

中国知財関連ニュース

このニュースは、1100 余名の弁護士、弁理士及びパライーガルを擁し、中国最大規模の総合法律事務所である金杜法律事務所によって編集された、日本の知財関係者にとって有用となる知財関連情報を月 1 回提供するものです。

**KING & WOOD
MALLESONS**
金杜律师事务所

北京市朝阳区东三环中路 1 号
环球金融中心东塔 20 层 邮编 100020
20th Floor, East Tower, World Financial Center
No. 1 Dongsihuan Zhonglu, Chaoyang District
Beijing, 100020, China
T +86 10 5878 5588
F +86 10 5878 5544
patent@cn.kwm.com
www.kwm.com

化合物に関する特許の無効審判段階での安定性分析

金杜法律事務所 特許部
邵紅, 郭煜, 韋嶸, 湛侃¹

はじめに

医薬品分野において、革新的な薬品の研究開発には通常、大量の資金及び人的資源が投入され、数十億ドルの投資や数年に及ぶ実験・審査を経て初めて、その販売が可能となる。したがって、革新的な薬品は、知的財産権保護への依存度が非常に高い特殊分野である。知的財産権、特に医薬品関連特許の保護を強化してこそ、増え続ける革新的な薬品の開発を常に促し、人々の生命と健康に利益をもたらすことができる。

優れた治療効果を発揮する革新的薬品の核心は、例えば化学薬品における活性化合物。薬品活性化合物のスクリーニングは、革新的薬品の研究開発における最初の段階であり、研究開発では時間と資金の投入が最も多い段階の 1 つである。薬品活性化合物は医薬品の核心であり、新たな化合物の発見がなければ、革新的な薬品も生まれえないと言える。これに対応して、化合物の特許も医薬品特許では最も初歩的な特許であり、医薬品特許における核心でもある。

同時に、医薬品分野の特許をめぐる係争も増え続けており、核心的特許である化合物特許が無効審判を請求される案件も、増え続けている。統計によれば、直近 10 年間に化合物特許が全部の無効を宣告された比率は 34.29% であるが、この比率は欧米等の主要市場より高い。また、全部の無効を宣告された案件において、大多数の案件は化合物特許が進歩性を欠くことを理由に、無効を宣告されている。

このため、本テーマではまず、中国のここ 10 年来の化合物特許の無効宣告の審査及び無効紛争の行政訴訟の現状について統計及び分析を行い、欧米での実務と併せて、化合物の進歩性の問題におけるリード化合物の問題、構造修飾の動機及び示唆の問題、並びに実験データ補充の問題について主に比較分析し、対応する提案を示し、関係者のための参考とする。

¹ 執筆者はいずれも北京市金杜弁護士事務所の弁理士である。

第一部分 中国における化合物特許無効審判の統計分析

第一部分ではまず、中国における化合物の無効宣告審査及び無効紛争の行政訴訟について検索及び分析・統計を行う。

一. 無効案件の検索及び分析の方法

国家知識財産局特許局 復審及び無効審理部のホームページの「口頭審理公告決定検索」システムにおいて医薬関連分野の国際分類番号（例えば C07D、A61K、A61P、C07C、C07F、C07K）を検索のキーワードとし 2010～2019 年（直近 10 年）の無効審決を検索するとともに、検索して得られた無効審決の中からさらに授權請求項の主題が医薬品分野の化合物に関わる無効審決を選別し、計 35 件の無効審決を得た。関連無効審決の基本情報は、下記表 1 を参照されたい。

表1. 無効審決35件の基本情報

番号	審決番号	出願番号	発行日	発明の名称	条文 (化合物部分)	結論 (化合物部分)
1	14762	02806025.3	2010/4/12	モノアミン取込の阻害剤	A22.2	全部無効
2	15069	00802685.8	2010/6/24	ω -カルボキシアールで置換された Raf キナーゼ阻害剤としてのジフェニル尿素	A26.3	有効を維持
3	19064	99807521.3	2012/7/19	ピロロ [2, 3-d] ピリミジン化合物並びにその組成物及び用途	A26.3	全部無効
4	20147	02821537.0	2012/12/24	Xa 因子阻害剤としてのラクタム含有化合物およびその誘導体	A22.3	全部無効
5	22284	97197460.8	2014/2/13	ヌクレオチドアナログ	A22.2/A22.3	全部無効
6	24591	03139760.3	2014/12/10	分化および抗増殖活性を有するベンズアミドヒストンデアセチラーゼ阻害剤およびその医薬品	A22.3	有効を維持
7	27258	03108814.7	2015/10/9	チロシンキナーゼ阻害剤としての新規縮合キナゾリン誘導体	A33/A26.3/ A26.4/A22.3	有効を維持
8	31881	01803432.2	2017/3/31	化合物 (I)、その抽出方法および前記化合物を含む薬品組成物	A22.2/A26.3	有効を維持

番号	審決 番号	出願番号	発行日	発明の名称	条文 (化合物部分)	結論 (化合物部分)
9	32428	20091017699 4.1	2017/5/23	シネペジド窒素酸化 物、その調製方法及 び用途	A26.3/A26.4/A 22.2/A22.3	有効を維持
10	33101	20131041411 9.9	2017/8/15	グルコピラノシル置 換フェニル誘導体、 該化合物を含有する 医薬品及びその使用 と製造方法	A26.3/A22.3	全部無効
11	33102	20131037990 6.4	2017/8/15	グルコピラノシル置 換フェニル誘導体、 該化合物を含有する 医薬品及びその使用 と製造方法	A26.3/A22.2/ A22.3	全部無効
12	33103	20131036832 8.4	2017/8/15	グルコピラノシル置 換フェニル誘導体、 該化合物を含有する 医薬品及びその使用 と製造方法	A26.3/A22.2/A 22.3	全部無効
13	33591	99815926.3	2017/10/1 0	新トリアゾロ(4,5- D)ピリミジン化合 物	A22.3	全部無効
14	33610	99814202.6	2017/10/2 0	N-置換されている 2-シアノピロリジ ン系化合物	A26.3/A22.3	有効を維持
15	34167	20061006771 9.2	2017/11/3 0	アンドロゲン受容体 活性を調節するた めのヒダントイン誘 導体とその応用	A26.4	有効を維持
16	34757	20041005914 0.2	2018/1/19	ブンカンカの殻と茎 から抽出された化合 物とその抽出方法と 応用	A22.3/A26.3/A 26.4/R20.1	有効を維持
17	35451	99814202.6	2018/3/29	N-置換されている 2-シアノピロリジ ン系化合物	A26.3/A26.4/A 22.3等	有効を維持
18	35557	99814202.6	2018/3/29	N-置換されている 2-シアノピロリジ ン系化合物	A26.3/A26.4/ A22.3等	有効を維持
19	36170	20048001914 8.4	2018/5/30	修飾されたフッ化ヌ クレオシド類似体	A26.3/A26.4/A 22.2/A22.3	有効を維持
20	36367	20148001941 7.0	2018/6/20	メチル修飾酵素のモ ジュレーター、その 組成物及び使用	A26.4	有効を維持
21	36902	00816941.1	2018/8/8	ピロロ[2,3-d]ピリミジン化合物	A26.3	全部無効
22	37390	20068002554 5.1	2018/9/28	ジアリールチオヒダ ントイン化合物	A22.3/A26.4	有効を維持

番号	審決 番号	出願番号	発行日	発明の名称	条文 (化合物部分)	結論 (化合物部分)
23	37539	2819025.4	2018/10/8	セロトニン再取り込み阻害薬としてのフェニルピペラジン誘導体	A26.3/A26.4/A22.4	有効を維持
24	37633	01813161.1	2018/10/18	ホスホネートヌクレオチドアナログのプロドラッグならびにこれを選択および製造するための方法	A33/A26.3/A26.4/A22.2/A22.3等	有効を維持
25	37674	200680025545.1	2018/10/25	ジアリールチオヒダントイン化合物	A22.3	全部無効
26	38388	201010234711.7	2018/12/17	新生物疾患、炎症および免疫系障害の処置に有用な2,4-ジ(フェニルアミノ)ピリミジン	A26.4	有効を維持
27	38394	201280004097.2	2018/12/21	抗ウイルス化合物としての縮合イミダゾリルイミダゾール	A22.3	有効を維持
28	38507	200680025545.1	2018/12/27	ジアリールチオヒダントイン化合物	A22.3	全部無効
29	39131	01805445.5	2019/2/21	2-オキソ-1-ピロリジン誘導体、それらの製造方法及びそれらの使用	A26.3/A26.4/A22.3	全部無効
30	40981	01813161.1	2019/7/8	ホスホネートヌクレオチドアナログのプロドラッグならびにこれを選択および製造するための方法	A22.3	有効を維持
31	41239	201380065731.8	2019/7/24	ブルトン型チロシキナーゼの阻害剤	A26.3/A26.4/A33/A22.3	有効を維持
32	42407	01807269.0	2019/11/21	ピロール置換2-インドリノン蛋白質キナーゼ阻害剤	A22.2/A22.3	有効を維持
33	42535	201080036154.6	2019/11/25	置換された多環性カルバモイルピリドン誘導体	A22.2/A22.3/A26.4	部分無効
34	42474	02819025.4	2019/11/26	セロトニン再取り込み阻害薬としてのフェニルピペラジン誘導体	A26.3/A22.3	有効を維持
35	42586	01813161.1	2019/12/3	ホスホネートヌクレオチドアナログのプロドラッグならびにこれを選択および製造するための方法	A22.3	有効を維持

以上の情報に基づき、上述の 35 件の無効審決の本文について、無効理由、証拠、請求項の訂正、審判部の意見及び結論等を含め分析を行った。

二、無効案件全体の統計分析

1. 無効審決の年度別分布状況

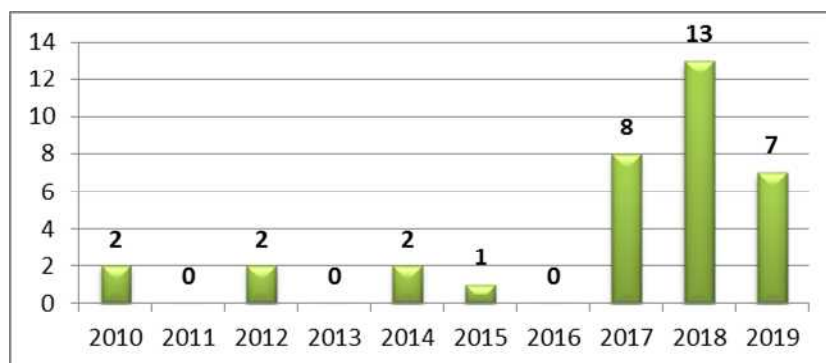


図1 無効審決の年度別分布状況

図 1 に示されているように、2010～2016 年の間、化合物関連特許の無効案件は比較的少なかったが、2017 年から化合物関連特許の無効案件数は顕著に増加しており、特に 2018 年の無効審決は 13 件に達している。

2. 無効理由の分布状況

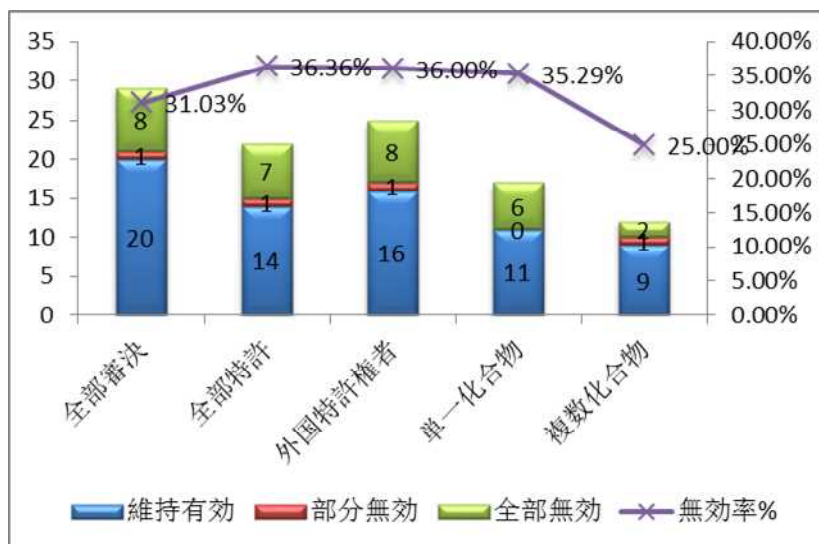


図2 無効理由の分布状況

図 2 に示されているように、化合物関連特許の無効案件での主な無効理由は、進歩性及び記載不備である。統計分析した計 35 件の無効審決のうち、進歩性の無効理由に関わる案件は 24 件で、70% 近くを占めている。これは、化合物関連特許の無効審判において、進歩性が注目されていることを示している。また、記載不備に関わる案件も 17 件あり、50% 近くを占めている。進歩性及び記載不備以外に、サポート要件、新規性及び新規事項追加に関わる無効案件は、6～10 件である。最後に

、数は少ないが、不明確及び他の無効理由（例えば実用性、法 5 条、法 25 条等）に関わる無効案件も存在する。

3. 無効審決の結論の分布状況



注：以上の「無効率」の統計は全部無効及び部分無効の状況を含む。

図3 無効審決の結論の分布状況

図 3 は、各無効審決の結論（化合物関連請求項のみを対象）の分布を分析したものである。まず、計 35 件の無効審決のうち、特許権が維持された審決は 22 件、特許権が部分無効された審決は 1 件、特許権が全部無効された審決は 12 件であった。全部無効率は 34.29%、部分無効率は 2.86%である。

統計分析中に、一部の特許が複数の無効審決に関っている。対応する特許の無効率をより正確に表すために、案件毎に統計を行った（1 つの案件が複数の無効審決に関わる場合も 1 つの案件とした）。その結果、上述の 35 件の無効審決は全部で 28 件の特許に関わっており、そのうち 16 件は特許権が維持され、1 件は特許権が部分無効され、残りの 11 件は特許権が全部無効されていることが分かった。全部無効率は 39.29%、部分無効率は 3.57%である。このような観点で統計を行った無効率は、審決数で算出した無効率より高く、また、化合物特許が無効される比率をより正確に反映することができる。上述の無効率から分かったように、化合物関連案件は、無効審判において 40%近くが全部無効されており、3.57%が部分無効されている。

また、化合物特許が主にマーカッシュの一般式構造及び具体的化合物であることに鑑み、保護する主題にさらに細分化して、その無効結論の分布を分析した。単一化合物の保護（即ち、1 つの具体的化合物のみを保護）に関わる特許について、計 19 件の無効審決のうち、特許権が維持された審

決は 12 件、特許権が全部無効された審決は 7 件であり、無効率は 36.84%である。これに対し、マーカーの一般式又は複数の具体的化合物の保護に関わる特許については、計 16 件の無効審決のうち、特許権が維持された審決は 10 件、特許権が部分無効された決定は 1 件、特許権が全部無効された決定は 5 件で、全部無効率は 31.25%、部分無効率は 6.25%である。化合物請求項は一般的に各特許の核心を構成するものと考えられるが、その核心が単一の具体的化合物のみをカバーしている場合であっても、無効審判では依然三分の一を越える特許が無効されているのである。

最後に、当初の出願書類に技術効果を証明するための定量的な実験データがない特許について統計分析を行ったところ、データがない特許 5 件は、いずれも全部無効となっており、無効率は 100%である。無効審判において進歩性を審査する際の予測外技術効果、及び上記効果に関する補充実験データについては、以下で詳細に説明する。

4. 無効理由ごとの結論の分布

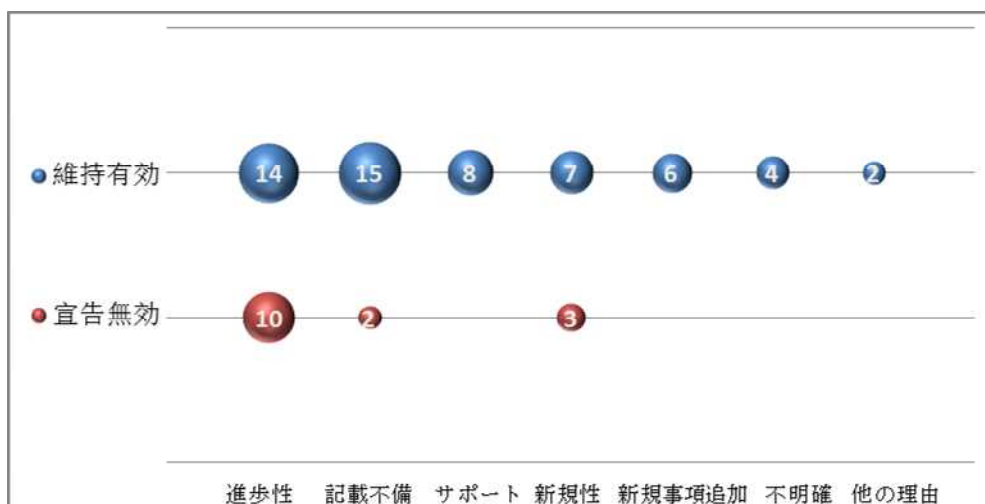


図4 無効理由ごとの結論の分布

図 4 から示されているように、無効審決に無効理由の分布は広範囲に渡っているが、主な理由はやはり、進歩性、記載不備及び新規性である。また、無効理由ごとに、特許権維持及び特許権無効の比率をさらに分析したところ、無効理由は主に、化合物に進歩性が欠如していることが分かった。合計 13 件の無効審決のうち、10 件は請求項の進歩性の欠如が理由とされ、3 件は請求項の新規性欠如、2 件は明細書の記載不備が理由とされている。サポート要件違反、新規事項追加、不明確であるといった理由では、統計を行った範囲で特許権が無効されたもの 1 件もない。

しかしながら説明を加えるべき点として、以上の統計では、特許権者が無効審判中に請求の範囲を訂正した状況が考慮されている。無効請求人が提出したサポート要件や新規性等の無効理由に対し、特許権者が請求項を減縮した場合、最終的な無効審決には、訂正後請求項が対応する欠陥によ

り無効であることは反映されていない。したがって、サポート要件や新規性のような無効理由は、特許保護範囲の減縮に対して、依然として顕著な意義を有する。

三、 中国裁判所の関連判決

1. データ統計

関連データベースを利用し、医薬品分野の国際分類番号（例えば C07D、A61K、A61P、C07C、C07F、C07K）をキーワードに 2010～2019 年の無効審決取消訴訟を検索するとともに、検索して得られた結果の中からさらに、請求項が化合物に関わる判決を選別し、以下の判決を得た。

表2

商品名	特許番号	特許権者	審決/判決番号 及び結論	発行日
レナリドミド	ZL97180299.8	セルジーン	第13179号無効審決 特許権有効	2009/04/13
			第21646号無効審決 特許権無効	2013/10/12
			(2014)一中知行初字第4557号 審決維持（21646号審決対し）	---
			(2015)高行(知)終字第309号 審決維持（21646号審決に対し）	2016/03/18
アピキサバン	ZL02821537.0	ブリストル・ マイヤーズ スクイブ	第20147号無効審決 特許権無効	2012/12/24
			(2013)一中知行初字第2985号 審決維持	2014/03/10
			(2015)高行(知)終字第62号 審決取消	2015/12/18
			(2016)最高法行審第4696号 再審受理	2018/09/30
			(2019)京行再7号 審決維持	2019/12/30
ビルダグリプチン	ZL99814202.6	ノバルティス	第35557号無効審決 特許権有効	2018/03/29
			第35451号無効審決 特許権有効	2018/03/29
			第33610号無効審決 特許権有効	2017/10/20
			(2017)京73行初字第9665号 原告が訴訟請求を取り下げ	2019/06/26
チカグレロル	ZL99815926.3	アストラゼネ カ	第33591号無効審決 特許権無効	2017/10/10
			(2018)京73行初字第753号 審決維持	2018/07/30
			(2018)京行終字第6345号 審決取消	2018/12/24

商品名	特許番号	特許権者	審決/判決番号 及び結論	発行日
テノビルジソプロ キシル	ZL97197460.8	ギリアド・サイ エンシズ	第22284号無効審決 特許権無効	2014/02/13
			(2015)京知行初字第1297号 審決維持	2016/09/20
			(2017)京行終字第1806号 審決取消	2017/12/19
オルメサルタン	ZL97126347.7	第一三共株式 会社	第WX16266号無効審決 特許権有効	2011/04/01
			(2011)一中知行初字第2403号 審決維持	2011/12/20
			(2012)高行終字第833号 審決取消	2013/09/24
			(2014)知行字第56号 再審受理	2015/12/23
			(2019)最高法行再41号 審決維持	2017/12/20
ソラフェニブ	ZL00802685.8	バイエル	第15069号無効審決 特許権有効	2010/06/24
			(2010)一中知行初字第3548号 審決維持	2011/08/05

上記 7 組の審決取消訴訟において、ビルダグリプチン案件は、原告が訴訟請求を自主的に取り下げたため、実際は訴訟が行われなかった。

上記案件 6 組の結論をまとめると、下記の表が得られる。

表 3

	無効審判結論	一審結論	二審結論	再審結論
レナリドミド案 件	無効	無効	無効	--
アピキサバン案 件	無効	無効	有効	無効
チカグレロル案 件	無効	無効	有効	--
テノビルジソ プロキシル案件	無効	無効	有効	--
オルメサルタン 案件	有効	有効	無効	有効
ソラフェニブ	有効	有効	--	--

この表の内容から、次のことが理解できる。

(i) この 6 組の訴訟中、5 組は二審裁判所に上訴され、うち 2 件は最高裁判所で再審された。実際には、我々が理解しているところでは、チカグレロル案件及びテノホビルジソプロキシル案件について、審判部は二審判決を受理後、最高裁に再審請求を提起したが、現時点では最高裁が受理するかどうかの裁定をまだ発行していなかった。

(ii) 一審裁判所と審判部の結論は一致性が極めて高く、審判部の結論が覆された案件は 1 件もない。上訴された案件 5 件のうち、二審裁判所は 4 件の結論について判決を覆しており、判決が覆された比率は 80%に上る。

(iii) 再審手続きに入った 2 件の訴訟案件において、最高裁はさらに二審判決を覆し、審判部の審決を維持しており、最高裁が判決を覆す比率は 100%である。

上記 6 組の審決取消訴訟の争点は主に進歩性であり、また、いずれも補足試験データが認めるかどうかの問題に関わっている。

…続きあり…

以上

2021 年 3 月 4 日 (原稿受領)

事務所概要紹介

金杜法律事務所は、中国司法部から最も早く設立を認可されたパートナーシップ制法律事務所の一つとして1993年に設立された、中国法律業界においてリーダー的地位を占める総合法律事務所の一つです。当事務所は、「顧客第一」の理念のもと、誠心誠意、クライアントに良質なリーガル・サービスを提供しています。当事務所はチームワークを尊重し、事務所の一元的管理、内部の緊密な協力、そして相互のサポート体制を事務所業務発展における堅固な基礎としています。「卓越したリーガル・サービス」、「卓越した体制」、「卓越した人材」の追求—金杜は、一貫して「卓越」を追求してきました。金杜の弁護士、弁理士の多くが国内外の著名大学の法学部や理学部を修了しており、そのうちの多くは国際的に名高い法律事務所に勤務又は弁護士、弁理士としての執務経験を有します。金杜の高い業務能力は、全方的なリーガル・サービスに具現化されています。近年、金杜はその傑出した業績により、国内外の法律業界において高い信望と評価を集めています。

当所の知的財産権グループは、2001年3月に設立され、現在、「特許部」、「商標部」、「IP 訴訟及び法律業務部」を擁し、権利出願から権利行使までの知的財産業務を含む包括的なリーガル・サービスを提供しております。クライアントの皆様のご愛顧を受け、設立から現在に至り、特許・商標弁理士、特許技術者 130 数名、裁判官OB、有資格者を含む弁護士 40 数名を有するまでに成長して参りました。誠実な業務態度の徹底及びリーズナブルなコストパフォーマンスにより、技術・法律・言語が三位一体となった高品質な特許出願業務や無効審判、訴訟などを遂行しております。

当所の知財業務の特色は以下のとおりです：

- ・ 知財の発掘、出願、権利化、保護、活用などの知財業務全般における、高品質なワンストップサービスのご提供
- ・ 出願にとどまらず、訴訟案件の経験も多数有する出願担当の知財実務者による、豊富な実務経験に基づいた安定的で強い権利の取得
- ・ 涉外知財訴訟の取扱件数は中国各事務所でナンバー・ワン

東京オフィスの知財駐在員の連絡先

中国特許弁理士馬立栄

住所：東京都千代田区丸の内 3-2-3 丸の内二重橋ビル 21 階 〒100-0005

電話番号：+813-5218-6711(代表)

ファックス番号：+813-5218-6712

Eメール：malirong@cn.kwm.com