物が存在し得る。しかしながら、この場合には、すなわち、それらが医薬品などとして機能する場合には、それらは、本審査指針の意味における「中間体」ではなくなり、前項に従って分析すべきである。

上記の説明を考慮して、次の2つの状況が生じ得る。

(1) 中間体が主発明である場合

(2) 中間体が慣習的に「付属発明」と称されるものであり、主発明が最終化合物又は化合物を取得するための方法であり得る場合

中間体化合物が主発明でない場合には、中間体及びその調製が、化合物(最終製品)及び/又はその調製方法である主発明と同一の発明概念に属するか否かを評価すべきである。ここでは、審査指針第1部3.119から3.125までに含まれる指針が適用される。

両方の場合において、中間体に関するクレームは、必ず製品クレームであり、本審査指針に記載された最も適切な指針を適用することによってそのように扱うべきであると認識される。また、両方の場合において、中間体を取得する方法についてのクレームは、受け入れられる。

2.6.1 主発明としての中間体化合物

中間体に関するクレームは、必ず化合物クレームであり、この対象の技術的分析は、化合物

一般に適用される同一の指針に従う。

中間体の進歩性は、中間体としてのその用途及び先行技術の化合物に対するその差異に基づいて判断しなければならない。したがって、最も近い先行技術が、クレームされた中間体に類似した化合物を開示しているが、他の化合物の取得におけるその用途、すなわち、中間体としてのその用途を示唆していない場合には、先行技術の化合物に類似した化合物を合成中間体として使用することは、当該技術の熟練者にとって自明又は明白でないと理解される。

最も近い先行技術の化合物が中間体の機能を有する場合には、クレームされた化合物の中間体機能を考慮して、クレームされた(中間体)化合物と先行技術の化合物との差異が自明であるか否かを評価するために、これらの差異を観察しなければならない。

2.6.2 付属発明としての中間体化合物

中間体が主発明としての別の化合物に関する特許出願における付属発明である場合には、主発明と中間体との効果/活性/目的が異なることから、主発明の新規性及び進歩性を中間体に当てはめることはできない。

中間体化合物が主発明でない場合には、中間体及びその調製が、化合物(最終製品)及び/又はその調製方法である主発明と同一の発明概念に属するか否かを評価すべきである。ここでは、審査指針第1部3.119から3.125までに含まれる指針が適用される。

2.6.3 中間体化合物の取得方法

中間体の取得方法は、特許出願の主発明を構成することができるが、最も一般的なものは、最終化合物又は更に中間体の主発明の付属発明である。

中間体を取得する方法が発明である前者の場合には、中間体の方法クレームは、次のものを定義しなければならない。

- (1) 出発物質、取得される製品及び出発物質を取得物質に変換する手段、及び
- (2) 提案された目的を達成するために必要な種々の工程

2.7 自然界に存在する化合物

自然界に存在する化合物は、LPI第10条(IX)の規定に従って、発明とみなされない。

天然に存在する対応物を有する合成化学的に取得される化合物であって、自然界に存在する化合物と区別することができないものもまた、発明とみなされない。この側面については、特許出願に関する審査指針第2部1.43及びバイオテクノロジー分野における特許出願に関する審査指針4.2.1.1においてより詳細に述べている。

2.8 化合物の選択に関する特許出願

一部の特許出願は、先行技術に記載された広範なクラスの化合物、例えば、マーカッシュ形式の一般式によって定義された化合物からの化合物の選択を扱う場合がある。通常、上記の文献は、新規クラスの化合物に言及している。

化合物の選択についての特許出願に関する技術的審査の手続は、特許出願に関する審査指針第2部4.19から4.25まで及び5.31から5.34までに詳述されている。

一般に、新規とみなされるためには、選択された化合物は、例示、試験、結果、一覧、表、命名法、個別の構造式又は調製方法の形で、先行技術において具体的に開示されてい

らない。進歩性に関しては、前記化合物の選択は、当該技術の熟練者にとって先行技術の教示から自明又は明白であってはならない。常に、これは先の文献において既に一般的に記載された化合物の選択であることから、化合物の選択についての特許の進歩性要件の評価は、先行技術に対する比較データの提示を必要とする。特許出願に関する審査指針第2部4.19及び5.32に規定したように、比較は、最も近い技術水準に対して行わなければならない、これは、この場合には、先行技術において開示された構造的に最も高い類似性を有する化合物に相当する。

以下のものは、化合物の選択についての特許出願に関する技術的審査において生じ得る3つの状況を示すいくつかの例である。1) 新規性及び進歩性を欠く化合物の選択、2) 進歩性を欠く新規化合物の選択、及び3) 新規性及び進歩性を有する化合物の選択

例1：新規性及び進歩性を欠く化合物

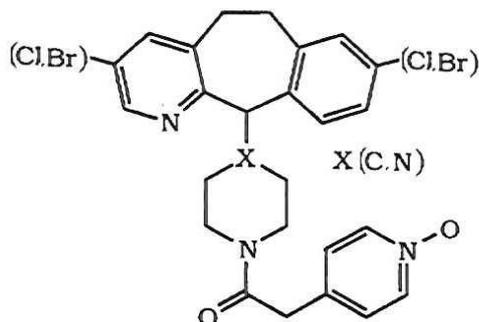
本発明

増殖性疾患の治療に有用な三環式アミド化合物

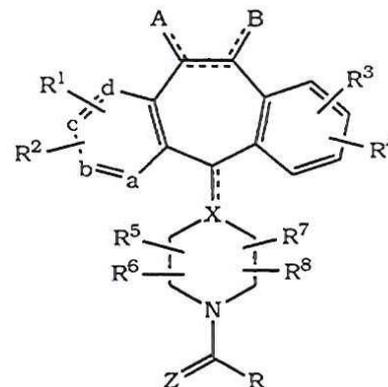
先行技術

先行技術文献は、増殖性疾患の治療にも使用される三環式アミド又は尿素化合物を開示している。

本発明



先行技術



技術的分析

選択された化合物は、先行技術文献のマーカッシュ式で一般的に開示された化合物の中の限定された群を表す。分析中の出願において選択された当該化合物は、先行技術文献において例示された化合物には相当しないが、前記文献において好ましい当該化合物の中に記載されている。それにより、クレームされた化合物は、先行技術において具体的に開示されているとみなされ(特許出願に関する審査指針第2部4.21から4.23まで)、新規性要件を満たしていない。

進歩性を証明するために、出願人は、選択された化合物と、先行技術において具体的に開示された高い構造的類似性を有する化合物とを比較する一連の生物学的試験を提示した。しかしながら、クレームされた化合物が新規でないという事実を照らして、それらはまた、進歩性の要件を満たしていない。

例 2：進歩性を欠く新規化合物

本発明

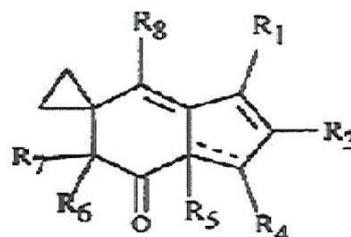
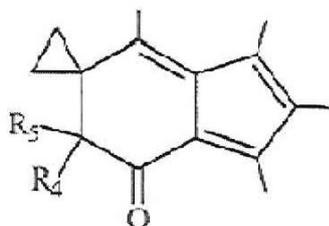
本願は、哺乳動物における腫瘍を治療するための、抗増殖活性を有するイルジン類似化合物に関する。

先行技術

先行技術は、抗増殖剤として有用なイルジンの類似物質を、マーカッシュ式で包括的に記載している。

本発明

先行技術



技術的分析

選択された化合物は、先行技術文献において一般的に開示された化合物の中の限定された群を表すが、具体的に開示されていないことから(特許出願に関する審査指針第 2 部 4.21 から 4.23 まで)、新規とみなされる。

出願人は、クレームされた化合物と、先行技術において具体的に開示された高い構造的類似性を有する化合物との抗増殖活性を比較する試験結果を提示した。クレームされた化合物の抗増殖活性は、先行技術において開示された化合物に非常に類似していたことから、提示された結果は、先行技術に対して自明でない効果を証明しなかった(特許出願に関する審査指針第 2 部 5.33)。したがって、クレームされた化合物は、新規とみなされるが、進歩性の要件を満たしていない。

例 3：新規性及び進歩性を備える化合物

本発明

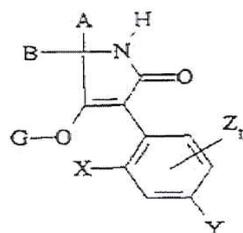
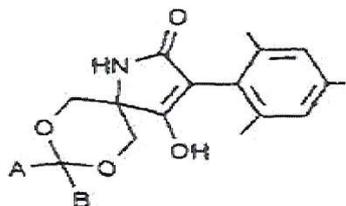
本特許出願は、フェニル置換環状ケトエノール、その調製方法並びに殺虫及び除草組成物におけるその使用に関する。

先行技術

先行技術は、審査中の特許出願において選択された化合物を包含する、殺虫及び除草活性を有する環状ケトエノールの包括的記載を開示している。

本発明

先行技術



技術的分析

選択特許出願においてクレームされた化合物は、先行技術文献においてマーカッシュ式で一般的に化学的に規定された誘導体であるが、具体的に開示されていないことから、新規とみなされた(特許出願に関する審査指針第2部4.21から4.23まで)。

対象の進歩性を裏付けるために、先行技術において具体的に開示された高い構造的類似性を有する化合物と比較して、クレームされた化合物の自明でない技術的效果を明確に証明する試験データが提示されている。かくして、選択された化合物は、当該技術の熟練者にとって自明でないといなされた(特許出願に関する審査指針第2部5.34)。

3. 立体異性体

異性体は、同一の分子式を有するが、性質、その原子の結合順序又は空間的配置が異なる化合物である。下記に定義するエナンチオマー、アトロプ異性体及びジアステレオ異性体は、同一の分子式を有するが、その原子の空間的位置が異なる異性体のクラスに属する。

エナンチオマーは、キラル中心を有し、互いに重ならない鏡像を有する分子である。ジアステレオマー化合物は、互いに鏡像でなく、異なる物理化学的特性を有する立体異性体である。アトロプ異性体は、純粋な化学種として単離することができ、(通常は非常にかさ高い置換基に起因する)単結合の回転の束縛により生じる、配座異性体のサブクラスである。

立体異性体混合物は、任意の比の立体異性体の混合物である。

ラセミ混合物は、等モルの立体異性体の混合物である。

3.1 記載の十分性

純粋な形態の立体異性体の明確かつ十分な記載は、特許出願時におけるそのキラル中心の絶対配置の特徴付けにある。

円二色性、(キラルシフト試薬添加又は無添加の)核磁気共鳴、円複屈折、旋光分散、(キラルカラムを用いた)クロマトグラフィー、偏光分析及び単結晶 X 線回折などの分析技術を、クレームされたエナンチオマー/アトロプ異性体/ジアステレオ異性体の特徴付けに使用することができる。

不斉合成又は化合物の合成後の精製過程の何れかによる立体異性体を取得する方法のパラメータは、当該技術の熟練者によるその再現性を保証するために、明細書に明記しなければならない。製造過程におけるキラル化合物のラセミ化の可能性に起因して、明細書が、(主にキラル中心形成段階において)使用される試薬、反応条件、前記方法によって取得された立体異性体の単離及び精製方法を開示することが重要である。明細書はまた、取得される可能なエナンチオマー過剰率及びその測定に使用される分析方法を記載すべきである。

3.2 明確性

立体異性体は、正式命名法(IUPAC)又はそれを明確に特定する他の方式によって定義しなければならない。

化合物それ自体に関するクレームにおける「立体異性体」という包括的用語の使用は、化合物の立体異性体を明確かつ正確に特定していないことを強調しておく。特許出願明細書がこれらを十分に記載している場合には、クレームの範囲は、クレームされた主題をより明確に定義するように再構築することができる。

3.3 新規性

立体異性体化合物は、先行技術がクレームされたエナンチオマー/アトロプ異性体/ジアステレオ異性体を記載していない場合には、新規とみなされる。新規性はまた、自然界から単離されたエナンチオマー/アトロプ異性体/ジアステレオ異性体が先行技術に記載されており、その対掌体が今回クレームされている場合に発生する。

しかしながら、先行技術において、化合物がラセミ混合物などの立体異性体混合物として既に開示されていることから、エナンチオマー的に純粋な又はアトロプ異性的に純粋な化合物は、新規とみなされず、その理由は、立体異性体混合物は、両方の立体異性体を既に有する

からである。先行技術が記載された化合物のキラル中心の絶対配置を明記しておらず、当該化合物の合成方法において如何なるキラル作用も観察されない場合には、エナンチオマーの配分が均等に生じる、すなわち、ラセミ混合物であるとみなされることを強調しておく。

ジアステレオ異性体を扱う特許出願の場合には、新規性は、先行技術がクレームされたジアステレオ異性体を具体的に記載していない場合に証明される。一部の場合には、クレームされたジアステレオ異性体の新規性の評価は、クレームされたジアステレオ異性体と先行技術とを比較することができるように既知化合物の特徴付けデータを提示することによってのみ可能である。この場合には、クレームされたジアステレオ異性体の特徴付けに用いた同一の分析技術を、先行技術において開示された立体異性体の試料に適用すべきである。

立体異性体のうち 1 のみを含む組成物は、先行技術がラセミ混合物又は他の立体異性体混合物の形態の当該化合物を含む組成物を記載していても、新規とみなされる。この場合には、組成物クレームの表現は必ず、保護が先行技術において既に記載されたラセミ組成物又は立体異性体を含む他の組成物も対象とする可能性を排除しなければならない。特に、「からなる」という用語の使用は、限定的用語とみなされることから、組成物の構成要素をクレームにおいて定義されたもののみ限定する(特許出願に関する審査指針第 1 部 3.48)。例えば、「化合物 X の R-エナンチオマーとビヒクルとからなる組成物」という種類のクレームは、クレームされた組成物において定義されたもの以外の他の立体異性体の存在を排除している。

「ビヒクル」(賦形剤、アジュバント、担体など)という用語は、R-エナンチオマーの担体物質に関するものであり、したがって、(不活性成分である場合でも)S-エナンチオマーを含まないことに留意されたい。他方で、「含む」という用語の使用は、組成物クレームの保護範囲を広くし、新規性が損なわれる。例えば、「化合物 X の R-エナンチオマーとビヒクルとを含む組成物」という種類のクレームの表現は、構成要素をクレームされた組成物において定義された要素のみ限定しておらず、これは、立体異性体 R に加えて、立体異性体 S を含めた他の構成要素を含むことができる(特許出願に関する審査指針第 1 部 3.49)。しかしながら、「化合物 X の R-エナンチオマーとビヒクルとを含み、化合物 X の S-エナンチオマーを含まない種類の組成物」は、クレームされた組成物の S-エナンチオマーの存在を排除しているという事実を照らして、新規とみなすことができる。

明確な構成(所定の立体異性体過剰率)を有する立体異性体混合物からなる組成物は、先行技術において先に開示されていないことを条件として、新規とみなされる。例えば、「化合物 X の R-エナンチオマーとビヒクルとを含み、エナンチオマー過剰率が 70%超である組成物」という種類のクレームは、新規とみなすことができる。

単離されたエナンチオマー/アトロプ異性体の使用は、先行技術が当該目的でのそのラセミ混合物の使用を既に開示している場合には新規でない。化合物のジアステレオマーを扱うクレームについても、先行技術が前記化合物についてのクレームされた使用を先に記載している場合には、同様とみなされる。

出願が単離された立体異性体化合物の新規な使用に関する場合には、審査は、特許出願に関する審査指針第 1 部 3.73 から 3.76 まで及び第 2 部 4.18 並びに特許出願に関する審査指針—化学、既知製品の新規な使用に関する項に基づくべきである。

3.4 進歩性

先行技術の化合物の目的が既知である場合には、この化合物の純粋な立体異性体は、同一の

目的を示すと予想される。したがって、当該技術の熟練者は、最も好適な産業上の使用、例えば、最も活性な立体異性体形態を特定する目的で、この立体異性体を取得するよう動機付けられると考えられる。立体異性体を含む組成物の進歩性の分析にも、同一の推論を適用すべきである。

出願が単離された立体異性体化合物の新規な使用に関する場合には、審査は、特許出願に関する審査指針第1部 3.73 から 3.76 まで及び第2部 5.40 から 5.45 まで並びに特許出願に関する審査指針—化学、既知製品の新規な使用に関する項に基づくべきである。

4. 多形

多形とは、化合物が、規則的な結晶格子における分子の配置及び/又は配座が異なる 1 又は 2 以上の結晶相として存在し得ることを指す。非晶質固体は、不規則な分子配列を有する固体からなり、明確な結晶格子を有さない。

4.1 記載の十分性

結晶形の特徴付けのために、明細書は、出願日において、固体の物理化学的特徴付け技術、例えば、下記に例示するものによって又はそれを最も明確に特定する検証済みの代替的技術によって取得された同定データを含むべきである。

- (a) 単結晶 X 線回折(単結晶 XRD)
- (b) 粉末法による X 線回折(粉末法による XRD)
- (c) 固体炭素-13 核磁気共鳴分光法 (^{13}C NMR)
- (d) 赤外領域での分光法
- (e) ラマン分光法
- (f) 電子顕微鏡法
- (g) 熱分析：示差走査熱量測定(DSC)、熱重量分析(TG)及び示差熱分析(DTA)

単結晶 XRD 技術は、固体の結晶構造の完全な特徴付けに十分であることに留意すべきである。単結晶 XRD データが提供されない場合には、指数付け粉末法による XRD 技術を、他の固体の物理化学的同定方法とともに使用すべきである。ただし、一連の技術が結晶形の明確な特定に十分であることを条件とする。本審査指針に定めがないより高度な固体特徴付け技術は、クレームされた結晶性固体の特定に対するその適切性について評価されることに留意すべきである。結晶性固体の特徴付けデータがない場合には、明細書は、対象を明確かつ十分に記載していないとみなされる。クレームされた固体の特徴付けデータを特許出願後に提示することは、事項の追加とみなされることから、許可されないことに留意されたい。

結晶形を取得する方法のパラメータは、当該技術の熟練者によるその再現性を保証するために、明細書に明記しなければならない。これらの方法における不可欠なパラメータ、例えば、溶媒及びその濃度、溶媒の添加速度、加熱及び冷却速度の表示、結晶化過程において使用される種結晶の取得方法の記載並びに重要と考えられる他のパラメータが検討される。

クレームされた結晶形は、調製方法の一部とみなされ、すなわち、方法が当該技術の熟練者によるその再現が可能となるように十分に記載されているとみなされるために、当該方法によって取得される多形を、明細書において十分に特徴付けるべきであることに留意すべきである。

4.2 クレームの明確性及び正確性

結晶形の特定は、その構造を定義する物理化学的パラメータによって行われる。 α 型又は β 型、形態 I 又は形態 II などの名称による単なる命名は、結晶形を明確かつ正確に定義していない。以下のものは、明確かつ正確な表現による結晶形のクレームの例である。

例 1：示差走査熱量測定(DSC 2K min^{-1})によって測定して 151°C の融点を有し、X 線ディフракトグラムにおいて 7.5, 10.1, 12.0, 12.4, 13.7, 15.0, 16.0, 17.3, 17.7, 18.0, 19.2, 19.8, 20.7, 21.0, 22.2, 22.7, 22.9, 23.6, 24.1, 25.6 及び 30.5 の反射 (2θ) を各相対強

度 11.4, 63.0, 19.0, 21.0, 7.6, 15.2, 9.5, 7.6, 5.7, 14.3, 5.7, 23.0, 11.4, 11.4, 61.0, 100.0, 13.3, 7.6, 28.6, 9.5 及び 7.6 で示し, 赤外スペクトルにおいて 3338, 1708 及び 1431cm^{-1} に最大ピークを示し, ^{13}C 固体 NMR スペクトルにおいて 107.9, 118.2 及び 135.0ppm に最大ピークを示し, ラマンスペクトルにおいて 3080, 1580 及び 122cm^{-1} に最大ピークを示すことを特徴とする, 化合物 X の結晶形。

例 2 : 単結晶 X 線ディフラクトグラムにおいて 7.5, 10.1, 12.0, 12.4, 13.7, 15.0, 16.0, 17.3, 17.7, 18.0, 19.2, 19.8, 20.7, 21.0, 22.2, 22.7, 22.9, 23.6, 24.1, 25.6 及び 30.5 の反射 (2θ) を各相対強度 11.4, 63.0, 19.0, 21.0, 7.6, 15.2, 9.5, 7.6, 5.7, 14.3, 5.7, 23.0, 11.4, 11.4, 61.0, 100.0, 13.3, 7.6, 28.6, 9.5 及び 7.6 で示すことを特徴とする, 化合物 X の結晶形。

4.3 新規性

結晶形の識別的特徴は, 物理化学的パラメータに基づく。一般に, 最も近い先行技術は, 大抵の場合, その結晶構造について特徴付けられていない当該化合物の取得を開示しているものである。そのような場合には, クレームされた結晶形の新規性を評価するために, 特許出願時又は技術的審査中に, 先行技術に記載された固体化合物の物理化学的特徴付けデータを提示することができる。

先行技術がクレームされた結晶形を既の開示している場合には, 他の形態との混和物であっても, その濃度に拘らず, クレームされた結晶形は, 新規とみなされない。

先行技術が非固体状態 (例えば, 液体状, ペースト状又は油状) の当該化合物を記載している場合には, 先行技術の化合物の物理化学的特徴付けデータはなくてもよく, その理由は, これらの状況下では, クレームされた多形の新規性について疑義が生じていないからである。

4.4 進歩性

単一の化学物質であり, 異なる結晶ネットワークの形成の可能性が固体の固有の特性であっても, 多形態は, 製品調製方法及び保存期間の両方において又は更に化学的効果の観点から, 異なる物理化学的特性を有し得る。

しかしながら, 化合物の結晶性固体についての調査は, 化合物一般の物理化学的特徴を改善するための業界の慣行であることに留意することが重要である。したがって, 既知化合物の代替的な結晶性固体の単なる記載及び特徴付けは, 当該固体に自明でない特性又は先行技術に対する技術的進歩を伴わない場合には, 進歩性を有さない。

5. 溶媒和物, クラスレート, 共結晶

一部の結晶性固体においては、溶媒が、化学量論的又は非化学量論的割合で、化合物の結晶ネットワークに取り込まれ得る。これらの分子付加物は、溶媒和物と称され、擬多形とも称される。水が結晶化溶媒である場合には、得られる固体は、水和物と称される。

溶媒和物が(意図的か否かを問わず)結晶格子に取り込まれた溶媒の分子を失い、結晶が溶媒和物の構造を保持する場合には、取得された固体は、脱溶媒和物と称される。この物質は、1種類の分子のみから構成される結晶形を指すことから、本審査指針の多形に関する項において論じたように評価すべきである。

一方、クラスレートは、分子(ゲスト)が宿主分子又は宿主分子ネットワークの空隙に捕捉された包接化合物(例えば、シクロデキストリン包接複合体)である。

一般に、溶媒和物、クラスレート及び共結晶は、以下の共通の特徴を有する。

- 1) すべて、少なくとも2分子によって形成されること
- 2) すべて、異なる結晶形を呈し得ること
- 3) すべて、結晶の構造及び構成要素によって異なる特徴を有し得ること

その発明がこれらの製品の何れかである特許出願においては、次のことを考慮しなければならない。

- 1) 溶媒和物、クラスレート、結晶又は共結晶複合体の明確かつ十分な記載のためには、分子及び化学量論の化学的同定が必須であり、これは、熱重量分析技術(TG)、カール・フィッシャー又は当該情報を提供する他の検証済みの技術によって決定することができる。
- 2) 保護されるべき発明が溶媒和物である場合には、本審査指針の化合物の項及び INPI の特許出願に関する審査指針を主題の評価のために参照すべきであり、その理由は、溶媒和物は、その溶媒和されていない又は無水の対応物とは異なる化合物とみなされるからである。
- 3) 保護されるべき発明が結晶形(クラスレート、共結晶又は溶媒和物の結晶形)である場合には、結晶形の構成要素及び構造の両方を定義するために、INPI の特許出願に関する審査指針に加えて、本審査指針の多形に関する項に記載された技術によって、これを物理化学的に特徴付けなければならない。
- 4) 化合物それ自体に言及しているクレームにおける「その溶媒和物」、「水和物」、「そのクラスレート」及び/又は「その共結晶」という包括的用語の使用は、化合物の溶媒和物、水和物、クラスレート及び共結晶を明確かつ正確に特定していない。特許出願明細書がこれらの対象を十分に記載している場合には、クレームの範囲は、クレームされた主題をより明確に定義するように再構築することができる。

6. 組成物、製剤及び組成物の物理的形態

組成物、製剤及び組成物の物理的形態のクレームは、特許出願に関する審査指針第 2 部 7.1 から 7.15 までに従って審査される。

6.1 クレームの明確性及び正確性

特許出願に関する審査指針第 2 部 7.1 から 7.15 までにおいて論じたように、組成物は通常、その構成要素のみによって定義される。しかしながら、組成物は、その構成要素によって定性的及び/又は定量的に定義されている限りにおいて、物理的特徴又は用途特徴を包含するように、複合的特徴によって更に定義することができる。以下に、組成物の補足例をクレームの明確性及び正確性の分析(LPI 第 25 条)に重点を置いて提示する。

例 1:

クレーム 1: 化合物 A 並びに添加剤 B 及び C を含むことを特徴とする医薬組成物。

クレーム 2: 経口投与用であることを特徴とする、クレーム 1 に記載の医薬組成物。

本組成物は、クレーム 1 においてその構成要素によって定義されており、投与形態は、クレームされた事項を経口使用のための組成物(錠剤、カプセル剤、シロップ剤など)の分野に限定する追加の特徴であることから、LPI 第 25 条に準拠している。

クレーム 3: カプセル形態であることを特徴とする、クレーム 1 に記載の医薬組成物。

本組成物は、クレーム 1 においてその構成要素によって定義されており、「カプセル形態である」という表現は、クレームされた主題の更なる特徴であることから、LPI 第 25 条に準拠している。

クレーム 4: 喘息の治療用であることを特徴とする、クレーム 1 に記載の医薬組成物。

本組成物は、クレーム 1 においてその構成要素によって定義されており、その用途は、クレームされた事項を喘息の治療に有用な製品の分野に限定する追加の特徴であることから、LPI 第 25 条に準拠している。

クレーム 5: 30 分未満で成分 A の 80%を放出することを特徴とする、クレーム 1 に記載の医薬組成物。

本組成物は、クレーム 1 においてその構成要素によって定義されており、成分 A の放出は、クレームされた物質の特性を伝える追加の特徴であることから、LPI 第 25 条に準拠している。

例 2:

クレーム 1: 経口投与用の、化合物 A 並びに添加剤 B 及び C を含むことを特徴とする医薬組成物。

本組成物は、その構成要素によって定義されていることから、LPI 第 25 条に準拠している。投与形態に関する情報は、クレームされた対象を経口使用のための組成物(錠剤、カプセル剤、シロップ剤など)の分野に限定する追加の特徴である。

例 3:

クレーム 1: 化合物 A 並びに添加剤 B 及び C を含むことを特徴とする、経口投与用医薬組成物。

本組成物は、その構成要素によって定義されていることから、LPI 第 25 条に準拠している。

投与方法に関する情報は、クレームされた対象を経口使用のための組成物(錠剤、カプセル剤、シロップ剤など)の分野に限定する追加の特徴である。

例 4 :

クレーム 1 : 喘息を治療するための、化合物 A 並びに添加剤 B 及び C を含むことを特徴とする医薬組成物。

本組成物は、その構成要素によって定義されていることから、LPI 第 25 条に準拠している。組成物の使用に関する情報は、クレームされた事項を喘息の治療に有用な製品の分野に限定する組成物の追加の特徴付けであるにすぎない。

例 5 :

クレーム 1 : 疾患 Y の治療用であることを特徴とする、化合物 A と添加剤 B 及び C とを含む医薬組成物。

本組成物は、その構成要素によってではなくその用途によって特徴付けられていることから、明確性(LPI 第 25 条)の欠如により受け入れられない。この場合には、LPI 第 25 条に適合するように、組成物の構成要素を特徴部分に移動させることによってクレームを書き換えることが可能である(特許出願に関する審査指針第 1 部 3.04 から 3.09 まで)。

組成物が先行技術において既知である場合には、本クレームもまた新規でなく、その理由は、組成物の使用に関する特徴は、製品に新規性を付与しないからである。

例 6 :

クレーム 1 : 30 分未満で活性成分の 80%を放出することを特徴とする組成物。

本組成物は、その構成要素によって特徴付けられていないことから、明確性(LPI 第 25 条)の欠如により受け入れられない。活性成分の放出割合は、クレームされた事項を定義していない。

例 7 :

クレーム 1 : スプレーの形態であることを特徴とする殺虫組成物。

本組成物は、その構成要素によって特徴付けられておらず、適用形態は、クレームされた事項を定義していないことから、明確性(LPI 第 25 条)の欠如により受け入れられない。

例 8 :

クレーム 1 : 30 分未満で成分 A の 80%を放出することが可能な徐放性錠剤として使用される、化合物 A とその添加剤 B 及び C とを含むことを特徴とする医薬組成物。

本組成物は、その構成要素によって特徴付けられており、剤形及び製品の特性は、組成物の追加の特徴であることから、LPI 第 25 条に準拠している。

例 9 :

クレーム 1 : 化合物 A 並びに添加剤 B 及び C を含むことを特徴とする錠剤。

本錠剤は、その構成要素(この場合には、本発明を構成する組成物の要素)によって特徴付けられていることから、LPI 第 25 条に準拠している。

例 10 :

クレーム 1 : 100mg の A, 220mg の B 及び 200mg の C からなる錠剤の形態であることを特徴とする剤形。

本剤形は、その構成要素及び錠剤の物理的形態によって特徴付けられていることから、LPI 第 25 条に準拠している。

例 11 :

クレーム 1 : 化合物 A とその添加剤 B 及び C とを含むことを特徴とする医薬組成物。

クレーム 2 : A の用量が患者 1kg 当たり 45mg から 90mg までの範囲であることを特徴とする、クレーム 1 に記載の医薬組成物。

従属クレームの追加の特徴は、医薬組成物の投与方法に言及しており、これは、治療レジメンの一部であり、製品に関するものではないことから、明確性(LPI 第 25 条)の欠如により受け入れられない。追加された特徴は、製品それ自体についての情報を追加しておらず、クレームされた物質との不一致を生じさせる。

クレーム 3 : 1 日 2 回投与されることを特徴とする、クレーム 1 に記載の医薬組成物。

従属クレームの追加の特徴は、医薬組成物の投与方法に関するものであり、これは、製品ではなく治療レジメンの一部であることから、明確性(LPI 第 25 条)の欠如により受け入れられない。追加された特徴は、製品それ自体についての情報を追加しておらず、クレームされた物質との不一致を生じさせる。

例 12 :

クレーム 1 : 化合物 A 及び化合物 B を含むことを特徴とする組成物。

クレーム 2 : 任意選択で他の活性成分を含むことを特徴とする、クレーム 1 に記載の組成物。

「任意選択で他の活性成分」という用語は、前記活性成分を定義していないことから、明確性(LPI 第 25 条)の欠如により受け入れられない。

出願明細書が「活性成分」なるものを十分に記載している場合には、クレームは、活性成分を明細書に記載されたものに限定するために再構築することができる。

例 13 :

クレーム 1 : 着色剤として存在するそれぞれ濃度 x 及び y の要素 A 及び要素 B を含み、ガラスの全光線透過率が、厚さ 4mm のガラスについて <20%であることを特徴とする、灰色ソーダ石灰ガラス組成物。

クレーム 2 : ガラスの全光線透過率が、厚さ 4mm のガラスについて <10%であることを特徴とする、クレーム 1 に記載の灰色ソーダ石灰ガラス組成物。

本組成物は、その構成要素及びその各濃度によって特徴付けられていることから、LPI 第 25 条に準拠している。光透過率(物理的パラメータ)は、主題の追加の特徴である。

例 14 :

クレーム 1 : 原料 A(例えば、硝酸アンモニウム)及び原料 B(例えば、硫酸カルシウム)を、それぞれ濃度 X 及び Y で含むことを特徴とする肥料組成物。

クレーム 2 : 80 重量%の濃度の栄養素 Z(例えば, 全窒素)と, 10 重量%の濃度の栄養素 W(例えば, カルシウム)とを含むことを特徴とする, クレーム 1 に記載の肥料組成物。

本組成物は, その原料及びその濃度によって特徴付けられていることから, LPI 第 25 条に準拠している。栄養素及びその濃度は, 組成物の更なる特徴である。

例 15 :

クレーム 1 : 要素 X, Y 及び Z(例えば, 炭素, 水素, 窒素, リン, カリウム・・・)からなることを特徴とする肥料組成物。

本組成物は, 当該要素を含む原料によって特徴付けられておらず, その濃度も明記していないことから, 明確性(LPI 第 25 条)の欠如により受け入れられない。

7. 化合物の組合せ

組合せは、特定の最終製品を目的とする 2 以上の化合物の集合である。組合せは、単一形態で又は同時適用のための分離形態で含まれ得る。組合せに関する審査については、特許出願に関する審査指針第 2 部 5.24 から 5.30 まで及び 7.16 から 7.23 までを考慮すべきである。組合せに関する発明の特定の場合には、集合した化合物間の相互作用は、自明でない効果、例えば、前記組合せを構成する各化合物の効果の単なる総和である相加効果に相当しない相乗効果又は超相加効果を生じるべきである。

したがって、2 以上の既知化合物の集合の結果が、単独で使用した各化合物について予想される効果の総和である場合には、クレームされた組合せは、進歩性を欠いているとみなされ、その理由は、前記組合せは、予想された技術的效果を生じさせることが知られている化合物の予測可能な組合せに相当するからである。

組合せの自明でない効果の証拠は、多くの場合、同一の実験条件下で、各化合物を単独で使用した場合に観察される効果と、これらの化合物の組合せから得られる効果との比較を可能にするデータの提示を必要とする。

主張された自明でない効果は、先行技術において、例えば、分析中の組合せの化合物と同一のクラスの化合物の組合せにおいて示唆されてはならないことに留意すべきである（特許出願に関する審査指針第 2 部 7.19）。

7.1 クレームの記載の十分性、明確性及び正確性

7.1.1 「マーカッシュ式」によって定義された化合物を含む組合せ

発明が 2 以上の化合物の新規組合せに関するものであり、化合物の少なくとも 1 が「マーカッシュ」形式の式によって定義されている場合、例えば、

「一般式(I)によって定義される化合物を、化合物 A とともに含むことを特徴とする組合せ」においては、クレームの表現の明確性及び正確性に特別な注意を払うべきであり、特許出願に関する審査指針第 2 部(6.13 及び 6.14)を参照すべきである。

7.1.2 1 又は 2 以上のクラスの化合物を含む組合せ

本発明は、その化学的クラス又はその作用機序によって定義された 1 又は 2 以上の群の化合物を含む組合せ、例えば、「ピレスロイド化合物と酵素阻害剤化合物 X とを含むことを特徴とする殺虫剤組合せ」に関する。

組合せに含まれる正確な化合物を明記することなく、組合せの化合物をその化学的クラス又はその作用機序によって包括的な方法で定義することは、保護されるべき事項を明確に定義するのに十分でなく、LPI 第 25 条の規定に反する。

出願の明細書が本発明による化合物のクラスに該当する化合物を十分に記載している場合には、クレームは、化合物を明細書に記載されたものに限定するように再構築することができる。

7.1.3 任意選択で他の活性成分を含む組合せ

新規組合せについての請求は、組合せに関する主クレームに加えて、「化合物 A 及び B 並びに任意選択で他の活性成分を含むことを特徴とする組合せ」という種類の付属クレームを含むことができる。

そのような状況においては、組合せクレームの表現の明確性及び正確性に特に注意を払うべきであり、その理由は、「並びに任意選択で他の活性成分」という用語に言及するのみでは、クレームされた主題を明確に定義するのに十分でなく、LPI 第 25 条の規定に反するからである。

出願の明細書が本発明による他の活性成分に該当する化合物を十分に記載している場合には、クレームの範囲は、保護されるべき物質をより明確に定義するように再構築することができる。

7.1.4 化合物が分離形態である組合せ

化合物が分離形態である組合せに関する出願においては、明細書は、当該組合せが、キットによって請求された場合でも、同時適用のための製品の形態で取得可能であるという証拠を提供しなければならない(特許出願に関する審査指針第 2 部 7.11)。

例：

明細書：

本特許出願は、除草剤 A 及び B を含む組合せに関する。明細書において、組合せの相乗効果は、それらの化合物を別個であるが同時に植物に適用した場合に証明された。

クレーム一覧

クレーム 1：「化合物 A 及び化合物 B を含むことを特徴とする相乗的除草剤組合せ。」

クレーム 2：「クレーム 1 に記載の組合せにより植物を処理することを特徴とする、雑草を制御するための方法。」

クレーム 3：「化合物 A 及び化合物 B が、同時に又は連続して適用される、クレーム 2 に記載の方法。」

技術的分析：クレーム 1 及びクレーム 2 は、特許性要件を満たしていることを条件として、受け入れることができる。これに対して、クレーム 3 は、化合物 A 及び B の適用が連続して行われる可能性を含むことから、受け入れることができない。組合せは、同時適用のための 2 以上の化合物の組合せ製品を指すことから、連続適用の可能性は、保護されるべき物質と不一致である。

8. 類似方法

類似方法は、当該技術において既知の手順の組合せ又は使用を伴うが、先行技術に照らして新規性及び進歩性を有する出発物質及び/又は最終製品を含む。

出発物質及び/又は最終製品についての新規性及び進歩性を特定する際には、類似方法のその各クレームについて当該要件を調査する必要はない。ただし、出発物質及び/又は最終製品の主クレームと相互に関連していることを条件とする。

それにより、類似方法のクレームは、一般的に付属クレームと解釈することができ、その理由は、定義上、新規性及び進歩性の付与は、製品及び/又は出発物質におけるこれらの要件の存在に依存するからである。新規性及び進歩性を有する化合物の合成に関する類似方法に加えて、この概念はまた、とりわけ医薬組成物、農薬、医薬、触媒、潤滑剤、殺虫剤又は除草剤の製造に関する方法に当てはめることができる。

技術的審査により、出発物質及び/又は最終製品が新規性及び/又は進歩性を有しないとみなされた場合には、クレームされた類似方法は、先行技術に対する新規性及び/又は進歩性の欠如により受け入れられない。

別の状況において、技術的審査により、出発物質及び/又は最終製品が新規性及び/又は進歩性を有しないとみなされたが、クレームされた方法が新規性及び/又は進歩性を伴うとみなされた場合には、当該方法クレームは、方法クレームとして審査すべきであり、すなわち、類似方法クレームではなくなる。

類似方法に含まれる工程は、当該技術の熟練者に一般的に周知であることから、明細書においてそれに一般的に言及すれば足りる。

9. 既知製品の新たな使用

本項では、特許出願に関する審査指針第1部3.73から3.76まで並びに第2部4.18及び5.40から5.45までに加えて、既知製品の新たな使用、とりわけ新規医薬用途の発明に関する技術的審査の詳細について述べる。

新たな使用についてのクレームの保護は、新たな目的での既知物質の使用全体に与えられる。かくして、明細書は、請求された新たな使用を明確かつ十分に記載すべきである。

出願が例えば「マーカッシュ式」で特定された種々の化合物の新たな使用の保護を求める場合には、明細書において有効に証明されている化合物の使用のみが、クレームされた使用を証明するために十分に記載されているとみなされる。理論上、特定の「マーカッシュ式」によって定義された化合物は、類似の活性を示し得るが、この効果の同等性を証明する試験が示されない限り、単一化合物の新たな使用を他のすべてに当てはめることはできない。

化合物群の新たな使用を扱う出願は、前記化合物が構造的に関連している(例えば、マーカッシュ式)か、又は同一の作用機序を有する場合には、発明の単一性を有する。医薬分野においては、同一の病因を有する疾患群のための新規医薬用途を扱う出願もまた、発明の単一性を有する。

9.1 新規医薬用途

9.1.1 新規性

新規とみなされるためには、新規医薬用途の発明は、疾患の治療又は予防用医薬を製造するための既知の医薬製品の用途であって、この製品が先行技術において既に用いられた用途以外のものを開示すべきである。

治療計画(用量、投与/適用経路、用量範囲)及び/又は患者群などの化合物の使用に関する特徴は、化合物の既知の使用に新規性を与えない。例えば、先行技術が「疾患 Y の治療用医薬を製造するための化合物 X の使用」を開示しており、本願が「糖尿病患者における Y 疾患の治療用医薬を製造するための化合物 X の使用」をクレームしている場合には、請求された使用は、新規とみなされない。

9.1.2 進歩性

新規医薬用途発明の場合には、進歩性要件を評価するために、いくつかの側面を観察しなければならない。

- (1) 新たな使用に係る化合物の作用機序は、先行技術において既に開示された医薬用途についてのその作用機序から理解されてはならない。
- (2) 新たな使用は、先行技術において開示された使用に関する疾患の病因とは異なる病因を有する疾患の治療に関するものでなければならない。
- (3) 新たな使用は、構造的に関連した分子と比較した薬物の構造活性相関から、すなわち、今回クレームされている同一の活性を示す先行技術において既に開示された他の化合物との構造的類似性から推定されてはならない。
- (4) 新たな使用は、当該薬物に対する先行技術から既知の有害作用の開示から理解されてはならない。
- (5) 新たな使用は、クレームされた使用が異なる疾患に言及していても、先行技術において

既に開示された疾患の症状を治療するための化合物の使用から理解されてはならない。

9.1.3 明細書の十分性及びクレームの裏付け

新規医薬用途についてのクレームの保護は、新規治療用途のための医薬を製造するための既知物質の使用全体に対するものであると理解すべきである。かくして、明細書は、請求された新規な使用を明確かつ十分に記載すべきである。

明細書は、出願時に請求された新規な使用を証明する証拠を提示しなければならない。当該使用の証拠がない場合には、クレームのこの本質的な技術的特徴は、明細書において裏付けられておらず、したがって、当該主題は、十分に記載されていないとみなされる。in vitro 試験の結果は、新規治療用途を示唆し得るが、とりわけ生体内における薬物の挙動に関する薬物動態学的側面に起因して、「in vivo」で確認されないことが多い。したがって、この効果の同等性を証明する追加の情報が提供されない限り、in vitro アッセイの結果を実際の治療用途に当てはめて推定することが常に可能であるとは限らない。動物試験の場合には、採用されたモデルは、治療されるべきヒト又は動物に当てはめて推定する可能性を示すべきである。

出願が「マーカッシュ式」によって定義された化合物の新規医薬用途の保護を求める場合には、有効に証明されている化合物の使用のみが、根拠を有するとみなされる。理論上、特定のマーカッシュ式によって定義された化合物は、類似の用途を有するかもしれないが、この効果の同等性を証明する証拠が提供されない限り、単一化合物の使用を他のすべてに当てはめて推定することはできない。

特許出願に関する審査指針第 1 部 3.89 に従って、出願人は、クレームの裏付けを証明する責任を負い、このために、技術的審査の過程で追加の証拠が受け入れられる。ただし、原出願に既に含まれる情報のみに向けられたものであることを条件とする。

9.1.4 クレームの明確性及び正確性

薬物を調製するための新規な使用のクレームは、治療される疾患を明記しなければならない。障害、症候群、症状又は他の包括的用語、例えば、「胃腸障害」、「呼吸器症候群」に言及する新規な使用のクレームは、保護されるべき事項に関して不明確性を生じさせることから、受け入れられない。

治療される状態に作用機序の観点から言及する新規医薬用途のクレーム、例えば、「セロトニン受容体の選択的占有による疾患の治療用医薬を調製するための化合物 X の使用」又は「セロトニン再取込阻害薬を調製するための化合物 X の使用」は、当該疾患を明確かつ正確に定義していないことから、受け入れられない。

新規医薬用途についてのクレームに含まれる治療計画及び患者群に関する引用もまた、医薬を調製するための化合物の使用を定義しておらず、したがって、事項に不明確性を生じさせることから、受け入れられない。以下のものは、新規医薬用途に関する補足例である。

例 1 :

クレーム : 「疾患 Y の治療用医薬の調製におけるものであることを特徴とする、製品 (又は化合物若しくは活性成分) X の使用。」

本製品の使用は、定義された疾患の治療用医薬の調製のために明確かつ正確な方法で特徴付

けられていることから、第 25 条に準拠している。

例 2 :

クレーム : 「医薬として使用されることを特徴とする製品 X。」

本製品は、その技術的特徴によってではなくその使用によって定義されていることから、明確性(LPI 第 25 条)の欠如により受け入れられない。

加えて、本製品は、先行技術から既知であることから、新規性を示さない(特許出願に関する審査指針第 1 部 3.74)。

例 3 :

クレーム : 「疾患 Y の治療用であることを特徴とする製品 X。」

本製品は、その技術的特徴によってではなくその使用によって定義されていることから、明確性(LPI 第 25 条)の欠如により受け入れられない。

加えて、本製品は、先行技術から既知であることから、新規性を示さない(特許出願に関する審査指針第 1 部 3.74)。

例 4 :

クレーム : 「疾患 Y の治療におけるものであることを特徴とする、製品 X の使用。」

記載のように、これは治療方法に言及していることから、受け入れられない(特許出願に関する審査指針第 1 部 3.76)。

例 5 :

クレーム : 「製品 X を投与することを特徴とする、疾患 Y を治療するための方法。」

記載のように、これは治療方法に言及していることから、受け入れられない(特許出願に関する審査指針第 1 部 3.76)。

例 6 :

クレーム : 「Y 受容体阻害薬を調製するための化合物 X の使用。」

これは、治療されるべき状態に作用機序の観点から言及しており、疾患を明確かつ正確に定義していないことから、明確性(LPI 第 25 条)の欠如により受け入れられない。

例 7 :

クレーム : 「CNS 障害又は症候群の治療用医薬を調製するための化合物 X の使用。」

これは、治療されるべき状態に包括的用語で言及しており、疾患を明確かつ正確に定義していないことから、明確性(LPI 第 25 条)の欠如により受け入れられない。

例 8 :

クレーム : 「疾患 Y の治療用医薬を調製するための製品 X の使用であって、前記医薬を 1 日 3 回経口投与するものである使用。」

クレームの追加の特徴(「・・・前記医薬を 1 日 3 回経口投与するものである」)は、使用(疾患 Y の治療用医薬を調製するための方法)ではなく投与方法(治療レジメンの一部)に言及し

ており，請求と不一致であることから，明確性(LPI 第 25 条)の欠如により受け入れられない。