

**平成16年度 特許流通支援チャート**

**化学28**

# **ドラッグデリバリー システム**

**2005年3月**

**独立行政法人 工業所有権情報・研修館**

## 薬剤を適所に適宜送達する技術

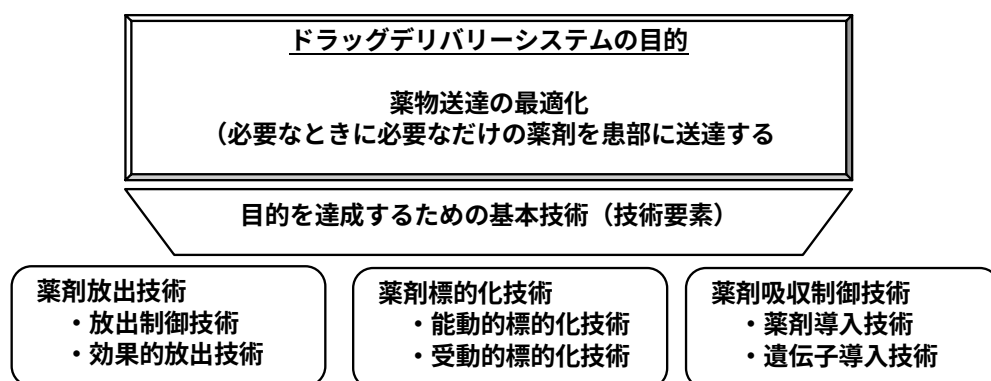
### ■ 必要なときに必要なだけの薬剤を患部に送達する技術

ドラッグデリバリーシステム（DDS）は、必要なときに必要なだけの薬剤を病巣に送る技術であり、薬剤放出技術と薬剤標的化技術、薬剤吸収制御技術からなる。

薬剤放出技術には、薬剤を徐々に長期間にわたって放出させる放出制御技術と、水に不溶性の薬剤を体内に取り込まれやすいようにする効果的放出技術がある。

薬剤標的化技術には、細胞の受容体や抗体などを利用して薬剤を患部に送達する能動的標的化技術と、体内循環時間を長くすることにより、がんなどに薬剤を集積させる受動的標的化技術がある。

薬剤吸収制御技術には、薬剤を皮膚などを通して吸収させる薬剤導入技術と、遺伝子を細胞内に送達する遺伝子導入技術がある。



### ■ 欧米を中心に研究開発が行なわれている

ドラッグデリバリーシステムに関する特許出願の特徴は、海外からの出願が多いことである。1992年1月～02年12月に出願された2,253件の出願のうち、79%が海外からの出願である。最も多くの特許を出願しているのはフランスのサノフィ・アベンティスであり、米国のジョンソンアンドジョンソンがこれに次いでいる。

もう一つの特徴は、大学や公的研究機関による出願が多いことであり、米国のカリフォルニア大学や国立衛生研究院、日本の科学技術振興機構などが多数の特許出願を行っている。

さらに、ベンチャー企業からの出願が多いことも特徴であり、米国ジェネンテック、カイロンなどから多数出願されている。

日本の企業では、武田薬品工業、久光製薬、協和醗酵工業といった製薬会社からの出願が多い。

## 生体メカニズムを利用して前進

### ■ モノクローナル抗体開発の障壁とその克服

ドラッグデリバリーシステムの研究開発は、薬剤を徐々に長期間放出することによって、たとえば心筋症や緑内障の治療における患者の負担を軽減するとともに治療効果を向上させることから始まった。その後、モノクローナル抗体の開発によって、がんなどの標的治療ができると期待されたが、マウスの抗体であったこともあり、1990年代半ばに研究開発が一次的に停滞した。しかし、その後、ヒト化抗体の開発などの新しい技術が開発されるとともに、再度研究開発が活発化してきている。

### ■ 生体メカニズム、物理的刺激の利用

薬剤を患部に送達する手段として、細胞の受容体を利用したり、抗体を利用したりするといった生体反応を利用する技術が活発に研究されている。さらに、薬剤を患部で放出させて薬効を発揮させる手段として、患部の細胞に存在する酵素によって薬剤を切り離したりする技術が研究されている。また、薬剤の放出速度を制御するために、患部の pH などを利用したり、生分解性の高分子マトリックスに分散させた薬剤を用いて体内で分解させるとともに、薬剤を放出させるといった生体条件を利用する技術が研究されている。

一方、薬剤を気泡入りのリポソームに入れて患部に送達し、超音波のような物理的刺激によってリポソームを破裂させることによって薬剤を放出させる技術や、電気パルスを与えることによって、薬剤や DNA の経皮吸収を促進するといった物理的刺激を利用したドラッグデリバリーシステムの研究も行われている。

### ■ さらに効果的なドラッグデリバリーシステムの開発

従来の遺伝子治療は、アデノウイルスなどの感染性を利用したベクターを用いていたため、ウイルスによる副作用が無視できなかったが、ポリカチオンを用いた遺伝子導入技術が開発されるなど、より安全な遺伝子導入技術が開発されてきている。また、ドラッグデリバリーシステムによって薬剤を患部に送達することにより、組織を再生したり、遺伝子を送達して血管を再生させたりするといった、再生医療へのドラッグデリバリーシステムの応用も研究されている。ドラッグデリバリーシステムと遺伝子治療、再生医療とが融合することによって、さらに効果的なドラッグデリバリーシステムの開発が進むと期待されている。

## 薬剤標的化技術が中心

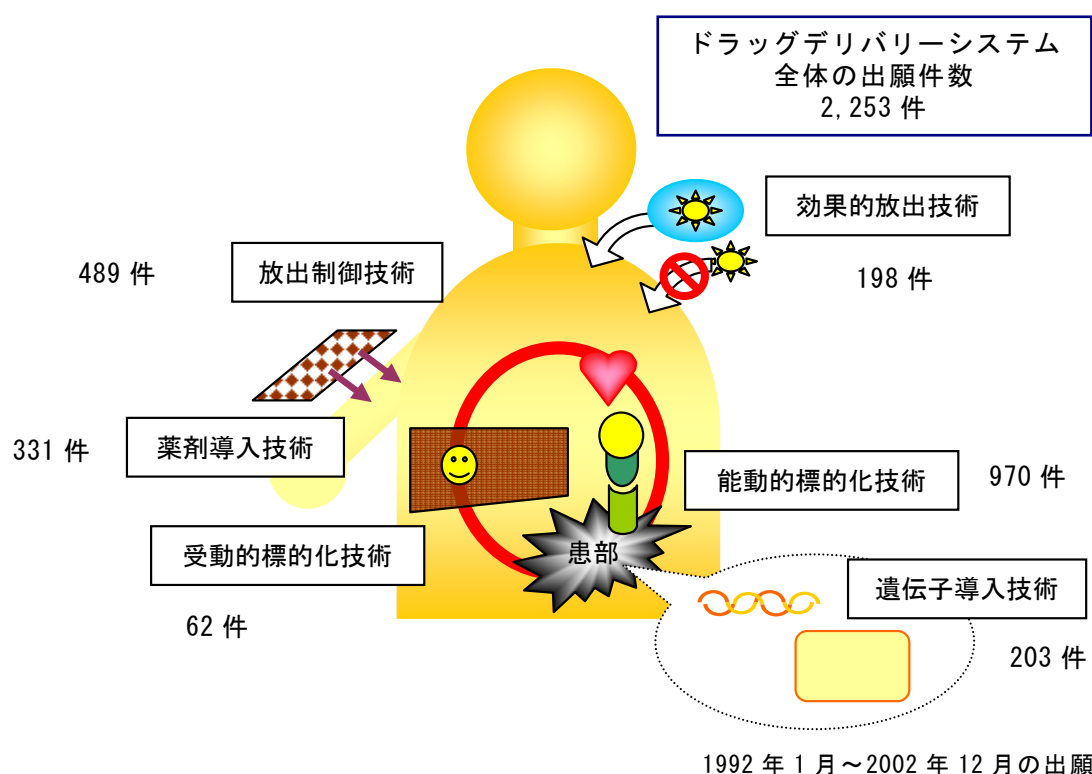
1992年1月～02年12月に出願されたドラッグデリバリーシステムの出願件数は2,253件である。

薬剤放出技術には、薬剤を徐々に長期間にわたって放出させる放出制御技術と、水に不溶性の薬剤を体内に取り込まれやすいようにしたりする効果的放出技術がある。薬剤放出技術の出願件数は、放出制御技術の489件と効果的放出技術の198件を合わせた687件である。

薬剤標的化技術には、細胞の受容体や抗体などを利用して薬剤を患部に送達する能動的標的化技術と、体内循環時間を長くすることにより、がんなどに薬剤を集積させる受動的標的化技術がある。薬剤標的化技術に関する特許出願件数は、能動的標的化技術が970件、受動的標的化技術が62件で合計1,032件と3つの技術要素の中で最も多く、研究開発の中心となっている。

薬剤吸収制御技術には、薬剤を皮膚などを通して吸収させる薬剤導入技術と、遺伝子を細胞内に送達する遺伝子導入技術がある。薬剤吸収制御技術の特許出願件数は534件で、薬剤吸収技術が331件、遺伝子導入技術が203件である。

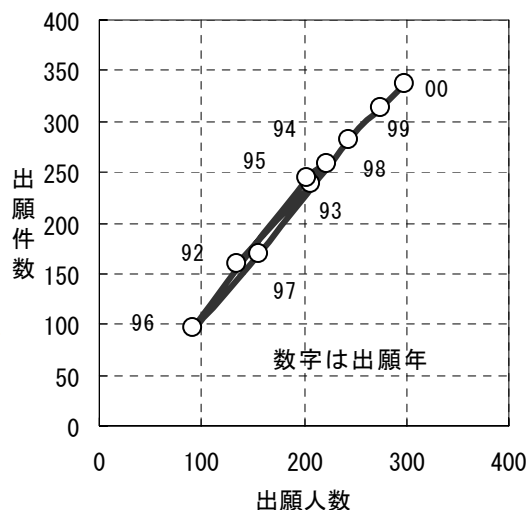
ドラッグデリバリーシステムの主要構成技術



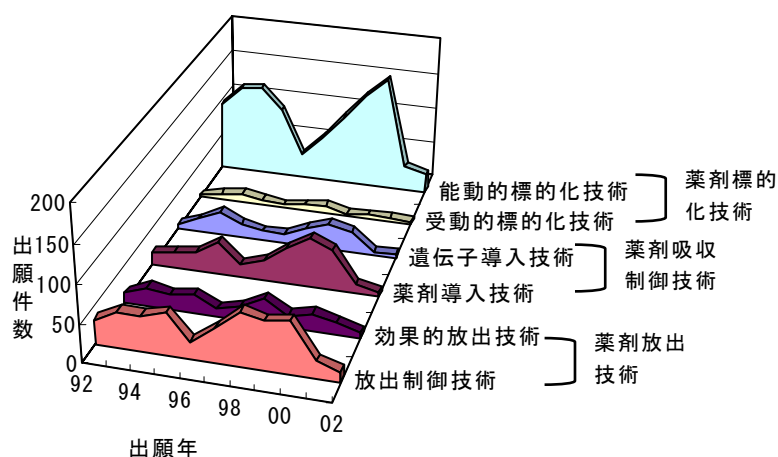
## 再び研究が活発化している

ドラッグデリバリーシステムの研究は、モノクローナル抗体開発が障壁に当たったことから、1990年代半ばに研究開発が停滞したが、1997年頃から再度研究が活発化してきている。01年、02年については、PCTによる公開の遅れがあるため、図から除外したが、97年～00年の出願件数の増加傾向から判断して、現在も出願件数が伸びているものと見られる。

ドラッグデリバリーシステムの  
出願人数と出願件数の推移（全件数）

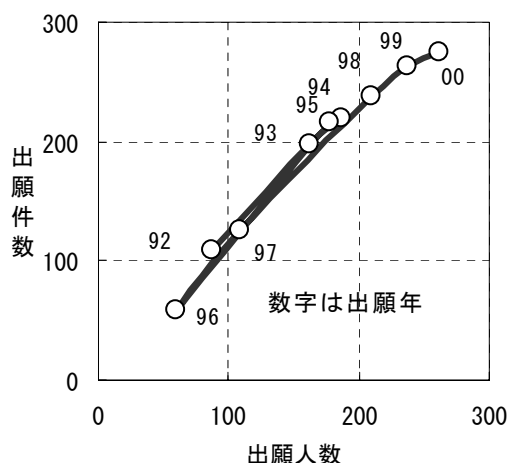


ドラッグデリバリーシステムの  
技術要素別出願件数推移



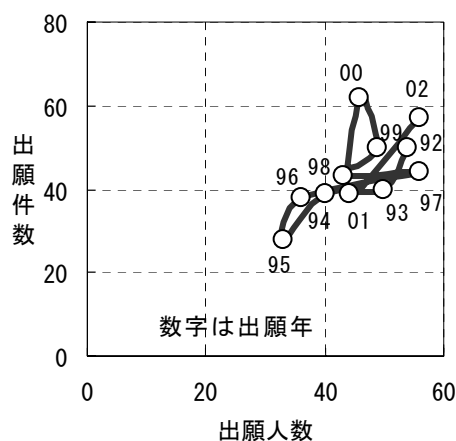
1992年1月～2002年12月の出願  
(01～02年のPCT出願が未公表のため、図からは除外)

ドラッグデリバリーシステムの  
出願人数と出願件数の推移（PCT出願分）



1992年1月～2002年12月の出願  
(01年～02年は未公表のため図からは除外)

ドラッグデリバリーシステムの  
出願人数と出願件数の推移（国内出願分）

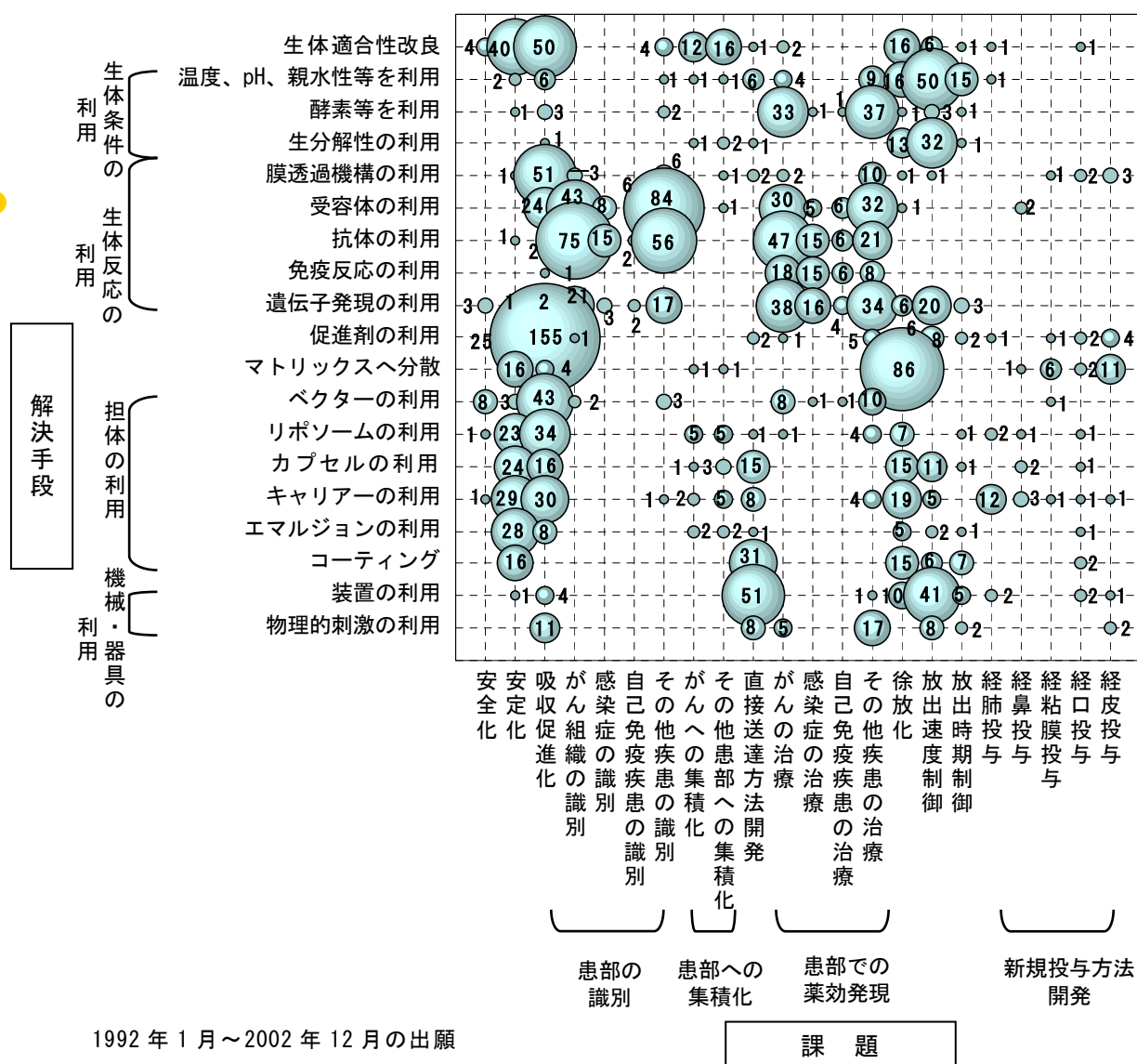


1992年1月～2002年12月の出願

## 生体メカニズムを利用

ドラッグデリバリーシステム技術の開発は、吸収制御と放出制御、薬剤標的化であり、皮膚などからの吸収を促進すること、放出速度を制御すること、患部を識別し治療することなどが課題である。これらの課題に対して、吸収促進剤や担体の利用、高分子マトリックスの利用といった解決手段とともに、細胞の受容体の利用や抗体の利用といった生体反応の利用、患部の温度や pH などの生体条件の利用といった生体メカニズムの利用が解決手段として用いられている。

ドラッグデリバリーシステム全体の課題と解決手段の分布



## 外国からの出願が多い

ドラッグデリバリーシステムに関しては、多数の出願人が、生体メカニズムを生かしたり、高分子マトリックスを利用したりといったように、それぞれの研究機関の特徴を活かした出願を行っている。また、製薬メーカーをはじめとして、ベンチャー企業、大学、公的研究機関などさまざまな研究機関から出願されており、外国からの出願が多いことがドラッグデリバリーシステムの特徴となっている。

放出制御技術の課題・解決手段と出願人

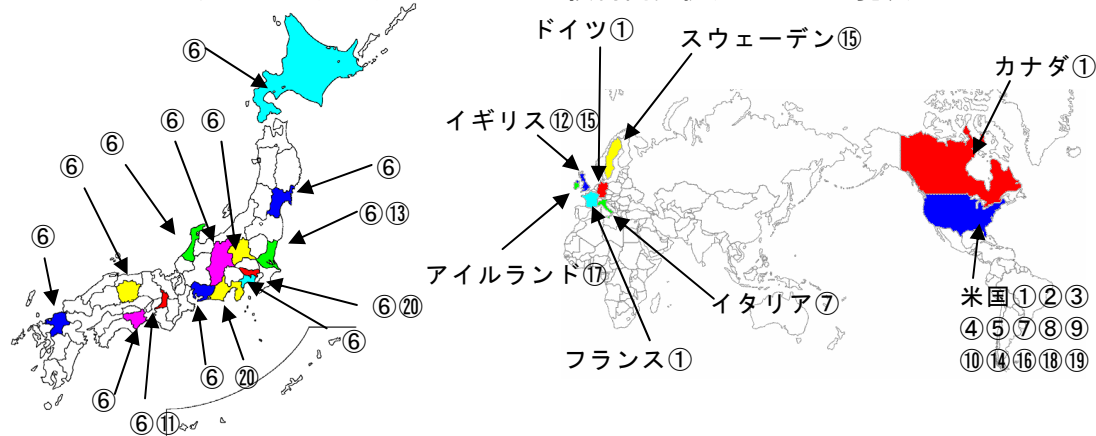
| 課題<br>解決手段        | 徐放化                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        | 放出速度制御                                                                                                                                                                                       | 放出時期制御                     |
|-------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------|
| 生体適合性改良           | ディー ディー エス研究所(3)<br>特許 2602607、特許 2710900<br>特許 2766141<br>参天製薬(2)<br>特開 2002-326962、特開<br>2003-171315<br>キネートン<br>特表平 11-508289<br>コンセイユ ド ルシエルシェ<br>ダブリカシオン シャンティ<br>特許 3476775<br>シェリング プラウ<br>特開 2000-309541<br>タノックス バイオシステムズ<br>特許 3507507<br>ネクススター PHARM<br>特開 2004-43513<br>ベス イスラエル ディコネス<br>メディカル センター<br>特表平 11-501506<br>ホーヤ<br>特開平 06-306250<br>ポリーメッド<br>特許 3476775<br>ミシガン大学<br>特表平 10-511957<br>池田模範堂<br>特開平 11-43467<br>中外製薬<br>特開 2002-32957<br>日本医薬品工業<br>特開平 07-10758 | スカイファム(2)<br>特表 2001-515852、特表 2001-515853<br>アドバンス<br>特開 2003-12383<br>アリックス セラピューティクス<br>特表 2003-531196<br>イエナファルム<br>特表 2003-523929<br>カイロン<br>特表 2001-515852<br>フロリダ大学<br>特表 2003-516926 | 科学技術振興機構<br>特開 2001-270898 |
| 生体条件の利用<br>酵素等の利用 | ケンタツキー大学 リサーチ ファン<br>デイション<br>特表平 09-509151                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                | ペクトレイド<br>特表 2002-542304<br>ビタフオア<br>特表平 10-504277<br>テラピン テクノロジーズ<br>特表平 11-507370                                                                                                          | イギリス<br>特表平 11-500136      |



## 世界的規模で研究開発されている

ドラッグデリバリーシステムの研究開発は、大手製薬会社やベンチャー企業などによって行われているほか、大学や公的研究機関によって行われていることが特徴であり、開発拠点は米国、欧州をはじめとして世界に広がっている。

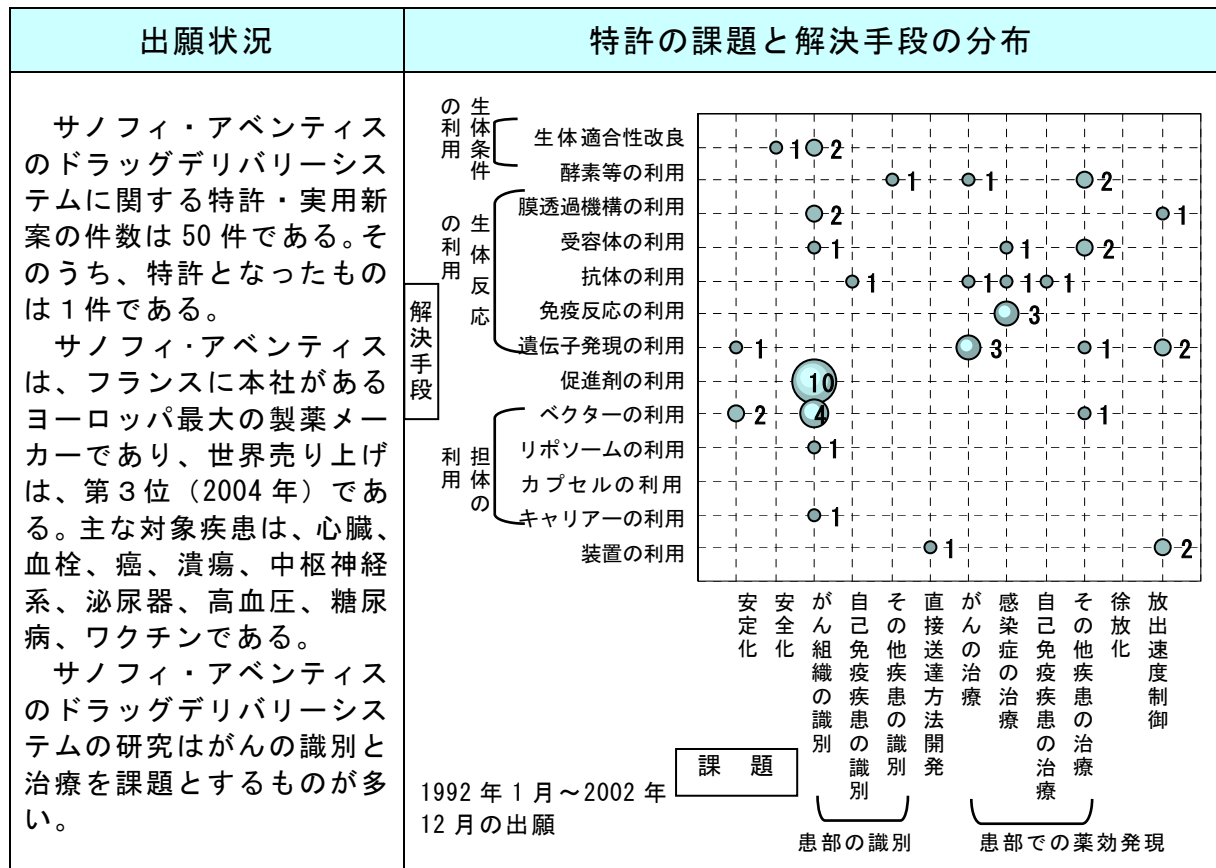
ドラッグデリバリーシステムの技術開発拠点および一覧表



| No. | 出願人名                       | 出願件数 | 住所     |                                  |
|-----|----------------------------|------|--------|----------------------------------|
|     |                            |      | 都道府県等  | 所在地・事業所名                         |
| ①   | サノフィ・アベンティス (フランス)         | 50   | フランス   | パリ市                              |
|     |                            |      | ドイツ    | マールブルグ市                          |
|     |                            |      | カナダ    | オンタリオ州                           |
|     |                            |      | 米国     | ニュージャージー州                        |
| ②   | ジョンソンアンドジョンソン(米国)          | 36   | 米国     | カリフォルニア州                         |
| ③   | カリフォルニア大学(米国)              | 28   | 米国     | カリフォルニア州                         |
| ④   | ジェネンテック(米国)                | 26   | 米国     | カリフォルニア州                         |
| ⑤   | ファイザー(米国)                  | 25   | 米国     | コネチカット州                          |
| ⑥   | 科学技術振興機構                   | 23   | 北海道    | 札幌市                              |
|     |                            |      | 宮城県    | 仙台市                              |
|     |                            |      | 長野県    | 松本市                              |
|     |                            |      | 群馬県    | 前橋市                              |
|     |                            |      | 茨城県    | 牛久市                              |
|     |                            |      | 東京都    | 新宿区                              |
|     |                            |      | 神奈川県   | 川崎市                              |
|     |                            |      | 石川県    | 金沢市                              |
|     |                            |      | 愛知県    | 名古屋市                             |
|     |                            |      | 大阪府    | 吹田市                              |
|     |                            |      | 岡山県    | 岡山市                              |
|     |                            |      | 徳島県    | 徳島市                              |
|     |                            |      | 福岡県    | 福岡市                              |
| ⑦   | カイロン(米国)                   | 21   | 米国     | カリフォルニア州                         |
|     |                            |      | イタリア   | シエナ                              |
| ⑧   | プリストルマイヤーズスクイブ(米国)         | 20   | 米国     | ニュージャージー州                        |
| ⑨   | アメリカ合衆国(米国)                | 20   | 米国     | メリーランド州                          |
| ⑩   | テキサス大学(米国)                 | 19   | 米国     | テキサス州                            |
| ⑪   | 武田薬品工業                     | 18   | 大阪府    | 大阪市淀川区十三本町二丁目17番85号 大阪工場地区研究部門   |
| ⑫   | ウェスト ファーマシューティカル サービスズ(米国) | 17   | イギリス   | ノッティングム                          |
| ⑬   | 久光製薬                       | 17   | 茨城県    | つくば市観音台1-25-15 久光製薬株式会社筑波研究所     |
| ⑭   | メルク(米国)                    | 20   | 米国     | ニュージャージー州                        |
| ⑮   | アストラゼネカ(イギリス)              | 16   | イギリス   | ミアサイド                            |
|     |                            |      | スウェーデン | メルンダール                           |
| ⑯   | イミュノメディクス(米国)              | 15   | 米国     | ニュージャージー州                        |
| ⑰   | エラン(アイルランド)                | 15   | アイルランド | ダブリン市                            |
| ⑱   | マサチューセッツ工科大学(米国)           | 15   | 米国     | マサチューセッツ州                        |
| ⑲   | エミスフェア・テクノロジーズ(米国)         | 14   | 米国     | ニューヨーク州                          |
| ⑳   | 協和醗酵工業                     | 14   | 東京都    | 町田市旭町3-6-6 協和醗酵工業株式会社 東京研究所      |
|     |                            |      | 静岡県    | 駿東郡長泉町下土狩 1188 協和醗酵工業株式会社医薬総合研究所 |

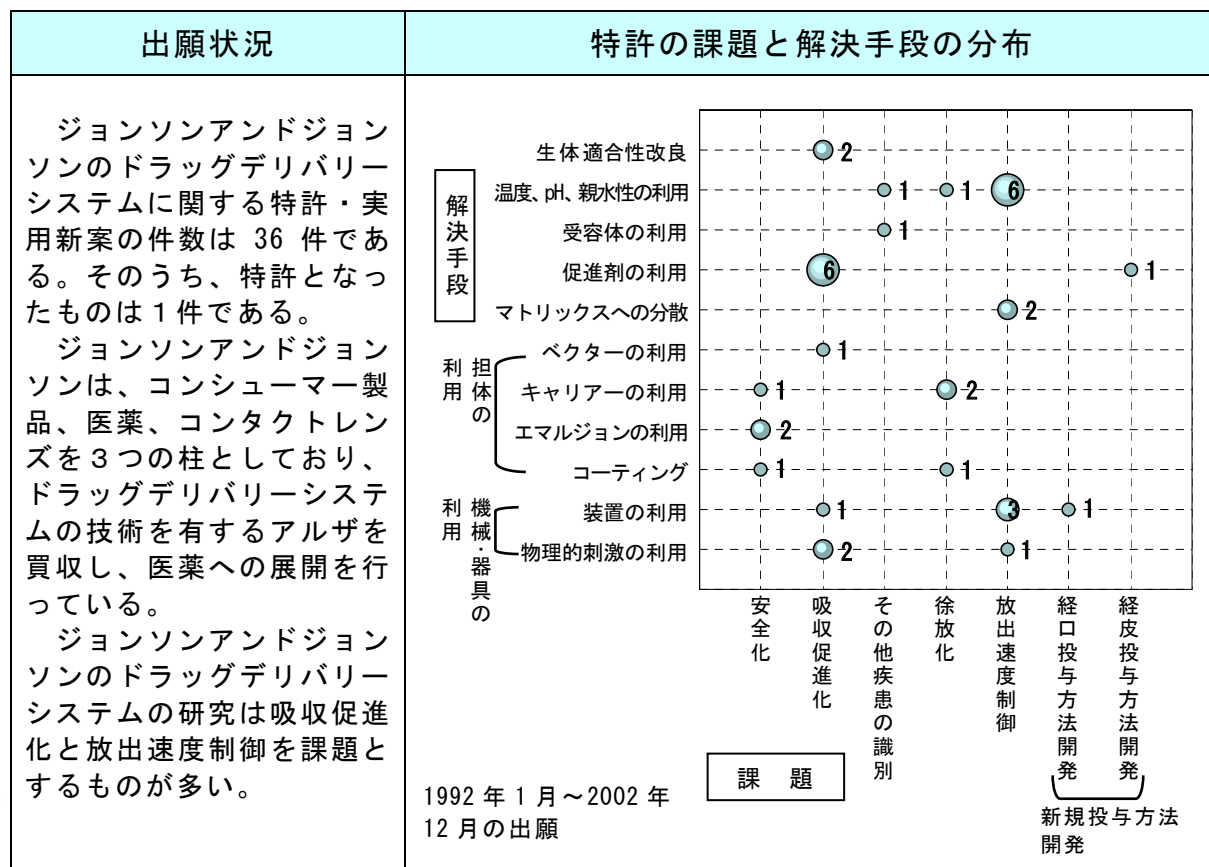


# サノフィ・アベンティス



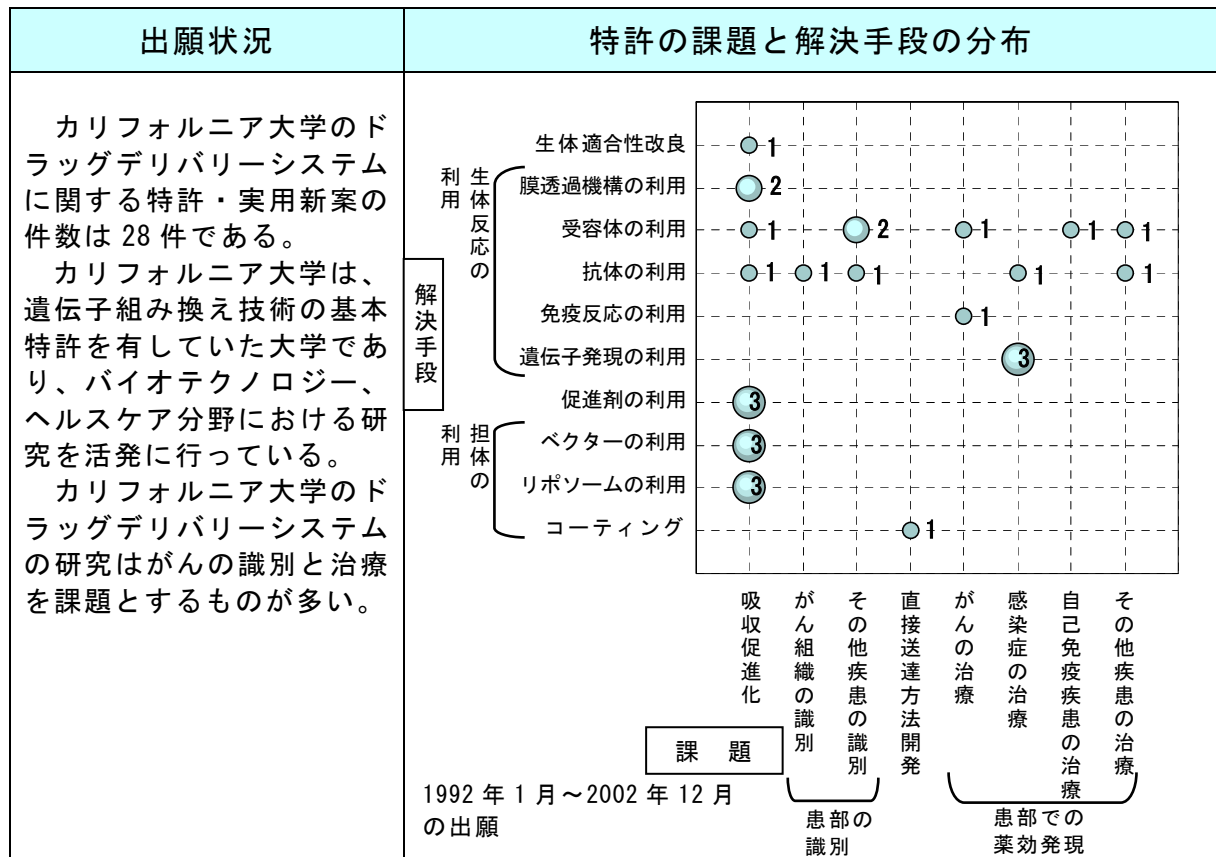
| 保有特許例               |                 |                   |                                                    |                                                                                                                                       |
|---------------------|-----------------|-------------------|----------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 技術要素<br>I<br>II     | 課題<br>I<br>II   | 解決手段 I<br>解決手段 II | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数] | 発明の名称<br>概要                                                                                                                           |
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | 感染症の識別<br>患部の識別 | 生体反応の利用<br>抗体の利用  | 特許 3534771<br>94.10.24<br>G12N1/20                 | Moraxella の主要外層膜蛋白 CD<br>Moraxella 株から非変性外層膜蛋白 CD を単離・精製し、診断に利用する。特に、in vivo で宿主に投与して、CD 蛋白と特異的に反応する抗体を誘発する病原菌によって引き起こされる疾患に対する予防を行う。 |
|                     | 直接送達方法開発        | 機械・器具の利用<br>装置の利用 | 特開平 10-236984<br>97.2.28<br>A61K47/42              | 徐放性局所送達製剤                                                                                                                             |

# ジョンソンアンドジョンソン



| 保有特許例     |         |                       |                                            |                                     |
|-----------|---------|-----------------------|--------------------------------------------|-------------------------------------|
| 技術要素 I II | 課題 I II | 解決手段 I 解決手段 II        | 特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]        | 発明の名称 概要                            |
| 薬剤吸収制御技術  | 吸収促進化   | 促進剤の利用                | 特表平 10-503184<br>94. 07. 13<br>A61K47/16   | 経皮電氣的移送式作用剤投与を促進するための組成物と方法         |
|           |         |                       | 特表平 11-512073<br>95. 06. 07<br>A61K47/14   | グリセロールモノラウレートとラウリルアセートを含む皮膚透過増強剤組成物 |
| 薬剤放出制御技術  | 放出速度制御  | 生体条件の利用 温度、pH、親水性等の利用 | 特開平 09-100235<br>1995. 06. 07<br>A61K33/18 | 架橋ポリビニルピロリドン-ヨウ素複合物及びその製造方法         |
|           |         |                       | 特表 2003-514847<br>99. 11. 22<br>A61K9/24   | 第一コートおよび第二コートを含む浸透圧性剤形              |
|           |         | 機械・器具の利用 装置の利用        | 特表 2001-526214<br>97. 12. 22<br>A61K9/70   | 薬剤供給を調節するデバイスのための速度調節膜              |

# カリフォルニア大学



| 保有特許例               |               |                     |                                                    |                                  |
|---------------------|---------------|---------------------|----------------------------------------------------|----------------------------------|
| 技術要素 I<br>技術要素 II   | 課題 I<br>課題 II | 解決手段 I<br>解決手段 II   | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数] | 発明の名称<br>概要                      |
| 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 吸収促進化         | 促進剤の利用              | 特表 2003-516306<br>98.04.24<br>C07F91/17            | 膜透過性ホスホイノシチド                     |
|                     |               | 担体の利用<br>ベクターの利用    | 特表 2002-539176<br>99.03.15<br>A61K48/00<br>カイロン    | 眼の疾患を処置または予防するための組換え遺伝子送達ベクターの使用 |
|                     |               | 担体の利用<br>リポソームの利用   | 特表 2002-510713<br>98.04.03<br>C07C22/906           | ペンタエリトリトール脂質誘導体                  |
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | 患部での薬効発現      | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利用 | 特表平 08-510134<br>93.05.17<br>C12N15/09             | HIV 感染およびエイズを対象としたリボザイム遺伝子治療     |
|                     |               |                     | 特表 2004-505892<br>00.05.12<br>A61K48/00            | ヒトパピローマウイルス (HPV) - 感染細胞の治療      |

## ジェネンテック

| 出願状況                                                                                                                                                                                                           | 特許の課題と解決手段の分布                                                                                                                                                                                                                                                                                             |
|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| <p>ジェネンテックのドラッグデリバリーシステムに関する特許・実用新案の件数は26件である。</p> <p>ジェネンテックは、1982年に世界で初めての遺伝子組換え医薬であるヒトインスリンを開発した米国のベンチャー企業である。その後、ヒト成長ホルモンや喘息の抗体医薬などを開発している。</p> <p>ジェネンテックのドラッグデリバリーシステムの研究はがんその他の疾患の識別と治療を課題とするものが多い。</p> | <div> <div> <div>利用</div> <div>生体条件の</div> <div>温度、pH、親水性の利用</div> <div>酵素等の利用</div> </div> <div> <div>利用</div> <div>生体反応の</div> <div>受容体の利用</div> <div>抗体の利用</div> <div>遺伝子発現の利用</div> <div>キャリアーの利用</div> </div> <div>解決手段</div> </div> <p>課題</p> <p>1992年1月～2002年12月の出願</p> <p>患部の識別      患部での薬効発現</p> |

| 保有特許例               |                    |                     |                                                    |                                 |
|---------------------|--------------------|---------------------|----------------------------------------------------|---------------------------------|
| 技術要素 I<br>技術要素 II   | 課題 I<br>課題 II      | 解決手段 I<br>解決手段 II   | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数] | 発明の名称<br>概要                     |
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | がん組織の識別<br>患部の識別   | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利用 | 特表 2004-520806<br>00.08.24<br>C12N15/09            | 腫瘍の診断と治療のための組成物と方法              |
|                     |                    |                     | 特表 2004-520808<br>00.08.24<br>C12N15/09            | 腫瘍の診断と治療のための組成物と方法              |
|                     | その他の疾患の識別<br>患部の識別 | 生体反応の利用<br>受容体の利用   | 特表 2003-505020<br>99.07.02<br>C12N15/09            | ペプチドリガンドドメイン及び多量体化ドメインを含む融合ペプチド |
|                     |                    | 生体反応の利用<br>抗体の利用    | 特表 2000-503204<br>96.01.08<br>C12N15/09            | WSX レセプター及びリガンド類                |

# ファイザー

| 出願状況                                                                                                                                                                                                                                                                  | 特許の課題と解決手段の分布                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| <p>ファイザーのドラッグデリバリーシステムに関する特許・実用新案の件数は25件である。そのうち、特許となったものは1件である。</p> <p>ファイザーは、米国の大手製薬メーカーである。循環器系、中枢神経系、感染症、アレルギー系、疼痛・関節系、泌尿器系、眼科系、がん、内分泌系などの疾患に対する医薬を開発している。ドラッグデリバリーシステムに関する製品としては、禁煙補助剤がある。</p> <p>ファイザーのドラッグデリバリーシステムの研究は多岐に渡っているがマトリックスへの分散などを解決手段とするものが多い。</p> | <p><b>課題 (Topics):</b> 安定化, 安全化, 吸収促進化, その他疾患の識別, 直接送達方法開発, 感染症の治療, その他疾患の治療, 徐放化, 放出速度制御, 経鼻投与方法開発, 経粘膜投与方法開発</p> <p><b>解決手段 (Solutions):</b> 生体適合性改良 (温度、pH、親水性の利用), 酵素等の利用, 遺伝子発現の利用, 促進剤の利用, マトリックスへの分散, カプセルの利用, キャリアーの利用, エマルジョンの利用, コーティング, 装置の利用</p> <p>1992年1月～2002年12月の出願</p> <p>患部での薬効発現 (徐放化, 放出速度制御, 経鼻投与方法開発, 経粘膜投与方法開発)</p> <p>新規投与方法開発 (経鼻投与方法開発, 経粘膜投与方法開発)</p> |

| 有特許例              |                      |                   |                                                    |                                                |
|-------------------|----------------------|-------------------|----------------------------------------------------|------------------------------------------------|
| 技術要素 I<br>技術要素 II | 課題 I<br>課題 II        | 解決手段 I<br>解決手段 II | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数] | 発明の名称<br>概要                                    |
| 薬剤放出技術<br>出制御技術   | 放出時期制御               | 機械・器具の利用<br>装置の利用 | 特許 3174285<br>96.05.29<br>A61K31/495               | セチリジンおよびプソイドエフェドリンを含む固体剤形およびその製造方法             |
| 薬剤放出技術<br>的放出技術   | 新規投与方法開発<br>経鼻投与方法開発 | 担体の利用<br>カプセルの利用  | 特表平 09-504305<br>93.11.01<br>A61K31/465            | ニコチンまたはその誘導体およびデンブン微小球からなるドラッグデリバリー用組成物およびその製法 |

# 目次

ドラッグデリバリーシステム

## 1. 技術の概要

|                                    |    |
|------------------------------------|----|
| 1.1 ドラッグデリバリーシステム .....            | 3  |
| 1.1.1 ドラッグデリバリーシステムとは .....        | 3  |
| 1.1.2 ドラッグデリバリーシステム開発の流れ .....     | 4  |
| 1.1.3 ドラッグデリバリーシステムの技術要素 .....     | 7  |
| (1) 薬剤放出技術 .....                   | 8  |
| ① 放出制御技術 .....                     | 8  |
| ② 効果的放出技術 .....                    | 9  |
| (2) 薬剤標的化技術 .....                  | 10 |
| ① 能動的標的化技術 .....                   | 10 |
| ② 受動的標的化技術 .....                   | 10 |
| (3) 薬剤吸収制御技術 .....                 | 11 |
| ① 薬剤導入技術 .....                     | 11 |
| ② 遺伝子導入技術 .....                    | 12 |
| 1.1.4 特許からみた技術の進展 .....            | 13 |
| (1) 薬剤放出技術の進展 .....                | 13 |
| (2) 薬剤標的化技術の進展 .....               | 15 |
| (3) 薬剤吸収制御技術の進展 .....              | 17 |
| 1.1.5 ドラッグデリバリーシステムの市場 .....       | 19 |
| (1) 技術と市場の関係 .....                 | 19 |
| (2) 市場の参入環境 .....                  | 20 |
| 1.2 ドラッグデリバリーシステムの特許情報へのアクセス ..... | 21 |
| 1.2.1 国際特許分類（IPC）によるアクセス .....     | 21 |
| 1.2.2 ファイル・インデックス（FI）によるアクセス ..... | 21 |
| 1.2.3 Fターム（FT）によるアクセス .....        | 21 |
| 1.2.4 キーワードによるアクセス .....           | 22 |
| 1.2.5 ドラッグデリバリーシステムのアクセス例 .....    | 22 |
| 1.3 技術開発活動の状況 .....                | 23 |
| 1.3.1 ドラッグデリバリーシステムの技術開発活動 .....   | 23 |
| 1.3.2 技術要素別の技術開発活動 .....           | 27 |
| (1) 薬剤放出技術 .....                   | 27 |
| ① 放出制御技術 .....                     | 27 |

|                                   |     |
|-----------------------------------|-----|
| ②効果的放出技術 .....                    | 30  |
| (2) 薬剤標的化技術 .....                 | 32  |
| ①能動的標的化技術 .....                   | 32  |
| ②受動的標的化技術 .....                   | 35  |
| (3) 薬剤吸収制御技術 .....                | 36  |
| ①薬剤導入技術 .....                     | 37  |
| ②遺伝子導入技術 .....                    | 39  |
| 1.4 技術開発の課題と解決手段 .....            | 41  |
| 1.4.1 ドラッグデリバリーシステムの課題と解決手段 ..... | 43  |
| (1) 技術要素と課題 .....                 | 43  |
| (2) 課題と解決手段 .....                 | 44  |
| 1.4.2 技術要素別の課題と解決手段 .....         | 46  |
| (1) 薬剤放出技術 .....                  | 46  |
| ①放出制御技術 .....                     | 46  |
| ②効果的放出技術 .....                    | 57  |
| (2) 薬剤標的化技術 .....                 | 63  |
| ①能動的標的化技術 .....                   | 63  |
| ②受動的標的化技術 .....                   | 81  |
| (3) 薬剤吸収制御技術 .....                | 84  |
| ①薬剤導入技術 .....                     | 84  |
| ②遺伝子導入技術 .....                    | 93  |
| 1.5 注目特許（サイテーション分析） .....         | 100 |
| 1.5.1 注目特許の抽出 .....               | 100 |
| 1.5.2 引用関連図 .....                 | 105 |
| <b>2. 主要企業等の特許活動</b>              |     |
| 2.1 サノフィ・アベンティス(フランス) .....       | 112 |
| 2.1.1 企業の概要 .....                 | 112 |
| 2.1.2 製品例 .....                   | 112 |
| 2.1.3 技術開発拠点と研究者 .....            | 113 |
| 2.1.4 技術開発課題対応特許の概要 .....         | 114 |
| 2.2 ジョンソンアンドジョンソン（米国） .....       | 119 |
| 2.2.1 企業の概要 .....                 | 119 |
| 2.2.2 製品例 .....                   | 119 |
| 2.2.3 技術開発拠点と研究者 .....            | 119 |
| 2.2.4 技術開発課題対応特許の概要 .....         | 121 |



|                              |     |
|------------------------------|-----|
| 2.3 カリフォルニア大学(米国) .....      | 126 |
| 2.3.1 大学の概要 .....            | 126 |
| 2.3.2 製品例 .....              | 126 |
| 2.3.3 技術開発拠点と研究者 .....       | 126 |
| 2.3.4 技術開発課題対応特許の概要 .....    | 128 |
| 2.4 ジェネンテック(米国) .....        | 132 |
| 2.4.1 企業の概要 .....            | 132 |
| 2.4.2 製品例 .....              | 132 |
| 2.4.3 技術開発拠点と研究者 .....       | 132 |
| 2.4.4 技術開発課題対応特許の概要 .....    | 133 |
| 2.5 ファイザー(米国) .....          | 138 |
| 2.5.1 企業の概要 .....            | 138 |
| 2.5.2 製品例 .....              | 138 |
| 2.5.3 技術開発拠点と研究者 .....       | 138 |
| 2.5.4 技術開発課題対応特許の概要 .....    | 140 |
| 2.6 科学技術振興機構 .....           | 144 |
| 2.6.1 機関の概要 .....            | 144 |
| 2.6.2 製品例 .....              | 144 |
| 2.6.3 技術開発拠点と研究者 .....       | 144 |
| 2.6.4 技術開発課題対応特許の概要 .....    | 146 |
| 2.7 カイロン(米国) .....           | 150 |
| 2.7.1 企業の概要 .....            | 150 |
| 2.7.2 製品例 .....              | 150 |
| 2.7.3 技術開発拠点と研究者 .....       | 150 |
| 2.7.4 技術開発課題対応特許の概要 .....    | 152 |
| 2.8 ブリストルマイヤーズスクイブ(米国) ..... | 157 |
| 2.8.1 企業の概要 .....            | 157 |
| 2.8.2 製品例 .....              | 157 |
| 2.8.3 技術開発拠点と研究者 .....       | 157 |
| 2.8.4 技術開発課題対応特許の概要 .....    | 159 |
| 2.9 アメリカ合衆国(米国) .....        | 163 |
| 2.9.1 出願人の概要 .....           | 163 |
| 2.9.2 製品例 .....              | 163 |
| 2.9.3 技術開発拠点と研究者 .....       | 163 |
| 2.9.4 技術開発課題対応特許の概要 .....    | 165 |

|                                      |     |
|--------------------------------------|-----|
| 2.10 テキサス大学（米国） .....                | 169 |
| 2.10.1 大学の概要 .....                   | 169 |
| 2.10.2 製品例 .....                     | 169 |
| 2.10.3 技術開発拠点と研究者 .....              | 169 |
| 2.10.4 技術開発課題対応特許の概要 .....           | 171 |
| 2.11 武田薬品工業 .....                    | 175 |
| 2.11.1 企業の概要 .....                   | 175 |
| 2.11.2 製品例 .....                     | 175 |
| 2.11.3 技術開発拠点と研究者 .....              | 175 |
| 2.11.4 技術開発課題対応特許の概要 .....           | 177 |
| 2.12 ウエスト ファーマシューティカル サービス（米国） ..... | 181 |
| 2.12.1 企業の概要 .....                   | 181 |
| 2.12.2 製品例 .....                     | 181 |
| 2.12.3 技術開発拠点と研究者 .....              | 181 |
| 2.12.4 技術開発課題対応特許の概要 .....           | 183 |
| 2.13 久光製薬 .....                      | 187 |
| 2.13.1 企業の概要 .....                   | 187 |
| 2.13.2 製品例 .....                     | 187 |
| 2.13.3 技術開発拠点と研究者 .....              | 187 |
| 2.13.4 技術開発課題対応特許の概要 .....           | 189 |
| 2.14 メルク（米国） .....                   | 193 |
| 2.14.1 企業の概要 .....                   | 193 |
| 2.14.2 製品例 .....                     | 193 |
| 2.14.3 技術開発拠点と研究者 .....              | 193 |
| 2.14.4 技術開発課題対応特許の概要 .....           | 195 |
| 2.15 アストラゼネカ（イギリス） .....             | 199 |
| 2.15.1 企業の概要 .....                   | 199 |
| 2.15.2 製品例 .....                     | 199 |
| 2.15.3 技術開発拠点と研究者 .....              | 199 |
| 2.15.4 技術開発課題対応特許の概要 .....           | 201 |
| 2.16 イミュノメディクス（米国） .....             | 205 |
| 2.16.1 企業の概要 .....                   | 205 |
| 2.16.2 製品例 .....                     | 205 |
| 2.16.3 技術開発拠点と研究者 .....              | 205 |
| 2.16.4 技術開発課題対応特許の概要 .....           | 206 |

|                          |     |
|--------------------------|-----|
| 2.17 エラン（アイルランド）         | 210 |
| 2.17.1 企業の概要             | 210 |
| 2.17.2 製品例               | 210 |
| 2.17.3 技術開発拠点と研究者        | 210 |
| 2.17.4 技術開発課題対応特許の概要     | 212 |
| 2.18 マサチューセッツ工科大学（米国）    | 216 |
| 2.18.1 大学の概要             | 216 |
| 2.18.2 製品例               | 216 |
| 2.18.3 技術開発拠点と研究者        | 216 |
| 2.18.4 技術開発課題対応特許の概要     | 217 |
| 2.19 エミスフェア・テクノロジーズ（米国）  | 221 |
| 2.19.1 企業の概要             | 221 |
| 2.19.2 製品例               | 221 |
| 2.19.3 技術開発拠点と研究者        | 221 |
| 2.19.4 技術開発課題対応特許の概要     | 223 |
| 2.20 協和発酵工業              | 227 |
| 2.20.1 企業の概要             | 227 |
| 2.20.2 製品例               | 227 |
| 2.20.3 技術開発拠点と研究者        | 227 |
| 2.20.4 技術開発課題対応特許の概要     | 229 |
| 2.21 主要企業以外の特許番号一覧       | 242 |
| 2.22 公的研究機関・大学関係の特許番号一覧  | 243 |
| (1) 公的研究機関               | 243 |
| (2) 大学関係                 | 246 |
| <b>3. 主要企業の技術開発拠点</b>    |     |
| 3.1 ドラッグデリバリーシステムの技術開発拠点 | 256 |
| 3.2 技術要素別の技術開発拠点         | 258 |
| (1) 薬剤放出技術               | 258 |
| ① 放出制御技術                 | 258 |
| ② 効果的放出技術                | 260 |
| (2) 薬剤標的化技術              | 262 |
| ① 能動的標的化技術               | 262 |
| ② 受動的標的化技術               | 264 |
| (3) 薬剤吸収制御技術             | 266 |
| ① 薬剤導入技術                 | 266 |

②遺伝子導入技術 .....268

資 料

1. ライセンス提供の用意のある特許 .....273

## **1．技術の概要**

- 1.1 ドラッグデリバリーシステム
- 1.2 ドラッグデリバリーシステムの特許情報へのアクセス
- 1.3 技術開発活動の状況
- 1.4 技術開発の課題と解決手段
- 1.5 引用特許の状況

## 1. 技術の概要

ドラッグデリバリーシステムは、薬剤を患部に送達する技術であり、薬剤放出技術、薬剤標的化技術、薬剤吸収制御技術がある。

### 1.1 ドラッグデリバリーシステム

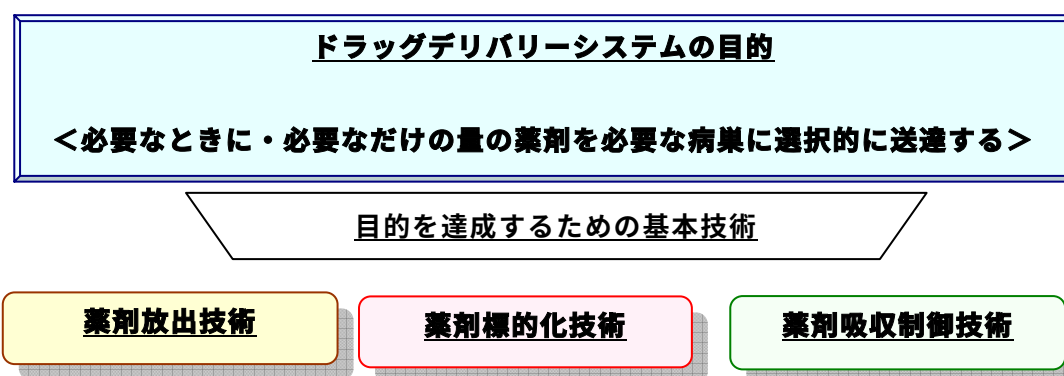
#### 1.1.1 ドラッグデリバリーシステムとは

ドラッグデリバリーシステム（Drug Delivery System）は、薬物送達システムと訳されることもあるが、英語の頭文字をとって DDS（ディーディーエス）と呼ばれる。

病気の治療においては、「必要なときに・必要なだけの量の薬物を必要な病巣に選択的に送り届ける」ことが最も理想的である。従来の飲み薬などは、体内の目的場所に到達する過程において、そのほとんどの成分が変化するとともに、目的の場所に到達する量はわずかであるという課題があった。こうすることにより、薬物の効果を最も有効にするとともに、副作用を低減することができ、患者に優しい薬剤を提供することができる。さらに、長期間薬効を持続させることなどにより患者の負担を軽減し、利便性を向上させることもできる。また、注射による投薬を経口に偏光することによって患者の負担を軽減することもできる。

図 1.1.1 に示すように、DDS 技術には大きく分けて 3 つの技術がある。すなわち、①必要なときに必要な量の薬物を放出する「薬剤放出技術」、②薬物を標的とする病巣に送り届ける「薬剤標的化技術」、③薬物の吸収率を高めて体内に効率よく吸収させる「薬剤吸収制御技術」がある。

図 1.1.1 ドラッグデリバリーシステム



### 1.1.2 ドラッグデリバリーシステム開発の流れ

1968年に米国カリフォルニア州に設立されたアルザ（現ジョンソンアンドジョンソン）が放出制御型製剤や経皮吸収型製剤の開発を行い、ドラッグデリバリーシステムというコンセプトを打ち出した。これは、製剤から薬物を徐々に放出させることによって、効果を長期間持続するようにさせたものである。1日に数回服用する必要のあった薬物を1回の服用で済むようになるなど、患者の負担を大幅に軽減でき、飲み忘れをなくすことにより、より確実な治療を実現できるといった効果も見られるようになった。

次いで、ドラッグデリバリーシステムの究極の目的である標的化技術の開発が、活発に行われるようになった。がんなどの細胞の表面には、その細胞に特異的な受容体がある場合があり、この受容体に結合するリガンドに薬剤を結合して患部に送達する技術が開発されている。また、細胞表面の抗原物質に、特異的に結合する抗体であるモノクローナル抗体<sup>注1)</sup>を用いた標的化技術が開発されている。抗体を用いた薬剤を用いた治療は、標的細胞を攻撃するという意味で「ミサイル療法」とも呼ばれ、がんなどの副作用の問題が大きい病気に対する治療法としての期待が高い。ただし、当初はマウスで作製したマウス抗体が用いられていたために、ヒトに投与した場合、マウス抗体に対する抗体ができてしまい、効果が低減したり、アレルギーによるショックを引き起こしたりといった問題が生じた。そのため、研究開発が一時期停滞したことがあったが、その後、キメラ抗体やヒト化抗体<sup>注2)</sup>作製技術が開発され、ドラッグデリバリーシステムへの応用が再び活発化してきている。

注 1) モノクローナル抗体：単一な抗原決定基と反応する1次構造が均一な抗体で、細胞融合で得られたハイブリドーマによって産生される抗体。特異性の高いものを選ぶこと、均質な製品を作ること、大量生産ができることなどの特徴がある。これに対して複数の抗原決定基と反応するものをポリクローナル抗体という。[JIS K 3600 1227]

注 2) ヒト化抗体：マウスの抗原結合部位（CDR）の遺伝子配列だけをヒト抗体遺伝子に移植したヒト様抗体。マウスの抗体部分が少ないため、ヒトへの投与により適している。[JIS K 3600 1267]



一方、がん組織や炎症部位の近くでは、他の部位に比べて血管の粒子透過性が高くなっていることが知られている。そこで、薬剤をリポソームのような 100nm 程度の粒子に封入して注射すると、血液中に長時間循環させて患部の近くを何度も通過する際に血管から漏れ出させることができる。結果として患部に薬剤を集積することができることになり、こうしたドラッグデリバリーシステムは「受動的標的化」システムと呼ばれ、活発に研究開発されている。

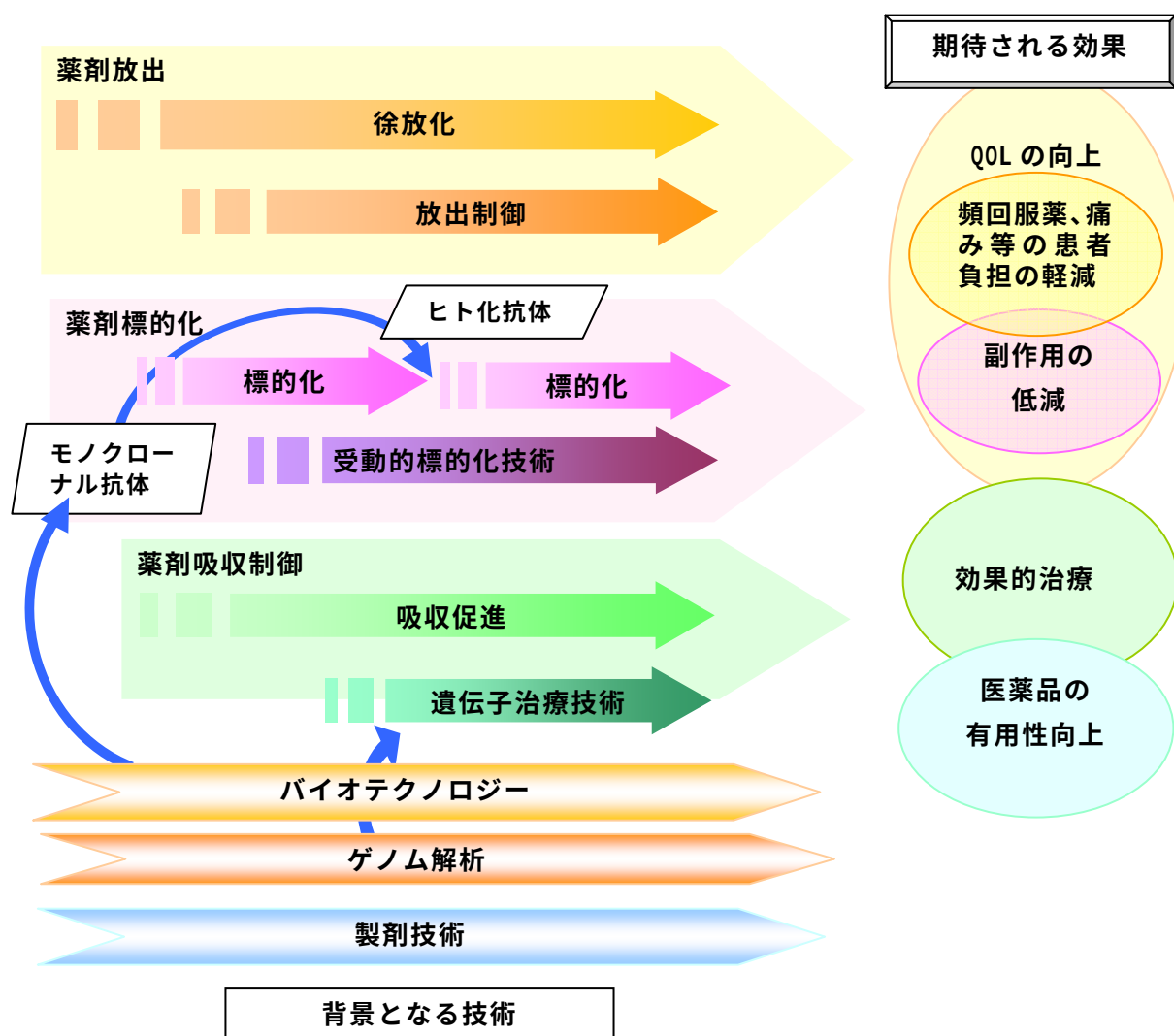
近年のバイオテクノロジーの発展によって、さまざまなペプチドやたんぱく質が製造できるようになり、ヒトの治療への応用が研究されている。しかし、たんぱく質やペプチドは水に難溶性であるものが多く、活性が高いにもかかわらず、体内に吸収されにくいために利用できないものがある。こうした薬剤の吸収性を改善する技術が研究されている。

また、病気を根治する新しい医療として期待の高い遺伝子治療では、遺伝子を細胞内に導入する技術の開発が大きな課題であり、ウイルスの感染力を利用したベクターが使用されてきた。しかし、ウイルスベクターの安全性に問題が持ち上がっており、ドラッグデリバリーシステム技術によって遺伝子を細胞内に導入する技術の開発が期待されている。

近年、医療現場で「患者の生活の質（QOL：Quality of Life）の向上」が重視されるようになり、DDS 技術がますます重要になってきている。一方、医薬の研究開発には莫大な費用が必要となってきており、製薬会社としては、開発した医薬品から最大限の利益を引き出す必要がある。DDS 技術は医薬品の有用性を向上させることのできる技術であり、多くの実績が上がってきている。

従来の徐放化やミサイル療法といった薬剤を長期間作用させたり、目的の患部に送達するドラッグデリバリーシステムが、今後さらに具体的な展開をすると期待され、これに加えて、バイオテクノロジー、特にゲノム解析の成果を取り入れたドラッグデリバリーシステムの広がりが期待されている。

図 1.1.2 ドラッグデリバリーシステム開発の流れ



### 1.1.3 ドラッグデリバリーシステムの技術要素

ドラッグデリバリーシステムの技術要素を表1.1.3-1に示す。ドラッグデリバリーシステムは、患部に薬剤を送達することにより、副作用を少なくして、効果を大きくする技術であり、技術要素としては、「薬剤放出技術」、「薬剤標的化技術」、「薬剤吸収制御技術」の3つから構成される。

薬剤放出技術には、薬剤を高分子マトリックスなどに分散させて一定量の薬剤を長期間にわたって放出させたりする「放出制御技術」と、水に溶けにくいタンパク製剤などをリポソームなどの担体に包含させることにより体内で有効に薬効を発現させたりする「効果的放出技術」がある。

薬剤標的化技術には、ガン組織を認識するリガンドや抗体を用いて薬剤を積極的に患部に送達する「能動的標的化技術」と、薬剤にポリエチレングリコールなどを結合することにより、血管に注射された薬剤が肝臓などで代謝されにくくし、体内を長期間循環させることによって、がんなどの患部に薬剤を蓄積させる「受動的標的化技術」がある。

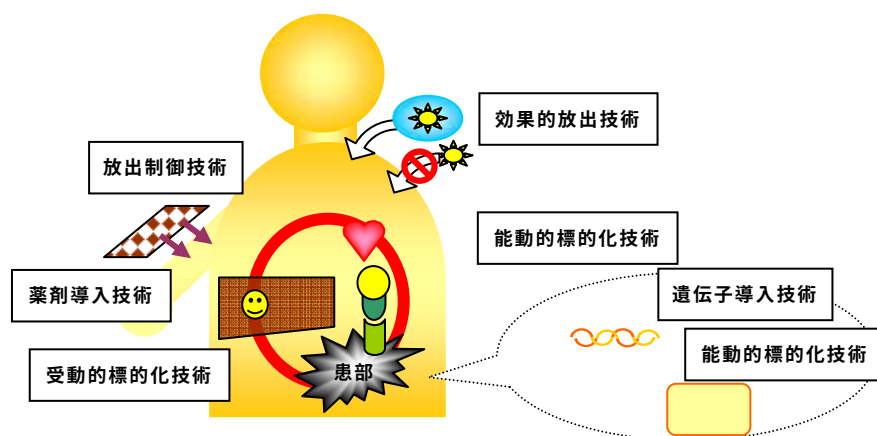
薬剤吸収制御技術には、粘膜や皮膚などを通して薬剤を吸収させる「薬剤導入技術」と、細胞内に遺伝子を導入して疾患を治療する遺伝子治療などに用いられる「遺伝子導入技術」がある。

表 1.1.3-1 ドラッグデリバリーシステムの技術要素

| 技術要素Ⅰ    | 技術要素Ⅱ    |
|----------|----------|
| 薬剤放出技術   | 放出制御技術   |
|          | 効果的放出技術  |
| 薬剤標的化技術  | 能動的標的化技術 |
|          | 受動的標的化技術 |
| 薬剤吸収制御技術 | 薬剤導入技術   |
|          | 遺伝子導入技術  |

図1.1.3-1にドラッグデリバリーシステムの技術要素を模式的に示す。

図 1.1.3-1 ドラッグデリバリーシステムの技術要素の模式図



## (1) 薬剤放出技術

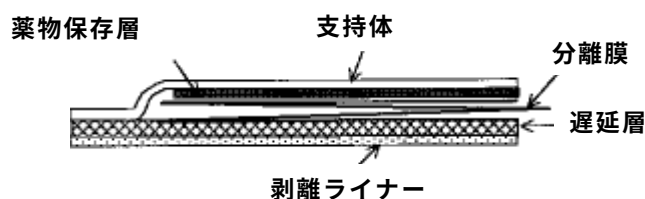
### ①放出制御技術

禁煙用のニコチン経皮パッチ製剤などに使われている放出制御技術は、ドラッグデリバリーシステムが有用であることを初めて示した技術である。具体的には、30年以上前に経皮吸収システムが開発され、狭心症の治療に用いられるニトログリセリンの経皮パッチ製剤が開発され、夜間の就寝時にも発作を予防することができるようになり、数十億円のヒット製品となった。現在、ドラッグデリバリーシステム製剤の売り上げの70%を放出制御型が占めている。

放出制御技術によって、投与回数を減らして患者のQOLを向上することができる。例えば、緑内障の治療には、1日2回の点眼が必要であったが、涙液中のナトリウムイオンでゲル化するジェランガムとともに薬剤を下瞼の内側に投与することにより、1日1回の投与で済むようになった。

また、マイクロパーティクルに性ホルモン分泌刺激物質を包含させたドラッグデリバリーシステムは、1回の投与で4週間作用が持続し、子宮筋腫などの治療に用いられている。徐放性ドラッグデリバリーシステムが開発される前は、患者が毎日注射する必要があったが、投与の煩わしさと苦痛が大幅に緩和され、患者のQOLの向上に大きな貢献をしている。

図1.1.3-2 経皮吸収パッチ



特開 2003-104875 「放出遅延型薬物投与デバイス」

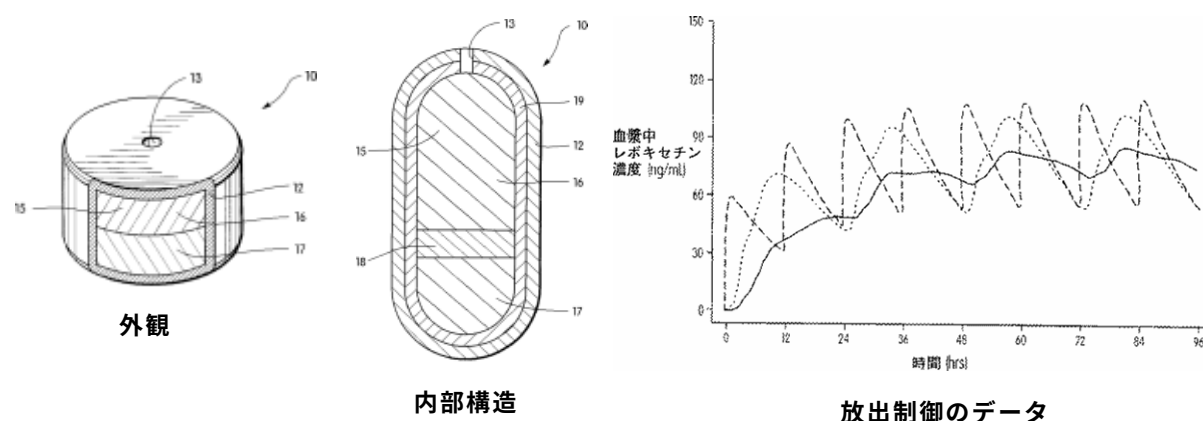
徐放化技術を発展させたものとして薬剤の放出を制御する技術がある。薬剤の血中濃度を一定に保つことにより薬効を持続化して治療の最適化を図ることを目的としている。薬剤放出技術の例を表1.1.3-2に示す。

表1.1.3-2 薬剤放出制御技術の例

| 技術名    | 放出制御方法                                                                                           | イメージ図 |
|--------|--------------------------------------------------------------------------------------------------|-------|
| 浸透圧ポンプ | 塩を多量に含有する製剤を半透膜で覆い、半透膜を通して錠剤内に侵入した水によって薬剤が飽和溶液となり表面に開いた小孔から一定速度で放出される。                           |       |
| 拡散制御   | 顆粒状の薬剤に小孔のあるポリマー層を形成したもので、胃腸内容液などが侵入して薬剤を溶解し、薬剤を放出する。ポリマー層の穴の大きさが変化するように設計することなどにより、放出量を一定に制御する。 |       |

放出制御型ドラッグデリバリーシステムの代表例である浸透圧ポンプは、世界初のドラッグデリバリーのベンチャー企業である米国アルザが開発したOros技術が代表的なものである。図1.1.3-3に示すように、半透膜で包まれた電解質と薬物コアに徐々に消化液の水が浸透し、その浸透圧によってオリフィス（細孔）から一定速度で薬物を放出する。

図1.1.3-3 浸透圧ポンプ型放出制御システムの例



特表2003-509354 「1日1回投与で有効なレボキセチン治療を与える製剤及び方法」

## ②効果的放出技術

たんぱく質やペプチドなどは水に難溶性である。また、作用は強いが化学的に不安定な薬剤もある。さらにがんの治療薬として有効なタキソールは毒性も強く、使いにくいという課題がある。こうした薬剤を医薬品として実用化するためにはDDS技術を含む製剤技術が有効である。

具体的な技術としては、薬剤を粉碎あるいは再結晶化して微細粒子化（マイクロ粒子、ナノ粒子）する技術がある。また、水溶性高分子へ溶解（固溶化）したり、微細分散（固体分散体）させる技術、可溶性の塩と複合体を形成させる技術がある。さらには、シクロデキストリンなどの包接体を用いる技術、界面活性剤あるいは油脂・溶剤に溶解する技術、マイクロエマルジョン化技術などがある。

特に、水溶性高分子の中に薬物を溶解する固溶体利用技術など技術の蓄積があり、難溶性薬剤を活用する手段として広く用いられている。

## (2) 薬剤標的化技術

### ① 能動的標的化技術

ドラッグデリバリーシステムの最大の目的である「標的の病巣に薬物を送達する」技術が能動的標的化である。がん細胞を最大の標的として技術開発が活発に行われている。がんに対しては、外科手術や放射線治療と並行して抗がん剤による化学療法が行われているが、正常細胞への副作用が強く、十分な治療が施せないというのが現状である。

がん細胞の表面には特異的に発現している物質があり、これらの抗原物質に対する抗体を用いて標的化する研究が行われている。また、がん細胞などに特有の受容体に対するリガンドを利用した標的化の研究も行われている。

抗体に関しては、特定の抗原だけに結合するモノクローナル抗体を用いる方法がいち早く検討されたが、初期のモノクローナル抗体は、マウスを用いて作製されたものであったために、ヒトの体内で異物として認識され、アレルギーを引き起こすといった問題が明らかになった。その後、ヒト化抗体を作製する技術が開発されて、こうした課題を解決することができる可能性が出てきたことから、モノクローナル抗体を用いた標的化に関する研究開発が再度活発化してきている。ただし、日本ではモノクローナル抗体を利用した標的化ドラッグデリバリーシステムは、まだ実用化されていない。

図1.1.3-4に能動的標的化システムの例を示す。

図1.1.3-4 能動的標的化システムの例

Fig.1.

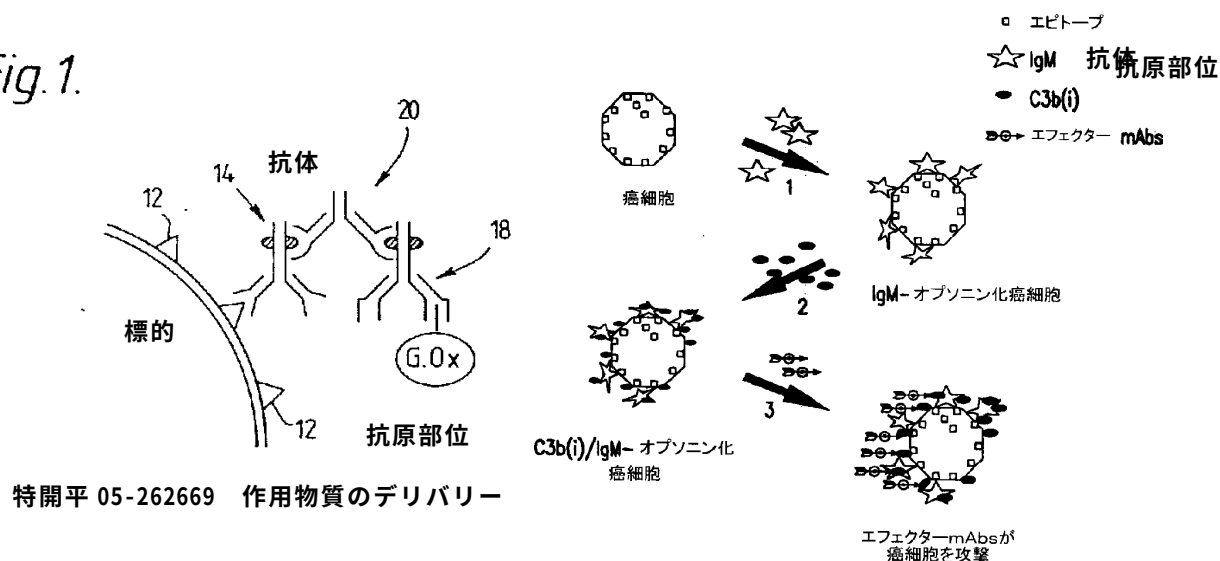


FIG.8

特表 2002-524533 癌細胞に診断薬及び治療薬を  
デリバリーするための C3b(i) に対する抗体

### ② 受動的標的化技術

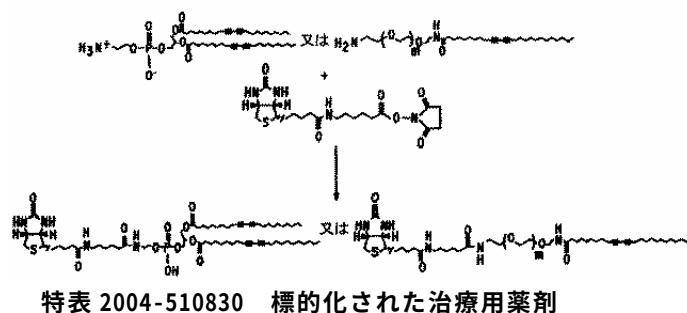
がん細胞は通常細胞に比べて増殖が早く、より多くの栄養や酸素を必要とする。そのために、がん細胞は血管造成因子を産生して血管を新生するとともに、血管透過性亢進因子を分泌するために血管の微粒子透過性が通常の血管よりも高くなっている。こうしたがん

組織における血管系の特殊性に及ぼす効果は EPR 効果（Enhanced Permeability and Retention Effect）と呼ばれ、この効果を逆手に取ったがん細胞への薬剤標的化技術が研究開発されている。

一方、血管系（静脈）に投与された薬剤は、血液中のたんぱく質や補体と結合して肝臓や脾臓などで捕捉される。こうした捕捉を回避して体内を長時間循環させ、EPR 効果によって標的の患部に薬剤を集積させる技術があり、受動的標的化と呼ばれる。

ポリエチレングリコールによる表面修飾は、薬剤にこうした効果を与える代表的な技術であり、薬剤の担体として重要なリポソームとの複合による受動的標的化の研究開発が活発に行われている。

図1.1.3-5 受動的標的化システムの例

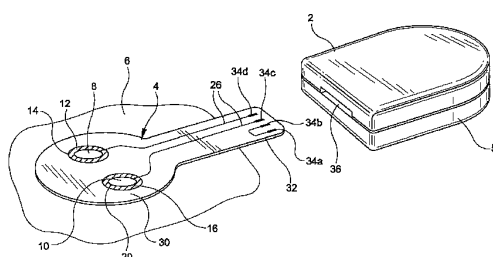


### (3) 薬剤吸収制御技術

#### ①薬剤導入技術

薬剤導入技術は、体内に吸収されにくい薬剤を皮膚や腸管の粘膜を通して送達する方法である。皮膚などを通して薬剤を導入する方法としては、イオントフォレシス<sup>注1)</sup>などのように電流を使うものや超音波を利用する方法など、物理的刺激を利用した装置が開発されている。

図1.1.3-6 薬剤導入方法の例（物理的刺激を利用した方法）



イオントフォレシスの例

特開 2001-95928

イオン導入法による薬剤 投入装置

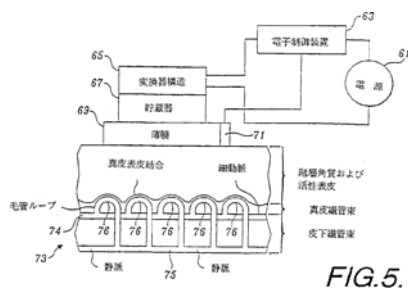


FIG.5.

超音波を利用した例

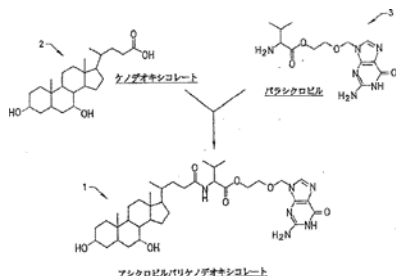
特表平 08-502424

超音波経皮 薬物 供給システム

注 1)イオントフォレシス：直流電流によって一定量の薬剤を皮膚または粘膜を通して投与する方法。[JIS K 3611 15167]

一方、腸管などから吸収されにくい薬剤に例えば胆汁酸などを結合させることにより、吸収されやすくし、体内に吸収されてから開裂して薬効を発揮させるようにするプロドラッグ化が薬剤導入方法として開発されている。

図1.1.3-7 薬剤導入方法の例（プロドラッグ）

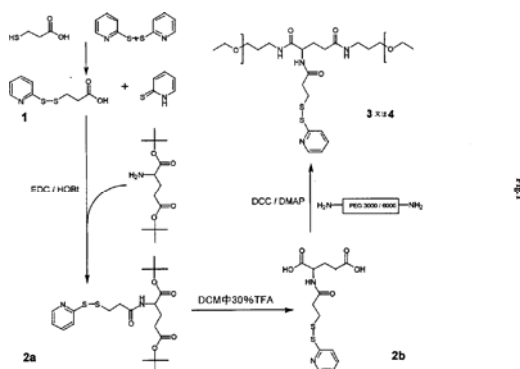


特表 2003-530329 増大したバイオアベイラビリティを有する胆汁酸含有プロドラッグ

## ② 遺伝子導入技術

遺伝子導入技術は、細胞内に遺伝子を導入して治療を行う遺伝子治療と呼ばれる方法であり、ドラッグデリバリーシステムの応用として研究が行われている。遺伝子を細胞内に導入するには、従来ウイルスの感染性を利用したウイルスベクターが用いられていたが、副作用の危険性があるために、人工的なベクターの開発が望まれている。ポリカチオンが遺伝子を細胞内に導入することを助けることが分かってきており、新しい遺伝子導入方法として開発が行われている。

図1.1.3-8 遺伝子導入に用いられるポリカチオンの例



特表 2003-50359 核酸を細胞に輸送するためのコポリマー



#### **1.1.4 特許からみた技術の進展**

##### **(1) 薬剤放出技術の進展**

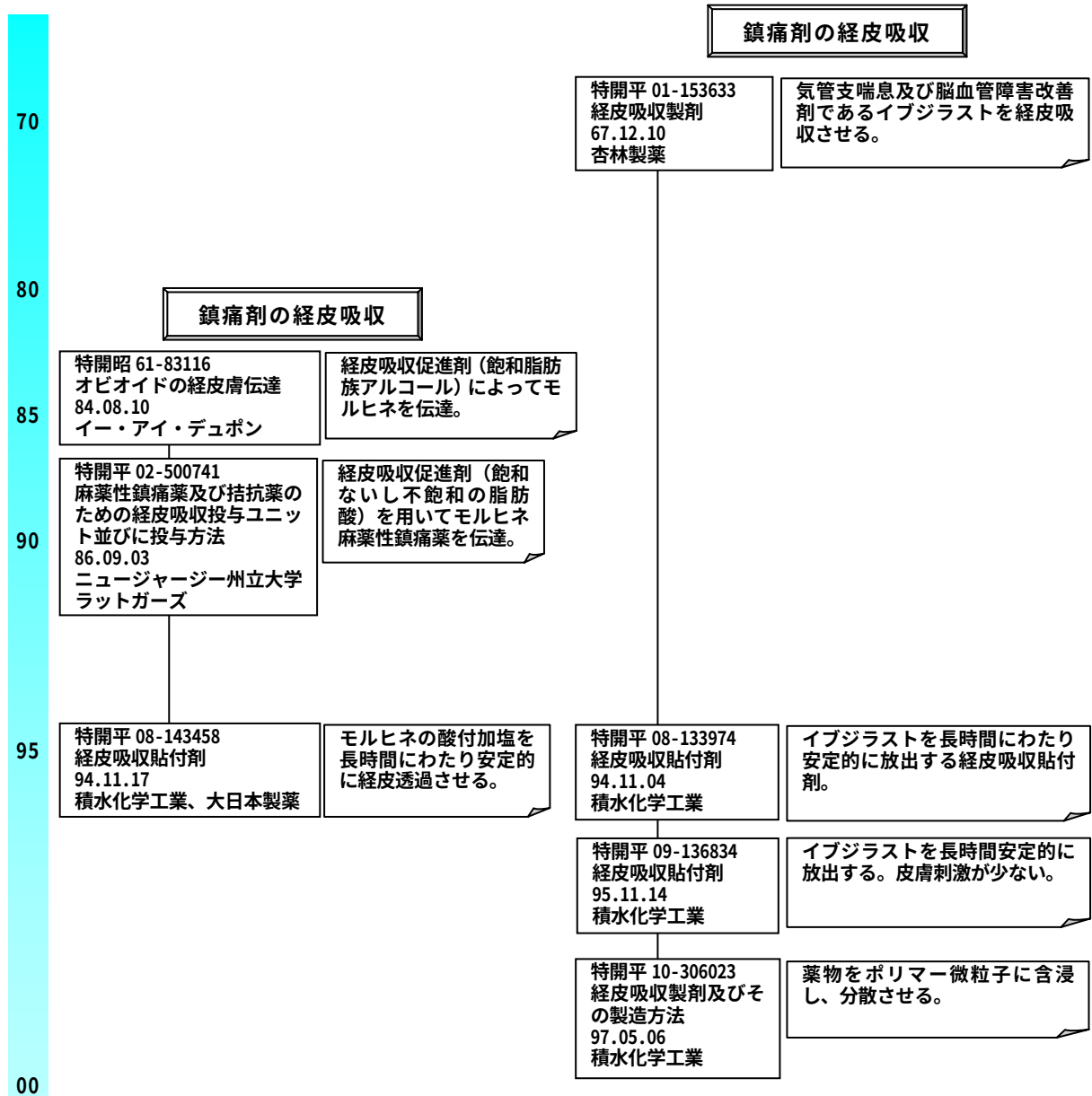
喘息治療薬などの薬剤は、長時間にわたって安定的に薬剤を投与する必要がある。特に就寝時にも薬剤を継続的に投与する必要がある。こうした薬物送達の要求に応える技術として、薬剤を粘着剤などに分散させたパッチやテープを皮膚に密着させて、薬剤を放出させる技術が開発されている。

図 1.1.4-1 に薬剤放出技術の発展図を示す。気管支喘息及び脳血管障害改善剤であるイブジラストを経皮吸収させる技術が早くも 1967 年に開発されている。その後、皮膚刺激を少なくする改良などがなされ、患者の QOL 改善が進められている。

また、モルヒネなどの鎮痛剤を経皮投与によって連続的に投与する技術が開発されている。

図 1.1.4-1 薬剤放出技術の発展図

経皮吸収技術の発展図



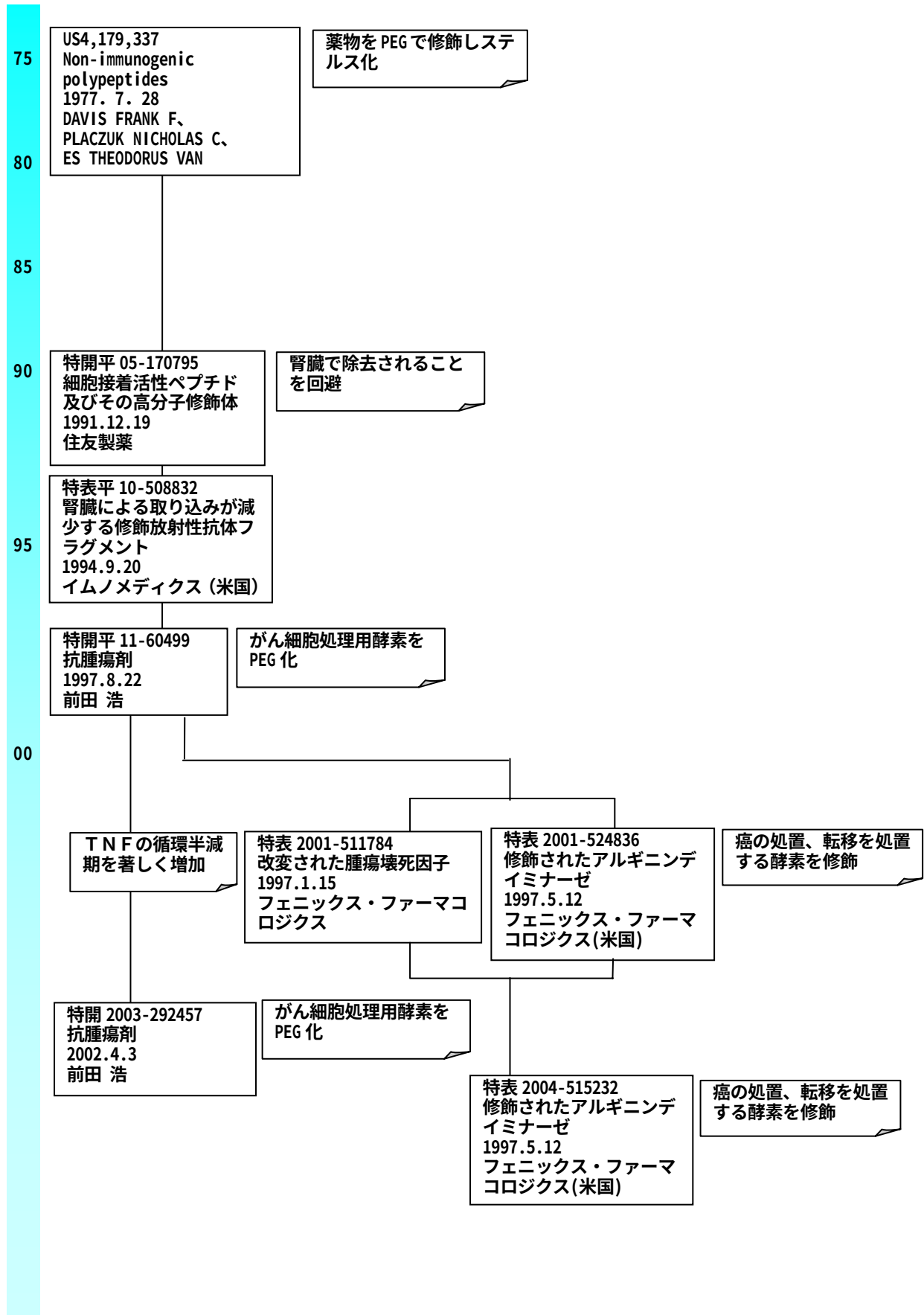
## **(2) 薬剤標的化技術の進展**

薬物送達技術において、薬剤を注射等によって体内に投与し肝臓をはじめとする臓器によって薬物が捕らえられることを回避（ステルス化）し、体内循環を高めて患部に到達させる技術がある。がんなどの患部では、血管細胞の隙間が広がっており、薬物が供給される。こうした技術としては、水溶性の高分子化合物であるポリエチレングリコール（PEG）を薬物に結合させてステルス化させる技術がある。

図 1.1.4-2 にポリエチレングリコールを用いてステルス化する技術の発展図を示す。

図 1.1.4-2 薬剤標的化技術の発展図

ポリエチレングリコールを用いてステルス化する技術の発展図



### **(3) 薬剤吸収制御技術の進展**

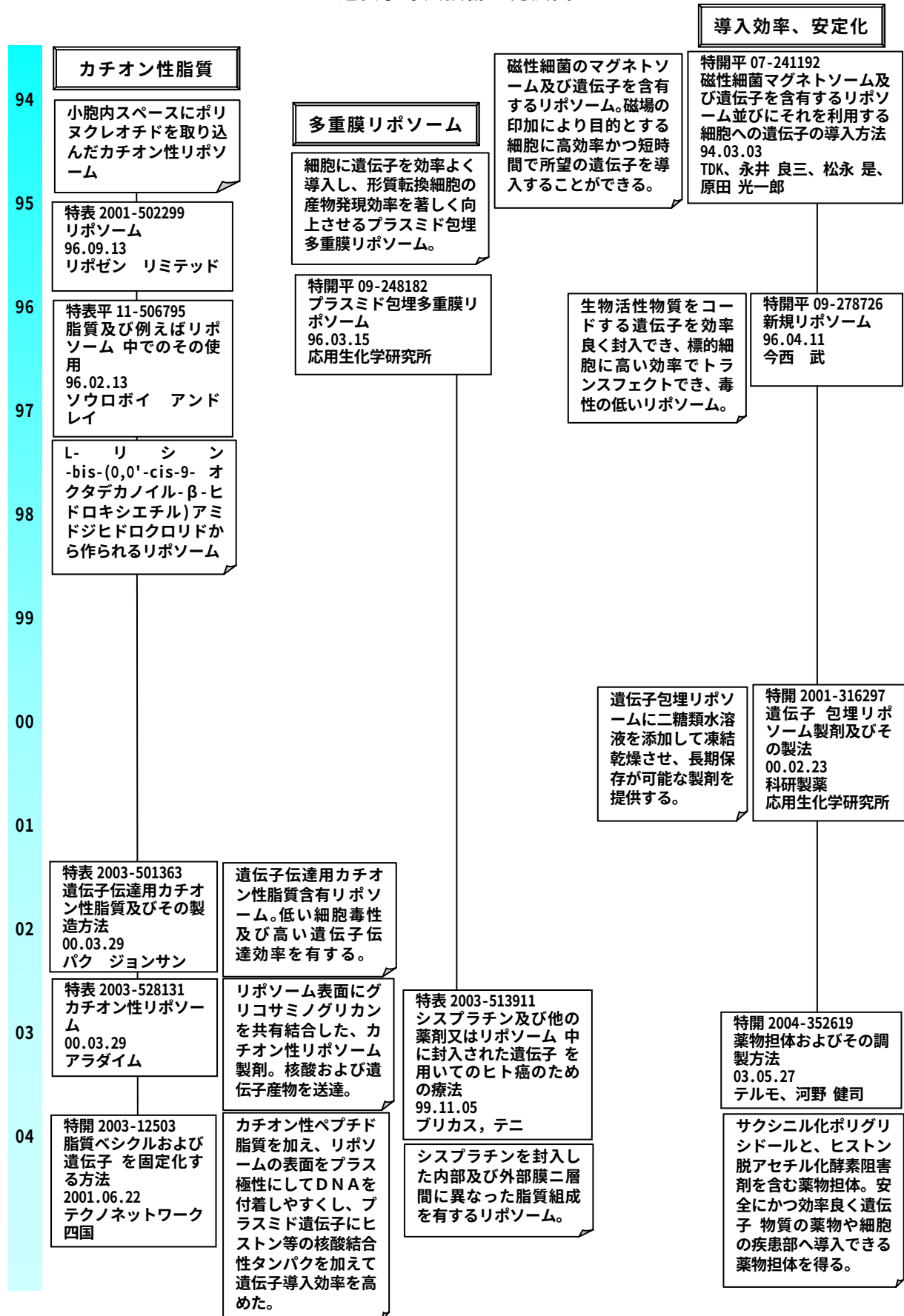
薬剤吸収制御技術として、遺伝子導入技術が注目されている。図 1.1.4-3 に遺伝子導入技術の発展図を示す。従来はアデノウイルスなどのウイルスベクターのもつ感染性、すなわち遺伝子を細胞内に挿入する能力を利用していましたが、ウイルスには本来病原性があることから安全性などの点に問題があった。そこで、リポソームなどを遺伝子導入に用いる技術が開発されてきている。リポソームを細胞内に取り込まれやすくするために、細胞内に取り込まれる能力を有するカチオン性ポリマーとリポソームを組み合わせる方法が検討されている。

また、多重膜にしてリポソームを安定化するとともに、内外の電荷を調節し、遺伝子導入性を向上させる技術が検討されている。

その他、リポソームを安定化したり、導入効率をさらに向上させるために磁場を利用したりする技術が開発されている。

図 1.1.4-3 薬剤吸収制御技術の発展図

遺伝子導入技術の発展図



### 1.1.5 ドラッグデリバリーシステムの市場

#### (1) 技術と市場の関係

ドラッグデリバリーシステムが利用されている疾患の概要を表1.1.5-1に示す。

表1.1.5-1 ドラッグデリバリーシステムが利用されている疾患の概要

| 利用されているドラッグデリバリーシステム技術 | 疾患     | 薬物                  | 特性                           |
|------------------------|--------|---------------------|------------------------------|
| 薬剤放出制御（経皮）             | 狭心症    | 亜硝酸化合物              | 持続的な頻回投与が必要                  |
| 薬剤放出制御（経口）             | 喘息     | キサンチン誘導体            | 持続的な投与が必要                    |
| 薬剤放出制御（目）              | 緑内障    | ピロカルピン              | 持続的な頻回投与が必要                  |
| 薬剤放出制御                 | 糖尿病    | インスリン               | 生体応答を組み込んだ管理が必要              |
| 薬剤放出制御（安定化）            | 先天性代謝病 | 欠損酵素                | 体内での半減期を長くすることが必要            |
| 薬剤標的化                  | 悪性腫瘍   | 抗がん剤                | 特定の細胞群を標的にし、副作用を引き起こさないことが必要 |
| 薬剤標的化                  | 免疫疾患   | サイトカイン              | 多様な生理活性物質の分離が必要              |
| 薬剤吸収制御（プロドラッグ化）        | 細菌感染症  | 抗生物質                | 経口投与型の薬剤が必要                  |
| 薬剤吸収制御                 | 内分泌異常  | ペプチド性ホルモン           | 吸収障壁の透過性を増加させることが必要          |
| 薬剤吸収制御                 | 脳機能低下  | ニューロペプチド            | 薬剤が脳関門を通過できるようにすることが必要       |
| 薬剤吸収制御                 | 遺伝子治療  | アンチセンスRNA、オリゴヌクレオチド | 細胞内、核内への遺伝子送達が必要             |

ドラッグデリバリーシステムの世界市場は約6兆円であり、徐放性の経口剤や注射製剤、吸入剤が主流となっている。年平均伸び率は16%であり、2005年には10兆円を超えると予測されている。

徐放性ドラッグデリバリーシステムは、ドラッグデリバリーシステムの有用性を認めさせた技術の一つであり、現在、ドラッグデリバリーシステムの売り上げの70%を占めている。

DDSの市場規模は今後10年で大幅に拡大すると予測されている。

2001年 6.0兆円（医薬品全体の13.6%）

2011年 22.6兆円（同34%）

資料：経済産業省「今後のナノテクノロジー材料分野政策」（平成16年4月13日）

## (2) 市場の参入環境

表1.1.5-2にドラッグデリバリーシステムの情報源を示す。

表1.1.5-2 ドラッグデリバリーシステムの情報源

| 学 会 名                                                                                      | 概 要                                                    |
|--------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------|
| 日本DDS学会<br><a href="http://square.umin.ac.jp/js-dds/">http://square.umin.ac.jp/js-dds/</a> | 臨床医学、薬学、薬理学を始め幅広い領域のDDSに関する研究を発表する場として1984年に設立された。     |
| 遺伝子・デリバリー研究会<br><a href="http://www.gene-delivery.org/">http://www.gene-delivery.org/</a>  | 遺伝子治療に必要な、遺伝子およびそのデリバリーシステムを研究・開発することを目的として2001年に発足した。 |

公的機関による研究開発については、厚生労働省による「ナノメディシン」、農林水産省による「均一粒径ナノ粒子の製造・利用技術の開発」、新エネルギー・産業技術開発機構（NEDO）による「ナノカプセル型人工酸素運搬体製造プロジェクト」などがあったが、平成16年度から、府省連携プロジェクトとして「ナノ薬物送達システム（DDS）」が始まっている。

文部科学省では、物質・材料研究機構が東京大学など共同して、ナノ分子合成技術、ナノ粒子制御技術の活用により、がんや糖尿病などの疾患を安全で効果的に治療する薬物送達システム（DDS、ドラッグデリバリーシステム）用の担体材料を開発する「革新的ナノ薬物送達システム（DDS）のための担体材料開発」（18億円）を実施している。



## 1.2 ドラッグデリバリーシステムの特許情報へのアクセス

### 1.2.1 国際特許分類（IPC）によるアクセス

国際特許分類（IPC）では、ドラッグデリバリーシステムの技術のみを有する分類（グループ）を用意していない。このため、ドラッグデリバリーシステムに関する特許にアクセスするためには、薬剤放出技術、薬剤標的化技術、薬剤吸収制御技術それぞれにアクセスする必要がある。

ドラッグデリバリーシステムに関する特許がカバーされるグループとしては、下記のミサイル療法という薬剤標的化技術に関するものが1つある。その他にマイクロカプセルとプロドラッグという広い意味でドラッグデリバリーシステムに関連した分類があるが、これらの分類は従来のカプセル製剤などを含有するため、ドラッグデリバリーシステムに絞るためにはキーワード等による限定を加える必要がある。

IPC：A61K39/395 ミサイル療法

A61K9/50（医薬品を含有するマイクロカプセル）

A61K9/52（徐放性医薬品マイクロカプセル）

A61K00/00, AGB プロドラッグ製剤

A61P43/00, 123 プロドラッグ（H11.6 新設）

### 1.2.2 ファイル・インデックス（FI）によるアクセス

ドラッグデリバリーシステムに関する技術のうち、薬剤標的化技術については、以下のファイル・インデックス（FI）によってアクセスすることができる。

FI：A61K39/395 ・抗体；免疫グロブリン；免疫血清、例．抗リンパ球血清

A61K39/395A 抗体

A61K39/395C ・ミサイル技術

A61K39/395H モノクローナル抗体

A61K39/395L ・ミサイル技術

A61K39/395V 免疫グロブリン

A61K39/395Y ・医薬用途、配合剤、製剤〔ミサイル〕

### 1.2.3 Fターム（FT）によるアクセス

ドラッグデリバリーシステム技術に関しては、以下のFタームによってアクセスすることができる。

FT：4C084NA13 蛋白脂質酵素含有：その他の医薬 ・薬物体内輸送（DD S）

FT：4C086NA13 他の有機化合物及び無機化合物含有医薬 ・薬物体内輸送（DD S）

FT：4C087NA13 動物、微生物物質含有医薬 ・薬物体内輸送（DD S）

FT：4C206NA13 非環式または炭素環式化合物含有医薬 ・薬物体内輸送（DD S）

FT：4C088NA13 植物物質含有医薬 ・薬物体内輸送（DD S）

FT：4C076AA93 医薬品製剤 ・徐放化系

FT：4C076AA95 医薬品製剤 ・・ドラッグデリバリー系

FT：4C085AA21 抗原、抗体含有医薬：生体内診断剤  
・・・他の薬効成分と結合させたもの（ミサイル）

#### 1.2.4 キーワードによるアクセス

パトリスが提供する検索サービスでは、ドラッグデリバリーに関連するフリーキーワードとして、以下のものを用いることができる。

ドラッグデリバリー、ドラッグデリバリ、ドラッグ・デリバリー、ドラッグ・デリバリ  
DDS、ディーディーエス、ディー・ディー・エス  
（薬物+薬剤）\*（送達+配送）

#### 1.2.5 ドラッグデリバリーシステムのアクセス例

ドラッグデリバリーシステム技術を構成する技術にアクセスする場合、これらの技術を分類している IPC、FI、FT を選択して母集合とし、漏れのないようにキーワードを用いてアクセスする方法がある。表 1.2.5-1 にドラッグデリバリーシステム技術へのアクセス参考例を示す。

表 1.2.5-1 ドラッグデリバリーシステム技術へのアクセス参考例

| 技術要素          | 使用分類またはキーワード                                                               |
|---------------|----------------------------------------------------------------------------|
| 薬物体内輸送（DDS）全体 | FT = 4C084NA13 + 4C086NA13 + 4C087NA13 + 4C206NA13 + 4C088NA13 + 4C076AA95 |
|               | ドラッグデリバリー+ドラッグデリバリ+ドラッグ・デリバリー+DDS+ディーディーエス+ディー・ディー・エス                      |
|               | （薬物+薬剤）*（送達+配送）                                                            |
| 薬剤放出技術        | FT = 4C076AA93                                                             |
| 薬剤標的化技術       | FI = A61K39/395C + A61K39/395L + A61K39/395Y                               |
|               | FT = 4C085AA21                                                             |

なお、ドラッグデリバリーシステムの個々の技術要素ごとにアクセスする場合には、IPC や FI、FT を用いて適当な検索を行うことは難しいため、キーワードの組み合わせを用いることが推奨される。表 1.2.5-2 に能動的標的化技術へのアクセスの例を示す。

表 1.2.5-2 能動的標的化技術へのアクセス参考例

| 技術要素     | キーワード                          |
|----------|--------------------------------|
| 能動的標的化技術 | 能動的*標的化                        |
|          | （抗体+抗原+受容体+レセプター+リガンド）*（標的+送達） |

## 1.3 技術開発活動の状況

### 1.3.1 ドラッグデリバリーシステムの技術開発活動

ドラッグデリバリーシステムに関する特許出願の特徴は、外国人による出願が圧倒的に多いことである。図 1.3.1-1 にドラッグデリバリーシステムの出願人の国籍別分布を示す。ドラッグデリバリーシステムの出願人は米国が約半数を占め、8 割が外国国籍である。

図 1.3.1-1 ドラッグデリバリーシステムの出願人の国籍の分布

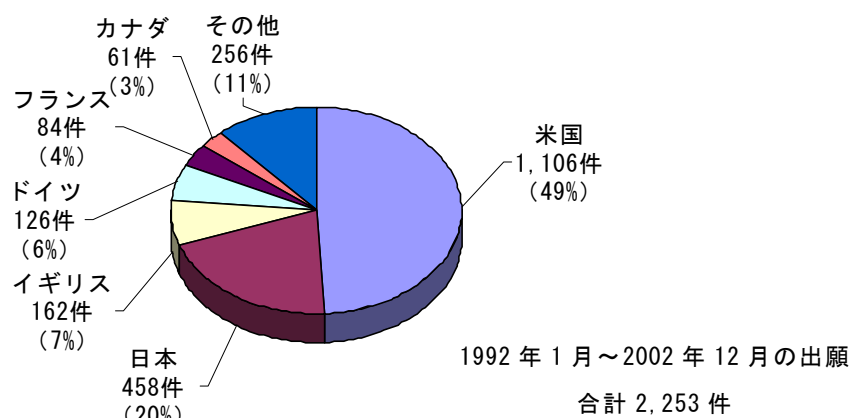
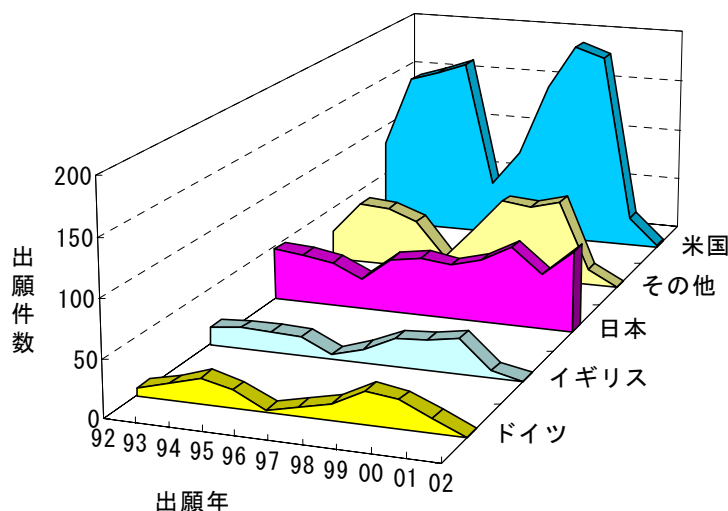


図 1.3.1-2 に出願人の国籍別の出願件数の推移を示す。いずれの国においても 1990 年代半ばに出願件数が減少したが、その後、増加に転じていることが分かる。日本の場合には 00 年以降も出願件数が増加している。外国国籍の出願人の出願件数が 00 年以降減少しているのは、PCT による出願が多いことによるもので、全体として公開が遅れる。したがって、ドラッグデリバリーシステムの研究開発は 90 年代半ば以降、年々活発になってきていると見られる。

図 1.3.1-2 ドラッグデリバリーシステムの出願人の国籍別の出願件数の推移

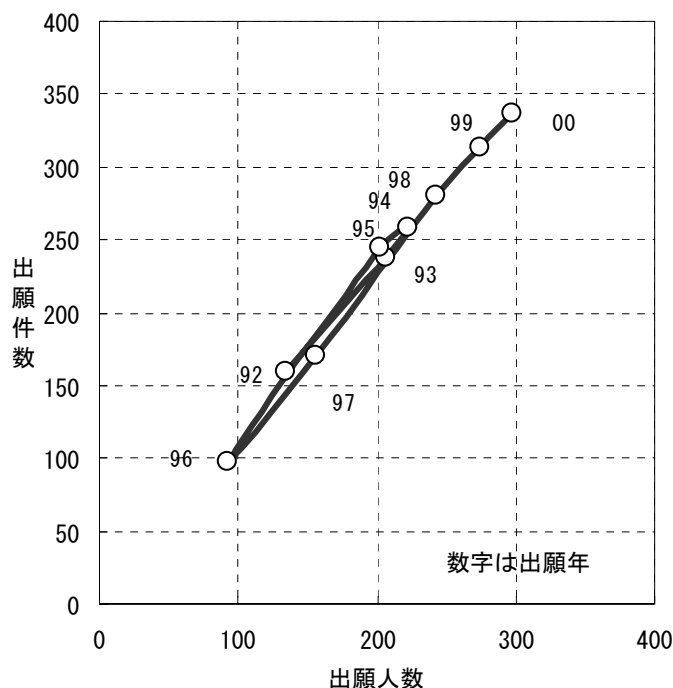


ドラッグデリバリーシステムに関する出願は、PCT による国際出願が非常に多く、全体の 80%を占めている。このため、以下、PCT 出願によるものと国内出願によるものとに分けて分析する。

図 1.3.1-3 および図 1.3.1-4、図 1.3.1-5 にドラッグデリバリーシステム全体の出願件数と出願人数の推移を示す。PCT によるドラッグデリバリーシステムに関する特許出願は、92 年の年間約 100 件の出願から 93 年には年間約 200 件へと倍増し、その後 95 年まで年間 200 件程度を維持し、出願人数も 160 人程度を維持していた。ところがモノクローナル抗体開発の障壁に当たったことから 96 年に年間 50 件に出願件数が急減し、出願人数も同様に減少した。この減少は長期的なものではなく、97 年からは出願件数が再度増加に転じ、99 年には年間 250 件を超え、00 年には 275 件の出願件数になり、出願人数も 270 人程度になった。01 年、02 年については、PCT による公開の遅れがあるため、図から除外している。一方、日本の公開特許については、92 年～95 年にかけて出願件数が減少し、96 年以降増加に転じている。01 年に件数が再度減少したが、02 年には年間 50 件に戻っている。

すなわち、ドラッグデリバリーシステムの技術開発活動としては、90 年代半ばに一次的に活動が低調になったか、その後活発化してきていることが分かる。

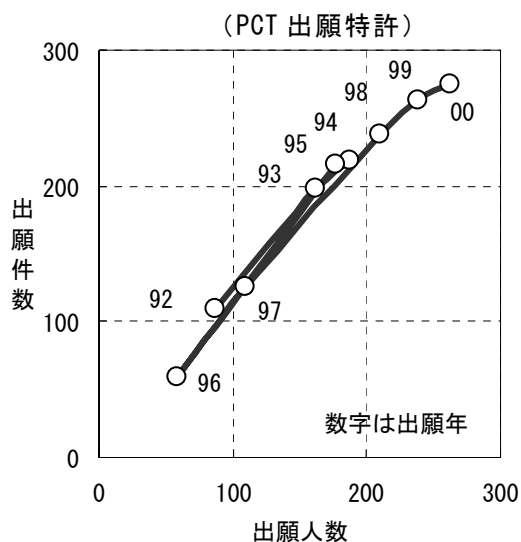
図 1.3.1-3 ドラッグデリバリーシステム全体の出願人数と出願件数の推移  
(全件数)



1992 年 1 月～2002 年 12 月の出願

(01～02 年は PCT 出願が未公表のため、図からは除外)

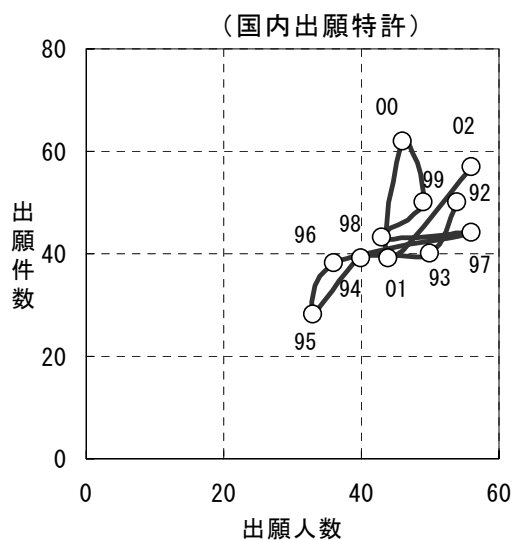
図 1.3.1-4 ドラッグデリバリーシステム  
全体の出願人数と出願件数の推移



1992 年 1 月～2002 年 12 月の出願

(01～02 年は未公表のため図からは除外)

図 1.3.1-5 ドラッグデリバリーシステム  
全体の出願人数と出願件数の推移



1992 年 1 月～2002 年 12 月の出願

表 1.3.1-1 に主要出願人の出願状況を示す。ドラッグデリバリーシステムに関する特許は外国の出願人が多いことが特徴である。上位 10 社に日本からは科学技術振興機構が入っているだけである。特に、米国の出願人がほとんどを占めており、出願上位 20 社では、フランスのサノフィ・アベンティスが 1 社入っているだけである。

出願人の業種としては、サノフィ・アベンティスやジョンソンアンドジョンソンなどの外国の製薬メーカー、ヘルスケア商品メーカーからの出願が多い。日本からも武田薬品工業などの製薬メーカーが多数出願している。

ドラッグデリバリーシステムに関する特許出願のもう一つの特徴として、カリフォルニア大学やテキサス大学などの米国の大学からの出願および、アメリカ合衆国政府や科学技術振興機構などの公的機関からの出願が多いことが挙げられる。

出願件数 1 位のサノフィ・アベンティスは 93 年に多くの出願をしており、その後は出願件数が減少している。これに対して科学技術振興機構は 00 年以降に出願件数が増加している。

表 1.3.1-1 主要出願人の出願状況

| No. | 出願人                       | 年次別出願件数 |    |    |    |    |    |    |    |    |    |    | 合計 |
|-----|---------------------------|---------|----|----|----|----|----|----|----|----|----|----|----|
|     |                           | 92      | 93 | 94 | 95 | 96 | 97 | 98 | 99 | 00 | 01 | 02 |    |
| 1   | サノフィ・アベンティス（フランス）         | 2       | 13 | 9  | 7  | 1  | 2  | 6  | 6  | 3  | 2  |    | 50 |
| 2   | ジョンソン アンド ジョンソン（米国）       |         | 2  | 2  | 9  | 3  | 6  | 6  | 4  | 3  | 1  |    | 36 |
| 3   | カリフォルニア大学（米国）             | 2       | 7  | 2  | 1  | 1  |    | 4  | 6  | 5  |    |    | 28 |
| 4   | ジェネンテック（米国）               | 1       | 2  | 2  | 5  | 1  | 3  |    | 5  | 7  |    |    | 26 |
| 5   | ファイザー（米国）                 | 1       | 2  | 3  |    | 2  | 1  | 3  | 6  | 4  | 3  |    | 25 |
| 6   | 科学技術振興機構                  | 1       |    | 1  | 2  | 1  |    | 1  | 1  | 5  | 4  | 7  | 23 |
| 7   | カイロン（米国）                  | 3       | 2  | 3  |    | 1  | 4  | 3  | 3  | 2  |    |    | 21 |
| 8   | ブリストル・マイヤーズ スクイブ（米国）      | 2       | 4  | 4  | 4  |    |    | 3  | 1  | 2  |    |    | 20 |
| 9   | アメリカ合衆国（米国）               | 2       | 4  | 5  | 3  |    | 1  | 3  | 1  | 1  |    |    | 20 |
| 10  | テキサス大学（米国）                | 1       | 2  | 1  | 4  | 1  |    | 3  | 4  | 3  |    |    | 19 |
| 11  | 武田薬品工業                    | 3       | 1  | 2  |    | 2  | 2  | 2  |    | 3  | 1  | 2  | 18 |
| 12  | ウエスト ファーマシューティカル サービス（米国） | 1       |    | 2  | 3  | 2  | 5  | 2  | 2  |    |    |    | 17 |
| 13  | 久光製薬                      |         |    |    | 1  | 4  | 2  | 4  | 2  | 2  | 1  | 1  | 17 |
| 14  | メルク（米国）                   | 1       | 1  | 3  | 2  |    | 1  | 1  | 5  | 3  |    |    | 16 |
| 15  | アストラゼネカ（イギリス）             | 3       | 3  | 1  | 3  |    | 3  | 1  |    |    | 2  |    | 16 |
| 16  | イミュノメディクス（米国）             | 3       | 2  | 4  | 1  |    | 1  | 2  | 1  | 1  |    |    | 15 |
| 17  | エラン（アイルランド）               |         |    | 1  | 2  | 1  | 2  | 3  | 5  | 1  |    |    | 15 |
| 18  | マサチューセッツ工科大学（米国）          | 1       | 4  | 1  |    | 3  | 1  |    | 1  | 4  |    |    | 15 |
| 19  | エミスフィア・テクノロジーズ（米国）        | 1       | 1  | 3  | 1  |    | 3  | 2  | 3  |    |    |    | 14 |
| 20  | 協和醗酵工業                    |         |    |    | 1  |    | 1  | 2  | 3  | 3  | 1  | 3  | 14 |

1992 年 1 月～2002 年 12 月の出願

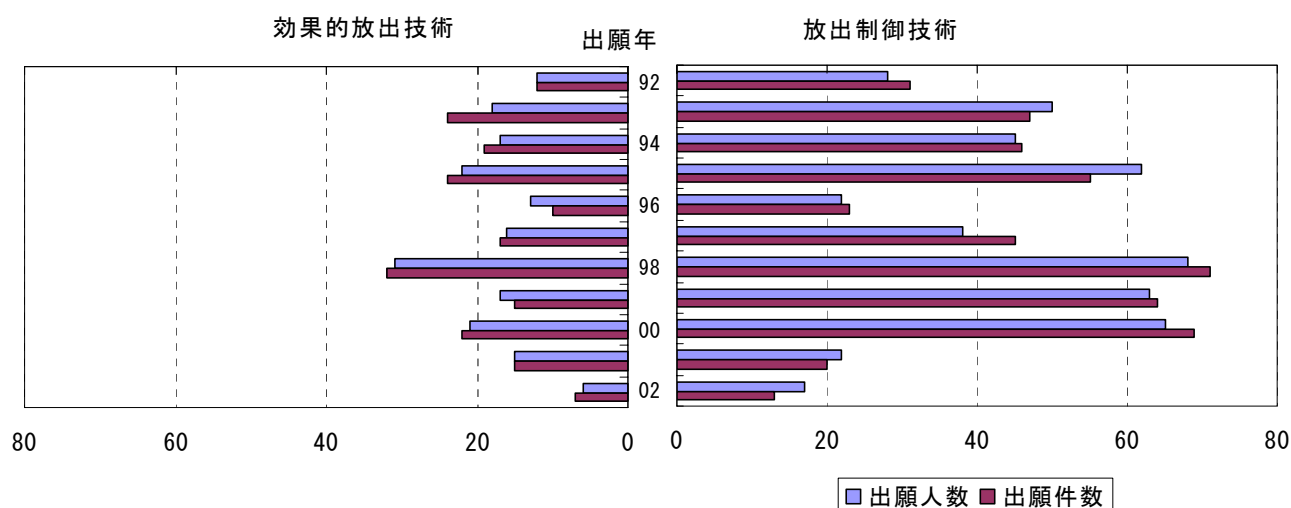
### 1.3.2 技術要素別の技術開発活動

#### (1) 薬剤放出技術

図1.3.2-1に薬剤放出技術の出願件数と出願人数の推移を、放出制御技術と効果的放出技術を対比して示す。放出制御技術と効果的放出技術の出願件数および出願人数はほぼ同様の増減推移をしている。1992～95年に件数、人数が増加し、96年に両者ともに減少している。その後、件数、人数が再度増加している。PCT出願の公開の遅れのために01年以降の件数、人数が少なくなっている。

放出制御技術の出願件数および出願人数は、効果的放出技術の約3倍となっている。効果的放出技術では出願件数と出願人数がほぼ1対1であるのに対して、放出制御技術では出願人数が出願件数よりも多くなっている。効果的放出技術は、薬剤の安定化などに関する技術であり、自社の技術的資源を用いた研究が中心であるのに対して、放出制御技術は、薬剤と高分子分離膜などの異なる技術の複合技術であるために共同で出願している場合が多いことを反映している。

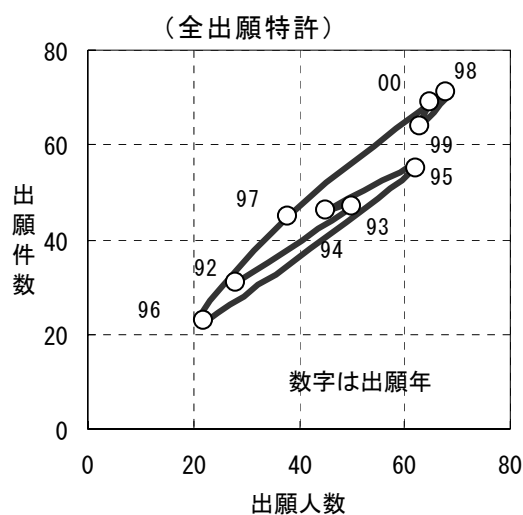
図1.3.2-1 薬剤放出技術の出願件数と出願人数の推移



#### ①放出制御技術

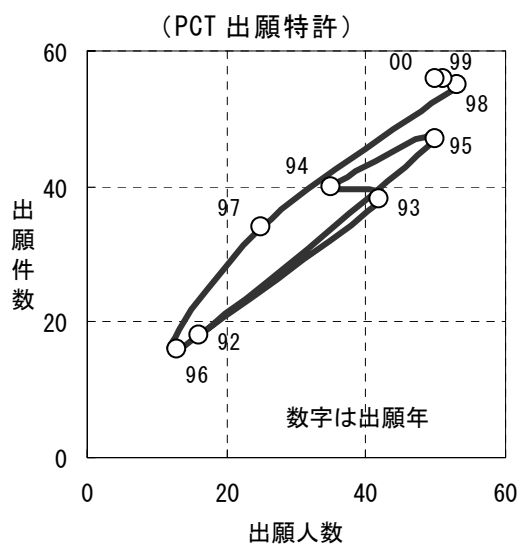
図1.3.2-2および図1.3.2-3、図1.3.2-4に放出制御技術の出願件数と出願人数の推移を示す。PCT出願は1992～95年にかけて出願件数、人数が増加した後、1996年に減少した。その後、再度増加に転じ、98年～00年には年間約55件の出願件数で推移している。その間、出願人数も60社前後で推移している。01年、02年については、PCTによる公開の遅れがあるため、図から除外している。国内出願特許は年間5件から15件の範囲で減少、増加を繰り返している。

図 1.3.2-2 放出制御技術の出願人数と出願件数の推移



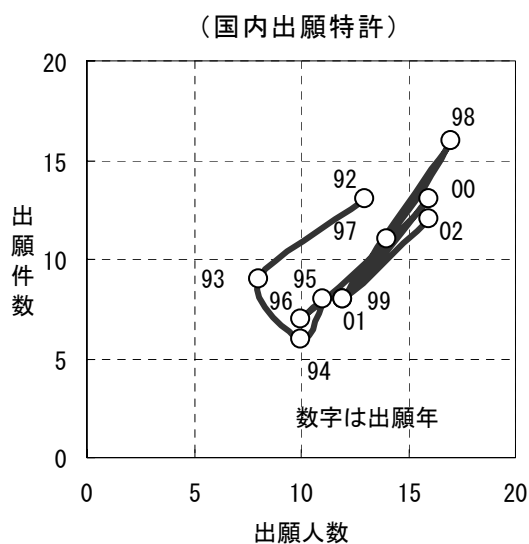
1992年1月～2002年12月の出願  
(01～02年はPCT出願が未公表のため、図からは除外)

図 1.3.2-3 放出制御技術の出願人数と出願件数の推移



1992年1月～2002年12月の出願  
(01～02年は未公表のため図からは除外)

図 1.3.2-4 放出制御技術の出願人数と出願件数の推移



1992年1月～2002年12月の出願



表1.3.2-1に放出制御技術の主要出願人の出願件数推移を示す。ジョンソンアンドジョンソンが最も多く出願しており、科学技術振興機構とファイザーがこれに次いで出願件数が多い。ジョンソンアンドジョンソンとファイザーは90年代を通じて出願しているが、アメリカ合衆国やウエスト ファーマシューティカル サービスなどは90年代末からの出願が見られなくなっている。

表1.3.2-1 放出制御技術の主要出願人の出願件数推移

| No. | 出 願 人                            | 年次別出願件数 |    |    |    |    |    |    |    |    |    |    |    |
|-----|----------------------------------|---------|----|----|----|----|----|----|----|----|----|----|----|
|     |                                  | 92      | 93 | 94 | 95 | 96 | 97 | 98 | 99 | 00 | 01 | 02 | 合計 |
| 1   | ジョンソンアンドジョンソン（米国）                |         | 2  | 1  | 2  | 1  | 7  | 1  | 3  | 1  |    |    | 18 |
| 2   | 科学技術振興機構                         |         |    | 1  | 1  |    |    | 8  |    | 1  | 1  |    | 12 |
| 3   | ファイザー（米国）                        |         | 1  | 2  |    | 1  |    |    | 4  | 2  | 1  |    | 11 |
| 4   | エラン(アイルランド)                      |         |    | 1  | 2  |    | 1  | 1  | 2  |    |    |    | 7  |
| 5   | エル テー イス ローマン テラピー システム<br>（ドイツ） | 1       |    | 2  | 1  |    |    | 1  |    | 1  |    |    | 6  |
| 6   | スカイファーム（米国）                      |         | 3  |    | 1  |    | 2  |    | 1  |    |    |    | 7  |
| 7   | マクロメド（米国）                        |         |    |    | 2  |    | 1  | 1  |    | 2  |    |    | 6  |
| 8   | 武田薬品工業                           |         |    | 1  |    | 1  | 1  | 2  |    | 1  |    |    | 6  |
| 9   | アメリカ合衆国（米国）                      |         | 2  | 1  | 2  |    |    |    |    |    |    |    | 5  |
| 10  | ウエスト ファーマシューティカル サービス<br>（米国）    |         |    | 1  | 1  |    | 2  | 1  |    |    |    |    | 5  |
| 11  | サノフィ・アベンティス<br>（フランス）            | 1       |    |    | 1  |    | 1  | 1  | 1  |    |    |    | 5  |
| 12  | マサチューセッツ工科大学（米国）                 |         | 2  | 1  |    | 1  |    |    | 1  |    |    |    | 5  |

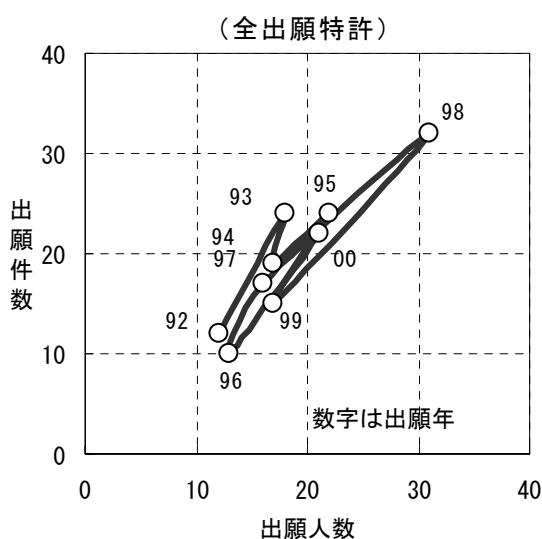
1992 年 1 月～2002 年 12 月の出願

## ② 効果的放出技術

図1.3.2-5および図1.3.2-6、図1.3.2-7に効果的放出技術の出願件数と出願人数の推移を示す。効果的放出技術の出願件数と出願人数は、ほぼ1対1の関係にあり、単独での出願が多いことが特徴である。出願件数、出願人数ともに1992～95年に増加した後、96年に減少した。その後出願件数、出願人数が増加し、98年に年間34件の出願が見られるようになった。その後はやや減少傾向にある。

PCT出願特許では、全出願件数、出願人数の推移とほぼ同じ推移を示している。01年、02年については、PCTによる公開の遅れがあるため、図から除外している。これに対して国内出願特許は、出願件数、出願人数の推移に格別の傾向は見られず、4件から8件の間で推移している。

図 1.3.2-5 効果的放出技術の出願人数と出願件数の推移



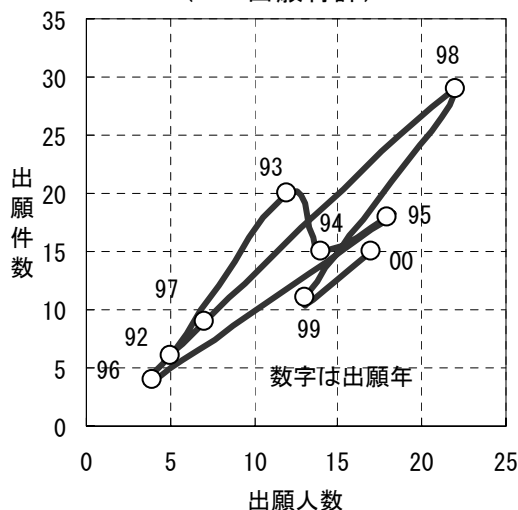
1992年1月～2002年12月の出願

(01～02年はPCT出願が未公表のため、図からは除外)

図 1.3.2-6 効果的放出技術の

出願人数と出願件数の推移

(PCT出願特許)



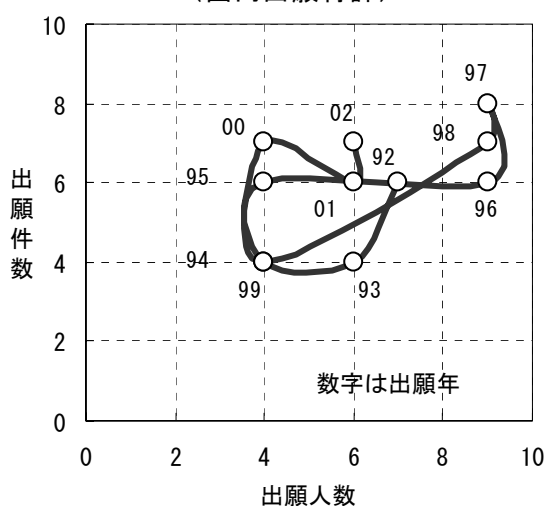
1992年1月～2002年12月の出願

(01～02年は未公表のため図からは除外)

図 1.3.2-7 効果的放出技術の

出願人数と出願件数の推移

(国内出願特許)



1992年1月～2002年12月の出願

表1.3.2-2に効果的放出技術の主要出願人の出願件数推移を示す。日本油脂が最も多く出願しているが、99年までの出願で、近年の出願は見られない。三共や千葉製粉といった日本のメーカーは日本油脂と同様に90年代末以降の出願が見られない。これに対して武田薬品工業は、96年以降に出願している。

アストラゼネカやファイザーは90年代を通じて継続的に出願している。

表1.3.2-2 効果的放出技術の主要出願人の出願件数推移

| No. | 出 願 人                   | 年 次 別 出 願 件 数 |    |    |    |    |    |    |    |    |    |    |     |
|-----|-------------------------|---------------|----|----|----|----|----|----|----|----|----|----|-----|
|     |                         | 92            | 93 | 94 | 95 | 96 | 97 | 98 | 99 | 00 | 01 | 02 | 合 計 |
| 1   | 日本油脂                    | 2             |    | 1  | 2  |    |    | 1  |    |    |    |    | 6   |
| 2   | アストラゼネカ（イギリス）           |               | 1  |    | 1  |    | 1  | 1  |    |    | 1  |    | 5   |
| 3   | エミスフエアー テクノロジーズ<br>（米国） | 1             |    |    |    |    | 2  | 1  | 1  |    |    |    | 5   |
| 4   | ジョンソンアンドジョンソン<br>（米国）   |               |    |    | 2  |    |    | 3  |    |    |    |    | 5   |
| 5   | ネクター セラピューテイクス<br>（米国）  |               |    |    |    |    |    | 3  |    | 1  |    |    | 4   |
| 6   | ファイザー（米国）               |               | 1  |    |    |    | 1  |    |    | 1  | 1  |    | 4   |
| 7   | 三 共                     |               |    |    |    |    | 2  | 1  | 1  |    |    |    | 4   |
| 8   | 千葉製粉                    | 2             | 2  |    |    |    |    |    |    |    |    |    | 4   |
| 9   | 第一製薬                    |               |    |    | 1  |    | 1  |    |    | 2  |    |    | 4   |
| 10  | 武田薬品工業                  |               |    |    |    | 1  | 1  |    |    | 1  |    | 1  | 4   |

1992年1月～2002年12月の出願

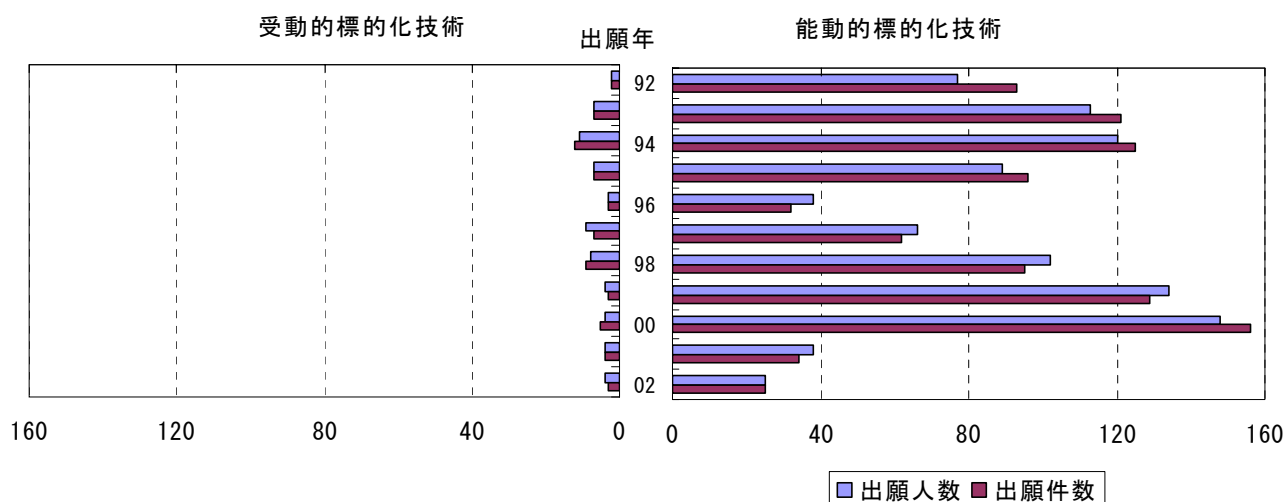
## (2) 薬剤標的化技術

図1.3.2-8に薬剤標的化技術の出願件数と出願人数の推移を、能動的放出技術と受動的標的化技術を対比して示す。能動的標的化技術の出願件数および出願人数は、受動的標的化技術の約10倍となっている。

出願件数、出願人数には大きな差が見られるものの、能動的標的化技術と受動的標的化技術の出願件数および出願人数はほぼ同様の増減推移をしている。1992～94年に受動的標的化技術の出願件数、出願人数が増加し、96年に両者ともに減少している。その後、出願件数、出願人数が再度増加している。PCT出願の公開の遅れのために01年以降の出願件数、出願人数が少なくなっている。

受動的標的化技術では出願件数と出願人数がほぼ1対1であるのに対して、能動的標的化技術では出願人数が出願件数よりも多くなっている。受動的標的化技術は、薬剤にポリエチレングリコールなどの親水性ポリマーを結合させて、標的以外の臓器に捉えられないようにする技術であり、自社の薬剤を修飾するものであり、単独出願が多くなっている。これに対して、能動的標的化技術は、特定の患部などに特異的に結合するモノクローナル抗体探索などの基礎研究と薬剤開発という応用研究の組み合わせであるために、大学などの研究機関と企業との共同出願が多いことを反映している。

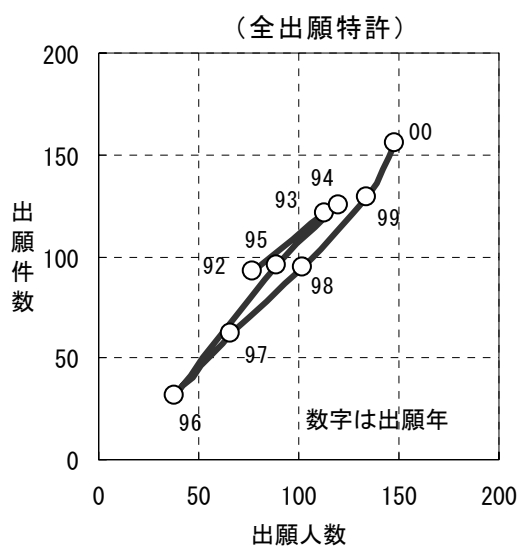
図1.3.2-8 薬剤標的化技術の出願件数・出願人数の推移



### ①能動的標的化技術

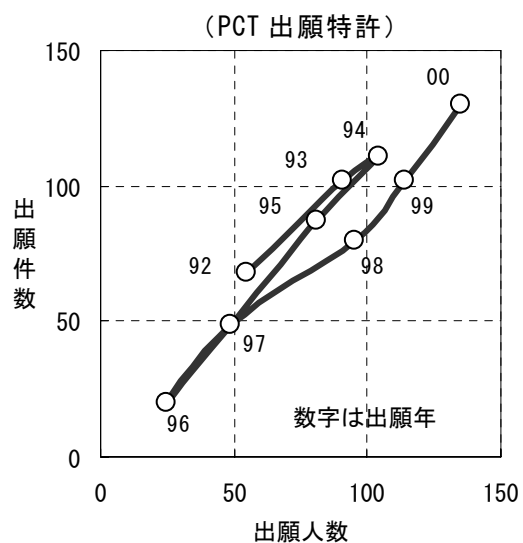
図1.3.2-9および図1.3.2-10、図1.3.2-11に能動的標的化技術の出願件数と出願人数の推移を示す。PCT出願は、1992～94年にかけて出願件数および出願人数が増加して年間100件以上の出願件数になったが、その後減少に転じ、96年には年間20件の出願件数にまで落ち込んだ。しかし、その後再度増加し、00年には年間130件の出願にまで達し、活発に技術開発活動が行われている。01年、02年については、PCTによる公開の遅れがあるため、図から除外している。国内出願特許については、92～95年まで出願件数が減少したが、96年から増加に転じ、99年以降年間約25件の出願件数になっている。

図 1.3.2-9 能動的標的化技術の出願人数と出願件数の推移



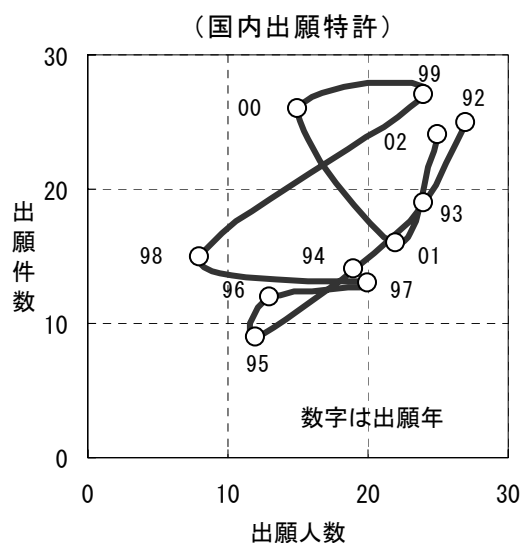
1992 年 1 月～2002 年 12 月の出願  
(01～02 年は PCT 出願が未公表のため、図からは除外)

図 1.3.2-10 能動的標的化技術の出願人数と出願件数の推移



1992 年 1 月～2002 年 12 月の出願  
(01～02 年は未公表のため図からは除外)

図 1.3.2-11 能動的標的化技術の出願人数と出願件数の推移



1992 年 1 月～2002 年 12 月の出願

表1. 3. 2-3に能動的標的化技術の主要出願人の出願件数推移を示す。サノフィ・アベンティスやメルクといった大手製薬企業による出願と、ジェネンテックやイミュノメディックスといったベンチャー企業からの出願が多いことが特徴である。また、カリフォルニア大学やテキサス大学などの大学および科学技術振興機構やアメリカ合衆国（NIH）などの公的研究機関による出願も多い。

表1. 3. 2-3 能動的標的化技術の主要出願人の出願件数推移

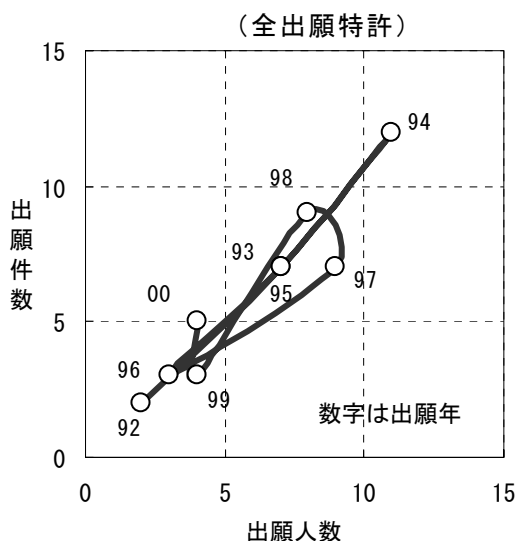
| No. | 出 願 人                              | 年次別出願件数 |    |    |    |    |    |    |    |    |    |    |    |
|-----|------------------------------------|---------|----|----|----|----|----|----|----|----|----|----|----|
|     |                                    | 92      | 93 | 94 | 95 | 96 | 97 | 98 | 99 | 00 | 01 | 02 | 合計 |
| 1   | サノフィ・アベンティス<br>（フランス）              |         | 9  | 4  | 3  | 1  | 1  | 1  | 1  | 1  |    |    | 21 |
| 2   | ジェネンテック（米国）                        | 1       | 1  | 1  | 1  | 1  | 3  |    | 4  | 7  |    |    | 19 |
| 3   | イミュノメディックス（米国）                     | 3       | 2  | 4  | 1  |    | 1  | 2  | 1  | 1  |    |    | 15 |
| 4   | カリフォルニア大学（米国）                      | 2       | 4  | 2  |    |    |    |    | 2  | 4  |    |    | 14 |
| 5   | ブリストル・マイヤーズ スクイブ<br>（米国）           | 2       | 3  | 2  | 3  |    |    | 1  | 2  |    |    |    | 13 |
| 6   | 科学技術振興機構                           | 1       |    |    |    |    |    |    | 1  | 4  | 2  | 5  | 13 |
| 7   | 協和醗酵工業                             |         |    |    | 1  |    | 1  | 1  | 3  | 3  | 1  | 3  | 13 |
| 8   | テキサス大学（米国）                         |         | 1  | 1  | 2  | 1  |    | 3  | 2  | 2  |    |    | 12 |
| 9   | カイロン（米国）                           | 3       | 2  | 3  |    |    | 1  |    | 1  | 1  |    |    | 11 |
| 10  | メルク（米国）                            | 1       | 1  | 2  | 2  |    | 1  | 1  | 1  | 2  |    |    | 11 |
| 11  | アメリカ合衆国（米国）                        | 1       | 3  | 3  |    |    | 1  | 1  |    | 1  |    |    | 10 |
| 12  | 東ソー                                | 9       |    |    |    |    |    |    |    |    |    |    | 9  |
| 13  | トランスジーン（フランス）                      |         | 2  | 1  |    | 1  |    |    | 1  | 3  |    |    | 8  |
| 14  | アストラゼネカ（イギリス）                      | 3       | 2  | 1  | 1  |    |    |    |    |    |    |    | 7  |
| 15  | エール大学（米国）                          |         |    | 2  | 2  |    | 2  |    |    |    |    |    | 6  |
| 16  | キャンサー リサーチ キャンペーン テクノロジー<br>（イギリス） | 1       | 3  | 2  |    |    |    |    |    |    |    |    | 6  |
| 17  | コリクサ（米国）                           |         |    |    |    |    | 1  | 2  | 1  | 2  |    |    | 6  |
| 18  | ノバルティス（スイス）                        |         | 2  |    |    |    | 1  |    |    | 3  |    |    | 6  |
| 19  | ベーリンガー インゲルハイム<br>（ドイツ）            |         |    | 1  | 1  |    |    | 1  | 2  | 1  |    |    | 6  |
| 20  | ルードビッヒがん研究所<br>（米国）                |         |    |    | 2  |    |    |    | 4  |    |    |    | 6  |
| 21  | 久光製薬                               |         |    |    | 1  |    |    | 2  |    | 2  | 1  |    | 6  |
| 22  | 田辺製薬                               |         | 2  | 2  |    |    |    | 1  | 1  |    |    |    | 6  |

1992 年 1 月～2002 年 12 月の出願

## ②受動的標的化技術

図1.3.2-12および図1.3.2-13、図1.3.2-14に受動的標的化技術の出願件数と出願人数の推移を示す。PCT出願については1992～95年まで出願件数、出願人数が増加した後、96年に減少した。その後98年まで増加したが99年には再度減少に転じている。01年、02年については、PCTによる公開の遅れがあるため、図から除外している。国内出願特許については、1994年に8件の出願があったが、その後は年間3件程度で推移している。

図 1.3.2-12 受動的標的化技術の出願人数と出願件数の推移

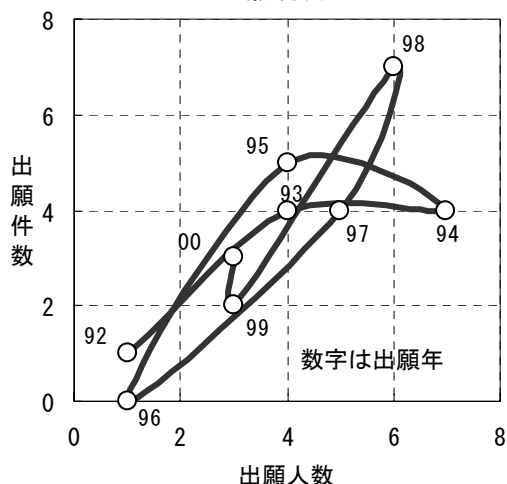


1992年1月～2002年12月の出願  
(01～02年はPCT出願が未公表のため、図からは除外)

図 1.3.2-13 受動的標的化技術の

出願人数と出願件数の推移

(PCT出願特許)

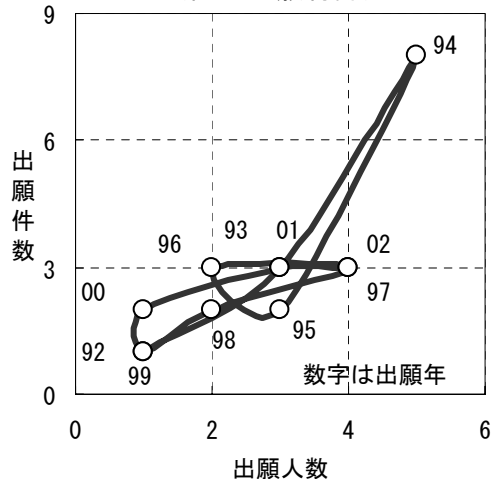


1992年1月～2002年12月の出願  
(01～02年は未公表のため図からは除外)

図 1.3.2-14 受動的標的化技術の

出願人数と出願件数の推移

(国内出願特許)



1992年1月～2002年12月の出願

表1.3.2-4に受動的標的化技術の主要出願人の出願件数推移を示す。第一製薬や三菱ウエルファーマ、日本油脂といった日本企業からの出願が多い。

表1.3.2-4 受動的標的化技術の主要出願人の出願件数推移

| No. | 出 願 人                     | 年次別出願件数 |    |    |    |    |    |    |    |    |    |    |    |
|-----|---------------------------|---------|----|----|----|----|----|----|----|----|----|----|----|
|     |                           | 92      | 93 | 94 | 95 | 96 | 97 | 98 | 99 | 00 | 01 | 02 | 合計 |
| 1   | 第一製薬                      |         |    |    | 1  |    | 1  |    |    | 2  |    |    | 4  |
| 2   | イネックス（カナダ）                |         |    | 1  |    |    | 1  |    | 1  |    |    |    | 3  |
| 3   | 三菱ウエルファーマ                 |         |    | 2  |    |    |    |    |    |    |    | 1  | 3  |
| 4   | 日本油脂                      |         |    | 2  |    |    |    |    |    |    |    | 1  | 3  |
| 5   | エフ ホフマン ラ ロシュ<br>（スイス）    |         |    |    |    |    |    | 2  |    |    |    |    | 2  |
| 6   | テルモ                       |         |    |    |    | 1  |    | 1  |    |    |    |    | 2  |
| 7   | ドイツがん研究センター スチット<br>（ドイツ） |         |    |    | 2  |    |    |    |    |    |    |    | 2  |
| 8   | 三共                        |         |    |    |    |    |    | 1  | 1  |    |    |    | 2  |
| 9   | 武田薬品工業                    |         | 1  | 1  |    |    |    |    |    |    |    |    | 2  |

1992 年 1 月～2002 年 12 月の出願

### (3) 薬剤吸収制御技術

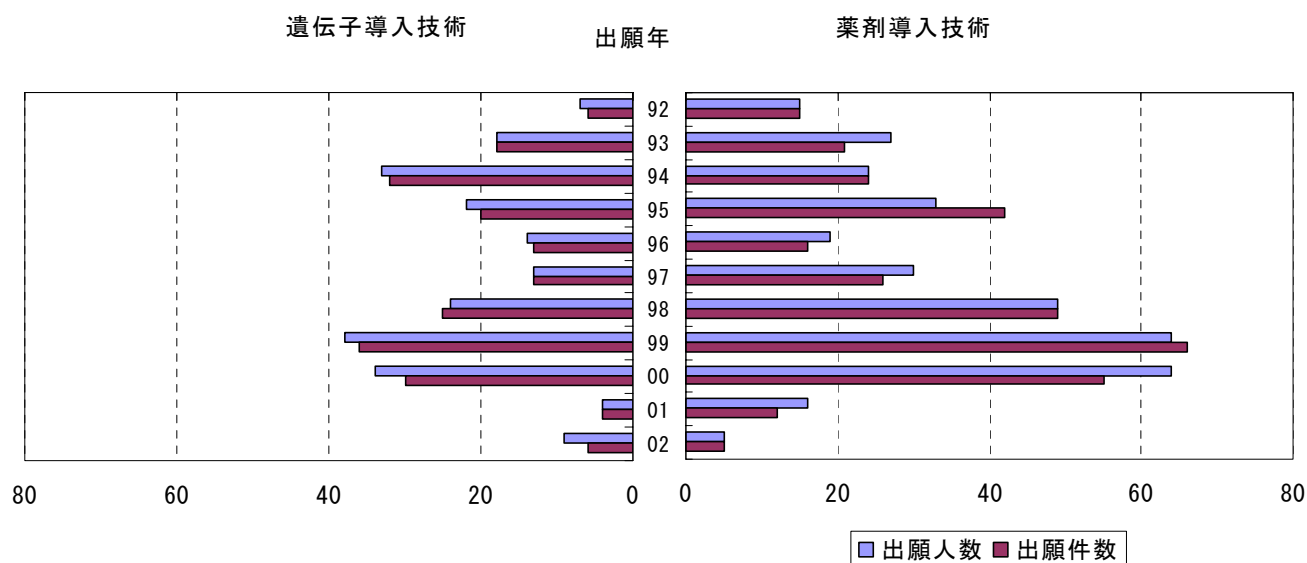
図1.3.2-15に薬剤吸収制御技術の出願件数と出願人数の推移を、薬剤導入技術と遺伝子導入技術を対比して示す。薬剤吸収制御技術の出願件数および出願人数は、遺伝子導入技術の約2倍となっている。

出願件数、出願人数には大きな差が見られるものの、薬剤導入技術と遺伝子導入技術の出願件数および出願人数はほぼ同様の増減推移をしている。1992～94年、95年に件数、人数が増加し、96年、97年に両者ともに減少している。その後、件数、人数が再度増加している。PCT出願の公開の遅れのために01年以降の件数、人数が少なくなっている。

また、薬剤導入技術、遺伝子導入技術ともに出願人数が出願件数よりも多くなっている。薬剤放出技術、遺伝子導入技術は、特定の細胞などに薬剤や遺伝子を取り込ませるために細胞膜の機能研究などの基礎研究と薬剤開発という応用研究の組み合わせであり、大学などの研究機関と企業との共同出願が多いことを反映している。



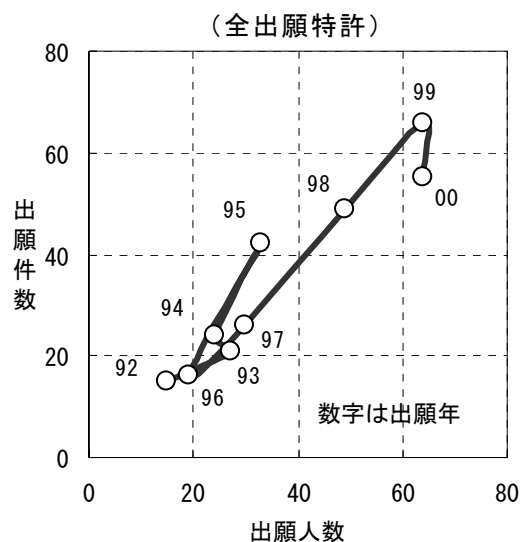
図1.3.2-15 薬剤吸収制御技術の出願件数と出願人数の推移



### ①薬剤導入技術

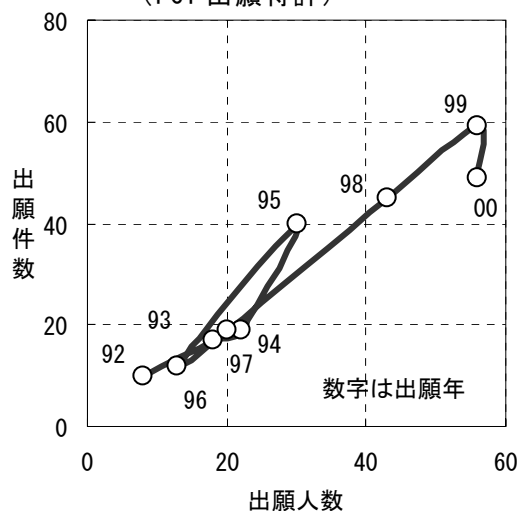
図1.3.2-16および図1.3.2-17、図1.3.2-18に薬剤導入技術の出願件数と出願人数の推移を示す。PCT出願については、1992～95年に、出願件数、出願人数が増加して年間40件を越えるようになったのち96年に20件弱に減少したが、97年以降、再度増加し99年には年間60件に達している。01年、02年については、PCTによる公開の遅れがあるため、図から除外している。国内出願特許については、年間5件前後で推移している。

図1.3.2-16 薬剤導入技術の出願人数と出願件数の推移



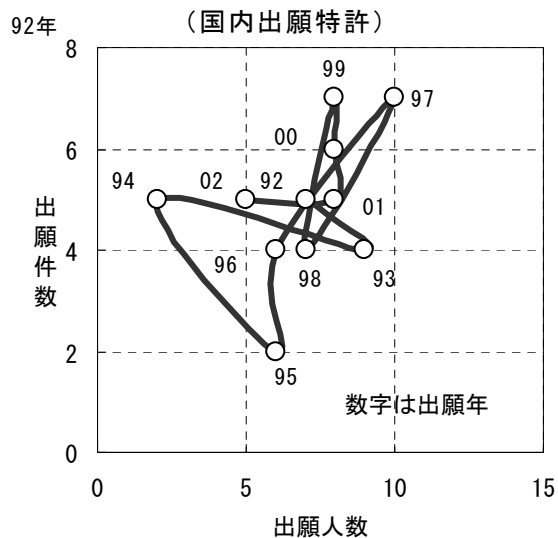
1992年1月～2002年12月の出願  
(01～02年はPCT出願が未公表のため、図からは除外)

図 1.3.2-17 薬剤導入技術の  
出願人数と出願件数の推移  
(PCT 出願特許)



1992 年 1 月～2002 年 12 月の出願  
(01～02 年は未公表のため図からは除外)

図 1.3.2-18 薬剤導入技術の  
出願人数と出願件数の推移  
(国内出願特許)



1992 年 1 月～2002 年 12 月の出願

表 1.3.2-5 に薬剤導入技術の主要出願人の出願件数推移を示す。ジョンソンアンドジョンソンが最も多くの特許を出願しているが、これはアルザの買収によるものであり、エミスフェア・テクノロジーズなどとともにベンチャー企業による出願が多いことが特徴である。また、カリフォルニア大学やメリーランド大学などの大学からの出願が多い。

表 1.3.2-5 薬剤導入技術の主要出願人の出願件数推移

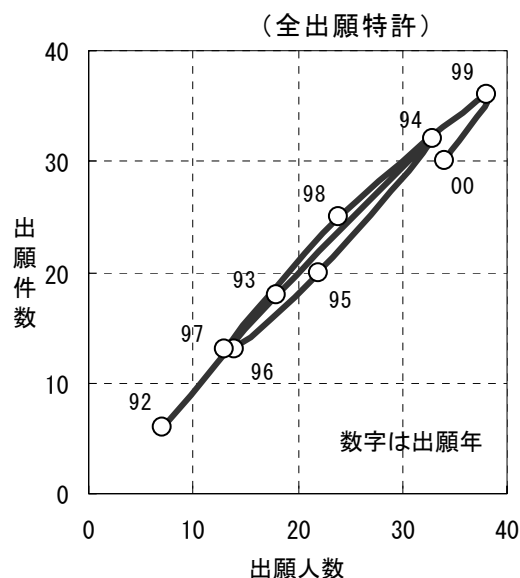
| No. | 出 願 人                              | 年 次 別 出 願 件 数 |    |    |    |    |    |    |    |    |    |    |    |
|-----|------------------------------------|---------------|----|----|----|----|----|----|----|----|----|----|----|
|     |                                    | 92            | 93 | 94 | 95 | 96 | 97 | 98 | 99 | 00 | 01 | 02 | 合計 |
| 1   | ジョンソンアンドジョンソン（米国）                  |               |    | 1  | 5  | 1  | 1  | 1  | 1  | 2  |    |    | 12 |
| 2   | カリフォルニア大学（米国）                      |               | 2  |    | 1  | 1  |    | 3  | 3  |    |    |    | 10 |
| 3   | エミスフェア・テクノロジーズ(米国)                 |               |    | 2  | 1  |    | 1  | 1  | 2  |    |    |    | 7  |
| 4   | ウェスト PHARM サービス ドラッグ デリバリー<br>（米国） | 1             |    | 1  | 1  |    | 3  |    |    |    |    |    | 6  |
| 5   | エラン（アイルランド）                        |               |    |    |    | 1  | 1  | 1  | 1  | 1  |    |    | 5  |
| 6   | サノフィ・アベンティス（フランス）                  |               | 1  |    |    |    |    | 2  | 1  | 2  |    |    | 6  |
| 7   | メリーランド大学ボルティモア校<br>（米国）            |               |    |    | 2  |    | 2  |    |    | 1  |    |    | 5  |
| 8   | アドバンスド インハレーション リサーチ（米国）           |               |    |    |    |    |    | 1  | 2  | 1  |    |    | 4  |
| 9   | アメリカ合衆国（米国）                        | 1             |    |    | 1  |    |    | 1  | 1  |    |    |    | 4  |
| 10  | セラテック（米国）                          |               |    |    | 4  |    |    |    |    |    |    |    | 4  |
| 11  | ファイザー（米国）                          | 1             |    |    |    |    |    | 1  | 1  |    | 1  |    | 4  |
| 12  | 3 M（米国）                            |               | 1  |    | 2  |    |    | 1  |    |    |    |    | 4  |
| 13  | 久光製薬                               |               |    |    |    | 1  |    | 1  | 1  |    |    | 1  | 4  |
| 14  | 中外製薬                               |               |    |    | 1  | 1  |    |    | 1  | 1  |    |    | 4  |

1992 年 1 月～2002 年 12 月の出願

## ②遺伝子導入技術

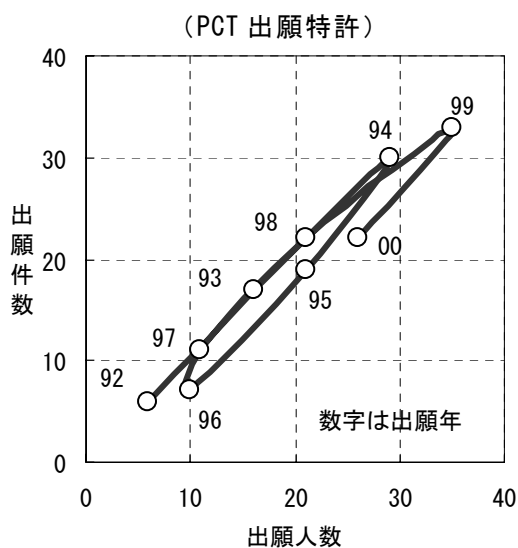
図1.3.2-19および図1.3.2-20、図1.3.2-21に遺伝子導入技術の出願件数と出願人数の推移を示す。PCT出願については、1992～94年まで出願件数、出願人数がともに増加したが、96年、件数が減少し、その後99年にかけて再度件数が増加し、年間30件以上出願されている。001年、02年については、PCTによる公開の遅れがあるため、図から除外している。日本公開特許については、年間数件で推移している。

図 1.3.2-19 遺伝子導入技術の出願人数と出願件数の推移



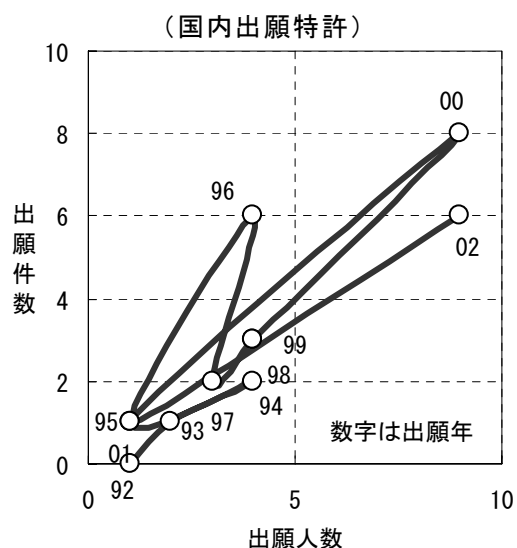
1992年1月～2002年12月の出願  
(01～02年はPCT出願が未公表のため、図からは除外)

図 1.3.2-20 遺伝子導入技術の  
出願人数と出願件数の推移



1992年1月～2002年12月の出願  
(01～02年は未公表のため図からは除外)

図 1.3.2-21 遺伝子導入技術の  
出願人数と出願件数の推移



1992年1月～2002年12月の出願

表1.3.2-6に遺伝子導入技術の主要出願人の出願件数推移を示す。サノフィ・アベンティスからの出願が多く、94年に多数の特許が出願されている。

表1.3.2-6 遺伝子導入技術の主要出願人の出願件数推移

| No. | 出 願 人                              | 年 次 別 出 願 件 数 |    |    |    |    |    |    |    |    |    |    |    |
|-----|------------------------------------|---------------|----|----|----|----|----|----|----|----|----|----|----|
|     |                                    | 92            | 93 | 94 | 95 | 96 | 97 | 98 | 99 | 00 | 01 | 02 | 合計 |
| 1   | サノフィ・アベンティス<br>（フランス）              | 1             | 3  | 5  | 3  |    |    | 2  | 3  |    | 2  |    | 19 |
| 2   | トランジエヌ（フランス）                       |               |    |    |    |    | 2  | 1  | 1  | 1  | 1  |    | 6  |
| 3   | 久光製薬                               |               |    |    |    | 2  | 1  | 1  | 1  |    |    |    | 5  |
| 4   | ジェンザイム（米国）                         |               |    | 1  |    |    |    | 2  | 1  |    |    |    | 4  |
| 5   | テルモ                                |               |    |    |    | 2  |    |    | 1  | 1  |    |    | 4  |
| 6   | バレンティス（米国）                         |               |    |    | 1  |    | 1  | 2  |    |    |    |    | 4  |
| 7   | カリフォルニア大学（米国）                      |               | 1  |    |    |    |    | 1  | 1  | 1  |    |    | 4  |
| 8   | アストラル・ド・ラ・サント・エド・ラ・ルシエル<br>（フランス）  | 1             |    | 1  |    |    |    |    | 1  |    |    |    | 3  |
| 9   | カイロン（米国）                           |               |    |    |    | 1  | 1  |    |    | 1  |    |    | 3  |
| 10  | ケンブリッジ大学テクニカル<br>（イギリス）            |               |    | 1  |    |    |    |    |    | 2  |    |    | 3  |
| 11  | サントラル・ド・ラ・ルシエル・シアンティフィック<br>（フランス） |               |    |    |    |    | 1  |    | 2  |    |    |    | 3  |
| 12  | ダイナベック研究所                          |               |    |    |    |    |    | 1  |    | 2  |    |    | 3  |
| 13  | ノバルティス（スイス）                        |               |    | 1  |    |    |    |    | 2  |    |    |    | 3  |
| 14  | ブリティッシュ コロンビア大学<br>（カナダ）           |               |    |    |    |    | 1  |    | 2  |    |    |    | 3  |
| 15  | ペンシルバニア大学（米国）                      |               |    | 1  | 1  |    |    |    | 1  |    |    |    | 3  |
| 16  | ライフ テクノロジー                         | 1             | 1  |    | 1  |    |    |    |    |    |    |    | 3  |

1992 年 1 月～2002 年 12 月の出願

## 1.4 技術開発の課題と解決手段

ドラッグデリバリーシステムに関する技術開発の課題を表1.4-1に示す。課題Ⅰは、具体的な課題である課題Ⅱおよび課題Ⅲで示されるものをまとめたものである。

表1.4-1 ドラッグデリバリーシステムの課題一覧

| 課題Ⅰ       |             | 課題Ⅱ           | 課題Ⅲ |
|-----------|-------------|---------------|-----|
| 安全化       |             |               |     |
| 安定化       |             |               |     |
| 吸収促進化     |             | 経肺吸収促進化       |     |
|           |             | 経鼻吸収促進化       |     |
|           |             | 経粘膜吸収促進化      |     |
|           |             | 経口投与促進化       |     |
|           |             | 経皮吸収促進化       |     |
|           |             | 細胞内吸収促進化      |     |
|           |             | その他の吸収促進化     |     |
| 患部の識別     | がん組織の識別     | 前立腺がんの識別      |     |
|           |             | 大腸、結腸がんの識別    |     |
|           |             | 白血病の識別        |     |
|           |             | がんの識別         |     |
|           | 感染症の識別      | HIVの識別        |     |
|           |             | その他の感染症の識別    |     |
|           | 自己免疫疾患の識別   | 炎症の識別         |     |
|           | その他疾患の識別    | その他の自己免疫疾患の治療 |     |
| 患部への集積化   | がんへの集積化     |               |     |
|           | その他の患部への集積化 |               |     |
| 直接送達方法開発  |             |               |     |
| 患部での薬効発現  | がんの治療       | 前立腺がんの治療      |     |
|           |             | 肝がんの治療        |     |
|           |             | その他のがんの治療     |     |
|           | 感染症の治療      | B型、C型肝炎の治療    |     |
|           |             | HIVの治療        |     |
|           |             | その他の感染症の治療    |     |
|           | 自己免疫疾患の治療   | 関節リウマチの治療     |     |
|           |             | その他の自己免疫疾患の治療 |     |
| その他の疾患の治療 | 血管狭窄の治療     |               |     |
|           | その他の疾患の治療   |               |     |
| 徐放化       |             |               |     |
| 放出速度制御    |             |               |     |
| 放出時期制御    |             |               |     |
| 新規投与方法開発  | 経肺投与方法開発    |               |     |
|           | 経鼻投与方法開発    |               |     |
|           | 経粘膜投与方法開発   |               |     |
|           | 経口投与方法開発    |               |     |
|           | 経皮投与方法開発    |               |     |

一方、このような課題を解決するために開発された解決手段を表1.4-2に示す。解決手段Ⅰは、具体的な解決手段である解決手段Ⅱおよび解決手段Ⅲをまとめたものである。

表1.4-2 ドラッグデリバリーシステムの解決手段一覧

| 解決手段Ⅰ     | 解決手段Ⅱ         | 解決手段Ⅲ          |
|-----------|---------------|----------------|
| 生体適合性改良   |               | PEG を結合        |
|           |               | リポソーム構造の改良     |
|           |               | 化学修飾           |
|           |               | 生物学的改良         |
| 生体条件の利用   | 温度、pH、親水性等を利用 | pH 変化の利用       |
|           |               | 温度変化の利用        |
|           |               | 親水性の利用         |
|           |               | 水の吸収の利用        |
|           |               | その他の条件の利用      |
| 生体反応の利用   | 酵素等を利用        |                |
|           | 生分解性を利用       |                |
|           | 膜透過機構の利用      |                |
|           | 受容体を利用        | レセプターの利用       |
|           | 抗体の利用         | リガンドの利用        |
|           |               | モノクローナル抗体の利用   |
|           |               | ヒト化抗体の利用       |
| 促進剤の利用    | 免疫反応の利用       |                |
|           | 遺伝子発現の利用      | その他の抗体の利用      |
|           |               | アンチセンス RNA の利用 |
|           | その他の遺伝子発現の利用  |                |
|           | カチオン性脂質添加     |                |
|           | カチオン性ポリマー添加   |                |
|           | 界面活性剤添加       |                |
|           | ペプチド添加        |                |
|           | 胆汁酸           |                |
|           | 毒素添加          |                |
| マトリックスへ分散 | その他の促進剤添加     |                |
|           | 有機物添加         |                |
|           | 無機物添加         |                |
|           | ポリマーに分散       |                |
| 担体の利用     | ゲルに分散         |                |
|           | その他のマトリックスに分散 |                |
|           | ベクターの利用       |                |
|           | リポソームの利用      |                |
|           | カプセルの利用       |                |
|           | キャリアーの利用      |                |
| 機械・器具の利用  | エマルジョンの利用     |                |
|           | コーティング        |                |
|           | 装置の利用         | カテーテルによる送達     |
|           |               | 磁性体の利用         |
|           |               | その他装置による送達     |
|           | 物理的刺激の利用      | 超音波の利用         |
|           |               | 光の利用           |
|           |               | その他の物理的刺激の利用   |

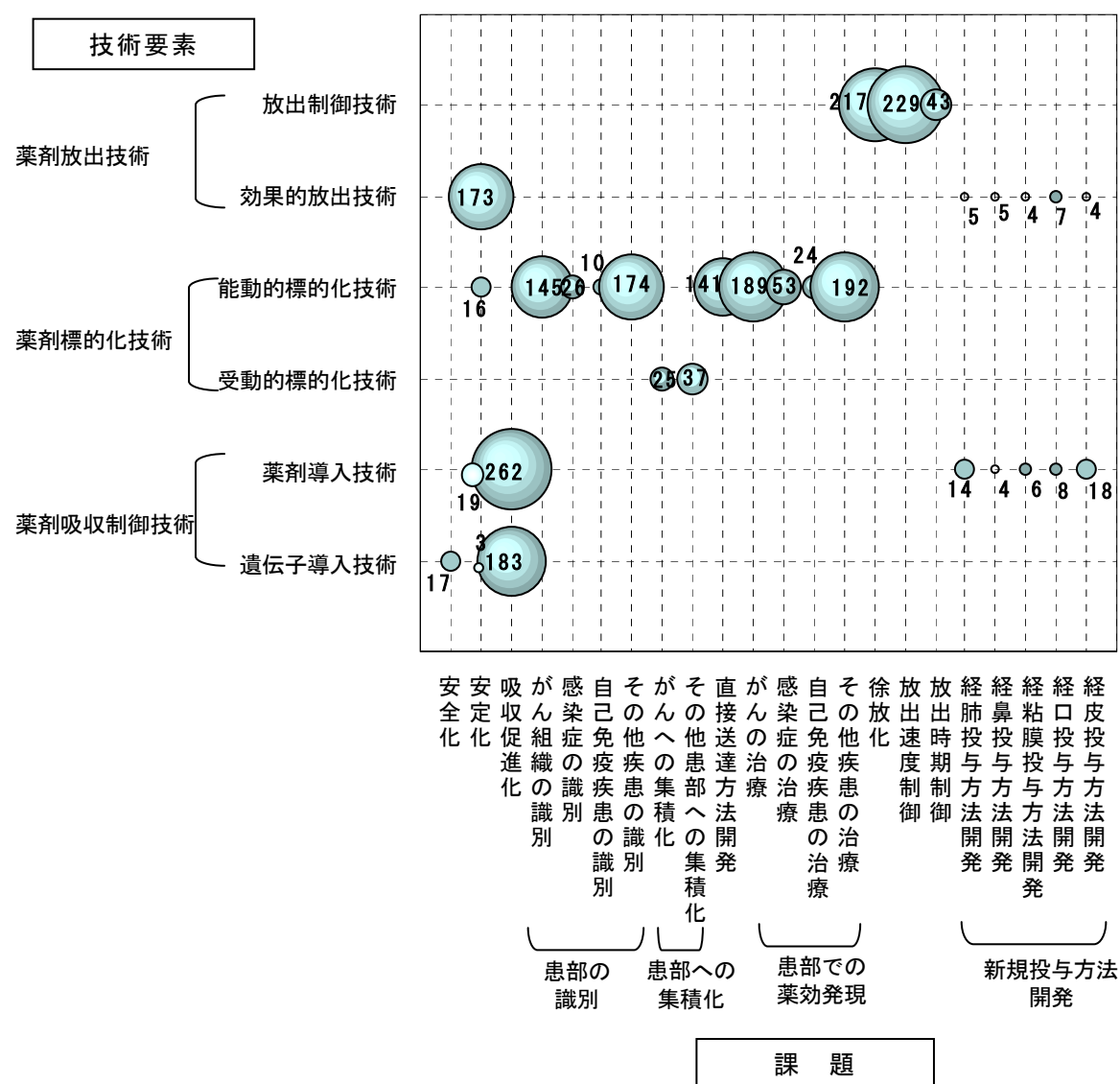
## 1.4.1 ドラッグデリバリーシステムの課題と解決手段

### (1) 技術要素と課題

図1.4.1-1にドラッグデリバリーシステムの技術要素と課題に対応した出願件数の分布を示す。

ドラッグデリバリーシステムの技術開発の課題は、それぞれの技術要素ごとに異なるが、全体では「患部での薬効発現」が一番多く、具体的には「がんの治療」や「その他疾患の治療」である。次いで「吸収促進化」を課題とするものが多い。さらに、「患部の識別」、「放出時期制御」、「徐放化」を課題とする順になっている。

図 1.4.1-1 ドラッグデリバリーシステムの技術要素と課題の分布



1992年1月～2002年12月の出願

薬剤放出技術のうち「放出制御技術」については、薬剤を徐々に長期間にわたって放出させる「徐放化」が大きな課題である。ドラッグデリバリーシステム開発の中でも最も初期の段階から検討されてきた課題であり、例えば、緑内障の治療に応用されている。緑内

障の治療には、従来、点眼剤が用いられていたが、患者の負担を少なくするための徐放化が大きな課題であった。徐放化をさらに進めた形として、「放出速度制御」がもう1つの大きな課題である。また、薬剤によっては、あるタイミングで一度に放出する必要があるものがあり、「放出時期制御」も課題となっている。

薬剤標的化技術では、課題が「患部の識別」、「患部への集積化」、「患部での薬効発現」に集中している。「能動的標的化技術」の課題としては、「患部の識別」（患部を認識すること）と「患部での薬効発現」（患部で薬剤を放出して薬効を発揮させること）が最大の課題である。薬剤を患部に送達させる方法は、抗原－抗体反応を利用する方法など生物学的方法が主体であるが、カテーテルなどを用いて直接患部に薬剤を送達する方法も課題となっている。薬剤標的化技術のもう一つの技術要素である「受動的標的化技術」は、薬剤の体内滞留時間を長くすることで患部に薬剤を集積する技術であり、「患部への集積化」（患部にいかに集積させるか）が課題である。

薬剤吸収制御技術では、「吸収促進化」に関するものに集中している。薬剤導入技術は、皮膚や粘膜などを通して薬剤を効率よく吸収させることによって薬剤を患部に送達する方法であり、「吸収促進化」が最大の課題である。また、皮膚などから薬剤を吸収させる「新規投入方法の開発」も課題となっている。

遺伝子導入技術は、遺伝子を患部の細胞に導入して治療する技術であり、細胞内に遺伝子を効率よく導入する「吸収促進化」が課題である。また、現在、遺伝子を細胞内に導入するためにウイルスの感染能力を利用する技術が用いられているが、ウイルス本来の病原としての危険性を抑える「安全化」も課題となっている。

## (2) 課題と解決手段

図 1.4.1-2 にドラッグデリバリーシステム全体の課題と解決手段に対応した出願の分布を示す。

薬剤の「安定化」の課題に対しては、「担体の利用」と「生体適合性改良」が解決手段として対応している。「吸収促進化」については、「促進剤の利用」が解決手段として集中して対応しており、「生体反応の利用」や「担体の利用」も解決手段として対応している。さらに、電気刺激を利用して皮膚などから薬剤を吸収させる「物理的刺激の利用」も解決手段として利用されている。

「患部の識別」の課題に対しては、細胞の「受容体の利用」や「抗体の利用」が主な解決手段である。「患部への集積化」の課題に対しては「生体適合性改良」の解決手段が集中している。「直接送達方法開発」の課題に対しは、「装置の利用」が主な解決手段である。

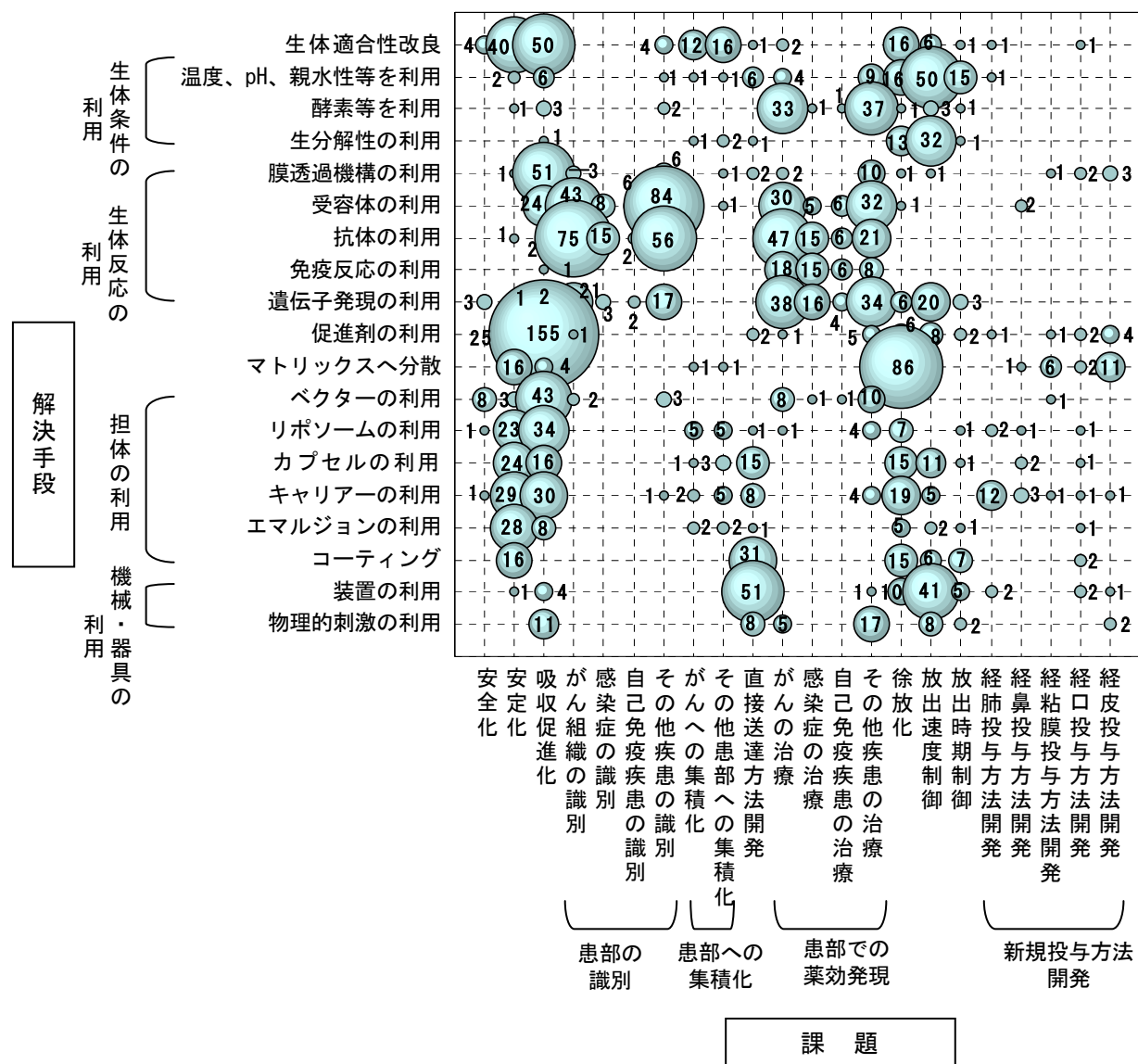
「患部での薬効発現」の課題に対しては、受容体などの「生体反応の利用」や、患部の酵素などを利用してプロドラッグを開裂させて薬効を発揮させる「生体条件の利用」が主な解決手段となっている。また、空気を薬剤とともに封入したリポソームを超音波で破裂させて薬剤を患部に放出するといった「物理的刺激の利用」も解決手段となっている。

「徐放化」の課題に対しては、薬剤を高分子などの「マトリックスへ分散」させる方法が主な解決手段となっている。これに対して、「放出速度制御」や「放出時期制御」の課題に対しては、温度や pH、親水性といった「生体条件の利用」が主に解決手段として対応している。



「新規投与方法開発」の課題に対する解決手段は、「担体の利用」を始めとしてさまざまな解決手段が用いられている。

図 1.4.1-2 ドラッグデリバリーシステム全体の課題と解決手段の分布



1992 年 1 月～2002 年 12 月の出願

## 1.4.2 技術要素別の課題と解決手段

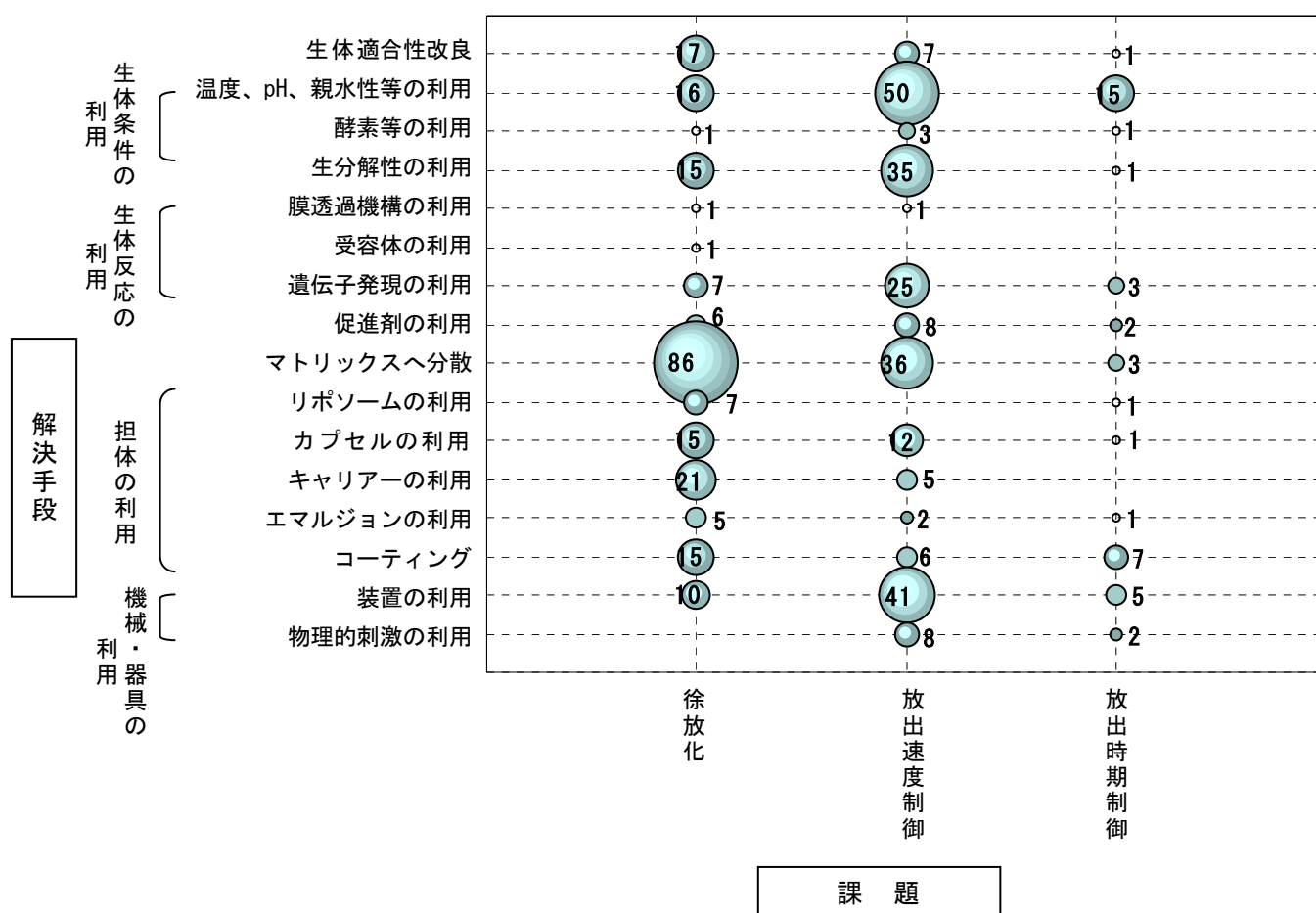
### (1) 薬剤放出技術

#### ①放出制御技術

図 1.4.2-1 に放出制御技術の課題と解決手段の分布を示す。放出制御技術で集中している課題は、「徐放化」と「放出速度制御」である。

徐放化に対しては、高分子などの「マトリックスへ分散」で集中して対応し、次いで「キャリアの利用」、「生体適合性改良」、「温度、pH、親水性等の利用」、「生分解性の利用」、「カプセルの利用」、「コーティング」で対応している。放出速度制御に対しては、「温度、pH、親水性等の利用」で多く対応し、「装置の利用」、「マトリックスへ分散」、「生分解性の利用」でも対応している。

図 1.4.2-1 放出制御技術の課題と解決手段の分布



1992年1月～2002年12月の出願

表 1.4.2-1 に放出制御技術の課題に対する解決手段の詳細を示す。徐放化の課題に対して集中して対応しているマトリックスへ分散は、「その他のマトリックスに分散」、「ゲルに分散」と「ポリマーに分散」でより具体的な解決手段によって対応している。また、放出速度制御の課題に対して多く対応している温度、pH、親水性等の利用による対応は、「温度変化の利用」、「pH 変化の利用」、「親水性の利用」、「水の吸収の利用」、「その他の

条件の利用」で、より具体的な解決手段で対応している。装置の利用という対応は、「放出制御膜の利用」、「機械的制御」、「電子的制御」、「その他の制御装置の利用」という解決手段に細分される。

表 1.4.2-1 放出制御技術の課題と解決手段の分布

| 課題<br>解決手段 |               |             | 徐放化 | 放出速度制御 | 放出時期制御 |
|------------|---------------|-------------|-----|--------|--------|
| 生体適合性改良    |               |             | 17  | 7      | 1      |
| 生体条件の利用    | 温度、pH、親水性等の利用 | 温度変化の利用     | 3   | 10     | 3      |
|            |               | pH 変化の利用    | 3   | 9      | 1      |
|            |               | 親水性の利用      | 1   | 6      | 3      |
|            |               | 水の吸収の利用     | 3   | 16     | 6      |
|            |               | その他の条件の利用   | 6   | 9      | 2      |
|            | 酵素等の利用        |             | 1   | 3      | 1      |
|            | 生分解性の利用       |             | 15  | 35     | 1      |
| 生体反応の利用    | 膜透過機構の利用      |             | 1   | 1      |        |
|            | 受容体の利用        |             | 1   |        |        |
|            | 遺伝子発現の利用      |             | 7   | 25     | 3      |
| 促進剤の利用     |               |             | 6   | 8      | 2      |
| マトリックスへ分散  | ゲルに分散         |             | 21  | 12     |        |
|            | ポリマーに分散       |             | 21  | 14     | 2      |
|            | その他のマトリックスに分散 |             | 44  | 10     | 1      |
| 担体の利用      | ベクターの利用       |             |     |        |        |
|            | リポソームの利用      |             | 7   |        | 1      |
|            | カプセルの利用       |             | 15  | 12     | 1      |
|            | キャリアーの利用      |             | 21  | 5      |        |
|            | エマルジョンの利用     |             | 5   | 2      | 1      |
|            | コーティング        |             | 15  | 6      | 7      |
| 機械・器具の利用   | 装置の利用         | 放出制御膜の利用    | 2   | 13     | 1      |
|            |               | 機械的制御       | 5   | 12     | 1      |
|            |               | 電子的制御       |     | 10     | 2      |
|            |               | その他の制御装置の利用 | 3   | 6      | 1      |
|            | 物理的刺激の利用      |             |     | 8      | 2      |

1992 年 1 月～2002 年 12 月の出願

表 1.4.2-2 に放出制御技術の課題に対する解決手段の出願人を示す。出願が最も集中している課題である徐放化に対して「その他のマトリックスに分散」に関しては、エルテー エス ローマン テラピー システメ、クリンゲファルマが3件、テルモとブリストル・マイヤーズ スクイブ、ヘレウス クルツアが各2件出願していて、大学からは5大学5件の出願がある。徐放化に対して、「ゲルに分散」に関しては、3大学から各1件の出願がある。さらに京都大学の田畑泰彦氏の出願が1件ある。徐放化に対して、「ポリマーに分散」に関しては、大学は1校1件の出願がある。課題放出制御に対して、「生分解性の利用」に関しては、デビオ ルシエルシェが2件出願し、大学からは5校5件の出願がある。

表 1.4.2-2 放出制御技術の課題・解決手段と出願人 (1/9)

| 課題      |                          | 徐放化                                                                                                                                                                                                                                                         | 放出速度制御                                                                                                                                                                                                            |
|---------|--------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 解決手段    |                          |                                                                                                                                                                                                                                                             |                                                                                                                                                                                                                   |
| 生体適合性改良 |                          | ディー ディー エス 研究所 (3)<br>特許 2602607<br>特許 2710900<br>特許 2766141<br>参天製薬 (2)<br>特開 2002-326962<br>特開 2003-171315<br>キネートン<br>特表平 11-508289<br>コンセイユ ド ルシエル シュ エ<br>ダブリカシオン シャン ティ<br>特許 3476775<br>シューリング プラウ<br>特開 2000-309541<br>タノックス バイオシステムズ<br>特許 3507507 | アドバンス<br>特開 2003-12383<br>アリックス セラビューティクス<br>特表 2003-531196<br>イエナファルム<br>特表 2003-523929<br>スカイファーム、カイロン<br>特表 2001-515852<br>スカイファーム<br>特表 2001-515853<br>フロリダ大学<br>特表 2003-516926<br>科学技術振興機構<br>特開 2001-270898 |
|         | 温度、 $\text{pH}$ 、親水性等の利用 | アドバンス ト インハレーション リサーチ<br>特表 2003-507410<br>バッテル メモリアル INST<br>特表 2004-525194<br>森 有一<br>特許 3135340                                                                                                                                                          | 帝人 (2)<br>特開 2000-80158<br>特開平 11-92554<br>科学技術振興機構 (2)<br>特開平 08-134146<br>特開平 11-322941<br>デューク大学<br>特表 2002-518317<br>マクロメド<br>特表平 11-513985                                                                   |
| 生体条件の利用 | 温度変化の利用                  |                                                                                                                                                                                                                                                             | ユタ大学 リサーチ ファウンデーション<br>特表 2001-517603<br>産業技術総合研究所、化学技術戦略推進機構<br>特開 2000-86729<br>産業技術総合研究所、チッソ<br>特開 2002-60436<br>長田 義仁、岡野 光夫、山之内製薬<br>特開平 10-139689                                                            |
|         | $\text{pH}$ 変化の利用        | ワイス ホールディングズ<br>特開平 06-009407<br>住友製薬<br>特開平 06-199657<br>アラーガン<br>特表平 07-503974                                                                                                                                                                            | メルク (2)<br>特表 2003-504415<br>特表 2003-513033<br>アンマット テクノロジー<br>特表 2004-523531<br>グラクソ スミスクライン<br>特表平 07-507293<br>ノボバスキュラー<br>特表 2003-527209                                                                      |

表 1. 4. 2-2 放出制御技術の課題・解決手段と出願人 (2/9)

| 課題      |               | 徐放化                                   |                                                                                                                                                                                                          | 放出速度制御                                                                                                                                                                                                                                                          |                                                                                                                                                                                            |
|---------|---------------|---------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 解決手段    |               |                                       |                                                                                                                                                                                                          |                                                                                                                                                                                                                                                                 |                                                                                                                                                                                            |
| 生体条件の利用 | 温度、pH、親水性等の利用 | 親水性の利用                                | ブリistol・マイヤーズ スクイブ<br>特開平 09-110682                                                                                                                                                                      | マクロメド(2)<br>特表 2002-516910<br>特表 2003-531927<br>アマリン DEV<br>特開 2001-131059<br>イエダ リサーチ アンド DEV、ベン グリオン大学 ネゲブ リサーチ<br>特表平 11-501306                                                                                                                              | オキュレックス PHARM<br>特表平 11-506450<br>メルク<br>特表平 11-509829                                                                                                                                     |
|         |               | 水の吸収の利用                               | ジョンソンアンドジョンソン<br>特表 2003-509354<br>武田薬品工業<br>特開 2000-026316<br>日本大学<br>特開 2004-189618                                                                                                                    | ジョンソンアンドジョンソン(6)<br>特表平 09-502182<br>特表平 10-507440<br>特表 2001-510791<br>特表 2001-510792<br>特表 2003-514847<br>特開平 09-100235<br>アンドルックス PHARM<br>特表平 11-506774<br>イーエム IND<br>特表 2002-517431<br>シャイア LAB<br>特表 2001-503054<br>ニューロスフィアーズ ホウルディングス<br>特表平 09-507747 | ファイザー<br>特表 2004-505907<br>マクグレゴール アレキサンダー<br>特表 2004-513975 マンカイ<br>ンド<br>特表 2001-509490<br>メドトロニック ミニメッド<br>特表 2000-502993<br>メドロジック グローバル<br>特表平 11-513041<br>日本医薬品工業<br>特開 2004-231520 |
|         |               | その他の条件の利用                             | コメディカス<br>特表平 09-510231<br>ジェネンテック<br>特表 2000-504210<br>イスチ ディ リセルシュ ディ バイオロジア モレコラレ<br>特表 2002-522558<br>コンジュシエム<br>特表 2003-508501<br>スリーエム イノベイティブ プロパティズ<br>特表 2003-522780<br>デイボメド<br>特表 2004-510687 | バクスター IMTERN<br>特表平 08-503715<br>オックスフォード バイオメディカ ユー ケイ<br>特表平 09-508531<br>セネス PHARM<br>特表平 10-506301<br>アメリカ合衆国、アクロン大学<br>特表平 11-503456<br>カーディアック ペースメーカーズ<br>特表 2002-524409                                                                                 | ニュージャージー大学 ラトガーズ<br>特表 2003-511550<br>テンプル大学<br>特表 2003-526598<br>日本油脂<br>特開平 06-192069<br>産業技術総合研究所<br>特開 2004-026636                                                                     |
|         | 酵素等の利用        | ケンタッキー リサーチ ファンディション<br>特表平 09-509151 | テラピン テクノロジーズ<br>特表平 11-507370<br>ビタフォア<br>特表 10-504277<br>ベクトレイド<br>特表 2002-542304                                                                                                                       |                                                                                                                                                                                                                                                                 |                                                                                                                                                                                            |

表 1. 4. 2-2 放出制御技術の課題・解決手段と出願人 (3/9)

| 課題      |              | 徐放化                                                                                                                                                                                                              |                                                                                                                                                                                                                    | 放出速度制御                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |
|---------|--------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 解決手段    |              |                                                                                                                                                                                                                  |                                                                                                                                                                                                                    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |
| 生体条件の利用 | 生分解性<br>の利用  | アトリックス LAB<br>特表 2004-510807<br>アメリカ合衆国<br>特表平 11-508872<br>アラーガン<br>特開 2004-210798<br>エラン<br>特表平 11-503147<br>キナートン<br>特許 3390177<br>サンスター<br>特開 2000-95677<br>バイパス<br>特表平 11-508872<br>ペンタックス<br>特開平 09-208457 | メディオラヌム<br>PHARM<br>特表 2002-531486<br>ワシントン大学<br>特開平 09-286921<br>ライオン<br>特開 2003-192577<br>三菱ウエルファーマ<br>特開平 09-286921<br>中外製薬<br>特開 2001-066142<br>農林水産省蚕糸・昆虫<br>農業技術研究所<br>特許 3101711<br>武田薬品工業<br>特開平 11-036099 | デビオ ルシェルシュ<br>PHARM (2)<br>特表 2001-518528<br>特表 2001-523637<br>LTTバイオファーマ<br>特開 2003-342196<br>アトウル ジェイ シュクラ<br>特表 2004-511431<br>アドバンスド ポリマー シ<br>ステムズ<br>特表 2002-517535<br>アボット LAB<br>特表 2003-526708<br>アラーガン<br>特表 2004-514702<br>アルティムプラント<br>特表 2004-526003<br>インサート セラビューティ<br>クス<br>特表 2004-523502<br>ウエスト ファーマシュー<br>ティカル サービスズ<br>特表平 11-508912<br>エイ ビー ファーマ<br>特表 2000-512322<br>エシコン<br>特許 3257750<br>カリフォルニア工科大学<br>特表 2004-523502<br>韓国科学技術院<br>特表 2002-526383<br>キナートン<br>特開 2003-026606<br>ケメストリー<br>特表 2004-502722<br>ケンブリッジ サイエンティ<br>フィック<br>特表平 08-512288<br>コーネル大学 リサーチ<br>ファウンデーション<br>特表 2004-526043 | ジアンパパ ヴィンセント<br>カーマイン<br>特表平 08-500088<br>ジェンザイム<br>特表 2002-512182<br>ジョーンズ ホプキンス大<br>学<br>特表平 10-505587<br>タキロン<br>特開平 08-257055<br>デルシテク<br>特表 2004-526749<br>ネオメンド<br>特表 2003-525683<br>ネクター セラビュー<br>ティックス エイエル<br>特表 2003-518526<br>ブロックター アンド ギャ<br>ンブル<br>特表平 09-503504<br>ポリーメッド<br>特許 3131195<br>マサチューセッツ工科大学<br>特表平 10-505587<br>メディソープ テクノロ<br>ジーズ INTERN<br>特表平 08-510639<br>モガン バイオテクノロ<br>ジー リサーチ INST<br>特表 2002-526383<br>テキサス大学<br>特表 2003-506401<br>ニュージャージー州立大学<br>ラトガーズ<br>特表 2000-501139<br>三養社<br>特許 2642869<br>電気化学工業<br>特開 2001-329002<br>武田薬品工業<br>特開平 11-269094 |
|         | 膜透過機構<br>の利用 | 岡畑 恵雄、サンメディカ<br>ル<br>特開 2001-327591                                                                                                                                                                              |                                                                                                                                                                                                                    | サノフィ・アベンティス<br>特表 2002-529099                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |
| 生体反応の利用 | 受容体<br>の利用   | ブラエシス PHARM<br>特表 2004-508411                                                                                                                                                                                    |                                                                                                                                                                                                                    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |

表 1.4.2-2 放出制御技術の課題・解決手段と出願人 (4/9)

| 課題      |          | 徐放化                                                                                                                                                                                                 |  | 放出速度制御                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |  |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |  |                                                                                                              |
|---------|----------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 解決手段    |          |                                                                                                                                                                                                     |  |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |  |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |  |                                                                                                              |
| 生体反応の利用 | 遺伝子発現の利用 | ワシントン大学 (2)<br>特表平 08-500033<br>特表平 10-510815<br>ジャパン ティッシュ エ<br>ンジニアリング、上田 実<br>特開 2000-125863<br>ピッツバーグ大学<br>特表平 08-508415<br>アメリカ合衆国<br>特表平 08-509215<br>アプライド ティッシュ<br>テクノロジーズ<br>特表平 08-509356 |  | デйнаベック研究所 (2)<br>特許 3526844<br>特開平 09-031656<br>トランスカリオティック セ<br>ラピーズ (2)<br>特表 2000-501299<br>特表 2003-511100<br>アドバンスト リサーチ ア<br>ンド テクノロジー INST<br>特表平 09-505471<br>アベンティス ファルマ<br>特表 2003-512059<br>アンスチ. パスツール<br>特表平 08-508880<br>イーアオ ショウ シュー<br>特表平 07-509217<br>ウォルフ ジョン エイ<br>特表平 07-509217<br>エスアールエル<br>特開平 09-094092<br>ケース ウェスタン リザー<br>ブ大学<br>特表平 08-510930<br>サイトセラピューティックス<br>特表平 09-508002<br>ジェネンテック<br>特表平 10-508025<br>シドニー キンメル キャン<br>サー センター<br>特表平 09-504786 |  | スペイウッド LAB<br>特表平 11-504006<br>セレクシス<br>特表平 08-508642<br>ヘキスト マリオン ルセ<br>特開平 11-089587<br>マイクロバイオロジカル<br>リサーチ オーソリティー<br>特表平 11-504006<br>メディカル リサーチ カ<br>ウンシル<br>特表平 08-508642<br>メトロヘルス システム<br>特表平 08-510930<br>アクロン大学<br>特表平 08-510930<br>南フロリダ大学<br>特表平 11-509170<br>ペンシルバニア大学<br>特表平 09-505054<br>ロイヤル フリー ホスピ<br>タル スクール オブ メ<br>ディスン<br>特表平 09-501306<br>ワーナー ランバート<br>特表平 10-506794 |  |                                                                                                              |
|         | 促進剤の利用   | サーフィス ソリューションズ LAB<br>特表 2002-506052<br>ジェンザイム<br>特表 2004-516016<br>ネクスメッド ホールディ<br>ングス<br>特表 2002-544240                                                                                           |  | ビロテックス<br>特表 2001-508038<br>ファーマアウエア ア<br>イ ビー<br>特表平 09-502342<br>大洋薬品工業<br>特開平 09-263537                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |  | ホフマン ラ ロシュ<br>特開平 07-196535<br>スカイファー<br>特表平 09-505301<br>セル ジェネシス<br>特表平 09-509049<br>ディー オー ブイ PHARM<br>特開 2000-26278<br>ノバジェント<br>特表 2000-504002                                                                                                                                                                                                                                          |  | バフォード バイオメディ<br>カル<br>特表 2001-517613<br>ニュージャージー州立大学<br>ルトガーズ<br>特表 2003-519194<br>日本メジフィジックス<br>W000/078352 |

表 1.4.2-2 放出制御技術の課題・解決手段と出願人 (5/9)

| 課題        |         | 徐放化                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        | 放出速度制御                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |                                                           |
|-----------|---------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------|
| 解決手段      |         |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |                                                           |
| マトリックスへ分散 | ゲルに分散   | <p>アルコン LAB<br/>特表平 09-508143<br/>インセプト<br/>特表 2002-522469<br/>エノシス<br/>特表平 10-505822<br/>エル エー エム PHARM<br/>特表 2002-513410<br/>コントロールド セラ<br/>ピューティックス スコッ<br/>トランド<br/>特表 2002-531393<br/>シュンフォラ<br/>特表 2004-520361<br/>ジーンメディシン<br/>特表平 11-502507<br/>テバ PHARM IND<br/>特表 2004-501186<br/>ドロハン ウイリアム エ<br/>ヌ、マクフィー マーティ<br/>ン ジェイ、ミーカ<br/>シャーリー アイ<br/>特表平 11-507697<br/>バイエル<br/>特表 2001-510150</p>                               | <p>ラメル テクノロジー<br/>特表 2004-502723<br/>マクロメド<br/>特表平 11-515016<br/>テキサス大学、ダン<br/>ランドル シー<br/>特表平 09-509401<br/>ネブラスカ大学<br/>特表平 10-501814<br/>ミシガン大学<br/>特表 2002-527408<br/>ユニメッド PHARM<br/>特表 2004-507511<br/>ラボラトワール イノ<br/>テラ<br/>特表平 11-514994<br/>ランバクシイ L A B<br/>L T D<br/>特表 2002-524494<br/>三菱ウエルファーマ<br/>特開平 06-024962<br/>田畑 泰彦、米田 正<br/>始<br/>特開 2004-115413<br/>米田 正始、田畑 泰<br/>彦、科研製薬<br/>特開 2002-145797</p> | <p>アトリックス LAB<br/>特表 2003-516958<br/>インセプト<br/>特表 2003-523926<br/>サザン バイオシステムズ<br/>特表 2001-516728<br/>ハイドロ メドサイエン<br/>シーズ<br/>特表 2002-535452<br/>バイロ テックス<br/>特表 2001-500863<br/>マクロメド<br/>特表 2002-525404<br/>マックス デルブリュック<br/>ツェントラム フュル モレ<br/>キュラー<br/>特表 2003-506397<br/>メディケア マネージメント<br/>コンサルタンシー<br/>特表 2004-518646<br/>メドレックス<br/>特開 2004-002320<br/>ロイヤル ガーフィールド<br/>ビー<br/>特表平 10-504281</p>                                                        | <p>科研製薬<br/>特開平 08-325160<br/>参天製薬<br/>特開 2004-196787</p> |
|           | ポリマーに分散 | <p>アムジェン<br/>特表 2003-531106<br/>インファイムド<br/>特表 2001-510151<br/>ガレン CHEM<br/>特表平 10-510825<br/>コロンビア LAB パ<br/>ミューダ<br/>特表平 10-507178<br/>サムヤン<br/>特表 2003-517886<br/>ジー エス DEV<br/>特表平 11-513393<br/>シグナス<br/>特表平 09-504810<br/>ニトロメド<br/>特表 2004-528337<br/>バイオテック オーストラ<br/>リア<br/>特表 2001-514316<br/>バイテリス<br/>特表 2002-525307<br/>ファルマシア<br/>特表 2003-518061<br/>ファーマービーン<br/>特表 2000-501094<br/>フィズ テクノロジーズ<br/>特表 2001-515030</p> | <p>フォーシス デンタル<br/>インファーマリー<br/>フォー チルドレン、<br/>プレジデント アンド<br/>フェローズ オブ<br/>ハーバード カレッジ<br/>特表 2002-541085<br/>ポリセラピューティッ<br/>クス<br/>特表 2002-514589<br/>マウリツィオ トネッ<br/>テイ<br/>特表平 09-507212<br/>マクロメド<br/>特表 2004-507450<br/>マサチューセッツ工科<br/>大学、チルドレンズ<br/>メディカル センター<br/>特表平 09-508892<br/>ミネソタ マイニング<br/>アンド MFG<br/>特表 2000-503009<br/>メドトロニック<br/>特表平 10-513471<br/>武田薬品工業<br/>特開 2002-226365</p>                      | <p>アイヴリア<br/>特表 2003-524635<br/>アクシア テクノロジーズ<br/>特表平 10-503757<br/>アルザ<br/>特表 2002-541094<br/>アンジオジェニックス<br/>特表 2002-512200<br/>エウランド INTERN<br/>特表 2003-526653<br/>エラン<br/>特表 2003-507416<br/>エル エー エム PHARM<br/>特表 2002-511057<br/>オーソ マクニール PHARM<br/>特表平 09-503997<br/>スプラテック ファーマ<br/>特表 2002-524579<br/>ファイザー<br/>特開 2000-229888<br/>ブロックター アンド ギャン<br/>ブル<br/>特表 2004-526830<br/>ボストン サイエнти<br/>フィック<br/>特表 2002-531183<br/>テキサス大学<br/>特許 3011768</p> | <p>レ LAB セルビエ<br/>特表 2004-518666</p>                      |



表 1.4.2-2 放出制御技術の課題・解決手段と出願人 (6/9)

| 課題        |               | 徐放化                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  | 放出速度制御                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |  |
|-----------|---------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--|
| 解決手段      |               |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |  |
| マトリックスへ分散 | その他のマトリックスに分散 | エル テー エス ローマン テラピー システム、クリンゲ ファルマ(3)<br>特許 3407073<br>特表平 10-505825<br>特表平 11-512080<br>テルモ(2)<br>特開 2001-190280<br>特開 2002-058485<br>ブリストル・マイヤーズ スクイブ(2)<br>特表平 10-512850<br>特表平 10-512851<br>ヘレウス クルツア(2)<br>特開 2002-322097<br>特開 2002-338472<br>アトリックス LAN、アブソバブル ポリマー テクノロジーズ<br>特表 2003-514006<br>アメリカン ナショナル レッド クロス、ロヨラ大学シカゴ校、アメリカ合衆国<br>特表平 09-502161<br>ウエスト ファーマシューティカル サービスズ<br>特表平 10-506376<br>エイカスフィアー<br>特表 2002-513752<br>エイドгентシッシュ テクニーシェ ホツシュール<br>チューリッヒ、チューリッヒ大学<br>特表 2003-525916<br>エクシモル<br>特開平 06-001724<br>オースティン サム エル、デイビス トーマス イー<br>特表 2004-513676<br>オリオン イヒティメ<br>特表 2000-514081<br>オンコ PHARM<br>特表 2002-525268<br>ギルフォード PHARM<br>特表 2002-540137<br>ゲルーデル テクノロジーズ<br>特表 2003-533468<br>コヘーション テクノロジーズ<br>特開平 08-034747<br>コロンビア LAB パミューダ<br>特表 2004-500317<br>ジー エス DEV<br>特表平 09-510980 | ジェネティックス INST、イリノイ大学<br>ファウンデーション<br>特表平 09-501932<br>シュミット アルフレート、ウップマイヤー ハンス・ユルゲン<br>特表平 09-510466<br>スカイファーム<br>特表平 09-503743<br>グラクソ スミスクライン<br>特表平 07-504182<br>ネオルックス<br>特表平 08-510209<br>バスキュラー セラピーズ ライアビリティ<br>特表 2004-523537<br>ファルマシア<br>特表平 09-503023<br>ブーツ<br>特表 2002-522376<br>ブラウン大学リサーチ<br>ファイウンデーション<br>特表平 08-502949<br>ベーカー ノートン PHARM<br>特許 2729333<br>マクニール ピーピー シー<br>特開平 07-304656<br>マテリアル エボリューション アンド DEV<br>ユー エス エー<br>特表平 09-503675<br>マトリクス PHARM<br>特表平 09-507233<br>ノースカロライナ大学<br>チャペルビル<br>特表 2004-501113<br>ミシガン大学<br>特表平 07-509735<br>ラビファーム<br>特開 2002-284701<br>ロクセニ LAB<br>特表 2003-522127<br>ロレアル<br>特開 2000-095693<br>三井化学<br>特開 2000-159888<br>浜松科学技術研究振興会<br>特開 2004-231604<br>武田薬品工業<br>特開平 10-167985 | アー ベー デー ファルマ<br>特表 2003-528829<br>アキュスフィアー<br>特表 2004-503484<br>エラン ドラッグ デリバリ<br>ー<br>特表 2001-527087<br>オステオジェニックス<br>特表平 11-506659<br>サイオス<br>特表 2002-501886<br>シグナス<br>特表平 09-505554<br>グラクソ スミスクライン<br>特表平 11-509539<br>テルモ<br>特開 2002-060400<br>ベン グリオン大学 ネゲブ<br>リサーチ<br>特表 2002-518315<br>ワーナー ランバート<br>特表平 09-500645 |  |

表 1.4.2-2 放出制御技術の課題・解決手段と出願人 (7/9)

| 課題   |           | 徐放化                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |                                                                                                                                                                                                                                                                                            | 放出速度制御                                                                                                                                                                                                                                                               |                                                                                                                                                                  |
|------|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 解決手段 | リポソームの利用  | アメリカ合衆国<br>特表平 10-510249<br>カップ PHARM<br>特表平 08-504204<br>カナダ<br>特表 2003-504322<br>スカイファーム<br>特表平 11-508900                                                                                                                                                                                                                    | ネクスター PHARM<br>特表平 08-504439<br>君が淵学園、上岡 竜一<br>特開 2000-290170<br>中外製薬<br>特開平 07-291871                                                                                                                                                                                                     |                                                                                                                                                                                                                                                                      |                                                                                                                                                                  |
|      | カプセルの利用   | ウエスト ファーマ<br>シューティカル サービス<br>シズ<br>特表 2001-525848<br>エドワーズ ライフサイ<br>エンシーズ<br>特表 2003-520830<br>エムアイテック<br>特表 2004-501188<br>シミズテック<br>特開 2003-062088<br>スカイファーム<br>特表 2003-501376<br>チルドレンズ メディカ<br>ル センター<br>特表平 11-504634<br>テバ PHARM IND<br>特表 2004-507451                                                                  | ドラッグテック<br>特開 2003-286193<br>マルホ<br>特開平 11-012571<br>南カリフォルニア大学<br>特表平 11-507038<br>ヨーロッパ人 コミュニ<br>ティー<br>特許 3486417<br>第一製薬<br>特許 3372408<br>田中貴金属工業<br>特開平 08-059460<br>富士バイオ<br>特開 2001-031575<br>武田薬品工業<br>特開平 08-157389                                                               | エラン(2)<br>特表平 11-503148<br>特表平 10-503769<br>クラスターテクノロジー<br>特開 2004-081754<br>コンセイユ ド ルシェル<br>シュ エ ダブリカシオン<br>シャンティ<br>特表 2002-521343<br>セラニーズ ベンチャーズ<br>特表 2004-512405<br>ドンク クック PHARM<br>特表 2002-534392<br>ニューロテック<br>特表 2003-524621<br>ノルスク ヒドロ<br>特表 2002-523445 | バイオハイブリッド テク<br>ノロジーズ<br>特表平 11-501928<br>ブラウン大学リサーチ<br>ファンデーション<br>特表平 08-503472<br>ミレニアムゲートテクノ<br>ロジー、八尾 健<br>特開 2004-081754<br>不二パウダル、福森 義信<br>特開 2004-002511 |
|      | 担体の利用     | アルタナ ファルマ(2)<br>特表平 11-508577<br>特表平 11-508578<br>アドバンス<br>特開平 10-158075<br>エテックス<br>特表 2001-524937<br>オリンパス光学工業<br>特開 2002-104955<br>コンジュシエム<br>特表 2003-508502<br>ジョンソンアンドジョン<br>ソン<br>特表 2000-501429<br>セントコア<br>特表 2001-512480<br>タツブ ホールディング<br>ス<br>特表 2004-501065<br>チッソ<br>特開 2002-356447<br>ファーマトリックス<br>特表平 08-503465 | フラメル テクノロジー<br>特表 2004-510753<br>レイラス<br>特表 2002-529493<br>レキット ベンキサー<br>ヘルスケア ユー ケイ<br>特表平 11-501652<br>喜務良工業<br>特開平 07-014484<br>呉羽化学工業<br>特開平 06-040945<br>三共<br>特開 2003-321390<br>昭和電工<br>特開平 07-126162<br>村上 弘一<br>特開 2002-356447<br>明治製菓<br>特開平 06-092870<br>由井 伸彦<br>特開 2002-356447 | ウエスト ファーマシュー<br>ティカル サービスズ<br>特表 2001-515862<br>オーストラリアン ニューク<br>リア サイエンス アンド<br>テクノロジー<br>特表 2003-523379<br>サンケイ化学<br>特開平 06-135713<br>帝人)<br>特開 2000-143538<br>凸版印刷<br>特開 2003-321398                                                                              |                                                                                                                                                                  |
|      | エマルジョンの利用 | ケー ブイ PHARM(2)<br>特表平 10-503482<br>特表平 10-503519<br>アジス IND 1983<br>特開平 08-092097<br>アボット LAB<br>特表 2003-520767<br>ミシガン大学<br>特表 2001-524957                                                                                                                                                                                    |                                                                                                                                                                                                                                                                                            | 宮崎 県、エス ピー ジー<br>テクノ、明治乳業<br>特開平 10-203962<br>エス アール アイ INTERN<br>特表平 11-507382                                                                                                                                                                                      |                                                                                                                                                                  |

表 1.4.2-2 放出制御技術の課題・解決手段と出願人（8/9）

| 課題       |        | 徐放化                                                                                                                                                                                                                                                                     |                                                                                                                                                                                                                                                         | 放出速度制御                                                                                                                                                                                                                           |                                                                                                                                                                                             |
|----------|--------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 解決手段     |        |                                                                                                                                                                                                                                                                         |                                                                                                                                                                                                                                                         |                                                                                                                                                                                                                                  |                                                                                                                                                                                             |
| 担体の利用    | コーティング | アクゾ ノーベル<br>特開平 10-287549<br>ジョンソンアンドジョンソン<br>特表平 08-510755<br>エル ティ エス ローマン テラピーズ ユステメ<br>特表 2003-528912<br>セルテック MFG カリフォルニア<br>特表 2004-512296<br>ドクトル ファルク<br>ファルマ<br>特許 3258666<br>トライデント テクノロ<br>ジーズ ライアビリテ<br>イ<br>特表 2003-520209<br>ニコメド ダンマーク<br>特表 2001-515854 | ブリストル・マイヤーズ<br>スクイブ<br>特表 2002-506812<br>プロク ター アンド<br>ギャンブル<br>特表 2003-531814<br>ポリーメッド<br>特表 2002-501908<br>マサチューセッツ工科大<br>学<br>特表平 09-504042<br>レイラス<br>特表 2003-521456<br>興和<br>特開平 11-322588<br>佐賀大学長<br>特許 2857741<br>中外製薬、富士化学工業<br>特開平 11-071285 | アストラ ゼネカ<br>特表 2004-522798<br>エラン<br>特表 2002-528485<br>サイデックス<br>特表 2002-534472<br>スリーエム イノベイティブ<br>プロパティズ<br>特表 2003-512414<br>ファイザー<br>特開 2000-229846<br>メットコン メディシン<br>特表 2004-512306                                         |                                                                                                                                                                                             |
|          |        | 放出制御膜の利用                                                                                                                                                                                                                                                                | 放出制御膜の利用                                                                                                                                                                                                                                                | ボシュ アンド ロム(4)<br>特表 2004-517674<br>特表 2004-516889<br>特表 2004-521882<br>特表 2004-522730<br>アラーガン<br>特表 2003-512417<br>ジョンソンアンドジョンソン<br>特表 2001-526214<br>エル テー エス ローマン<br>テラピー システメ<br>特表平 10-505264<br>バイロ テックス<br>特表 2002-512950 | フィズ テクノロジーズ<br>特開平 11-158081<br>ユーロセルティク<br>特表 2004-521085<br>ワーナー ランバート ラ<br>イアビリティ<br>特開 2002-212061<br>三井製糖<br>特開平 06-145071<br>三和化学研究所<br>特開 2000-86535                                 |
| 機械・器具の利用 | 装置の利用  | 機械的制御                                                                                                                                                                                                                                                                   | 大阪産業振興機構<br>特開 2003-275327<br>プロク ター アンド<br>ギャンブル<br>特表平 09-511927<br>ミネソタ マイニング<br>アンド MFG<br>特表 2000-502349<br>アルコン<br>特表 2003-515528<br>アルコーブ サーフィ<br>シーズ<br>特表 2003-517853                                                                          | サノフィ・アベンティス<br>特表平 07-509696<br>アムジェン<br>特表平 08-503873<br>アラダイム<br>特表平 08-509465<br>アルザ<br>特表平 11-505264<br>キネテック<br>特表 2003-513001<br>コントロール デリヴァリー<br>システムズ<br>特表 2003-530964<br>コーディス<br>特表 2003-533494                       | コントロール デリヴァ<br>リー システムズ、ピアソ<br>ン ポール エイ<br>特表平 11-512711<br>デュレクト<br>特表 2002-538895<br>ユーローセルティック<br>特表 2003-534053<br>ミシガン州立大学リサーチ<br>ファウンデーション<br>特表 2004-505675<br>久光製薬<br>特開平 11-019226 |
|          | 電子的制御  | 電子的制御                                                                                                                                                                                                                                                                   | マイクロチップス(2)<br>特表 2003-506477<br>特表 2003-525432<br>マサチューセッツ工科大学<br>(2)<br>特表 2000-513725<br>特表 2003-516343<br>アプライド ワクチン テク<br>ノロジーズ<br>特表 2003-523308<br>コーディス<br>特表 2004-501102                                                                       | コントロール デリバリー<br>システムズ<br>特表 2002-539263<br>スミス アンド フュー、<br>マサチューセッツ工科大学<br>特表 2003-508185<br>ファーリントン PHARM<br>特表 2004-503264<br>ユー ティー バトル、テ<br>ネシー大学 リサーチ<br>特表 2002-531194                                                     |                                                                                                                                                                                             |

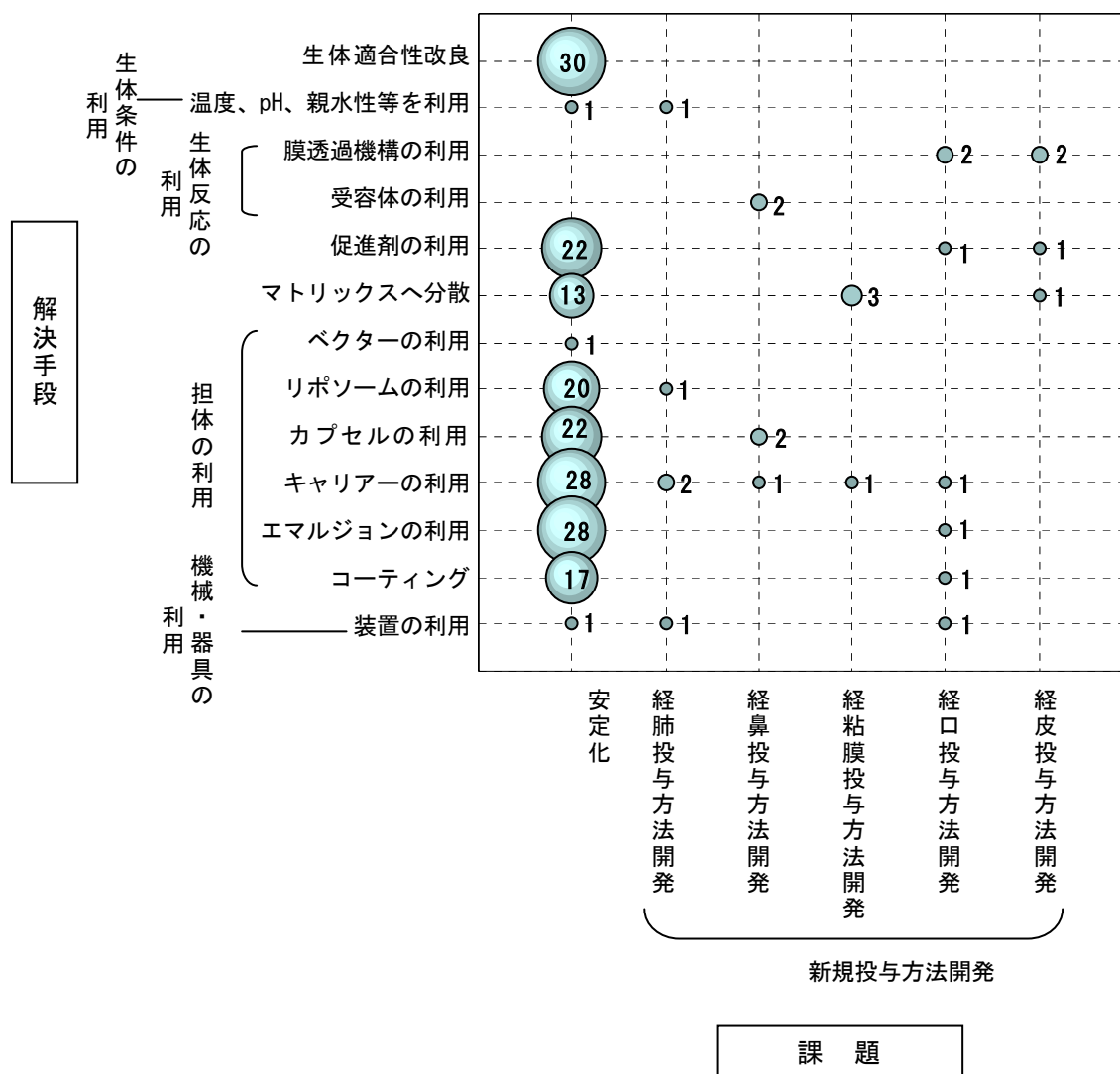
表 1. 4. 2-2 放出制御技術の課題・解決手段と出願人（9/9）

| 課題   |          |             | 徐放化                                                                                                | 放出速度制御                                                                                                                                                                                                                                                                     |
|------|----------|-------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 解決手段 | 機械・器具の利用 | その他の制御装置の利用 | <p>ローム アンド ハース<br/>特開 2001-270839</p> <p>テルモ<br/>特開 2002-193838</p> <p>日東電工<br/>特開 2003-313122</p> | <p>サノフィ・アベンティス<br/>特開平 08-337540</p> <p>テラピコン<br/>特表平 10-502376</p> <p>エル ティ エス ローマン テラピー ズースターメ<br/>特表 2002-518430</p> <p>アドバンス PHARM<br/>特表 2003-531115</p> <p>ジョンソンアンドジョンソン<br/>特表 2004-508319</p> <p>ボストン サイエнтиフィック<br/>特表 2004-519260</p>                            |
|      |          | 物理的刺激の利用    |                                                                                                    | <p>ザーズ(2)<br/>特表 2002-525172<br/>特表 2002-525297</p> <p>ジョンソンアンドジョンソン<br/>特表 2000-514065</p> <p>ジェネラル ホスピタル<br/>特表 2003-534235</p> <p>セラマテック<br/>特表 2004-512073</p> <p>ノバルティス<br/>特表平 09-512006</p> <p>バーチ ポイント メディカル<br/>特表 2002-523194</p> <p>ユタ大学<br/>特表 2001-501596</p> |

## ②効果的放出技術

図 1.4.2-2 に効果的放出技術の課題と解決手段の分布を示す。効果的放出技術の課題は「安定化」に集中している。安定化に対しては、「担体の利用」で集中して対応している。

図 1.4.2-2 効果的放出技術の課題と解決手段の分布



1992 年 1 月～2002 年 12 月の出願

表 1.4.2-3 に効果的放出技術の課題・解決手段の詳細を示す。安定化の課題に対して集中して対応している担体の利用は、「キャリアの利用」、「エマルジョンの利用」と「カプセルの利用」でより具体的な解決手段で対応している。

表 1.4.2-3 効果的放出技術の課題・解決手段の分布

| 課題<br>解決手段 |               | 安定化 | 新規投与方法開発 |      |       |      |      |
|------------|---------------|-----|----------|------|-------|------|------|
|            |               |     | 経肺投与     | 経鼻投与 | 経粘膜投与 | 経口投与 | 経皮投与 |
| 生体適合性改良    | 化学修飾          | 19  |          |      |       |      |      |
|            | 組成改良          | 7   |          |      |       |      |      |
|            | 生物学的改変        | 1   |          |      |       |      |      |
|            | その他の改良        | 3   |          |      |       |      |      |
| 生体条件の利用    | 温度、pH、親水性等の利用 | 1   | 1        |      |       |      |      |
|            | 酵素等の利用        |     |          |      |       |      |      |
|            | 生分解性を利用       |     |          |      |       |      |      |
| 生体反応の利用    | 膜透過機構の利用      |     |          |      |       | 2    | 2    |
|            | 受容体を利用        |     |          | 2    |       |      |      |
|            | 抗体の利用         |     |          |      |       |      |      |
|            | 免疫反応の利用       |     |          |      |       |      |      |
|            | 遺伝子発現の利用      |     |          |      |       |      |      |
| 促進剤の利用     |               | 22  |          |      |       | 1    | 1    |
| マトリックスへ分散  | ポリマーに分散       | 9   |          |      | 1     |      | 1    |
|            | その他のマトリックスに分散 | 4   |          |      | 2     |      |      |
| 担体の利用      | ベクターの利用       | 1   |          |      |       |      |      |
|            | リポソームの利用      | 20  | 1        |      |       |      |      |
|            | カプセルの利用       | 22  |          | 2    |       |      |      |
|            | キャリアーの利用      | 28  | 2        | 1    | 1     | 1    |      |
|            | エマルジョンの利用     | 28  |          |      |       | 1    |      |
|            | コーティング        | 17  |          |      |       | 1    |      |
| 機械・器具の利用   | 装置の利用         | 1   | 1        |      |       | 1    |      |
|            | 物理的刺激の利用      |     |          |      |       |      |      |

1992 年 1 月～2002 年 12 月の出願

表 1.4.2-4 に安定化、新規投与方法開発について、課題に対する解決手段の出願人を示す。安定化に対する「キャリアーの利用」に関して、エミスフェアー テクノロジーズは 3 件、ネクター セラピューティクスとバクスターと日本油脂が各 2 件出願している。安定化に対する「エマルジョンの利用」に関して、アライアンス、ジュンソンアンドジョンソンとシャイアが各 2 件出願している。安定化に対する「カプセルの利用」に関して、4 大学から 4 件の出願がある。

表 1. 4. 2-4 効果的放出技術の課題・解決手段と出願人 (1/4)

| 課題<br>解決<br>手段 | 安定化    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |
|----------------|--------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 生体適合性改良        | 化学修飾   | アムジェン(3)<br>特許 3485842、特開 2003-327600<br>特表平 10-508853<br>ノベックス(2)<br>特開 2003-206236、特表 2003-509386<br>エンザクタ アール アンド デイ<br>特開 2003-292458<br>キングズ カレッジ ロンドン<br>特表 2004-521911<br>シアウォーター ポリマーズ<br>特許 3114998<br>シューリング ブラウ<br>特表 2002-507583<br>ジェンザイム<br>特表 2003-522806<br>ネクター セラピューティックス エイエル<br>特表 2002-506087<br>バイオフィジカ<br>特許 3425955<br>ブラツコ リサーチ<br>特表 2002-523418<br>ヘキサル<br>特表 2004-502726<br>三共<br>特開 2000-198731<br>三菱化学<br>特開平 09-221502<br>森永乳業<br>特開平 06-172200<br>第一製薬<br>特開平 11-080032<br>田畑 泰彦、参天製薬<br>特開 2002-371016                                                                                                                                                            |
|                | 組成改良   | 千葉製粉(2)<br>特許 3085485、特許 3217450<br>ジェイエスアール、小林 猛<br>特開平 11-106391<br>テクノネットワーク四国<br>特開 2003-012503<br>ポリマスク PHARM<br>特表平 11-504915<br>科学技術振興機構<br>特許 2690276<br>日本油脂、生産開発科学研究所<br>特開平 06-016688                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
|                | 生物学的改変 | ロッシュ ディアグノスティクス<br>特許 3103116                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |
|                | その他の改良 | バイオアーティフィシャル ゲル テクノロジーズ<br>特表 2004-526025<br>産業技術総合研究所<br>特開 2004-217739<br>大塚製薬工場<br>特開 2004-155771                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |
| 促進剤の利用         |        | 武田薬品工業(2)<br>特開平 10-81621、特開 2004-155773<br>アストラ<br>特表 2002-510311<br>アドバンスド インハレーション リサーチ<br>特表 2002-523360<br>アルカーメス コントロールド セラピューティックス<br>特表 2001-515457<br>ウエスト PHARM サービスズ ドラッグ デリバリー<br>特表平 11-509545<br>エミスフェアー テクノロジーズ<br>特表 2004-501057<br>エムジー製薬<br>特開 2002-255811<br>エル テイ エス ローマン テラピース ユステーメ<br>特表 2002-519371<br>サイトゲン<br>特表平 10-508851<br>ノエビア<br>特開 2002-301356<br>第一製薬<br>特開 2002-32403<br>日本ケミカルリサーチ<br>特開 2004-51502<br>ノバルティス<br>特開平 07-145070<br>ノボ ノルディスク<br>特表 2002-527487<br>フィズ INTERN<br>特表 2003-522097<br>マリンクロッド メディカル<br>特表平 09-510454<br>ワイス<br>特開平 07-196518<br>高橋 正士<br>特開 2004-167178<br>産業技術総合研究所<br>特許 3138733<br>千葉製粉<br>特許 3102612<br>大洋薬品工業<br>特開平 09-309829 |

表 1.4.2-4 効果的放出技術の課題・解決手段と出願人 (2/4)

| 課題         |               | 安定化                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |                                                                                                                                                                                                                                                                                         |
|------------|---------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 解決手段       |               |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |                                                                                                                                                                                                                                                                                         |
| マトリックスへの分散 | ポリマーに分散       | <p>アストラ ゼネカ (2)<br/>特表 2002-516822<br/>特表 2004-521963<br/>イマレックス セラピューティクス<br/>特表 2003-520210<br/>エフ ホフマン ラ ロシュ<br/>特開 2000-095708<br/>ノウブン PHARM<br/>特表平 11-506744</p>                                                                                                                                                                        | <p>フィズ テクノロジーズ<br/>特表平 11-514979<br/>ファイザー<br/>特表 2001-515029<br/>田辺製薬<br/>特開 2000-239152<br/>武田薬品工業<br/>特開 2002-241267</p>                                                                                                                                                             |
|            | その他のマトリックスに分散 | <p>アルタナ ファルマ<br/>特表 2004-514737<br/>ゾナジェン<br/>特表平 10-513202<br/>ノバルティス<br/>特許 2944419<br/>ヤクルト本社、早津 彦哉<br/>特開平 10-077235</p>                                                                                                                                                                                                                   |                                                                                                                                                                                                                                                                                         |
| 担体の利用      | ベクターの利用       | <p>ミシガン大学<br/>特表平 09-500524</p>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |                                                                                                                                                                                                                                                                                         |
|            | リポソームの利用      | <p>日本油脂 (3)<br/>特許 3249583<br/>特許 3443939<br/>特開平 09-87168<br/>イマレックス PHARM (2)<br/>特表平 08-511523<br/>特表平 08-511526<br/>三共 (2)<br/>特開平 11-171771<br/>特開平 11-171772<br/>アフィオス<br/>特表平 10-509459<br/>オプティム セラピューティクス<br/>特表 2002-535268<br/>ゲンティウム<br/>特開 2001-002565<br/>ジェネレックス PHARM<br/>特表 2002-525309<br/>シュワーベ グリーンウェーブ<br/>特許 3249583</p> | <p>ネオファーム<br/>特開 2004-59590<br/>ヒュンダイ PHARM<br/>特表 2004-506003<br/>ブルー リッジ PHARM<br/>特表 2002-535268<br/>マックス ブランク G ツア フェルデルンク<br/>デル ウィッセ<br/>特表 2001-515082<br/>リボクセン テクノロジーズ<br/>特表 2003-521508<br/>赤池 孝章<br/>特開平 10-265383<br/>千葉製粉<br/>特許 3329554<br/>藤沢薬品工業<br/>特表平 10-505818</p> |



効果的放出技術の課題・解決手段と出願人（3/4）

| 課題<br>解決<br>手段 | 安定化                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         |
|----------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 担体の利用          | <p>カプセルの利用</p> <p>アイサイエンス<br/>特表 2004-505065<br/>アルカーメス コントロールド セラピューティック<br/>ス<br/>特表平 07-507806<br/>イオン工学振興財団<br/>特開平 07-222804<br/>イネックス PHARM<br/>特表 2002-502831<br/>エウランド INTERN<br/>特表 2004-513645<br/>エル ディー エス テクノロジーズ<br/>特表平 09-510182<br/>クノル<br/>特表平 09-502963<br/>ケンブリッジ バイオスタビリティ<br/>特開 2004-196776<br/>ジー ディー サール<br/>特表 2001-508762<br/>チルドレンズ ホスピタル オブ フィラデルフィ<br/>ア、テンブル大学<br/>特表平 10-500889<br/>バイオキュア<br/>特表 2003-518015</p>                                                          | <p>バクスシン<br/>特表平 10-508834<br/>バルケム<br/>特表 2003-517831<br/>ファーマシューティカル ディスカバリー<br/>特許 2617273<br/>ブラウン大学リサーチ ファンデーション<br/>特表平 11-510142<br/>ブラッコ リサーチ<br/>特表平 09-511762<br/>マサチューセッツ工科大学<br/>特表 2004-510692<br/>リボソーム<br/>特表 2002-535242<br/>ワシントン大学<br/>特表 2001-508762<br/>宮崎県<br/>特開 2004-8015<br/>森下仁丹<br/>特許 3102990<br/>第一製薬<br/>特開平 08-268916</p>                                                 |
|                | <p>キャリアーの利用</p> <p>エミスフェア テクノロジーズ (3)<br/>特表平 07-508004<br/>特開 2001-131090<br/>特開 2001-139494<br/>ネクター セラピューティクス (2)<br/>特表 2003-535017<br/>特表 2003-533449<br/>バクスター (2)<br/>特表 2004-511447<br/>特表 2004-511447<br/>日本油脂 (2)<br/>特開平 08-333282<br/>特開平 11-322857<br/>アール ピー シェラー テクノロジーズ<br/>特表 2004-519504<br/>アルザ<br/>特表 2002-533380<br/>エーザイ<br/>特開 2001-270827<br/>エス ディー ジー<br/>特表 2001-510811<br/>エム エル LAB<br/>特表 2003-504312<br/>オキシジェニクス<br/>特開 2001-226259<br/>カリフォルニア工科大学<br/>特表 2002-531530</p> | <p>コニカ<br/>特開平 09-114592<br/>サイムド ライフ システムズ<br/>特表 2004-523520<br/>ジェネンテック<br/>特表平 11-510170<br/>スーゲン<br/>特表 2004-504342<br/>テクノネットワーク四国<br/>特開 2003-1097<br/>ファルマシア アンド アップジョン<br/>特表 2004-504342<br/>ファレス PHARM リサーチ<br/>特表 2002-507966<br/>ベクトン ディッキンソン<br/>特許 3055771<br/>共和薬品工業<br/>特開 2004-10575<br/>産業技術総合研究所<br/>特開平 08-301791<br/>石原 一彦、中林 宣男<br/>特開平 11-322857<br/>田辺製薬<br/>特開平 06-157294</p> |

表 1.4.2-4 効果的放出技術の課題・解決手段と出願人（4/4）

| 課題       |           | 安定化                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |
|----------|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 解決手段     |           |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |
| 担体の利用    | エマルジョンの利用 | <p>アライアンス PHARM(2)<br/>特表平 11-506783<br/>特表平 11-508237<br/>ジョンソンアンドジョンソン(2)<br/>特表平 11-506730<br/>特表 2002-524407<br/>シャイア LAB(2)<br/>特表平 09-510712<br/>特表平 09-511744<br/>アドバンストスキニリサーチ研究所<br/>特開平 11-009988<br/>アメリカ合衆国<br/>特表 2002-532535<br/>アール ティー ピー ファーマ<br/>特表 2002-509877<br/>アルタナ ファルマ<br/>特表 2004-514735<br/>イーエム IND<br/>特表 2002-520377<br/>インヘイル セラピューティック システムス<br/>特表 2003-525842<br/>エラン<br/>特表 2002-513750<br/>エルティーティー研究所<br/>特開平 11-343249<br/>カバノフ アレクサンダー ブイ<br/>特表平 11-507619</p> | <p>サム ヤン<br/>特表平 10-512287<br/>ジー ディー サール<br/>特表平 10-504291<br/>シーンズ ドラッグ デリバリー<br/>特表 2002-506901<br/>スブラテック ファーマ<br/>特表平 11-507619<br/>ソーナス PHARM<br/>特表 2003-500368<br/>ファルマシア アップジョン<br/>特表 2004-520398<br/>ヤゴテック<br/>特表平 10-508614<br/>イリノイ大学ファウンデーション<br/>特表 2003-535149<br/>フロリダ大学<br/>特表 2004-505033<br/>ニュージャージー州立大学 ラトガーズ<br/>特表 2001-522909<br/>旭硝子<br/>特開平 11-343249<br/>宮崎県<br/>特開 2004-008837<br/>日研化学<br/>特開平 11-092386</p> |
|          | コーティングの利用 | <p>アストラ ゼネカ<br/>特表平 09-511767<br/>アルザ<br/>特表 2002-532569<br/>イル ヤン ファーム<br/>特開平 11-315032<br/>ウエスト PHARM サービスズ ドラッグ デリバリー<br/>特表 2003-517440<br/>スクール オブ ファーマシー大学 オブ ロンドン<br/>特表 2002-534455<br/>グラクソ スミスクライン<br/>特表平 09-512027<br/>チルドレンズ ホスピタル メディカル センター<br/>特表 2003-514864<br/>バークメイヤー ユー エス エー<br/>特表平 08-512021</p>                                                                                                                                                                              | <p>ファルティオン テクニリネン トウトキムスケスクス<br/>特表 2002-511404<br/>ブリガム アンド ウイメンズ ホスピタル<br/>特表平 10-511340<br/>ポーラ化成工業<br/>特開平 06-279285<br/>メルク シャープ エンド ドーム<br/>特表 2002-534455<br/>三共<br/>特開 2000-264846<br/>第一製薬<br/>特開 2002-005855<br/>中塚 勝人<br/>特開平 09-328438<br/>科学技術振興機構<br/>特開 2003-147418<br/>日鉄鉱業<br/>特開平 09-003284</p>                                                                                                                          |
| 機械・器具の利用 | 装置の利用     | <p>久光製薬<br/>特開平 09-201420</p>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |

## (2) 薬剤標的化技術

### ①能動的標的化技術

図 1.4.2-3 に能動的標的化技術の課題と解決手段の分布を示す。能動的標的化技術で集中している課題は、「がん組織の識別」、「その他疾患の識別」、「直接送達方法開発」、「がんの治療」と「その他疾患の治療」である。がん組織の識別に対しては、「抗体の利用」と「受容体の利用」で対応している。その他疾患の識別に対しても、「受容体の利用」と「抗体の利用」で対応している。直接送達方法開発に対しては、「装置の利用」と「コーティング」で対応している。がんの治療に対しては、「抗体の利用」、「遺伝子発現の利用」、「受容体の利用」の他に「酵素等の利用」で対応している。その他疾患の治療に対しては、「酵素等の利用」、「遺伝子発現の利用」と「受容体の利用」で対応している。

図 1.4.2-3 能動的標的化技術の課題・解決手段の分布

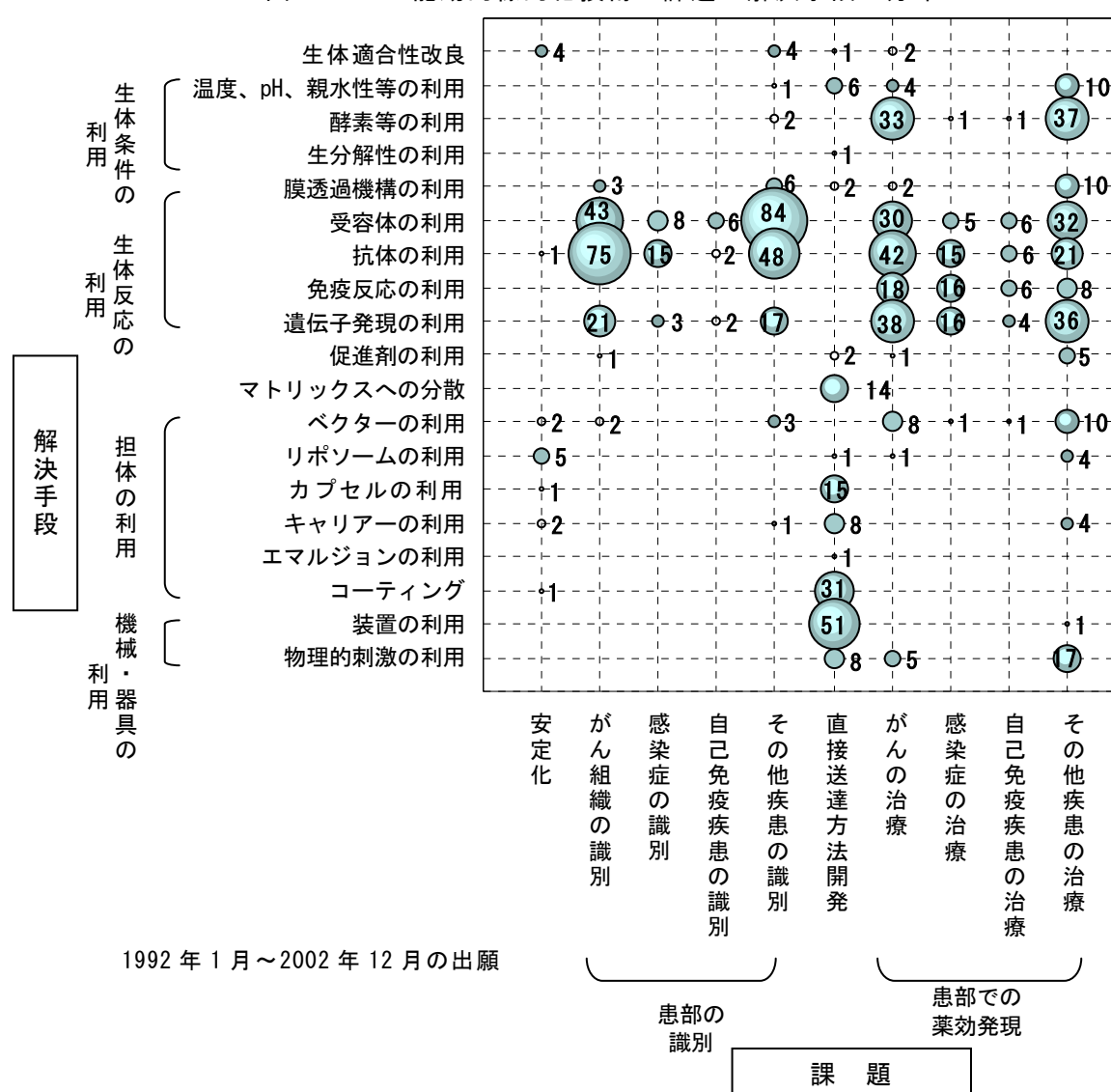


表 1.4.2-5 に能動的標的化技術の課題・解決手段の詳細を示す。出願が集中している課題である患部の識別の具体的な課題は、「がんの識別」と「その他疾病の識別」である。次に多い課題である患部での薬効発現の具体的な課題は、「その他のがんの治療」と「その他の疾患の治療」である。また「直接送達方法開発」の課題も多い。

表 1.4.2-6 に能動的標的化の課題に対する解決手段の出願人を示す。がんの識別に対して「その他の抗体の利用」に関しては、ルードリッヒとフォー キャサリン リサーチ（共願）で4件出願している。その他疾患の識別に対して「リガントの利用」に関しては、ジェネンテックが3件出願している。その他のがんの治療に対して「その他の遺伝子発現の利用」に関して、ベイラー カレッジ メディシン、リボファルマとローヌ プーラン ローラが各2件の出願がされている。その他の疾患の治療に対して「酵素等の利用」に関して、イミュノメディックス、ウエルカム ファンデーション、エンザクタ アール アン ド ディが各2件の出願がされている。

表 1. 4. 2-5 能動的標的化技術の課題・解決手段の分布 (1/2)

| 課題   |  | 安定化 | 患部の識別    |            |        |       |         |            |           |               | 直接送達方法開発 | 患部での薬効発現 |  |          |        |           |              |         |            |           |               |          |           |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |
|------|--|-----|----------|------------|--------|-------|---------|------------|-----------|---------------|----------|----------|--|----------|--------|-----------|--------------|---------|------------|-----------|---------------|----------|-----------|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|--|
|      |  |     | がん組織の識別  |            |        |       | 感染症の識別  |            | 自己免疫疾患の識別 |               |          | その他疾患の識別 |  | がんの治療    |        |           | 感染症の治療       |         |            | 自己免疫疾患の治療 |               | その他疾患の治療 |           |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |
|      |  |     | 前立腺がんの識別 | 大腸、結腸がんの識別 | 白血病の識別 | がんの識別 | HIV の識別 | その他の感染症の識別 | 炎症の識別     | その他の自己免疫疾患の識別 |          |          |  | 前立腺がんの治療 | 肝がんの治療 | その他のがんの治療 | B 型、C 型肝炎の治療 | HIV の治療 | その他の感染症の治療 | 関節リウマチの治療 | その他の自己免疫疾患の治療 | 血管狭窄の治療  | その他の疾患の治療 |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |
| 解決手段 |  |     |          |            |        |       |         |            |           |               |          |          |  |          |        |           |              |         |            |           |               |          |           |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |  |

表 1.4.2-6 能動的標的化技術の課題・解決手段と出願人 (1/12)

| 課題      |               | 患部の識別                                                  |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    | 患部での薬効発現                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |
|---------|---------------|--------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 解決手段    |               | がんの識別                                                  | その他疾患の識別                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           | その他のがんの治療                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          | その他の疾患の治療                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |
|         |               |                                                        | テクニクロン<br>特表 2000-503301<br>テルモ<br>特開平 08-27030<br>プリティッシュ コロンビア大学、イネックス PHAM<br>特表 2004-511572<br>富士レピオ<br>特開平 06-329581                                                                                                                                                                                                                                                                                                          | ブリストル マイヤーズ<br>スクイブ<br>特開平 08-191692<br>前田 浩<br>特開平 11-60499                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |
| 生体適合性改良 |               |                                                        | ジャンセル<br>特表 2004-508364                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            | キャンサー リサーチ INST<br>特表平 10-512279<br>デンドリテック<br>特表平 08-507517<br>岡野 光夫<br>特開 2002-020318<br>協和醗酵工業<br>特開平 11-021250                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 | ジョンソンアンドジョンソン<br>特表 2004-525138<br>イネックス PHARM<br>特表 2002-528381<br>ナノキャリア<br>特開 2001-146556<br>バッテル メモリアル INST<br>特表 2002-512987<br>ブラッコ INTERN<br>特開平 07-89922<br>アクロン大学<br>特表 2001-527077<br>リボソーム<br>特表 2003-513009<br>協和醗酵工業<br>W000/038736<br>科学技術振興機構<br>特開 2002-128784                                                                                                                                                      |
|         | 温度、pH、親水性等の利用 |                                                        |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |
| 生体条件の利用 |               | サノフィ・アベンテス<br>特表 2003-514895<br>東亜薬品<br>特開 2003-160485 | キャンサー リサーチ<br>キャンペーン テクノロジー (5)<br>特表平 10-512565<br>特表平 08-509490<br>特表平 09-500896<br>特表平 09-505037<br>特表平 10-505335<br>エンザクタ アール アンド デイ (2)<br>特表 2000-502071<br>特表 2000-502698<br>アストラ ゼネカ (2)<br>特表平 10-511547<br>特表平 11-511970<br>インテリジーン<br>特表 2002-528424<br>ベーリングベルケ (2)<br>特開平 06-319554<br>特開平 07-316074<br>オックスフォード バイオメディカ ユーケイ<br>特表 2002-505341<br>ジェネンテック<br>特表 2003-523407<br>ロンドン大学スクールオブ ファーマシー<br>特表 2004-522781 | キャンサー リサーチ<br>キャンペーン テクノロジー (5)<br>特表平 10-512565<br>特表平 08-509490<br>特表平 09-500896<br>特表平 09-505037<br>特表平 10-505335<br>エンザクタ アール アンド デイ (2)<br>特表 2000-502071<br>特表 2000-502698<br>アストラ ゼネカ (2)<br>特表平 10-511547<br>特表平 11-511970<br>インテリジーン<br>特表 2002-528424<br>ベーリングベルケ (2)<br>特開平 06-319554<br>特開平 07-316074<br>オックスフォード バイオメディカ ユーケイ<br>特表 2002-505341<br>ジェネンテック<br>特表 2003-523407<br>ロンドン大学スクールオブ ファーマシー<br>特表 2004-522781 | イミューメディックス (2)<br>特表平 07-508979<br>特表 2002-508400<br>ウェルカム ファウンデーション (2)<br>特許 3492951、<br>特表平 08-508295<br>エンザクタ アール アンド デイ (2)<br>特表 2002-542303<br>特表 2004-518618<br>エンゾン (2)<br>特表 2000-503639<br>特表 2000-503658<br>ブリストル マイヤーズ (2)<br>特表平 10-509732<br>特表平 10-508291<br>アドバンスド ポリマーシステムズ<br>特表平 10-509326<br>イシス イノベイション<br>特表 2004-525171<br>インターナショナル メディカル イノベーションズ<br>特表 2004-523464<br>オレゴン ヘルス サイエンスズ大学<br>特表平 10-506881 |
|         | 酵素等の利用        |                                                        |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |

表 1.4.2-6 能動的標的化技術の課題・解決手段と出願人 (2/12)

| 課題      |        | 患部の識別 |          | 患部での薬効発現                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |
|---------|--------|-------|----------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 解決手段    |        | がんの識別 | その他疾患の識別 | その他のがんの治療                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               | その他の疾患の治療                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |
| 生体条件の利用 | 酵素等の利用 |       |          | セント ジュード チ<br>ルドレンズ リサーチ<br>ホスピタル<br>特表 2002-504340<br>デ モントフォート大<br>学<br>特表 2003-525851<br>デニー ウイリアム<br>アレクサンダー、ヘイ<br>マイケル パトリッ<br>ク、ウイルソン ウイ<br>リアム ロバート<br>特表平 11-511163<br>テリック<br>特表 2000-503648<br>ドイツチェス クレー<br>ブスフォルシュングス<br>ツェントルム<br>特表平 10-505842<br>ニューロリサーチ<br>特表 2003-525911<br>バイエル<br>特表 2004-519449<br>ファルマヘミー<br>特開平 09-202796<br>ブリストル マイヤー<br>ズ スクイブ<br>特表 2003-526683<br>ベーリンガー インゲ<br>ルハイム<br>特表 2002-544242<br>マサチューセッツ工科<br>大学<br>特表 2003-525946<br>ユー エイ ビー リ<br>サーチ ファウンデイ<br>ション、サザン リ<br>サーチ INST<br>特表平 09-502612<br>リプラサム ファーマ<br>特表 2003-522193<br>ローヌ プーラン<br>ローラー<br>特表平 09-504955<br>前田 浩<br>特開 2003-292457<br>第一製薬<br>特開 2003-034653 | カーターベーツモル<br>フォルシュンクス<br>特表 2003-518000<br>クラレ<br>特表平 11-514009<br>コールター PHARM<br>特表 2003-510375<br>ジェネンコー<br>INTERN、トロント大学<br>ガバニング カウンシ<br>ル<br>特表 2002-526457<br>アストラゼネカ、キャ<br>ンサー リサーチ<br>キャンペーン テクノ<br>ロジー<br>特開平 07-149666<br>ダウ CHEM、インス<br>チ オブ モレキュ<br>ラー バイオロジー<br>特開平 06-228195<br>デイ ファーム<br>特開平 08-325270<br>デイパーメント オブ<br>ラディエーション オ<br>ンコロジー、ミトラ<br>メディカル テクノロ<br>ジー<br>特表 2001-505533<br>デビオ ルシエルシュ<br>PHARM<br>特表 2003-500417<br>ビクトリア大学マン<br>チェスター校<br>特表 2001-527049<br>ファルマシア、第一製<br>薬<br>W099/061061<br>ヘキスト<br>特表平 09-511240<br>ベーリンガー インゲ<br>ルハイム ファルマ<br>特表 2002-536015<br>ベーリングベルケ<br>特開 2001-128681<br>ヘルス プロテクショ<br>ン エージェンシー<br>特表 2002-523382<br>メダレックス<br>特表 2003-526681<br>メルク<br>特表平 07-506339<br>ラ レフィオン バロ<br>ンネ、ユニフェルシテ<br>カトリック デ ルー<br>ファインファイン<br>特許 3541037<br>ライアン PHARM、ワシ<br>ントン大学、カナダ国<br>立カOUNシル<br>特表平 09-507834<br>リバファー<br>特表 2004-510703<br>第一製薬<br>特表平 10-502619<br>日本たばこ産業、生物<br>分子工学研究所、蛋白<br>工学研究所<br>特表 2002-519440 |

表 1.4.2-6 能動的標的化技術の課題・解決手段と出願人 (3/12)

| 課題       |  | 患部の識別                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       | 患部での薬効発現                                                                                                                                                                                                                                                                 |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         |
|----------|--|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 解決手段     |  | がんの識別                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            | その他疾患の識別                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              | その他のがんの治療                                                                                                                                                                                                                                                                | その他の疾患の治療                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |
|          |  | ジーエスブラッツ<br>特開 2003-284560<br>ディーディエス研究所<br>特開平 08-085703<br>テキサス大学<br>特表 2004-501664                                                                                                                                                                                                                                                                            | ハンサ メディカル<br>特表 2001-522601<br>レキシコン ジェネティックス<br>特表 2003-508076<br>ワシントン大学<br>特表 2002-518521<br>東京瓦斯<br>W02002/020061<br>日本メジフィジックス<br>特開 2001-114792<br>明治製菓<br>特開 2003-12547                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        | イミューノメディックス<br>特表平 08-500084<br>コンドラティブ アレクセイ<br>特表平 09-503486                                                                                                                                                                                                           | アビデックス<br>特表 2001-521005<br>アムジェン<br>特表 2001-525316<br>アンティボディー<br>バイオテクノロジー<br>特表 2001-524483<br>シーダーズ サイナイ<br>メディカル センター<br>特表 2003-523965<br>スローン ケタリング<br>INST フォーキャン<br>サリサーチ<br>特表 2002-501722<br>プロターガ<br>特表 2002-502594<br>マキシム PHARM<br>特表平 11-510164<br>ミグラゲン<br>特表 2004-519448<br>コネチカット大学、<br>ターゲテック<br>特表平 08-508645<br>持田製薬<br>特開 2003-325185                                                             |
| 膜透過機構の利用 |  |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       |                                                                                                                                                                                                                                                                          |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         |
| 生体反応の利用  |  | 武田薬品工業(2)<br>特開平 06-009672<br>特開 2003-116584<br>イノバー LAB、<br>エール大学<br>特表平 10-502051<br>コロンビア大学<br>特表 2003-532378<br>シーエルアイ オン<br>コロジー、<br>コーエン ステファン<br>エイ<br>特表平 09-503582<br>ジェネンテック<br>特表 2003-523207<br>シェペンズ アイ リ<br>サーチ INST<br>特表平 07-507537<br>ナプロ バイオセラ<br>ビューティクス<br>特表 2004-528309<br>マリンクロッド<br>特表 2002-537360<br>モーア ディー ジェー<br>ムズ<br>特表平 10-503921 | アメリカ合衆国<br>特許 3533219<br>アメリカン サイアナミッド<br>特表平 11-508232<br>アングストロム PHARM<br>特表 2003-528035<br>アンズチ、パスツール、サン<br>トル ナショナル ド ラ<br>シェルシュ シャンティフィツ<br>特表 2004-508065<br>インカイン PHARM<br>フィラデルフィア ヘルス エ<br>ンド エデュケーション<br>特表 2004-513066<br>オクラホマ メディカル リ<br>サーチ ファウンデーション<br>特表 2002-523381<br>グラウブナー ゲルハルト<br>特表 2003-530299<br>ケース ウェスタン リザーブ<br>大学<br>特表 2003-505518<br>サイティミューン サイエ<br>ンシーズ<br>特表 2001-522818<br>シェーリング<br>特表 2003-517037<br>ジェンベック<br>特表平 10-505242<br>シナプティック PHARM<br>特表平 09-511127<br>スノール モレキュラー<br>特表 2003-534821<br>タカラバイオ<br>特開 2002-325595<br>バイオジェン<br>特表 2004-508415<br>バンダービルト大学<br>特表 2003-521523<br>フォーク ワード ページ<br>特表 2004-501171<br>フリガム アンド ウィメンズ<br>ホスピタル、<br>エヌ ピー エス PHARM<br>特表平 07-506380<br>カリフォルニア大学<br>特表平 09-504790<br>コネチカット大学 ヘルス<br>センター<br>特表 2004-514113 | アカデミア シニカ<br>特開 2002-47298<br>アンティソマ リサ<br>ーチ<br>特表 2003-528156<br>エクシーズ<br>特表 2000-500749<br>エーザイ<br>特開 2002-95476<br>バイオイノベーション<br>特表 2001-523731<br>テキサス大学<br>特表 2002-520295<br>ニューヨーク大学 リ<br>サーチ ファウンデ<br>ション<br>特表 2004-500116<br>協和醗酵工業、渋谷<br>正史<br>特開 2003-261460 | ジョンソンアンドジョン<br>ソン、ハダシット メディ<br>カル リサーチ サービス<br>シズ<br>特表 2002-532407<br>イオニックス<br>特表平 11-505504<br>インサイト ジェノミッ<br>クス<br>特表 2003-504060<br>クリエイティブ バイオモ<br>レキュールズ、アメリカ合<br>衆国<br>特表平 08-505623<br>シー ブイ セラピュー<br>ティクス、ワシントン大学<br>特表 2003-508031<br>タカラバイオ、宝ホール<br>ディングス<br>W001/032899<br>デ モントフォート大学<br>特表平 09-501416<br>ネオルクス<br>特表平 09-505599<br>プリズム PHARM<br>特表平 09-510352<br>ロジャー エス キュビッ<br>チョティ<br>特表 2000-511513 |
| 受容体の利用   |  |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       |                                                                                                                                                                                                                                                                          |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         |
|          |  |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       |                                                                                                                                                                                                                                                                          |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         |



表 1. 4. 2-6 能動的標的化技術の課題・解決手段と出願人 (4/12)

| 課題      |          | 患部の識別                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     | 患部での薬効発現                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |
|---------|----------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 解決手段    |          | がんの識別                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      | その他疾患の識別                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            | その他のがんの治療                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     | その他の疾患の治療                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       |
|         |          |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |
| 生体反応の利用 | レセプターの利用 |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            | サウス フロリダ大学<br>特表平 10-506879<br>リーランド スタンフォード<br>ジュニア大学、ベクトン<br>ディッキンソン<br>特表平 09-504693<br>久光製薬<br>W096/028188<br>第一製薬<br>特開平 09-235292                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |
| 生体反応の利用 | リガンドの利用  | トランスジェン(2)<br>特開 2002-320475<br>特開 2002-330774<br>イミュネックス<br>特表平 09-502174<br>イムノーゼン<br>特表 2003-514903<br>オニックス PHARM<br>特表平 09-505735<br>カタリーナ スヴァンボル<br>イ、ペル アンダーシュ<br>ホーカンソン<br>特表 2001-524535<br>ジョージタウン大学、シ<br>ナーゼン セラピュー<br>ティックス<br>特表 2002-537318<br>ジョーンズ ホプキンズ大<br>学<br>特表平 08-508396<br>ジラ<br>特表 2003-525044<br>ダイアックス<br>特表 2003-530327<br>テムド トラスト<br>特表平 10-508003<br>ドイチェス クレブスフォ<br>ルシュンクスツェントルム<br>スチフトウ、モア リサー<br>チ アプリケーションズ<br>特表 2004-513074<br>トランジエヌ<br>特表 2003-522183<br>バイオフィジカ<br>特表平 10-510845<br>バーナム INST<br>特表 2003-516744<br>ブリストル マイヤーズ<br>スクイブ<br>特表 2002-532440<br>プロ ダクト ヘルス<br>特表 2003-532690<br>メルク<br>特開平 08-099901<br>テキサス大学<br>特表 2002-520297<br>癌研究会<br>特開 2000-279178<br>三共<br>特開 2004-002826<br>三菱化学<br>W000/054807<br>大塚製薬<br>W000/023476<br>科学技術振興機構<br>特開 2001-309790<br>日本メジフィジックス<br>特開平 08-053494<br>宝酒造<br>特開平 06-172203 | ジェネンテック(3)<br>特開 2004-097224<br>特開 2004-113239<br>特表 2003-505020<br>イミュノメディックス(2)<br>特表平 08-509226<br>特表平 11-507046<br>リーズ大学(2)<br>特表 2002-541064<br>特表 2004-506439<br>ラ ホヤ キャンサー リ<br>サーチ ファウンデーショ<br>ン(2)<br>特開 2003-155296<br>特表平 10-502674<br>野口研究所(2)<br>特開 2001-261706<br>特開 2001-278899<br>産業技術総合研究所(2)<br>特開 2003-226638<br>特開 2003-226647<br>アルニス バイオサイエン<br>シーズ<br>特表 2004-500438<br>イエナファルム<br>特開 2003-061693<br>イマアーレクス PHARM<br>特表平 11-507638<br>イントロヘーネ<br>特表平 11-510050<br>エーバーハルトーカルル<br>スー大学<br>特表 2004-503214<br>エピサイト PHARM<br>特表 2001-511122<br>エール大学<br>特表 2001-510691<br>オックスフォード バイオ<br>メディカ ユー ケイ<br>特表 2001-524971<br>キャンサー リサーチ テ<br>クノロジー<br>特表 2004-524821<br>ギリード サイエンシズ<br>特表平 11-504926<br>グリコテック<br>特表 2001-517427<br>ケース ウェスタン リ<br>ザーブ大学<br>特表 2003-522117<br>サングスタット メディカ<br>ル<br>特表平 10-511989<br>サントル ナショナル ド<br>ラ ルシエルシュ シャン<br>ティフィツ、アンスチ<br>バストウール ドゥ リー<br>ル<br>特表 2003-506335<br>ジェンザイム<br>特表 2003-532368 | ブリストル マイヤーズ<br>スクイブ(2)<br>特開平 06-025012<br>特開平 07-070175<br>ユー エイ ビー リサー<br>チファウンデーション(2)<br>特表 2000-500438<br>特表 2002-537347<br>アクセス PHARM<br>特表 2003-530317<br>ウエルカム ファウンダー<br>ション<br>特表平 09-501147<br>エドワーズ カタリナ、<br>カールソン ヨルゲン、ス<br>ヨバーク ステファン<br>特表 2001-525356<br>かずさディー エヌ エー<br>研究所、中外製薬<br>W02002/052008<br>グリーンビル ホスpital<br>システム<br>特表 2004-504272<br>シュイルマッハー フォル<br>カー、リトル メルビン、<br>ローデ ハンスーユルゲン<br>特表平 09-510089<br>センター フォー モレ<br>キュラー メディシン ア<br>ンド イミュノ<br>特表平 10-503478<br>バイエル<br>特表 2003-508497<br>パーチュール リサーチ<br>ファウンデーション<br>特表 2003-528924<br>フォルシュングスツェント<br>ルム カールスルーエ<br>特表 2002-506657<br>ヘルス リサーチ<br>特開平 06-157336<br>メダレックス<br>特表平 09-510201<br>リサーチ DEV ファン<br>デーション<br>特表平 08-501059<br>小野薬品工業<br>特開平 07-316200<br>辻 彰、大鵬薬品工業<br>特開平 11-080017 | アイシス PHARM<br>特表 2003-501487<br>アクティノバ<br>特表 2003-517021<br>サノフィ・アベンテス<br>特開平 10-004979<br>アメリカ合衆国<br>特許 3474574<br>ジョーンズ ホプキンズ大<br>学<br>特表平 11-505505<br>スクリツプ リサーチ<br>INST<br>特表 2000-506854<br>スタート テクノロジー<br>パートナーシップ<br>特表平 08-504766<br>ターボテック<br>特表平 09-510696<br>ファーマシューティカル<br>ディスカバリー<br>特表平 08-510999<br>プリズム PHARM、フィッ<br>ター INST フォー ダイ<br>アペーティス<br>特表平 09-503751<br>ヘキスト<br>特表平 10-507626<br>マリノクロド<br>特表平 11-507342<br>ムーアフィールドズ アイ<br>ホスピタル エヌ エイチ<br>エス トラ、インスチ<br>オブ オフサルモロジー<br>ロンドン大学<br>特表 2004-518649<br>メルク<br>特表 2004-504349<br>カリフォルニア大学<br>特表平 07-507689<br>カンザス大学<br>特表 2004-505029<br>バーモント大学<br>特表平 10-501210<br>メディシン アンド デン<br>ティストリー大学<br>特表平 10-501403<br>科学技術振興機構<br>特開 2003-002843<br>協和醗酵工業、土田 邦博<br>特開 2003-113111<br>三菱化学<br>W000/061114 |

表 1.4.2-6 能動的標的化技術の課題・解決手段と出願人 (5/12)

| 課題      |        |         | 患部の識別                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        | 患部での薬効発現  |           |
|---------|--------|---------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------|-----------|
| 解決手段    |        |         | がんの識別                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       | その他疾患の識別                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               | その他のがんの治療 | その他の疾患の治療 |
|         |        |         |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |           |           |
| 生体反応の利用 | 受容体の利用 | リガンドの利用 | ジェンベック<br>特表 2003-534806<br>シブテック<br>特表 2004-516809<br>ジリード サイエンス<br>特表 2003-505111<br>ステヒヒティング ポー<br>ル デ テヒニシェ ベ<br>テンシャツツペン、レイ<br>クス大学フロニンゲン<br>特表 2002-532384<br>グラクソ・スミスクライ<br>ン<br>特表 2004-512345<br>セモレックス<br>特表 2004-525973<br>セラテック<br>特表平 10-505835<br>セレクシス<br>特表平 09-504425<br>デー デー エス ド<br>ラ ッ グ デ リ バ リー<br>サービス ツール<br>特表 2002-521311<br>テルモ<br>特開 2004-231575<br>テンプル大学<br>特表平 11-502817<br>シンガポール国立大学<br>特表 2003-529560<br>ネオルツックス<br>特表平 07-507804<br>ネクスター PHARM<br>特表 2002-508387<br>ネーテック、小野薬品工<br>業<br>特開平 09-227600<br>ノージン ヨーロッパ<br>特表 2004-504359<br>ノバルティス、スクリッ<br>プス リサーチ INST<br>特表 2004-502450 | バイオクエスト<br>特開平 11-060603<br>バイオテック オーストラ<br>リア<br>特表 2002-543110<br>ブイ アイ テクノロジー<br>ズ<br>特表 2003-530554<br>ブラッコ INTERN<br>特表平 08-508048<br>メディサイエンスブラン<br>グ<br>特開 2002-003407<br>ユー エイ ビー リサー<br>チ ファウンデーション<br>特表平 10-501684<br>カリフォルニア大学<br>特表 2003-528891<br>コネチカット大学、ターボ<br>テック<br>特表平 10-504709<br>テキサス大学<br>特表 2004-515751<br>リーランド スタンフォー<br>ド ジュニア大学<br>特表平 09-509826<br>レイクス大学レイデン、<br>ネーデル ハルトシュ<br>テヒヒティング<br>特表平 08-502726<br>ワトソン PHARM<br>特表 2003-516305<br>旭化成<br>特開 2003-192700<br>海藻資源研究所、ヤマキ<br>特開 2001-181213<br>味の素<br>W001/002851 |           |           |

表 1. 4. 2-6 能動的標的化技術の課題・解決手段と出願人 (6/12)

| 課題   |  | 患部の識別                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    | 患部での薬効発現                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |                                                                                                           |
|------|--|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 解決手段 |  | がんの識別                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          | その他疾患の識別                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           | その他のがんの治療                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     | その他の疾患の治療                                                                                                 |
|      |  | 東ソー (3)<br>特開平 06-62887<br>特開平 06-62889<br>特開平 06-62890<br>ダウ ケミカル (2)<br>特表 2002-504371<br>特表 2002-504372<br>ベーリンガー インゲルハ<br>イム INTERN、フォルシュ<br>ングスツェントルム カー<br>ルスルーエ (2)<br>特許 3387929<br>特表 2000-502067<br>大鵬薬品工業 (2)<br>特許 3461365<br>特許 3268147<br>イントラセル リソーシー<br>ズ エル エル シー<br>特表 11-508235<br>コロンビア大学<br>特表 2004-518630<br>サイクロン、カリフォル<br>ニア大学<br>特表 07-506484<br>サントル ナショナル ド<br>ラ ルシエルシュ シャン<br>ティフィツ<br>特表 2002-543811<br>ジェネンテック<br>特許 3398382<br>メルク<br>特表 08-504088<br>モレキュラー ディスカ<br>ヴァリーズ<br>特表 2003-508355<br>ラコウィックズルチェン<br>スカー エバ エム<br>特表 09-506428<br>ルードヴィッヒ INST<br>フォア キャンサー リ<br>サーチ、メモリアル ス<br>ローナーケッタリング<br>キャンサー センター<br>特許 3541296<br>ルードヴィッヒ INST<br>フォア キャンサー リ<br>サーチ<br>特表 11-506435<br>国立がんセンター総長<br>特開 2003-174885<br>出光興産<br>特開平 06-339392<br>森永製菓<br>特開平 07-126299<br>真弓 忠範、中外製薬<br>特開平 10-30000<br>清水 信義、シバヤギ<br>特開平 07-216000<br>萩原 義秀<br>特開平 06-141884 | アストラゼネカ<br>特表 08-502246<br>インペリアル キャンサー<br>リサーチ テクノロジー<br>特表 08-506239<br>ウエルカム ファウンデー<br>ション<br>特表 10-508482<br>エーティーラボ、杉山 俊<br>博<br>特開 2003-212900<br>ジョーンズ ホプキンス大<br>学<br>特表 11-508125<br>ダナーファーバー キャン<br>サー INST<br>特表 09-502089<br>ディアクロン ア ディレ<br>クトワール エ コンセイ<br>ユ ド<br>特開平 08-291199<br>ノースウエスト バイオセ<br>ラビューティクス<br>特表 2002-506629<br>ビレックス<br>特表 2004-522447<br>ベス イスラエル ディー<br>コネス メディカル セン<br>ター、ダナーファーバー<br>キャンサー INST<br>特表 2004-501165<br>メダレックス<br>特表 2003-532409<br>カリフォルニア大学<br>特表 2003-513027<br>科学技術振興機構<br>特許 3154564<br>麒麟麦酒<br>W02002/057316 | アメリカ合衆国<br>特表 10-508202<br>イムノージェン<br>特開平 06-056697<br>オーストラリアン ナシヨ<br>ナル大学<br>特許 3490443<br>オンコロジクス<br>特表 08-504172<br>メルク<br>特開平 07-223968<br>モノクローナル アンチボ<br>ディーズ セラビューティ<br>クス エム<br>特表 2003-520250<br>イリノイ大学ファウンデー<br>ション<br>特表 07-507202<br>森永製菓<br>特開平 07-126187<br>清水 信義、シバヤギ<br>特開平 10-084959<br>東レ<br>特開平 09-110722 | イミュノテク パートナー<br>ズ<br>特開平 06-321809<br>サイティミューン サイエ<br>ンシーズ<br>特表 2002-503639<br>ビッツバーグ大学<br>特表 09-7508007 |

表 1.4.2-6 能動的標的化技術の課題・解決手段と出願人 (7/12)

| 課題<br>解決手段 | 患部の識別                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 | 患部での薬効発現                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |
|------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|            | がんの識別                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      | その他疾患の識別                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        | その他のがんの治療                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    | その他の疾患の治療                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       |
| 生体反応の利用    | ヒト化抗体の利用                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |
|            | <p>中外製薬<br/>特開平 08-169900<br/>興和、名古屋大学学長<br/>特開平 06-205689</p>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             | <p>アブジェニックス<br/>特表平 11-505107</p>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               | <p>アメリカ合衆国<br/>イミヌメディックス<br/>特開 2004-115529</p>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |
| 生体反応の利用    | 抗体の利用                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |
|            | <p>その他の抗体の利用</p> <p>ルードビッヒ INST<br/>フォー キャンサー リ<br/>サーチ (4)<br/>特表 2003-500072<br/>特表 2003-512057<br/>特表 2003-527826<br/>特表平 11-508767<br/>ルードビッヒ INST<br/>フォー キャンサー リ<br/>サーチ、レイクス大学レイ<br/>デン<br/>特表平 11-506904<br/>ルードビッヒ INST<br/>フォー キャンサー リ<br/>サーチ、メモリアル ス<br/>ローン-ケッタリング<br/>キャンサー センター、ス<br/>クリップス リサーチ<br/>INST<br/>特表 2003-527334<br/>アジェンシス (2)<br/>特表 2003-512842<br/>特表 2003-517306<br/>コリクサ (2)<br/>特表 2002-532093<br/>特表 2004-524003<br/>アイシス イノベーション<br/>特表平 08-506801<br/>アストラゼネカ<br/>特表平 09-506507<br/>アメリカ合衆国<br/>特表平 10-505481<br/>イージェニックス<br/>特表平 08-506815<br/>イミヌメディックス<br/>特表 2004-523205<br/>イーライ リリー<br/>特開平 06-217790<br/>インスチ. フュア ディ<br/>アグノスティックフォル<br/>シュング<br/>特表平 09-508352<br/>キャンサー リサーチ<br/>INST オブ コントラ コ<br/>スタ<br/>特表平 09-503901<br/>ジェネンテック、イムノゲ<br/>ン<br/>特表 2003-503365<br/>セント ヴィンセンツ ホ<br/>スピタル シドニー<br/>特表 2002-542768<br/>ダイアデクスアス<br/>特表 2004-501613<br/>ダブリュ アル グレー<br/>ス、メディカル カレッジ<br/>オブ ペンシルベニア<br/>特開平 07-138296</p> | <p>ジェネンテック (3)<br/>特表平 11-504007<br/>特表 2000-503204<br/>特表 2003-534292<br/>カイロン (2)<br/>特開 2003-081871<br/>特表平 09-509329<br/>ペーリンガー インゲルハ<br/>イム INTERN (2)<br/>特表 2002-513556<br/>特表 2003-530092<br/>科学技術振興機構 (2)<br/>特開 2001-316298<br/>特開 2003-286189<br/>オックスフォード バイオ<br/>メディカ ユー ケイ<br/>特表 2003-515323<br/>キャンサー リサーチ テ<br/>クノロジー<br/>特表平 09-505737<br/>ケイ エス バイオメ<br/>ディックス<br/>特表 2003-513985<br/>コペンハーゲンズ大学<br/>特表平 11-510375<br/>ジェネティクス INST<br/>特表 2003-520828<br/>ゾナジェン<br/>特表平 07-507570<br/>ダイアタイド<br/>特表平 11-503420<br/>ディ ディ エス研究所、<br/>明治製菓、旭化成<br/>W098/031392<br/>デイド ペーリング マル<br/>ブルク<br/>特開平 06-133768<br/>ネオルクス<br/>特表平 09-506106<br/>ノバルティス<br/>特表 2004-514433<br/>ヒューマン ジノーム サ<br/>イエンス、ケンブリッ<br/>ジ アンティボディー テ<br/>クノロジー グループ<br/>特表 2004-509615<br/>フィロジェン<br/>特表 2003-523406<br/>ヘルス プロテクション<br/>エージェンシー<br/>特表 2003-513941<br/>オクラホマ州立大学<br/>特表 2003-535063<br/>メルク<br/>特許 3481948<br/>ユニバーシティ オブ メ<br/>ディシン アンド デン<br/>ティストリー<br/>特表平 08-504098</p> | <p>アイデツク PHARM (2)<br/>特許 3095175<br/>特表 2003-513937<br/>スローン ケタリング<br/>INST フォー キャンサー<br/>リサーチ (2)<br/>特表 2002-516297、<br/>特表 2003-535913<br/>イミヌメディックス<br/>特表 2002-531523<br/>イムクロン システムズ<br/>特表平 11-507535<br/>イムノージェン<br/>特表 2004-520450<br/>エム セー アー DEV、<br/>ボーチャート ポール<br/>イー、ブリーゼンドープ<br/>ヒューバート エム、クア<br/>ドリ サイド エム<br/>特表 2002-509122<br/>キャンサー リサーチ<br/>キャンペーン テクノロ<br/>ジー<br/>特表平 09-510605<br/>グラクソ スミスクライン<br/>特表 2003-527441<br/>ケイ エス バイオメ<br/>ディックス<br/>特表 2002-524470<br/>ケンブリッジ アンティボ<br/>ディー テクノロジー<br/>特表 2002-519065<br/>コリクサ<br/>特表 2002-507387<br/>シェーリング ブラウ<br/>特表 2004-518717<br/>トーテリン ヴラディミ<br/>ール ピー、アイアコブレ<br/>オニド ズイー<br/>特表平 10-505819<br/>ネオルクス<br/>特表平 09-506594<br/>ノボリティックス<br/>特表 2002-529521<br/>ブフィツエンマイアー ク<br/>ラウス、バヤント ハラル<br/>ド<br/>特表 2004-508819<br/>ブリストル マイヤーズ<br/>スクイブ<br/>特表平 09-509043<br/>モロ リカード ジェイ<br/>特表平 11-511847<br/>テキサス大学<br/>特表 2002-543093 パー<br/>ニア大学<br/>特表 2002-524533</p> | <p>イミヌメディックス (3)<br/>特許 3095415<br/>特表平 10-509425<br/>特表平 09-505799<br/>アクゾ ノーベル (2)<br/>特表平 06-507918<br/>特開平 06-157350<br/>イーヴァン フリードリッ<br/>ヒ ベネス<br/>特開平 11-322634<br/>インベリアル キャンサー<br/>リサーチ テクノロジー<br/>特表平 08-509460<br/>ジェネンテック<br/>特表平 09-512163<br/>ジェンザイム<br/>特表 2004-505607<br/>ダウ CHEM<br/>特表平 07-505886<br/>ダナーファーマー キャン<br/>サー INST<br/>特表平 10-501681<br/>ナビ<br/>特表 2002-531421<br/>ハーバート ピルグリム<br/>特許 3436760<br/>ヘルス プロテクション<br/>エージェンシー<br/>特表 2002-529093<br/>マツムラ ケネス ナオユ<br/>キ<br/>特表平 06-508373<br/>カリフォルニア大学<br/>特表 2004-525858<br/>ロッシュ<br/>特許 3066983</p> |

表 1.4.2-6 能動的標的化技術の課題・解決手段と出願人 (8/12)

| 課題      |           | 患部の識別                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |                                                                                                                                                                                               | 患部での薬効発現                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |                                                                                                                                                                                                                                                                          |
|---------|-----------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 解決手段    |           | がんの識別                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             | その他の疾患の識別                                                                                                                                                                                     | その他のがんの治療                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             | その他の疾患の治療                                                                                                                                                                                                                                                                |
|         |           | トランジェーヌ<br>特表平 10-505745<br>バイオ テク ノ ロ ジー<br>ジェネラル<br>特表 2004-524023<br>マヨ ファウンデーション<br>フォー メディカル エ<br>デュケーション<br>特表 2003-524587<br>アバディーン大学<br>特表 2002-543765<br>リセンチア<br>特表平 09-511141<br>科学技術振興機構<br>特開 2001-218585<br>協和醗酵工業<br>W001/023431<br>相模中央化学研究所<br>特表 2000-516442<br>村松 喬<br>特開平 06-172218<br>東ソー<br>特開平 06-062888<br>同仁化学研究所<br>特許 2087396<br>扶桑薬品工業<br>W099/064591 | ロチェスター大学<br>特表 2003-530836<br>ロンドン大学<br>特表 2002-503677<br>ラモト<br>特表 2003-509020<br>リボソーム<br>特表 2003-514843<br>協和醗酵工業<br>特開 2004-000045<br>山之内製薬<br>特開平 07-228688<br>富士写真フイルム<br>特開平 06-256215 | ミネソタ大学<br>特表平 10-508868<br>レキシジェン PHARM<br>特表 2002-511432<br>ローヌ ブーラン ロー<br>ラー<br>特表平 08-508879<br>ロバーツ ジョゼフ、メ<br>ディカル エンチャーメス<br>特表平 09-502082<br>協和醗酵工業<br>W096/035451<br>生体科学研究所<br>特開平 07-206690                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |                                                                                                                                                                                                                                                                          |
| 抗体の利用   | その他の抗体の利用 |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |                                                                                                                                                                                               | コリクサ(2)<br>特表 2002-516659<br>特表 2002-543769<br>アイデック PHARM<br>特表 2003-535908<br>アメリカ合衆国<br>特表平 08-508252<br>アレクシス バイオテック<br>特表 2002-517517<br>イノジェネティクス<br>特表平 11-506915<br>ウイスター INST<br>特許 3541950<br>ゲムボックス<br>特表 2002-520293<br>コロンビア大学<br>特表平 11-510490<br>サイティック<br>特表 2004-525151<br>ジェンザイム、ストレス<br>ジェン バイオテクノロ<br>ジーズ<br>特表 2002-536344<br>ストレスジェン バイオテ<br>クノロジーズ<br>特表 2001-512749<br>ニューヨーク メディカル<br>カレッジ<br>特表 2002-533357<br>カリフォルニア大学<br>特表平 10-509702<br>ケンタッキー大学リサーチ<br>ファンデーション<br>特表平 11-500607<br>プリティッシュ コロンビ<br>ア大学<br>特表平 10-505755<br>ライデン大学 メディカル<br>センター<br>タノックス<br>特表 2002-528383<br>リサーチ DEV ファン<br>デーション<br>特表平 07-505882 | アクティブ バイオテック<br>特表 2001-510687<br>オクソン ファーマシンズ<br>特表 2004-509149<br>オーソ マクニール<br>PHARM<br>特表 2004-512030<br>カイロン<br>特表平 10-501136<br>トーマス ジェファーソン<br>大学<br>特表平 09-500902<br>パウダージェクト ヴァク<br>シンズ<br>特表 2004-522403<br>メルク<br>特表 2004-509846<br>シンシナティ大学<br>特表 2004-504264 |
|         | 生体反応の利用   |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |                                                                                                                                                                                               |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       |                                                                                                                                                                                                                                                                          |
| 免疫反応の利用 |           |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |                                                                                                                                                                                               |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       |                                                                                                                                                                                                                                                                          |
|         |           |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |                                                                                                                                                                                               |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       |                                                                                                                                                                                                                                                                          |

表 1. 4. 2-6 能動的標的化技術の課題・解決手段と出願人 (9/12)

| 課題      |                | 患部の識別                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   | 患部での薬効発現                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |
|---------|----------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 解決手段    |                | がんの識別                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             | その他疾患の識別                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          | その他のがんの治療                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        | その他の疾患の治療                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |
|         |                |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |
| 生体反応の利用 | アンチセンス RNA の利用 |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   | アイシス PHARM<br>特許 3527200                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          | ジョージタウン大学<br>特表平 10-506003<br>トーマス ジェファーソン大学<br>特表平 10-509878<br>バイオオーリアンスファーマ、サントル ナシオナル ド ラ ルシェルシュ シアンティフィファイツ、インスチ. グスタベルーシー アイジーアール<br>特表 2004-500018<br>イミュノファーマ<br>特表平 11-505113                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           | アイ シー エヌ PHARM<br>特表平 10-508312<br>イースト カロライナ大学<br>特表平 11-507218<br>ケース ウェスタン リザーブ大学<br>特表 2003-505518<br>サングスタット メディカル<br>特表 2003-500335<br>ジョーンズ ホプキンズ大学<br>特表 2000-511410<br>ビオブション<br>特表平 09-511143<br>リボザイム PHARM<br>特表平 09-509323<br>創薬技術研究所<br>特開平 09-110894                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |
|         | 遺伝子発現の利用       | ジェネンテック (4)<br>特開 2003-274980<br>特表 2004-520806<br>特表 2004-520808<br>特表 2004-520810<br>アイシス イノベーション<br>特許 2800850<br>カイロン、京都大学総長<br>特表 2003-516731<br>バイエル、インスチ. オブ ヴァイロロジー<br>特表平 07-508160<br>バイオン PHARM、エール大学<br>特表 2002-500001<br>ヒューマン ジェノム サイエンス<br>特表平 10-508484<br>フォルシュングスツェンtrum カールスルーエ<br>特表 2004-515221<br>マックス プランク G ツァ フェルデルンク デル ウィッセ<br>特表平 07-509477<br>ピツバーグ大学<br>特表 2003-527398<br>ルードビッヒ INST フォア キャンサー リサーチ<br>特表平 10-506537<br>佐々木 寛<br>特開 2003-289877<br>茶野 徳宏、岡部 英俊、池川 志郎<br>特開 2004-57003<br>富士写真フイルム<br>特開 2004-18484 | 協和醗酵工業 (2)<br>W001/068817<br>W001/098493<br>協和醗酵工業、野島 博<br>W001/025427<br>インサイト PHARM<br>特表 2002-541787<br>アルバータ大学<br>特表平 10-510046<br>キュラジェン、バイオジェン<br>特表 2003-507070<br>ゲッツエンバーク ロバート エイチ、バーンソン<br>ロバート アール<br>特表平 10-512158<br>ジェネラル ホスピタル、マサチューセッツ INST<br>オブ テクノロジー<br>特表平 08-510377<br>グラクソ スミスクライン<br>特表 2000-502890<br>ビクトリア大学マンチェスター校<br>特表 2001-520185<br>ヒューマン ジノーム サイエンス<br>特表 2003-515320<br>ファイザー<br>特開 2002-355051<br>プロスケリア、ハーバード大学、ケース ウェスタンリザーブ大学<br>特表 2004-507236<br>ベイラー カレッジ オブ メディシン<br>特表平 09-502094<br>ヘルス プロテクション エージェンシー<br>特表 2003-509476<br>テキサス大学<br>特表 2003-507076 | ベイラー カレッジ オブ メディシン (2)<br>特表平 08-508166<br>特表平 09-504784<br>リボファルマ (2)<br>特表 2004-519457<br>特表 2004-519458<br>ローヌ プーラン ローラー (2)<br>特表平 08-511162<br>特表平 11-514881<br>アンジオジーン、サントルドゥ ルシェルシュ デュ サントル オスピタリエ<br>特表 2001-504500<br>アンスチ. パスツール、アンスチ. ナシオナル ド ラ サンテ エ ド ラ ルシェルシュ、ピエール エ マリー キュリー大学 パリ、アシスタンスピュブリク オピトードゥ パリ<br>特表平 08-507757<br>ウエルカム ファウンダー ション<br>特表平 09-504957<br>エイ ジェイムズ ミクソン<br>特開平 11-187886<br>エフ ホフマン ラ ロシュ<br>特開平 06-209778<br>エムベーター ミュニヒ<br>バイオテクノロジー、ユニバーシティ テクノロジー<br>特表 2004-500049<br>カイロン<br>特表平 09-503740<br>カンジ<br>特表 2001-511815<br>サムヤン ジェネックス<br>特表 2004-504846 | エール大学 (2)<br>特表平 10-508181<br>特表平 11-507231<br>ジーン シアーズ (2)<br>特表平 09-508004<br>特表平 10-506261<br>アメリカ合衆国<br>特表平 09-505557<br>アン ゴー ジェン<br>特表 2003-509463<br>イミュソル<br>特表平 11-514855<br>カイロン<br>特表平 09-503920<br>ジー ピー シー バイオテック<br>特表 2001-512008<br>ジェネンテック<br>特表 2001-517437<br>セント エリザベスズ メディカル センター オブボストン<br>特表 2001-511462<br>ノバルティス<br>特表 2004-510741<br>プロテイン ニックス<br>特表平 10-502333<br>ベイラー カレッジ オブメディシン<br>特表 2003-512010<br>マイアミ大学、リーランドスタンフォード ジュニア大学、バーレット リチャード ジェイ、ランドー トーマス エイ<br>特表 2003-502288<br>ルイヴィル大学 リサーチファウンデーション<br>特表 2003-517311<br>リジェネレーション テクノロジーズ<br>特表 2003-505205<br>サノフィ・アベンティス<br>特表平 10-502533<br>ローラント クロイツァー、シュテファン リメル<br>特表 2003-502012 |



表 1. 4. 2-6 能動的標的化技術の課題・解決手段と出願人 (10/12)

| 課題<br>解決手段 |          |              | 患部の識別                  |          | 患部での薬効発現                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |                                                                                                                                                                                                                                                                                              |
|------------|----------|--------------|------------------------|----------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|            |          |              | がんの識別                  | その他疾患の識別 | その他のがんの治療                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               | その他の疾患の治療                                                                                                                                                                                                                                                                                    |
| 生体反応の利用    | 遺伝子発現の利用 | その他の遺伝子発現の利用 |                        |          | ジェネラル ホスピタル、ボストン大学、ダナーファーマー キャンサー INST<br>特表平 10-504308<br>シドニー キンメル キャンサー センター<br>特表平 09-512554<br>セント ジュード チルドレンズ リサーチ ホスピタル<br>特表平 11-514225<br>トランジエヌ<br>特表平 09-502993<br>バレンティス<br>特表 2002-524036<br>ピエル ファブル メディカマン<br>特表 2003-516126<br>プロシオン バイオファルマ<br>特許 2806634<br>ヘキスト<br>特表平 10-506526<br>アーカン大学<br>特表 2003-512036<br>マクギル大学<br>特表 2002-539760<br>ピエール エ マリー キュリー大学 パリ<br>特表平 10-506007<br>リサーチ DEV ファンデーション<br>特表 2002-534396<br>レアト<br>特表平 11-506340<br>ワイス<br>特表 2004-509909<br>協和醗酵工業<br>W02002/024227 | ファイザー<br>特表 2003-502321<br>桜川 宣男、内田 彩子、エスアールエル<br>特開 2003-125759<br>大阪府、麒麟麦酒<br>特開平 07-097328<br>武田薬品工業<br>特開 2002-355060                                                                                                                                                                    |
|            |          |              | 前田 浩、東レ<br>W000/076496 |          | セライト<br>特表 2003-520251                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  | マックス プランク G<br>ツァ フェルデルンク デル ウィッセ (2)<br>特表平 11-509412<br>特表平 10-501402<br>エス アール アイ<br>INTERN<br>特表平 11-506302<br>センター フォー モレ<br>キュラー メディシン ア<br>ンド イミュノ<br>特表平 10-505866<br>サントル ナショナル ド<br>ラ ルシエルシュ シシア<br>ンティフィツ<br>マサチューセッツ ジェネ<br>ラル ホスピタル、モレ<br>キュラー サイエンスズ<br>INST<br>特表 2004-516848 |
|            |          |              | 促進剤の利用                 |          |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         |                                                                                                                                                                                                                                                                                              |

表 1. 4. 2-6 能動的標的化技術の課題・解決手段と出願人（11/12）

| 課題    |          | 患部の識別                                                                       |                                                                             | 患部での薬効発現                                                                                                                                                                    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         |
|-------|----------|-----------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 解決手段  |          | がんの識別                                                                       | その他の疾患の識別                                                                   | その他のがんの治療                                                                                                                                                                   | その他の疾患の治療                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |
| 担体の利用 | ベクターの利用  | ジョージタウン大学<br>特表 2001-513508<br>ユー エイ ビー リサーチ<br>ファウンデーション<br>特表 2003-509079 | アラーガン<br>特表平 10-500988<br>ヘモソル<br>特表 2002-513747<br>大石 孝昭<br>特開 2003-096093 | グラスゴー大学、ウイスター INST<br>特表平 10-503766<br>カンジ<br>特表平 11-506315<br>ジョージタウン大学<br>特表平 11-506931<br>バージニア大学<br>特表 2003-527128<br>トクシメト<br>特表 2003-533203<br>長崎大学<br>特開 2004-236505 | アビジエン<br>特表平 11-514215<br>カイロン<br>特表 2001-514235<br>カイロン、アイオワ大学リサーチ<br>ファウンデーション<br>特表 2003-534787<br>テヘテ LAB エセ ア<br>デ セ ウベ<br>特表 2004-500040<br>トランスジーン、ヨーロピ<br>アン モレキュラー バイ<br>オロジー LAB エー エ<br>ム<br>特表 2003-508057<br>ノバルティス<br>特表 2002-507382<br>モンドゲン<br>特表平 11-505114<br>ロッシュ デイアグノス<br>ティクス<br>特表平 09-511405<br>ローヌ プーラン ロー<br>ラー、アンスチ ナシオ<br>ナル ドラ サンテ エ<br>ド ラ ルシエルシュ<br>特表平 08-509208<br>久光製薬<br>W001/052901 |
|       | リポソームの利用 |                                                                             |                                                                             | リポテック<br>特表 2004-510811                                                                                                                                                     | ボストン大学<br>特表平 11-506755<br>ラージ スケール バイオ<br>ロジー、エス アール ア<br>イ INTERN<br>特表 2002-507567<br>アロネックス PHARM<br>特表 2004-522770                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |
|       | キャリアーの利用 |                                                                             | モンドゲン<br>特表平 11-505114                                                      |                                                                                                                                                                             | ジェネラル ホスピタル<br>特表平 07-509467<br>タカラバイオ<br>特開 2005-52001<br>ウォルター アンド イラ<br>イザ ホール INST オブ<br>メディシン<br>特表 2003-0512435<br>サイエンティフィック<br>DEV アンド リサーチ、<br>モートン アラン ジョセ<br>フ<br>特表 2003-514842                                                                                                                                                                                                                             |



表 1. 4. 2-6 能動的標的化技術の課題・解決手段と出願人（12/12）

| 課題       |              | 患部の識別 |          | 患部での薬効発現  |                                                                                                                                                                                                                                     |
|----------|--------------|-------|----------|-----------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 解決手段     |              | がんの識別 | その他疾患の識別 | その他のがんの治療 | その他の疾患の治療                                                                                                                                                                                                                           |
|          |              |       |          |           |                                                                                                                                                                                                                                     |
| 機械・器具の利用 | その他の機械・器具の利用 |       |          |           | エンハンス PHARM<br>特表 2003-507109                                                                                                                                                                                                       |
|          | 超音波の利用       |       |          |           | アンジェス エムジー<br>特開 2002-145784<br>イマアーレクス PHARM(2)<br>特表 2002-510278<br>特表平 09-501410<br>ジーイー横河メディカルシステム<br>特開 2000-204047<br>シェーリング<br>特表平 09-502191<br>ネブラスカ大学<br>特表 2002-520298<br>竹内 康人<br>特開 2001-081045<br>東芝<br>特開 2000-189521 |
|          | 物理的刺激の利用     |       |          |           | スコシア ホールディングズ<br>特表 2003-525942<br>バイオリテック<br>特表 2003-526405<br>ファーマサイクリクス、テキサス大学(2)<br>特表平 11-506452<br>特表平 10-508581<br>フォトゲン<br>特表 2002-522111<br>ライト サイエンシーズ<br>特表 2002-534483                                                  |
|          | その他の物理的刺激の利用 |       |          |           | ジェンデル(3)<br>特表 2003-505409<br>特表 2003-522140<br>特表 2003-523236                                                                                                                                                                      |

表 1.4.2-7 に能動的標的化の課題に対する解決手段の出願人を示す。直接送達方法開発に対して「その他の機械・器具の利用」に関しては、コア ハイブリッド テクノロジーズ、ビバスとユー エム ティーが各 2 件の出願をしている。さらに京都大学の田畑泰彦氏の出願が 1 件ある。

表 1.4.2-7 能動的標的化技術の課題・解決手段と出願人 (1/3)

| 課題         |           | 直接送達方法開発                                                                                                                                                                                                                                                                                           |                                                                                                                                                                                                                       |
|------------|-----------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 解決手段       |           |                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |                                                                                                                                                                                                                       |
| 促進剤の<br>利用 |           | 鳥居薬品<br>特開 2000-247902<br>久光製薬<br>特表 2001-064253                                                                                                                                                                                                                                                   |                                                                                                                                                                                                                       |
| マトリックスへの分散 |           | サイバス PHARM (2)<br>特表平 11-507357、特表平 11-507406<br>サンヤン (2)<br>特表 2001-509471、特表 2002-521346<br>太田製薬<br>特許 3469926<br>明治製菓<br>特開平 10-324642<br>森永乳業<br>特開 2000-063289<br>アストラゼネカ<br>特表平 07-508735                                                                                                    | 大正製薬<br>特表平 09-503782<br>ミシガン大学<br>特許 3054634<br>メイヨー ファウンデーション フォー メディカル エデュケーション<br>特表 2000-505430<br>高田 寛治<br>特表 2002-531394<br>イッサム リサーチ DEV CO オブ ザ ヒーブルー UN<br>特表 2003-514845<br>ジェンザイム、フォーカル<br>特表 2004-518664 |
| 担体の利用      | リポソームの利用  | オラソマル テクノロジーズ<br>特表 2002-500165                                                                                                                                                                                                                                                                    |                                                                                                                                                                                                                       |
|            | カプセルの利用   | ニチニチ製薬、森下仁丹 (2)<br>特開平 11-199494、特開平 11-199495<br>アラーガン<br>特表 2002-538098<br>アラージェニクス<br>特表 2002-506019<br>ウエスト ファーマシューティカル サービス<br>特表 2000-510100<br>エミスフェアー テクノロジーズ<br>特表平 09-504300<br>キティー<br>特開平 07-145082<br>ビジョン<br>特開 2004-018443<br>マサチューセッツ工科大学、ペン ステイト リサーチ ファウンデーション<br>特表 2000-511189 | ファイザー<br>特表 2002-525314<br>三生医薬<br>特開平 11-076369<br>森本 一洋、田畑 泰彦、ファイザー<br>特開 2000-256182<br>太陽化学<br>特開 2003-334062<br>大正製薬<br>特表平 09-504280<br>日本レダリー<br>特開平 11-012179<br>理研ヘルス<br>特開 2001-354555                      |
|            | キャリアーの利用  | アストラゼネカ<br>特許 3366640<br>アドバンスト インハレーション リサーチ<br>特表 2004-509141<br>オラファーマ<br>特表 2003-509367<br>コモンウェルス サイエнтиフィック<br>特表平 09-505060                                                                                                                                                                 | ツアン ハオ<br>特表 2004-513182<br>ベクチュラ<br>特表 2003-525081<br>メルク<br>特開 2000-256191<br>核内受容体研究所<br>特開 2003-128574                                                                                                            |
|            | エマルジョンの利用 | 太陽化学<br>特開 2003-334062                                                                                                                                                                                                                                                                             |                                                                                                                                                                                                                       |

表 1.4.2-7 能動的標的化技術の課題・解決手段と出願人 (2/3)

| 課題       |            | 直接送達方法開発                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |
|----------|------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 解決手段     |            |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |
| 担体の利用    | コーティング     | カネボウ (4)<br>特許 3187502<br>特許 3202053<br>特開平 05-186337<br>特開平 06-133735<br>田辺製薬 (3)<br>特開平 07-2650<br>特開平 07-10745<br>特開 2000-103732<br>大正製薬 (2)<br>特表平 11-506432<br>特表平 11-506433<br>エフ ホフマン ラ ロシュ<br>特許 2774080<br>エンズレル<br>特表 2003-534252<br>グラクソスミスクライン<br>特表平 10-511930<br>シャイア LAB<br>特表平 09-510708<br>ダンバイオシスト ユー ケー<br>特許 2986217<br>テイロツツ ファルマ<br>特表平 11-509523<br>ノージン リサーチ、ハーバード大学<br>特表 2003-512320<br>ノバルティス<br>特表平 09-501939<br>バイオダイナミック PHARM<br>特表平 11-506766 | ファルマシューティスク LAB フェルリング<br>特表平 09-500617<br>ペリオ プロダクツ<br>特表 2000-503316<br>マヨ ファウンデーション フォー メディカル エデュケーション<br>特表平 11-502842<br>メイヤー ジェームス エイチ<br>特表平 07-507546<br>メファ<br>特表 2004-507487<br>メルク<br>特表平 09-504276<br>カリフォルニア大学、アイメッド<br>特表 2002-534485<br>久光製薬<br>特開平 11-335269<br>協和醗酵工業<br>特開 2000-319166<br>大塚製薬)<br>特表 2001-23000<br>日本カラコン、住友製薬、三洋化成工業<br>特開 2004-051578<br>日本ペイント<br>特開平 07-082302<br>日本政策投資銀行<br>特開 2001-342127 |
| 機械・器具の利用 | カテーテルによる送達 | アムジェン<br>特表 2003-517020<br>アメリカ合衆国、コメディカス<br>特表平 10-502905<br>オレゴン ヘルス サイエンス大学<br>特表 2002-502822<br>コーディス<br>特開 2004-154541<br>サイティック<br>特表 2002-526422                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       | シェーリング<br>特表 2001-516730<br>バイオカーディア<br>特表 2003-529409<br>ルーベン レオ、バーンステイン デイビット<br>特表 2004-500906<br>堀 信一<br>特開平 06-056676                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |
|          | 磁性体の利用     | ジェイエスアール (3)<br>特開平 09-208788<br>特開平 10-087711<br>特開平 11-191509<br>エフ イー アール エックス (2)<br>特許 3176600<br>特許 3145120                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             | 科学技術振興機構<br>特開 2000-229844<br>ユクロ ヨーロピアン コントラクト リサーチ<br>特表 2003-528911                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |

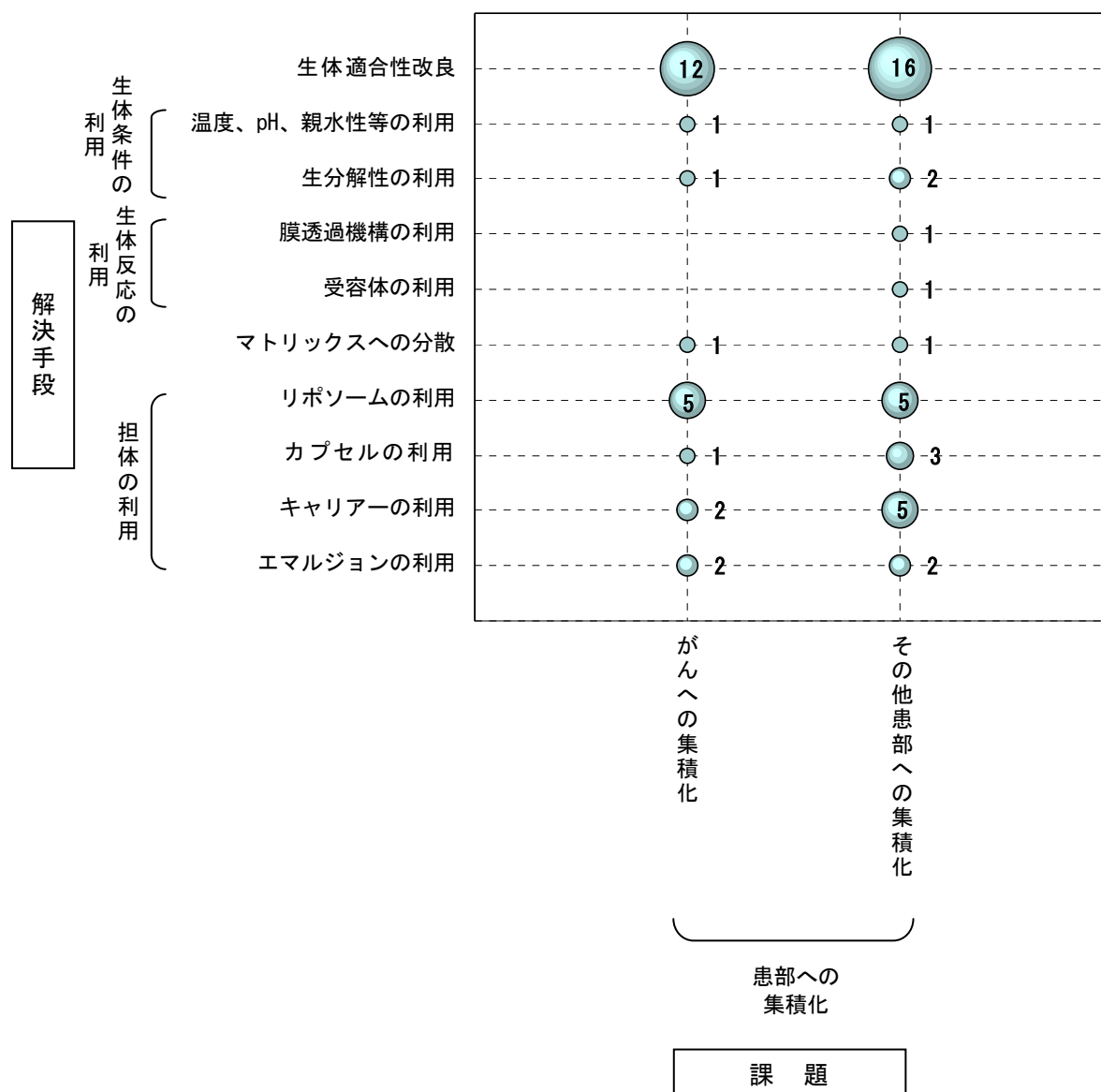
表 1.4.2-7 能動的標的化技術の課題・解決手段と出願人 (3/3)

| 課題       |          | 直接送達方法開発     |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
|----------|----------|--------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 解決手段     |          |              |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
| 機械・器具の利用 | 装置の利用    | その他の機械・器具の利用 | <p>ゴア ハイブリッド テクノロジーズ(2)<br/> 特表平 10-503964<br/> 特表平 10-503965<br/> ピバス(2)<br/> 特開 2003-212793<br/> 特表 2003-525844<br/> ユー エム ディー(2)<br/> 特表 2004-508296<br/> 特表 2004-519420<br/> アイシス PHARM<br/> 特表 2002-515513<br/> アトリック LAB<br/> 特表平 09-511741<br/> アバンテック バスキュラー<br/> 特表 2004-523275<br/> サノフィ・アベンティス<br/> 特開平 10-236984<br/> イクリプス サージカル テクノロジーズ<br/> 特開平 10-192414<br/> オメロス<br/> 特表 2003-505427<br/> オリンパス<br/> 特開 2003-210395<br/> キネテック<br/> 特表 2003-512318<br/> クアナム メディカル<br/> 特表 2002-519335<br/> グリュッスナー ウヴェ エミール クリスティアン<br/> 特表 2004-525666<br/> コーネル リサーチ ファウンデーション、ラーナー シドニー<br/> 特表 2004-506482<br/> サイトセラピューティクス<br/> 特表 2000-507854<br/> サンギ、国立感染症研究所長<br/> 特開 2004-35416</p> |
|          |          |              | <p>シュナイダー ユー エス エー<br/> 特表平 11-500047<br/> ジョーンズ ホプキンス大学<br/> 特表 2004-524866<br/> ダイレクト セラピューティクス<br/> 特表 2001-527051<br/> ニューワース ロバート エス<br/> 特表平 11-507353<br/> ネオルックス<br/> 特表平 11-500635<br/> ボシュ アンド ロム<br/> 特表 2001-516713<br/> ボストン サイエнтиフィック<br/> 特表 2001-514936<br/> ボストン サイエнтиフィック、セント エリザベス<br/> スィーズ メディカル センター<br/> 特表 2003-521275<br/> ボストン サイエнтиフィック、フレセニウス カビ<br/> 特表 2003-528129<br/> メディカル リサーチ カウンシル<br/> 特表 2004-518489<br/> メトリス セラピューティクス<br/> 特表 2003-531182<br/> ミシガン大学<br/> 特表平 08-509869<br/> ラビファム LAB<br/> 特表 2002-518417<br/> リーランド スタンフォード ジュニア大学<br/> 特表 2003-525913<br/> 田畑 泰彦、バイオメディカルセンター<br/> 特開 2003-081866<br/> 日本大学、アイアール<br/> 特開 2003-135588</p>         |
|          |          |              | <p>ネブラスカ大学(2)<br/> 特表 2000-507931<br/> 特表 2000-515499<br/> ブラッコ リサーチ<br/> 特表 2002-502829<br/> 立花 克郎、立花 俊郎<br/> 特開平 11-092360</p>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |
|          |          |              | <p>科学技術振興機構、神奈川科学技術アカデミー<br/> 特開 2002-316946</p>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |
| 物理的刺激的利用 | 物理的刺激的利用 | その他の物理的刺激的利用 | <p>ファークス(2)<br/> 特表 2002-500177<br/> 特表 2003-512336<br/> ヤクルト本社、ライフテクノロジー<br/> 特開平 09-143053</p>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |
|          |          |              |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |

## ②受動的標的化技術

図 1.4.2-4 に受動的標的化技術の課題に対する解決手段の分布を示す。受動的標的化技術の課題は、「がんへの集積化」と「その他患部への集積化」に集中している。がんへの集積化、その他患部への集積化に対して、両課題ともに、「生体適合性改良」で多く対応している。これは、ポリエチレングリコールなどを薬剤またはキャリアーに結合することで、異物とみなされて排除されることを防止して体内に長く循環させることによって、結果としてがんなどの患部に薬剤を集積させるものである。その他に、「リポソームの利用」や「キャリアーの利用」などの担体の利用で対応している。

図 1.4.2-4 受動的標的化技術の課題と解決手段の分布



1992 年 1 月～2002 年 12 月の出願

表 1.4.2-8 に受動的標的化の課題に対する解決手段と出願人を示す。出願が集中しているがんへの集積化に対して「がんへの集積化」に関して、三菱ウエルファーマが2件出願している。さらに熊本大学の前田浩氏、京都大学の田畑泰彦氏の出願がそれぞれ1件ある。

表 1.4.2-8 受動的標的化技術の課題・解決手段と出願人 (1/2)

| 課題<br>解決手段 | 患部への集積化                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |
|------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|            | がんへの集積化                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  | その他患部への集積化                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |
| 生体適合性改良    | 三菱ウエルファーマ (2)<br>特開平 08-053499<br>W095/024201<br>エム エル LAB<br>特表 2002-508758<br>ジョージタウン大学<br>特表 2002-535290<br>ドイチェス クレブスフォルシュンクスツェントルム<br>スチフトウ<br>特表平 11-508565<br>ニコメッド イマジング<br>特表平 08-502300<br>旭化成<br>W097/38727<br>生産開発科学研究所<br>特開平 09-235235<br>前田 浩<br>特開 2003-073273<br>第一製薬、デイ デイ エス研究所<br>特開平 11-092405<br>第一製薬<br>特開 2002-060351<br>田畑 泰彦<br>特開 2003-104914 | エフ ホフマン ラ ロシュ<br>特表 2002-517451<br>エミスフェア テクノロジーズ<br>特表平 10-507762<br>エンゾン<br>特表平 09-504299<br>カイロン<br>特表 2002-505338<br>デビオ ルシェルシュ PHARM<br>特表 2002-513055<br>ドイチェス クレブスフォルシュンクスツェントルム ス<br>チフトウ<br>特表平 11-503433<br>ネクター セラビューティックス エイエル<br>特表 2004-525212<br>フレゼニウス カビ ドイチュラント<br>特表 2004-525170<br>ノッティンガム大学、ヘント大学<br>特表平 09-511002<br>ユタ大学<br>特表 2000-500120<br>産業技術総合研究所<br>特許 2545729<br>大鵬薬品工業<br>特開平 10-236985<br>第一製薬<br>特開 2002-030002<br>日本油脂 (2)<br>特開平 08-092068<br>特開平 07-291853<br>日本油脂、三菱ウエルファーマ<br>特開 2004-196675 |
| 生体条件の利用    | 温度、 $pH$ 、<br>親水性等の利用                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    | マップ メディカル テクノロジーズ<br>特表 2002-527407                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |
|            | 生分解性の利用                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  | エフ ホフマン ラ ロシュ<br>特表 2002-502857                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |
| 生体反応の利用    | 膜透過機構の利用                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 | マサチューセッツ工科大学<br>特表平 09-504308<br>メディシン アンド デンティティストリー大学<br>特表 2002-506833                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |
|            |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          | バイオミラ<br>特表 2004-522717                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |

表 1.4.2-8 受動的標的化技術の課題・解決手段と出願人 (2/2)

| 課題<br>解決手段 |           | 患部への集積化                                                                                                                                    |                                                                                                                                            |
|------------|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|            |           | がんへの集積化                                                                                                                                    | その他患部への集積化                                                                                                                                 |
| 生体反応の利用    | 受容体の利用    |                                                                                                                                            | マリンクロドト<br>特表 2002-531377                                                                                                                  |
| マトリックスへの分散 |           | デイバーサ<br>特表 2004-523219                                                                                                                    | 武田薬品工業<br>特開平 07-206903                                                                                                                    |
| 担体の利用      | リボソームの利用  | 三共(2)<br>特開平 11-199488<br>特開 2001-026544<br>イネックス PHARM(2)<br>特許 3270478、<br>イネックス PHARM、テキサス大学<br>特表 2002-541088<br>日本精化<br>特開平 06-122634 |                                                                                                                                            |
|            | カプセルの利用   | シルテックス メディカル<br>特表平 09-508897                                                                                                              | ディデコ<br>特開平 11-005752<br>フラメル テクノロジー<br>特表平 11-503118<br>ナノファルム<br>特表 2001-502721                                                          |
|            | キャリアーの利用  | 小田切 優樹<br>特開平 06-293631<br>明治製菓<br>特表平 07-025764                                                                                           | エスアールエル<br>特開平 08-109142<br>コンジュシエム<br>特表 2001-522863<br>テクノネットワーク 四国<br>特開 2003-073258<br>テルモ<br>特開平 09-308484<br>武田薬品工業<br>特開平 07-097333 |
|            | エマルジョンの利用 | 日本農薬、第一製薬<br>特開平 08-301759<br>竜角散<br>特開 2004-113154                                                                                        | 神奈川科学技術アカデミー<br>特許 3499604<br>富山化学工業<br>特開平 08-217790                                                                                      |

### (3) 薬剤吸収制御技術

#### ①薬剤導入技術

図 1. 4. 2-5 に薬剤導入技術の課題に対する解決手段の分布を示す。薬剤導入技術で集中している課題は、「吸収促進化」である。

吸収促進化に対しては、「促進剤の利用」で集中して対応している。

一方、出願件数は多くないものの、患者の QOL を改善するために新規投与方法開発が課題となっており、マトリックスへの分散などの解決手段が用いられている。

図 1. 4. 2-5 薬剤導入技術の課題・解決手段の分布

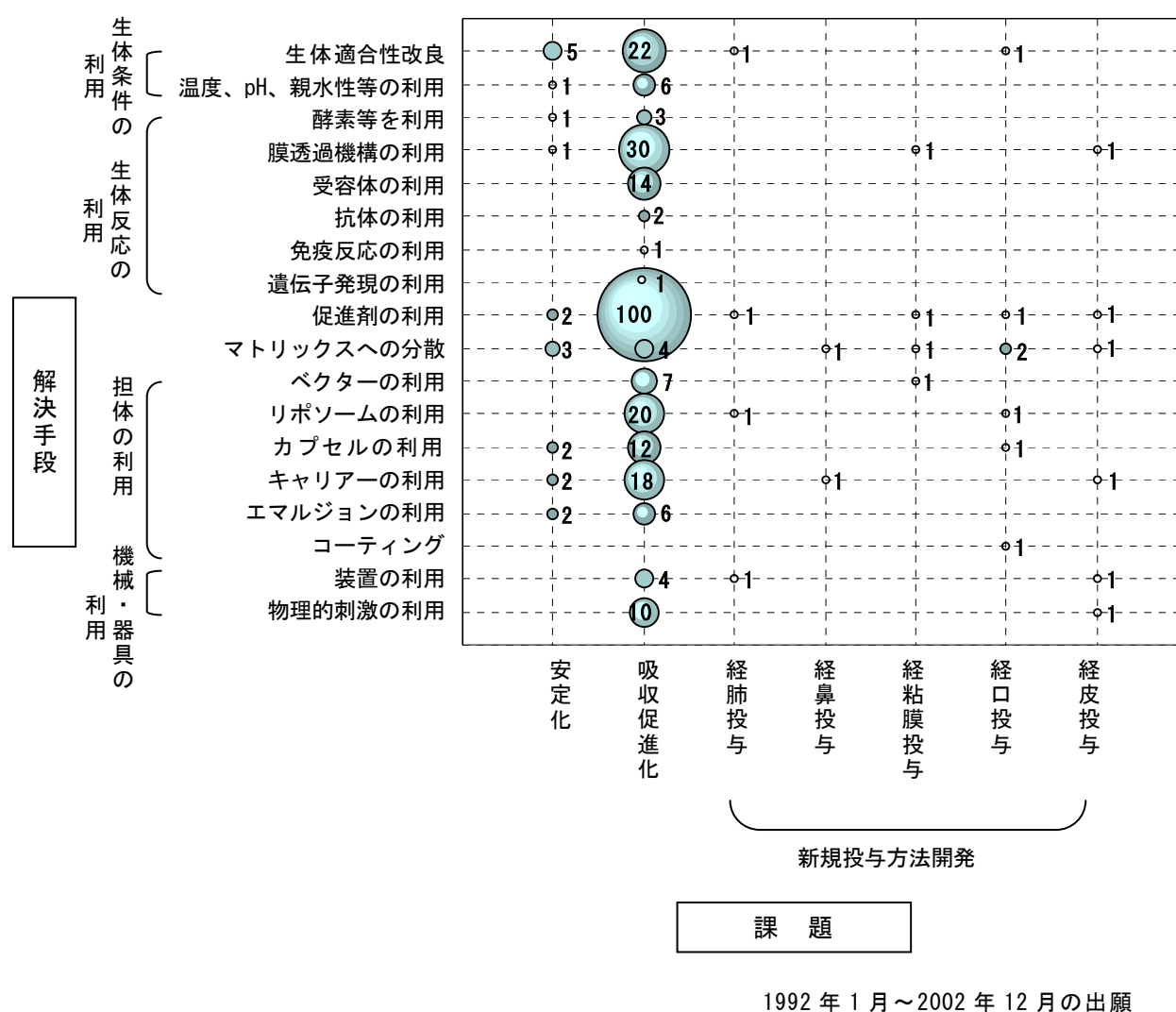


表 1. 4. 2-9 に薬剤導入技術の課題に対する解決手段の詳細を示す。出願が集中している吸収促進化の中でも、具体的には、「経粘膜吸収促進化」、「経皮吸収促進化」、「細胞内吸収促進化」、「その他の吸収促進化」に課題が集中している。

経粘膜吸収促進化と経皮吸収促進化に対しては、「その他の促進剤添加」で主に対処している。



細胞内吸収促進化に対しては、「リポソームの利用」によって対応している。その他の吸収促進化に対しては、生体適合性改良で対応している。

表 1.4.2-9 薬剤導入技術の課題・解決手段の分布

| 課題<br>解決手段 |               | 安定化 | 吸収促進化   |         |          |         |         |          |           | 新規投与方法開発 |      |       |      |      |
|------------|---------------|-----|---------|---------|----------|---------|---------|----------|-----------|----------|------|-------|------|------|
|            |               |     | 経肺吸収促進化 | 経鼻吸収促進化 | 経粘膜吸収促進化 | 経口投与促進化 | 経皮吸収促進化 | 細胞内吸収促進化 | その他の吸収促進化 | 経肺投与     | 経鼻投与 | 経粘膜投与 | 経口投与 | 経皮投与 |
| 生体適合性改良    |               | 5   |         | 1       |          |         | 2       | 7        | 12        | 1        |      |       | 1    |      |
| 生体条件の利用    | 温度、pH、親水性等の利用 | 1   |         | 1       | 3        |         | 1       | 1        |           |          |      |       |      |      |
|            | 酵素等の利用        | 1   |         |         |          | 1       | 1       |          | 1         |          |      |       |      |      |
| 生体反応の利用    | 膜透過機構の利用      | 1   | 1       |         | 2        |         | 1       | 17       | 9         |          |      | 1     |      | 1    |
|            | 受容体利用         |     |         |         | 2        |         |         | 6        | 6         |          |      |       |      |      |
|            | 抗体の利用         |     |         |         |          |         |         | 2        |           |          |      |       |      |      |
|            | 免疫反応の利用       |     |         |         |          |         |         | 1        |           |          |      |       |      |      |
|            | 遺伝子発現の利用      |     |         |         |          |         |         |          | 1         |          |      |       |      |      |
| 促進剤の利用     | 胆汁酸添加         | 2   |         |         | 1        |         | 1       | 1        |           |          |      |       |      |      |
|            | 毒素を添加         |     |         | 1       | 2        |         |         | 4        |           |          |      |       |      |      |
|            | ペプチド添加        |     |         |         | 2        |         | 1       | 8        |           | 1        |      |       |      |      |
|            | カチオン性脂質を添加    |     |         |         |          |         | 2       | 8        |           |          |      |       |      |      |
|            | 界面活性剤添加       |     |         |         | 2        |         | 3       | 1        |           |          |      | 1     |      |      |
|            | 有機物添加         |     |         |         | 4        |         | 7       | 4        |           |          |      |       |      | 1    |
|            | ビタミン添加        |     |         |         | 2        |         |         | 1        |           |          |      |       |      |      |
|            | 塩の添加          |     |         |         |          |         | 3       |          |           |          |      |       |      |      |
|            | 無機物添加         |     |         |         | 3        |         | 6       |          |           |          |      |       | 1    |      |
|            | その他の促進剤添加     |     | 1       |         | 10       |         | 13      | 9        |           |          |      |       |      |      |
| マトリックスへの分散 |               | 3   |         |         |          |         | 3       |          | 1         |          | 1    | 1     | 2    | 1    |
| 担体の利用      | ベクターの利用       |     |         |         |          |         |         | 5        | 2         |          |      | 1     |      |      |
|            | リポソームの利用      |     | 1       |         | 1        |         | 2       | 11       | 5         | 1        |      |       | 1    |      |
|            | カプセルの利用       | 2   |         | 1       |          |         | 4       | 3        | 4         |          |      |       | 1    |      |
|            | キャリアーの利用      | 2   | 4       |         | 1        |         | 2       | 3        | 8         |          | 1    |       |      | 1    |
|            | エマルジョンの利用     | 2   |         | 1       |          | 1       |         | 1        | 3         |          |      |       |      |      |
|            | コーティング        |     |         |         |          |         |         |          |           |          |      |       | 1    |      |
| 機械・器具の利用   | 装置の利用         |     | 1       |         |          |         | 2       |          | 1         | 1        |      |       |      | 1    |
|            | 物理的刺激の利用      |     | 1       |         |          |         | 5       | 1        | 3         |          |      |       |      | 1    |

表 1.4.2-10 に薬剤導入技術の課題・解決手段と出願人を示す。出願が集中している細胞内吸収促進化に対して「膜透過機構の利用」に関して、中外製薬が3件、カリフォルニア大学が2件出願している。細胞内促進化に対して「カチオンセリ脂質添加」に関して、プロメガ バイオサイエンシーズが3件出願している。

表 1.4.2-10 薬剤導入技術の課題・解決手段と出願人(1/7)

| 課題<br>解決手段 |               | 吸収促進化                                                                                  |                                                                |                                                                                                                                                                                                                           |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |
|------------|---------------|----------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|            |               | 経粘膜吸収促進化                                                                               | 経皮吸収促進化                                                        | 細胞内吸収促進化                                                                                                                                                                                                                  | その他の吸収促進化                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |
| 生体適合性改良    |               |                                                                                        | ジョンソンアンドジョンソン<br>特表平 11-507341<br>中川 百樹、富永 孝利<br>特開平 06-261934 | ベクトン ディッキンソン<br>特許 2506543<br>産業技術総合研究所、中西 守<br>特開 2003-040767<br>日本触媒<br>特開 2004-049214<br>バイオテック トゥールーズ<br>特表平 09-508099<br>エミスフェア テクノロジーズ<br>特表平 10-509433<br>アイシス PHARM<br>特表 2002-541089<br>テキサス大学<br>特表 2004-517800 | ノベックス (2)<br>特表 2002-522463<br>特表 2003-509385<br>シアウオーター<br>特表 2003-511357<br>ジェンブローブ<br>特表平 11-507031<br>シュベック ウルリヒ<br>特表 2004-524346<br>デイ ファーム<br>特表 2004-505898<br>ファルマシア<br>特表 2003-516394<br>ヘルス リサーチ、ジェネ トロニクス<br>特表 2003-523377<br>ムツク、旭硝子<br>特開平 11-116563<br>メディノバ メディカル<br>コンサルティング<br>特許 2930421<br>カリフォルニア大学<br>特表 2002-544243<br>南カリフォルニア大学<br>特表平 11-500108 |
|            | 温度、pH、親水性等の利用 | ユニジェン LAB<br>特許 3549542<br>イーノス PHARM<br>特表 2002-539257<br>アルタナ ファルマ<br>特表 2003-512329 | リブラサム ファーマ<br>特表 2003-530338                                   | ロス万 ジェームス イー<br>特表 2002-524536                                                                                                                                                                                            |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |
|            | 酵素等の利用        |                                                                                        | リブラサム ファーマ<br>特表 2003-530339                                   |                                                                                                                                                                                                                           | エンゾン<br>特表 2004-518776                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |

表 1.4.2-10 薬剤導入技術の課題・解決手段と出願人(2/7)

| 課題      |          | 吸収促進化                                                             |                                    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
|---------|----------|-------------------------------------------------------------------|------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 解決手段    |          | 経粘膜吸収促進化                                                          | 経皮吸収促進化                            | 細胞内吸収促進化                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      | その他の吸収促進化                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         |
|         |          |                                                                   |                                    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
| 生体反応の利用 | 膜透過機構の利用 | ナショナル ブラッド オーソリティー<br>特表平 11-504520<br>エラン<br>特表平 11-512451       | トランスダーマル テクノロジーズ<br>特表 2002-519366 | 中外製薬(3)<br>特開平 10-130168、特開 2001-213804、<br>W001/017511<br>カリフォルニア大学(2)<br>特表平 11-508240、特表 2000-507225<br>イムテック INTERN<br>特表 2002-523431<br>エムシーエス マイクロ キャリア システムズ<br>特表 2003-514564<br>エール大学<br>特表 2001-518295<br>サイクラセル<br>特表 2002-519392<br>スベイウッド LAB、マイクロバイオリジカル リサーチ オーソリティー<br>特表平 09-500867<br>トランスカリオティック セラピーズ<br>特表平 11-509084<br>バイオジェン<br>特許 2869396<br>ブリストル マイヤーズ スクイブ<br>特表 2003-500039<br>ハーバード大学長<br>特表 2000-510461<br>マイクロパック<br>特表平 09-510433<br>ローザンヌ大学<br>特表 2004-511494<br>科学技術振興機構<br>特開 2004-067563 | ムツク<br>特開平 07-188280<br>サノフィ・アベンティ<br>特開 2000-166579<br>神奈川科学技術アカデミー、三菱化学<br>特開 2001-302550<br>マサチューセッツ アイアンド イア インファーマリー、チルドレンズ メディカル センター<br>特表平 08-506807<br>ブラック キース エル<br>特表平 08-509978<br>シント イー エム<br>特表 2002-538080<br>スクリップ リサーチ INST<br>特表 2003-518077<br>オウ ジェシー エル エス、ウインティーズ エムジュローム<br>特表 2003-524624<br>マイクロバイオリジカル リサーチ オーソリティー<br>特表 2003-528157 |
|         | 受容体の利用   | アメリカ合衆国、ジェネンテック<br>特表 2003-512441<br>サイトジェン、エラン<br>特表 2002-504811 |                                    | 神奈川科学技術アカデミー<br>特開平 08-253430<br>アイ シー エヌ PHARM<br>特許 3516959<br>ペン ステイト リサーチ ファウンデーション<br>特表 2002-526397<br>アシロマー PHARM<br>特表 2002-532560<br>サノフィ・アベンティス<br>特表 2003-505517<br>シャンハイファームコ リサーチ、フダン大学<br>特表 2003-533555                                                                                                                                                                                                                                                                                                        | 大正製薬<br>特開平 07-316190<br>アメリカ合衆国<br>特表平 07-509250<br>ウォーセスター ファウンデーション フォー エクスペリメンタ<br>特表平 09-500102<br>アルカームズ、カリフォルニア大学<br>特表平 09-500381<br>パナセア バイオック<br>特表 2002-535266<br>スプラテック ファーマ<br>特表 2004-514410                                                                                                                                                        |
|         | 抗体の利用    |                                                                   |                                    | ユーカリオン<br>特表平 07-502753<br>カリフォルニア大学<br>特表 2002-513156                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
|         | 免疫反応の利用  |                                                                   |                                    | アレクション PHARM<br>特表平 10-503647                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
|         | 遺伝子発現の利用 |                                                                   |                                    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               | ジェネンテック、アメリカ合衆国<br>特表平 10-512276                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |

表 1.4.2-10 薬剤導入技術の課題・解決手段と出願人(3/7)

| 課題     |           | 吸収促進化                                                         |                                                                                                                |                                                                                                                                                                                                                                                           |           |
|--------|-----------|---------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------|
| 解決手段   |           | 経粘膜吸収促進化                                                      | 経皮吸収促進化                                                                                                        | 細胞内吸収促進化                                                                                                                                                                                                                                                  | その他の吸収促進化 |
|        |           |                                                               |                                                                                                                |                                                                                                                                                                                                                                                           |           |
| 促進剤の利用 | 胆汁酸添加     | 久光製薬<br>特開 2000-247911                                        | ファーマーク ニーダーラ<br>ンド<br>特表 2001-508027                                                                           | メリーランド大学ボルティ<br>モア、ポリー ジェイムズ<br>イー、クーブ アンド<br>リュー、マエダ ディーン<br>ワイ、レンツ キンバリー<br>エイ<br>特表 2003-530329                                                                                                                                                        |           |
|        | 毒素添加      | メリーランド大学ボルティ<br>モア(2)<br>特開 2003-155253<br>特表平 11-505844      |                                                                                                                | ニューヨーク大学<br>特表 2000-502885<br>ハーバード大学<br>特表 2000-503004<br>バイオフアウシア<br>特表 2002-502399<br>マイクロバイオリジカル<br>リサーチ オーソリティー<br>特表 2003-522199                                                                                                                    |           |
|        | ペプチド添加    | アムジェン<br>特表平 09-508141<br>シント イー エム<br>特表 2002-531420         | ゼライス<br>特開 2001-302690                                                                                         | ブリストル マイヤーズ<br>スクイブ<br>特表 2002-530426<br>フォゲン<br>特表 2002-537828<br>エム エル LAB<br>特表 2002-544126<br>アレルゲン<br>特表 2003-502385<br>エラン<br>特表 2003-511464<br>バンダービルト大学<br>特表 2003-514852<br>インブリクス<br>特表 2003-530360<br>サノフィ・アベンティス<br>特表 2004-512275            |           |
|        | カチオン性脂質添加 |                                                               | アクティブ オーガニクス<br>特開 2002-128702<br>ピアスアライズ<br>特開 2003-267817                                                    | プロメガ バイオサイエン<br>シーズ(3)<br>特表平 11-507352<br>特表平 11-507815<br>特表平 11-510489<br>久光製薬、化学及血清療法<br>研究所<br>特開平 10-045630<br>サノフィ・アベンティス<br>特表 2002-513543<br>インビトロゲン<br>特表 2002-529439<br>セゴエー ペーテル<br>特表 2003-503363<br>バイオペクター セラ<br>ビューティクス<br>特表 2003-531181 |           |
|        | 界面活性剤添加   | ウエスト ファーマシュー<br>ティカル サービスズ<br>特表平 11-510506<br>特表 2001-523728 | ジョンソンアンドジョンソ<br>ン<br>特表平 11-512073<br>三養社、サム ヤン<br>特表 2001-517696<br>スリーエム イノベイティ<br>ブ プロパティ<br>特表 2004-513890 | 小野薬品工業<br>特開平 10-226650                                                                                                                                                                                                                                   |           |

表 1.4.2-10 薬剤導入技術の課題・解決手段と出願人(4/7)

| 課題     |        | 吸収促進化                                                                                                            |                                                                                                                                                                                                                                                |                                                                                                                            |           |
|--------|--------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------|
| 解決手段   |        | 経粘膜吸収促進化                                                                                                         | 経皮吸収促進化                                                                                                                                                                                                                                        | 細胞内吸収促進化                                                                                                                   | その他の吸収促進化 |
|        |        |                                                                                                                  |                                                                                                                                                                                                                                                |                                                                                                                            |           |
| 促進剤の利用 | 有機物添加  | 武田薬品工業<br>特開平 06-009424<br>シェーリング<br>特開 2000-290181<br>ジェネレクス PHARM<br>特表 2003-508421<br>セルゲート<br>特表 2003-523982 | ノーベン PHARM<br>特表平 09-511987<br>オーソマクニール<br>PHARM<br>特表平 10-500660<br>セラテック<br>特許 3228341<br>ウェスト ッファーマ<br>シューティカル サービス<br>ズ<br>特表平 10-508004<br>ミネソタ マイニング ア<br>ンド MFG<br>特表平 11-502836<br>ダーマテック<br>特表 2002-533384<br>セルゲート<br>特表 2003-507438 | シグマ タウ IND PHARM<br>リュニチ(2)<br>特表 2002-513779<br>特表 2002-541238<br>アルカームズ<br>特表 2002-538222<br>カリフォルニア大学<br>特表 2003-516306 |           |
|        | ビタミン添加 | バイオテック オーストラ<br>リア<br>特表 2002-518405<br>カウンスル オブサイエ<br>ンティフィック アンド<br>IND リサーチ<br>特表 2004-517103                 |                                                                                                                                                                                                                                                | バイオテック オーストラ<br>リア<br>特表 2003-506319                                                                                       |           |
|        | 塩の添加   |                                                                                                                  | ジョンソンアンドジョンソ<br>ン<br>特表平 11-504229<br>特表平 11-504237<br>ワトソン PHARM<br>特表 2003-532629                                                                                                                                                            |                                                                                                                            |           |
|        | 無機物添加  | 粟津 荘司、大西 俊正、<br>間 和之助、藤沢薬品工業<br>特開 2000-219641<br>アクセス PHARM<br>特表平 10-510831<br>アルク アペーロ<br>特表 2003-517452      | 相模中央化学研究所(2)<br>特開平 07-233177<br>特開平 11-092490<br>スンキョン I IND<br>特許 2847578<br>ジョンソンアンドジョンソ<br>ン<br>特表 2001-522793<br>ダーマトレンズ<br>特表 2004-500360<br>ボレッキイ イズリアル、<br>クリーザ ジョン イー<br>特表 2004-520337                                               |                                                                                                                            |           |

表 1.4.2-10 薬剤導入技術の課題・解決手段と出願人(5/7)

| 課題     |            | 吸収促進化                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         |                                                                                                 |
|--------|------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 解決手段   |            | 吸収促進化                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         |                                                                                                 |
|        |            | 経粘膜吸収促進化                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       | 経皮吸収促進化                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 | 細胞内吸収促進化                                                                                                                                                                                                                                                                                                                | その他の吸収促進化                                                                                       |
| 促進剤の利用 | その他の促進剤添加  | セラテック(2)<br>特表平 11-513982<br>特表平 11-513983<br>アイシス PHARM<br>特表 2002-537343<br>アドヘレックス テクノロ<br>ジーズ<br>特表 2003-524384<br>アルバート ティー ナイ<br>トー<br>特開平 05-339148<br>バイオヴェクター ソ<br>リューションズ<br>特表 2003-518135<br>ハーバード大学、オーガ<br>ニックス、ジェネラル ホ<br>スピタル<br>特開 2002-338569<br>メリーランド大学ボルティ<br>モア校<br>特表 2001-527572<br>小山 義之、片岡 一則、<br>岡野 光夫、中富 一郎<br>特開平 08-104651<br>天藤製薬<br>W000/016784 | ジョンソンアンドジョンソ<br>ン(2)<br>特表平 10-503184<br>特表 2002-531526<br>エミスフェア テクノロ<br>ジーズ<br>特表 2002-522413<br>オーソ マクニール<br>PHARM<br>特表 2000-509734<br>サノフィ・アベンティス<br>特表 2004-505049<br>セラテック<br>特開 2001-039865<br>セレジー PHARM<br>特表 2001-522804<br>ノボ ノルディスク<br>特表平 10-500415<br>パウダージェクト リサー<br>チ<br>特表 2002-535293<br>ブリストルマイヤーズ<br>スクイブ<br>特開平 07-002670<br>ミネソタ マイニング ア<br>ンド MFG<br>特表 2000-503638<br>ランバクシイ LAB<br>特表 2004-525859<br>リュファトルン エイチ<br>エフ、スターテンス セル<br>ミンスティチュト<br>特表平 09-508614 | 三和化学研究所<br>特開平 06-192107<br>オレゴン州<br>特表平 07-509227<br>フォトキュアー<br>特表平 10-508295<br>グラクソスミスクライン<br>特表 2001-515872<br>エミスフェア テクノロ<br>ジーズ<br>特表 2001-517694<br>ワシントン大学、マサ<br>チューセッツ大学<br>特表 2002-500201<br>ペンシルバニア大学<br>特表 2002-506046<br>ファウスタス フォース<br>シュングス シー トラン<br>スレイショナル<br>特表 2003-514529<br>メルク<br>特表 2004-501981 |                                                                                                 |
|        | マトリックスへの分散 |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                | テイ ティ エス技術研究<br>所<br>特開平 07-233054<br>久光製薬<br>特開 2000-219623<br>ナショナル スターチ ア<br>ンド CHEM インベストメ<br>ント<br>特表 2004-509222                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         | ロッタファーム<br>特表 2002-518434                                                                       |
|        | 担体の利用      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         | サノフィ・アベンティス<br>特表平 08-509373<br>バイオベクター セラ<br>ビューティクス<br>特表 2001-511440<br>ジェンザイム<br>特表 2002-508967<br>ベルナー ルビッツ<br>特表 2002-538198<br>オンコリティクス バイオ<br>テック<br>特表 2004-517966                                                                                                                                             | サントル ナシオナル ド<br>ラ ルシェルシュ シアン<br>ティフィツ<br>特表 2004-526670<br>カイロン、カリフォルニア<br>大学<br>特表 2002-539176 |

表 1.4.2-10 薬剤導入技術の課題・解決手段と出願人(6/7)

| 課題    |          | 吸収促進化                          |                                                                                                                           |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |
|-------|----------|--------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 解決手段  |          | 経粘膜吸収促進化                       | 経皮吸収促進化                                                                                                                   | 細胞内吸収促進化                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            | その他の吸収促進化                                                                                                                                                                                                                                                                                       |
|       |          |                                |                                                                                                                           |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |
| 担体の利用 | リボソームの利用 | ジェネレクス PHARM<br>特表 2003-508483 | アイシス PHARM<br>特表 2002-515514<br>服部 利光<br>特開 2000-229815                                                                   | ノヴォソム(2)<br>特表 2004-521917<br>特表 2004-525902<br>カリフォルニア大学(2)<br>特表平 09-501146<br>特表 2002-510713<br>インフェクティオ レ<br>シェーレ<br>特表平 10-506396<br>ジェンザイム、アイオワ大<br>学 リサーチ ファウン<br>デーション<br>特表平 11-511757<br>セルテック セラピュー<br>ティックス<br>特表 2002-511446<br>メガバイオス<br>特表平 09-505808<br>モントリオール大学<br>特表平 10-511363<br>ラメラ セラピューティ<br>クス<br>特表 2004-517031<br>リボソーム<br>特表平 09-511521 | アールティーエー アソシ<br>エーツ<br>特開平 09-323939<br>リボソーム<br>特表平 10-507737<br>キノイン ギオギスゼル<br>エス ベギエスゼチ テル<br>メケク ギア<br>特表平 10-507749<br>カリフォルニア大学<br>特表 2003-510345<br>ジョンソンアンドジョンソ<br>ン<br>特表 2003-511405                                                                                                  |
|       | カプセルの利用  |                                | ノバパックス<br>特表平 10-513185<br>ミネソタ マイニング ア<br>ンド MFG<br>特表 2002-513774<br>エラン<br>特表 2002-524411<br>ペンタファルム<br>特表 2002-535247 | カリフォルニア工科大学<br>特表平 10-508302<br>ペン ステイト リサーチ<br>ファウンデーション、マサ<br>チューセッツ工科大学<br>特表 2000-506165<br>ジョーンズ ホプキンズ<br>大学<br>特表 2002-506436                                                                                                                                                                                                                                 | 参天製薬(2)<br>特開 2000-247871<br>特開 2002-138036<br>サザン リサーチ INST、<br>マクレ マクフアーランド<br>アマンダ、ダールストロー<br>ム アンニカ ベー<br>特表平 10-506373<br>マインドセット バイオ<br>PHARM ユー エス エイ<br>特表 2002-532416                                                                                                                  |
|       | キャリアーの利用 | 中外製薬<br>特開平 08-333259          | ファーマシューティカルズ<br>アプリケーションズ アソ<br>シエイツ<br>特表 2002-519310<br>パウダージェクト リサー<br>チ<br>特表 2002-536317                             | エミスフェア テクノロ<br>ジーズ<br>特開 2003-313157<br>イネックス PHARM<br>特表平 10-505320<br>サザン カリフォルニア大<br>学<br>特表 2002-531543                                                                                                                                                                                                                                                         | 武田薬品工業)<br>特開平 06-228199<br>明石 満、第一製薬<br>特開平 10-087763<br>栗津 荘司、大西 俊正、<br>間 和之助、藤沢薬品工業<br>特開平 11-171794<br>帝人<br>特開 2001-122768<br>参天製薬<br>特開 2003-313119<br>オレゴン ヘルスサイエ<br>ンシズ大学<br>特表 2002-514188<br>エミスフェア テクノロ<br>ジーズ、バージニア コモ<br>ンウェルス大学<br>特表 2002-534363<br>ジェネキユア PTE<br>特表 2003-508456 |

表 1.4.2-10 薬剤導入技術の課題・解決手段と出願人(7/7)

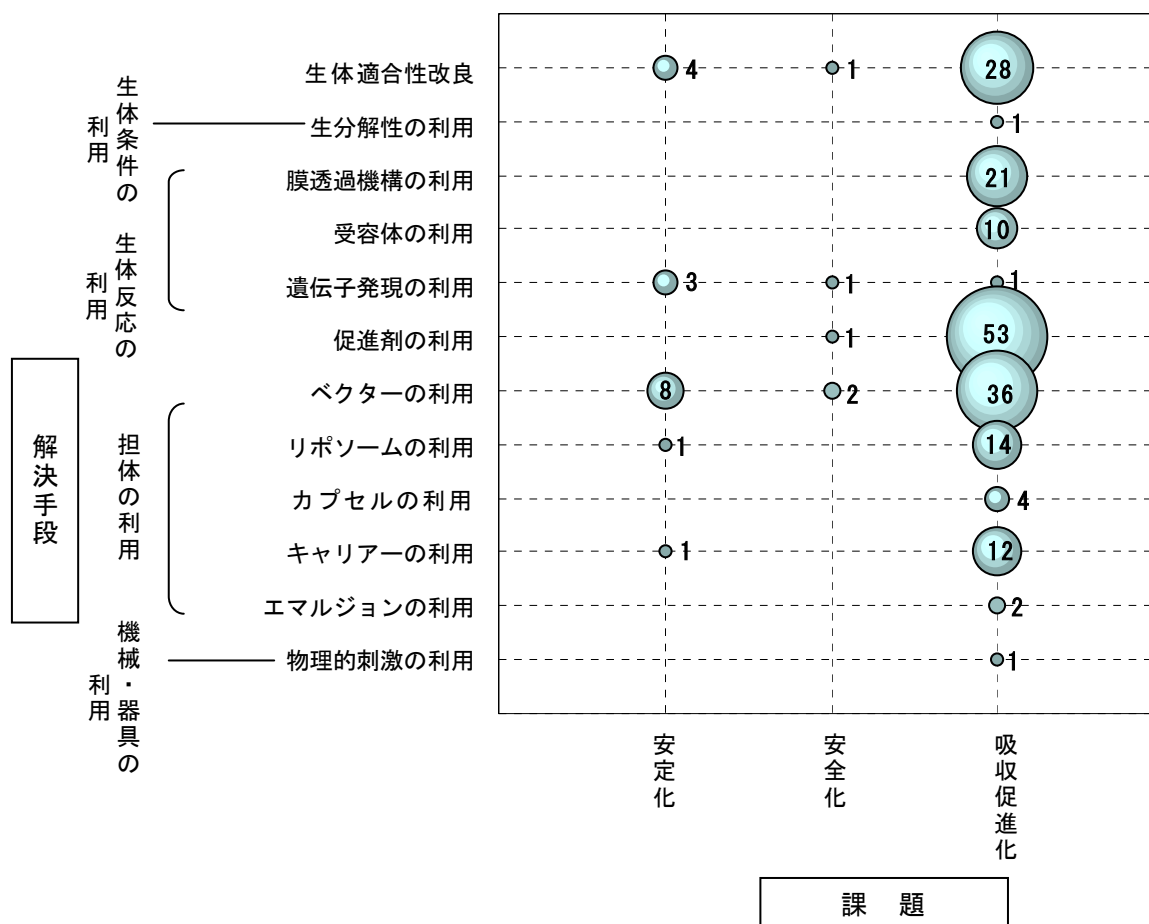
| 課題       |           | 吸収促進化    |                                                                                                                                                                            |                                     |                                                                                                                              |
|----------|-----------|----------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 解決手段     |           | 経粘膜吸収促進化 | 経皮吸収促進化                                                                                                                                                                    | 細胞内吸収促進化                            | その他の吸収促進化                                                                                                                    |
|          |           |          |                                                                                                                                                                            |                                     |                                                                                                                              |
| 担体の利用    | エマルジョンの利用 |          |                                                                                                                                                                            | ピッツバーグ大学<br>特表平 11-512712           | ウエスト ファーマシュー<br>ティカル サービスズ<br>特表平 08-501534<br>ファーマス<br>特表平 08-508975<br>スプラテック ファーマ、<br>カバノフ アレクサンダー<br>ブイ<br>特表平 11-507028 |
|          | 装置の利用     |          | アルテア テクノロジーズ<br>特表 2002-505304<br>ジョンソンアンドジョンソ<br>ン<br>特表 2004-520152                                                                                                      |                                     | ジャンセン PHARM<br>特許 2921987                                                                                                    |
| 機械・器具の利用 | 物理的刺激の利用  |          | ジョンソンアンドジョンソ<br>ン(2)<br>特表 2001-506263<br>特表 2004-508148<br>マーチット ケヴィン エ<br>ス、フロック ステファン<br>ティー<br>特表 2002-543942<br>ライト サイエンス<br>特表 2002-534218<br>久光製薬<br>特開 2003-210591 | ビーシーアイ バイオテッ<br>ク<br>特表 2004-520021 | ザーズ、チャン ハオ<br>特許 3547453<br>ファーマソニックス<br>特表 2002-521118<br>バイテリス<br>特表 2004-501727                                           |



## ②遺伝子導入技術

図 1.4.2-6 に遺伝子導入技術の課題に対する解決手段の分布を示す。遺伝導入技術の課題は「吸収促進化」に集中している。吸収促進化に対して、「促進剤の利用」で集中して対応し、「ベクターの利用」、「生体適合性の利用」、「膜透過機構の利用」でも多く対応している。

図 1.4.2-6 遺伝子導入技術の課題と解決手段の分布



1992 年 1 月～2002 年 12 月の出願

表 1.4.2-11 に遺伝子導入技術の課題に対する解決手段の詳細を示す。吸収促進化に対して集中して対応している吸収促進の利用は、より具体的な解決手段では「カチオン性脂質添加」による対応が中心となっている。

表 1.4.2-11 遺伝子導入技術の課題・解決手段の分布

| 課題<br>解決手段 |           | 安全化         | 安定化 | 吸収促進化 |
|------------|-----------|-------------|-----|-------|
| 生体適合性改良    |           | 4           | 1   | 28    |
| 生体条件の利用    | 生分解性の利用   |             |     | 1     |
| 生体反応の利用    | 膜透過機構の利用  |             |     | 21    |
|            | 受容体を利用    |             |     | 10    |
|            | 遺伝子発現の利用  | 3           | 1   | 1     |
| 促進剤の利用     |           | 界面活性剤添加     |     | 2     |
|            |           | カチオン性脂質添加   | 1   | 20    |
|            |           | カチオン性ポリマー添加 |     | 12    |
|            |           | その他の促進剤添加   |     | 6     |
|            |           | 胆汁酸添加       |     | 1     |
|            |           | 毒素添加        |     | 1     |
|            |           | ペプチド添加      |     | 3     |
|            |           | 無機物添加       |     | 1     |
|            |           | 有機物添加       |     | 7     |
| 担体の利用      | ベクターの利用   | 8           | 2   | 36    |
|            | リボソームの利用  | 1           |     | 14    |
|            | カプセルの利用   |             |     | 4     |
|            | キャリアーの利用  | 1           |     | 12    |
|            | エマルジョンの利用 |             |     | 2     |
| 機械・器具の利用   | 物理的刺激の利用  |             |     | 1     |

表 1.4.2-12 に遺伝子導入技術の課題・解決手段と出願人を示す。出願が集中している吸収促進化に対して、カチオン性脂質添加に関して、サノフィ・アベンティスが 3 件、テルモとバエンティス、ライフ テクノロジーズが各 2 件出願している。

表 1.4.2-12 遺伝子導入技術の課題・解決手段と出願人(1/5)

| 課題      |          | 吸収促進化                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |
|---------|----------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 解決手段    |          |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |
| 生体適合性改良 |          | ウエスト パーマシューティカル サービスズ(2)<br>特表 2000-503645<br>特表 2002-538174<br>ジェンザイム(2)<br>特表平 10-510813<br>特表 2002-518313<br>メガバイオス(2)<br>特表平 09-505593<br>特許 2918693<br>サノフィ・アベンティス<br>特表 2003-503362<br>アムジェン<br>特表平 11-503407<br>アラダイム<br>特表 2003-528131<br>アルザ<br>特表 2001-504093<br>イ デ エム イミュノ デジネ モレキュル<br>特表 2002-532388<br>エクスプレション ジェネティックス<br>特表 2004-522809<br>オハイオ大学、ケース ウェスタン リザーブ大学<br>特表平 10-503469<br>カイロン<br>特表 2001-515051<br>ザイコス<br>特表 2002-538196<br>サミアン<br>特表 2001-525357 | ジャンセル<br>特表 2004-520288<br>ロンドン大学スクール オブ ファーマシー<br>特表 2002-526456<br>セルテック アル アンド ディー<br>特表 2003-506475<br>バレンティス<br>特表 2001-515913<br>ヒルガース アルノルト<br>特表 2003-504320<br>ブランク クリスティアン、フィンジンガー ディルク<br>特表 2003-503569<br>ブランク クリステン、ステンベルゲール アクセル、シェレール フランツ<br>特表 2003-503370<br>ペーリンガー インゲルハイム INTERN、ジェネンテック<br>特許 3519407<br>ポリジーン<br>特表 2003-505473<br>ペンシルバニア大学<br>特表 2003-523320<br>ローヌ プーラン ローラー PHARM<br>特表平 09-505982<br>癌研究会、東京薬科大学<br>特開平 07-069933 |
|         | 生体条件の利用  | 生分解性の利用                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             | メディソープ テクノロジーズ<br>特表平 08-511418                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |
| 生体反応の利用 | 膜透過機構の利用 | トランジェーヌ(2)<br>特開 2001-029087<br>特開 2002-316997<br>アマクサ<br>特表 2002-534437<br>エイビオス サイエンスズ グループ<br>特表平 09-504035<br>エフ ホフマン ラ ロシュ<br>特開 2002-338503<br>オクタジーン<br>特表 2004-506006<br>クロマ セラピューティクス<br>特表 2002-523748<br>コミッサリア タ レネルジー アトミック、サントル ナショナル ド ラ ルシエルシュ シャンティフィック<br>特表 2001-521747<br>サントル ナショナル ド ラ ルシエルシュ シャンティフィック<br>特表 2002-543810<br>ターゲッテイド ジェネティクス<br>特表平 10-501963                                                                                                 | ドイチェス クレブスフォルシュングスツェントルム スチフトゥ、ケプゼル ヘルマン<br>特表 2002-504318<br>バイオジェン<br>特許 2702285<br>フォゲン<br>特表 2004-508341<br>メビオファーム<br>特許 3415131<br>ルイ パスツール大学<br>特表 2002-533088<br>リサーチ DEV ファンデーション<br>特表平 09-508792<br>ローヌ プーラン ローラー<br>特表平 11-512704<br>久光製薬<br>特開平 10-28583<br>国立循環器病センター総長、ブリヂストン<br>特開 2004-081039<br>持田製薬<br>W02002/030961<br>田畑 泰彦、三洋化成工業<br>特開 2004-000070                                                                                     |

表 1.4.2-12 遺伝子導入技術の課題・解決手段と出願人(2/5)

| 課題      |             | 吸収促進化                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |                                                                                                                                                                                                                                                                                      |
|---------|-------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 解決手段    |             |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |                                                                                                                                                                                                                                                                                      |
| 生体反応の利用 | 受容体の利用      | <p>インペリアル カレッジ オブ サイエンス テクノロジー<br/>特表平 10-509166</p> <p>セレクトィブ ジェネティックス<br/>特表平 11-505805</p> <p>ツォ ポール オー ピー<br/>特表 2000-501414</p> <p>ニューヨーク大学<br/>特表平 07-509599</p> <p>ベイラー カレッジ オブ メディシン<br/>特表平 11-506722</p>                                                                                                                                                             | <p>ボビュレイション カウンシル<br/>特表 2004-524371</p> <p>アイオワ大学 リサーチ ファウンデーション、カイロン<br/>特開 2000-143548</p> <p>ノース カロライナ大学 アット チャペル<br/>特表 2002-533110</p> <p>科学技術振興機構<br/>特開 2003-235560</p> <p>味の素、ディ ディ エス研究所<br/>特開平 08-089278</p>                                                             |
|         | 遺伝子発現の利用    | <p>コルバス INTERN<br/>特表 2003-514524</p>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |                                                                                                                                                                                                                                                                                      |
| 促進剤の利用  | 界面活性剤添加     | <p>グラクソ スミスクライン、ケンブリッジ大学テクニカル サービス(2)<br/>特表 2004-515228<br/>特表 2004-520316</p>                                                                                                                                                                                                                                                                                                |                                                                                                                                                                                                                                                                                      |
|         | カチオン性脂質添加   | <p>サノフィ・アベンティス(3)<br/>特表平 09-508100<br/>特表平 10-509958<br/>特表 2000-501383</p> <p>テルモ(2)<br/>特開平 09-263579<br/>特開平 09-263582</p> <p>バレンティス(2)<br/>特表平 11-507365<br/>特表 2002-510615</p> <p>ライフ テクノロジー(2)<br/>特許 3210019<br/>特表平 11-506935</p> <p>イネックス PHARM<br/>特表平 11-507537</p> <p>イマアーレクス PHARM<br/>特表平 11-500727</p> <p>ゲー オー テー G フュア テラピエオブティミューリンク<br/>特表 2003-516970</p> | <p>ノースウエスタン大学<br/>特表平 10-500399</p> <p>バイオコンパティブルズ<br/>特表 2002-530456</p> <p>バイカル<br/>特表 2000-502061</p> <p>パク ジョンサン<br/>特表 2003-501363</p> <p>バンダービルト大学<br/>特表平 10-512255</p> <p>ブリティッシュ コロンビア大学<br/>特表 2002-542341</p> <p>ワイス<br/>特表平 10-506901</p> <p>三菱化学<br/>特表 2004-522722</p> |
|         | カチオン性ポリマー添加 | <p>トランスジーン(2)<br/>特表 2001-510863<br/>特許 3499137</p> <p>イントロヘーネ、オクトプラス、ユトレヒト大学<br/>特表平 11-501821</p> <p>カイロン<br/>特表 2001-503385</p> <p>コペルニクス セラピピューティクス<br/>特表 2003-534811</p> <p>サブラテック ファーマ<br/>特表 2003-526692</p>                                                                                                                                                           | <p>スブラテック ファーマ、カバノフ アレクサンダー・バイ<br/>特表 2002-536399</p> <p>テルモ<br/>特開 2001-354639</p> <p>カリフォルニア大学<br/>特表平 09-500136</p> <p>ローヌ プーラン ローラー<br/>特表平 10-502918</p> <p>ローマン工業、エルティーティー研究所<br/>特開平 07-206892</p> <p>慶應義塾<br/>特許 3493608</p>                                                 |

表 1.4.2-12 遺伝子導入技術の課題・解決手段と出願人(3/5)

| 課題     |             | 吸収促進化                                                                                                                                                                                          |                                                                                                                                                                                                |
|--------|-------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 解決手段   |             |                                                                                                                                                                                                |                                                                                                                                                                                                |
| 促進剤の利用 | カチオン性ポリマー添加 | トランスジーン(2)<br>特許 3499137<br>特表 2001-510863<br>ローマン工業、エルティーティー研究所<br>特開平 07-206892<br>テルモ<br>特開 2001-354639<br>慶應義塾<br>特許 3493608<br>カリフォルニア大学<br>特表平 09-500136<br>サノフィ・アベンティス<br>特表平 10-502918 | イントロヘーネ、オクトプラス、ユトレヒト大学<br>特表平 11-501821<br>カイロン CORP<br>特表 2001-503385<br>スプラテック ファーマ、カバノフ アレクサンダー ブイ<br>特表 2002-536399<br>スプラテック ファーマ<br>特表 2003-526692<br>コペルニクス セラビューティクス<br>特表 2003-534811 |
|        | その他の促進剤添加   | サノフィ・アベンティス<br>特表 2002-501762<br>カンジ<br>特表 2001-509492<br>セダーシナイ メディカル センター<br>特表 2003-535612                                                                                                  | バレンティス<br>特表 2002-517519<br>カリフォルニア大学<br>特表 2002-502885                                                                                                                                        |
|        | 胆汁酸添加       | プリンストン大学<br>特表平 09-512270                                                                                                                                                                      |                                                                                                                                                                                                |
|        | 毒素添加        | ベルス ベンフリート<br>特表平 09-511916                                                                                                                                                                    |                                                                                                                                                                                                |
|        | ペプチド添加      | ジェイ デビッド グラッドストーン、シュール<br>ルト ユーリッヒ、ヘンケレン ピーター<br>特表 2004-501111                                                                                                                                | メディジェン、ブリティッシュ コロンビア大学<br>特表 2003-501111<br>久光製薬<br>特開 2001-120268                                                                                                                             |
|        | 無機物添加       | ジェンテリック<br>特表 2003-520253                                                                                                                                                                      |                                                                                                                                                                                                |
|        | 有機物添加       | アドバンスド リサーチ アンド テクノロジー<br>INST、ノースウエスタン大学<br>特許 3411039<br>サノフィ・アベンティス<br>特表 2003-513078<br>エラン<br>特表 2002-544175<br>コモノウエルズ サイエнтиフィック アンド<br>IND リサーチ<br>特表平 10-509862                       | フレイ フェリックス、ラスコーン サンドロ<br>特表 2002-523422<br>ブリティッシュ コロンビア大学<br>特表 2002-501511<br>住友製薬、高研<br>特表 2001-097857                                                                                      |

表 1. 4. 2-12 遺伝子導入技術の課題・解決手段と出願人(4/5)

| 課題<br>解決手段 | 吸収促進化                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |
|------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 担体の利用      | <p>ベクターの利用</p> <p>オックスフォード バイオメディカ ユー ケイ (2)<br/>特表 2002-518997<br/>特表 2003-500050<br/>デйнаベック研究所 (2)<br/>特開 2002-272465<br/>W001/053491<br/>カリフォルニア大学 (2)<br/>特表 2003-513942<br/>特表 2003-520597<br/>ピッツバーグ大学 (2)<br/>特表平 08-511507<br/>特表平 10-502526<br/>ローヌ プーラン ローラー (2)<br/>特表平 08-501703<br/>特表平 08-510122<br/>アーク セラピューティックス<br/>特表 2003-533992<br/>サノフィ・アベンティス、アンスチ、 ナショナル ド<br/>ラ サンテ エ ド ラ ルシエルシュ<br/>特表 2002-543097<br/>アビジェン、吉田 純、水野 正明、岡田 秀穂<br/>特表 2002-514900<br/>アンスチ、 ナショナル ド ラ サンテ エ ド<br/>ラ ルシエルシュ<br/>特表平 10-503644<br/>カイロン<br/>特表 2003-527863<br/>カンジ<br/>特表平 09-507051<br/>クルセル ホランド<br/>特表 2002-543846<br/>コモンウエルス サイエнтиフィック アンド IND<br/>リサーチ<br/>特表平 08-501453<br/>ジェンザイム<br/>特表 2003-501040<br/>シンジェニックス<br/>特開 2004-000280</p> <p>セル ジェネシス<br/>特表平 08-511169<br/>チルドレンズ ホスピタル<br/>特表平 10-504185<br/>ディベロゲン フール アントヴィクラングスバイオ<br/>ロジ<br/>特表 2001-509375<br/>ノバルティス、スクリップス リサーチ INS<br/>特表 2002-534130<br/>ノバルティス<br/>特表 2003-519199<br/>バイオトランスプラント、ジェネラル ホスピタル<br/>特表平 08-510636<br/>バイオフォーカス ディスカバリー<br/>特表平 10-501980<br/>ババリアン ノルディック、ゲー エス エフ フォ<br/>ルシュンクス ツェエントルム<br/>特表平 11-508768<br/>メディゲン<br/>特表 2003-505032<br/>メルク<br/>特表 2002-535986<br/>ノース カロライナ大学 アット チャペル<br/>特表 2002-538770<br/>ペンシルバニア大学<br/>特表平 11-507240<br/>ピエール エ マリー キュリー大学 パリ<br/>特表平 09-509060<br/>リバファーム<br/>特表 2004-506684<br/>ロックフェラー大学、エール大学<br/>特表平 10-501686<br/>サノフィ・アベンティス、アンスチ、 ナショナル<br/>ド ラ サンテ エ ド ラ ルシエルシュ<br/>特表平 08-501686</p> |
| リボソームの利用   | <p>アイネックス PHARM<br/>特表 2002-520038<br/>サノフィ・アベンティス<br/>特表 2003-501373<br/>アンティキヤンサー<br/>特許 2950520<br/>オパーバス ホールディング<br/>特表平 11-514349<br/>ソウロボイ アンドレイ<br/>特許 3525393<br/>トランジーン<br/>特表 2004-528384<br/>ニカ ヘルス プロダクツ<br/>特表 2000-509404</p> <p>フォーカル<br/>特表平 10-509696<br/>ブリカス テニ<br/>特表 2003-535832<br/>テキサス大学<br/>特表平 11-512099<br/>ライフ テクノロジー<br/>特表平 09-510435<br/>科研製薬、応用生化学研究所<br/>特開 2003-226646<br/>京都大学総長<br/>特開 2004-49227<br/>山之内製薬<br/>特開 2001-335512</p>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |

表 1.4.2-12 遺伝子導入技術の課題・解決手段と出願人 (5/5)

| 課題       |           | 吸収促進化                                                                                                                                                                                                         |                                                                                                                                                                                       |
|----------|-----------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 解決手段     |           |                                                                                                                                                                                                               |                                                                                                                                                                                       |
| 担体の利用    | カプセルの利用   | <p>日本食品化工<br/>特開 2001-103969<br/>エフ ビー ピー<br/>特表 2000-515896</p>                                                                                                                                              | <p>ジェンザイム<br/>特表 2002-506834<br/>サントル ナショナル ド ラ ルシェルシュ シアンティフィツ<br/>特表 2003-514912</p>                                                                                                |
|          | キャリアーの利用  | <p>久光製薬 (2)<br/>特開平 11-021255<br/>特開 2000-210079<br/>サノフィ・アベンティス<br/>特表 2004-518752<br/>シトリックス<br/>特表平 09-503788<br/>セイフサイエンス<br/>特表 2003-503308<br/>ダイナベック研究所<br/>W099/043752<br/>テルモ<br/>特開 2000-319200</p> | <p>ノバルティス<br/>特表平 10-510822<br/>ビオンテックス LAB<br/>特表 2001-515060<br/>ファルマコンセプツ、アルトウルソン ペル、グアン ホリー<br/>特表 2003-516365<br/>中村 栄一、藤沢薬品工業<br/>特開 2002-088075<br/>日本油脂<br/>特開平 09-313180</p> |
|          | エマルジョンの利用 | <p>久光製薬<br/>特開平 09-255561</p>                                                                                                                                                                                 | <p>コリア INST オブ サイエンス アンド テクノロジー<br/>特表 2002-521423</p>                                                                                                                                |
| 機械・器具の利用 | 物理的刺激の利用  | <p>モレニアムラボラトリーズ、名菱テクニ<br/>カ<br/>特表 2001-055294</p>                                                                                                                                                            |                                                                                                                                                                                       |

## 1.5 注目特許（サイテーション分析）

### 1.5.1 注目特許の抽出

ドラッグデリバリーシステムについての被引用特許を審査官引用文献および選考技術引用文献から抽出した。これらのうち、被引用回数が多いものを抽出して注目特許とする。表 1.5.1-1～表 1.5.1-3 に注目特許のリストを技術要素別に示す。

表 1.5.1-1 薬剤放出技術の注目特許リスト(1/2)

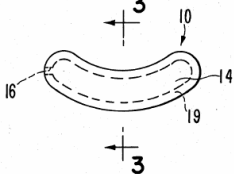
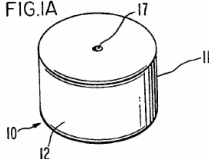
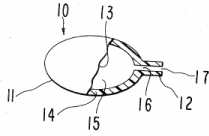
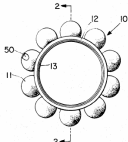
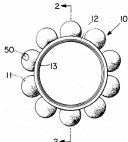
| 被引用特許番号<br>出願人<br>発明の名称<br>出願日<br>(対応日本特許)                                                                                                                                           | 被引用回数 | 自社特許数 | 他社特許数 | 引用した特許の出願人                                                                                                 | 概要                                                                                                                   |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------|-------|-------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| US3,916,899<br>ALZA CORP<br>Osmotic dispensing device with maximum and minimum sizes for the passageway<br>74.02.07                                                                  | 12    | 5     | 7     | アルザ(5)<br>アルタナ ファルマ(1)<br>シャイア LAB(1)<br>ディポメド(1)<br>デュレクト(1)<br>ノバルティス(1)<br>マクグレゴール アレキサンダー(1)<br>メルク(1) | 透過性の膜で薬剤溶液を制御しながら放出する<br>         |
| US4,327,725<br>ALZA CORP<br>Osmotic device with hydrogel driving member<br>80.11.25<br>(特許1316538)<br>(特許0920381)                                                                    | 12    | 4     | 8     | アルザ(4)<br>ファイザー(3)<br>エラン ドラッグ デリバリー(1)<br>シャイア LAB(1)<br>デュレクト(1)<br>ペリオ プロダクツ(1)<br>メルク(1)               | 薬剤を、半透膜を通して放出する。<br>FIG.1A<br>  |
| US3,845,770<br>ALZA CORP<br>OSMATIC DISPENSING DEVICE FOR RELEASING BENEFICIAL AGENT<br>72.06.05<br>(特許1230864)                                                                      | 11    | 5     | 6     | アルザ(5)<br>アルタナ ファルマ(1)<br>シャイア LAB(1)<br>デュレクト(1)<br>マクグレゴール アレキサンダー(1)<br>メドロジック グローバル(1)<br>メルク(1)       | 薬剤を、半透膜を通して放出する。<br>            |
| US3,995,634<br>PROCTER & GAMBLE<br>Vaginal cavity dispensing means and method<br>75.12.02                                                                                            | 8     | 0     | 8     | ビロテックス(2)<br>アクゾ ノーベル(1)<br>アトリックス LAB(1)<br>デュレクト(1)<br>ノバルティス(1)<br>バイロ テックス(1)<br>ユーロセルティク(1)           | 避妊薬を効果的に放出するデバイス。<br>           |
| US4,938,763<br>COWSAR DONALD R,<br>DUNN RICHARD L,<br>ENGLISH JAMES P,<br>VANDERBILT DAVID P<br>Biodegradable in-situ forming implants and methods of producing the same<br>88.10.03 | 8     | 0     | 8     | アトリックス LAB(2)<br>マクロメド(2)<br>アトオール ジェイシュクラ(1)<br>サザン バイオシステムズ(1)<br>ポリーメッド(1)<br>ユタ大学 リサーチファウンデーション(1)     | 生分解性ポリマーを注入して発泡させインプラントを作る。<br> |



表 1.5.1-1 薬剤放出技術の注目特許リスト (2/2)

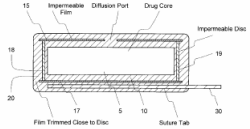
| 被引用特許番号<br>出願人<br>発明の名称<br>出願日<br>(対応日本特許)                                                                | 被引用回数 | 自社特許数 | 他社特許数 | 引用した特許の出願人                                     | 概要                                                                                                              |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------|-------|-------|------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| US5902598<br>CONTROL DELIVERY<br>SYSTEMS INC<br>Sustained release<br>drug delivery<br>devices<br>97.08.28 | 8     | 1     | 7     | ボシュ アンド ロム<br>(7)<br>コントロール デリバ<br>リー システムズ(1) | 3層構造の半透膜によって薬剤を制御して放出する。<br> |

表 1.5.1-2 薬剤標的化技術の注目特許リスト (1/3)

| 被引用特許番号<br>出願人<br>発明の名称<br>出願日<br>(対応日本特許)                                                                                                                                      | 被引用回数 | 自社特許数 | 他社特許数 | 引用した特許の出願人                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  | 概要                                                        |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------|-------|-------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------|
| US4,816,567<br>GENENTECH INC<br>Recombinant<br>immunoglobulin<br>preparations<br>83.04.08<br>(特許3559795)<br>(特許3162055)<br>(特開平07-194384)<br>(特開2001-346592)<br>(特開2001-346591) | 46    | 16    | 30    | ジェネンテック(16)<br>アストラゼネカ(4)<br>テキサス大学(3)<br>ルードビッヒ INST フォー キャンサー リサーチ(3)<br>ダウ グローバル テクノロジーズ(2)<br>ダナーファーバー キャンサー INST(2)<br>ヒューマン ジェノム サイエンス(2)<br>アドバンス リサーチ アンド テクノロジー<br>INST(1)<br>イムクロン システムズ(1)<br>キュラジェン(1)<br>ネオルクス(1)<br>バイエル(1)<br>ベス イスラエル ホスピタル アソシエーション(1)<br>マクギル大学(1)<br>ミリアド ジェネティクス(1)<br>メダレックス(1)<br>カリフォルニア大学(1)<br>コネティカット大学ヘルス センター(1)<br>バージニア大学(1)<br>レキシジェン PHARM(1)<br>アメリカ合衆国(1) | 抗原結合特性が改良された免疫グロブリンを遺伝子配列が挿入された発現ベクターを用いて宿主細胞を形質転換し手生産する。 |
| US4,946,778<br>GENEX CORP<br>Single<br>polypeptide chain<br>binding molecules<br>87.09.21                                                                                       | 31    | 0     | 31    | イミューメディックス(8)<br>エンゾン(2)<br>ノースウエスト バイオセラピューティクス(1)<br>イノジェネティクス(1)<br>カイロン(1)<br>キュラジェン(1)<br>コリクサ(1)<br>ダイアデクスアス(1)<br>トーマス ジェファーソン大学(1)<br>ネオルクス(1)<br>ノバルティス(1)<br>バンダービルト大学(1)<br>ヒューマン ジェノム サイエンス(1)<br>マクギル大学(1)<br>メダレックス(1)<br>カリフォルニア大学(1)<br>コネティカット ヘルス センター(1)<br>バージニア大学(1)<br>ピッツバーグ大学(1)<br>ライデン大学メディカル センター(1)<br>ラホヤ INST フォア アレルギー アンド イムノロ<br>ジー(1)<br>ローヌ プーラン ローラー(1)<br>アメリカ合衆国(1)   | 一本鎖ポリペプチドに結合する分子を生産する方法。抗体をコードする遺伝子配列とそれを用いた生産方法。         |

表 1.5.1-2 薬剤標的化技術の注目特許リスト (2/3)

| 被引用特許番号<br>出願人<br>発明の名称<br>出願日<br>(対応日本特許)                                                                          | 被引用回数 | 自社特許数 | 他社特許数 | 引用した特許の出願人                                                                                                                                                                                                                                                                                | 概要                                                                                       |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------|-------|-------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------|
| US4, 683, 202<br>CETUS CORP<br>Process for amplifying nucleic acid sequences<br>85.03.28<br>(特許2622327)             | 20    | 0     | 20    | カイロン(3)<br>コリクサ(2)<br>メディシン アンド デンティストリー大学(2)<br>リーランド スタンフォード ジュニア大学(2)<br>オニックス PHARM(1)<br>キュラジェン(1)<br>ジェンザイム(1)<br>ジョーンズ ホプキンズ大学(1)<br>トーマス ジェファーソン大学(1)<br>ノースウエスト バイオセラピューティクス(1)<br>アーカンソー大学(1)<br>ミリアド ジェネティックス(1)<br>カリフォルニア大学(1)<br>テキサス大学(1)<br>ワトソン PHARM(1)                 | ポリメレース・チェイン・リアクション法によってDNAを増幅する方法。                                                       |
| US4, 683, 195<br>CETUS CORP<br>Process for amplifying, detecting, and/or-cloning nucleic acid sequences<br>86.01.30 | 18    | 0     | 18    | カイロン(3)<br>コリクサ(2)<br>アドバンスト リサーチ アンド テクノロジー INST(1)<br>オニックス PHARM(1)<br>キュラジェン(1)<br>ジー ピー シー バイオテック(1)<br>ジェンザイム(1)<br>ジョーンズ ホプキンズ大学(1)<br>トーマス ジェファーソン大学(1)<br>ノースウエスト バイオセラピューティクス(1)<br>アーカンソー大学(1)<br>ミリアド ジェネティックス(1)<br>カリフォルニア大学(1)<br>メディシン アンド デンティストリー大学(1)<br>ワトソン PHARM(1) | ポリメレース・チェイン・リアクション法によってDNAを増幅する方法。                                                       |
| US4, 179, 337<br>DAVIS FRANK F, PLACZUK NICHOLAS C, ES THEODORUS VAN<br>Non-immunogenic polypeptides<br>73.07.20    | 17    | 0     | 17    | ジェネンテック(9)<br>エンゾ(2)<br>アジェンシス(1)<br>イノジェネティクス(1)<br>エフ ホフマン ラ ロシュ(1)<br>カイロン(1)<br>デビオ ルシェルシュ PHARM(1)<br>バイオマリン PHARM(1)                                                                                                                                                                | 酵素やインスリンのようなポリペプチドに分子量500～20,000ダウTONのポリエチレングリコールまたはポリプロピレングリコールを結合し、免疫不活性な水溶性ポリペプチドを得る。 |
| US4, 376, 110<br>HYBRITECH INC<br>Immunometric assays using monoclonal antibodies<br>80.08.04                       | 17    | 0     | 17    | ジェネンテック(9)<br>アドバンスト リサーチ アンド テクノロジー INST(1)<br>コーネル リサーチ ファウンデーション(1)<br>コロンビア大学(1)<br>ノバルティス(1)<br>ミリアド ジェネティックス(1)<br>カリフォルニア大学(1)<br>コネティカット大学ヘルス センター(1)<br>ラホヤ INST フォア アレルギー アンド イムノロジー(1)                                                                                         | モノクローナル抗体を用いたサンドイッチ免疫アッセイ法。標識した溶解性の第1のモノクローナル抗体と固体キャリアーに結合した第2のモノクローナル抗体を用いる。            |
| US4, 485, 045<br>RESEARCH CORP<br>Synthetic phosphatidyl cholines useful in forming liposomes<br>81.07.06           | 17    | 0     | 17    | ジェネンテック(14)<br>アドバンスト リサーチ アンド テクノロジー INST(1)<br>オラソマル テクノロジーズ(1)<br>バイオジェン(1)                                                                                                                                                                                                            | 薬物送達システムのビシクルとして有用なフォスファチジルコリンの製造方法。安定性が改善されており、内部の薬剤の放出速度を制御できる。                        |

表 1.5.1-2 薬剤標的化技術の注目特許リスト (3/3)

| 被引用特許番号<br>出願人<br>発明の名称<br>出願日<br>(対応日本特許)                                                                                                     | 被<br>引<br>用<br>回<br>数 | 自<br>社<br>特<br>許<br>数 | 他<br>社<br>特<br>許<br>数 | 引用した特許の<br>出願人                                                                                                                                                                                                                                                                                         | 概要                                                                                                                                                                |
|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------|-----------------------|-----------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| US4, 544, 545<br>TRUSTEES<br>UNIVERSITY OF<br>MASSACH<br>Liposomes<br>containing<br>modified<br>cholesterol for<br>organ targeting<br>83.06.20 | 17                    | 0                     | 17                    | ジェネンテック (14)<br>アドバンスト リサーチ アンド テクノロジー<br>INST (1)<br>ターゲサム (1)<br>バイオジェン (1)                                                                                                                                                                                                                          | 外層にコレステロール<br>エステルなどを有し、ト<br>レーサー剤などが水媒体<br>で閉じ込められた脂質二<br>重膜リポソーム。特定の<br>器官へのターゲッティン<br>グに用いることができる。                                                             |
| US4, 676, 980<br>US HEALTH<br>Target specific<br>cross-linked<br>heteroantibodies<br>85.09.23                                                  | 17                    | 0                     | 17                    | ジェネンテック (12)<br>アドバンスト リサーチ アンド テクノロジー<br>INST (1)<br>クリエイティブ バイオモレキュールズ (1)<br>ヒューマン ジノーム サイエンス (1)<br>メダレックス (1)<br>バージニア大学 (1)                                                                                                                                                                      | 目標特異的交互結合ヘ<br>テロ抗体の製造方法。こ<br>のヘテロ抗体は、望まし<br>くない細胞を免疫機構に<br>よって死滅させることが<br>できる。腫瘍や感染症な<br>どに適用できる。                                                                 |
| US5, 225, 539<br>MEDICAL RES<br>COUNCIL<br>Recombinant<br>altered<br>antibodies and<br>methods of making<br>altered<br>antibodies<br>86.03.27  | 17                    | 0                     | 17                    | ルードビッヒ INST フォー キャンサー リサーチ (3)<br>ダウ グローバル テクノロジーズ (2)<br>イムクロン システムズ (1)<br>キュラジェン (1)<br>ネオルクス (1)<br>ノースウエスト バイオセラピューティクス (1)<br>ヒューマン ジノーム サイエンス (1)<br>ベス イスラエル ホスピタル (1)<br>メダレックス (1)<br>コネティカット大学 ヘルス センター (1)<br>バージニア大学 (1)<br>ライデン大学メディカル センター (1)<br>レキシジェン PHARM (1)<br>アメリカン サイアナミッド (1) | 免疫グロブリンの相補<br>性決定領域を置換するこ<br>とによって組換え抗体を<br>製造する方法。長鎖オリ<br>ゴヌクレオチドを使っ<br>て、特定部位の突然変異<br>を誘発して組換え抗体を<br>作る。                                                        |
| WO8807378<br>CANCER RES<br>CAMPAIGN TECH<br>IMPROVEMENTS<br>RELATING TO DRUG<br>DELIVERY SYSTEMS<br>87.03.09                                   | 17                    | 5                     | 12                    | キャンサー リサーチ キャンペーン テクノロジー (6)<br>ウエルカム ファウンデーション (2)<br>エンザクタ アール アンド デイ (2)<br>ジェネンテック (2)<br>アストラゼネカ (2)<br>アンティソマ リサーチ (1)<br>デニー ウィリアム アレクサンダー (1)<br>バイエル (1)                                                                                                                                      | 抗原を認識して腫瘍に<br>結合し、細胞毒のプロド<br>ラッグを開裂させる酵素<br>に結合する部分と、細胞<br>毒のプロドラッグからな<br>る薬剤。このシステム<br>は、新生細胞の成長を制<br>御できる。カルボキシペ<br>プチダーゼで切断されて<br>ナイトロジェンマスター<br>ドを放出する。       |
| US5, 013, 556<br>LIPOSOME<br>TECHNOLOGY INC<br>Liposomes with<br>enhanced<br>circulation time<br>1989.10.20<br>(特許2889549)<br>(特開2001-181214)  | 16                    | 0                     | 16                    | ジェネンテック (10)<br>アルザ (1)<br>カンジ (1)<br>シエーリング ブラウ (1)<br>グラクソ・スミスクライン (1)<br>リブラサム ファーマ (1)<br>リポソーム (1)                                                                                                                                                                                                | フォスファチジルエタ<br>ノールアミンとポリエチ<br>レングリコールなどから<br>なる両親媒性脂質を 1 ~<br>20%含むリポソーム。こ<br>のリポソームは体内循環<br>時間を数倍延長すること<br>ができる。また、血流を<br>通して薬剤を目標とする<br>組織に到達させ、徐放さ<br>せることができる。 |

表 1.5.1-3 薬剤吸収制御技術の注目特許リスト

| 被引用特許番号<br>出願人<br>発明の名称<br>出願日<br>(対応日本特許)                                                                                                                                                 | 被引用回数 | 自社特許数 | 他社特許数 | 引用した特許の出願人                                                                                              | 概要                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------|-------|-------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| EP140308<br>NEW YORK大学<br>Regulation of gene expression by employing translational inhibition utilizing mRNA interfering complementary RNA<br>83.10.20<br>(特開平09-135686)<br>(特開昭60-232092) | 13    | 0     | 13    | ファイザー (9)<br>サノフィ・アベンティス (3)<br>ジャンセル (1)                                                               | 細胞あるいは生物体のmRNAに相補的なRNA (micRNA) を用いて細胞の遺伝子発現を調節あるいは阻害する。                                                                                                                                                                                                                                                             |
| US5,334,761<br>LIFE TECHNOLOGIES<br>Cationic lipids<br>92.08.28                                                                                                                            | 11    | 0     | 11    | テルモ (4)<br>ジェンザイム (2)<br>カリフォルニア大学 (2)<br>カンジ (1)<br>ノバルティス (1)<br>バイカル (1)                             | 高分子または他の化合物を細胞内に導入するのに役立つカチオン性脂質。特に遺伝子導入に有効である。                                                                                                                                                                                                                                                                      |
| US5,264,618<br>VICAL<br>Cationic lipids for intracellular delivery of biologically active molecules<br>90.04.19                                                                            | 10    | 1     | 9     | ジェンザイム (2)<br>マガバイオス (2)<br>カリフォルニア大学 (2)<br>アンティキヤンサー (1)<br>イネックス PHARM (1)<br>ノバルティス (1)<br>バイカル (1) | 生物学的に活性な物質を細胞内に輸送する能力を持つカチオン性脂質。<br>$  \begin{array}{c}  \text{H}_2\text{C} - \text{Y}^1 - \text{R}^1 \\    \\  \text{HC} - \text{Y}^2 - \text{R}^2 \\    \\  (\text{CH}_2)_n - \text{N}^+ - \text{R}^4 \quad \text{X}^- \\    \\  \text{R}^3 - \text{O} - \text{R}^6 - \text{R}^7  \end{array}  \quad (\text{I})  $ |
| US4,897,355<br>SYNTEX<br>N[ω, (ω-1)-dialkylloxy]- and N-[ω, (ω-1)-dialkenylloxy]-alk-1-yl- N, N, N-tetrasubstituted ammonium lipids and uses therefor<br>85.01.07                          | 10    | 0     | 10    | テルモ (4)<br>ライフテクノロジー (2)<br>イネックス (1)<br>バレンティス (1)<br>カリフォルニア大学 (1)<br>ブリティッシュ コロンビア大学 (1)             | DNAを細胞内に導入するのに有効な脂質。                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |

### 1.5.2 引用関連図

図 1.5.2-1 に薬剤放出技術の引用関連図を示す。薬剤を微小な孔を持つ隔膜等を用いて放出することによって、薬物の放出速度を制御する技術である。アルザ（現ジョンソンアンドジョンソン）の US3,845,700、US3,916,899、US4,327,725 が、同社およびファイザーなどから多数引用されている。

図 1.5.2-2 に薬剤標的化技術の引用関連図を示す。薬剤をポリエチレングリコール（PEG）で修飾することによって、標的以外の器官などにとらえられることをなくす技術である US4,179,337 が、ジェネンテックなどから多数引用されている。一方、リポソームを薬剤送達のビヒクルとして用いる方法である。US4,485,045 および US4,544,545 もジェネンテックなどから多数引用されている。さらに、リポソームを PEG で修飾することにより、薬剤の体内循環時間を長くし、がんなどの患部に薬剤を安定して送達する手段である US5,013,556 もジェネンテックなど多数から引用されている。

図 1.5.2-3 に薬剤吸収制御技術の引用関連図を示す。細胞内への遺伝子導入技術に関する技術であり、カチオン性ポリマーの細胞膜透過能力を利用して DNA を細胞内に導入するものである。シンテックスの US4,897,355、バイカルの US5,264,618、ライフ テクノロジーズ US5,334,761 がテルモやジェンザイムなどから引用されている。

図 1.5.2-1 薬剤放出技術の引用関連図

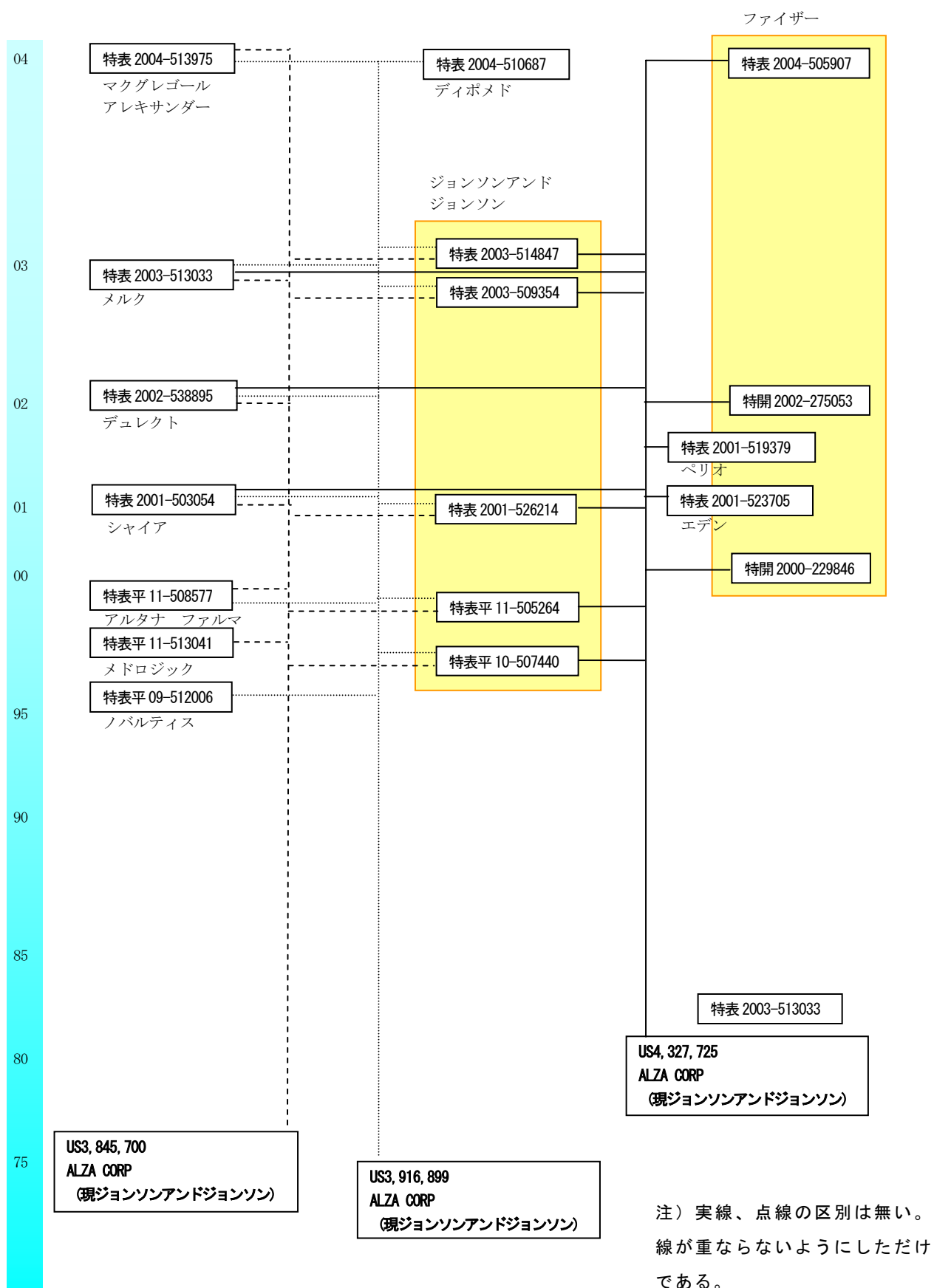


図 1.5.2-2 薬剤標的化技術の引用関連図

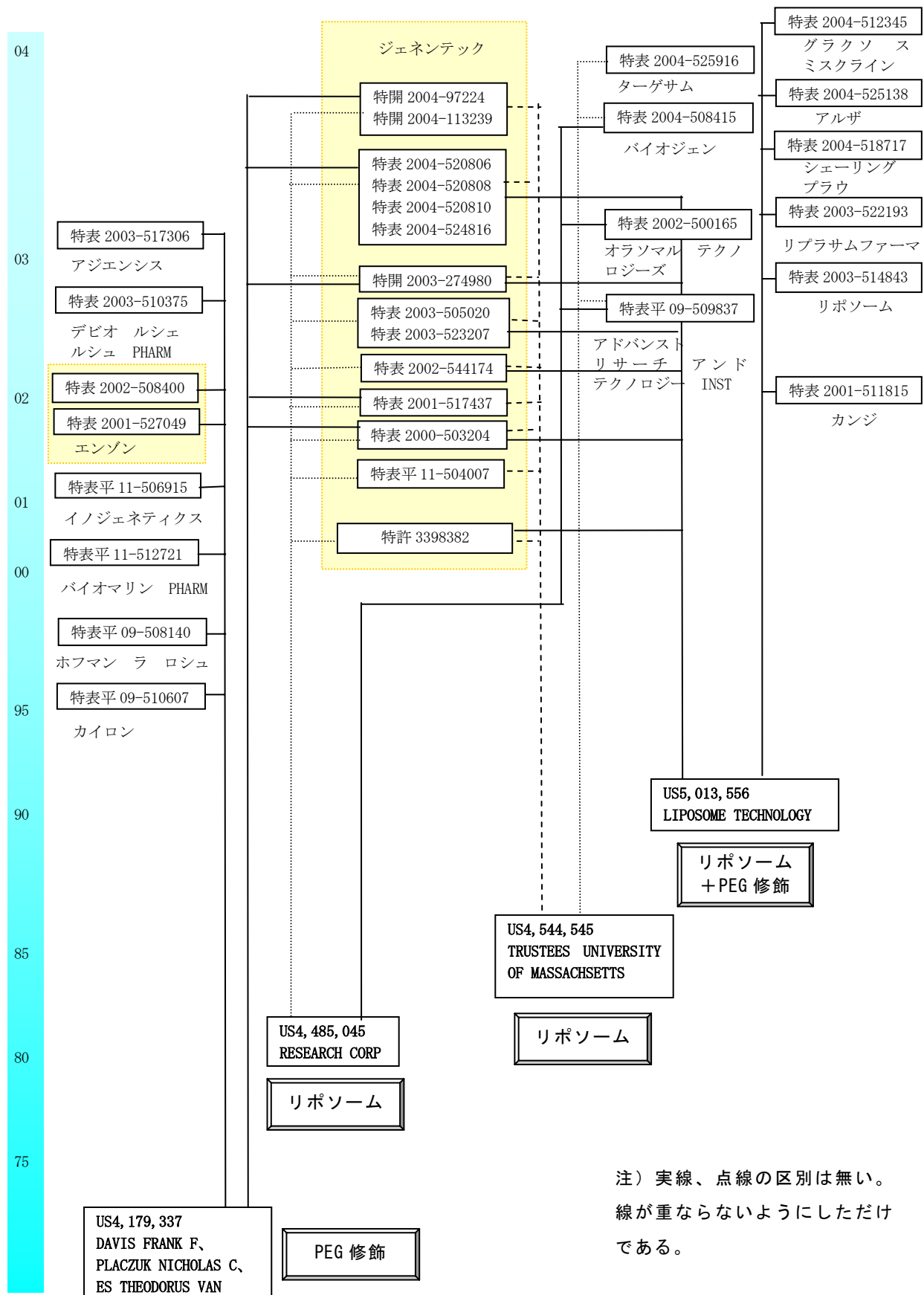
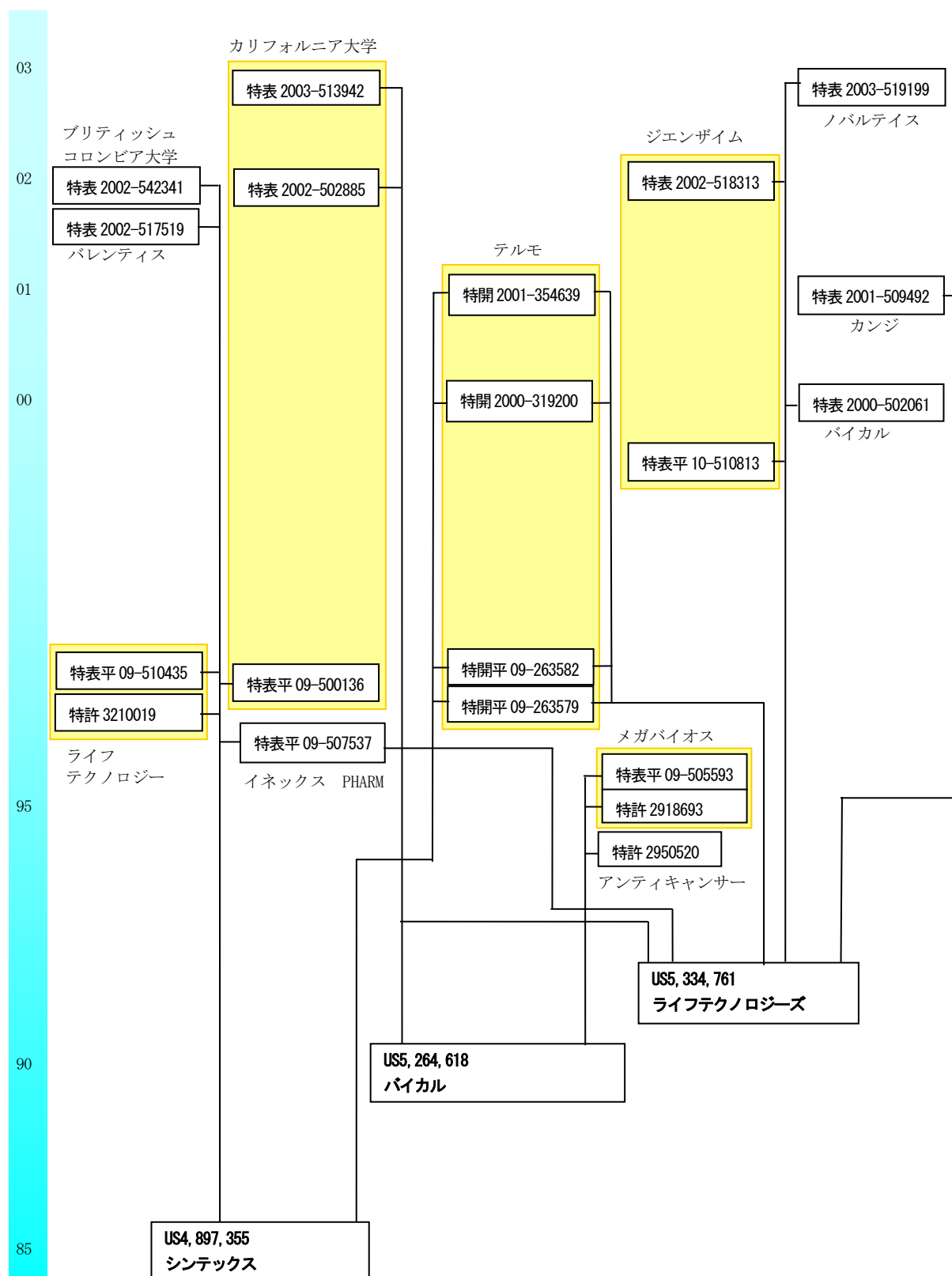


図 1.5.2-3 薬剤吸収制御技術の引用関連図





## 2. 主要企業等の特許活動

- 2.1 サノフィ・アベンティス（フランス）
- 2.2 ジョンソンアンドジョンソン（米国）
- 2.3 カリフォルニア大学（米国）
- 2.4 ジェネンテック（米国）
- 2.5 ファイザー（米国）
- 2.6 科学技術振興機構
- 2.7 カイロン（米国）
- 2.8 ブリストル・マイヤーズ スクイブ（米国）
- 2.9 アメリカ合衆国（米国）
- 2.10 テキサス大学（米国）
- 2.11 武田薬品工業
- 2.12 ウエスト ファーマシューティカル サービス（米国）
- 2.13 久光製薬
- 2.14 メルク（米国）
- 2.15 アストラゼネカ（イギリス）
- 2.16 イミュノメディクス（米国）
- 2.17 エラン（アイランド）
- 2.18 マサチューセッツ工科大学（米国）
- 2.19 エミスフェア・テクノロジーズ（米国）
- 2.20 協和醗酵工業
- 2.21 主要企業以外の特許番号一覧
- 2.22 公的研究機関・大学関係の特許番号一覧

## 2. 主要企業等の特許活動

ドラッグデリバリーシステムの研究開発は、製薬メーカー、ベンチャー企業、大学、公的研究機関とさまざまな研究機関によって世界的な広がりをもって実施されている。

ドラッグデリバリーシステムの特許活動に関し、出願件数の多い上位 20 社について扱う。1992 年 1 月から 2002 年 12 月までに提出されたドラッグデリバリーシステムに関する出願件数と主要 20 社を表 2.1 に示す。ただし、本書に記載されている特許は、開放の用意がある特許とは限らない。

表2.1 主要企業20社の出願件数

| No. | 出願人名                      | 特許出願件数 |
|-----|---------------------------|--------|
| 1   | サノフィ・アベンティス（フランス）         | 50     |
| 2   | ジョンソンアンドジョンソン（米国）         | 36     |
| 3   | カリフォルニア大学（米国）             | 28     |
| 4   | ジェネンテック（米国）               | 26     |
| 5   | ファイザー（米国）                 | 25     |
| 6   | 科学技術振興機構                  | 23     |
| 7   | カイロン（米国）                  | 21     |
| 8   | ブリストルマイヤーズスクイブ（米国）        | 20     |
| 9   | アメリカ合衆国（米国）               | 20     |
| 10  | テキサス大学（米国）                | 19     |
| 11  | 武田薬品                      | 18     |
| 12  | ウエスト ファーマシューティカル サービス（米国） | 17     |
| 13  | 久光製薬                      | 17     |
| 14  | メルク（米国）                   | 16     |
| 15  | アストラゼネカ（イギリス）             | 16     |
| 16  | イミュノメディクス（米国）             | 15     |
| 17  | エラン（アイルランド）               | 15     |
| 18  | マサチューセッツ工科大学（米国）          | 15     |
| 19  | エミスフェア・テクノロジーズ（米国）        | 14     |
| 20  | 協和醗酵工業                    | 14     |

## 2.1 サノフィ・アベンティス（フランス）

### 2.1.1 企業の概要

|       |                                                  |
|-------|--------------------------------------------------|
| 商号    | Sanofi-Aventis                                   |
| 本社所在地 | 174, avenue de France, 75013 Paris, France       |
| 設立年   | 2004年（Sanofi-SynthelaboがAventis Pharmaを買収統合して設立） |
| 資本金   | N/A                                              |
| 従業員数  | 約99,000名                                         |
| 事業内容  | 医療用医薬品（心臓、血栓、癌、潰瘍、中枢神経系、泌尿器、高血圧、糖尿病向け等）の開発・製造・販売 |

サノフィ・アベンティスは、ヨーロッパ最大の製薬会社である。主な対象疾患は、心臓、血栓、癌、潰瘍、中枢神経系、泌尿器、高血圧、糖尿病、ワクチンである。特に、循環器・抗血栓分野の世界的なリーダーであり、この分野の医薬品売上高は、グループ全体の3分の1を占めている。

サノフィ・アベンティスは、2004年8月に、サノフィ・サンテラボ（フランス）がアベンティスファーマ（フランス）を買収してできた会社である。アベンティスファーマは、99年にドイツのヘキストとフランスのローヌ・プーランが合併したフランス最大手（欧州第3位）の製薬会社であり、サノフィ・サンテラボは、99年にフランスの石油会社エルフの子会社であるサノフィと、フランスの総合化粧品会社ロレアルの子会社であるサンテラボが合併したものである。

（出典：サノフィ・アベンティスのホームページ <http://www.sanofi-aventis.com/>）

### 2.1.2 製品例

サノフィ・アベンティスにはドラッグデリバリーシステムの製品はまだないが、インスリンの乾燥粉末を食前に吸入して糖尿病患者の血糖値上昇を抑える吸入型インスリン粉末が2004年3月に欧州で市販許可申請を受理されている。

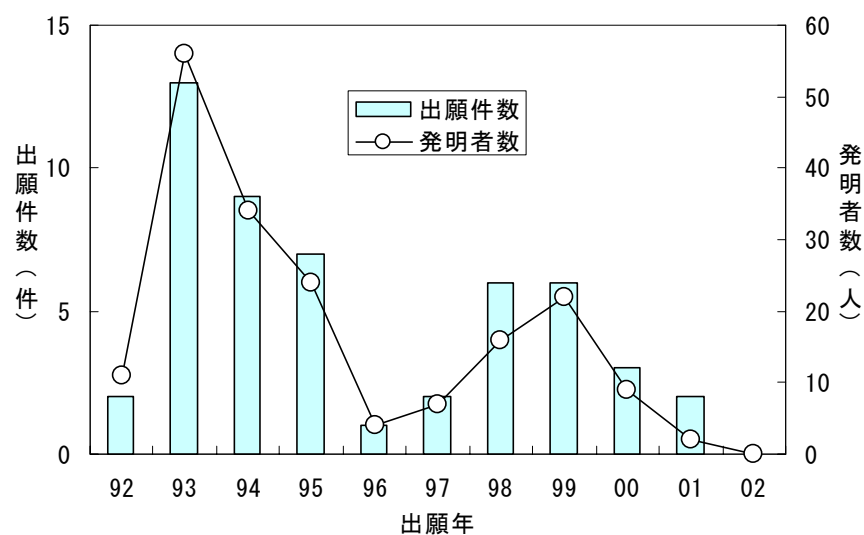
### 2.1.3 技術開発拠点と研究者

特許明細書に記載されているサノフィ・アベンティスの発明者の住所から調査した主な技術開発拠点は、次のとおりであり、主としてフランスから出願されている。

フランス パリ  
ドイツ マールブルグ  
カナダ オンタリオ州  
米国 ニュージャージー  
富山県 富山市

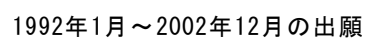
サノフィ・アベンティスの出願件数・発明者数の推移を図2.1.3に示す。1992～96年にかけて出願件数、発明者数が徐々に減少したが、その後、97年から再度増加に転じている。01年、02年については、PCTによる公開の遅れがあるため、判断できない。

図2.1.3 サノフィ・アベンティスの出願件数・発明者数の年次推移



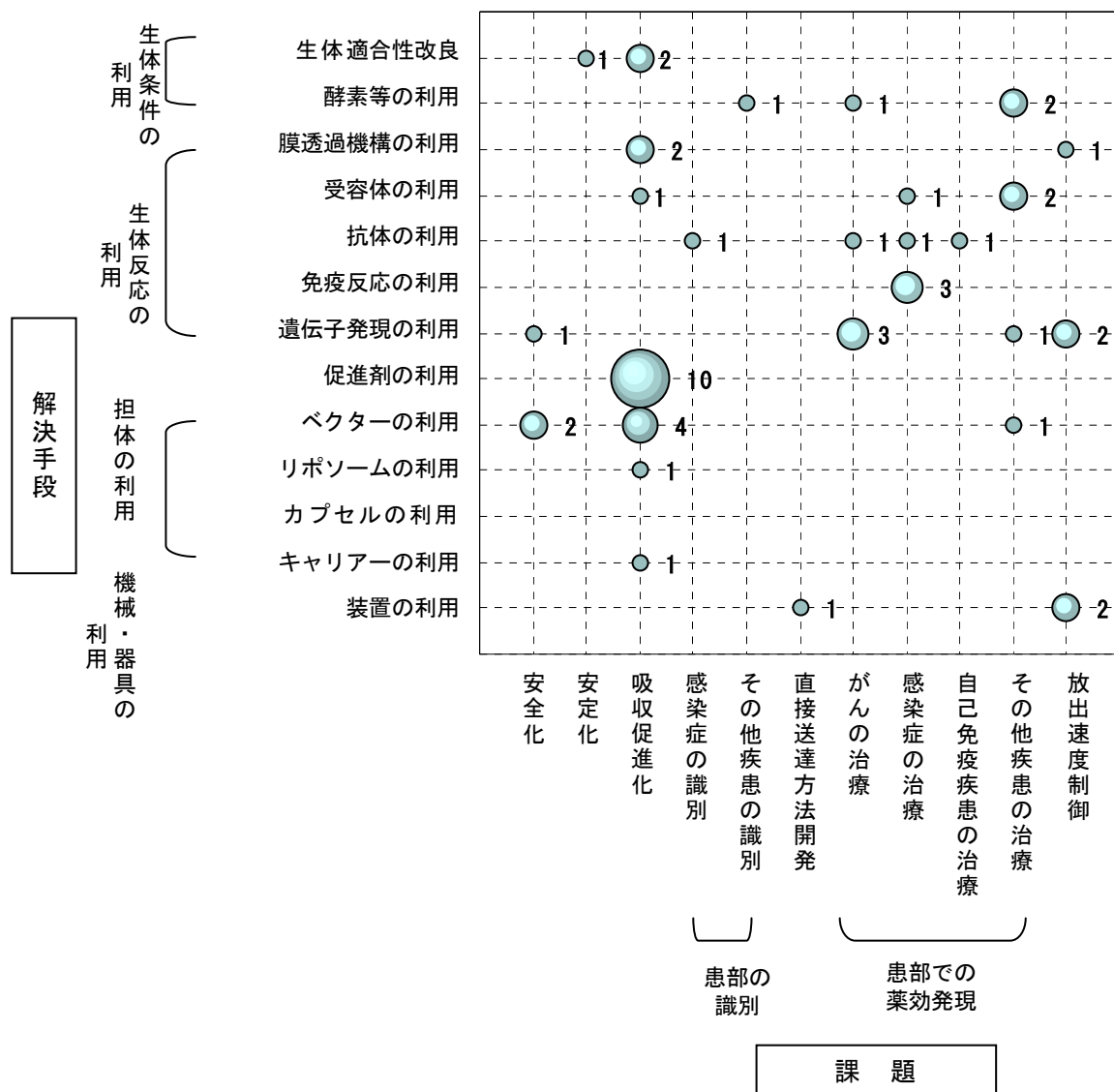
最近11年間（1992年1月～2002年12月）に出願されたサノフィ・アベンティスのドラッグデリバリーシステムに関する特許・実用新案の件数は50件であり、表2.1.4にその内容を示している。

図2.1.4 サノフィ・アベンティスの技術要素と課題の分布



サノフィ・アベンティスの課題と解決手段の分布を図2.1.4-2に示す。「吸収促進化」が最大の課題であり、促進剤の利用やベクターの利用が解決手段となっている。また、がんの治療という課題に対しては遺伝子発現の利用などが解決手段となっている。

図2.1.4-2 サノフィ・アベンティスの課題と解決手段の分布



1992年1月～2002年12月の出願

表2.1.4 サノフィ・アベンティスの技術要素別課題対応特許 (1/3)

| 技術要素<br>I II | 課題 I<br>課題 II      | 解決手段 I<br>解決手段 II   | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数] | 発明の名称<br>概要                                                                                                                   |
|--------------|--------------------|---------------------|----------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 薬放出制御技術      | 放出速度制御             | 生体反応の利用<br>膜透過機構の利用 | 特表 2002-529099<br>98.11.09<br>C12N15/09            | トランスジーンの新規な発現調節系                                                                                                              |
|              |                    | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利用 | 特開平 11-089587<br>97.07.21<br>C12N15/09             | 遺伝的に改変された細胞および疾患の予防または治療におけるそれらの使用                                                                                            |
|              |                    |                     | 特表 2003-512059<br>99.10.15<br>C12N15/09            | 自己切断するRNA配列、およびタンパク質合成を調節するためのその使用                                                                                            |
|              |                    | 機械・器具の利用<br>装置の利用   | 特開平 08-337540<br>(取下げ)<br>95.04.11<br>A61K45/00    | 薬力学パラメーターを定め薬物の投与法をデザインする方法                                                                                                   |
|              |                    |                     | 特表平 07-509696<br>92.07.23<br>A61K38/00             | 顆粒球コロニー形成刺激因子溶液の輸送方法                                                                                                          |
| 薬剤標的化技術      | 安定化                | 生体適合性改良             | 特表平 08-508491<br>(取下げ)<br>93.03.31<br>C07H21/04    | ホスホジエステル結合をアミド結合に置き換えたオリゴヌクレオチド                                                                                               |
|              | 患部の識別<br>感染症の識別    | 生体反応の利用<br>抗体の利用    | 特許 3534771<br>94.10.24<br>C12N1/20                 | Moraxellaの主要外層膜蛋白CD<br>Moraxella株から非変性外層膜蛋白CDを単離・精製し、診断に利用する特に、in vivoで宿主に投与して、CD蛋白と特異的に反応する抗体を誘発する病原菌によって引き起こされる疾患に対する予防を行う。 |
|              | 患部の識別<br>その他の疾患の識別 | 生体条件の利用<br>酵素等の利用   | 特表 2003-514895<br>99.11.22<br>A61K47/48            | 酵素的に除去可能な側鎖基を有するコーティング物質を含む担体システム                                                                                             |
|              | 直接送達方法開発           | 機械・器具の利用<br>装置の利用   | 特開平 10-236984<br>97.02.28<br>A61K 47/42            | 徐放性局所送達製剤                                                                                                                     |
|              | 患部での薬効発現<br>がんの治療  | 生体条件の利用<br>酵素等の利用   | 特表平 09-504955<br>93.11.18<br>C12N 15/09            | 癌における遺伝子治療のための組換えアデノウイルス                                                                                                      |
|              |                    | 生体反応の利用<br>抗体の利用    | 特表平 08-508879<br>93.04.22<br>C12N15/09             | 腫瘍の遺伝子療法のための欠陥組換えアデノウイルス                                                                                                      |
|              |                    | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利用 | 特表平 08-511162<br>93.06.16<br>C12N15/09             | 細胞内結合タンパク質(IBP)およびその使用                                                                                                        |
|              |                    |                     | 特表平 10-506526<br>94.08.26<br>C12N15/09             | 内皮細胞に特異的な細胞サイクルに依存する活性化合物を用いる腫瘍の遺伝子療法                                                                                         |
|              |                    |                     | 特表平 11-514881<br>(取下げ)<br>95.0.31<br>C12N15/09     | GAXタンパク質の癌治療への応用                                                                                                              |
|              | 患部での薬効発現<br>感染症の治療 | 生体反応の利用<br>受容体の利用   | 特表平 09-506247<br>93.11.08<br>C12N15/09             | ヘモフィリス属菌株トランスフェリン受容体遺伝子                                                                                                       |
|              |                    | 生体反応の利用<br>抗体の利用    | 特表平 11-506336<br>95.06.07<br>C12N15/09             | 免疫系選択細胞への抗原送達のためのキメラ抗体                                                                                                        |
|              |                    | 生体反応の利用<br>免疫反応の利用  | 特表平 08-511007<br>93.06.09<br>C07K14/155            | タンデム合成HIV-1ペプチド                                                                                                               |
|              |                    |                     | 特表平 11-500744<br>95.10.11<br>C07K14/195            | モラクセラ属菌由来トランスフェリン受容体タンパク質                                                                                                     |

表2.1.4 サノフィ・アベンティスの技術要素別課題対応特許 (2/3)

| 技術要素<br>I<br>II     | 課題 I<br>課題 II         | 解決手段 I<br>解決手段 II   | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]                                 | 発明の名称<br>概要                                           |
|---------------------|-----------------------|---------------------|------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------|
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | 患部での薬効発現<br>感染症の治療    | 生体反応の利用<br>免疫反応の利用  | 特表 2002-525028<br>98.07.27<br>C12N15/09                                            | Chlamydia抗原および対応するDNAフラグメントおよびそれらの使用                  |
|                     | 患部での薬効発現<br>自己免疫疾患の治療 | 生体反応の利用<br>抗体の利用    | 特開 2001-253900<br>00.01.11<br>C07K19/00                                            | アレルギー反応および自己免疫疾患の予防および処置のための接合体の製造方法およびそれらの使用         |
|                     | 患部での薬効発現<br>その他の疾患の治療 | 生体条件の利用<br>酵素等の利用   | 特開平 07-149666<br>93.09.22<br>A61K47/48                                             | プローブドラッグ、その製造および使用                                    |
|                     |                       |                     | 特開平 07-149666<br>93.09.22<br>A61K47/48                                             | プローブドラッグ、その製造および使用                                    |
|                     |                       | 生体反応の利用<br>受容体利用    | 特開平 10-004979<br>96.02.13<br>C12N15/09                                             | 細胞中に遺伝子を導入するための標的細胞に特異的なベクター、そのベクターを含んでなる医薬、およびそれらの使用 |
|                     |                       |                     | 特表平 10-507626<br>94.08.26<br>C12N15/09                                             | 細胞サイクルによつて変化する細胞に特異的な活性化化合物を用いる血管系の疾病の遺伝子療法           |
|                     |                       | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利用 | 特表平 10-502533<br>(取下げ)<br>94.07.12<br>C12N15/09                                    | NOシンターゼをコードする遺伝子を含むアデノウイルス                            |
|                     |                       | 担体の利用<br>ベクターの利用    | 特表平 08-509208<br>93.03.03<br>A61K48/00<br>アンスチ、ナシ<br>オナル ド ラ<br>ンテ エ ド ラ<br>ルシエルシエ | 組み換えアデノウイルスおよび眼疾患の治療のための遺伝子療法におけるそれらの使用               |
| 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 吸収促進化                 | 生体反応の利用<br>膜透過機構の利用 | 特開 2000-166579<br>98.12.02<br>C12N15/09                                            | 血液凝固因子とP-セレクトインのDNA構築体                                |
|                     |                       | 生体反応の利用<br>受容体利用    | 特表 2003-505517<br>99.07.28<br>A61K47/48                                            | 接合体ならびにそれらの製造方法および生体膜を横切り分子を輸送するためのそれらの使用             |
|                     |                       | 促進剤の利用              | 特表 2002-513543<br>98.04.02<br>C12N15/09                                            | 新規核酸移入剤とそれらを含む組成物及びそれらの使用                             |
|                     |                       |                     | 特表 2004-505049<br>00.08.01<br>A61K31/421                                           | ペフロキサトンの経皮投与用の医薬組成物                                   |
|                     |                       |                     | 特表 2004-512275<br>00.08.25<br>C07K14/47                                            | 膜透過性ペプチドおよびその使用                                       |
|                     |                       | 担体の利用<br>ベクターの利用    | 特表平 08-509373<br>93.04.30<br>C12N15/09                                             | 組換えウイルスおよび遺伝子療法におけるそれらの使用                             |
| 薬剤吸収制御技術<br>遺伝子導入技術 | 安全化                   | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利用 | 特開平 11-285394<br>98.02.20<br>C12N15/09                                             | DNA配列の遺伝子輸送用アデノウイルストランスファーベクター                        |
|                     |                       | 担体の利用<br>ベクターの利用    | 特表平 10-506018<br>94.09.27<br>C12N7/00                                              | 不活化IVa2遺伝子を有する欠陥組換えアデノウイルス                            |
|                     |                       |                     | 特表平 10-507922<br>94.10.28<br>C12N7/00                                              | 生存汚染粒子を持たないアデノウイルス、その製造および使用                          |



表2.1.4 サノフィ・アベンティスの技術要素別課題対応特許 (3/3)

| 技術要素<br>I II        | 課題 I<br>課題 II | 解決手段 I<br>解決手段 II   | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]                                   | 発明の名称<br>概要                                     |
|---------------------|---------------|---------------------|--------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------|
| 薬剤吸収制御技術<br>遺伝子導入技術 | 吸収促進化         | 生体適合性改良             | 特表平 09-505982<br>93.09.13<br>C12N15/09                                               | アデノ関連ウイルス(AAV)リポソームおよびそれに関連する方法                 |
|                     |               |                     | 特表 2003-503362<br>99.06.24<br>A61K48/00                                              | 新規なベクター複合体および遺伝子治療のためのその使用                      |
|                     |               | 生体反応の利用<br>膜透過機構の利用 | 特表平 11-512704<br>95.09.28<br>A61K48/00                                               | 核酸のトランスフェクションに有用な医薬組成物及びその使用                    |
|                     |               | 促進剤の利用              | 特表平 09-508100<br>94.01.10<br>A61K31/70                                               | 核酸を含む組成物、調製および使用                                |
|                     |               |                     | 特表平 10-502918<br>94.07.13<br>A61K48/00                                               | 核酸を含有する組成物、その製造および使用                            |
|                     |               |                     | 特表平 10-509958<br>94.12.05<br>C07C23/506                                              | トランスフェクション剤としてのリポポリアミン及びその医薬への使用                |
|                     |               |                     | 特表平 11-500431<br>95.02.17<br>A61K48/00                                               | 核酸を含む組成物、その製造及び使用                               |
|                     |               |                     | 特表 2000-501383<br>95.11.14<br>C07C23/706                                             | トランスフェクション剤としてのリポポリアミン及びその医薬的使用                 |
|                     |               |                     | 特表 2002-501762<br>98.01.30<br>C12N15/09                                              | 還元性条件に感受性のトランスフェクション用組成物、該組成物を含有する医薬組成物及びそれらの用途 |
|                     |               |                     | 特表 2003-513078<br>99.11.05<br>C07D23/520                                             | オリゴベンズイミダゾール誘導体及びDNA形質転換剤としてのそれらの使用             |
|                     |               | 担体の利用<br>ベクターの利用    | 特表平 08-501686<br>92.09.25<br>C12N15/09<br>アンスチ ナシ<br>オナル ド ラ サ<br>ンテ エ ド ラ<br>ルシエルシェ | 中枢神経系、特に脳における細胞への外来遺伝子の転移のためのアデノウイルスベクター        |
|                     |               |                     | 特表平 08-501703<br>93.07.13<br>C12N7/00                                                | 欠陥組換えアデノウイルスベクター及び遺伝子治療での使用                     |
|                     |               |                     | 特表平 08-510122<br>93.05.18<br>C12N15/09                                               | 動物起源のアデノウイルスベクターおよび遺伝子治療におけるそれらの使用              |
|                     |               | 担体の利用<br>リポソームの利用   | 特表 2003-501373<br>99.06.02<br>A61K48/00                                              | 新規なリポソームベクター複合体および遺伝子療法でのそれらの使用                 |
|                     |               | 担体の利用<br>キャリアーの利用   | 特表 2004-518752<br>01.02.19<br>A61K48/00                                              | 強化された細胞内輸送のためのポリヌクレオチド配合物                       |

## 2.2 ジョンソンアンドジョンソン（米国）

### 2.2.1 企業の概要

|       |                                                               |
|-------|---------------------------------------------------------------|
| 商号    | Johnson & Johnson                                             |
| 本社所在地 | One Johnson & Johnson Plaza, New Brunswick, NJ 08993 U. S. A. |
| 設立年   | 1887年                                                         |
| 資本金   | 3,120百万米ドル（2003年12月末）                                         |
| 従業員数  | 約110,600名（連結：2003年12月末）                                       |
| 事業内容  | スキンケア・オーラルケア製品、一般用医薬品、医療用医薬品、医療機器・用具、コンタクトレンズ等の製造・販売          |

ジョンソンアンドジョンソンは、世界57カ国に拠点をもち、175カ国以上で製品を販売している。その事業は、大きく、コンシューマー製品（創傷被覆テープ、ローションなどのスキンケア製品、歯ブラシなどのオーラルケア製品、解熱鎮痛剤などの一般用医薬品）、医療用医薬品、医療用器具の3つのセグメントに分けられる。

医薬部門では、2001年にドラッグデリバリーシステム技術を有するアルザ（ALZA Corporation）を買収するなど買収による展開を積極的に進めている。

（出典：ジョンソンアンドジョンソンのホームページ <http://www.jnj.com/>）

### 2.2.2 製品例

ジョンソンアンドジョンソンのドラッグデリバリーシステムとしては、傘下のアルザが有する経口デリバリーシステム、経皮吸収システム、埋め込み型システムがある。

製品としては、慢性疼痛治療薬と禁煙補助製品がある。

（出典：ジョンソンアンドジョンソンのホームページ <http://www.jnj.com/>）

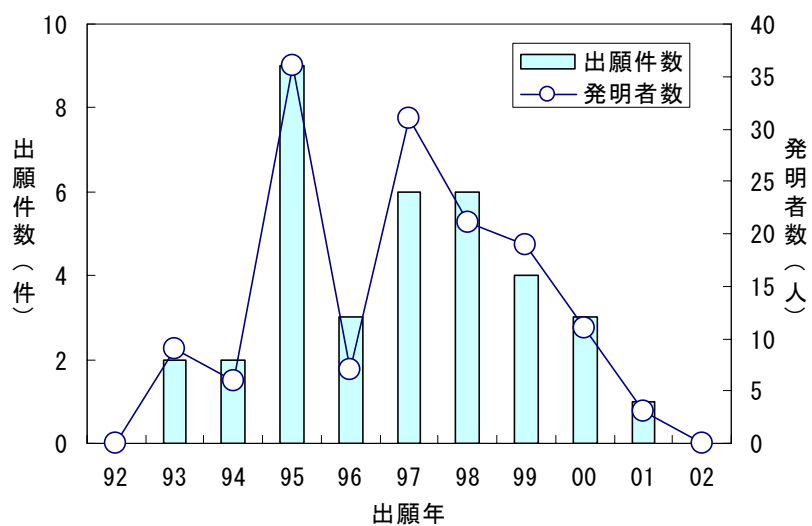
### 2.2.3 技術開発拠点と研究者

特許明細書に記載されているジョンソンアンドジョンソンの発明者の住所から調査した主な技術開発拠点は、次のとおりであり、主として合併したアルザの研究開発拠点である米国カリフォルニア州から出願されている。

米国 カリフォルニア州  
米国 ニュージャージー州  
イスラエル エルサレム  
イタリア ローマ

ジョンソンアンドジョンソンの出願件数・発明者数の推移を図2.2.3に示す。1995年は急激に出願件数、発明者数が増加したが、96年に減少した。その後、97年に再度増加したが、99年から徐々に減少している。

図2.2.3-1 ジョンソンアンドジョンソンの出願件数・発明者数の年次推移

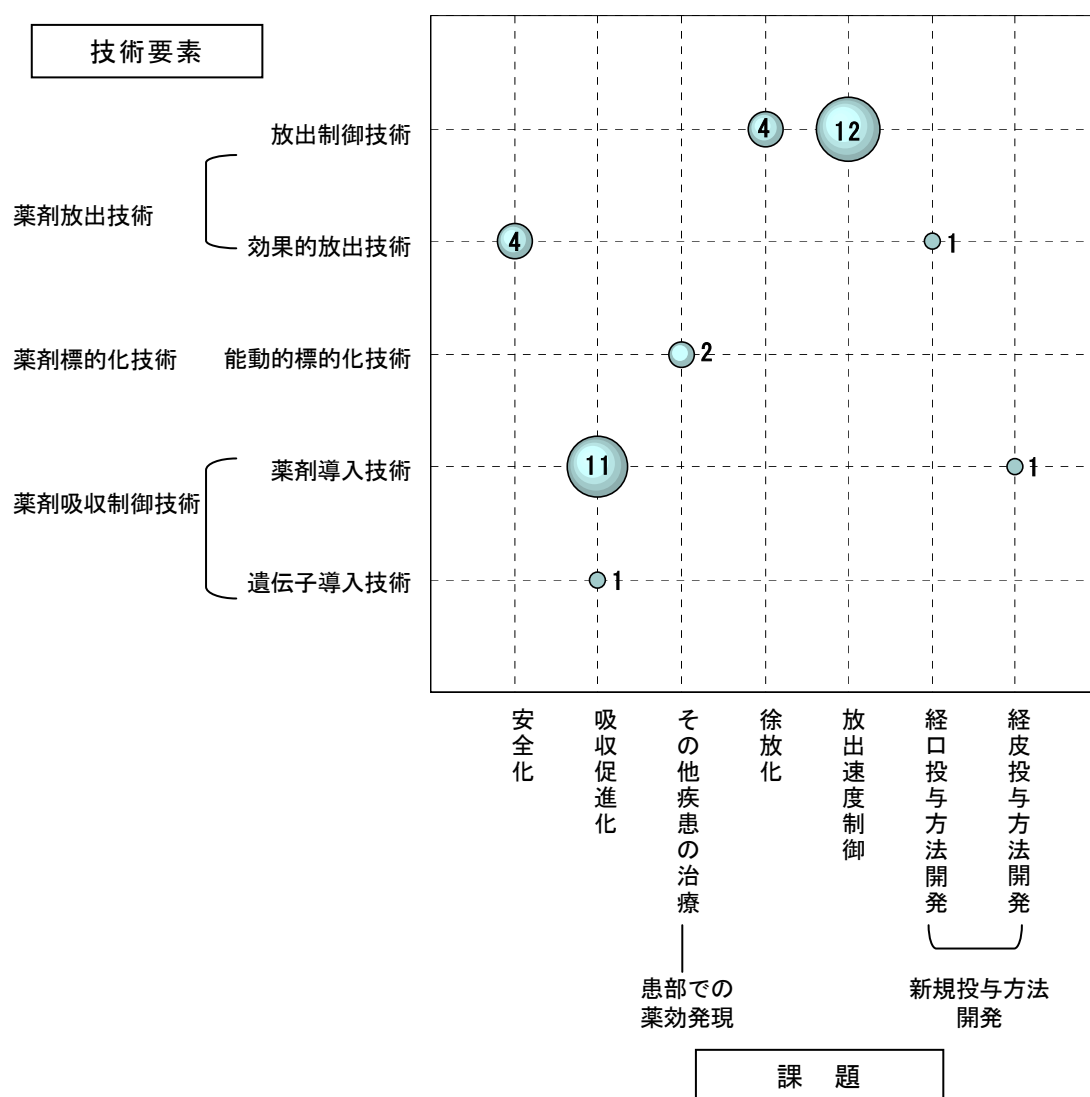


## 2.2.4 技術開発課題対応特許の概要

最近11年間（1992年1月～2002年12月）に出願されたジョンソンアンドジョンソンのドラッグデリバリーシステムに関する特許・実用新案の件数は36件であり、表2.2.4にその内容を示している。

図2.2.4-1にジョンソンアンドジョンソンの技術要素と課題の分布を示す。「薬剤放出技術」、「薬剤標的化技術」、「薬剤吸収制御技術」の3つの分野に出願している。技術要素で最も多いのは、「放出制御技術」の16件であり、次いで「薬剤導入技術」が12件である。「放出制御技術」の課題は「放出速度制御」であり、「薬剤導入技術」の課題は「吸収促進化」である。

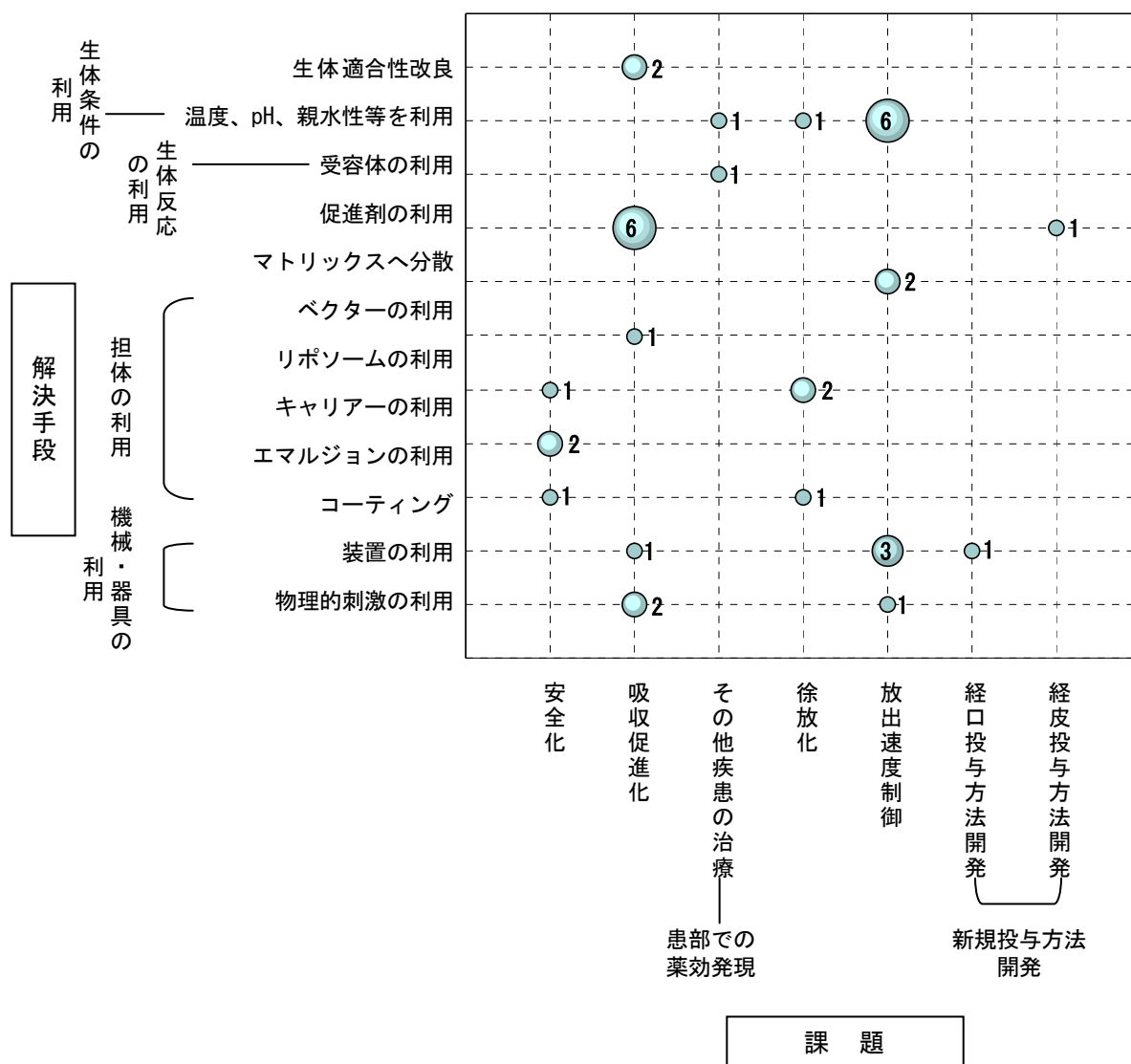
図2.2.4-1 ジョンソンアンドジョンソンの技術要素と課題の分布



1992年1月～2002年12月の出願

ジョンソンアンドジョンソンの課題と解決手段の分布を図2.2.4-2に示す。課題としては「吸収促進化」や「放出速度制御」を目指したものが多い。「吸収促進化」に対しては、「促進剤の利用」や「生体適合性改良」、「物理的刺激の利用」などにより解決している。「放出速度制御」に対しては、「温度、pH、親水性等を利用」によって解決している。

図2.2.4-2 ジョンソンアンドジョンソンの課題と解決手段の分布



1992年1月～2002年12月の出願

表2.2.4-1 ジョンソンアンドジョンソンの技術要素別課題対応特許 (1/3)

| 技術要素<br>I II | 課題<br>I II | 解決手段 I<br>解決手段 II        | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数] | 発明の名称<br>概要                   |
|--------------|------------|--------------------------|---------------------------------------------------|-------------------------------|
| 薬放出制御技術      | 徐放化        | 生体条件の利用<br>温度、pH、親水性等の利用 | 特表2003-509354<br>99.09.15<br>A61K3/15             | 1日1回投与で有効なレボキセチン治療を与える製剤及び方法  |
|              |            | 担体の利用<br>キャリアーの利用        | 特表2000-501429<br>96.09.13<br>A61K7/48             | 局所治療用および化粧用製剤の組成物基剤           |
|              |            |                          | 特表2001-512480<br>97.02.19<br>A61K47/48            | 持続的薬物送達およびそれに有用な組成物           |
|              |            | 担体の利用<br>コーティング          | 特表平08-510755<br>93.05.27<br>A61K31/135            | 抗鬱薬投薬形態                       |
|              | 放出速度制御     | 生体条件の利用<br>温度、pH、親水性等の利用 | 特開平09-100235<br>95.06.07<br>A61K33/18             | 架橋ポリビニルピロリドン-ヨウ素複合物及びその製造方法   |
|              |            |                          | 特表平09-502182<br>93.08.31<br>A61K47/34             | 疎水性剤を含有するディスペンサー              |
|              |            |                          | 特表平10-507440<br>(取下げ)<br>94.06.27<br>A61K31/47    | タクリン医薬製剤                      |
|              |            |                          | 特表2001-510791<br>97.07.25<br>A61K9/52             | 半透性プラグを備えた浸透投与系               |
|              |            |                          | 特表2001-510792<br>97.07.25<br>A61K9/52             | 浸透投与系フローモジュレーター装置             |
|              |            |                          | 特表2003-514847<br>99.11.22<br>A61K9/24             | 第一コートおよび第二コートを含む浸透圧性剤形        |
|              |            | マトリックスへ分散                | 特表2002-541094<br>99.04.01<br>A61K47/34            | ポリウレタン薬物貯蔵部を含んでなる経皮薬物送達装置     |
|              |            |                          | 特表2002-501886<br>98.01.30<br>A61K38/00            | ペプチドまたはタンパク質の制御放出送達           |
|              |            | 機械・器具の利用<br>装置の利用        | 特表平11-505264<br>95.05.22<br>A61K31/215            | オキシブチニンを含んで成る剤形               |
|              |            |                          | 特表2001-526214<br>97.12.22<br>A61K9/70             | 薬剤供給を調節するデバイスのための速度調節膜        |
|              |            |                          | 特表2004-508319<br>00.09.08<br>A61K9/70             | 経路閉鎖を阻害することによる経皮的薬物流動の減少の抑制方法 |
|              |            | 機械・器具の利用<br>物理的刺激の利用     | 特表2000-514065<br>97.07.03<br>A61K9/70             | ドラッグデリバリーデバイスとその製造法           |
| 効果的放出技術      | 安定化        | 担体の利用<br>エマルジョンの利用       | 特表平11-506730<br>95.06.07<br>A61K9/10              | ペプチド/タンパク質懸濁配合物               |
|              |            |                          | 特表2002-524407<br>98.09.09<br>A61K9/52             | 液体配合物を含んで成る剤形                 |
|              |            | 担体の利用<br>キャリアーの利用        | 特表2002-533380<br>98.12.23<br>A61K9/16             | 多孔性粒子を含む剤形                    |

表2.2.4-1 ジョンソンアンドジョンソンの技術要素別課題対応特許 (2/3)

| 技術要素<br>I II                   | 課題<br>I II            | 解決手段 I<br>解決手段 II        | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]                        | 発明の名称<br>概要                         |
|--------------------------------|-----------------------|--------------------------|--------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------|
| 効果的放出技術<br>薬剤放出技術              | 安定化                   | 担体の利用<br>コーティング          | 特表2002-532569<br>98.12.22<br>A61K9/70                                    | ポリマー膜薬物貯蔵                           |
|                                | 経口投与方法開発              | 機械・器具の利用<br>装置の利用        | 特表平11-507340<br>95.06.07<br>A61K48/00                                    | 遺伝子構築物の経口送出                         |
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術            | その他の疾患の治療<br>患部での薬効発現 | 生体条件の利用<br>温度、pH、親水性等の利用 | 特表2004-525138<br>01.03.26<br>A61K91/27                                   | 治療剤の改良された細胞内送達のためのリポソーム組成物          |
|                                |                       | 生体反応の利用<br>受容体利用         | 特表2002-532407<br>98.12.18<br>A61K47/48<br>ハダシット メディカル リサーチ サービスズ アンド DEV | 多薬物耐性細胞に対する化合物の投与方法                 |
| 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術<br>薬剤吸収制御技術 | 吸収促進化                 | 生体適合性改良                  | 特表平11-507341<br>95.06.06<br>C07K14/47                                    | 電気輸送流量を増加させる、ポリペプチド系薬物の修飾           |
|                                |                       | 促進剤の利用                   | 特表平10-503184<br>94.07.13<br>A61K47/16                                    | 経皮電氣的移送式作用剤投与を促進するための組成物と方法         |
|                                |                       |                          | 特表平11-504229<br>95.04.28<br>A61N1/30                                     | 電氣的輸送薬剤分配を増進する組成物および方法              |
|                                |                       |                          | 特表平11-504237<br>95.04.28<br>A61N1/30                                     | 電氣的移送式作用剤投与を促進する組成物及び方法             |
|                                |                       |                          | 特表平11-512073<br>95.06.07<br>A61K47/14                                    | グリセロールモノラウレートとラウリルアセートを含む皮膚透過増強剤組成物 |
|                                |                       |                          | 特表2001-522793<br>97.11.12<br>A61K9/00                                    | 経皮電気輸送送達用の緩衝処理された薬物処方物              |
|                                |                       |                          | 特表2002-531526<br>98.12.04<br>A61K9/06                                    | 無水状態の局所的皮膚調製剤                       |
|                                |                       |                          | 特表2003-511405<br>99.10.08<br>C07D23/302                                  | 核酸および薬剤送達用の中性-カチオン性脂質               |
|                                |                       |                          | 特表2004-520152<br>00.10.26<br>A61M37/00                                   | 被覆された微細突出物を有する経皮的薬剤配達装置             |
|                                |                       |                          | 特表2001-506263<br>96.12.17<br>A61K9/00                                    | 電気輸送放出装置用のポリマーフォーム貯蔵槽               |
|                                |                       |                          | 特表2004-508148<br>00.09.11<br>A61N1/30                                    | 経皮性の電気輸送装置とその製造方法                   |

表2.2.4-1 ジョンソンアンドジョンソンの技術要素別課題対応特許（3/3）

| 技術要素<br>I II        | 課題<br>I II           | 解決手段 I<br>解決手段 II | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数] | 発明の名称<br>概要      |
|---------------------|----------------------|-------------------|---------------------------------------------------|------------------|
| 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 経皮投与方法開発<br>新規投与方法開発 | 促進剤の利用            | 特表平11-507361<br>95.06.07<br>A61K31/48             | ペルゴライドの経皮放出用新規製剤 |
| 薬剤吸収制御技術<br>遺伝子導入技術 | 吸収促進化                | 生体適合性改良           | 特表2001-504093<br>96.10.11<br>A61K91/27            | 融合性リポソーム組成物および方法 |



## 2.3 カリフォルニア大学（米国）

### 2.3.1 大学の概要

|       |                                                                                                    |
|-------|----------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 名称    | The University of California                                                                       |
| 本部所在地 | 111 Franklin Street, Oakland, CA 94607 U.S.A.                                                      |
| 設立年   | 1869年                                                                                              |
| 教職員数  | 約160,000名                                                                                          |
| 概要    | カリフォルニア州内に9つのキャンパス (Berkeley、Davis、Irvine、Los Angeles、Riverside、San Diego、San Francisco等) を有する総合大学 |

カリフォルニア大学は、遺伝子組み換え技術の基本特許を有していた大学であり、バイオテクノロジー、ヘルスケア分野における研究を活発に推進している。

（出典：カリフォルニア大学のホームページ <http://www.universityofcalifornia.edu/>）

### 2.3.2 製品例

ドラッグデリバリーシステムに関する研究を行っているが、製品はない。

### 2.3.3 技術開発拠点と研究者

特許明細書に記載されているカリフォルニア大学の発明者の住所から調査した主な技術開発拠点は、次のとおりであり、主として米国から出願されている。

米国 カリフォルニア州

カナダ ウィニペグ州

メキシコ モレロズ

スイス ジュネーブ

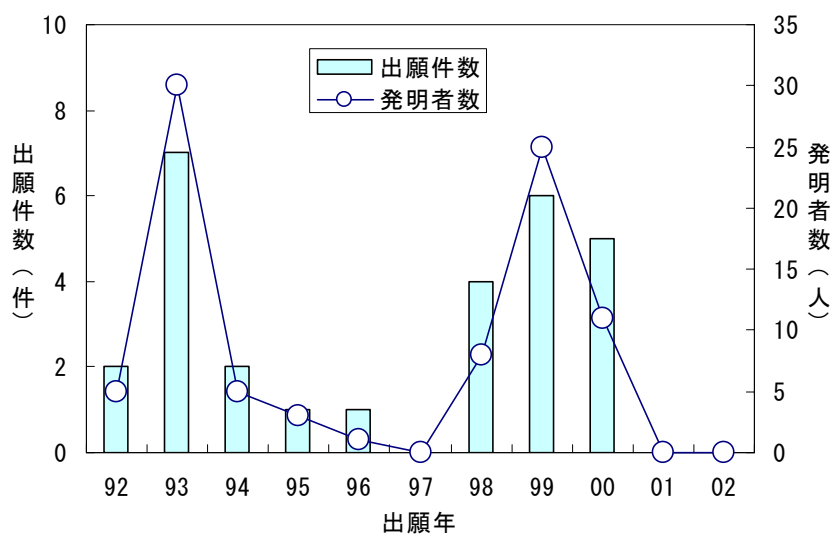
ドイツ ブレーメン

フランス プティート-ロセル リュ プランシパル

千葉県 千葉市

カリフォルニア大学の出願件数・発明者数の推移を図2.3.3に示す。1993年と99年をピークとして出願件数、発明者数が増加し減少している。01年と02年に出願が見られないのは、PCT出願のためにまだ公開されていないためと考えられる。

図2.3.3 カリフォルニア大学の出願件数・発明者数の年次推移

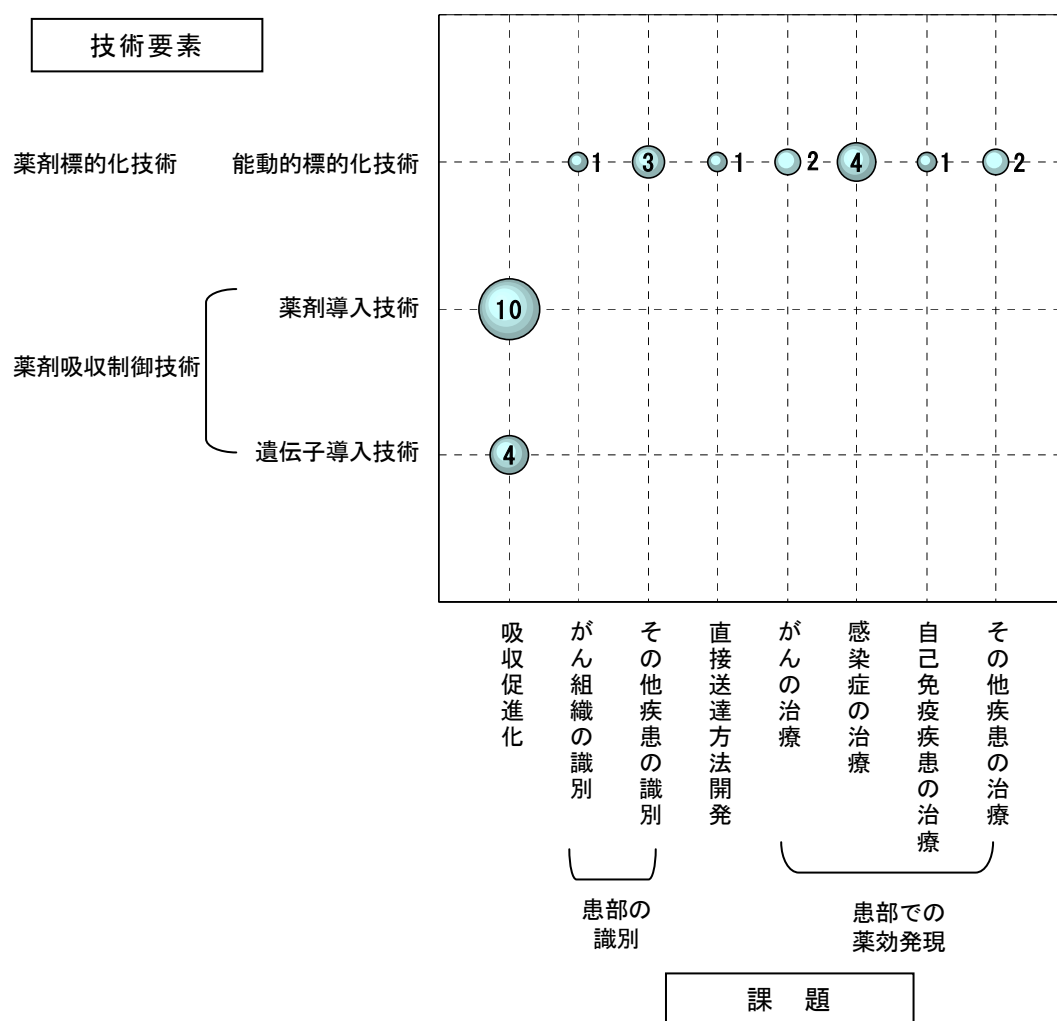


### 2.3.4 技術開発課題対応特許の概要

最近11年間（1992年1月～2002年12月）に出願されたカリフォルニア大学のドラッグデリバリーシステムに関する特許・実用新案の件数は28件であり、表2.3.4にその内容を示している。

図2.3.4-1にカリフォルニア大学の技術要素と課題の分布を示す。薬剤標的化技術と薬剤吸収制御技術に出願している。「薬剤導入技術」に関する「吸収促進化」が最も大きな課題であり、「遺伝子導入技術」に関する「吸収促進化」も大きな課題となっている。薬剤標的化技術の「能動的標的化技術」に関する「患部の識別」および「患部での薬効発現」も大きな課題となっている。

図2.3.4-1 カリフォルニア大学の技術要素と課題の分布



1992年1月～2002年12月の出願

カリフォルニア大学の課題と解決手段の分布を図2.3.4-2に示す。「吸収促進化」という課題に対しては、ベクターやリポソームのような「担体の利用」や「促進剤の利用」をはじめ、「膜透過性の利用」などの「生体反応の利用」といった解決手段が採られている。また、「感染症の治療」などでは、「遺伝子発現の利用」が解決手段として用いられている。「患部の識別」および「患部での薬効発現」という課題に対しては、「受容体の利用」などの生体反応を利用した解決手段が採られている。

図2.3.4-2 カリフォルニア大学の課題と解決手段の分布

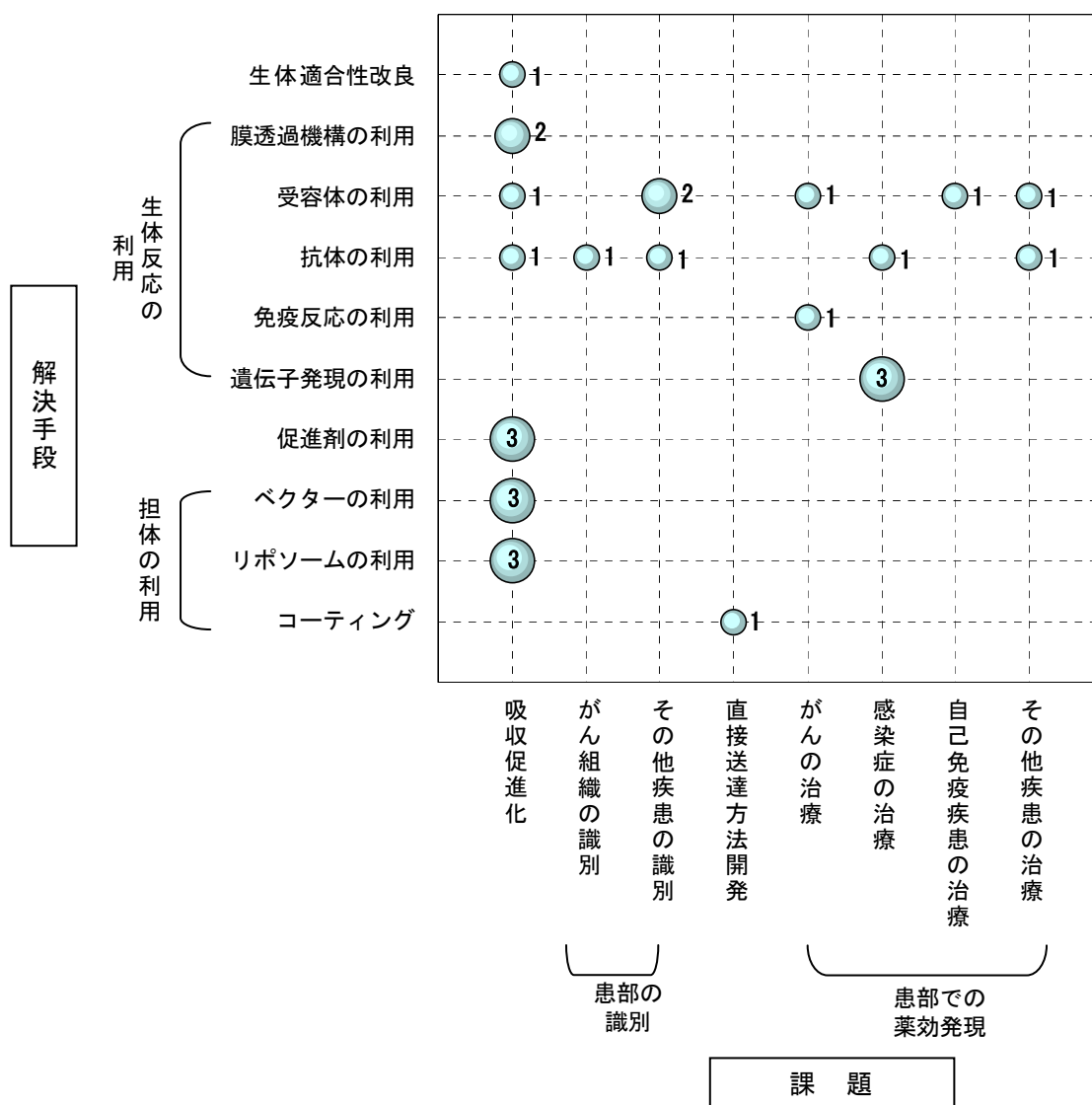


表2.3.4 カリフォルニア大学の技術要素別課題対応特許 (1/2)

| 技術要素<br>I II        | 課題<br>I II            | 解決手段 I<br>解決手段 II   | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数] | 発明の名称<br>概要                                              |
|---------------------|-----------------------|---------------------|---------------------------------------------------|----------------------------------------------------------|
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | がん組織の識別               | 生体反応の利用<br>抗体の利用    | 特表平 07-506484<br>92.01.29<br>C12P21/08<br>サイークロン  | カルチノーマ関連抗原 (SK1), SK1 に対するモノクローナル抗体, これら抗体を産生する方法及びその使用  |
|                     | その他の疾患の識別             | 生体反応の利用<br>受容体利用    | 特表平 09-504790<br>93.11.01<br>A61K9/50             | 化学的触媒作用および細胞受容体活性化のための生化学的活性物質                           |
|                     |                       | 生体反応の利用<br>受容体利用    | 特表 2003-528891<br>00.03.27<br>A61K47/42           | 非分泌性成分に対するリガンド、pIgR の非ストーク領域およびその使用方法                    |
|                     |                       | 生体反応の利用<br>抗体の利用    | 特表 2003-513027<br>99.10.26<br>A61K51/00           | アテローム性動脈硬化症の診断、結像、治療用の薬剤及びその方法                           |
|                     | 直接送達方法開発              | 担体の利用<br>コーティング     | 特表 2002-534485<br>99.01.11<br>A61K38/00           | ペプチド類およびタンパク質類の経口送達用粒子                                   |
|                     | がんの治療<br>患部での薬効発現     | 生体反応の利用<br>受容体利用    | 特表 2003-522195<br>00.02.10<br>A61K39/00           | 肝細胞癌の治療のための方法及び組成物                                       |
|                     |                       | 生体反応の利用<br>免疫反応の利用  | 特表平 10-509702<br>94.11.03<br>A61K48/00            | 腫瘍関連抗原ペプチドをコードする裸のポリヌクレオチドの投与によって腫瘍関連抗原に対して宿主を免疫する方法及び装置 |
|                     | 感染症の治療<br>患部での薬効発現    | 生体反応の利用<br>抗体の利用    | 特表平 08-508980<br>93.03.31<br>C07K16/12            | クローン化レプトスピラ外膜タンパク質                                       |
|                     |                       | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利用 | 特表平 08-510134<br>93.05.17<br>C12N15/09            | HIV 感染およびエイズを対象としたリボザイム遺伝子治療                             |
|                     |                       |                     | 特表平 10-509037<br>(却下)<br>94.11.10<br>C12N9/50     | 機能不全プロテアーゼ形成によるタンパク質分解活性の抑制                              |
|                     |                       |                     | 特表 2004-505892<br>00.05.12<br>A61K48/00           | ヒトパピローマウイルス (HPV) - 感染細胞の治療                              |
|                     | 自己免疫疾患の治療<br>患部での薬効発現 | 生体反応の利用<br>受容体利用    | 特表平 08-509720<br>93.05.03<br>A61K38/00<br>ジェネンテック | 白血球接着阻害                                                  |

表2.3.4 カリフォルニア大学の技術要素別課題対応特許 (2/2)

| 技術要素<br>I II        | 課題<br>I II | 解決手段 I<br>解決手段 II   | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]       | 発明の名称<br>概要                                     |
|---------------------|------------|---------------------|----------------------------------------------------------|-------------------------------------------------|
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | 患部での疾患の治療  | 生体反応の利用<br>受容体の利用   | 特表平 07-507689<br>(拒絶)<br>92.06.08<br>C12N15/09           | 特定組織のターゲティング方法及び組成物                             |
|                     |            | 生体反応の利用<br>抗体の利用    | 特表 2004-525858<br>00.04.25<br>A61K48/00                  | 脳への非侵襲性遺伝子ターゲティング                               |
| 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 吸収促進化      | 生体適合性改良             | 特表 2002-544243<br>99.05.14<br>A61K47/20                  | 薬剤および診断薬の送達のための高分子担体                            |
|                     |            | 生体反応の利用<br>膜透過機構の利用 | 特表平 11-508240<br>95.06.07<br>C07F9/09                    | 膜透過性第2メッセンジャー                                   |
|                     |            |                     | 特表 2000-507225<br>96.03.08<br>A61K39/395                 | mab 3E10 ならびにその突然変異体および／または機能的フラグメントを使用する送達システム |
|                     |            | 生体反応の利用<br>受容体の利用   | 特表平 09-500381<br>(拒絶)<br>93.07.16<br>C07K16/46<br>アルカームズ | トランスフェリン受容体特異的リガンドー神経作用剤融合タンパク質                 |
|                     |            | 生体反応の利用<br>抗体の利用    | 特表 2002-513156<br>98.04.24<br>G01N33/68                  | インターナライズする抗体を選択する方法                             |
|                     |            | 促進剤の利用              | 特表 2003-516306<br>98.04.24<br>C07F91/17                  | 膜透過性ホスホイノシチド                                    |
|                     |            | 担体の利用<br>ベクターの利用    | 特表 2002-539176<br>99.03.15<br>A61K48/00<br>カイロン          | 眼の疾患を処置または予防するための組換え遺伝子送達ベクターの使用                |
|                     |            | 担体の利用<br>リボソームの利用   | 特表平 09-501146<br>93.06.03<br>A61K51/00                   | ホウ素を使った中性子捕獲療法のための組成物およびその使用法                   |
|                     |            |                     | 特表 2002-510713<br>98.04.03<br>C07C22/906                 | ペンタエリトリール脂質誘導体                                  |
|                     |            |                     | 特表 2003-510345<br>99.10.07<br>C07D49/308                 | オルトエステル脂質                                       |
| 薬剤吸収制御技術<br>遺伝子導入技術 | 吸収促進化      | 促進剤の利用              | 特表平 09-500136<br>93.07.14<br>A61K48/00                   | 樹枝状体ポリ陽イオンを含む自己集合性ポリヌクレオチド配送系                   |
|                     |            |                     | 特表 2002-502885<br>98.02.11<br>A61K48/00                  | 増強された遺伝子送達のための、核酸および血管作用性薬剤の組合せ                 |
|                     |            | 担体の利用<br>ベクターの利用    | 特表 2003-513942<br>99.11.05<br>A61K48/00                  | インビボ遺伝子送達による心血管疾患を処理するための技術および組成物               |
|                     |            |                     | 特表 2003-520597<br>00.01.21<br>C12N15/09                  | 組換えフラビウイルスおよびその使用方法                             |

## 2.4 ジェネンテック（米国）

### 2.4.1 企業の概要

|       |                                                      |
|-------|------------------------------------------------------|
| 商号    | Genentech, Inc.                                      |
| 本社所在地 | 1 DNA Way, South San Francisco, CA 94080-4990 U.S.A. |
| 設立年   | 1976年                                                |
| 資本金   | 10百万米ドル（2003年12月末）                                   |
| 従業員数  | 6,226名（連結：2003年12月末）                                 |
| 事業内容  | バイオ医薬品の開発・製造・販売                                      |

ジェネンテックは、1982年に世界で初めての遺伝子組換え医薬であるヒトインスリンを開発した。ヒト成長ホルモンや喘息の抗体医薬などのバイオ医薬品を開発している。

（出典：ジェネンテックのホームページ <http://www.gene.com/>）

### 2.4.2 製品例

ジェネンテックは、ドラッグデリバリーシステムの研究を行っているが、製品はない。

### 2.4.3 技術開発拠点と研究者

特許明細書に記載されているジェネンテックの発明者の住所から調査した主な技術開発拠点は、次のとおりであり、主として米国から出願されている。

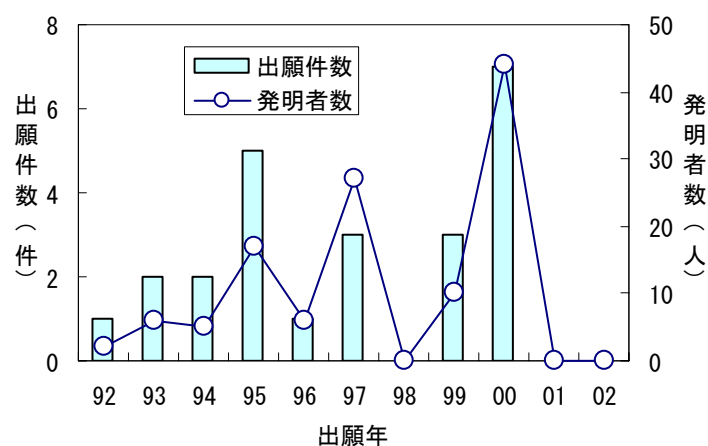
米国 カリフォルニア州

オーストリア ウィーン

イギリス ノースヨークシャー

ジェネンテックの出願件数・発明者数の推移を図2.4.3に示す。1996～98年に出願件数、発明者数が減少したが、その後、出願件数、発明者数が増加している。01年と02年の出願が見られないのは、PCT出願のためにまだ公開されていないためと考えられる。

図2.4.3 ジェネンテックの出願件数・発明者数の年次推移

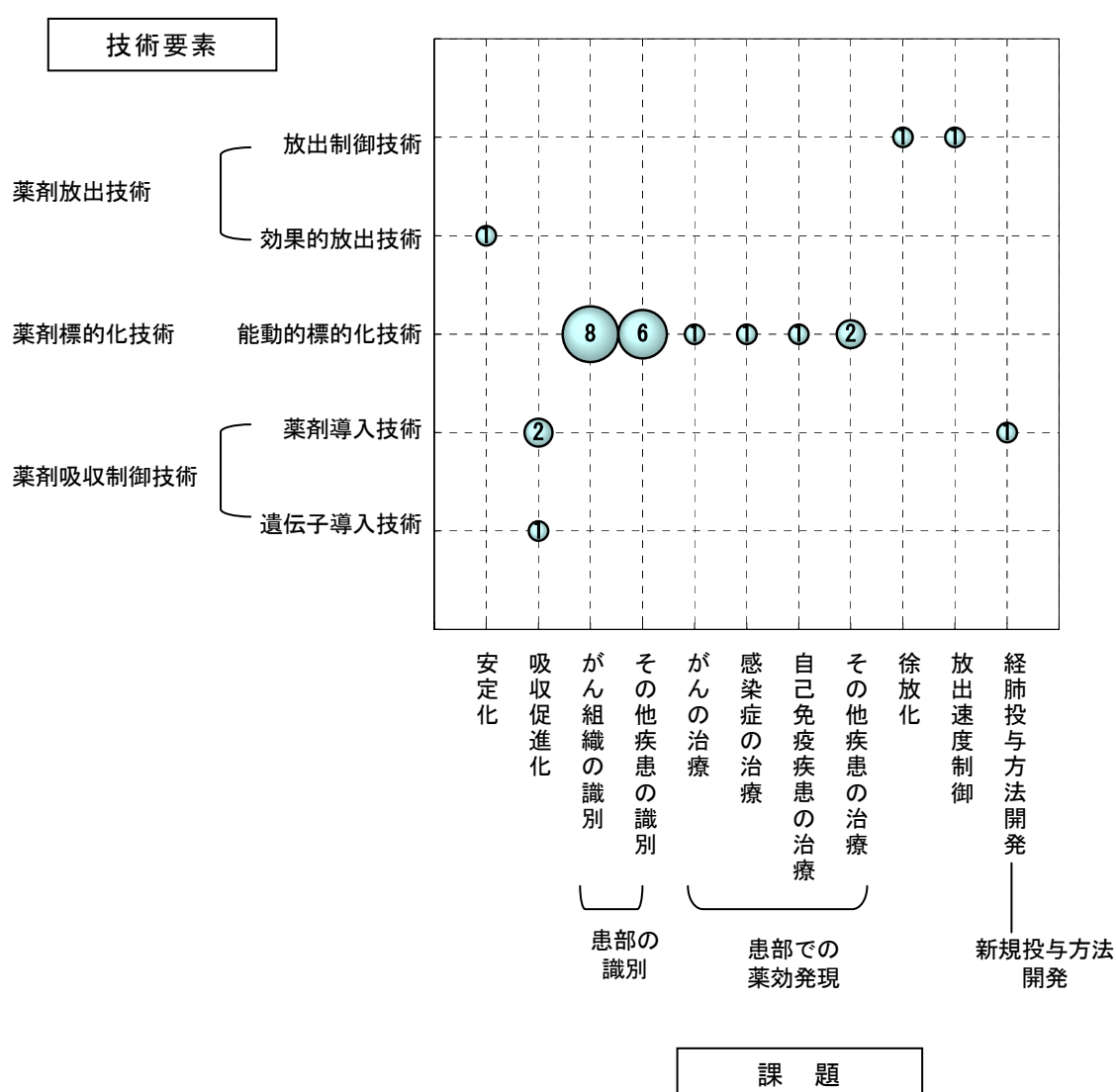


## 2.4.4 技術開発課題対応特許の概要

最近11年間（1992年1月～2002年12月）に出願されたジェネンテックのドラッグデリバリーシステムに関する特許・実用新案の件数は26件であり、表2.4.4にその内容を示している。

図2.4.4-1にジェネンテックの技術要素と課題の分布を示す。「薬剤標的化技術」と「薬剤放出技術」、「薬剤吸収制御技術」に出願している。「薬剤標的化技術」に関する「がん組織の識別」および「その他の疾患の識別」が最も大きな課題となっている。また、「がんの治療」や「感染症の治療」も「能動的標的化技術」の課題である。「薬剤吸収制御技術」では、「薬剤導入技術」と「遺伝子導入技術」に関する「吸収促進化」が課題である。

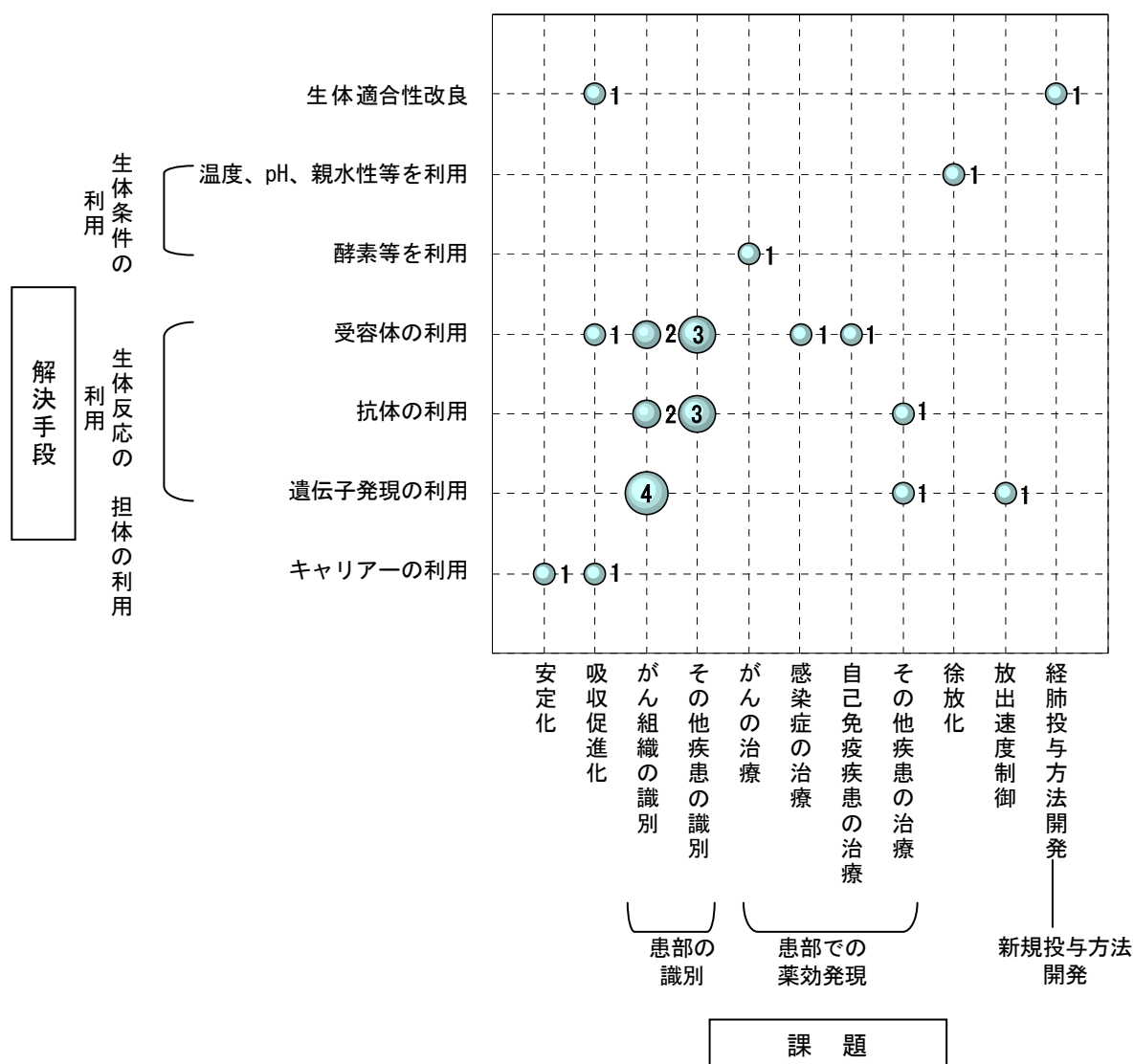
図2.4.4-1 ジェネンテックの技術要素と課題の分布





ジェネンテックの課題と解決手段の分布を図2.4.4-2に示す。「がん組織の識別」という課題に対しては、「遺伝子発現の利用」や「受容体を利用」、「抗体の利用」といった「生体反応の利用」が解決手段として用いられている。「その他疾患の識別」でも、「受容体を利用」、「抗体の利用」が解決手段として用いられている。「患部での薬効発現」という課題に対しても、「受容体を利用」などの生体反応を利用した解決手段が採られている。「放出速度制御」に関する課題に対しては、「遺伝子発現の利用」が解決手段となっている。

図2.4.4-2 ジェネンテックの課題と解決手段の分布



1992年1月～2002年12月の出願

表2.4.4 ジェネンテックの技術要素別課題対応特許 (1/3)

| 技術要素<br>I II | 課題<br>I II | 解決手段 I<br>解決手段 II            | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]  | 発明の名称<br>概要                                |
|--------------|------------|------------------------------|----------------------------------------------------|--------------------------------------------|
| 薬剤放出技術       | 徐放化        | 生体条件の利用<br>温度、pH、親水性<br>等の利用 | 特表2000-504210<br>95. 12. 27<br>C12N15/09           | 半減期の長いOBタンパク質誘導体                           |
|              | 放出速度制御     | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利<br>用      | 特表平10-508025<br>94. 10. 31<br>A61K48/00            | 眼の遺伝子療法                                    |
| 効果的放出技術      | 安定化        | 担体の利用<br>キャリアーの利<br>用        | 特表平11-510170<br>95. 07. 27<br>A61K38/00            | タンパク質の処方                                   |
| 能動的標的化技術     | がん組織の識別    | 生体反応の利用<br>受容体の利用            | 特表2003-523207<br>00. 01. 25<br>C12N15/09           | LIV-1関連タンパク質、それをコードするポリヌクレオチド、及び癌の治療へのその利用 |
|              |            |                              | 特表2004-524816<br>00. 09. 26<br>C12N15/09           | PUMPCn組成物とその使用                             |
|              |            | 生体反応の利用<br>抗体の利用             | 特表2003-503365<br>99. 06. 25<br>A61K39/395<br>イムノゲン | 抗-ErbB抗体-メイタンシノイド複合体を用いた治療方法               |
|              |            |                              | 特表平08-502514<br>92. 10. 28<br>C07K16/28            | 血管内皮細胞増殖因子アンタゴニスト                          |
|              |            | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利<br>用      | 特開2003-274980<br>99. 03. 08<br>C12N15/09           | 腫瘍治療のための組成物及び方法                            |
|              |            |                              | 特表2004-520806<br>00. 08. 24<br>C12N15/09           | 腫瘍の診断と治療のための組成物と方法                         |
|              |            |                              | 特表2004-520808<br>00. 08. 24<br>C12N15/09           | 腫瘍の診断と治療のための組成物と方法                         |
|              |            |                              | 特表2004-520810<br>00. 08. 24<br>C12N15/09           | 腫瘍の診断と治療のための組成物と方法                         |
|              |            | 生体反応の利用<br>受容体の利用            | 特開2004-097224<br>97. 09. 19<br>C12N15/09           | リガンドホモログ                                   |
|              |            |                              | 特開2004-113239<br>97. 09. 19<br>C12N15/09           | リガンドホモログ                                   |
|              |            |                              | 特表2003-505020<br>99. 07. 02<br>C12N15/09           | ペプチドリガンドドメイン及び多量体化ドメインを含む融合ペプチド            |

表2.4.4 ジェネンテックの技術要素別課題対応特許 (2/3)

| 技術要素 I II           | 課題 I II               | 解決手段 I<br>解決手段 II   | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]    | 発明の名称<br>概要                                    |
|---------------------|-----------------------|---------------------|-------------------------------------------------------|------------------------------------------------|
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | その他の疾患の識別<br>患部の識別    | 生体反応の利用<br>抗体の利用    | 特表平 11-504007<br>95.04.20<br>C07K1/20                 | 抗体精製                                           |
|                     |                       |                     | 特表 2000-503204<br>96.01.08<br>C12N15/09               | WSX レセプター及びリガンド類                               |
|                     |                       |                     | 特表 2003-534292<br>00.05.19<br>A61K45/00               | ERBB アンタゴニスト癌治療に対する有効な応答の可能性を向上させるための遺伝子検出アッセイ |
|                     | がんの治療<br>患部での薬効発現     | 生体条件の利用<br>酵素等の利用   | 特表 2003-523407<br>00.02.24<br>A61K47/48               | カスパーゼ活性化プロドラッグ療法                               |
|                     | 感染症の治療<br>患部での薬効発現    | 生体反応の利用<br>受容体の利用   | 特表 2002-544174<br>99.05.07<br>A61K45/00<br>アイデック PHAM | B 細胞表面マーカーに結合するアンタゴニストを用いた自己免疫疾患の治療            |
|                     | 自己免疫疾患の治療<br>患部での薬効発現 | 生体反応の利用<br>受容体の利用   | 特表平 08-509720<br>93.05.03<br>A61K38/00<br>カリフォルニア大学   | 白血球接着阻害                                        |
|                     | その他の疾患の治療<br>患部での薬効発現 | 生体反応の利用<br>抗体の利用    | 特表平 09-512163<br>94.04.04<br>C12N15/09                | Jlk2/flt3 リセプターに対するアゴニスト抗体とその使用                |
|                     |                       | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利用 | 特表 2001-517437<br>97.09.19<br>C12N15/09               | リガンドホモログ                                       |
| 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 吸収促進化                 | 生体反応の利用<br>受容体の利用   | 特表 2003-512441<br>99.10.22<br>A61K45/00<br>アメリカ合衆国    | 極性上皮細胞層を横断するタンパク質の送達                           |
|                     |                       | 担体の利用<br>キャリアーの利用   | 特開 2002-234831<br>95.05.12<br>A61K9/12                | 機能生物学的物質の粗いスプレー供給                              |

表2.4.4 ジェネンテックの技術要素別課題対応特許 (3/3)

| 技術要素<br>I II        | 課題<br>I II           | 解決手段 I<br>解決手段 II | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]                     | 発明の名称<br>概要                     |
|---------------------|----------------------|-------------------|------------------------------------------------------------------------|---------------------------------|
| 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 新規投与方法開発<br>経肺投与方法開発 | 生体適合性改良           | 特表平 10-510292<br>95.04.05<br>A61K33/14                                 | 塩化ナトリウムエアゾル製剤の調製                |
| 薬剤吸収制御技術<br>遺伝子導入技術 | 吸収促進化                | 生体適合性改良           | 特表平 08-508648<br>93.04.08<br>C12N15/09<br>ベーリンガー イ<br>ンゲルハイム<br>INTERN | 高等真核細胞へ外来DNAを導入するためのアデノウ<br>イルス |

## 2.5 ファイザー（米国）

### 2.5.1 企業の概要

|       |                                                              |
|-------|--------------------------------------------------------------|
| 商号    | Pfizer Inc.                                                  |
| 本社所在地 | 235 East 42 <sup>nd</sup> Street, New York, NY 10017, U.S.A. |
| 設立年   | 1849年                                                        |
| 資本金   | 654百万米ドル（2003年12月末）                                          |
| 従業員数  | 約122,000名（連結：2003年12月末）                                      |
| 事業内容  | 医療用医薬品、一般用医薬品、動物薬の開発・製造・販売                                   |

ファイザーは、2000年にワーナー・ランバート（Warner-Lambert）、03年にファルマシア（Pharmacia）を買収して、世界最大の医薬品メーカーとなっている。特に、循環器系、中枢神経系、感染症、アレルギー系、疼痛・関節系、泌尿器系、眼科系、がん、内分泌系などの疾患に対する医薬品を開発している。

（出典：ファイザーのホームページ <http://www.pfizer.com/>）

### 2.5.2 製品例

ファイザーのドラッグデリバリーシステムに関する製品としては、禁煙補助剤がある。

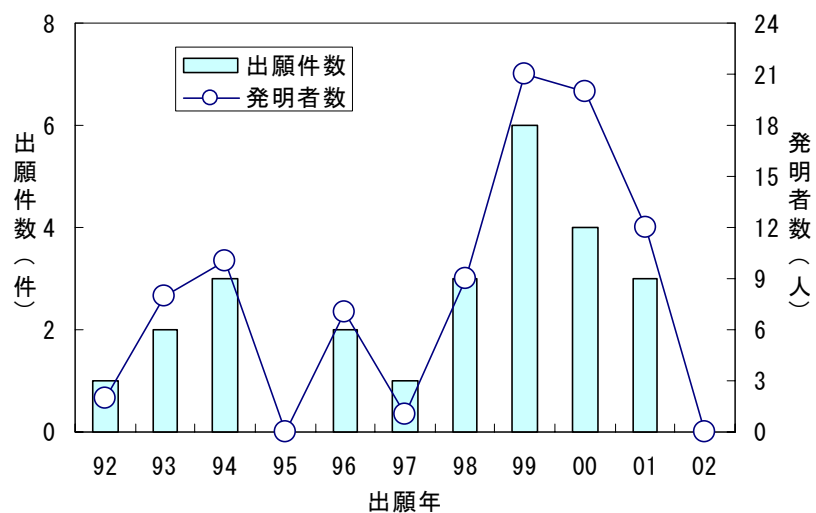
### 2.5.3 技術開発拠点と研究者

特許明細書に記載されているファイザーの発明者の住所から調査した主な技術開発拠点は、次のとおりであり、主として米国から出願されている。ファルマシアが買収したファルマシア、ワーナー・ランバートの技術開発拠点も含まれているために、技術開発拠点が世界に広がっている。

米国 コネチカット州06340, グロートン, イースタン・ポイント・ロード,  
ファイザー・インク, セントラル・リサーチ・ディヴィジョン  
米国 オレゴン州、ミシガン州、イリノイ州、カリフォルニア州  
イギリス ケント シーティー13・9エヌジェイ, サンドウィッチ, ラムズゲート・ロ  
ード, ファイザー・グローバル・リサーチ・アンド・ディベロプメント  
スウェーデン ヘルシングボリ  
デンマーク アールホルムパーケン ヴアイ  
イタリア ミラノ  
スイス ホフシュテッテン  
ベルギー ブス  
茨城県つくば市

ファイザーの出願件数・発明者数の推移を図2.5.3に示す。1995～97年に  
出願件数、発明者数が減少したが、その後、99年まで出願件数、発明者数が増加している。02年に  
出願が見られないのは、PCT出願のためにまだ公開されていないためと考えられる。

図2.5.3 ファイザーの出願件数・発明者数の年次推移

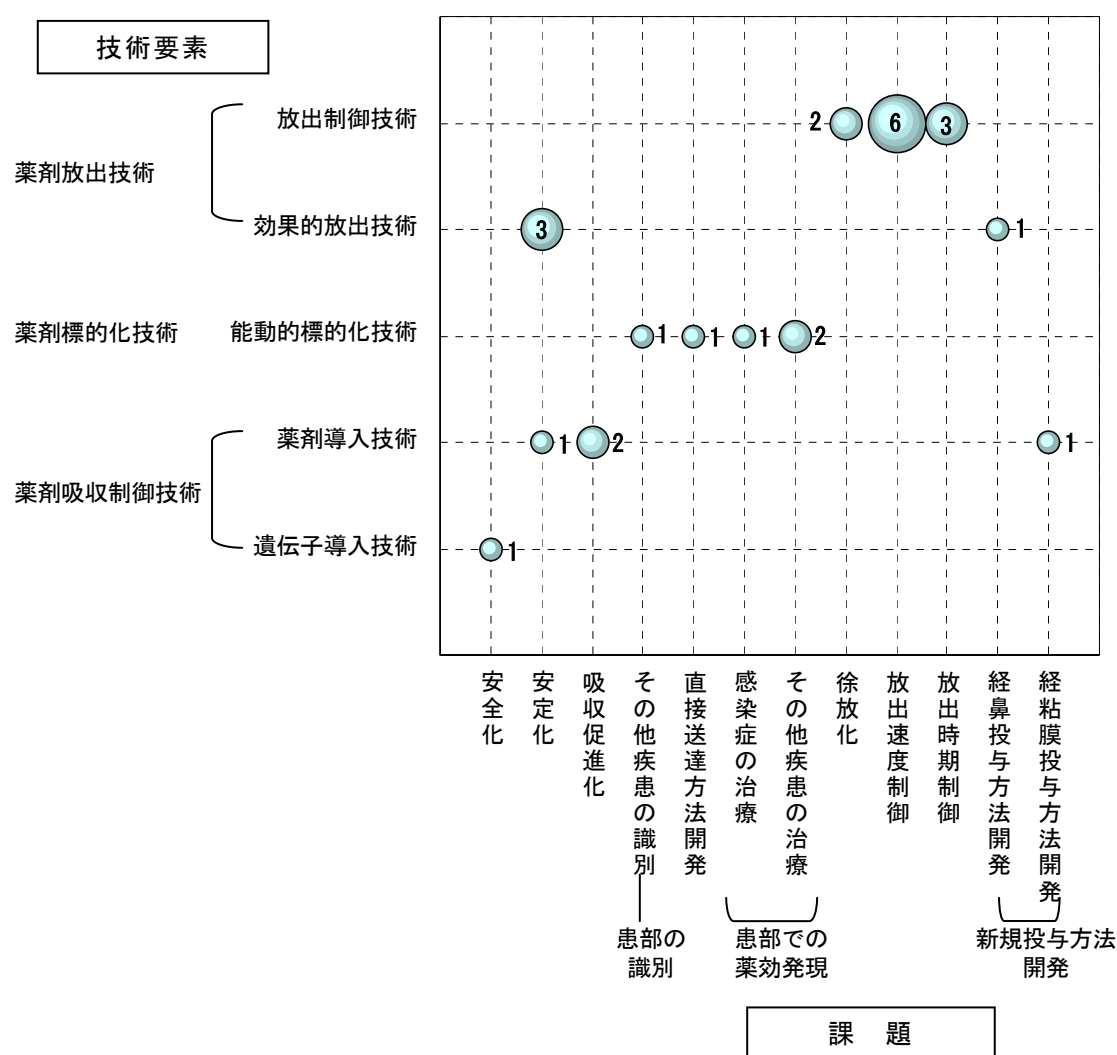


## 2.5.4 技術開発課題対応特許の概要

最近11年間（1992年1月～2002年12月）に出願されたファイザーのドラッグデリバリーシステムに関する特許・実用新案の件数は25件であり、表2.5.4にその内容を示している。

図2.5.4-1にファイザーの技術要素と課題の分布を示す「薬剤放出技術」と「薬剤標的化技術」、「薬剤吸収制御技術」に出願している。薬剤放出技術では、「放出制御技術」に関して、「放出速度制御」、「放出時期制御」、「徐放化」が課題となっている。「薬剤標的化技術」に関しては、「その他疾患の治療」、「その他疾患の識別」などの課題がある。薬剤吸収制御技術では、「薬剤導入技術」における「吸収促進化」のほかに、「遺伝子導入技術」の「安全化」が課題となっている。

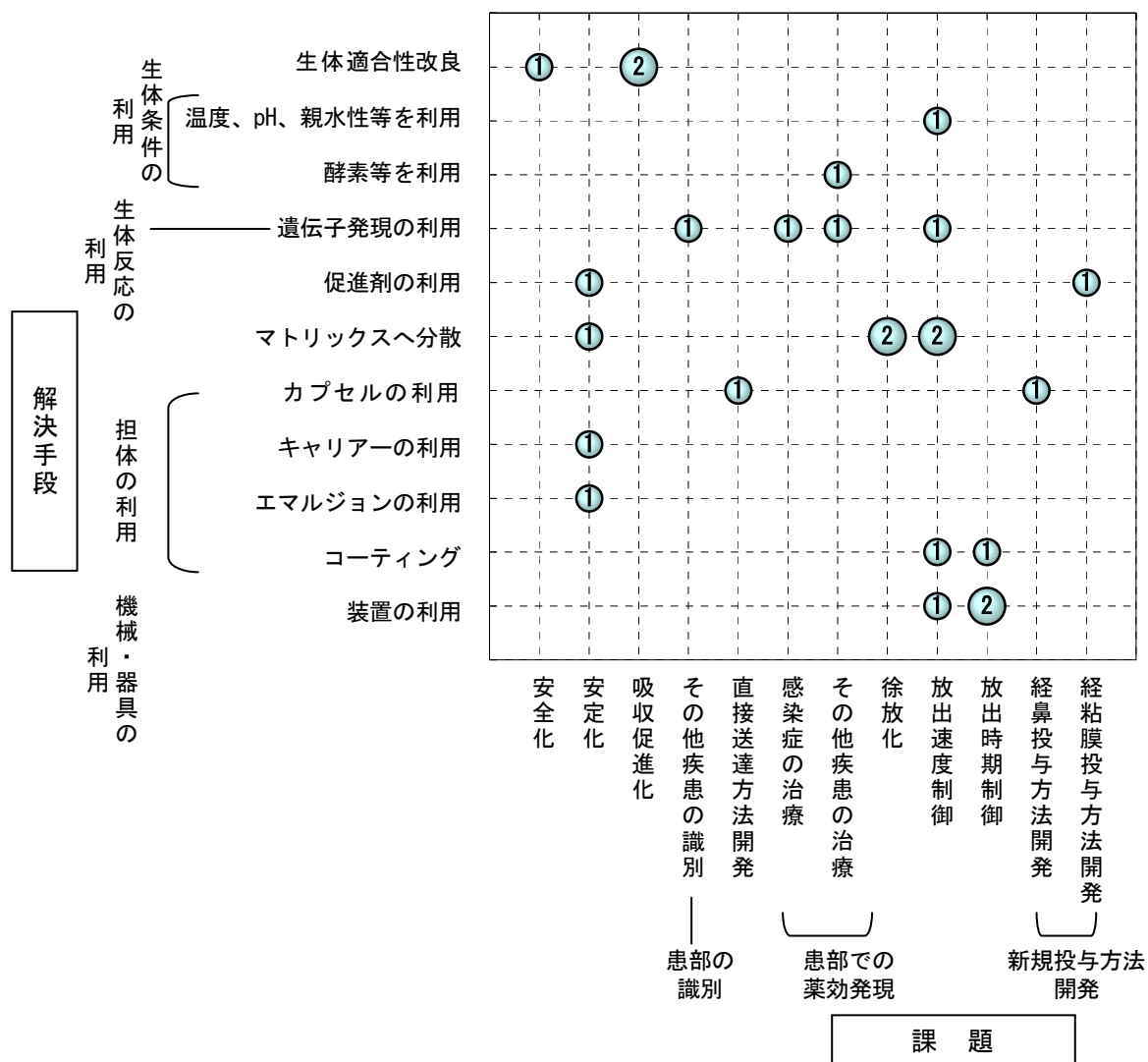
図2.5.4-1 ファイザーの技術要素と課題の分布



1992年1月～2002年12月の出願

ファイザーの課題と解決手段の分布を図2.5.4-2に示す。「放出速度制御」、「放出時期制御」という課題に対しては、「コーティング」や「装置の利用」という解決手段が採られている。「その他の疾患治療」に対しては、「遺伝子発現の利用」が解決手段となっている。「吸収促進化」に対しては、「生体適合性改良」が解決手段として用いられている。

図2.5.4-2 ファイザーの課題と解決手段の分布



1992年1月～2002年12月の出願



表2.5.4 ファイザーの技術要素別課題対応特許 (1/2)

| 技術要素<br>I II      | 課題<br>I II | 解決手段 I<br>解決手段 II            | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数] | 発明の名称<br>概要                                                                                                                                   |
|-------------------|------------|------------------------------|---------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 薬剤放出技術            | 徐放化        | マトリックスへ分散                    | 特表平09-503023<br>94. 06. 16<br>C08B30/12           | 生物付着性澱粉及び該澱粉の製造方法                                                                                                                             |
|                   |            |                              | 特表2003-518061<br>99. 12. 22<br>A61K45/00          | シクロオキシゲナーゼ-2 阻害剤の持続放出製剤                                                                                                                       |
|                   | 放出速度制御     | 生体条件の利用<br>温度、pH、親水性<br>等の利用 | 特表2004-505907<br>00. 08. 09<br>A61K9/22           | ヒドロゲルにより駆動される薬物剤形                                                                                                                             |
|                   |            | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利用          | 特表平10-506794<br>94. 10. 06<br>C12N15/09           | アテローム性動脈硬化症の処置におけるスカベンジャー受容体の使用方法                                                                                                             |
|                   |            | マトリックスへ分散                    | 特開2000-229888<br>99. 02. 10<br>A61K47/38          | マトリックス制御放出デバイス                                                                                                                                |
|                   |            |                              | 特表平09-500645<br>(取下げ)<br>93. 07. 22<br>A61K31/47  | 制御放出タクリン薬物送達システムおよびその製造方法                                                                                                                     |
|                   |            | 担体の利用<br>コーティング              | 特開2000-229846<br>99. 02. 10<br>A61K9/22           | 放出制御型剤形                                                                                                                                       |
|                   |            | 機械・器具の利用<br>装置の利用            | 特開2002-212061<br>00. 12. 07<br>A61K9/20           | 制御放出薬物送達のための方法およびシステム                                                                                                                         |
|                   | 放出時期制御     | 担体の利用<br>コーティング              | 特開2002-275053<br>01. 03. 14<br>A61K9/22           | 医薬錠剤及びその製造のための方法                                                                                                                              |
|                   |            | 機械・器具の利用<br>装置の利用            | 特許3174285<br>96. 05. 29<br>A61K31/495             | セチリジンおよびブソイドエフェドリンを含む固体剤形およびその製造方法<br>非鎮静性の抗アレルギー薬、鎮痙薬および抗ヒスタミン薬であるセチリジンを直後放出成分として、ブソイドエフェドリンを調整放出成分としてともに含む製剤の製造方法。1日4回の投与を1回または2回にすることができる。 |
|                   |            |                              | 特表2003-518062<br>99. 12. 22<br>A61K31/122         | シクロオキシゲナーゼ-2 阻害薬の二重放出性組成物                                                                                                                     |
| 効果的放出技術<br>薬剤放出技術 | 安定化        | マトリックスへ分散                    | 特表2001-515029<br>97. 08. 21<br>A61K9/14           | 粒状分散形態の固形医薬剤形                                                                                                                                 |
|                   |            | 担体の利用<br>キャリアーの利用            | 特表2004-504342<br>00. 07. 24<br>A61K47/34<br>スーゲン  | 極めて水不溶性の脂肪親和性薬剤用の自己乳化性ドラッグデリバリーシステム                                                                                                           |
|                   |            | 担体の利用<br>エマルジョンの利用           | 特表2004-520398<br>01. 01. 18<br>A61K31/337         | 経口生物学的利用能が改善されたパクリタキセルの化学療法マイクロエマルジョン組成物                                                                                                      |
|                   | 新規投与方法開発   | 担体の利用<br>カプセルの利用             | 特表平09-504305<br>93. 11. 01<br>A61K31/465          | ニコチンまたはその誘導体およびデンプン微小球からなるドラッグデリバリー用組成物およびその製法                                                                                                |

表2.5.4 ファイザーの技術要素別課題対応特許 (2/2)

| 技術要素<br>I II        | 課題<br>I II            | 解決手段 I<br>解決手段 II   | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数] | 発明の名称<br>概要                                               |
|---------------------|-----------------------|---------------------|----------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------|
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | その他の疾患の識別             | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利用 | 特開 2002-355051<br>00.06.29<br>C12N15/09            | 標的                                                        |
|                     | 直接送達<br>方法開発          | 担体の利用<br>カプセルの利用    | 特表 2002-525314<br>98.09.28<br>A61K9/52             | HPMCカプセルを使用する腸及び結腸への送達                                    |
|                     | 感染症の治療<br>患部での薬効発現    | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利用 | 特表平 10-503654<br>94.08.05<br>C12N15/09             | レトロウイルスの感染の治療におけるトランスドミナント・ネガティブ・レトロウイルス・インテグラーゼの使用法      |
|                     | その他の疾患の治療<br>患部での薬効発現 | 生体条件の利用<br>酵素等の利用   | 特表 2001-505533<br>96.07.03<br>C07D21/385           | スルホンアミド誘導体を用いた標的化ドラッグデリバリー                                |
|                     |                       | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利用 | 特表 2003-502321<br>99.06.10<br>C07D27/736           | ローダニン誘導体ならびにアミロイドの阻害および画像化におけるその使用                        |
| 薬剤導入技術<br>薬剤吸収制御技術  | 安定化                   | 促進剤の利用              | 特表 2004-520359<br>01.01.18<br>A61K9/08             | 薬物の結晶化が低減された性質を有する医薬組成物                                   |
|                     | 吸収促進化                 | 生体適合性改良             | 特開平 06-087887<br>(取下げ)<br>92.08.19<br>C07K5/08     | ペプチドのエナミン誘導体およびそれをプロドラッグとして含有するペプチド製剤                     |
|                     |                       |                     | 特表 2003-516394<br>99.12.09<br>C07D23/360           | セレコキシブの多型結晶形態                                             |
| 薬剤導入技術<br>薬剤吸収制御技術  | 経粘膜投与方法開発<br>新規投与方法開発 | 促進剤の利用              | 特表 2002-530335<br>98.11.23<br>A61K31/465           | 急速経粘膜吸収を与えるニコチン含有医薬組成物                                    |
|                     | 安全性                   | 生体適合性改良             | 特表 2002-513811<br>98.05.06<br>A61K48/00            | 非ヒト脊椎動物への、非ヒト脊椎動物のペプチドホルモンまたはサイトカインをコードする裸のDNAまたは裸のRNAの導入 |

## 2.6 科学技術振興機構

### 2.6.1 機関の概要

|       |                                                                |
|-------|----------------------------------------------------------------|
| 名称    | 独立行政法人 科学技術振興機構                                                |
| 本部所在地 | 〒332-0012 埼玉県川口市本町4-1-8 川口センタービル                               |
| 設立年   | 2003年（平成15年）（10月、科学技術振興事業団が独立行政法人化）                            |
| 資本金   | 1,903億81百万円（2004年3月末）                                          |
| 職員数   | 478名（2004年3月末）                                                 |
| 事業内容  | 新技術の創出に資する研究、新技術の企業化開発の推進、科学技術情報の流通促進、科学技術関係の研究交流・支援、科学技術の理解増進 |

科学技術振興機構（Japan Science and Technology Agency 略称JST）は、日本の科学技術基本計画の中核的实施機関として大学などへの研究助成を行っている。

（出典：科学技術振興機構のホームページ <http://www.jst.go.jp/>）

### 2.6.2 製品例

研究支援が組織目標であり、ドラッグデリバリーシステムの研究にも助成を行っているが、製品はない。

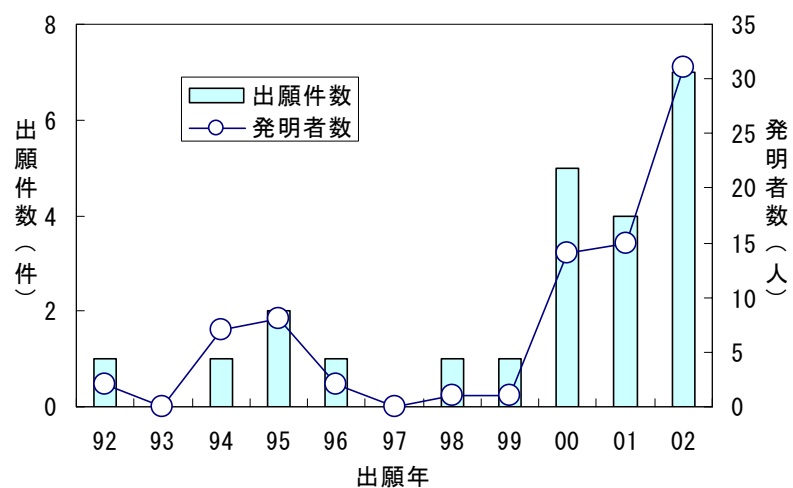
### 2.6.3 技術開発拠点と研究者

特許明細書に記載されている科学技術振興機構の発明者の住所から調査した主な技術開発拠点は、次のとおりであり、日本全国から出願されている。科学技術振興機構は大学などにおける研究の支援を行っており、これらの研究拠点は全国の大学などであると考えられる。

北海道 札幌市  
宮城県 仙台市  
群馬県 前橋市  
茨城県 牛久市、土浦市  
千葉県 市川市、松戸市、柏市、野田市  
東京都 新宿区、杉並区、世田谷、板橋区、豊島区、墨田区、小平市  
神奈川県 横浜市、川崎市、相模原市、藤沢市  
長野県 松本市  
石川県 金沢市、石川郡鶴来町、能美郡辰口町  
愛知県 名古屋市  
大阪府 吹田市、茨木市、豊能郡豊能町  
兵庫県 神戸市  
岡山県 岡山市  
徳島県 徳島市

科学技術振興機構の出願件数・発明者数の推移を図2. 6. 3に示す。1996～98年に  
出願件数、  
発明者数が減少したが、その後、出願件数、発明者数が増加している。

図2. 6. 3 科学技術振興機構の出願件数・発明者数の年次推移

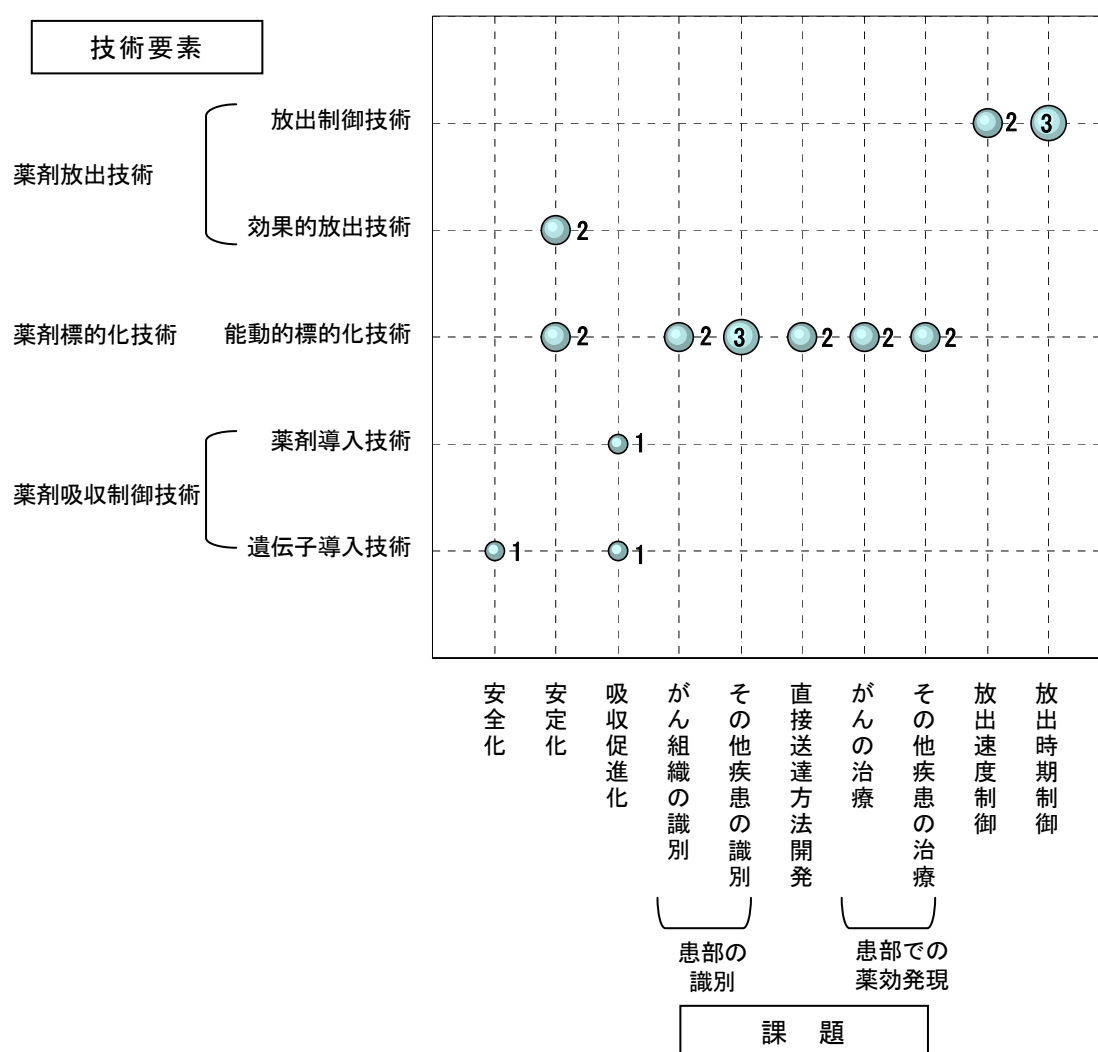


## 2.6.4 技術開発課題対応特許の概要

最近11年間（1992年1月～2002年12月）に出願された科学技術振興機構のドラッグデリバリーシステムに関する特許・実用新案の件数は23件であり、表2.6.4にその内容を示している。

図2.6.4-1に科学技術振興機構の技術要素と課題の分布を示す。「薬剤標的化技術」と「薬剤放出技術」、「薬剤吸収制御技術」に出願している。薬剤標的化技術では、「能動的標的化技術」に関する出願が多く、「患部の識別」と「患部での薬効発現」が最も大きな課題となっている。「放出制御技術」においては、「放出時期制御」と「放出速度制御」が課題である。「薬剤吸収制御技術」では、「吸収促進化」と「安全化」が課題である。

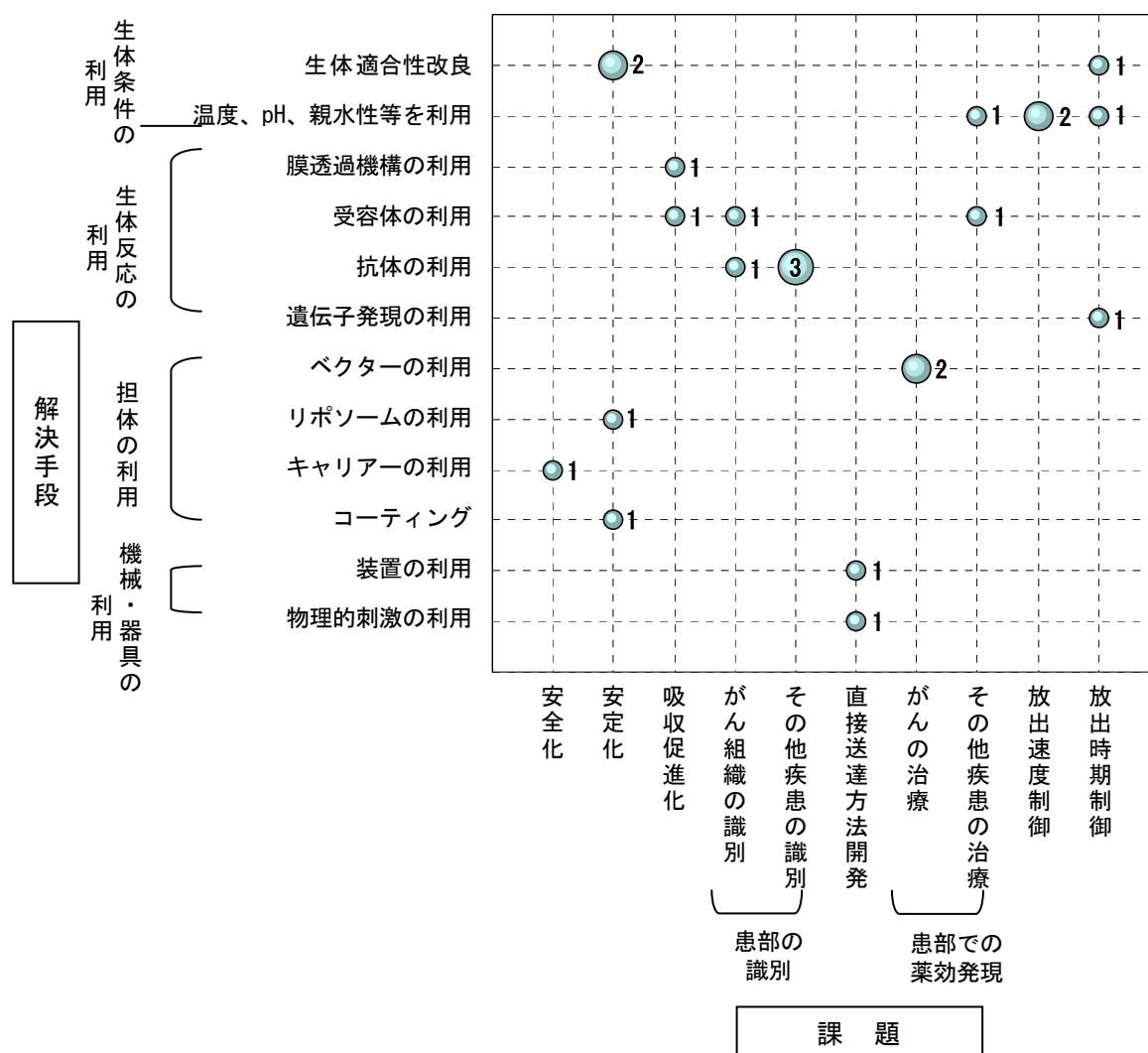
図2.6.4-1 科学技術振興機構の技術要素と課題の分布



1992年1月～2002年12月の出願

科学技術振興機構の課題と解決手段の分布を図2.6.4-2に示す。「患部の識別」という課題に対しては、「抗体の利用」をはじめとした「生体反応の利用」が解決手段として用いられている。「放出時期制御」、「放出速度制御」に対しては、温度やpHなどの「生体条件の利用」が解決手段となっている。また、「安定化」に対しては、「生体適合性改良」や「担体の利用」が解決手段として用いられている。

図2.6.4-2 科学技術振興機構の課題と解決手段の分布



1992年1月～2002年12月の出願

表2.6.4 科学技術振興機構の技術要素別課題対応特許 (1/2)

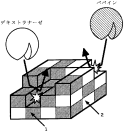
| 技術要素<br>I II        | 課題<br>I II | 解決手段 I<br>解決手段 II            | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数] | 発明の名称<br>概要                                                                                                                                                                                        |
|---------------------|------------|------------------------------|---------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 放出制御技術<br>薬剤放出技術    | 放出速度制御     | 生体条件の利用<br>温度、pH、親水性<br>等の利用 | 特開平08-134146<br>94. 11. 09<br>C08F22/036          | 側鎖に核酸塩基を導入したポリマーゲル及びその製造方法                                                                                                                                                                         |
|                     |            |                              | 特開平11-322941<br>98. 05. 11<br>C08G81/00           | 温度応答型生体内分解性高分子                                                                                                                                                                                     |
|                     | 放出時期制御     | 生体適合性改良                      | 特開2001-270898<br>00. 03. 24<br>C07K7/18           | 蛋白質との複合体の形成・解離を利用する生理活性ペプチドの作用制御法                                                                                                                                                                  |
|                     |            | 生体条件の利用<br>温度、pH、親水性<br>等の利用 | 特許3538741<br>95. 05. 23<br>A61K7/30               | 複合刺激応答型生体内分解性高分子ヒドロゲル<br>疾患の特異的に放出される複数の酵素に<br>応答して生体内で分解することが可能な2種の<br>水溶性高分子からなる複合刺激応答型生体内<br>分解性高分子ヒドロゲル<br> |
|                     |            | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利用          | 特開2003-33178<br>01. 05. 17<br>C12N15/09           | 細胞シグナル応答型遺伝子転写制御系                                                                                                                                                                                  |
| 効果的放出技術<br>薬剤放出技術   | 安定化        | 生体適合性改良                      | 特許2690276<br>95. 01. 10<br>A61K47/34              | 静電結合型高分子ミセル薬物担体とその薬剤                                                                                                                                                                               |
|                     |            | 担体の利用<br>コーティング              | 特開2003-147418<br>01. 11. 09<br>B22F9/24           | シエル架橋型ミセルを鋳型とする金属ナノ粒子の調製                                                                                                                                                                           |
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | 安定化        | 生体適合性改良                      | 特開2004-81210<br>02. 06. 28<br>C12N15/09           | システイン残基を改変したタンパク質からなる中空ナノ粒子およびそれを用いた薬剤                                                                                                                                                             |
|                     |            | 担体の利用<br>リポソームの利用            | 特開2004-175665<br>02. 11. 22<br>A61K38/00          | タンパク質中空ナノ粒子およびそれを用いた薬剤                                                                                                                                                                             |
|                     | がん組織の識別    | 生体反応の利用<br>受容体利用             | 特開2001-309790<br>00. 05. 02<br>C12N15/09          | 腫瘍指向性ペプチドベクター                                                                                                                                                                                      |
|                     |            | 生体反応の利用<br>抗体利用              | 特開2001-218585<br>00. 02. 08<br>C12N15/09          | ヒト核蛋白質とこれをコードするcDNA                                                                                                                                                                                |
|                     | その他の疾患の識別  | 生体反応の利用<br>抗体利用              | 特許3154564<br>92. 09. 07<br>C12P21/08              | モノクローナル抗体の改変方法<br>モノクローナル抗体産生株から分離したレクチン耐性株の糖鎖合成変異ハイブリドーマにより抗原結合性を改変させ、抗原結合性の高いヒト型モノクローナル抗体を得た。                                                                                                    |
|                     |            |                              | 特開2001-316298<br>00. 02. 28<br>A61K48/00          | タンパク質中空ナノ粒子とそれを用いた物質運搬体、ならびに細胞への物質導入方法                                                                                                                                                             |
|                     |            |                              | 特開2003-286189<br>02. 03. 29<br>A61K38/00          | 中空ナノ粒子を形成するタンパク質に疾患治療用の細胞導入物質を融合させた薬剤                                                                                                                                                              |
|                     | 患部での薬効発現   | 担体の利用<br>ベクター利用              | 特開2003-286198<br>02. 03. 29<br>A61K48/00          | 増殖因子等を提示するタンパク質中空ナノ粒子を用いる治療薬剤                                                                                                                                                                      |
|                     |            |                              | 特開2003-286199<br>02. 03. 29<br>A61K48/00          | タンパク質中空ナノ粒子を用いる肝臓疾患治療用薬剤                                                                                                                                                                           |

表2.6.4 科学技術振興機構の技術要素別課題対応特許（2/2）

| 技術要素<br>I II        | 課題<br>I II            | 解決手段 I<br>解決手段 II            | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]      | 発明の名称<br>概要                                                     |
|---------------------|-----------------------|------------------------------|---------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------|
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | その他の疾患の治療<br>患部での薬効発現 | 生体条件の利用<br>温度、pH、親水性<br>等の利用 | 特開 2002-128784<br>00.10.25<br>C07D49/308                | 細胞侵入型励起一重項酸素発生化合物および該化合物を含む薬剤類                                  |
|                     |                       | 生体反応の利用<br>受容体利用             | 特開 2003-2843<br>01.06.21<br>A61K45/00                   | 組織特異的トランスポーター阻害剤                                                |
|                     | 直接送達方法開発              | 機械・器具の利用<br>装置の利用            | 特開 2000-229844<br>99.02.12<br>A61K9/00                  | 磁気利用ドラッグデリバリーシステム                                               |
|                     |                       | 機械・器具の利用<br>物理的刺激的利用         | 特開 2002-316946<br>01.04.19<br>A61K41/00<br>神奈川科学技術アカデミー | 光触媒の生体内への注入方法ならびに生体内への打ち込み粒子およびその製造方法                           |
| 遺伝子導入技術<br>薬剤吸収制御技術 | 安全化                   | 担体の利用<br>キャリアーの利用            | 特許 3217286<br>96.12.19<br>C07H21/04                     | DNA 固定化複合体<br>無機質固体をDNAの固定化担体とすることで、より安定にDNAが保持されるDNA固定化複合体を得た。 |
|                     | 吸収促進化                 | 生体反応の利用<br>受容体利用             | 特開 2003-235560<br>02.02.21<br>C12N15/09                 | 遺伝子導入のための複合体および方法                                               |
| 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 吸収促進化                 | 生体反応の利用<br>膜透過機構の利用          | 特開 2004-67563<br>02.08.05<br>A61K48/00                  | 癌細胞内部への抗癌剤の選択的輸送用組成物                                            |



## 2.7 カイロン（米国）

### 2.7.1 企業の概要

|       |                                                   |
|-------|---------------------------------------------------|
| 商号    | Chiron Corporation                                |
| 本社所在地 | 4560 Horton Street, Emeryville, CA 94608 U. S. A. |
| 設立年   | 1981年                                             |
| 資本金   | 2百万米ドル（2003年12月末）                                 |
| 従業員数  | 5,332名（連結：2003年12月末）                              |
| 事業内容  | バイオ医薬品、ワクチン、血液検査薬の開発・製造・販売                        |

カイロンは、感染症を対象としたバイオ医薬、ワクチン、血液検査薬を製造販売している。バイオ医薬品としてはC型肝炎治療用のインターフェロンがあり、ワクチンとしてはインフルエンザワクチンなどがある。血液検査薬としては、感染症のDNAやRNAを検出するシステムがある。

（出典：カイロンのホームページ <http://www.chiron.com/>）

### 2.7.2 製品例

ポリエチレングリコールでインターロイキンを修飾した薬剤の研究などがなされているが、ドラッグデリバリーシステムの製品はない。

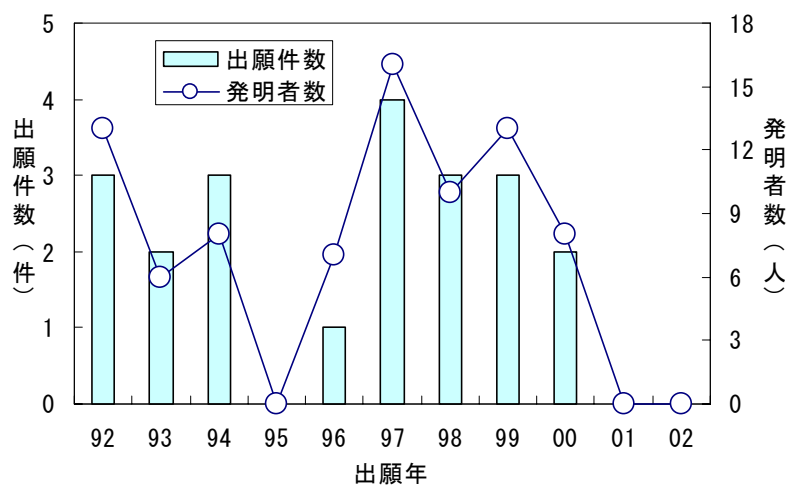
### 2.7.3 技術開発拠点と研究者

特許明細書に記載されているカイロンの発明者の住所から調査した主な技術開発拠点は、次のとおりであり、主として米国から出願されている。日本の京都市は京都大学との共同研究である。

米国 カリフォルニア州 94662-8097, エミリービル, P. O. Box 8097,  
インテレクチュアル プロパティーズ アール440, カイロン コーポレーション  
米国 ミネソタ州  
イタリア シエナ  
オランダ ジェイジー アルメール  
カナダ ケベック州  
京都府 京都市

カイロンの出願件数・発明者数の推移を図2.7.3に示す。1996年に発明者数が減少したが、その後、出願件数、発明者数が年間3件前後に回復している。01年と02年の出願が見られないのは、PCT出願のためにまだ公開されていないためと考えられる。

図2.7.3 カイロンの出願件数・発明者数の年次推移

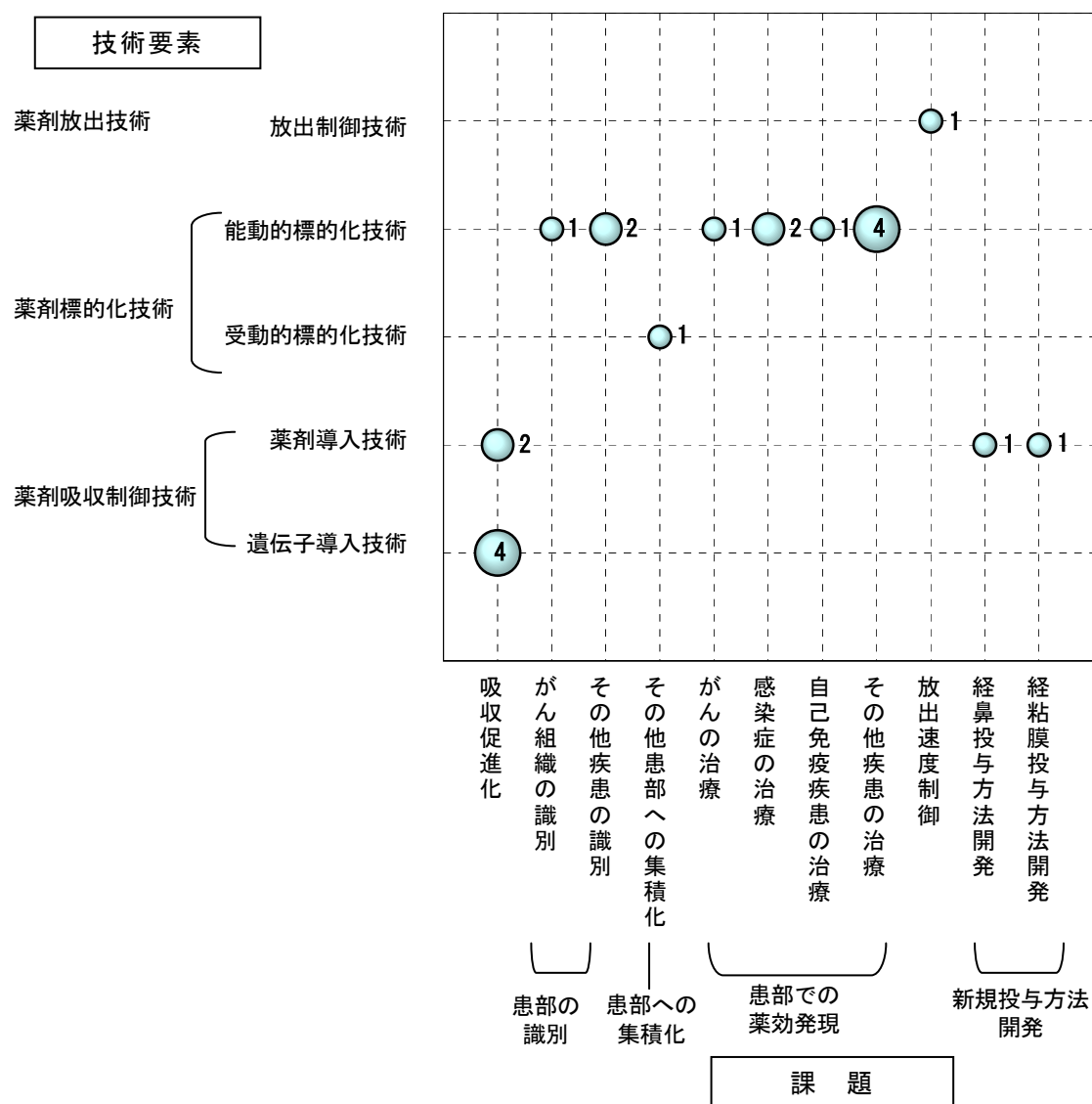


## 2.7.4 技術開発課題対応特許の概要

最近11年間（1992年1月～2002年12月）に出願されたカイロンのドラッグデリバリーシステムに関する特許・実用新案の件数は21件であり、表2.7.4にその内容を示している。

図2.7.4-1にカイロンの技術要素と課題の分布を示す「薬剤標的化技術」と「薬剤吸収制御技術」、「薬剤放出技術」に出願している。薬剤標的化技術では、「能動的標的化技術」に関する出願が多く、「その他疾患の治療」が最も大きな課題となっている。薬剤吸収制御技術では、「遺伝子導入技術」における「吸収促進化」が課題である。

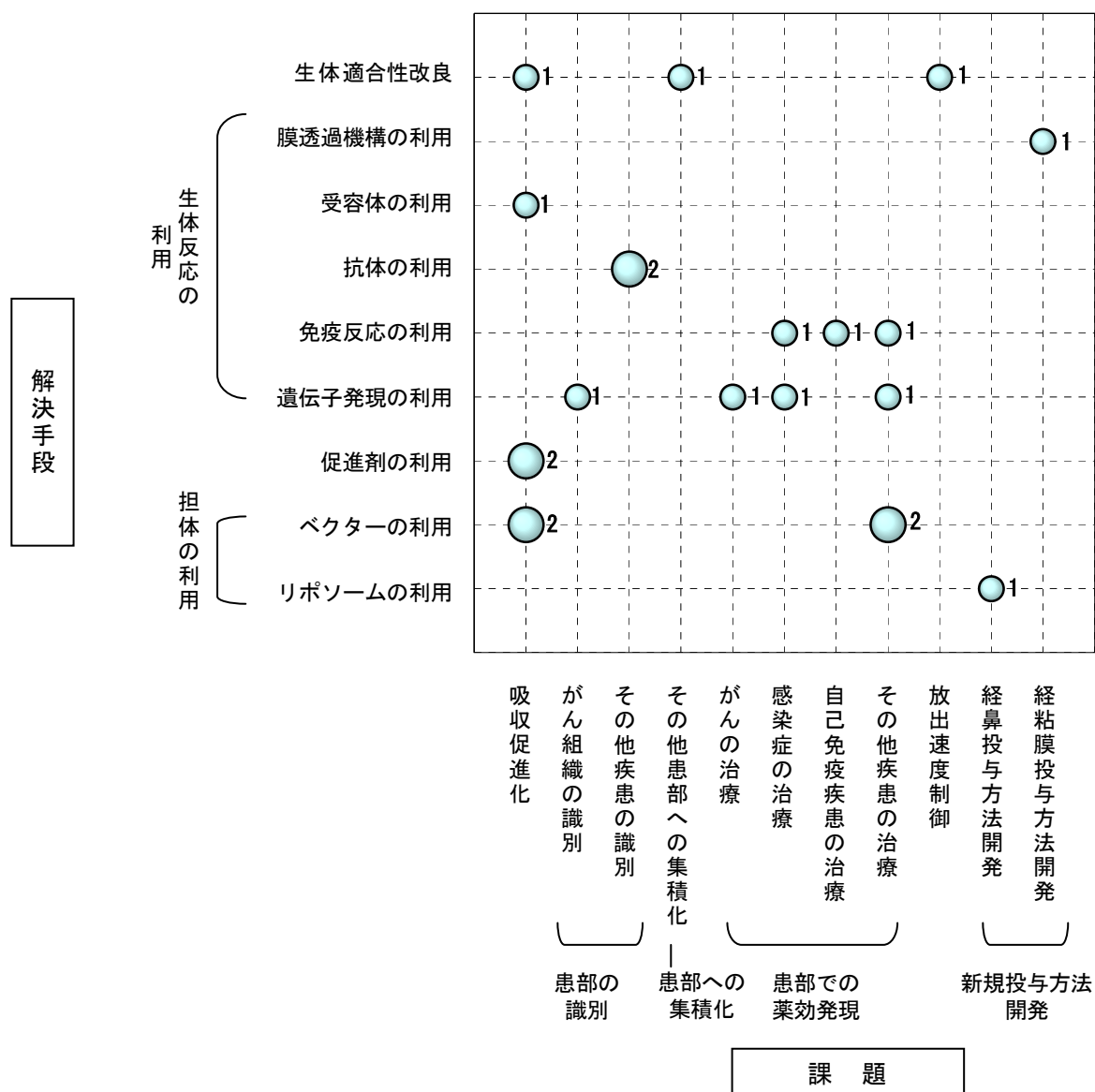
図2.7.4-1 カイロンの技術要素と課題の分布



1992年1月～2002年12月の出願

カイロンの課題と解決手段の分布を図2.7.4-2に示す。「吸収促進化」の課題に対しては、「促進剤の利用」と「ベクターの利用」などが解決手段として用いられている。「その他疾患の識別」に対しては「抗体の利用」が、「その他疾患の治療」に対しては「ベクターの利用」、次いで「免疫反応の利用」や「遺伝子発現の利用」といった「生体反応の利用」が解決手段となっている。

図2.7.4-2 カイロンの課題と解決手段の分布



1992年1月～2002年12月の出願

表2.7.4 カイロンの技術要素別課題対応特許 (1/3)

| 技術要素<br>I II        | 課題<br>I II | 解決手段 I<br>解決手段 II   | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]   | 発明の名称<br>概要                          |
|---------------------|------------|---------------------|-----------------------------------------------------|--------------------------------------|
| 薬剤放出制御技術            | 放出速度制御     | 生体適合性改良             | 特表2001-515852<br>97. 09. 08<br>A61K91/27<br>スカイファーム | 多胞状リボソーム中のIGF-Iの高封入量製剤および低封入量製剤      |
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | がん組織の識別    | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利用 | 特表2003-516731<br>99. 11. 18<br>C12N15/09<br>京都大学総長  | ヒトFGF-21遺伝子および遺伝子発現産物                |
|                     | その他の疾患の識別  | 生体反応の利用<br>抗体の利用    | 特開2003-081871<br>92. 07. 09<br>A61K39/395           | 細胞表面分子に対する抗体の生産方法                    |
|                     |            |                     | 特表平09-509329<br>94. 05. 13<br>C12N15/09             | 遺伝子搬送媒体を標的とする組成物及び方法                 |
|                     | 患者での薬効発現   | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利用 | 特表平09-503740<br>93. 03. 17<br>A61K48/00             | 組換えウイルス・ベクターによる選択された腫瘍増殖の阻害          |
|                     | 患者での薬効発現   | 生体反応の利用<br>免疫反応の利用  | 特開2003-055265<br>(取下げ)<br>92. 02. 04<br>A61K48/00   | 肝炎療剤                                 |
|                     |            | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利用 | 特表平08-502167<br>92. 09. 28<br>C12N15/09             | HCVタンパク質の翻訳を制御するための方法および組成物          |
|                     | 自己免疫疾患の治療  | 生体反応の利用<br>免疫反応の利用  | 特表平09-510607<br>94. 02. 18<br>C12N15/02             | B7-1特異的リガンド、およびT細胞アネルギーの誘導のためのそれらの使用 |

表2.7.4 カイロンの技術要素別課題対応特許 (2/3)

| 技術要素<br>I II        | 課題<br>I II             | 解決手段 I<br>解決手段 II   | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]                       | 発明の名称<br>概要                        |
|---------------------|------------------------|---------------------|--------------------------------------------------------------------------|------------------------------------|
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | その他の疾患の治療<br>患部での薬効発現  | 生体反応の利用<br>免疫反応の利用  | 特表平 10-501136<br>94.06.02<br>C12N15/09                                   | ウイルスに基づく感染／トランスフェクションシステムを用いる核酸免疫化 |
|                     |                        | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利用 | 特表平 09-503920<br>93.11.18<br>C12N15/09                                   | 条件致死遺伝子を利用する組成物及び方法                |
|                     |                        | 担体の利用<br>ベクターの利用    | 特表 2001-514235<br>97.09.02<br>A61K48/00                                  | 遺伝子治療を利用して関節炎を処置するための組成物および方法      |
|                     |                        |                     | 特表 2003-534787<br>00.05.26<br>C12N15/09<br>アイオワ大学 リ<br>サーチ ファウン<br>デーション | レンチウイルスベクターを使用する神経細胞の形質導入の方法       |
| 受動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | その他の患部への集積化<br>患部への集積化 | 生体適合性改良             | 特表 2002-505338<br>98.03.05<br>C07K11/07                                  | 生物学的に活性な分子の血清半減期を増加するための方法         |
| 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 吸収促進化                  | 促進剤の利用              | 特表 2001-524940<br>97.01.09<br>A61K9/72<br>メリーランド大学<br>ボルティモア             | 鼻送達のための投薬組成物およびその使用方法              |
|                     |                        | 担体の利用<br>ベクターの利用    | 特表 2002-539176<br>99.03.15<br>A61K48/00<br>カリフォルニア大<br>学                 | 眼の疾患を処置または予防するための組換え遺伝子送達ベクターの使用   |
|                     | 経鼻投与方法開発<br>新規投与方法開発   | 担体の利用<br>リポソームの利用   | 特表 2002-531490<br>98.12.09<br>A61K9/08                                   | 中枢神経系に薬剤を投与するための方法                 |
|                     | 経粘膜投与方法開発<br>新規投与方法開発  | 生体反応の利用<br>膜透過機構の利用 | 特表 2003-516360<br>99.12.09<br>A61K38/00                                  | 中枢神経系およびリンパ系に対するサイトカイン投与方法         |

表2.7.4 カイロンの技術要素別課題対応特許 (3/3)

| 技術要素 I II           | 課題 I II | 解決手段 I<br>解決手段 II | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]                         | 発明の名称                        |
|---------------------|---------|-------------------|----------------------------------------------------------------------------|------------------------------|
| 薬剤吸収制御技術<br>遺伝子導入技術 | 吸収促進化   | 生体適合性改良           | 特表 2001-515051<br>97. 08. 13<br>C07C23/722                                 | 核酸送達用の脂質-ポリアミド結合体および組成物      |
|                     |         | 生体反応の利用<br>受容体利用  | 特開 2000-143548<br>98. 11. 16<br>A61K48/00<br>アイオワ大学 リ<br>サーチ ファウン<br>デーション | レトロウイルスの感染性を増大させるための方法および組成物 |
|                     |         | 促進剤の利用            | 特表 2001-503385<br>96. 08. 13<br>A61K47/48                                  | ポリヌクレオチド送達のための組成物および方法       |
|                     |         | 担体の利用<br>ベクターの利用  | 特表 2003-527863<br>00. 03. 24<br>C12N15/09                                  | 遺伝子送達のための改変ノダウイルス RNA        |

## 2.8 ブリストルマイヤーズスクイブ（米国）

### 2.8.1 企業の概要

|       |                                            |
|-------|--------------------------------------------|
| 商号    | Bristol-Myers Squibb Company               |
| 本社所在地 | 345 Park Avenue, New York, NY 10154 U.S.A. |
| 設立年   | 1989年（Bristol-MyersとSquibbが合併して設立）         |
| 資本金   | 220百万米ドル（2003年12月末）                        |
| 従業員数  | 約44,000名（連結：2003年12月末）                     |
| 事業内容  | 医療用医薬品等の開発・製造・販売                           |

ブリストルマイヤーズスクイブは、ブリストルマイヤーズとスクイブが1989年に合併してできた医薬品メーカーである。セイヨウイチョの木から抽出される植物成分であるパクリタキセルの抗腫瘍作用を利用した卵巣がん治療薬を世界で初めて承認されるなど、医薬品開発を積極的に展開している。

（出典：ブリストルマイヤーズスクイブのホームページ <http://www.bms.com/>）

### 2.8.2 製品例

ブリストルマイヤーズスクイブは、フランスのFlamel Technologiesのナノ微粒子技術を使って徐放性のインスリン製剤を開発しているが、ドラッグデリバリーシステムの製品はない。

### 2.8.3 技術開発拠点と研究者

特許明細書に記載されているブリストルマイヤーズスクイブの発明者の住所から調査した主な技術開発拠点は、次のとおりであり、主として米国のニュージャージー州、ワシントン州から出願されている。

米国 ニュージャージー州

米国 ワシントン州

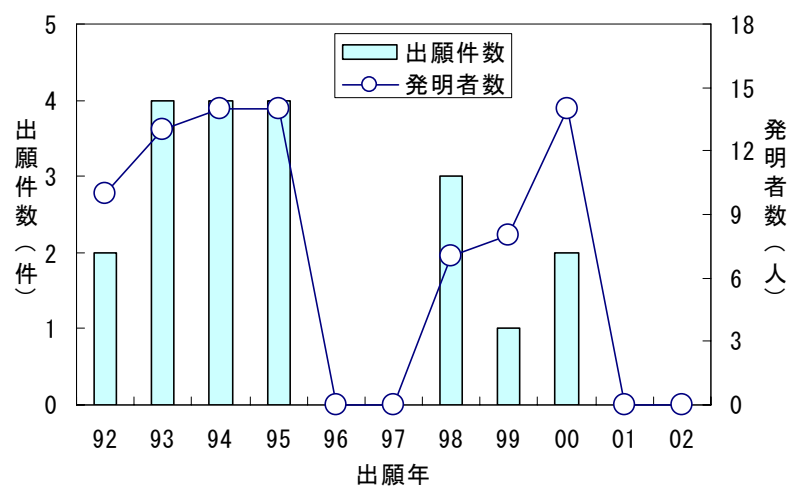
米国 コネチカット州、ペンシルベニア州、マサチューセッツ州

イギリス オックスフォード



ブリストルマイヤーズスクイブの出願件数・発明者数の推移を図2.8.3-1に示す。1996年～97年に発明者数がないが、その後00年にかけて、出願件数、発明者数が年間3件前後に回復している。01年と02年の出願が見られないのは、PCT出願のためにまだ公開されていないためと考えられる。

図2.8.3-1 ブリストルマイヤーズスクイブの出願件数・発明者数の年次推移

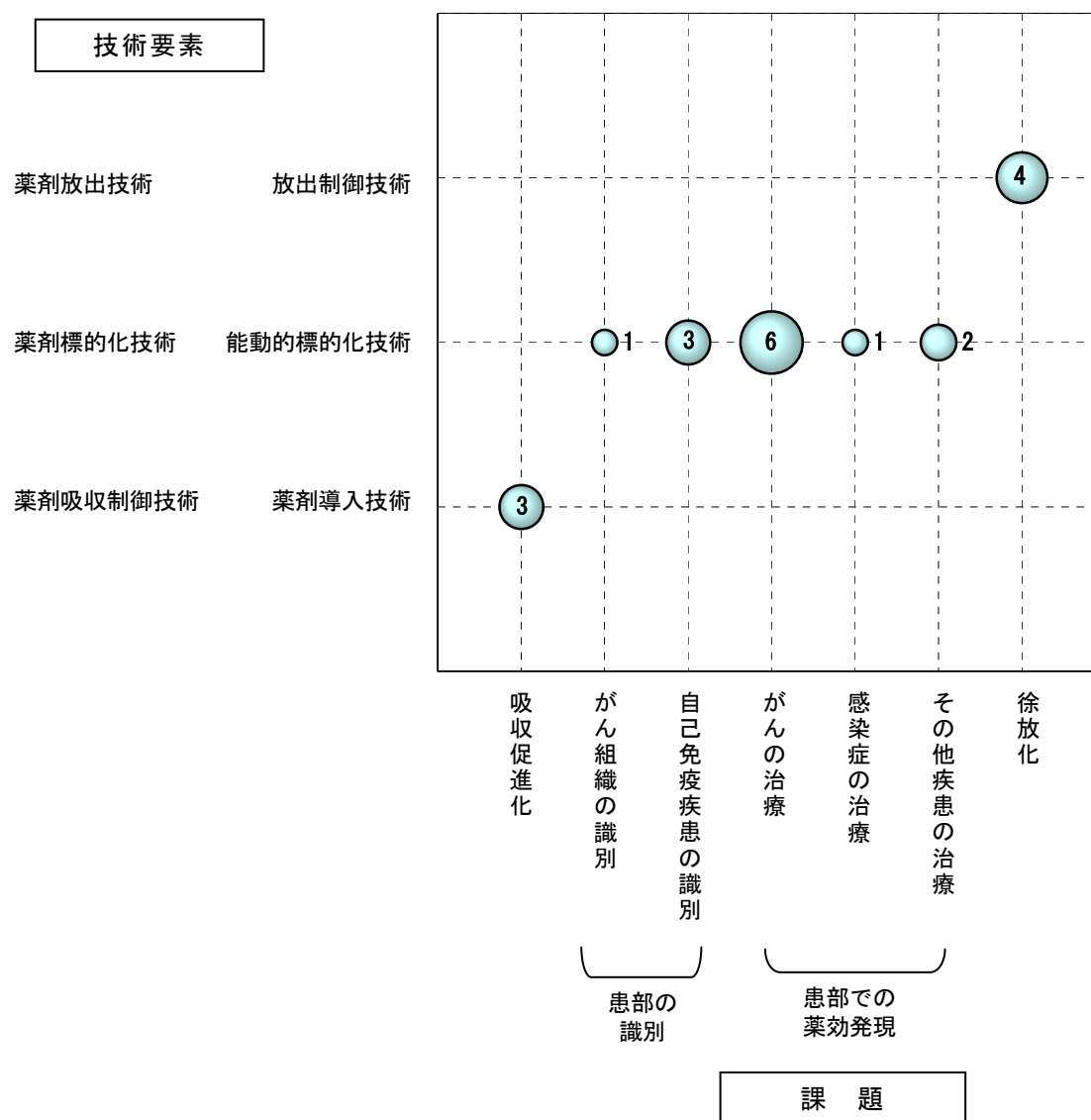


## 2.8.4 技術開発課題対応保有特許の概要

最近11年間（1992年1月1日～2002年12月31日）に出願されたブリストルマイヤーズスクイブのドラッグデリバリーシステムに関する特許・実用新案の件数は20件であり、表2.8.4にその内容を示している。

図2.8.4-1にブリストルマイヤーズスクイブの技術要素と課題の分布を示す。「薬剤標的化技術」と「薬剤吸収制御技術」、「薬剤放出技術」に出願している。薬剤標的化技術では、「能動的標的化技術」に関する出願が多く、がんをはじめとした疾患に対する患部の識別と治療が最も大きな課題となっている。薬剤放出技術では、「放出制御技術」について「徐放化」が課題となっている。薬剤吸収制御技術では、「薬剤導入技術」における「吸収促進化」が課題である。

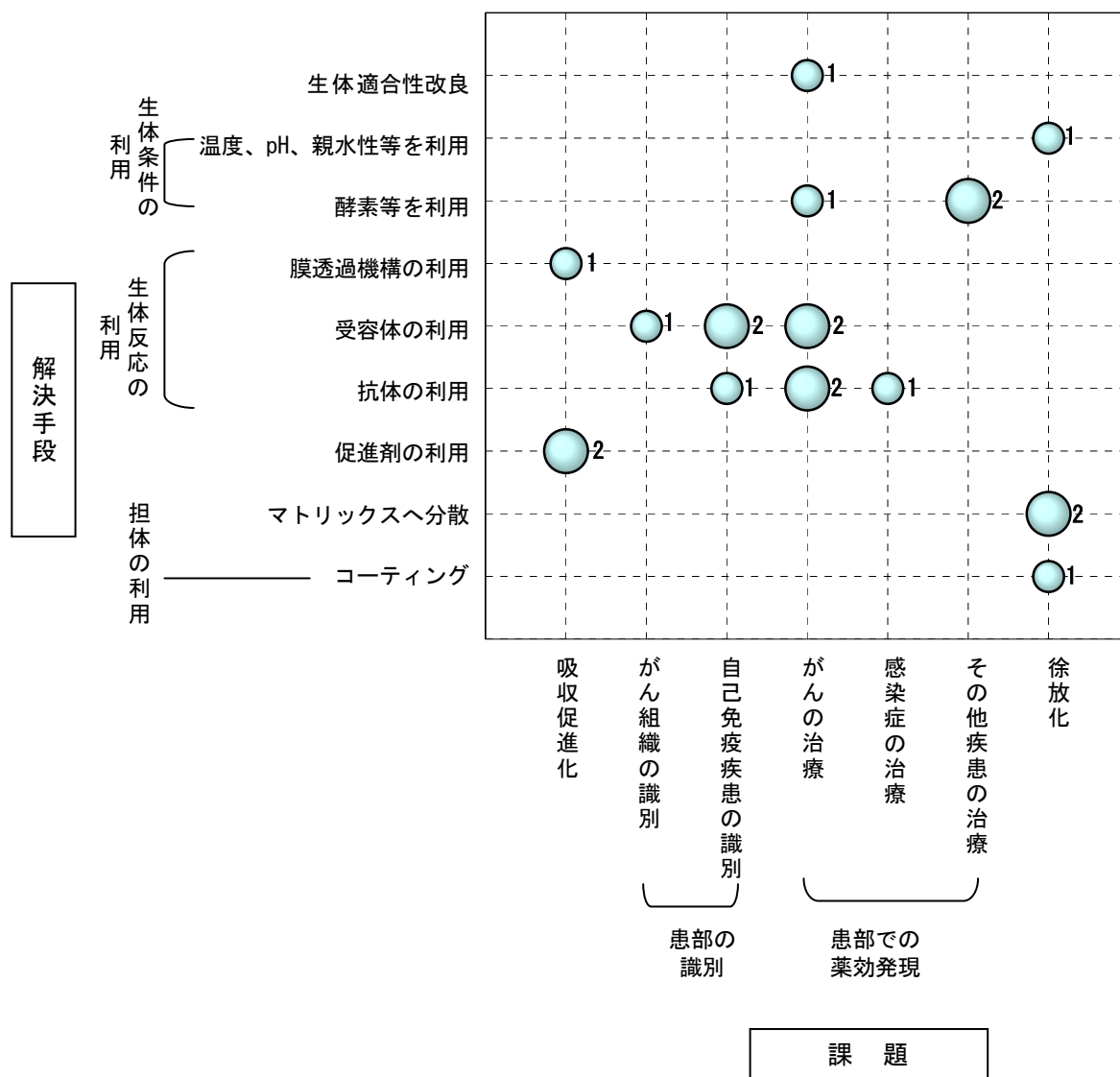
図2.8.4-1 ブリストルマイヤーズスクイブの技術要素と課題の分布



1992年1月～2002年12月の出願

ブリストルマイヤーズスクイブの課題と解決手段の分布を図2.8.4-2に示す。「吸収促進化」の課題に対しては、「促進剤の利用」と「膜透過機構の利用」が解決手段として用いられている。「疾患の識別」の課題に対しては、「受容体の利用」や「抗体の利用」といった「生体反応の利用」が解決手段となっている。

図2.8.4-2 ブリストルマイヤーズスクイブの課題と解決手段の分布



1992年1月～2002年12月の出願

表2.8.4 ブリストルマイヤーズスクイブの技術要素別課題対応特許 (1/2)

| 技術要素<br>I II        | 課題<br>I II        | 解決手段 I<br>解決手段 II            | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]                      | 発明の名称<br>概要                                        |
|---------------------|-------------------|------------------------------|------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------|
| 薬剤放出制御技術            | 徐放化               | 生体条件の利用<br>温度、pH、親水性<br>等の利用 | 特開平09-110682<br>(拒絶)<br>95. 09. 12<br>A61K9/70                         | 治療薬のバックル放出性製剤                                      |
|                     |                   | マトリックスへ<br>分散                | 特表平10-512850<br>94. 11. 22<br>A61K45/00                                | アレルギー性接触皮膚炎の予防的治療                                  |
|                     |                   |                              | 特表平10-512851<br>94. 11. 22<br>A61K45/00                                | 皮膚感作および刺激の予防および治療処置                                |
|                     |                   | 担体の利用<br>コーティング              | 特表2002-506812<br>98. 03. 19<br>A61K9/24                                | 易溶性薬物の二層性放出制御送達システムおよび方法                           |
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | がん組織の識別           | 生体反応の利用<br>受容体利用             | 特表2002-532440<br>98. 12. 18<br>C07D40/114                              | ビトロネクチン受容体拮抗剤薬剤                                    |
|                     | 自己免疫疾患の識別         | 生体反応の利用<br>受容体利用             | 特開平06-220096<br>92. 02. 14<br>C07K14/46<br>ダートマス大学<br>マサチューセッツ<br>総合病院 | CD40CRレセプター及びそれに対するリガンド                            |
|                     |                   |                              | 特表2004-521066<br>00. 06. 21<br>A61K31/47                               | 併用療法用ビトロネクチン受容体アンタゴニスト医薬                           |
|                     | がんの治療<br>患部での薬効発現 | 生体反応の利用<br>抗体の利用             | 特表平10-513348<br>95. 01. 26<br>C12N15/09                                | ヒトgp39の種々のエピトープに対して特異的なモノクローナル抗体およびその診断および治療における使用 |
|                     |                   | 生体適合性改良                      | 特開平08-191692<br>94. 08. 04<br>C12N15/09                                | ヒトガンに有効な新規なBR96抗体異性体                               |
|                     |                   | 生体条件の利用<br>酵素等の利用            | 特表2003-526683<br>00. 03. 15<br>C07K51/17                               | ペプチダーゼ切断可能な標的抗新生物薬およびそれらの治療への使用                    |
|                     |                   | 生体反応の利用<br>受容体利用             | 特開平06-025012<br>92. 01. 23<br>A61K39/395                               | チオエーテルコンジュゲート                                      |
|                     |                   |                              | 特開平07-070175<br>93. 05. 14<br>C07K5/06                                 | リソゾーム酵素開裂性抗腫瘍剤結合体                                  |
|                     |                   | 生体反応の利用<br>抗体の利用             | 特開平07-223969<br>(取下げ)<br>94. 01. 27<br>A61K39/44                       | チオエーテル結合体の製造法                                      |
|                     |                   |                              | 特表平09-509043<br>(取下げ)<br>93. 10. 25<br>C12N15/09                       | 植物ブリオニア・デイオイカから単離された新規なりボソーム不活性化タンパク質              |

表2.8.4 ブリストルマイヤーズスクイブの技術要素別課題対応特許 (2/2)

| 技術要素<br>I<br>II     | 課題<br>I<br>II         | 解決手段 I<br>解決手段 II | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数] | 発明の名称<br>概要                               |
|---------------------|-----------------------|-------------------|----------------------------------------------------|-------------------------------------------|
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | 患部での薬効発現              | 生体反応の利用<br>抗体の利用  | 特開平 07-147983<br>93. 05. 25<br>C12N15/09           | CD2 抗原に特異的なモノクローナル抗体及び Fv                 |
|                     | その他の疾患の治療<br>患部での薬効発現 | 生体条件の利用<br>酵素等の利用 | 特開平 08-325270<br>(取下げ)<br>95. 05. 31<br>G07D50/116 | $\beta$ -ラクタマーゼに対するポリマープロドラッグおよびその使用      |
|                     |                       |                   | 特表 2000-503639<br>95. 12. 22<br>G07D207/452        | 分枝ヒドラゾンのリンカー類                             |
|                     | 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術    | 吸収促進化             | 生体反応の利用<br>膜透過機構の利用                                | 特表 2003-500039<br>99. 05. 20<br>C12N15/09 |
| 促進剤の利用              |                       |                   | 特開平 07-002670<br>93. 02. 25<br>A61K31/47           | 薬物誘発過敏症に対するマスト細胞脱顆粒剤を用いる経皮治療用組成物          |
|                     |                       |                   | 特表 2002-530426<br>98. 11. 24<br>A61K38/00          | 70kD 熱ショック蛋白による化合物の細胞内標的輸送                |

## 2.9 アメリカ合衆国（米国）

### 2.9.1 出願人の概要

「アメリカ合衆国」名義でなされている日本への出願について、対応する外国出願の出願人名で確認したところ、大半がDepartment of Health & Human Services (DHHS:健康福祉省) もしくはその傘下のNational Institutes of Health (NIH: 国立衛生研究所) となっている。

アメリカ合衆国政府は、バイオテクノロジー、ヘルスケアを重要な研究開発分野と位置づけており、ドラッグデリバリーシステムに関してもNIHを中心として研究開発を進めている。NIHでは、傘下の研究所における研究だけでなく、米国内の大学への研究資金援助を行っている。

### 2.9.2 製品例

研究開発の推進を行っており、製品はない。

### 2.9.3 技術開発拠点と研究者

特許明細書に記載されているアメリカ合衆国の発明者の住所から調査した主な技術開発拠点は、次のとおりであり、主としてNIHのある米国メリーランド州から出願されている。共同研究先として、米国各地ならびにイスラエルなどからも出願されている。

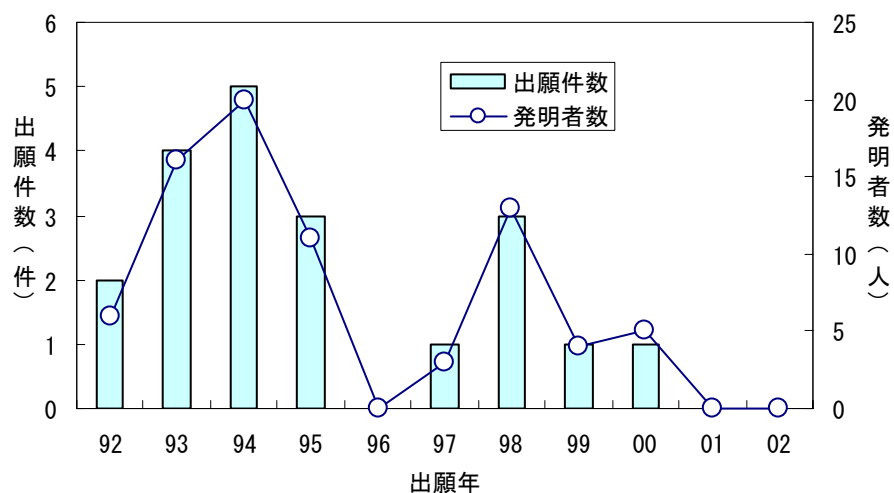
米国　メリーランド州

米国　カリフォルニア州、バージニア州、マサチューセッツ州、ミネソタ州

イスラエル　テルアビブ

アメリカ合衆国の出願件数・発明者数の推移を図2.9.3-1に示す。1994年をピークとした出願件数、発明者数の山が見られる。1996年に出願件数がゼロとなったが、その後出願件数、発明者数が回復している。2001年と2002年の出願が見られないのは、PCT出願のためにまだ公開されていないためと考えられる。

図2.9.3 アメリカ合衆国の出願件数・発明者数の年次推移

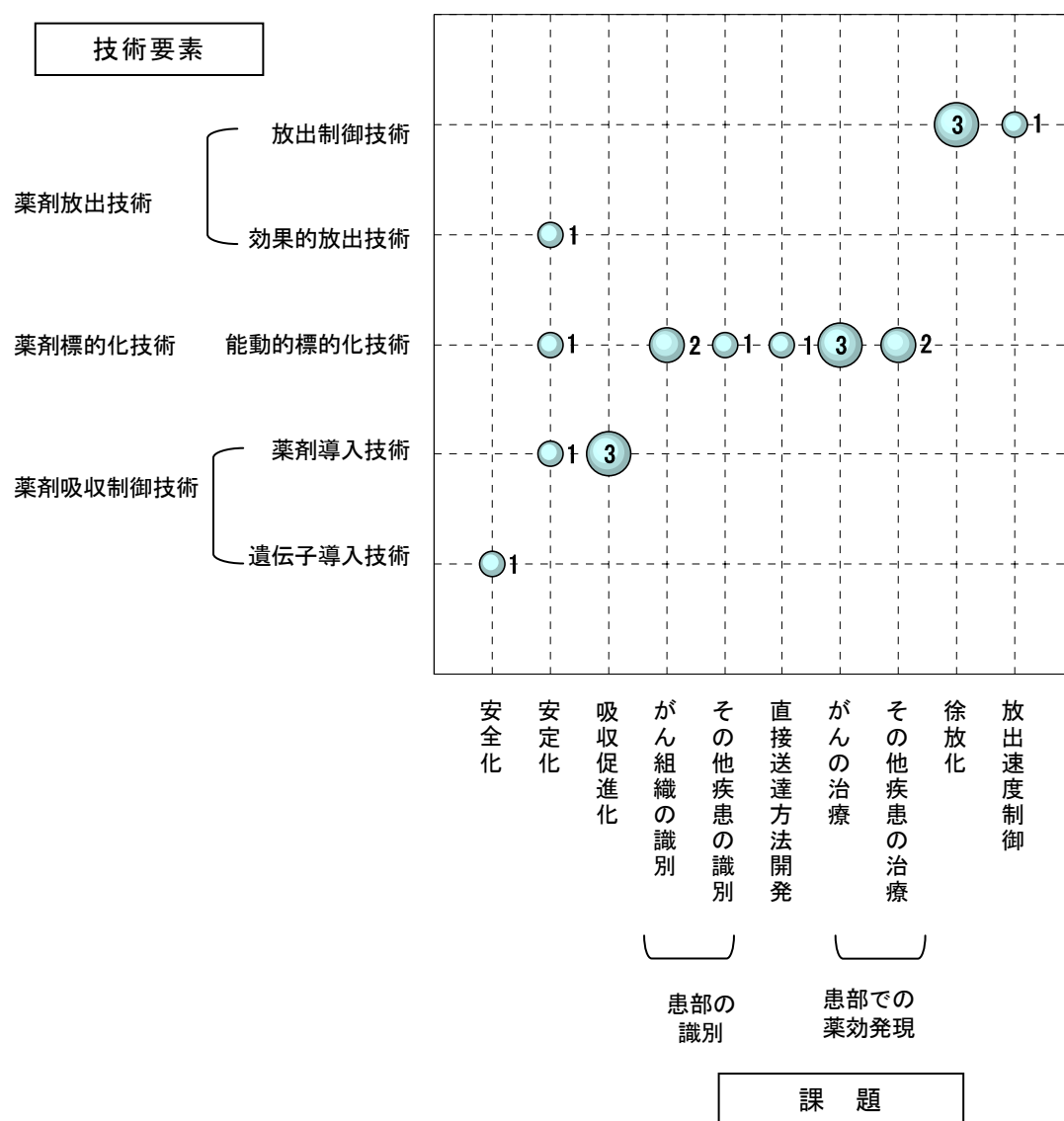


## 2.9.4 技術開発課題対応特許の概要

最近11年間（1992年1月～2002年12月）に出願されたアメリカ合衆国のドラッグデリバリーシステムに関する特許・実用新案の件数は20件であり、表2.9.4-1にその内容を示している。

図2.9.4-1にアメリカ合衆国の技術要素と課題の分布を示す。「薬剤標的化技術」と「薬剤吸収制御技術」、「薬剤放出技術」に出願している。薬剤標的化技術では、「能動的標的化技術」に関する出願が多く、がんをはじめとした疾患に対する患部の識別と治療が最も大きな課題となっている。薬剤放出技術では、「放出制御技術」について「除放化」が課題となっている。薬剤吸収制御技術では、「薬剤導入技術」における「吸収促進化」が課題である。

図2.9.4-1 アメリカ合衆国の技術要素と課題の分布

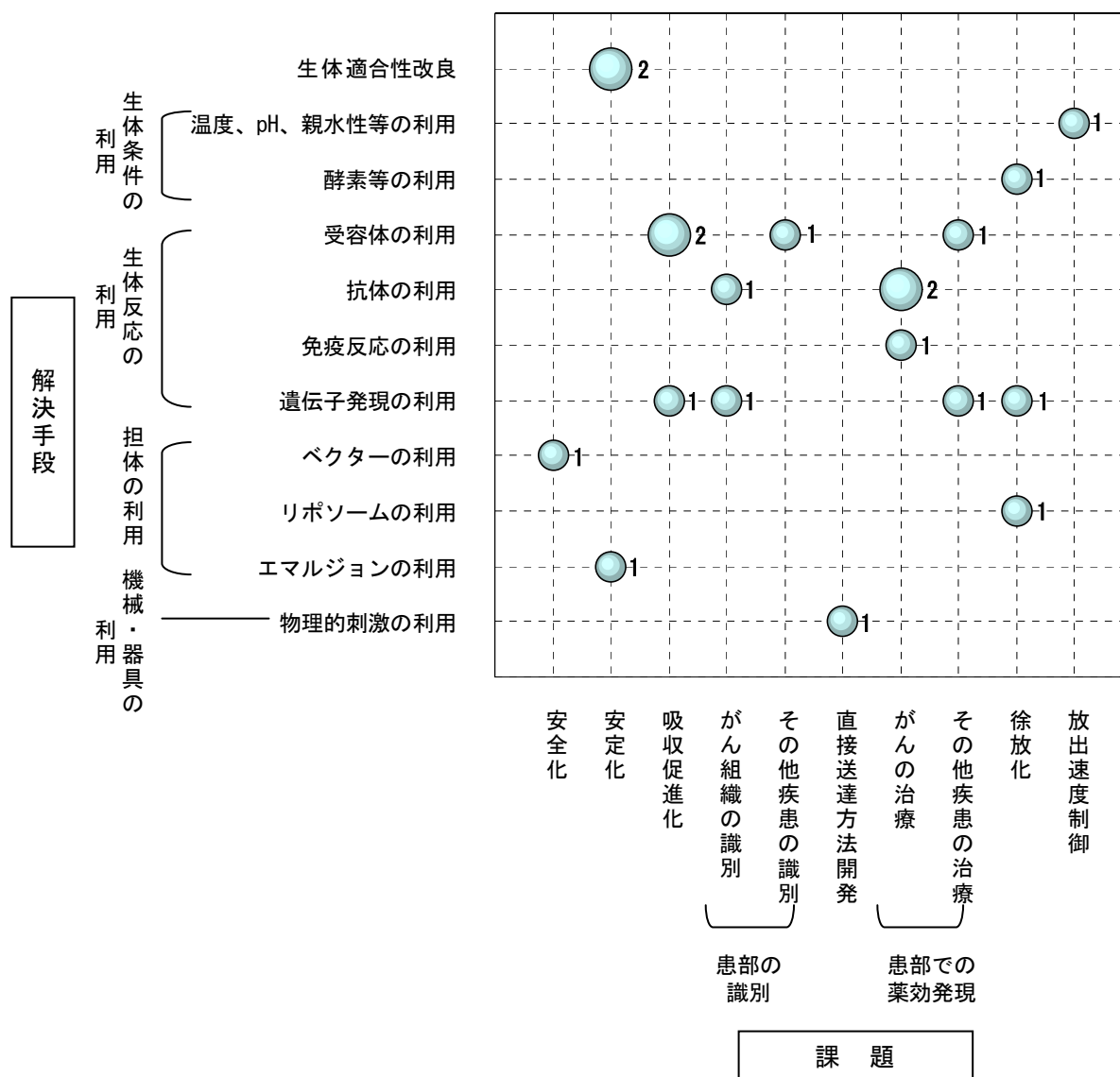


1992年1月～2002年12月の出願



アメリカ合衆国の課題と解決手段の分布を図2.9.4-2に示す。「吸収促進化」の課題に対しては、「受容体の利用」と「遺伝子発現の利用」が解決手段として用いられている。「がん組織の識別」の課題に対しては、「抗体の利用」や「遺伝子発現の利用」といった「生体反応の利用」が解決手段となっている。また、「がんの治療」の課題に対しては、「抗体の利用」や「免疫反応の利用」といった「生体反応の利用」が解決手段となっている。

図2.10.4-2 アメリカ合衆国の課題と解決手段の分布



1992年1月～2002年12月の出願

表2.9.4 アメリカ合衆国の技術要素別課題対応特許 (1/2)

| 技術要素<br>I II        | 課題<br>I II        | 解決手段 I<br>解決手段 II        | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]             | 発明の名称<br>概要                                                                                      |
|---------------------|-------------------|--------------------------|---------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 薬剤放出技術              | 徐放化               | 生体条件の利用<br>生分解性利用        | 特表平11-508872<br>(取下げ)<br>95. 04. 10<br>A61K31/785<br>バイパス     | インポテンスを治療するためのニトリックオキシド放出薬剤の使用                                                                   |
|                     |                   | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利用      | 特表平08-509215<br>93. 04. 13<br>A61K48/00                       | 移植治療のための神経由来胎児セルラインの使用                                                                           |
|                     |                   | 担体の利用<br>リポソームの利用        | 特表平10-510249<br>94. 11. 22<br>A61K38/00                       | 酸化窒素放出生体高分子含有医薬組成物                                                                               |
|                     | 放出速度制御            | 生体条件の利用<br>温度、pH、親水性等の利用 | 特表平11-503456<br>95. 04. 10<br>A61K47/48<br>アクリロン大学            | 多糖結合ニトリックオキシドー求核剤付加物                                                                             |
|                     | 安定化               | 担体の利用<br>エマルジョンの利用       | 特表2002-532535<br>98. 12. 22<br>A61K9/10                       | 水不溶性薬剤送達システム                                                                                     |
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | 安定化               | 生体適合性改良                  | 特表2004-503512<br>0. 06. 09<br>A61K47/48<br>クライトマン<br>ロバート ジェイ | 免疫複合体の抗腫瘍活性を改善し、かつ、毒性を低減するリンカーのPEG化                                                              |
|                     | がん組織の識別           | 生体反応の利用<br>抗体の利用         | 特表平10-505481<br>94. 04. 22<br>G12N15/09                       | メラノーマ抗原                                                                                          |
|                     |                   | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利用      | 特表2003-502273<br>98. 09. 01<br>A61K39/00                      | 正常な前立腺、精巣、および子宮ならびに新生物性の前立腺、精巣、および子宮に発現されたX連鎖GAG様遺伝子であるPAGE-4、ならびにその使用                           |
|                     | その他の疾患の識別         | 生体反応の利用<br>受容体利用         | 特許3533219<br>92. 11. 09<br>G12N15/09                          | 標的指向ベクター粒子<br>標的細胞の受容体に結合する受容体結合領域を含むキメラ包膜を含有する一つのベクター粒子。標的細胞あるいは組織に標的指向であり、また遺伝子治療方法として直接投与できる。 |
|                     | がんの治療<br>患部での薬効発現 | 生体反応の利用<br>抗体の利用         | 特開2004-115529<br>97. 05. 02<br>A61K38/43<br>イミューメディックス        | 悪性細胞に対する、oncタンパク質を含む、免疫毒素                                                                        |
|                     |                   |                          | 特表平10-508202<br>94. 10. 28<br>G12N15/09 ZNA                   | 腫瘍特異性抗体断片、融合タンパク質、およびそれらの使用                                                                      |
|                     |                   | 生体反応の利用<br>免疫反応の利用       | 特表平08-508252<br>93. 03. 17<br>C07K19/00                       | 小胞体シグナル配列ペプチドと少なくとも1個の他のペプチドをエンコードする核酸配列を含有する免疫原性キメラ、及びこのキメラのワクチン及び疾患の治療における使用                   |

表2.9.4 アメリカ合衆国の技術要素別課題対応特許 (2/2)

| 技術要素<br>I II        | 課題<br>I II            | 解決手段 I<br>解決手段 II   | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]             | 発明の名称<br>概要                                                                     |
|---------------------|-----------------------|---------------------|----------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------|
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | その他の疾患の治療<br>患部での薬効発現 | 生体反応の利用<br>受容体の利用   | 特許 3474574<br>93.06.14<br>C12N15/02                            | 結合特異性を有する組換えジスルフィド安定化ポリペプチドフラグメント<br>例えば抗体分子の可変領域をジスルフィド結合により安定化した Fv 抗体フラグメント。 |
|                     |                       | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利用 | 特表平 09-505557<br>(取下げ)<br>93.09.03<br>A61K48/00                | ヒト腫瘍細胞の遺伝子形質転換によるヒト腫瘍の治療                                                        |
|                     | 直接送達方法<br>開発          | 機械・器具の利用<br>装置の利用   | 特表平 10-502905<br>94.03.17<br>A61K31/655<br>コメディカス              | 再狭窄および関連障害を治療するための酸化窒素放出ポリマーの使用                                                 |
| 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 安定化                   | 生体適合性改良             | 特表 2002-520369<br>98.07.17<br>A61K47/48                        | 水溶性薬剤およびその製造方法                                                                  |
|                     | 吸収促進化                 | 生体反応の利用<br>受容体の利用   | 特表 2003-512441<br>99.10.22<br>A61K45/00<br>ジェネンテック             | 極性上皮細胞層を横断するタンパク質の送達                                                            |
|                     |                       |                     | 特表平 07-509250<br>(取下げ)<br>92.07.27<br>A61K47/48                | 血液脳バリアーへのリポソームの標的化                                                              |
|                     |                       | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利用 | 特表平 10-512276<br>(取下げ)<br>95.01.17<br>A61K48/00<br>ジェネティックセラピー | 遺伝子治療による治療薬の送達                                                                  |
| 薬剤吸収制御技術<br>遺伝子導入技術 | 安全化                   | 担体の利用<br>ベクターの利用    | 特表平 10-503924<br>94.05.04<br>C12N15/09<br>セリオン ビオロジックス         | イン・ビボ遺伝子送達の方法                                                                   |

## 2.10 テキサス大学（米国）

### 2.10.1 大学の概要

|       |                                                                             |
|-------|-----------------------------------------------------------------------------|
| 名称    | The University of Texas System                                              |
| 本部所在地 | 601 Clorado Street, Austin, TX 78701-2982 U. S. A.                          |
| 設立年   | 1883年                                                                       |
| 教職員数  | 約76,000名（内、教員・研究員約15,000名）                                                  |
| 概要    | テキサス州内に9つのキャンパス（Austin、Arlington等）と6つの医療・健康施設（Houston、San Antonio等）を有する総合大学 |

テキサス大学は、米国のバイオテクノロジー、ヘルスケア研究の中心の一つであり、医薬の研究開発を活発に推進している。通常の大学施設に加え、6カ所の医療・健康施設も有しているという特徴がある。

（出典：テキサス大学のホームページ <http://www.utssystem.edu/>）

### 2.10.2 製品例

テキサス大学は、研究機関であり、ドラッグデリバリーシステムの製品はない。

### 2.10.3 技術開発拠点と研究者

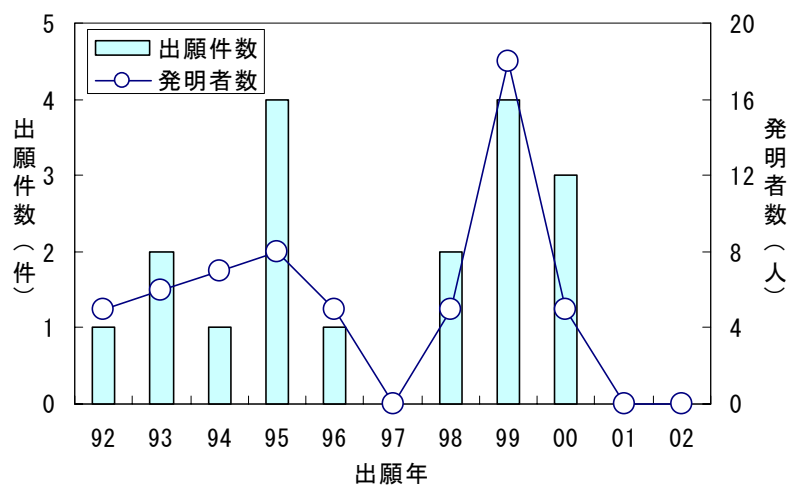
特許明細書に記載されているテキサス大学の発明者の住所から調査した主な技術開発拠点は、次のとおりであり、主として米国テキサス州から出願されている。その他に米国カリフォルニア州やカナダ ブリティッシュコロンビア州から共同出願として出願されている。

米国 テキサス州

カナダ ブリティッシュコロンビア州

テキサス大学の出願件数・発明者数の推移を図2.10.3に示す。1997年に出願件数、発明者数が減少したが、その後、出願件数、発明者数が増加している。01年、02年に出願が見られないのは、PCT出願のためにまだ公開されていないためと考えられる。

図2.10.3 テキサス大学の出願件数・発明者数の年次推移

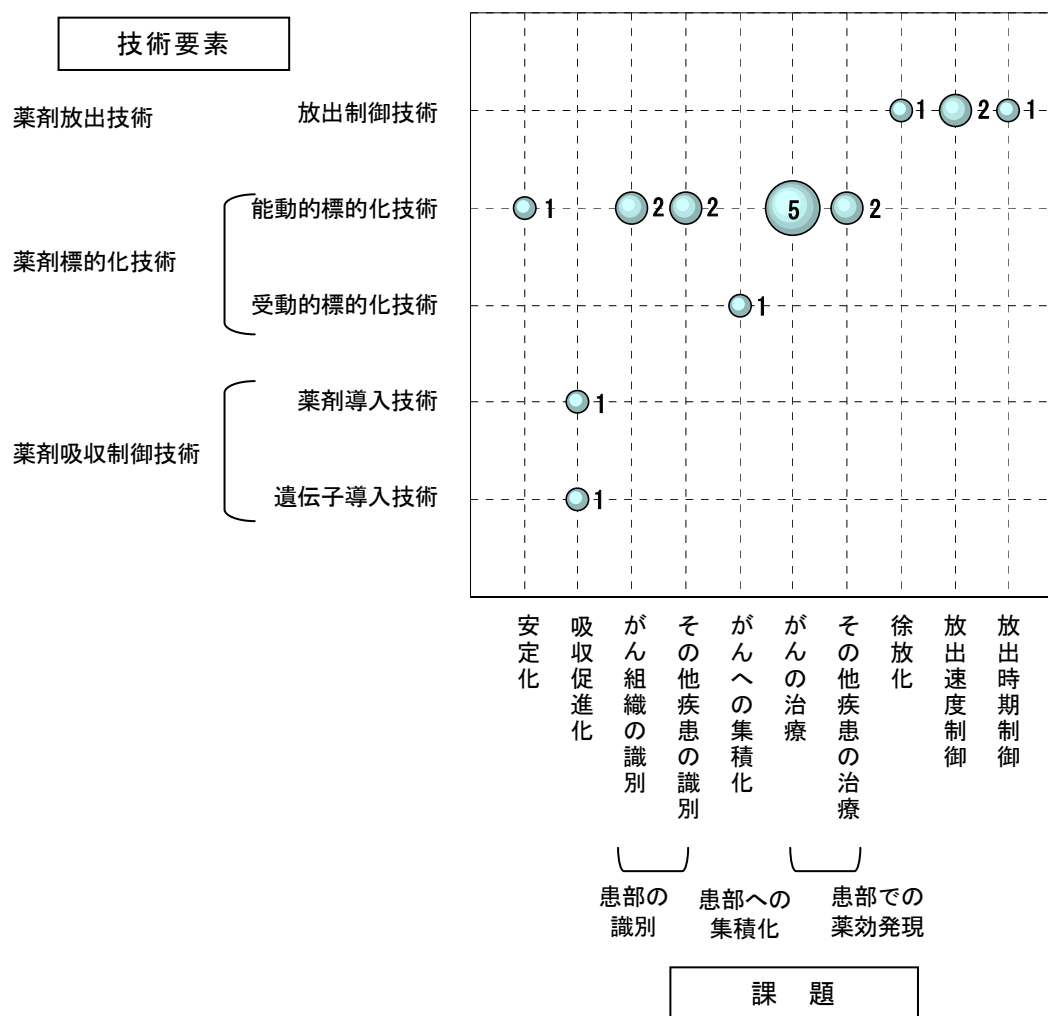


## 2.10.4 技術開発課題対応特許の概要

最近11年間（1992年1月～2002年12月）に出願されたテキサス大学のドラッグデリバリーシステムに関する特許・実用新案の件数は19件であり、表2.10.4にその内容を示している。

図2.10.4-1にテキサス大学の技術要素と課題の分布を示す。「薬剤標的化技術」と「薬剤放出技術」、「薬剤吸収制御技術」に出願している。薬剤標的化技術に関しては、「がんの治療」を中心とした課題、その他疾患に対する識別を中心とした課題がある。薬剤放出技術では、放出制御技術に関して、「放出速度制御」、「放出時期制御」、「徐放化」が課題となっている。薬剤吸収制御技術では、薬剤導入技術および遺伝子導入技術における「吸収促進化」が課題となっている。

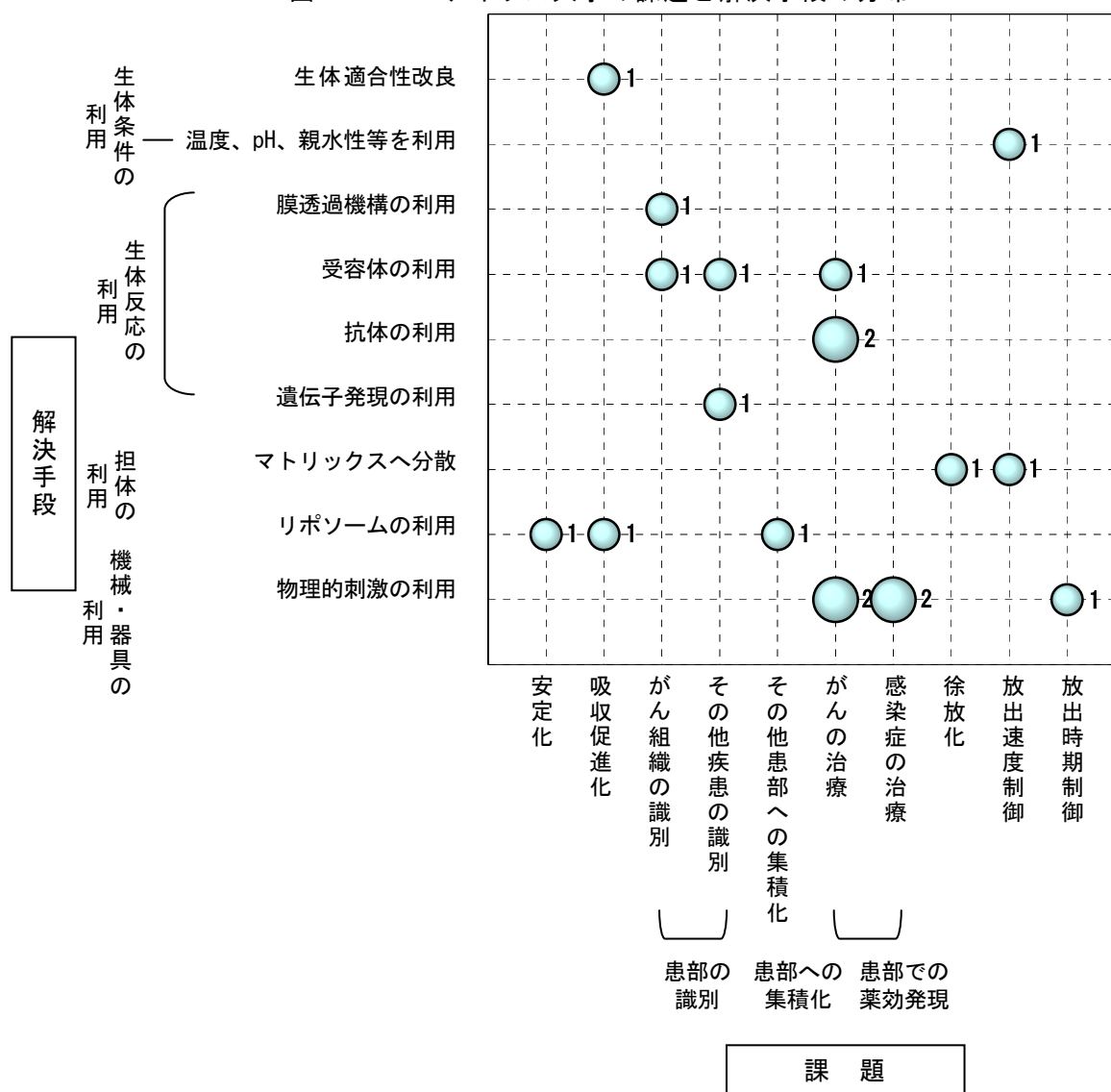
図2.10.4-1 テキサス大学の技術要素と課題の分布



1992年1月～2002年12月の出願

テキサス大学の課題と解決手段の分布を図2. 10. 4-2に示す。「がんの治療」という課題に対して、「抗体の利用」と「物理的刺激の利用」が解決手段として用いられている。「感染症の治療」に対しても「物理的刺激の利用」が解決手段となっている。「がん組織の識別」には、「受容体の利用」や「膜透過機構の利用」が解決手段となっている。「吸収促進化」に対しては、「生体適合性改良」と「リポソームの利用」が解決手段として用いられている。

図2. 11. 4-2 テキサス大学の課題と解決手段の分布



1992年1月～2002年12月の出願

表2. 10. 4 テキサス大学の技術要素別課題対応特許 (1/2)

| 技術要素<br>I II        | 課題<br>I II        | 解決手段 I<br>解決手段 II    | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]                    | 発明の名称<br>概要                                                 |
|---------------------|-------------------|----------------------|----------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------|
| 薬剤放出制御技術            | 徐放化               | マトリックスへ分散            | 特表平09-509401<br>93. 12. 10<br>A61K38/48                              | フィブリン溶解増強剤の局所送達                                             |
|                     | 放出速度制御            | 生体条件の利用<br>生分解性利用    | 特表2003-506401<br>99. 08. 06<br>A61K9/70                              | 薬剤放出生分解性繊維インプラント                                            |
|                     |                   | マトリックスへ分散            | 特許3011768<br>92. 02. 28<br>A61K9/00                                  | 組織接触材料および制御放出キャリアとしての光重合性生分解性親水ゲル<br>薬物の放出制御に親水性ポリマーゲルを用いる。 |
|                     | 放出時期制御            | 機械・器具の利用<br>物理的刺激の利用 | 特表平10-510844<br>95. 06. 07<br>A61K31/40<br>ファーマサイクリクス、<br>ダン ランドル シー | テキサフィリンを用いるRNAの光切断                                          |
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | 安定化               | 担体の利用<br>リポソームの利用    | 特表平09-501160<br>93. 07. 29<br>A61K91/27                              | リポソームアンチセンスホスホン酸メチルオリゴヌクレオチドとそれらの製造方法及び用途                   |
|                     | がん組織の識別           | 生体反応の利用<br>受容体利用     | 特表2002-520297<br>98. 07. 13<br>A61K47/48<br>ファーマサイクリクス               | アミノリン脂質に結合する治療結合体を用いる癌処置方法                                  |
|                     |                   | 生体反応の利用<br>膜透過機構の利用  | 特表2004-501664<br>00. 06. 30<br>C12N15/09                             | 標的化薬剤送達のための腫瘍組織を浸潤する細胞特異的な内部移行ペプチドの単離                       |
|                     | その他の疾患の識別         | 生体反応の利用<br>受容体利用     | 特表2004-515751<br>00. 09. 08<br>G01N3/53                              | インビトロターゲットングのための方法および組成物                                    |
|                     |                   | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利用  | 特表2003-507076<br>99. 08. 20<br>C12N15/09                             | 心臓の遺伝子発現の調節におけるHDAC4およびHDAC5                                |
|                     | がんの治療<br>患部での薬効発現 | 生体反応の利用<br>受容体利用     | 特表2002-520295<br>98. 07. 13<br>A61K39/395<br>ファーマサイクリクス              | アミノリン脂質に対する抗体を用いる癌処置方法                                      |
|                     |                   | 生体反応の利用<br>抗体の利用     | 特表2002-543093<br>99. 04. 28<br>A61K39/395<br>ファーマサイクリクス              | VEGFの選択的阻害による癌処置のための組成物および方法                                |
|                     |                   |                      | 特開2001-316270<br>(取り下げ)<br>95. 06. 07<br>A61K317/125                 | テキサフィリンを用いるRNAの光切断                                          |
|                     |                   | 機械・器具の利用<br>物理的刺激の利用 | 特表2002-516878<br>98. 06. 05<br>A61K47/48                             | テキサフィリン結合体およびその使用                                           |
|                     |                   |                      | 特表2000-512279<br>96. 06. 04<br>A61K41/00<br>ファーマサイクリクス               | テキサフィリンの膜取り組み                                               |



表2. 10. 4 テキサス大学の技術要素別課題対応特許 (2/2)

| 技術要素 I II           | 課題 I II               | 解決手段 I<br>解決手段 II    | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]        | 発明の名称<br>概要                                                            |
|---------------------|-----------------------|----------------------|-----------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | その他の疾患の治療<br>患者での薬効発現 | 機械・器具の利用<br>物理的刺激の利用 | 特表平 10-508581<br>94. 09. 21<br>C07H21/04                  | テキサフィリンを用いるDNAの光切断                                                     |
|                     |                       |                      | 特表平 11-506452<br>95. 06. 02<br>A61K31/70<br>ファーマサイクリクス    | 金属錯体を用いた核酸の加水分解および光切断                                                  |
| 受動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | がんへの集積化<br>患者への集積化    | 担体の利用<br>リボソームの利用    | 特表 2002-541088<br>99. 04. 01<br>A61K31/475<br>イネックス PHARM | リンパ腫の治療のための組成物および方法                                                    |
| 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 吸収促進化                 | 生体適合性改良              | 特表 2004-517800<br>00. 04. 07<br>A61K31/663                | 両性イオンリン脂質およびビスホスホネートを含む独特の組成物および胃腸毒性を低減化したビスホスフェートデリバリーシステムとしての該組成物の使用 |
| 薬剤吸収制御技術<br>遺伝子導入技術 | 吸収促進化                 | 担体の利用<br>リボソームの利用    | 特表平 11-512099<br>95. 08. 29<br>A61K31/70                  | リポソーマルホスホジエステル、ホスホロチオエート、およびp-エトキシオリゴヌクレオチド                            |

## 2.11 武田薬品工業

### 2.11.1 企業の概要

|       |                              |
|-------|------------------------------|
| 商号    | 武田薬品工業 株式会社                  |
| 本社所在地 | 〒540-8645 大阪府大阪市中央区道修町4-1-1  |
| 設立年   | 1925年（大正14年）                 |
| 資本金   | 635億41百万円（2004年3月末）          |
| 従業員数  | 5,937名（2004年3月末）（連結：14,592名） |
| 事業内容  | 医療用医薬品、一般用医薬品、医薬部外品等の製造・販売   |

武田薬品工業は、医療用医薬品、一般用医薬品、医薬部外品を開発、製造、販売している。武田薬品工業は、生活習慣病、癌・泌尿器疾患、中枢神経系疾患、消化器疾患LCM（Life Cycle Management）の4つを重点疾患領域として定め、研究開発を進めている。

（出典：武田薬品工業のホームページ <http://www.takeda.co.jp/>）

### 2.11.2 製品例

武田薬品工業のドラッグデリバリーシステム製品としては、前立腺がん・子宮内膜症治療剤の酢酸リュープロレリン製剤がある。酢酸リュープロレリンは、経口投与しても吸収されないため、水溶性注射液が開発された。しかし、効果を得るためには毎日注射をする必要があった。武田薬品工業は、酢酸リュープロレリンをマイクロカプセル化することにより、1ヶ月間一定速度で放出させ、効果を持続させることに成功した。（出典：武田薬品工業のホームページ <http://www.takeda.co.jp/>）

### 2.11.3 技術開発拠点と研究者

特許明細書に記載されている武田薬品の発明者の住所から調査した主な技術開発拠点は、次のとおりであり、大阪の研究所を中心に研究開発がなされている。

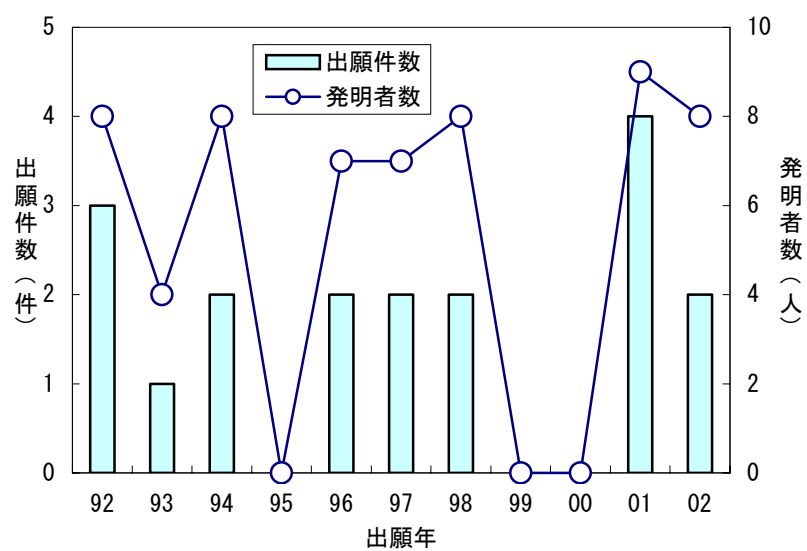
大阪府 池田市、豊能郡豊能町  
兵庫県 神戸市須磨区、兵神戸市北区、川西市  
京都府 宇治市、綴喜郡田辺町  
滋賀県草津市、滋賀県近江八幡市

参考として、武田薬品工業の研究所を以下に示す。

大阪工場地区研究部門 大阪市淀川区十三本町二丁目17番85号  
筑波地区研究部門 つくば市和台10番地

武田薬品工業の出願件数・発明者数の推移を図2.11.3に示す。1995年と99年、00年には出願が見られなかったが、年間2件前後の出願件数で推移している。発明者数は、7人前後で推移している。

図2.11.3 武田薬品工業の出願件数・発明者数の年次推移

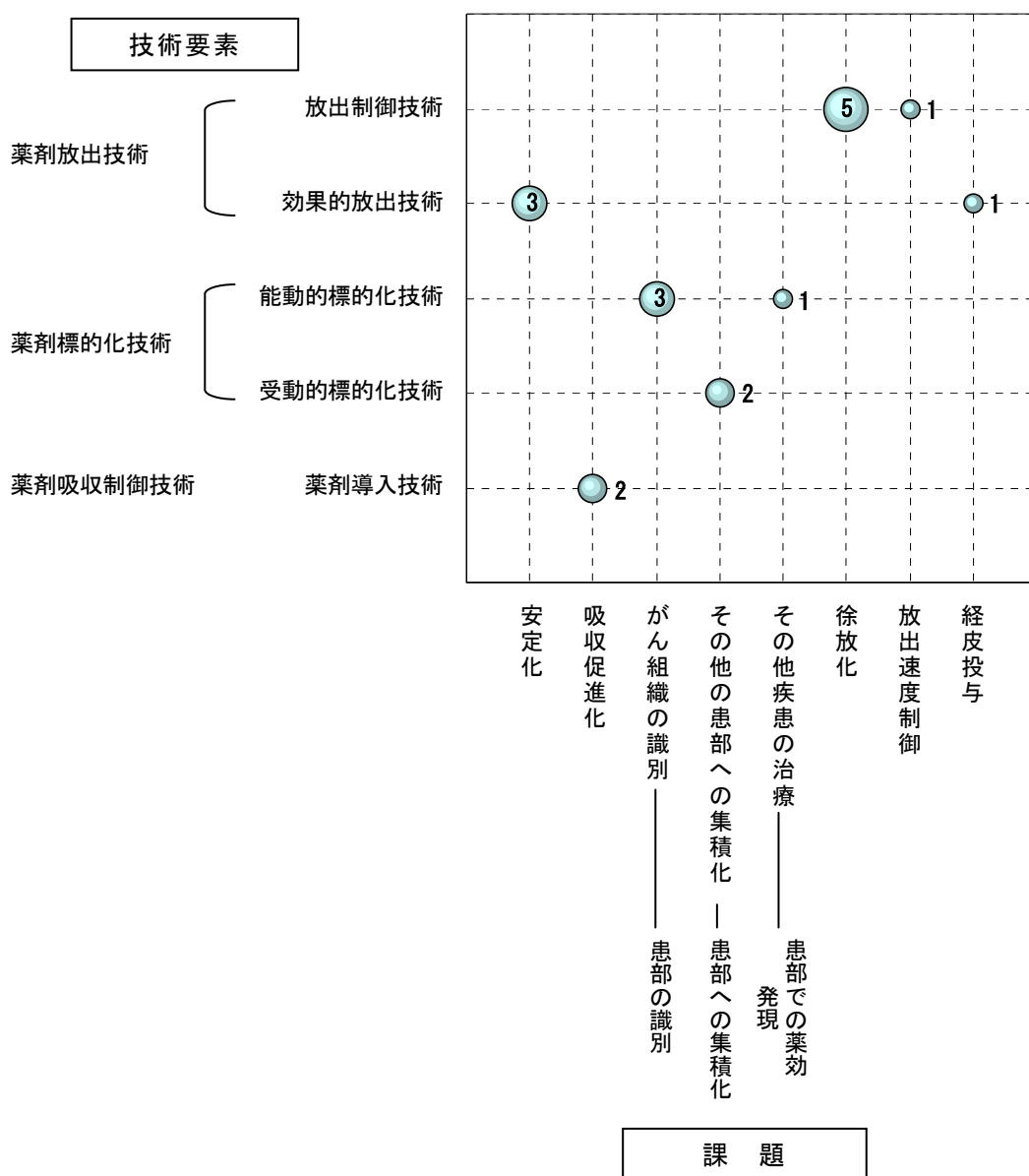


## 2.11.4 技術開発課題対応特許の概要

最近11年間（1992年1月～2002年12月）に出願された武田薬品工業のドラッグデリバリーシステムに関する特許・実用新案の件数は18件であり、表2.11.4にその内容を示している。

図2.11.4-1に武田薬品工業の技術要素と課題の分布を示す。「薬剤標的化技術」と「薬剤放出技術」、「薬剤吸収制御技術」に出願している。薬剤標的化技術に関しては、「がん組織の識別」を中心として、「その他疾患の治療」の課題がある。薬剤吸収技術では、「放出制御技術」に関して、「放出速度制御」、「徐放化」が課題となっている。薬剤吸収制御技術では、「薬剤導入技術」における「吸収促進化」が課題となっている。

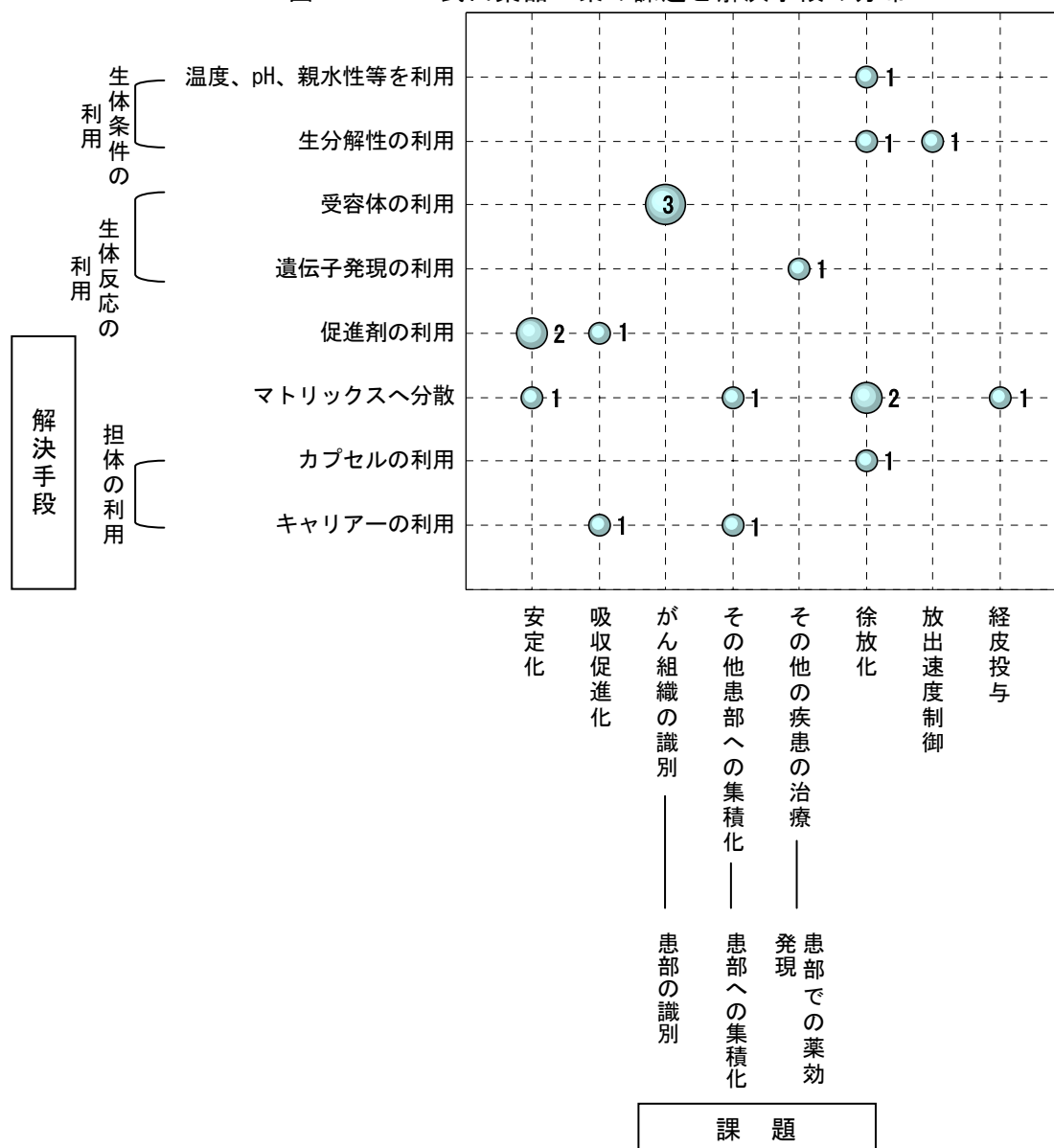
図2.11.4-1 武田薬品工業の技術要素と課題の分布



1992年1月～2002年12月の出願

武田薬品工業の課題と解決手段の分布を図2. 12. 4-2に示す。「がん組織の識別」という課題に対しては、「受容体の利用」が解決手段として用いられている。「徐放化」も課題であり、「マトリックスへ分散」を始めとして「生体条件の利用」が解決手段となっている。また、「安定化」という課題に対しては、「促進剤の利用」と「マトリックスへ分散」が解決手段として用いられている。

図2. 11. 4-2 武田薬品工業の課題と解決手段の分布



1992年1月～2002年12月の出願

表2.11.4 武田薬品工業の技術要素別課題対応特許 (1/2)

| 技術要素<br>I II        | 課題<br>I II       | 解決手段 I<br>解決手段 II        | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数] | 発明の名称<br>概要             |
|---------------------|------------------|--------------------------|---------------------------------------------------|-------------------------|
| 薬剤放出制御技術            | 徐放化              | 生体条件の利用<br>温度、pH、親水性等の利用 | 特開2000-026316<br>97.03.25<br>A61K47/36            | 消化管粘膜付着性抗ヘリコバクター・ピロリ組成物 |
|                     |                  | 生体条件の利用<br>生分解性利用        | W099/36099<br>(却下)<br>98.01.16<br>A61K47/30       | 徐放性組成物、その製造法および用途       |
|                     |                  | マトリックスへ分散                | 特開平10-167985<br>96.10.08<br>A61K45/00             | 抗ヘリコバクター剤               |
|                     |                  |                          | 特開2002-226365<br>00.12.01<br>A61K9/52             | 生理活性物質含有製剤の製造法          |
|                     |                  | 担体の利用<br>カプセルの利用         | 特開平08-157389<br>(取下げ)<br>94.10.04<br>A61K38/00    | 高トリグリセリド血症治療剤           |
|                     | 放出速度制御           | 生体条件の利用<br>生分解性利用        | 特開平11-269094<br>98.01.16<br>A61K47/12             | 徐放性組成物、その製造法および用途       |
| 効果的放出技術<br>薬剤放出技術   | 安定化              | 促進剤の利用                   | 特開平10-081621<br>96.04.01<br>A61K31/335            | 経口投与用医薬組成物              |
|                     |                  |                          | 特開2004-155773<br>02.10.16<br>A61K314/439          | 安定な固形製剤                 |
|                     |                  | マトリックスへ分散                | 特開2002-241267<br>00.12.11<br>A61K9/20             | 水溶解性が改善された医薬組成物         |
|                     | 新規投与方法開発<br>経皮投与 | マトリックスへ分散                | 特開平11-116470<br>97.08.12<br>A61K31/12             | イデベノン含有経皮投与製剤           |
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | がん組織の識別          | 生体反応の利用<br>受容体利用         | 特開平06-009672<br>(取下げ)<br>92.03.24<br>C07F17/02    | トランスフェリンープラチナ化合物複合体     |
|                     |                  |                          | 特開2003-116584<br>01.07.17<br>C12N15/09            | 癌の予防・治療剤および診断剤          |
|                     |                  |                          | 特開2004-075569<br>02.08.12<br>A61K38/00            | IL20受容体およびIL20の新規用途     |

表2.11.4 武田薬品工業の技術要素別課題対応特許（2/2）

| 技術要素<br>I II        | 課題<br>I II             | 解決手段 I<br>解決手段 II   | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数] | 発明の名称<br>概要       |
|---------------------|------------------------|---------------------|----------------------------------------------------|-------------------|
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | その他の疾患の治療<br>患部での薬効発現  | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利用 | 特開 2002-355060<br>00. 10. 05<br>C12N15/09          | 新規タンパク質、その製造法及び用途 |
| 受動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | その他の患部への集積化<br>患部への集積化 | マトリックスへ分散           | 特開平 07-206903<br>94. 01. 24<br>C08B37/00           | 超分子構造型集合体         |
|                     |                        | 担体の利用<br>キャリアーの利用   | 特開平 07-097333<br>(取下げ)<br>93. 08. 04<br>A61K38/00  | 超分子構造型集合体         |
| 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 吸収促進化                  | 促進剤の利用              | 特開平 06-009424<br>92. 04. 17<br>A61K37/02           | 経粘膜用製剤            |
|                     |                        | 担体の利用<br>キャリアーの利用   | 特開平 06-228199<br>(取下げ)<br>92. 11. 27<br>C07K15/12  | 血液脳関門通過可能なペプチド結合体 |

## 2.12 ウエスト ファーマシューティカル サービスズ（米国）

### 2.12.1 企業の概要

|       |                                                               |
|-------|---------------------------------------------------------------|
| 商号    | West Pharmaceutical Services, Inc.                            |
| 本社所在地 | 101 Gordon Drive, P.O.Box 645 Lionville, PA 19341-0645 U.S.A. |
| 設立年   | 1923年                                                         |
| 資本金   | 4百万米ドル（2003年12月末）                                             |
| 従業員数  | 4,365名（連結：2003年12月末）                                          |
| 事業内容  | 医薬品パッケージング、ドラッグデリバリーシステムの開発・製造・販売                             |

ウエスト ファーマシューティカル サービスズは、医薬品パッケージングをはじめとした薬品関連産業の幅広い分野で製品開発・販売を行っている。また、経鼻投与を始めとする各種のドラッグデリバリーシステムの開発を行っている。

（出典：ウエスト ファーマシューティカル サービスズのホームページ <http://www.westpharma.com/>）

### 2.12.2 製品例

ウエスト ファーマシューティカル サービスズは、キトサンとペクチンを基礎とした小分子薬物、ペプチド、たんぱく質、ワクチンのドラッグデリバリーシステム技術を有している。経口ドラッグデリバリーシステムとしては、薬剤やワクチンを大腸に送達させる技術を有している。

現在、臨床試験中のものがあるが、ドラッグデリバリーシステムに関連した製品はない。

（出典：ウエスト ファーマシューティカル サービスズのホームページ <http://www.westpharma.com/>）

### 2.12.3 技術開発拠点と研究者

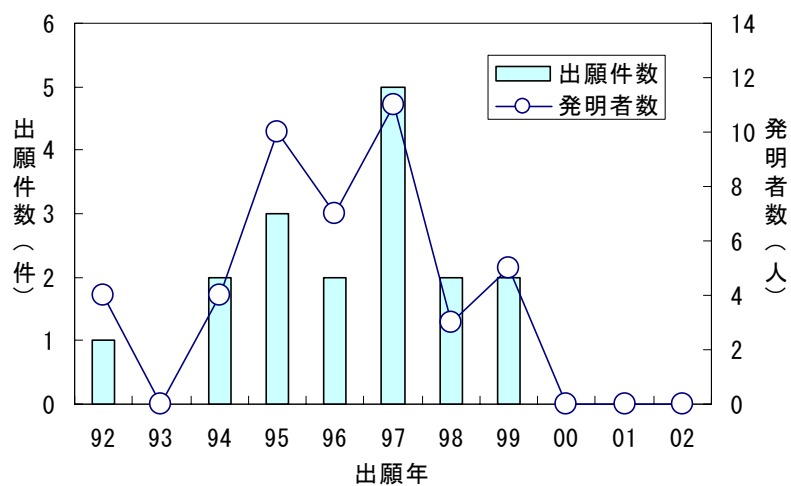
特許明細書に記載されているウエスト ファーマシューティカル サービスズの発明者の住所から調査した主な技術開発拠点は、次のとおりであり、主としてイギリスから出願されている。ウエスト ファーマシューティカル サービスズの本社はイギリス ノッティングハムのサイエンスパークにあるアルバート アインシュタイン センターである。カナダおよびスペインは共同研究先である。

イギリス ノッティングハム、ロンドン、ウエストサセックス  
カナダ ケベック州モントリオール  
スペイン ラ ラグナ ラグナ大学



ウエスト ファーマシューティカル サービスズの出願件数・発明者数の推移を図2.12.3に示す。1994～97年にかけて出願件数、発明者数が増加し、98年以降は減少している。

図2.13.3 ウエスト ファーマシューティカル サービスズの出願件数・発明者数の年次推移

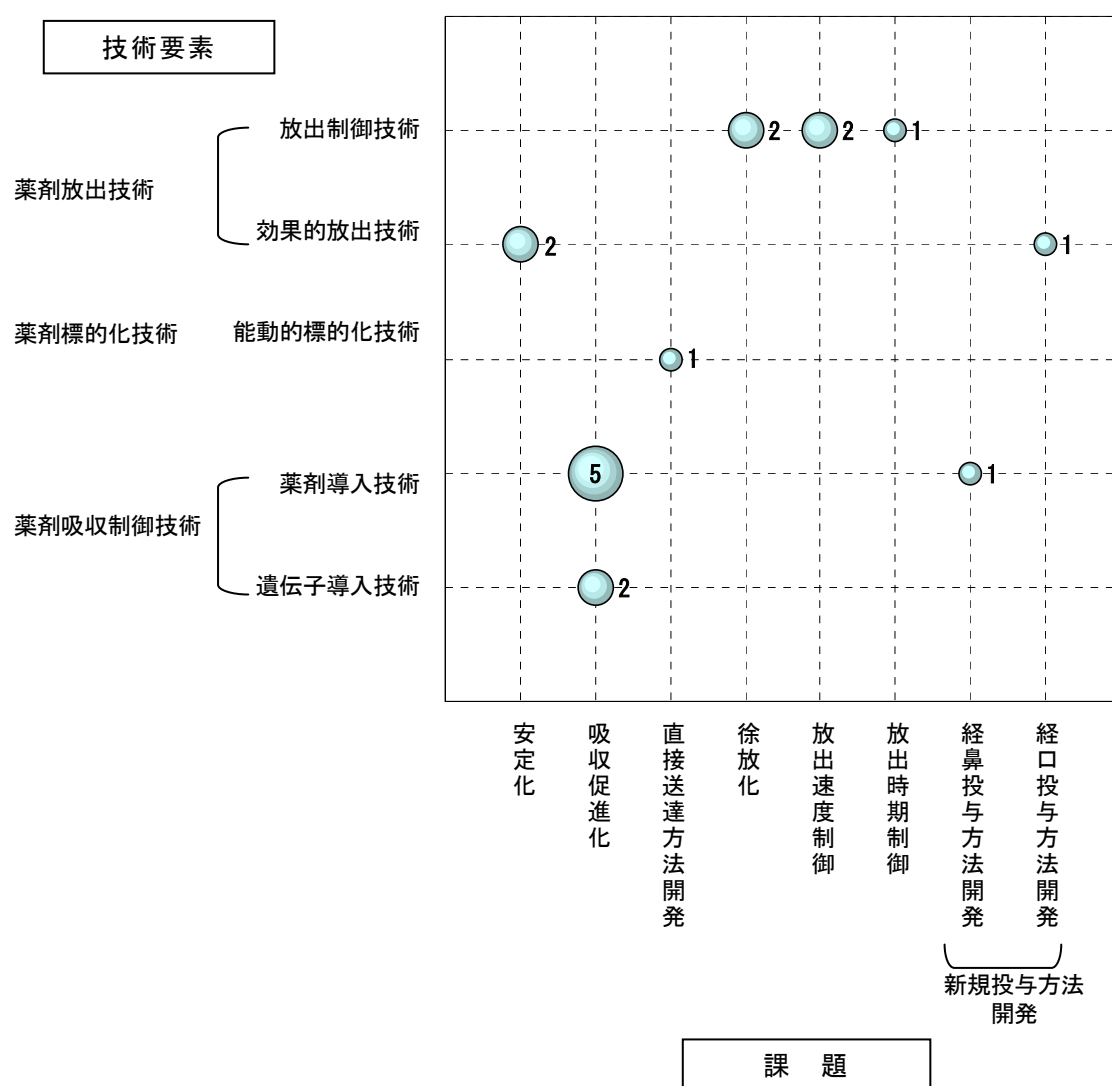


## 2.12.4 技術開発課題対応特許の概要

最近11年間（1992年1月～2002年12月）に出願されたウエスト ファーマシューティカル サービスズのドラッグデリバリーシステムに関する特許・実用新案の件数は17件であり、表2.12.4にその内容を示している。

図2.12.4-1にウエスト ファーマシューティカル サービスズの技術要素と課題の分布を示す。「薬剤吸収制御技術」、「薬剤標的化技術」、「薬剤放出技術」の3つの分野に出願している。薬剤導入技術が6件と最も多く、放出制御技術が5件となっている。薬剤導入技術の課題は「吸収促進化」である。放出制御技術の課題は「徐放化」と「放出速度制御」である。

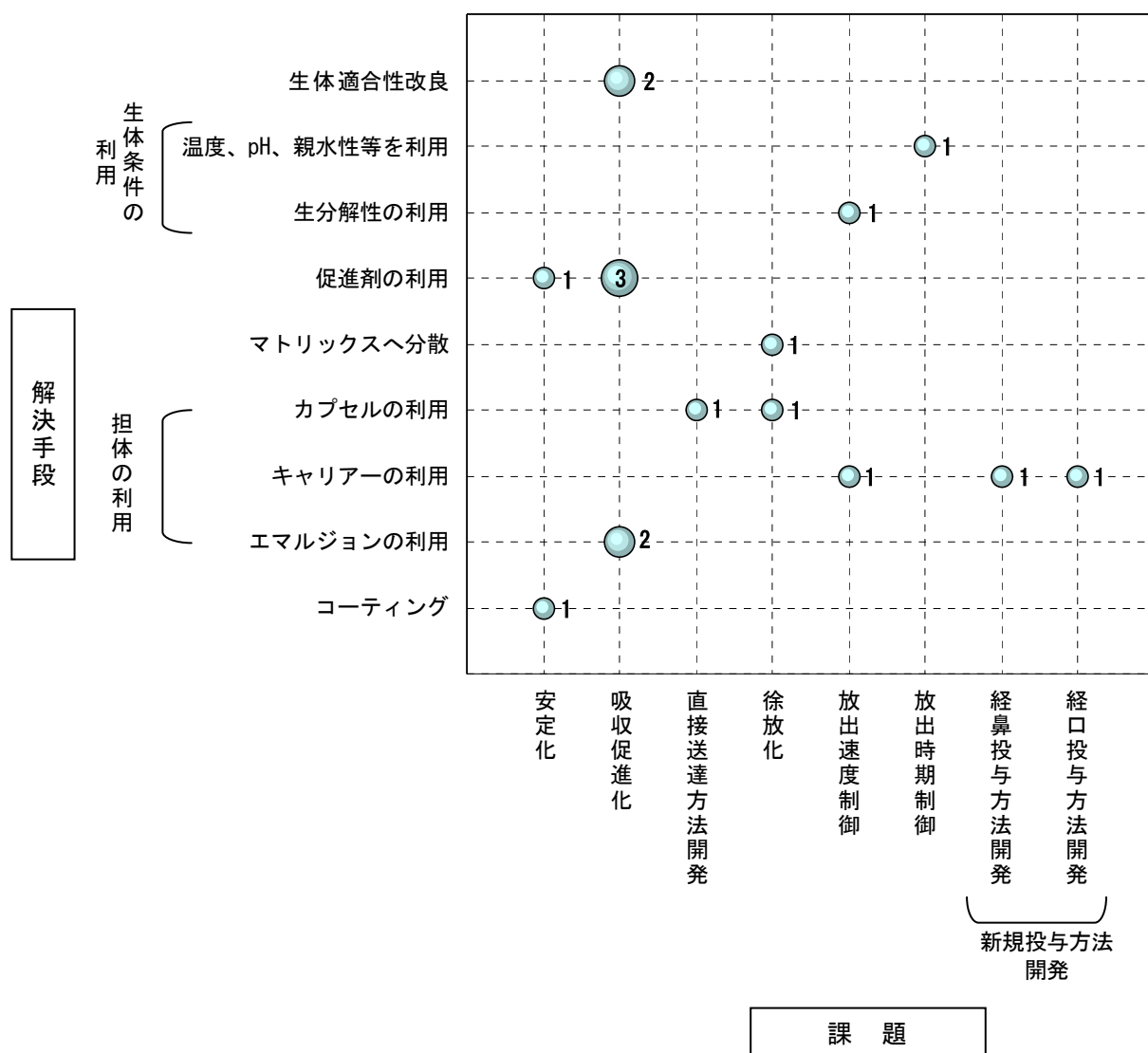
図2.12.4-1 ウエスト ファーマシューティカル サービスズの技術要素と課題の分布



1992年1月～2002年12月の出願

ウエスト ファーマシューティカル サービスズの課題と解決手段の分布を図2. 12. 4-2に示す。課題としては「吸収促進化」や「放出速度制御」を目指したものが多い。吸収促進化に対しては、「促進剤の利用」、「エマルジョンの利用」、「生体適合性改良」により解決している。放出速度制御に対しては、「生分解性の利用」や「エマルジョンの利用」によって解決している。

図2. 12. 4-2 ウエスト ファーマシューティカル サービスズの課題と解決手段の分布



1992年1月～2002年12月の出願

表2. 12. 4 ウェスト ファーマシューティカル サービスズの技術要素別課題対応特許 (1/2)

| 技術要素<br>I II | 課題<br>I II | 解決手段 I<br>解決手段 II        | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数] | 発明の名称<br>概要                                                   |
|--------------|------------|--------------------------|---------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------|
| 薬剤放出技術       | 徐放化        | マトリックスへ分散                | 特表平10-506376<br>94. 07. 26<br>A61K38/00           | 薬剤移送用組成物および薬剤投与方法                                             |
|              |            | 担体の利用<br>カプセルの利用         | 特表2001-525848<br>97. 05. 24<br>A61K9/52           | 改良ドラッグデリバリーのための胃保持型 (gastroretentive) 制御放出微小球体 (Microspheres) |
|              | 放出速度制御     | 生体条件の利用<br>生分解性利用        | 特表平11-508912<br>95. 07. 13<br>A61K9/16            | 薬剤送達のためのポリマー性のラメラ基質粒子                                         |
|              |            | 担体の利用<br>キャリアーの利用        | 特表2001-515862<br>97. 09. 09<br>A61K9/16           | 制御放出微小球体デリバリーシステム                                             |
|              | 放出時期制御     | 生体条件の利用<br>温度、pH、親水性等の利用 | 特表2002-501016<br>98. 01. 22<br>A61K9/28           | 新しい投薬形態                                                       |
|              | 安定化        | 促進剤の利用                   | 特表平11-509545<br>(取下げ)<br>95. 07. 20<br>A61K9/107  | ビタミンEを含む脂質ビヒクル薬剤送達組成物                                         |
|              |            | 担体の利用<br>コーティング          | 特表2003-517440<br>98. 08. 27<br>A61K9/107          | 微小粒子組成物                                                       |
|              | 新規投与方法開発   | 担体の利用<br>キャリアーの利用        | 特表2002-538112<br>99. 03. 02<br>A61K9/46           | 経口ドラッグデリバリーシステム                                               |
| 薬剤標的化技術      | 直接的な送達方法開発 | 担体の利用<br>カプセルの利用         | 特表2000-510100<br>96. 03. 23<br>A61K9/50           | 医薬物質の肺送達のためのポリサッカライド微小球                                       |
| 薬剤吸収制御技術     | 吸収促進化      | 促進剤の利用                   | 特表平10-508004<br>94. 08. 20<br>A61K47/36           | 限定されたZ電位を有するキトサンまたはその誘導体を含む薬剤移送組成物                            |
|              |            | 促進剤の利用                   | 特表平11-510506<br>95. 08. 08<br>A61K9/00            | 結腸からの極性薬剤の摂取を増強するための組成物                                       |
|              |            | 促進剤の利用                   | 特表2001-523728<br>(取下げ)<br>97. 11. 25<br>A61K38/46 | 親油性トロンビン阻害因子を有する粘膜デリバリーシステム                                   |

表2. 12. 4 ウエスト ファーマシューティカル サービスズの技術要素別課題対応特許（2/2）

| 技術要素<br>I II        | 課題<br>I II | 解決手段 I<br>解決手段 II  | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数] | 発明の名称<br>概要              |
|---------------------|------------|--------------------|---------------------------------------------------|--------------------------|
| 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 吸収促進化      | 担体の利用<br>エマルジョンの利用 | 特表平08-501534<br>92. 07. 28<br>A61K9/51            | リンパの搬送組成物                |
|                     |            |                    | 特表2001-526221<br>97. 12. 19<br>A61K31/352         | カンナビノイドを有する組成物           |
|                     | 新規投与方法開発   | 担体の利用<br>キャリアーの利用  | 特表2001-524509<br>97. 12. 02<br>A61K 4748          | 鼻孔投与用組成物                 |
| 薬剤吸収制御技術<br>遺伝子導入技術 | 吸収促進化      | 生体適合性改良            | 特表2000-503645<br>(取下げ)<br>96. 01. 06<br>A61K 3170 | ポリマー                     |
|                     |            |                    | 特表2002-538174<br>99. 03. 02<br>A61K 317088        | ポリヌクレオチドデリバリーのためのポリマー組成物 |

## 2.13 久光製薬

### 2.13.1 企業の概要

|       |                                 |
|-------|---------------------------------|
| 商号    | 久光製薬 株式会社                       |
| 本社所在地 | 〒841-8686 佐賀県鳥栖市市田代大官町408番地     |
| 設立年   | 1944年（昭和19年）                    |
| 資本金   | 84億73百万円（2004年2月末）              |
| 従業員数  | 1,048名（2004年2月末）（連結：1,432名）     |
| 事業内容  | 一般用医薬品（外用消炎鎮痛剤等）および医療用医薬品の製造・販売 |

久光製薬は、鎮痛消炎貼付剤を中心とした医薬品を中心として、外用剤のリーディングカンパニーとして製造・販売を行っている。

（出典：久光製薬のホームページ <http://www.hisamitsu.co.jp/>）

### 2.13.2 製品例

皮膚を通して全身的に薬物を投与する経皮吸収治療システム（TTS：Transdermal Therapeutic System）は、持続的に皮膚から吸収させることにより適切な血中濃度を長時間にわたり維持することができる、肝臓での初回通過効果を回避できる、消化管への副作用が低減できる、小児や高齢者など嚥下困難な患者へも投与可能である、副作用が発現した場合にも剥離により簡単に投与中断ができる、などの数多くのメリットを有している。久光製薬は、TTS製剤の研究開発に力を入れている。

久光製薬のTTS製剤としては、外用鎮痛・消炎貼付薬、経皮鎮痛消炎外用薬、美容液を浸透させるスキンケア商品がある。（出典：久光製薬のホームページ <http://www.hisamitsu.co.jp/>）

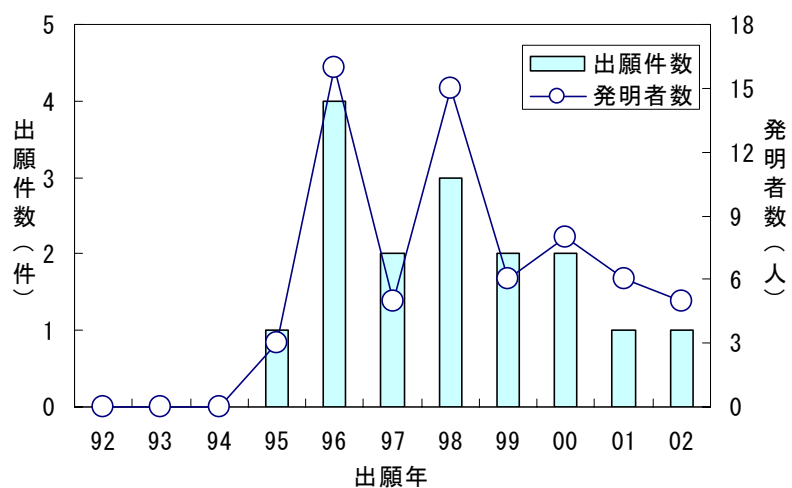
### 2.13.3 技術開発拠点と研究者

特許明細書に記載されている久光製薬の発明者の住所から調査した主な技術開発拠点は、次のとおりであり、茨城県つくば市の研究所から出願されている。その他、共同研究者と推定される住所がある。

茨城県 つくば市観音台1-25-11 久光製薬株式会社筑波研究所  
東京都 文京区、保谷市、  
神奈川県 横浜市、  
埼玉県 坂戸市、川越市  
熊本県 熊本市

久光製薬の出願件数・発明者数の推移を図2.13.3に示す。1995年から出願件数、発明者数が増加し、96年には年間4件の出願があった。その後は年に1、2件の出願件数で推移している。

図2.13.3 久光製薬の出願件数・発明者数の年次推移

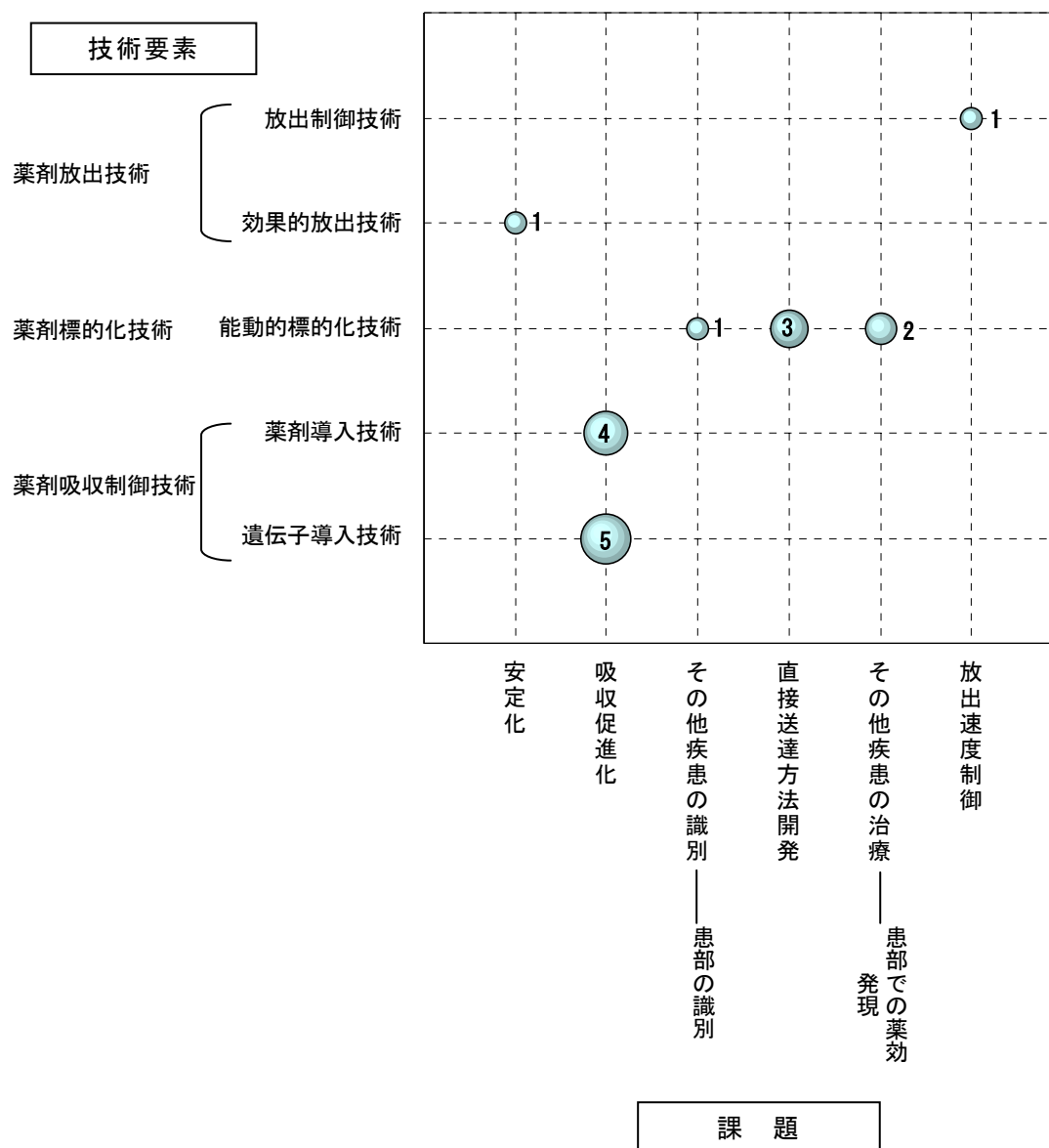


## 2.13.4 技術開発課題対応特許の概要

最近11年間（1992年1月～2002年12月）に出願された久光製薬のドラッグデリバリーシステムに関する特許・実用新案の件数は17件であり、表2.13.4にその内容を示している。

図2.13.4-1に久光製薬の技術要素と課題の分布を示す。「薬剤吸収制御技術」、「薬剤標的化技術」、「薬剤放出技術」の3つの分野に出願している。薬剤導入技術、遺伝子導入技術については「吸収促進化」が課題である。能動的標的化技術に関しては「直接送達方法開発」が主な課題である。

図2.13.4-1 久光製薬の技術要素と課題の分布

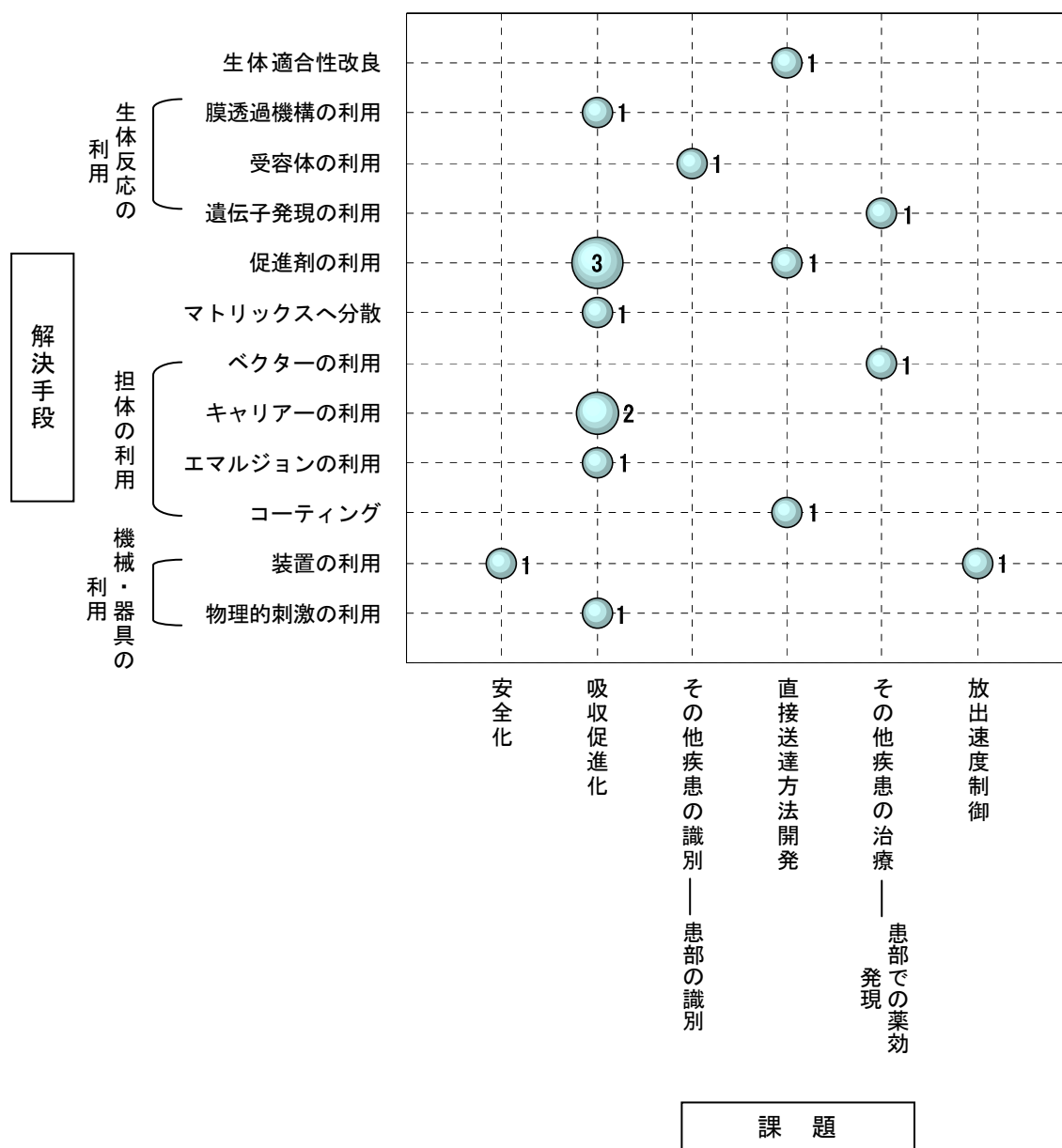


1992年1月～2002年12月の出願



久光製薬の課題と解決手段の分布を図2.13.4-2に示す。課題としては「吸収促進化」が多い。吸収促進化に対しては、「促進剤の利用」や「キャリアーの利用」などが解決手段として用いられているほか、イオントフォーシスといった「物理的刺激の利用」などにより解決している。直接送達方法開発も課題であり、「生体適合性改良」や「促進剤の利用」、「コーティング」などによって解決している。

図2.13.4-2 久光製薬の課題と解決手段の分布



1992年1月～2002年12月の出願

表2.13.4 久光製薬の技術要素別課題対応特許 (1/2)

| 技術要素<br>I II        | 課題<br>I II            | 解決手段 I<br>解決手段 II   | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]   | 発明の名称<br>概要                                   |
|---------------------|-----------------------|---------------------|-----------------------------------------------------|-----------------------------------------------|
| 薬剤放出技術              | 放出速度制御                | 機械・器具の利用<br>装置の利用   | 特開平11-019226<br>97.06.27<br>A61N1/30                | 経皮または経粘膜薬物送達用デバイス                             |
|                     | 安定化                   |                     | 特開平09-201420<br>96.01.30<br>A61N1/30                | 用時活性型イオントフォレーシス用デバイス                          |
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | その他の疾患の識別             | 生体反応の利用<br>受容体利用    | W096/28188<br>(却下)<br>95.03.16<br>A61K48/00         | 標的指向性物質送達方法                                   |
|                     | 直接送達方法開発              | 生体適合性改良             | 特開2003-201256<br>01.12.28<br>A61K47/30              | 大腸送達性経口医薬製剤、大腸癌治療用経口医薬製剤および大腸炎治療用経口医薬製剤       |
|                     |                       | 促進剤の利用              | W001/064253<br>00.03.02<br>A61P5/38                 | P-糖蛋白修飾剤を配合する大腸送達用薬剤組成物                       |
|                     |                       | 担体の利用<br>コーティング     | 特開平11-335269<br>98.05.19<br>A61K9/30                | 遺伝子関連医薬の経口投与固形製剤                              |
|                     | その他の疾患の治療<br>患部での薬効発現 | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利用 | 特表2002-519439<br>98.07.07<br>C07H21/04              | I L-15に標的されたアンチセンスオリゴヌクレオチド                   |
|                     |                       | 担体の利用<br>ベクターの利用    | W096/29096<br>00.01.21<br>A61K48/00                 | 遺伝子治療薬剤                                       |
| 薬剤吸収制御技術            | 吸収促進化                 | 促進剤の利用              | 特開平10-045630<br>96.08.01<br>A61K47/40<br>化学及血清療法研究所 | 新規なグラフト共重合体、それを用いた薬剤、及びそれを用いて薬物を特定細胞に取り込ませる方法 |

表2.13.4 久光製薬の技術要素別課題対応特許 (2/2)

| 技術要素<br>I II        | 課題<br>I II | 解決手段 I<br>解決手段 II    | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数] | 発明の名称<br>概要                  |
|---------------------|------------|----------------------|---------------------------------------------------|------------------------------|
| 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 吸収促進化      | 促進剤の利用               | 特開2000-247911<br>99.02.26<br>A61K47/22            | 大腸用吸収促進剤                     |
|                     |            | マトリックスへ分散            | 特開2000-219623<br>98.11.26<br>A61K9/70             | イオントフォーシス用粘着ゲル組成物及びその装置      |
|                     |            | 機械・器具の利用<br>物理的刺激の利用 | 特開2003-210591<br>02.01.24<br>A61N1/30             | エレクトロポレーション用経皮経粘膜適用製剤        |
| 薬剤吸収制御技術<br>遺伝子導入技術 | 吸収促進化      | 生体反応の利用<br>膜透過機構の利用  | 特開平10-028583<br>96.07.16<br>C12N15/09             | 核酸運搬体                        |
|                     |            | 促進剤の利用               | 特開2001-120268<br>99.10.20<br>C12N15/09            | ポリペプチドおよび組換えウイルスベクターを含む核酸運搬体 |
|                     |            | 担体の利用<br>キャリアーの利用    | 特開平11-021255<br>97.07.02<br>A61K48/00             | 機能性分子輸送体及びその製造方法             |
|                     |            |                      | 特開2000-210079<br>98.11.18<br>C12N15/09            | 核酸運搬体及び遺伝子治療用薬物              |
|                     |            | 担体の利用<br>エマルジョンの利用   | 特開平09-255561<br>96.03.26<br>A61K91/07             | エレクトロポレーション用マイクロエマルション製剤     |

## 2.14 メルク（米国）

### 2.14.1 企業の概要

|       |                                                             |
|-------|-------------------------------------------------------------|
| 商号    | Merck & Co., Inc.                                           |
| 本社所在地 | One Merck Drive, Whitehouse Station, NJ 08889-0100 U. S. A. |
| 設立年   | 1891年                                                       |
| 資本金   | 29百万米ドル（2003年12月末）                                          |
| 従業員数  | 63,200名（連結：2003年12月末）                                       |
| 事業内容  | 医薬品、動物薬の開発・製造・販売                                            |

メルク（米国）は、総合医薬品メーカーであり、世界150カ国で製品を販売している。1986年に、カイロン（Chiron Corporation）と世界初の遺伝子組換えワクチン（B型肝炎用ワクチン）を開発し、発売するなど、バイオ医薬もいち早く手掛けている。

（出典：メルクのホームページ <http://www.merck.com/>）

### 2.14.2 製品例

ドラッグデリバリーシステムに関する製品はない。

### 2.14.3 技術開発拠点と研究者

特許明細書に記載されているメルクの発明者の住所から調査した主な技術開発拠点は、次のとおりであり、メルクの出願は本社の住所となっていて、主として米国から出願されている。その他、グループ企業であるカナダ、共同研究者であるイギリス ロンドンから出願されている。

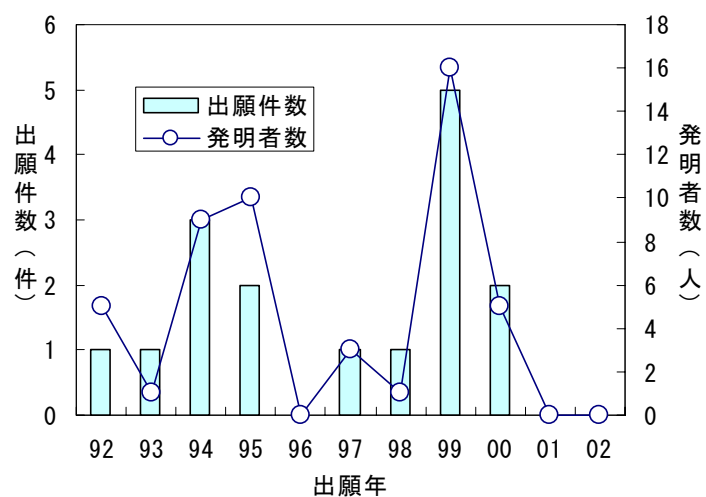
米国 ニュージャージー州

カナダ ケベック州

イギリス ロンドン

メルクの出願件数・発明者数の推移を図2.14.3に示す。1996～98年に出願件数、発明者数が減少したが、その後00年にかけて、出願件数、発明者数が年間4件前後に回復している。01年と02年の出願が見られないのは、PCT出願のためにまだ公開されていないためと考えられる。

図2.14.3 メルクの出願件数・発明者数の年次推移

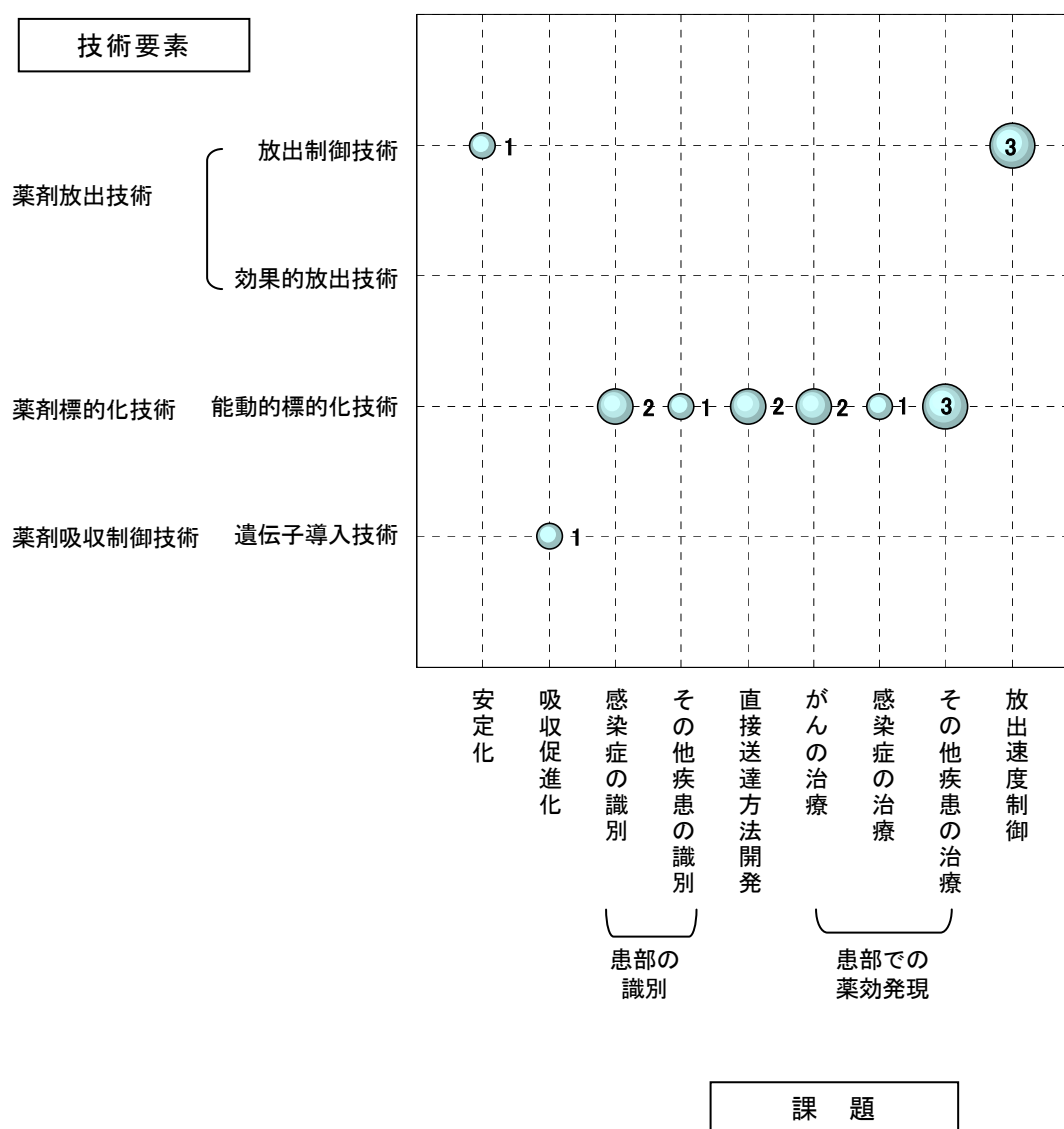


## 2.14.4 技術開発課題対応特許の概要

最近11年間（1992年1月～2002年12月）に出願されたメルクのドラッグデリバリーシステムに関する特許・実用新案の件数は16件であり、表2.14.4にその内容を示している。

図2.14.4-1にメルクの技術要素と課題の分布を示す。「薬剤標的化技術」と「薬剤吸収制御技術」、「薬剤放出技術」に出願している。薬剤標的化技術では、「能動的標的化技術」に関する出願が多く、がんを始めとした疾患に対する患部の識別と治療が最も大きな課題となっている。薬剤放出技術では、「放出制御技術」について「放出速度制御」が課題となっている。薬剤吸収制御技術では、「遺伝子導入技術」における「吸収促進化」が課題である。

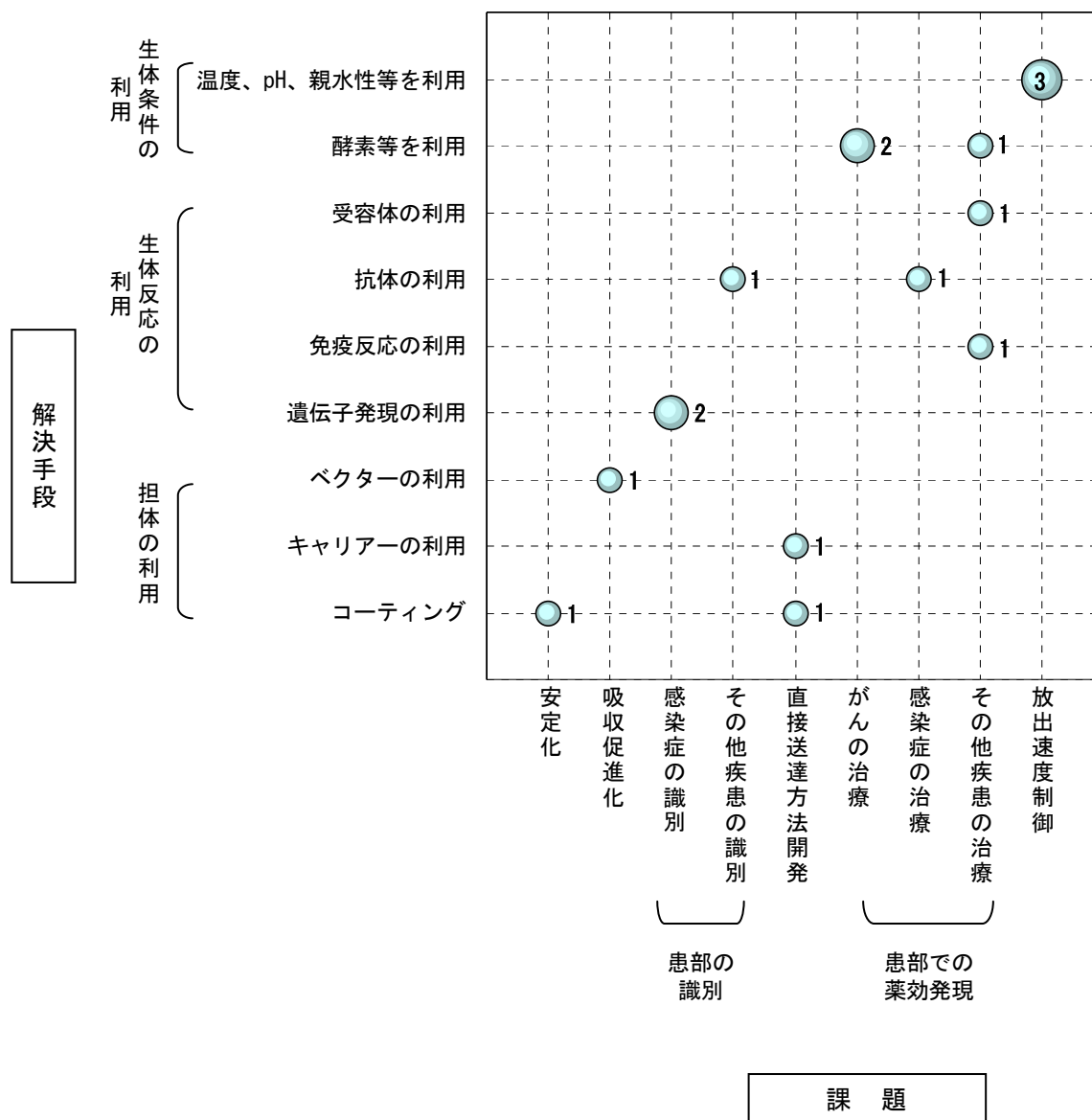
図2.14.4-1 メルクの技術要素と課題の分布



1992年1月～2002年12月の出願

メルクの課題と解決手段の分布を図2.14.4-2に示す。「放出速度制御」の課題に対しては、「温度、pH、親水性等を利用」が解決手段として用いられている。「疾患の識別」の課題に対しては、「遺伝子発現の利用」や「抗体の利用」といった「生体反応の利用」が解決手段となっている。

図2.14.4-2 メルクの課題と解決手段の分布



1992年1月～2002年12月の出願

表2. 14. 4 メルクの技術要素別課題対応特許 (1/2)

| 技術要素<br>I II        | 課題<br>I II         | 解決手段 I<br>解決手段 II        | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]                        | 発明の名称<br>概要                                                               |
|---------------------|--------------------|--------------------------|--------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------|
| 薬剤放出制御技術            | 放出速度制御             | 生体条件の利用<br>温度、pH、親水性等の利用 | 特表平11-509829<br>94. 12. 22<br>A61K9/24                                   | 制御放出薬剤懸濁液の送出デバイス                                                          |
|                     |                    |                          | 特表2003-504415<br>99. 07. 20<br>A61K9/22                                  | 持続放出性薬物分散剤輸送装置                                                            |
|                     |                    |                          | 特表2003-513033<br>99. 10. 29<br>A61K9/00                                  | 浸透圧制御放出薬剤送達装置                                                             |
| 薬剤放出技術              | 安定化                | 担体の利用<br>コーティング          | 特表2002-534455<br>99. 01. 12<br>A61K9/107<br>ロンドン大学スク<br>ール オブ ファ<br>ーマシー | 疎水性物質及び水感受性物質のための球状<br>化自己乳化系                                             |
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | 感染症の識別<br>患部の識別    | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利用      | 特表平10-506014<br>94. 09. 22<br>C12N15/09                                  | ヒトパピローマウイルス 6 a 型をコードす<br>るDNA                                            |
|                     |                    |                          | 特表平11-502704<br>95. 03. 22<br>C12N15/09                                  | ヒトパピローマウイルス 1 8 型をコードす<br>るDNA                                            |
|                     | その他の疾患の識別<br>患部の識別 | 生体反応の利用<br>抗体の利用         | 特許3481948<br>95. 10. 06<br>C07K7/06                                      | 新規ペプチド<br>遊離前立腺特異的抗原 (PSA) によって認<br>識され、蛋白分解的開裂を受けるアミノ酸配<br>列を有するオリゴペプチド。 |
|                     |                    |                          | 特表2001-525337<br>97. 12. 02<br>A61K47/48                                 | 前立腺癌の治療に有効なコンジュゲート                                                        |
|                     | がんの治療<br>患部での薬効発現  | 生体条件の利用<br>酵素等の利用        | 特表2002-505298<br>98. 03. 05<br>A61K45/00                                 | 前立腺癌治療に有用な結合体                                                             |
|                     |                    |                          | 特開平06-217791<br>92. 04. 01<br>C12P21/08                                  | H I V 感染の予防及び治療のための組換え<br>ヒトH I V 中和モノクローナル抗体                             |



表2.14.4 メルクの技術要素別課題対応特許 (2/2)

| 技術要素<br>I II        | 課題<br>I II            | 解決手段 I<br>解決手段 II  | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数] | 発明の名称<br>概要                        |
|---------------------|-----------------------|--------------------|---------------------------------------------------|------------------------------------|
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | その他の疾患の治療<br>患部での薬効発現 | 生体条件の利用<br>酵素等の利用  | 特表平 10-502619<br>94.06.28<br>C07K14/47            | 新規ペプチド                             |
|                     |                       | 生体反応の利用<br>受容体利用   | 特表 2004-504349<br>00.07.26<br>C07D21/374          | $\alpha$ v インテグリン受容体拮抗薬            |
|                     |                       | 生体反応の利用<br>免疫反応の利用 | 特表 2004-509846<br>00.06.02<br>C07K14/18           | 肝炎C型ウイルスコンジュゲート                    |
|                     | 直接送達方法開発              | 担体の利用<br>キャリアーの利用  | 特開 2000-256191<br>99.03.08<br>A61K31/194          | HMG-CoAレダクターゼ阻害剤のジヒドロキシオープン酸およびその塩 |
|                     |                       | 担体の利用<br>コーティング    | 特表平 09-504276<br>93.09.21<br>A61K31/675           | ビスホスホン酸誘導体を含む腸溶被覆経口組成物             |
| 遺伝子導入技術<br>薬剤吸収制御技術 | 吸収促進化                 | 担体の利用<br>ベクターの利用   | 特表 2002-535986<br>99.02.04<br>C12N15/09           | 遺伝子治療用の改良ヘルパーデペンデントベクター系           |

## 2.15 アストラゼネカ（イギリス）

### 2.15.1 企業の概要

|       |                                           |
|-------|-------------------------------------------|
| 商号    | AstraZeneca PLC                           |
| 本社所在地 | 15 Stanhope Gate, London W1K 1LN, England |
| 設立年   | 1999年（Astra ABとZeneca Group PLCが合併して設立）   |
| 資本金   | 423百万米ドル（2003年12月末）                       |
| 従業員数  | 61,900名（連結：2003年12月末）                     |
| 事業内容  | 医療用医薬品の開発・製造・販売                           |

アストラゼネカは、1999年にアストラ（スウェーデン）とゼネカ（イギリス）が合併して誕生した世界最大級の医薬品メーカーである。循環器、消化器、がん、呼吸器、神経系、感染症の分野で幅広く医薬を開発、製造・販売している。

（出典：アストラゼネカのホームページ <http://www.astrazeneca.com/>）

### 2.15.2 製品例

アストラゼネカのドラッグデリバリーシステム製品としては、徐放性の前立腺がん治療薬がある。1回の投与で効果が3ヶ月持続するため、注射の回数を減らすことができ患者の負担を軽減することができる。さらに、遠隔地からの通院患者や仕事が多忙な患者、通院に家族の付き添いが必要な患者などのQOLの改善にも役立っている。

（出典：アストラゼネカのホームページ <http://www.astrazeneca.com/>）

### 2.15.3 技術開発拠点と研究者

特許明細書に記載されているアストラゼネカの発明者の住所から調査した主な技術開発拠点は、次のとおりであり、主としてイギリス、スウェーデンから出願されている。

イギリス チェシャー エスケイ10 4ティージャー，マックレスフィールド，オールダーリー・パーク，ミアサイド，ゼネカ・ファーマシューティカルズ（番地なし）

スウェーデン エス-431 83メルンダール，アストラゼネカ，アール・アンド・ディー・メルンダール

フランス 95022セルジ・セデックス，ボアット・ポスタル127，リュ・デ・ショフル1，“ル・ガリアン”，ゼネカーファルマ・ソシエテ・アノニム

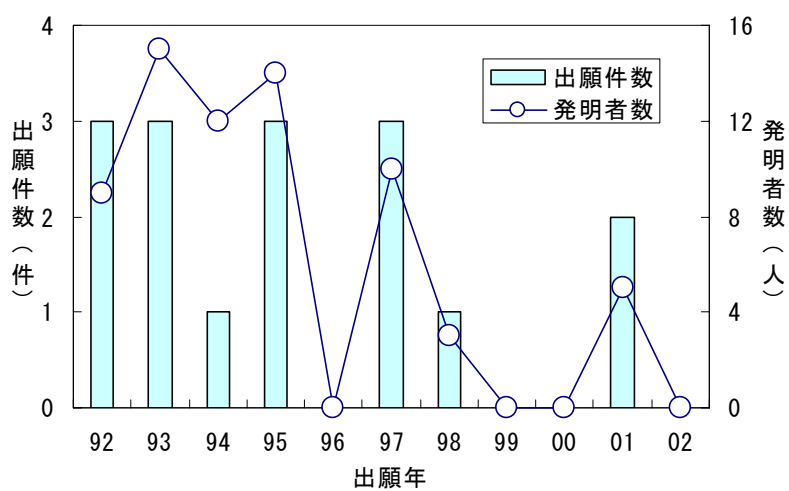
また、共同研究者の住所と考えられるものとして、以下のものがある。

イギリス ロンドン ダブリューシー1イー 6ビーティー，ゴウアー・ストリート，ユニバーシティ・カレッジ・ロンドン，ディパートメント・オブ・バイオケミストリー・アンド・モレキュラー・バイオロジー（番地なし）

イギリス ロンドン ダブリュー6 8アールエフ, セント・ダンスタンズ・ロード, ザ・  
 チャリング・クロス・アンド・ウエストミンスター・メディカル・スクール,  
 ズィ・アドヴァンスト・バイオテクノロジー・センター, ルーム 5エル 09

アストラゼネカの出願件数・発明者数の推移を図2.15.3に示す。1992～95、97年は出願  
 件数が3件であったが、98年は減少した。00年以降の出願件数は少ないが、これはPCT出願  
 による公開の遅れと考えられる。

図2.15.3 アストラゼネカの出願件数・発明者数の年次推移

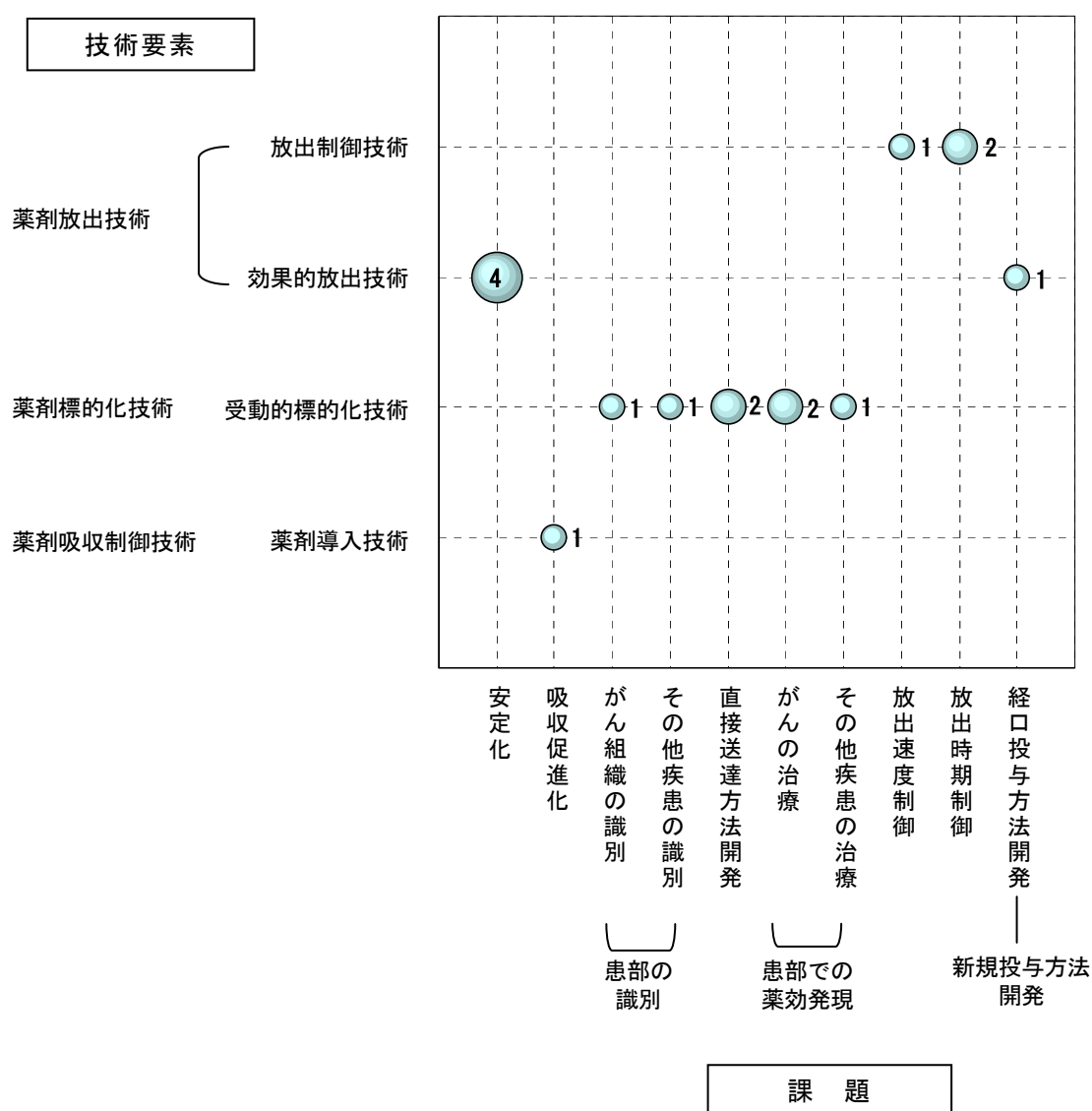


## 2. 15. 4 技術開発課題対応特許の概要

最近11年間（1992年1月～2002年12月）に出願されたアストラゼネカのドラッグデリバリーシステムに関する特許・実用新案の件数は16件であり、表2. 15. 4にその内容を示している。

図2. 15. 4-1にアストラゼネカの技術要素と課題の分布を示す。「薬剤放出技術」、「薬剤標的化技術」、「薬剤吸収制御技術」の3つの分野に出願している。「効果的放出技術」における「安定化」が最大の課題である。受動的標的化技術に関しては、がん組織やその他の疾患の識別とがんやその他の疾患の治療が課題である。放出制御技術の課題は「放出時期制御」と「放出速度制御」である。

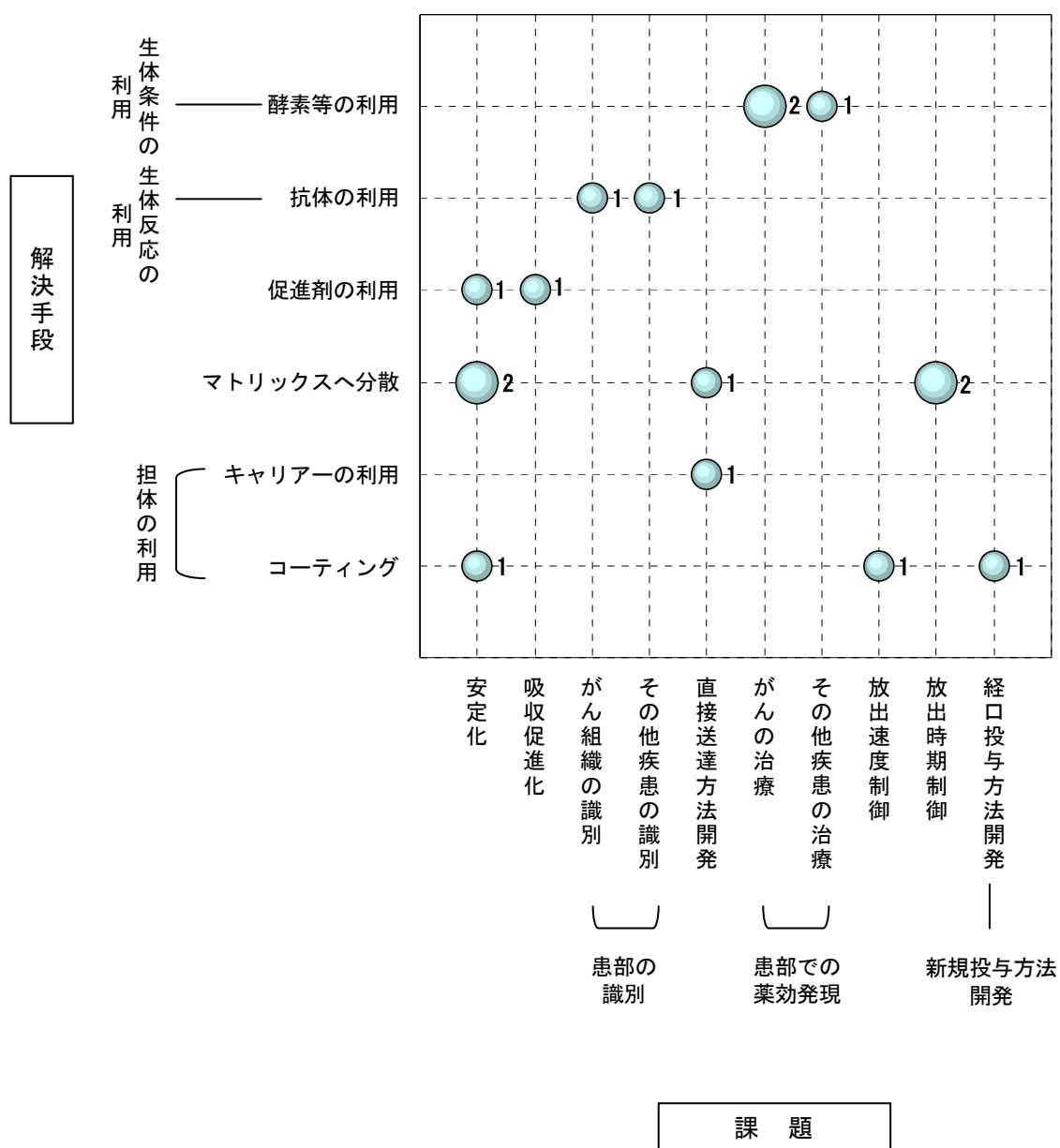
図2. 15. 4-1 アストラゼネカの技術要素と課題の分布



1992年1月～2002年12月の出願

アストラゼネカの課題と解決手段の分布を図2. 15. 4-2に示す。「安定化」の課題に対して、「マトリックスへ分散」や「コーティング」という解決手段が用いられている。「放出時期制御」の課題に対しては、「マトリックスへ分散」が解決手段としても用いられている。「患部での薬効発現」の課題に対しては「酵素等の利用」が解決手段として用いられている。

図2. 15. 4-2 アストラゼネカの課題と解決手段の分布



1992年1月～2002年12月の出願

表2. 15. 4 アストラゼネカの技術要素別課題対応特許 (1/2)

| 技術要素<br>I II        | 課題<br>I II | 解決手段 I<br>解決手段 II | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数] | 発明の名称<br>概要                              |
|---------------------|------------|-------------------|---------------------------------------------------|------------------------------------------|
| 薬剤放出技術              | 放出速度制御     | 担体の利用<br>コーティング   | 特表2004-522798<br>01. 03. 09<br>A61K9/62           | メトプロロールを含有する微粒子を製造する方法                   |
|                     | 放出時期制御     | マトリックスへ分散         | 特表2001-524513<br>97. 11. 28<br>A61K9/16           | 薬剤物質の担体としての多孔性ハイドロキシアパタイト粒子              |
|                     |            |                   | 特表2001-524514<br>97. 11. 28<br>A61K9/16           | 脂肪性、油性または粘性薬剤物質のためのポリエチレングリコールマトリックスペレット |
| 効果的放出技術<br>薬剤放出技術   | 安定化        | 促進剤の利用            | 特表2002-510311<br>97. 06. 27<br>A61K9/127          | トコフェロールにより安定化された吸引用プロリポソーム粉末             |
|                     |            | マトリックスへ分散         | 特表2002-516822<br>98. 04. 14<br>A61K39/00          | ポリマー粒子ワクチンデリバリーシステム                      |
|                     |            |                   | 特表2004-521963<br>01. 10. 15<br>A61K31/277         | 医薬製剤                                     |
|                     |            | 担体の利用<br>コーティング   | 特表平09-511767<br>95. 02. 06<br>A61K45/00           | 新規な経口用の医薬使用形態                            |
|                     | 新規投与方法開発   | 担体の利用<br>コーティング   | 特表平08-512316<br>93. 07. 09<br>A61K31/44           | 新規な医薬処方物                                 |
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | がん組織の識別    | 生体反応の利用<br>抗体の利用  | 特表平09-506507<br>93. 12. 03<br>C12P21/08           | C A 5 5 . 1 抗原指向性結合構造                    |
|                     | その他の疾患の識別  | 生体反応の利用<br>抗体の利用  | 特表平08-502246<br>92. 08. 31<br>C07K16/28           | T細胞抗原レセプターの画定された領域と反応性のモノクローナル抗体         |
|                     | 直接送達方法開発   | マトリックスへ分散         | 特表平07-508735<br>(取下げ)<br>92. 07. 07<br>A61K47/36  | 薬物送達デバイスおよびそのデバイスの製造方法                   |

表2. 15. 4 アストラゼネカの技術要素別課題対応特許（2/2）

| 技術要素<br>I II        | 課題<br>I II            | 解決手段 I<br>解決手段 II | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]                    | 発明の名称<br>概要                                                                                    |
|---------------------|-----------------------|-------------------|----------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | 直接送達方法開発              | 担体の利用<br>キャリアーの利用 | 特許3366640<br>93. 01. 08<br>C07J71/00                                 | 新規な結腸ーまたは回腸ー特異的ステロイド誘導体<br>炎症を起こしている腸粘膜に薬剤を送達するための新規化合物。糖に結合したグルコシル化ステロイドを用いることにより、回腸特異的に送達する。 |
|                     | がんの治療<br>患者での薬効発現     | 生体条件の利用<br>酵素等の利用 | 特表平10-511547<br>94. 12. 23<br>C12N15/09                              | 化合物                                                                                            |
|                     |                       |                   | 特表平11-511970<br>(取下げ)<br>95. 08. 16<br>C12N15/09                     | 化学化合物                                                                                          |
|                     | その他の疾患の治療<br>患者での薬効発現 | 生体条件の利用<br>酵素等の利用 | 特許3541037<br>92. 07. 23<br>C07C27/154<br>キャンサー リサーチ<br>キャンペーン テクノロジー | アミノ酸を結合したナイトロジェンマスタード誘導体及びその製造方法<br>抗体に指向されたプロドラッグを用いることでカルボキシペプチダーゼの基質となる部分が開裂し、高い細胞毒性を生成する。  |
| 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 吸収促進化                 | 促進剤の利用            | 特表平11-509515<br>(取下げ)<br>95. 02. 06<br>A61K31/66                     | 新規な医薬処方                                                                                        |

## 2.16 イミュノメディクス（米国）

### 2.16.1 企業の概要

|       |                                                   |
|-------|---------------------------------------------------|
| 商号    | Immunomedics, Inc.                                |
| 本社所在地 | 300 American Road, Morris Plains, NJ 07950 U.S.A. |
| 設立年   | 1982 年                                            |
| 資本金   | 498 千米ドル（2003 年 12 月末）                            |
| 従業員数  | 119 名（2004 年 8 月末）                                |
| 事業内容  | モノクローナル抗体を基礎とした医薬品の開発・製造・販売                       |

イミュノメディクスは、がんや自己免疫疾患などに用いられるモノクローナル抗体を基礎とした医薬品を開発している。

（出典：イミュノメディクスのホームページ <http://www.immunomedics.com/>）

### 2.16.2 製品例

モノクローナル抗体を用いた診断システム、試薬は販売しており、ドラッグデリバリーシステムの開発を行っているが、製品はない。

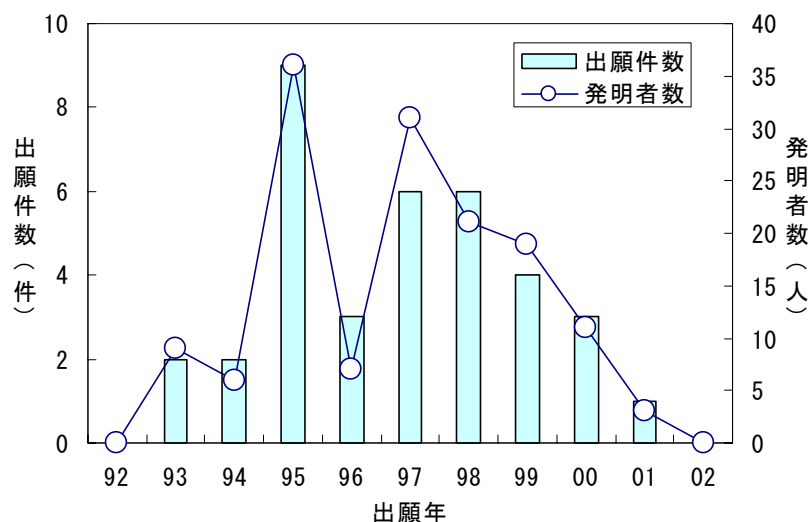
### 2.16.3 技術開発拠点と研究者

特許明細書に記載されているイミュノメディクスの発明者の住所から調査した主な技術開発拠点は、次のとおりであり、主として米国から出願されている。

米国 ニュージャージー州

イミュノメディクスの出願件数・発明者数の推移を図 2.16.3 に示す。1993～95 年にかけて出願件数、発明者数が増加したが、1999 年から減少傾向にある。ただし、00 年以降については PCT 出願のためにまだ公開されていないことも影響している。

図 2.16.3 イミュノメディクスの出願件数・発明者数の年次推移



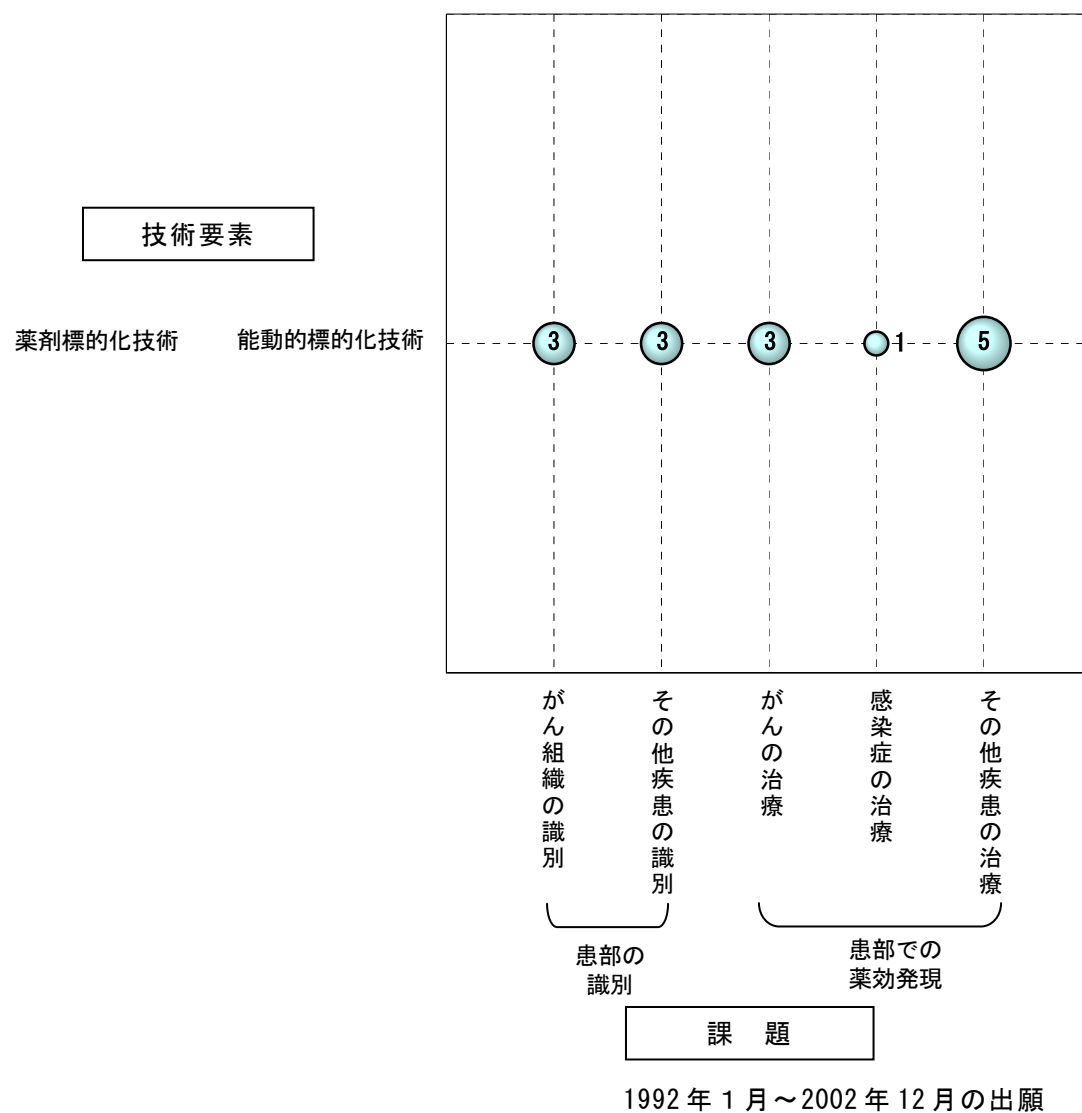


## 2.16.4 技術開発課題対応特許の概要

最近 11 年間（1992 年 1 月～2002 年 12 月）に出願されたイミュノメディックスのドラッグデリバリーシステムに関する特許・実用新案の件数は 15 件であり、表 2.16.4-1 にその内容を示している。

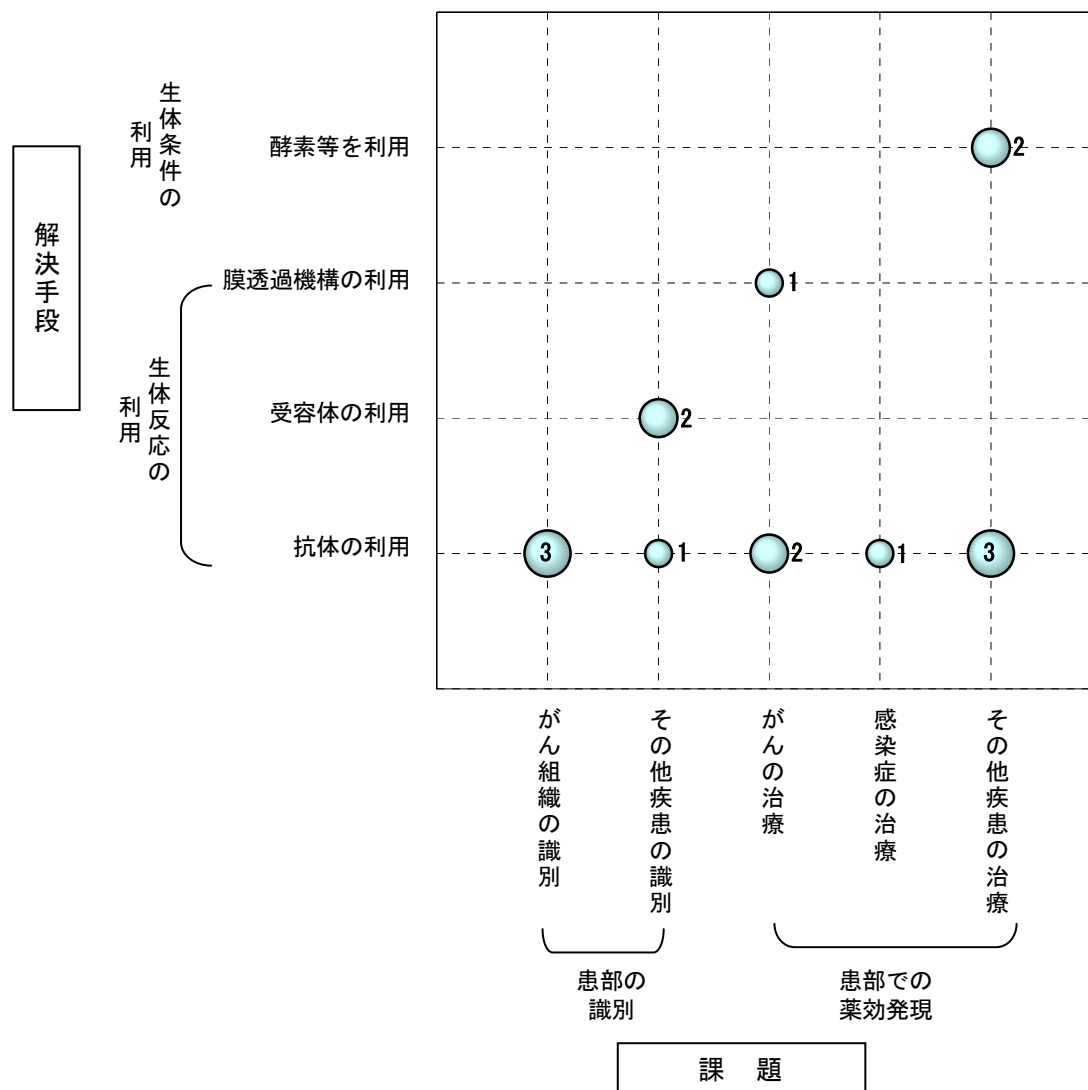
図 2.16.4-1 にイミュノメディックスの技術要素と課題の分布を示す。「薬剤標的化技術」に出願している。がんの識別と治療、その他の疾患の識別と治療が課題である。

図 2.16.4-1 イミュノメディックスの技術要素と課題の分布



イミュノメディクスの課題と解決手段の分布を図 2.16.4-2 に示す。がんや感染症、その他の疾患の識別、治療という課題に対して、「抗体の利用」を解決手段としている。「その他の疾患の治療」には「酵素等を利用」（プロドラッグ化）が解決手段となっている。

図 2.16.4-2 イミュノメディクスの課題と解決手段の分布



1992 年 1 月～2002 年 12 月の出願

表 2.16.4 イミュノメディクスの技術要素別課題対応特許 (1/2)

| 技術要素<br>I II        | 課題<br>I II                        | 解決手段 I<br>解決手段 II   | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]   | 発明の名称<br>概要                                                                                                                                                  |
|---------------------|-----------------------------------|---------------------|------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | がん<br>患部の<br>組織の<br>識別            | 生体反応の利用<br>抗体の利用    | 特許 3053873<br>94. 08. 12<br>C12N15/09                | B細胞リンパ腫細胞および白血病細胞に特異的な免疫結合体およびヒト化抗体<br>ヒト化キメラ L L 2 抗体と細胞障害剤または B細胞リンパ腫および白血病の治療および診断に使用する標識との結合体。                                                           |
|                     |                                   |                     | 特許 3437580<br>94. 10. 05<br>C12N15/09                | C D R を移植された I I I 型抗 C E A ヒト化マウスモノクローナル抗体<br>異種抗体のフレームワーク領域に移植された親マウスクラス III、抗 C E A モノクローナル抗体の相補性決定領域を有するヒト化モノクローナル抗体。親マウスモノクローナル抗体の結合特異性は保持するが、免疫原性が小さい。 |
|                     |                                   |                     | 特表 2004-523205<br>00. 07. 25<br>C12N15/09            | 多価標的結合タンパク質                                                                                                                                                  |
|                     | その<br>他の<br>患部の<br>疾患の<br>識別      | 生体反応の利用<br>受容体利用    | 特表平 08-509226<br>93. 04. 22<br>A61K49/00             | ビオチンやアビジンのポリマー複合体による病変の検出および治療法の改善                                                                                                                           |
|                     |                                   |                     | 特表平 11-507046<br>95. 06. 07<br>A61K47/48             | 診断剤および治療剤の標的部位への改良された送達方法                                                                                                                                    |
|                     |                                   | 生体反応の利用<br>抗体の利用    | 特表平 07-508974<br>92. 04. 07<br>A61K49/00             | 臓器および組織の画像化組成物、細胞防御複合体、およびそれを含むキット                                                                                                                           |
|                     | がんの<br>治療<br>患部での<br>薬効発現         | 生体反応の利用<br>膜透過機構の利用 | 特許 2942356<br>92. 05. 11<br>A61K38/00                | 毒素および薬剤を含む治療用複合体<br>毒素とモノクローナル抗体を結合した癌または伝染性疾患の治療に有用な複合体。                                                                                                    |
|                     |                                   | 生体反応の利用<br>抗体の利用    | 特表 2002-531523<br>98. 12. 04<br>A61K31/69            | プレターゲティング方法を用いるホウ素中性子捕獲療法                                                                                                                                    |
|                     |                                   |                     | 特開 2004-115529<br>97. 05. 02<br>A61K38/43<br>アメリカ合衆国 | 悪性細胞に対する、o n c タンパク質を含む、免疫毒素                                                                                                                                 |
|                     | 感染症の<br>治療<br>患部での<br>薬効発現        | 生体反応の利用<br>抗体の利用    | 特表 2002-544173<br>99. 05. 10<br>A61K39/395           | 抗 C D 2 2 抗体を用いた B 細胞悪性腫瘍の免疫療法                                                                                                                               |
|                     | その他の<br>疾患の<br>治療<br>患部での<br>薬効発現 | 生体条件の利用<br>酵素等の利用   | 特表平 10-506881<br>94. 08. 05<br>C07K16/46             | 多剤耐性表現型を標的とするための多重特異性免疫複合体と抗体組成物                                                                                                                             |
|                     |                                   |                     | 特表 2002-526457<br>98. 09. 18<br>A61K38/46            | 化学療法剤の標的特異的な毒性を増加させるための方法および組成物                                                                                                                              |
|                     |                                   | 生体反応の利用<br>抗体の利用    | 特表平 09-505799<br>92. 08. 21<br>A61K45/00             | ビオチン-アビジン複合体による病変の検出および治療法の改善                                                                                                                                |
|                     |                                   |                     | 特許 3095415<br>93. 12. 08<br>C12N15/09                | 免疫複合体の調製及び使用<br>診断もしくは治療成分と共有結合させた抗体断片を含む免疫複合体。標識組織に狙いを定めて送達する。                                                                                              |

表 2.16.4 イミュノメディクスの技術要素別課題対応特許 (2/2)

| 技術要素<br>I II        | 課題<br>I II            | 解決手段 I<br>解決手段 II | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数] | 発明の名称<br>概要              |
|---------------------|-----------------------|-------------------|----------------------------------------------------|--------------------------|
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | その他の疾患の治療<br>患部での薬効発現 | 生体反応の利用<br>抗体の利用  | 特表平 10-509425<br>94. 10. 05<br>C07K1/13            | 標的放射線療法のためのタンパク質の放射性リン標識 |

## 2.17 エラン（アイルランド）

### 2.17.1 企業の概要

|       |                                                |
|-------|------------------------------------------------|
| 商号    | Elan Corporatin, plc                           |
| 本社所在地 | Lincoln House, Licoln Place, Dublin 2, Ireland |
| 設立年   | 1969年                                          |
| 資本金   | 22百万ドル（2003年12月末）                              |
| 従業員数  | 2,159名（連結：2003年12月末）                           |
| 事業内容  | 医薬品（神経系、自己免疫疾患系、疼痛治療用）の開発・製造・販売                |

エランは、神経科学分野のバイオテクノロジー会社であり、神経系、自己免疫疾患系、疼痛の治療に用いる新薬の開発・製造・販売を行っている。本社はアイルランドにあり、米国およびイギリスにも開発・製造拠点を有している。

（出典：エランのホームページ <http://www.elan.com/>）

### 2.17.2 製品例

ドラッグデリバリーシステムの中でも、水に溶解しにくい薬剤を送達する技術を有している。薬剤をミルで粉碎し、従来の粒子の50分の1の微粒子にする技術であり、この技術を用いた薬剤が、他社から10品販売されている。

その他にも、薬剤放出を遅延させたり、パルス状に放出させたりするドラッグデリバリー技術を有する。

（出典：エランのホームページ <http://www.elan.com/>）

### 2.17.3 技術開発拠点と研究者

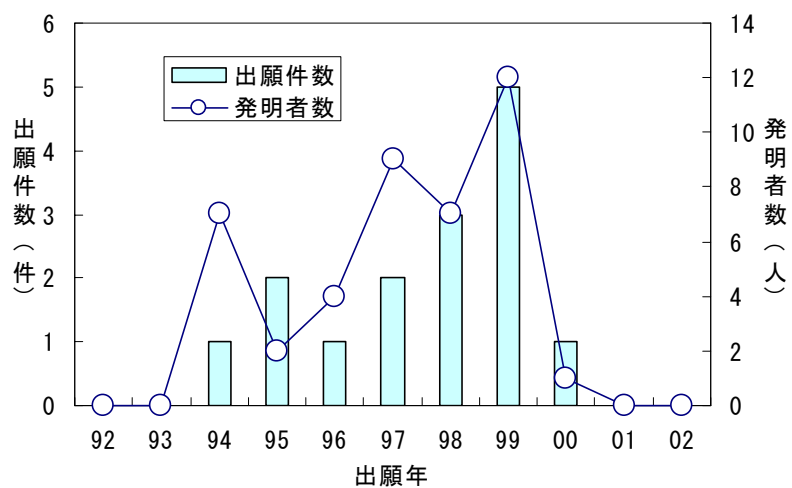
特許明細書に記載されているエランの発明者の住所から調査した主な技術開発拠点は、次のとおりであり、主としてアイルランドから出願されている。

アイルランド ダブリン

米国 ジョージア州

エランの出願件数・発明者数の推移を図2.17.3に示す。1994～99年にかけて出願件数、発明者数が増加している。00年以降の出願件数は少ないが、これはPCT出願による公開の遅れと考えられる。

図2.17.3 エランの出願件数・発明者数の年次推移

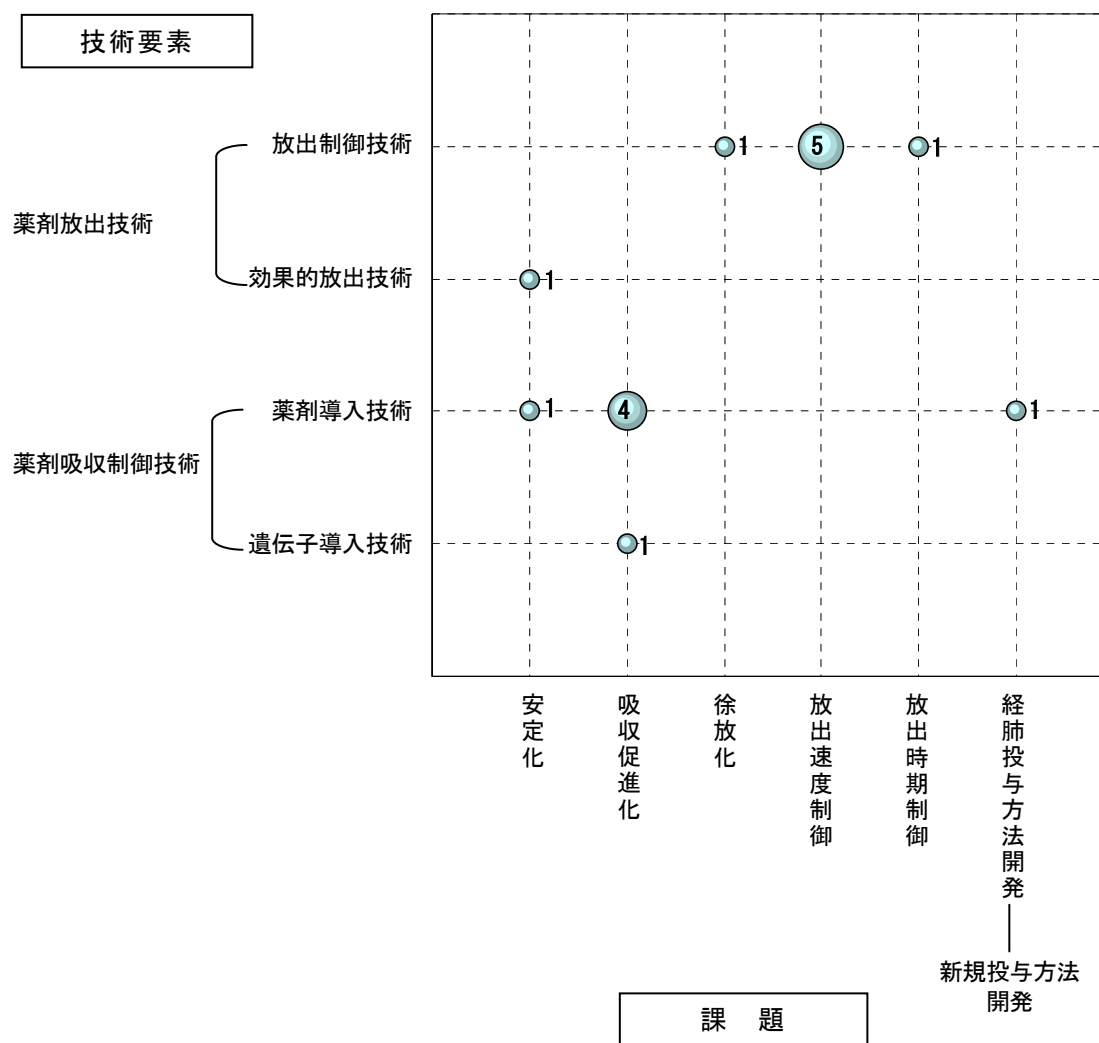


## 2.17.4 技術開発課題対応特許の概要

最近11年間（1992年1月～2002年12月）に公開されたエランのドラッグデリバリーシステムに関する特許・実用新案の件数は15件であり、表2.17.4にその内容を示している。

図2.17.4-1にエランの技術要素と課題の分布を示す。「放出制御技術」と「薬剤導入技術」に出願が集中している。放出制御技術の課題は「放出速度制御」であり、薬剤導入技術では「吸収促進化」が中心の課題となっている。

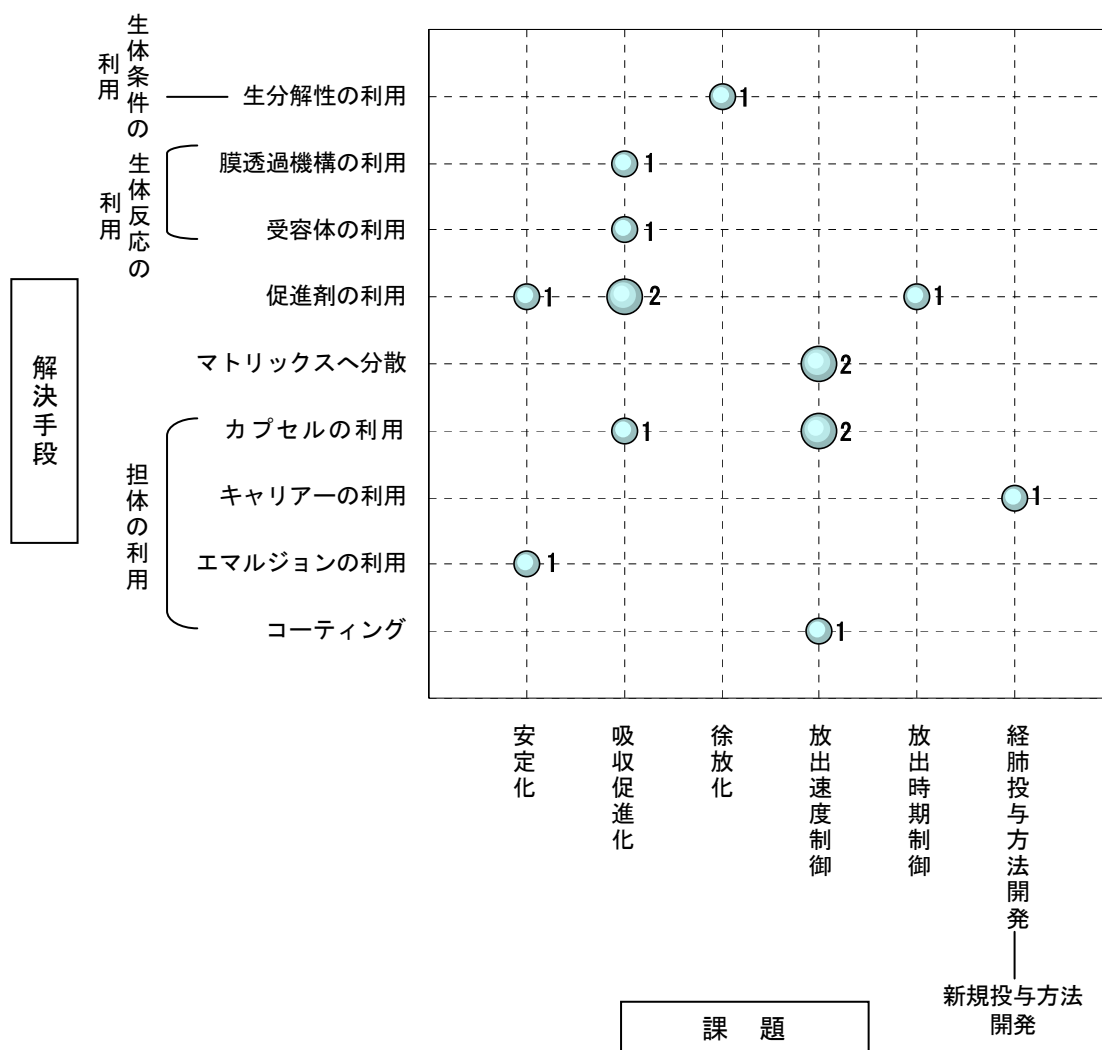
図2.17.4-1 エランの技術要素と課題の分布



1992年1月～2002年12月の出願

エランの課題と解決手段の分布を図2. 17. 4-2に示す。課題としては「吸収促進化」や「放出速度制御」を目指したものが多い。吸収促進化に対しては、「促進剤の利用」や「生体反応の利用」、「カプセルの利用」などにより解決している。放出速度制御に対しては、「マトリックスへ分散」、「カプセルの利用」、「コーティング」などが解決手段である。

図2. 17. 4-2 エランの課題と解決手段の分布



1992年1月～2002年12月の出願



表2. 17. 4 エランの技術要素別課題対応特許 (1/2)

| 技術要素<br>I II       | 課題<br>I II | 解決手段 I<br>解決手段 II   | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]  | 発明の名称<br>概要                                      |
|--------------------|------------|---------------------|----------------------------------------------------|--------------------------------------------------|
| 薬剤放出技術             | 徐放化        | 生体条件の利用<br>生分解性利用   | 特表平11-503147<br>95. 04. 03<br>A61K38/00            | 制御放出性のシクロスポリン含有生物分解性微少球および極小球                    |
|                    | 放出速度制御     | マトリックスへ分散           | 特表2003-507416<br>99. 08. 26<br>A61K9/58            | 医薬製剤                                             |
|                    |            |                     | 特表2001-527087<br>97. 12. 23<br>C07H13/06           | 固体輸送系において有用な炭水化物                                 |
|                    |            | 担体の利用<br>カプセルの利用    | 特表平11-503148<br>95. 04. 04<br>A61K38/28            | インスリンを含有する生分解性ナノ粒子の制御放出                          |
|                    |            | 担体の利用<br>カプセルの利用    | 特表平10-503769<br>94. 08. 04<br>A61K47/30            | 配合されている分子の制御放出用の固形放出系およびその製造方法                   |
|                    |            | 担体の利用<br>コーティング     | 特表2002-528485<br>98. 11. 02<br>A61K9/26            | 多粒子改質放出組成物                                       |
|                    | 放出時期制御     | 促進剤の利用              | 特表2002-537321<br>99. 02. 22<br>A61K9/20            | 促進剤を含む固体経口剤形                                     |
| 効果的放出技術<br>薬剤放出技術  | 安定化        | 担体の利用<br>エマルジョンの利用  | 特表2002-513750<br>98. 05. 07<br>A61K91/07           | 溶媒／助溶剤を含まないマイクロエマルジョン及びエマルジョンプレ濃縮物のドラッグデリバリーシステム |
| 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術 | 安定化        | 促進剤の利用              | 特表2003-504325<br>99. 07. 12<br>A61K47/48           | 乾燥粉体組成物                                          |
|                    | 吸収促進化      | 生体反応の利用<br>受容体利用    | 特表2002-504811<br>97. 05. 15<br>C12N15/09<br>サイトジェン | 胃腸管（G I T）輸送受容体に結合するランダムペプチド、及び関連した方法            |
|                    |            | 生体反応の利用<br>膜透過機構の利用 | 特表平11-512451<br>(取下げ)<br>96. 03. 26<br>A61K47/42   | 薬剤送達のためのトランスサイトosisビヒクルおよびエンハンサー                 |
|                    |            | 促進剤の利用              | 特表2003-511464<br>99. 09. 27<br>A61K47/42           | 膜転位ペプチド薬物送達系                                     |
|                    |            | 担体の利用<br>カプセルの利用    | 特表2002-524411<br>98. 09. 03<br>A61K9/14            | 微粒子                                              |

表2.17.4 エランの技術要素別課題対応特許（2/2）

| 技術要素<br>I II        | 課題<br>I II           | 解決手段 I<br>解決手段 II | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数] | 発明の名称<br>概要   |
|---------------------|----------------------|-------------------|---------------------------------------------------|---------------|
| 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 新規投与方法開発<br>経肺投与方法開発 | 担体の利用<br>キャリアーの利用 | 特表2003-525232<br>00.02.29<br>A61K9/12             | 肺送達のための治療用組成物 |
| 薬剤吸収制御技術<br>遺伝子導入技術 | 吸収促進化                | 促進剤の利用            | 特表2002-544175<br>99.05.05<br>A61K47/12            | 核酸系薬剤の送達促進法   |

## 2.18 マサチューセッツ工科大学（米国）

### 2.18.1 大学の概要

|       |                                                            |
|-------|------------------------------------------------------------|
| 名称    | The Massachusetts Institute of Technology                  |
| 本部所在地 | 77 Massachusetts Avenue, Cambridge, MA 02139-4307 U. S. A. |
| 設立年   | 1861 年                                                     |
| 教職員数  | 9,780 名（内、教員・研究員 2,177 名）（2004 年 10 月）                     |
| 概要    | 自然科学を中心とした研究・教育に関して世界有数の私立大学                               |

マサチューセッツ工科大学（MIT）は、特に工学、医学をはじめとした自然科学系の研究・教育で世界有数の大学であり、これまでに教授や卒業生で 59 人のノーベル賞受賞者を輩出している（2004 年 10 月時点）。企業との連携や共同研究を積極的に行っている。（出典：マサチューセッツ工科大学のホームページ <http://web.mit.edu/>）

### 2.18.2 製品例

マサチューセッツ工科大学は、医学等の研究開発を行い、その成果を民間企業に提供しているが、ドラッグデリバリーシステムに関する製品はない。

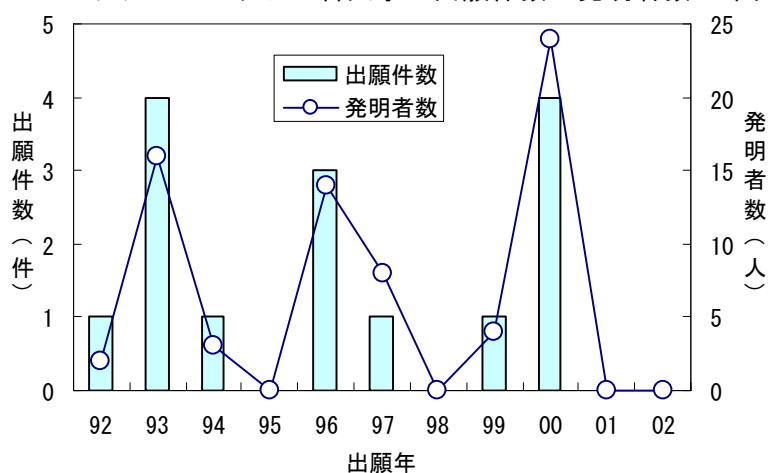
### 2.18.3 技術開発拠点と研究者

特許明細書に記載されているマサチューセッツ工科大学の発明者の住所から調査した主な技術開発拠点は、次のとおりであり、主として米国から出願されている。

米国 マサチューセッツ州  
 イスラエル エフラット  
 イタリア ジェノバ

マサチューセッツ工科大学の出願件数・発明者数の推移を図 2.18.3 に示す。1993 年、96 年、00 年をピークとして出願件数、発明者数が増減している。

図 2.18.3 マサチューセッツ工科大学の出願件数・発明者数の年次推移

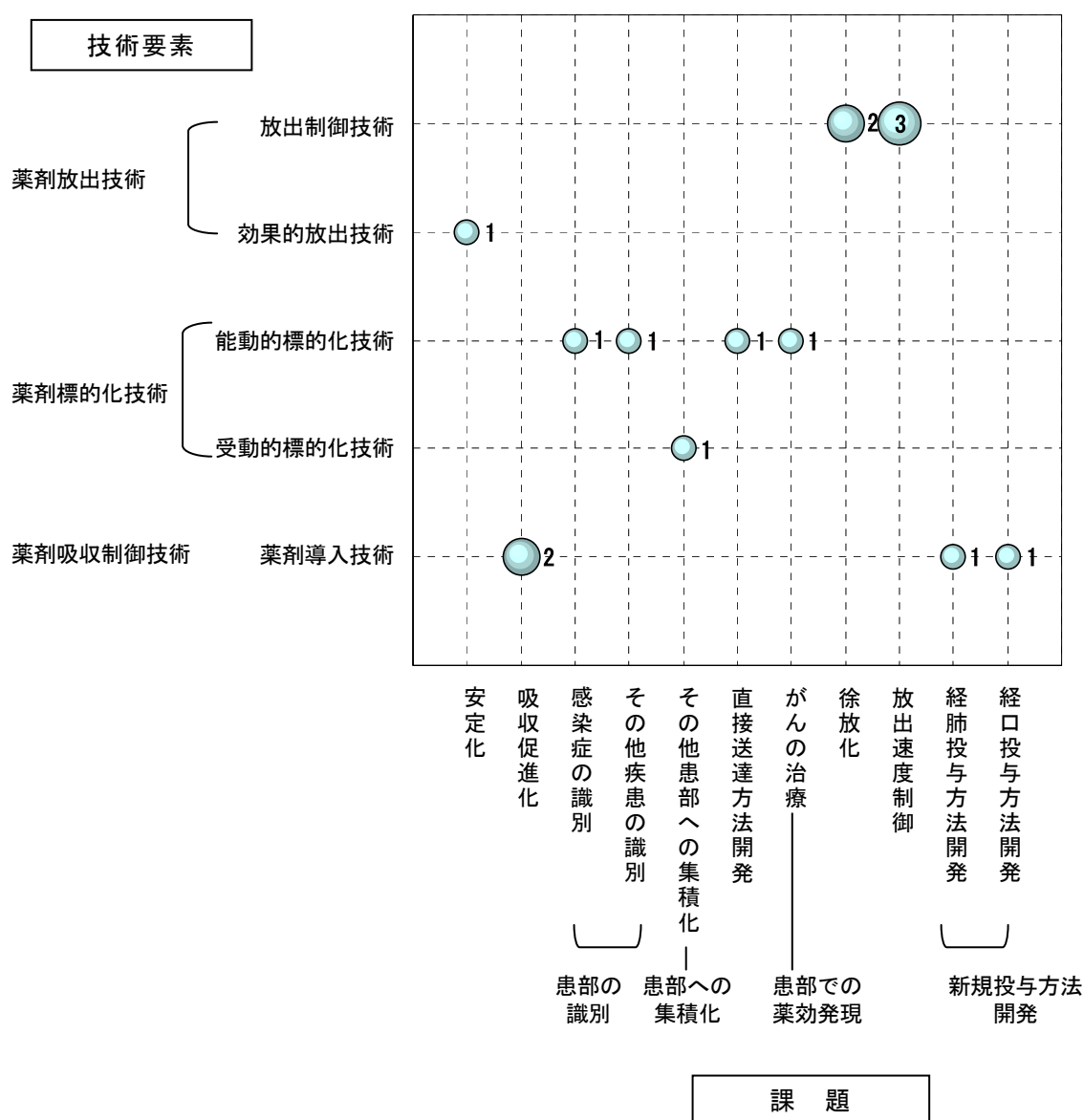


## 2.18.4 技術開発課題対応特許の概要

最近 11 年間（1992 年 1 月～2002 年 12 月）に出願されたマサチューセッツ工科大学のドラッグデリバリーシステムに関する特許・実用新案の件数は 15 件であり、表 2.18.4 にその内容を示している。

図 2.18.4-1 にマサチューセッツ工科大学の技術要素と課題の分布を示す。「薬剤放出技術」、「薬剤標的化技術」と「薬剤吸収制御技術」の 3 つの分野に出願している。放出制御技術の課題は、「放出速度制御」と「徐放化」である。能動的標的化技術の課題は感染症およびその他疾患の識別と治療である。薬剤導入技術の課題は「吸収促進化」と「新規投与方法開発」である。

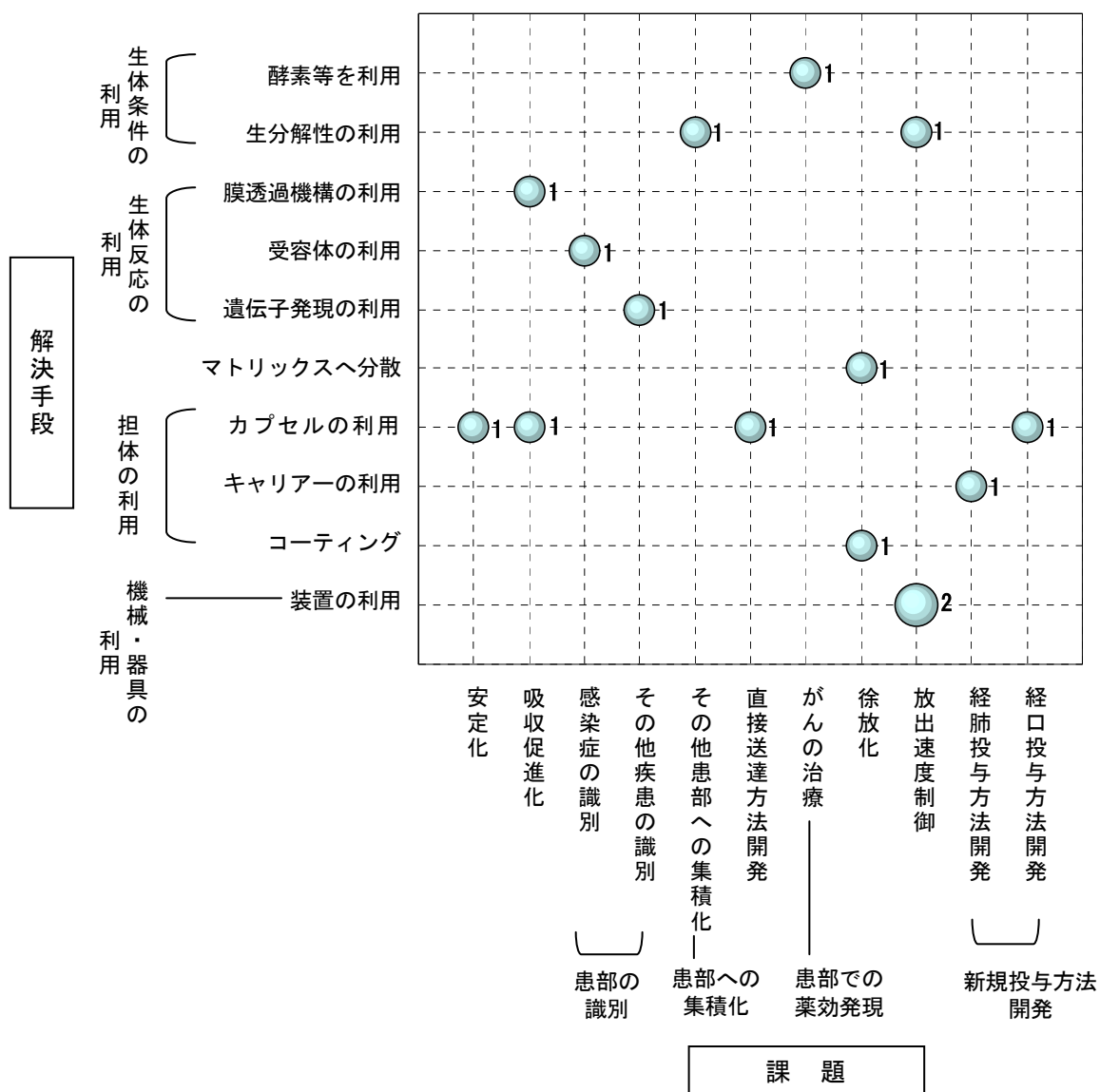
図 2.18.4-1 マサチューセッツ工科大学の技術要素と課題の分布



1992 年 1 月～2002 年 12 月の出願

マサチューセッツ工科大学の課題と解決手段の分布を図 2.18.4-2 に示す。「放出速度制御」に対しては「装置の利用」が解決手段となっている。「カプセルの利用」は「安定化や吸収促進化」、「直接送達方法開発」、「経口投与方法開発」などの課題を解決している。

図 2.18.4-2 マサチューセッツ工科大学の課題と解決手段の分布



1992 年 1 月～2002 年 12 月の出願

表 2.18.4 マサチューセッツ工科大学の技術要素別課題対応特許 (1/2)

| 技術要素 I II           | 課題 I II           | 解決手段 I<br>解決手段 II  | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]                           | 発明の名称<br>概要                                                    |
|---------------------|-------------------|--------------------|------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------|
| 薬剤放出制御技術            | 徐放化               | マトリックスへ分散          | 特表平 09-508892<br>93.11.17<br>A61K38/46<br>チルドレンズ メディカル センター                  | ヘパリナーゼを用いる血管形成の阻害方法                                            |
|                     |                   | 担体の利用<br>コーティング    | 特表平 09-504042<br>93.07.23<br>C08J3/14                                        | 生分解性粒子                                                         |
|                     | 放出速度制御            | 生体条件の利用<br>生分解性利用  | 特表平 10-505587<br>94.08.02<br>A61K31/47<br>ジョーンズ ホプキンス 大学                     | 固形腫瘍を処置するための化学療法薬剤の制御された局所送達                                   |
|                     |                   | 機械・器具の利用<br>装置の利用  | 特表 2000-513725<br>96.07.02<br>A61K9/00                                       | マイクロチップ薬物送達デバイス                                                |
|                     |                   |                    | 特表 2003-516343<br>99.12.10<br>A61K9/00                                       | 分子を送達するマイクロチップ素子およびその製作方法                                      |
| 効果的放出技術<br>薬剤放出技術   | 安定化               | 担体の利用<br>カプセルの利用   | 特表 2004-510692<br>00.04.07<br>A61K9/00                                       | 薬物送達組成物およびデバイス                                                 |
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | 患部の識別<br>感染症の識別   | 生体反応の利用<br>受容体利用   | 特表 2003-519668<br>00.01.14<br>A61K45/00<br>ホワイトヘッド INST<br>フォー バイオメディカル リサーチ | 熱ショックタンパク質融合タンパク質による、CD4+T細胞非依存性のインビボCTL惹起による個別ATP結合ドメインのマッピング |
|                     |                   | 生体反応の利用<br>遺伝子発現利用 | 特表平 08-510377<br>93.02.26<br>C12Q1/68<br>ジェネラル ホスピタル                         | 細胞壊死に由来する疾患を診断、治療および予防する化合物および方法                               |
|                     | 直接送達方法開発          | 担体の利用<br>カプセル利用    | 特表 2000-511189<br>96.05.24<br>A61K9/14<br>ペン ステイト リサーチ<br>ファウンデーション          | 肺への薬物送達のための空気力学的に軽い粒子                                          |
|                     | 患部でのがんの治療<br>薬効発現 | 生体条件の利用<br>酵素等利用   | 特表 2003-525946<br>00.03.08<br>A61K38/51                                      | ヘパリナーゼ I I I およびその使用                                           |

表 2.18.4 マサチューセッツ工科大学の技術要素別課題対応特許 (2/2)

| 技術要素 I II           | 課題 I II                | 解決手段 I<br>解決手段 II   | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]               | 発明の名称<br>概要                            |
|---------------------|------------------------|---------------------|------------------------------------------------------------------|----------------------------------------|
| 受動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | その他の患部への集積化<br>患部への集積化 | 生体条件の利用<br>生分解性利用   | 特表平 09-504308<br>(取下げ)<br>93.07.23<br>C08G81/00                  | 非直鎖状の親水性-疎水性マルチブロックコポリマーのナノ粒子およびマイクロ粒子 |
| 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 吸収促進化                  | 生体反応の利用<br>膜透過機構の利用 | 特表平 08-506807<br>92.12.04<br>A61K45/00<br>チルドレンズ メディカル センター      | 緑内障の治療                                 |
|                     |                        | 担体の利用<br>カプセルの利用    | 特表 2000-506165<br>96.03.04<br>A61K9/06<br>ペン ステイト リサーチ ファウンデーション | 細胞インターナリゼーションを増強するための物質および方法           |
|                     | 新規経肺投与方法開発             | 担体の利用<br>キャリアーの利用   | 特表 2001-526634<br>97.01.16<br>A61K9/12<br>ペン ステイト リサーチ ファウンデーション | 吸入用粒子の調製                               |
|                     | 新規経口投与方法開発             | 担体の利用<br>カプセルの利用    | 特表 2003-533470<br>00/05/18<br>A61K9/28<br>セリックス                  | 経口投薬形態における、毒性コアの非毒性領域中へのカプセル化          |

## 2.19 エミスフェア・テクノロジーズ（米国）

### 2.19.1 企業の概要

|       |                                                                            |
|-------|----------------------------------------------------------------------------|
| 商号    | Emisphere Technologies, Inc. (1991年、Clinical Technologies Associationから改称) |
| 本社所在地 | 765 Old Saw Mill River, Tarrytown, NY 10591 U.S.A.                         |
| 設立年   | 1986年                                                                      |
| 資本金   | 184千米ドル（2003年12月末）                                                         |
| 従業員数  | 120名（2004年3月）                                                              |
| 事業内容  | ドラッグデリバリーシステムの研究開発                                                         |

エミスフェア・テクノロジーズは、経口投与できない薬剤のドラッグデリバリーシステムの開発に特化したバイオ医薬会社である。心臓疾患、糖尿病、骨粗しょう症、成長障害、喘息、アレルギー、肥満、感染症など多岐にわたった研究開発を行っている。

（出典：エミスフェア・テクノロジーズのホームページ <http://www.emisphere.com/>）

### 2.19.2 製品例

受動的細胞間輸送機構を利用して、大きな分子量の薬剤や荷電した薬剤が細胞膜を透過できる技術を開発し、経口投与された薬剤を腸から吸収させるドラッグデリバリーシステム技術に適用している。ノバルティスやロシュといった製薬企業と共同で医薬開発を進めている。

現在、臨床試験中のものはあるが、ドラッグデリバリーシステムに関する製品はない。

### 2.19.3 技術開発拠点と研究者

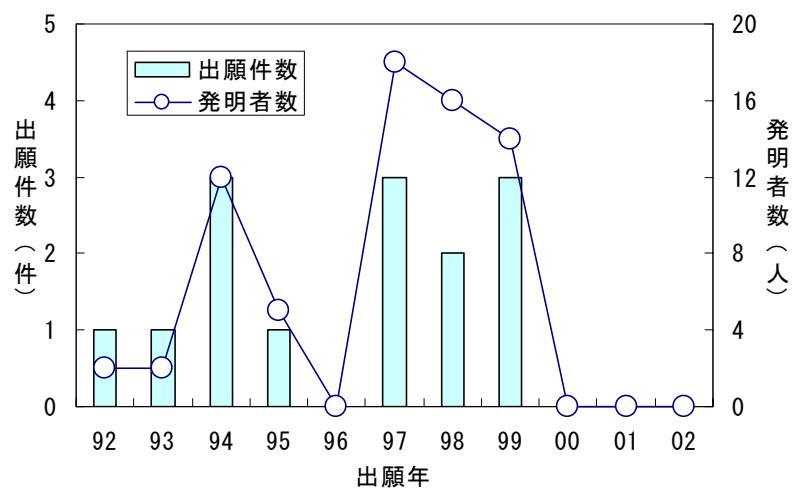
特許明細書に記載されているエミスフェア・テクノロジーズの発明者の住所から調査した主な技術開発拠点は、次のとおりである。エミスフェア・テクノロジーズはニューヨーク州タリータウンにあることから、技術開発拠点はニューヨーク州と考えられる。

米国 ニューヨーク州、コネチカット州、ニュージャージー州



エミスフェア・テクノロジーズの出願件数・発明者数の推移を図2.19.3に示す。1996年に出願件数、出願人数がゼロになったが、1992年～99年にかけて出願件数、発明者数が増加した。00年以降に出願が見られないが、これはPCT出願による公表の遅れと考えられる。

図2.19.3 エミスフェア・テクノロジーズの出願件数・発明者数の年次推移

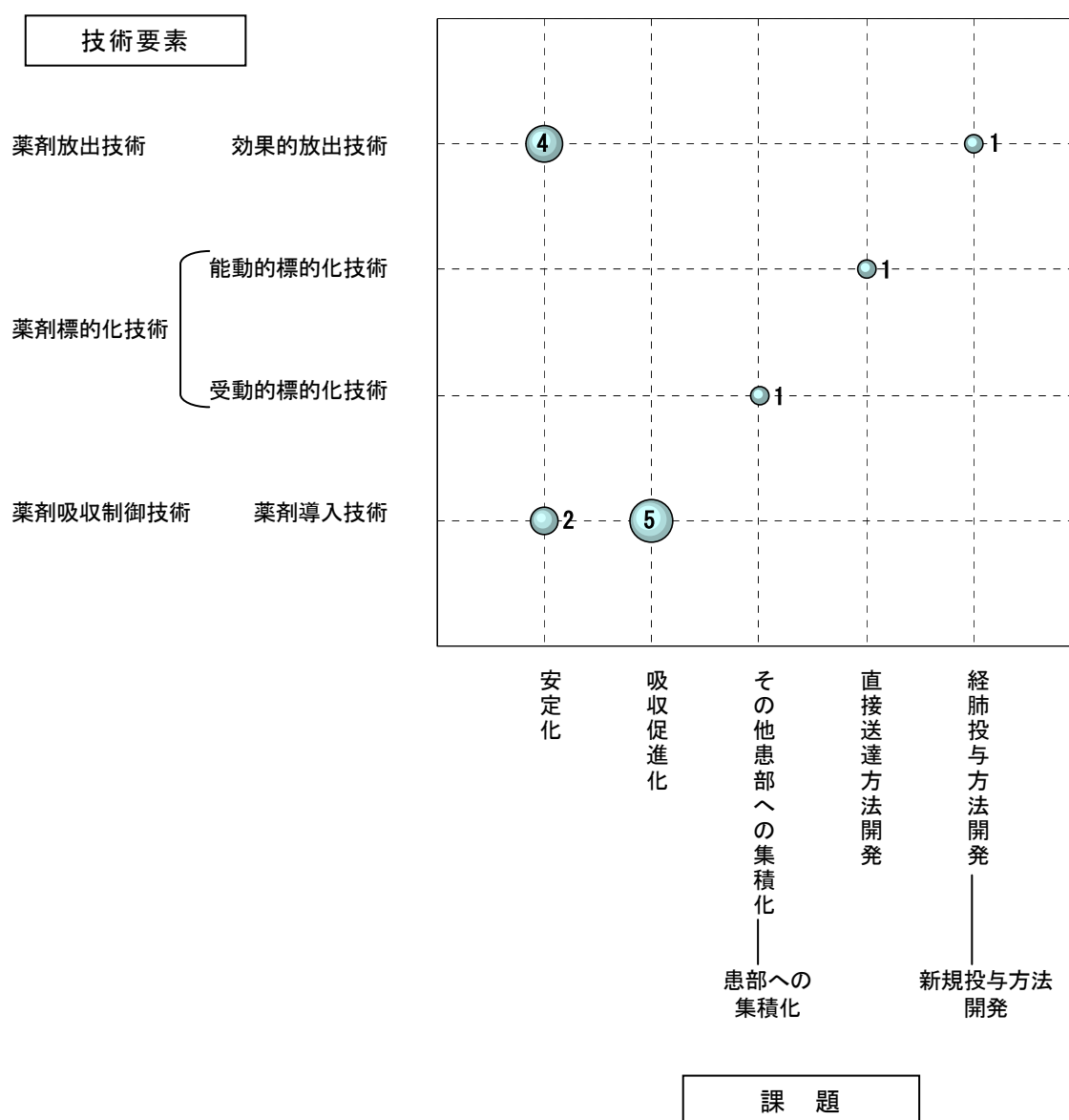


## 2. 19. 4 技術開発課題対応特許の概要

最近11年間（1992年1月～2004年12月）に公開されたエミスフェア・テクノロジーズのドラッグデリバリーシステムに関する特許・実用新案の件数は14件であり、表2. 19. 4にその内容を示している。

図2. 19. 4-1にエミスフェア・テクノロジーズの技術要素と課題の分布を示す。「薬剤導入技術」と「効果的放出技術」に関する出願が多い。薬剤導入技術の課題は「吸収促進化」と「安定化」である。効果的放出技術に関しては、「安定化」と経肺による新規投与方法の開発が課題である。

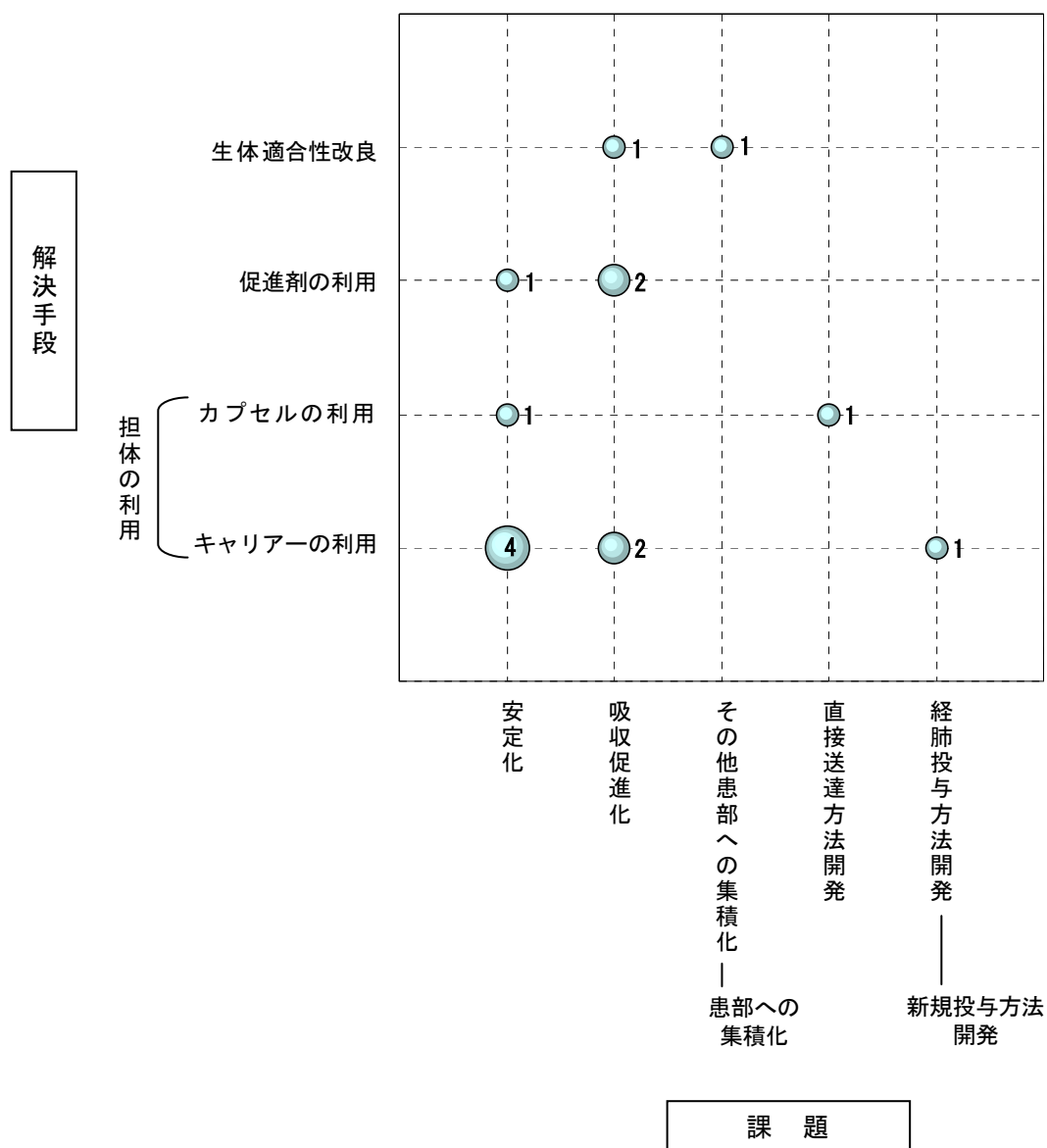
図2. 19. 4-1 エミスフェア・テクノロジーズの技術要素と課題の分布



1992年1月～2002年12月の出願

エミスフェア・テクノロジーズの課題と解決手段の分布を図2.19.4-2に示す。課題としては、「安定化」と「吸収促進化」を目指したものが多く。安定化に関しては「キャリアの利用」が解決手段の中心である。吸収促進化に対しては、「促進剤の利用」や「キャリアの利用」、「生体適合性改良」などにより解決している。

図2.19.4-2 エミスフェア・テクノロジーズの課題と解決手段の分布



1992年1月～2002年12月の出願

表2. 19. 4 エミスフェア・テクノロジーズの技術要素別課題対応特許 (1/2)

| 技術要素<br>I II        | 課題<br>I II  | 解決手段 I<br>解決手段 II | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数] | 発明の名称<br>概要                     |
|---------------------|-------------|-------------------|---------------------------------------------------|---------------------------------|
| 効果的放出技術<br>薬剤放出技術   | 安定化         | 促進剤の利用            | 特表2004-501057<br>99. 11. 05<br>C07C22/918         | フェニルアミンカルボン酸化合物及び活性剤を送達するための組成物 |
|                     |             | 担体の利用<br>キャリアーの利用 | 特開2001-131090<br>97. 02. 07<br>A61K45/06          | 化合物及び活性剤を送達するための組成物             |
|                     |             |                   | 特開2001-139494<br>97. 02. 07<br>A61K47/16          | 化合物及び活性剤を送達するための組成物             |
|                     |             |                   | 特表平07-508004<br>A09<br>92. 06. 15<br>A61K47/42    | プロテインノイド担体並びにその製造方法および使用方法      |
|                     | 新規投与方法開発    | 担体の利用<br>キャリアーの利用 | 特表2002-521455<br>98. 07. 27<br>A61K9/72           | 活性剤の肺性デリバリー                     |
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | 直接送達方法開発    | 担体の利用<br>カプセルの利用  | 特表平09-504300<br>93. 10. 26<br>A61K38/00           | デフェロキサミンの経口移送方法                 |
| 受動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | その他の患部への集積化 | 生体適合性改良           | 特表平10-507762<br>94. 10. 25<br>C07C22/942          | 活性剤デリバリー用化合物および組成物              |
| 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 安定化         | 担体の利用<br>キャリアーの利用 | 特表平09-512279<br>A09<br>94. 04. 22<br>C07C23/363   | 薬剤移送用修飾アミノ酸                     |
|                     |             | 担体の利用<br>カプセルの利用  | 特表2002-537372<br>99. 02. 26<br>C07C23/560         | 活性剤デリバリーのための化合物及び組成物            |
|                     | 吸収促進化       | 生体適合性改良           | 特表平10-509433<br>94. 10. 25<br>A61K47/48           | 活性薬輸送システム                       |
|                     |             | 促進剤の利用            | 特表2001-517694<br>97. 09. 29<br>A61K9/00           | 活性剤輸送システム                       |
|                     |             |                   | 特表2002-522413<br>98. 08. 07<br>C07C23/325         | 活性剤のデリバリーのための化合物及び組成物           |

表2.19.4 エミスフェア・テクノロジーズの技術要素別課題対応特許（2/2）

| 技術要素<br>I II         | 課題<br>I II    | 解決手段 I<br>解決手段 II | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]             | 発明の名称<br>概要            |
|----------------------|---------------|-------------------|---------------------------------------------------------------|------------------------|
| 薬剤<br>吸収<br>制御<br>技術 | 吸収<br>促進<br>化 | 担体の利用<br>キャリアーの利用 | 特表2002-534363<br>99.01.08<br>A61K47/48<br>バージニア コモ<br>ンウェルス大学 | ポリマー性デリバリー剤及びデリバリー剤化合物 |
|                      |               |                   | 特開2003-313157<br>95.03.31<br>C07C22/942                       | 活性剤デリバリー用化合物および組成物     |

## 2.20 協和醗酵工業

### 2.20.1 企業の概要

|       |                                                         |
|-------|---------------------------------------------------------|
| 商号    | 協和醗酵工業 株式会社                                             |
| 本社所在地 | 〒100-8185 東京都千代田区大手町1-6-1 大手町ビル                         |
| 設立年   | 1949年（昭和24年）                                            |
| 資本金   | 267億45百万円（2004年3月末）                                     |
| 従業員数  | 4,372名（2004年3月末）（連結：6,294名）                             |
| 事業内容  | 医療用医薬品、製剤原料および農畜水産薬、食品および原料用アルコールの製造・販売、化学品（溶剤、可塑剤等）の販売 |

協和醗酵工業は、医薬カンパニー、バイオケミカルカンパニー、食品カンパニーから成り、さらに溶剤や可塑剤などの化学品を子会社の協和発酵ケミカル（旧：協和油化）が主として製造している。医薬カンパニーでは、医療用医薬品の製造・販売をしており、血圧を調整する循環器薬、花粉症に効果がある抗アレルギー薬、抗がん剤、化学療法により低下した白血球数を回復させる G-CSF 製剤、消化器の働きを活発にする薬、中枢神経系に作用してパーキンソン病やてんかんに効果がある薬などを提供している。

（出典：協和醗酵工業のホームページ <http://www.kyowa.co.jp/>）

### 2.20.2 製品例

徐放性製剤、口腔内速崩壊錠を開発するなど、ドラッグデリバリーシステムの研究開発を推進している。

協和醗酵工業のドラッグデリバリーシステム製品としては、がんの痛みを緩和させる合成麻薬フェンタニルの経皮吸収型の持続性貼付製剤がある。また、狭心症発作を起こす可能性のある患者の体（胸・腰・上腕部）にテープを貼り付けて、ニトログリセリンが少しずつ皮膚から体内に吸収され発作が起こるのを予防するニトログリセリン製剤がある。これは、1993年に積水化学工業が製造承認を取得したものであり、協和醗酵工業が販売を担当している。

（出典：協和醗酵工業のホームページ <http://www.kyowa.co.jp/>）

### 2.20.3 技術開発拠点と研究者

特許明細書に記載されている協和醗酵工業の発明者の住所から調査した主な技術開発拠点は、次のとおりであり、東京都および静岡県 of 研究所から出願されている。

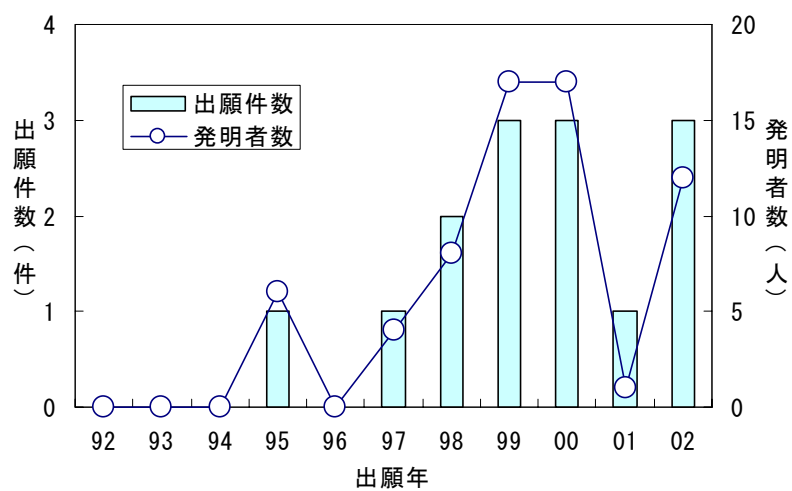
東京都町田市旭町3丁目6番6号 協和醗酵工業株式会社東京研究所

静岡県駿東郡長泉町下土狩1188 協和醗酵工業株式会社医薬総合研究所

東京都千代田区大手町一丁目6番1号 協和醗酵工業株式会社本社

協和醗酵工業の出願件数・発明者数の推移を図2.20.3に示す。1995～00年にかけて出願件数、発明者数が増加している。01年に減少したが、その後、再度増加に転じている。

図2.20 協和醗酵工業の出願件数・発明者数の年次推移

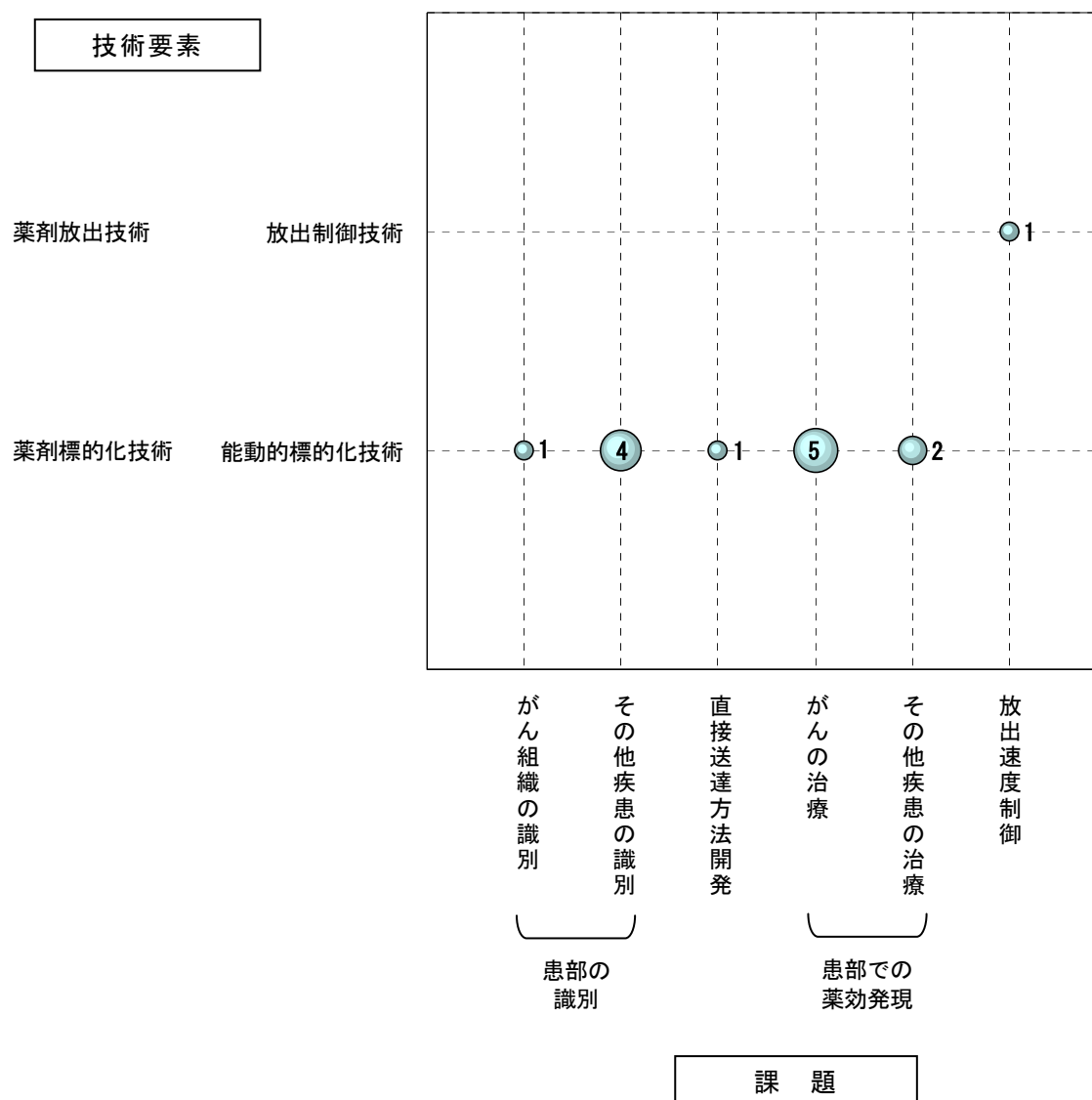


## 2. 20. 4 技術開発課題対応保有特許の概要

最近11年間（1992年1月～2002年12月）に公開された協和醗酵工業のドラッグデリバリーシステムに関する特許・実用新案の件数は14件であり、表2. 20. 4にその内容を示している。

図2. 20. 4-1に協和醗酵工業の技術要素と課題の分布を示す。「能動的標的化技術」に出願が集中している。能動的標的化の課題は、がん、その他の疾患の識別と治療である。

図2. 20. 4-1 協和醗酵工業の技術要素と課題の分布

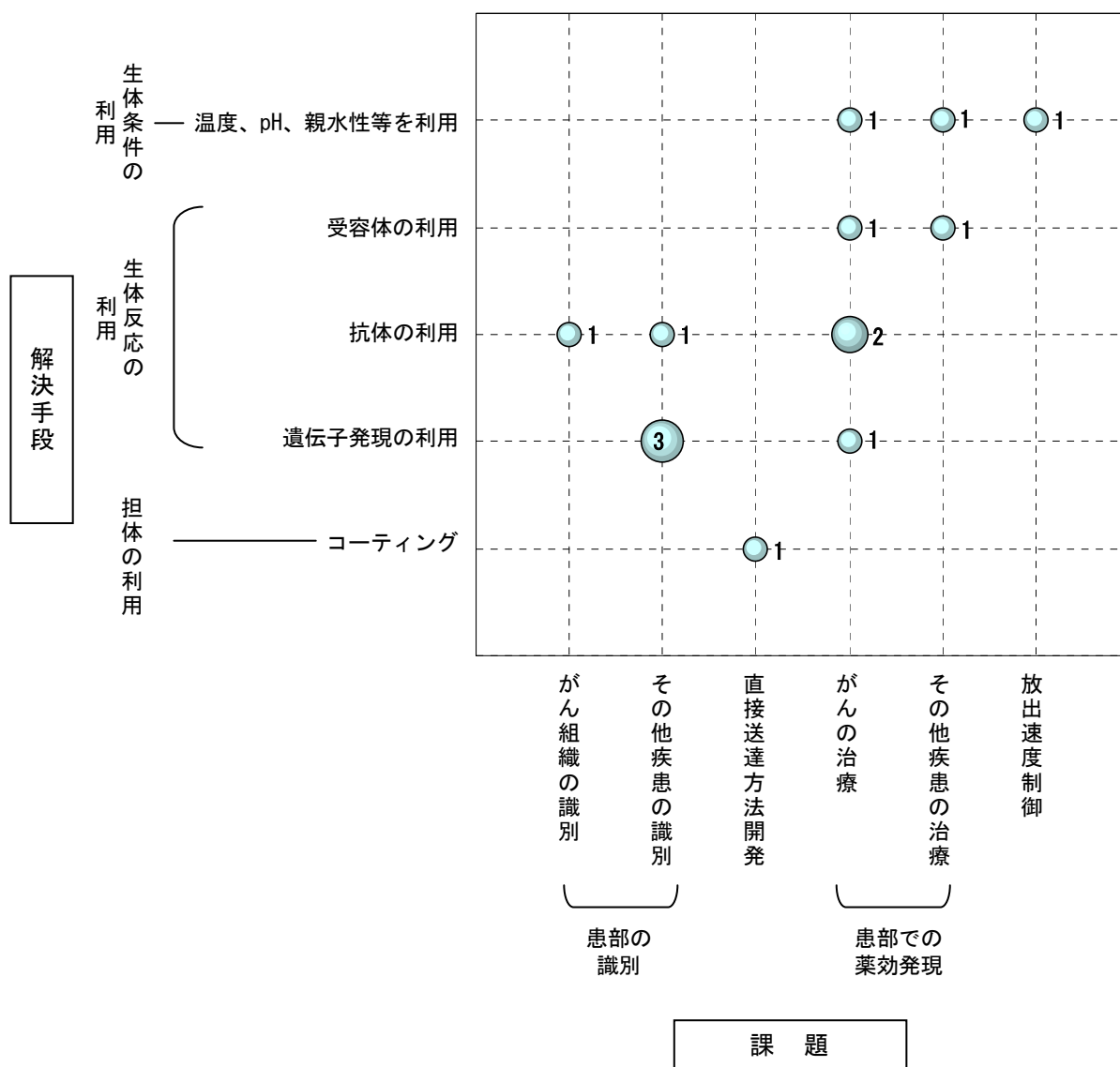


1992年1月～2002年12月の出願



協和醗酵工業の課題と解決手段の分布を図2. 20. 4-2に示す。がんやその他の疾患の識別と治療に課題が集中している。その他の疾患の識別に対しては、「遺伝子発現の利用」が解決手段となっている。がんの治療には「抗体の利用」などが解決手段として用いられている。

図2. 20. 4-2 協和醗酵工業の課題と解決手段の分布



1992年1月～2002年12月の出願

表2. 20. 4 協和醗酵工業の技術要素別課題対応特許 (1/2)

| 技術要素<br>I II        | 課題<br>I II        | 解決手段 I<br>解決手段 II        | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数] | 発明の名称<br>概要                                                |
|---------------------|-------------------|--------------------------|---------------------------------------------------|------------------------------------------------------------|
| 薬剤放出制御技術            | 放出速度制御            | 生体条件の利用<br>温度、pH、親水性等の利用 | W000/038735<br>98. 12. 24<br>A61K47/48            | 医薬製剤                                                       |
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | がん組織の識別           | 生体反応の利用<br>抗体の利用         | W001/023431<br>99. 09. 30<br>C07K16/18            | ガングリオシドGM2に対する抗体の誘導体                                       |
|                     | その他の疾患の識別         | 生体反応の利用<br>抗体の利用         | 特開2004-000045<br>02. 05. 31<br>C12N15/09          | 前立腺特異的膜抗原に対する抗体                                            |
|                     |                   | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利用      | W001/025427<br>99. 10. 01<br>C12N15/09<br>野島 博    | ずり応力応答性DNA                                                 |
|                     |                   |                          | W001/068817<br>00. 03. 16<br>C12N 1509 ZNA        | 腎臓修復因子                                                     |
|                     |                   |                          | W001/098493<br>00. 06. 15<br>C12N15/09            | インスリン様増殖因子結合蛋白質                                            |
|                     | 直接送達方法開発          | 担体の利用<br>コーティング          | 特開2000-319166<br>99. 03. 10<br>A61K9/52           | 腸溶製剤                                                       |
|                     | がんの治療<br>患部での薬効発現 | 生体条件の利用<br>温度、pH、親水性等の利用 | 特開平11-021250<br>97. 07. 02<br>A61K38/22           | 医薬製剤                                                       |
|                     |                   | 生体反応の利用<br>受容体の利用        | 特開2003-261460<br>02. 03. 08<br>A61K45/00<br>渋谷 正史 | 肺選択的癌転移の診断薬および治療薬                                          |
|                     |                   | 生体反応の利用<br>抗体の利用         | 特開2003-310276<br>02. 04. 30<br>C12N15/09<br>渋谷 正史 | 1214位チロシンがリン酸化したKDR/FI<br>k-1に対する情報伝達分子の結合を阻害する物質およびその利用方法 |
|                     |                   |                          | W096/035451<br>95. 05. 10<br>A61K39/44            | 新規毒素複合体                                                    |
|                     |                   | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利用      | W002/024227<br>00. 09. 20<br>A61K45/00            | 腫瘍細胞増殖抑制剤                                                  |

表2.20.4 協和醗酵工業の技術要素別課題対応特許（2/2）

| 技術要素<br>I II        | 課題<br>I II            | 解決手段 I<br>解決手段 II            | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数] | 発明の名称<br>概要 |
|---------------------|-----------------------|------------------------------|---------------------------------------------------|-------------|
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | その他の疾患の治療<br>患部での薬効発現 | 生体条件の利用<br>温度、pH、親水性等の<br>利用 | W000/038736<br>98.12.24<br>A61K47/48              | 医薬製剤        |
|                     |                       | 生体反応の利用<br>受容体の利用            | 特開2003-113111<br>01.10.02<br>A61K38/00<br>土田 邦博   | 糖尿病治療用医薬    |

## 2.21 主要企業以外の特許番号一覧

表 2.21 に主要企業以外の技術要素別課題対応特許を示す。

表 2.21 主要企業以外の特許要素別課題対応特許 (1/10)

| 技術要素<br>I II | 課題<br>I II | 解決手段 I<br>解決手段 II            | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]                                 | 発明の名称<br>概要                                                                                                          |
|--------------|------------|------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 薬剤放出技術       | 徐放化        | 生体適合性改良                      | 特許 3476775<br>99.01.26<br>C08G63/00<br>コンセイユ ドルシェル<br>シュ エ ダブリカシオン<br>シャンティ、ポリーメッド | 生物分解性ポリエステルおよび生物活性ポリペプチドのイオン分子結合体<br>少なくとも1つの有効イオノゲン性アミンを含む生物活性ポリペプチドとイオン結合している遊離COOH基を含むポリエステルを含みイオン結合している持続放出薬剤組成物 |
|              |            |                              | 特許 3507507<br>95.12.28<br>C07K19/00<br>タノツク バイオシステムズ                               | 非免疫原性ペプチドを介して結合されたインターフェロン-αと免疫グロブリンとのハイブリッド<br>ヒトインターフェロンとヒト免疫グロブリンFc断片が結合されているハイブリッド組換えタンパク質                       |
|              |            |                              | 特許 2602607<br>(権利消滅)<br>92.09.09<br>C07K7/16<br>ディ ディ エス研究所                        | 糖修飾ペプチド<br>作用持続時間が延長され、薬物として有用である新規な糖修飾ペプチド                                                                          |
|              |            |                              | 特許 2710900<br>(権利消滅)<br>92.09.02<br>C07H15/08<br>ディ ディ エス研究所                       | 酸性官能基を有する脂質誘導体及び同誘導体によって被覆された微粒子キャリアー<br>重合度が3以上のポリエチレングリコール鎖の一端に酸性官能基を有する化合物を付加された微粒子キャリアー                          |
|              |            |                              | 特許 2766141<br>(権利消滅)<br>92.09.03<br>C07H15/08<br>ディ ディ エス研究所                       | 酸性糖誘導体<br>重合度が3以上のポリエチレングリコール鎖の一端に酸性官能基を有する化合物を付加された微粒子キャリアー                                                         |
|              |            | 生体条件の利用<br>温度、pH、親水性<br>等の利用 | 特許 3135340<br>92.02.25<br>A61K47/30<br>森 有一                                        | ドラッグキャリアー<br>体温より低い温度でゲル化し、ゲル化温度以下の温度では水溶性を示す高分子化合物からなるドラッグキャリアー                                                     |
|              |            | 生体条件の利用<br>生分解性利用            | 特許 3390177<br>96.04.23<br>A61K9/16<br>キナートン                                        | 徐放イオン性複合体<br>互いにイオン結合している、遊離カルボキシル含有生分解性ポリマーと遊離アミノ基含有薬物を含んだ徐放イオン性複合体を球体化                                             |
|              |            |                              | 特許 3101711<br>97.11.20<br>B01J20/24<br>農業生物資源研究所                                   | 生体高分子からなる吸着体／徐放体及びその製造方法<br>有効成分を吸着する機能を有し、一旦吸着させた有効成分を徐放する徐放機能を有する生体高分子として、絹蛋白質または動物由来のケラチン、コラーゲンもしくはゼラチンを用いる       |
|              |            | マトリックスへ<br>分散                | 特許 3407073<br>92.11.12<br>A61K31/407<br>エル テー エス ロー<br>マン テラピー システ<br>ム、 クリンゲ ファルマ | フィズスチグミンの皮膚への投与のための経皮療法システム及びその製造方法<br>活性物質を通さない地層と感圧貯蔵層と可動保護層とから成るフィズスチグミンの皮膚への投与のための経皮療法システム                       |
|              |            |                              | 特許 2729333<br>92.07.02<br>A61K31/21<br>ペーカー ノートン<br>PHARM                          | 血管拡張療法が必要とされる症状を治療するための医薬組成物<br>亜硝酸エステルを長期間連続して登用する治療方法                                                              |

表 2.21 主要企業以外の技術要素別課題対応特許 (2/10)

| 技術要素<br>I<br>II | 課題<br>I<br>II | 解決手段 I<br>解決手段 II        | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]    | 発明の名称<br>概要                                                                                                                                |
|-----------------|---------------|--------------------------|-------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 薬剤放出制御技術        | 徐放化           | 担体の利用<br>カプセルの利用         | 特許 3486417<br>95.07.05<br>A61K9/51<br>ヨーロピアン コミュニティー  | タンパク質性薬物の吸収および送達のために設計された生物適合性および生分解性ナノ粒子<br>ナノ粒子を形成することで投与すべき薬物の活性を保持でき、投与すべき薬物の放出を調節することができる                                             |
|                 |               |                          | 特許 3372408<br>95.09.21<br>A61K47/48<br>第一製薬           | 微粒子性運搬体・薬物-コンプレックス<br>ポリアクリル酸をグラフト鎖とするグラフトポリマーの微粒子性運搬体と薬物の新しいコンプレックス                                                                       |
|                 |               | 担体の利用<br>コーティング          | 特許 3258666<br>93.09.23<br>A61K31/58<br>ドクトル ファルク ファルマ | 徐放性のブデゾナイドペレット及びその製造方法<br>内側から外側にかけて、中性のペレット；微粉碎処理したブデゾナイドと水溶性補助剤；ラッカーコーティング剤を含有する徐放性ブデゾナイドペレット                                            |
|                 |               |                          | 特許 2857741<br>95.08.31<br>A61K47/36<br>佐賀大学長          | コーティングされた薬剤内包架橋キトサン組成物、その製造方法および薬剤徐放制御システムとしての用途<br>薬剤の有効成分を一定量ずつ長時間にわたって放出し続けることができるように液晶物質にてコーティングされた薬剤内包架橋キトサン組成物                       |
|                 | 放出速度制御        | 生体条件の利用<br>生分解性の利用       | 特許 3257750<br>93.07.20<br>C08G63/08<br>エシコン           | ε-カプロラクトンおよびラクチドの液状コポリマー<br>約55～約70モル%の範囲内のラクチドおよび約45～約30モル%の範囲内のε-カプロラクトンからなるコポリマー。薬物デリバリーに好適                                             |
|                 |               |                          | 特許 3131195<br>98.01.29<br>C08G63/08<br>ポリメッド          | ヒドロゲル形成性で自己溶解性の吸収性ポリエステル共重合体およびその使用方法<br>水性環境と接すると選択的、セグメント的に会合して塑性変形自在なヒドロゲル塊を形成し得る新規な自己溶解性の吸収性ポリエステル共重合体                                 |
|                 |               |                          | 特許 2642869<br>94.01.10<br>C08G85/00<br>三養社            | 薬物送達マトリックス用の生分解性コポリマー<br>分子内架橋結合を有せず、改良された生分解性を有し、人体に対して毒性のないマルチブロックコポリマー                                                                  |
|                 |               | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利用      | 特許 3526844<br>99.06.22<br>C12N15/09<br>ダイナベック研究所      | 2つの外来遺伝子を発現させるためのベクター<br>2つの外来遺伝子を発現させるために、発現制御配列、スプライシング供与配列、第一の外来遺伝子挿入部位、RRE コア配列、スプライシング受容配列、第二の外来遺伝子挿入部位、の構成要素を5'側から3'側に向けて順に含むベクターDNA |
|                 |               | 促進剤の利用                   | 特許 2966745<br>93.12.13<br>A61K47/38<br>エフ ホフマン ラ ロシュ  | 制御された放出の医薬組成物<br>独自のゼロ次制御放出プロファイルを示す徐崩壊性医薬組成物                                                                                              |
|                 |               |                          | 特許 3002702<br>93.11.16<br>A61K9/127<br>スカイファーム        | 活性物質の制御放出を有する小胞<br>カプセル化後に治療レベルの生物学的活性物質の小胞からの放出速度を遅くし、持続させ、制御する                                                                           |
|                 | 放出制御時         | 生体条件の利用<br>温度、pH、親水性等の利用 | 特許 2699038<br>92.02.21<br>B01J13/02<br>ノエビア           | 温度感受性リポソーム<br>特定の温度において内包物質を放出することができる温度感受性リポソーム                                                                                           |

表 2.21 主要企業以外の技術要素別課題対応特許 (3/10)

| 技術要素<br>I II      | 課題<br>I II | 解決手段 I<br>解決手段 II  | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]                | 発明の名称<br>概要                                                                                                                   |
|-------------------|------------|--------------------|-------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 薬剤放出技術            | 放出時期制御     | 担体の利用<br>リポソームの利用  | 特許 3200704<br>99.05.13<br>A61K9/127<br>産業技術総合研究所、松村英夫、清水 秀明、真島 利和 | 機能的に配置された磁気粒子・リポソーム粒子複合体<br>磁気微粒子を中心にもち、その周囲に種々の試薬を内包させたりリポソーム微粒子                                                             |
|                   |            | 担体の利用<br>エマルジョンの利用 | 特許 2909418<br>(権利消滅)<br>95.09.18<br>A61K9/52<br>資生堂               | 薬物の遅延放出型マイクロスフィア<br>W/O/W 型のエマルジョンを形成することにより製造できるマイクロスフィア。特に、脳内への埋め込みに適する。                                                    |
| 効果的放出技術<br>薬剤放出技術 | 安定化        | 生体適合性改良            | 特許 3485842<br>94.03.31<br>C12N15/09<br>アムジェン                      | 巨核球の成長と分化を刺激するMGDFの誘導体とその製造方法<br>ヒト巨核球の増殖および発達を特異的に促進し実質上他のヒトタンパクを含まないヒトMGDFポリペプチドに少なくとも1つの水溶性ポリマーが結合されたMGDF誘導体               |
|                   |            | 生体適合性改良            | 特許 3114998<br>93.11.12<br>C08G65/321<br>シアウオーター ポリマーズ             | 表面及び分子の変性に用いる単離可能で水溶性で加水分解に対して安定なポリ(エチレングリコール)と関連ポリマーの活性スルホン類<br>スルホン部分によって活性化されて、分子及び表面のチオール部分に選択的に付着するポリ(エチレングリコール)誘導体(PEG) |
|                   |            |                    | 特許 3425955<br>95.06.01<br>C07D30/514<br>バイオフィジカ                   | 新規タクソイド<br>パクリタセルと比較して、水溶性の増大した、薬理的性質の改良された新規タクソイド                                                                            |
|                   |            |                    | 特許 3103116<br>94.07.15<br>C12N15/09<br>ロシュ ディアグノスティ               | 抗体の安定性を改良するための方法<br>組換え遺伝子を含む発現ベクターによる形質転換によって、安定性を有する機能性抗体、機能性誘導体、それらのフラグメントを製造                                              |
|                   |            |                    | 特許 3085485<br>92.04.21<br>C07H15/04<br>千葉製粉                       | オリゴサッカライド誘導体<br>優れたリン脂質小胞体分散安定性を賦与するオリゴサッカライド誘導体                                                                              |
|                   |            |                    | 特許 3217450<br>92.05.18<br>B01F17/56<br>千葉製粉                       | リン脂質小胞体用安定化剤<br>凝集抑制および蛋白等の溶液中での分散安定をはかることができるリン脂質小胞体用安定化剤                                                                    |
|                   |            | 促進剤の利用             | 特許 3138733<br>99.06.23<br>A61K9/127<br>産業技術総合研究所                  | 安定化リポソーム及びその形成方法<br>PCを主剤とする油脂材料から膜形成されるリポソームをカロテノイド化合物により安定化させた                                                              |
|                   |            |                    | 特許 3102612<br>93.07.30<br>A61K9/127<br>千葉製粉                       | 凍結小胞体<br>リン脂質小胞体に糖脂質を導入し、機能性物質を内包せしめを急速凍結して凍結小胞体を得る。長期間保存可能                                                                   |
|                   |            | マトリックスへ分散          | 特許 2944419<br>(権利消滅)<br>93.05.10<br>A61K38/00<br>ノバルティス           | 持続性遊離組成物中の薬理的活性成分の安定<br>ポリラクチドのマトリックス中に、エンボン酸またはアスコルビン酸またはその塩と組合わさってペプチドを活性成分として含む医薬組成物                                       |
|                   |            | 担体の利用<br>ベクターの利用   | 特許 290607<br>C12N48/910<br>93.15.09<br>ミシガン大学                     | 遺伝子治療のためのアデノウイルスベクター<br>アデノウイルス E3 領域の少なくとも一部分を保持し、アデノウイルス E1 領域少なくとも一部分の欠失を担持する。                                             |
|                   |            | 担体の利用<br>リポソームの利用  | 特許 3329554<br>93.03.10<br>A61K9/127<br>千葉製粉                       | 乾燥小胞体<br>燐脂質小胞体に糖脂質を導入したのち、凍結せずして減圧乾燥した乾燥小胞体。長期の保存ができる                                                                        |



表 2.21 主要企業以外の技術要素別課題対応特許 (4/10)

| 技術要素 I<br>技術要素 II   | 課題 I<br>課題 II | 解決手段 I<br>解決手段 II   | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]                                              | 発明の名称<br>概要                                                                                                                       |
|---------------------|---------------|---------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 効率的放出技術<br>薬剤放出技術   | 安定化           | 担体の利用<br>リポソームの利用   | 特許 3249583<br>92.07.07<br>A61K35/78<br>日本油脂、シュワーベ<br>グ<br>リンウェーブ                                | リポソーム製剤<br>膜脂質が中性リン脂質を含んでなる脂質成分より構成されるリポソームに銀杏葉抽出エキスを含有させた。相分離や凝集、有効成分の変質や分解等を極めて低く抑えることができる                                      |
|                     |               |                     | 特許 3443939<br>94.05.20<br>A61K9/127<br>日本油脂                                                     | 脂質小胞体および徐放性製剤<br>リン脂質からなる脂質小胞体として、保存安定性や生体内分解性にすぐれ、しかもリポソーム用の脂質小胞体として内水相に含ませた物質、たとえば薬物の徐放性にすぐれるもの                                 |
|                     |               | 担体の利用<br>カプセルの利用    | 特許 2617273<br>92.03.11<br>A61K47/22<br>ファーマシューティカル<br>ディスカバリー                                   | 自己アセンブリ性ジケトピペラジン薬物送達系<br>ジケトピペラジンマイクロパーティクルの形成に基づく薬物送達系                                                                           |
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | 安定化           | 担体の利用<br>カプセルの利用    | 特許 3102990<br>93.07.08<br>A61K9/48<br>森下仁丹                                                      | カプセルの製造方法およびそれから得られたカプセル<br>酸、水分または熱に弱い内容物質を常温では非流動性である疎水性物質に懸濁し、これをカプセル化した後、真空乾燥させる                                              |
|                     |               | 担体の利用<br>キャリアーの利用   | 特許 3055771<br>96.03.12<br>C12M1/00<br>ベクトン ディッキンソン                                              | 試料への粒子の輸送体<br>細胞を含む試料に粒子を送達するための輸送体                                                                                               |
|                     |               | 担体の利用<br>コーティング     | 特許 3463266<br>95.09.21<br>A61K314/439<br>ファーマ パス エル エ<br>ル シー                                   | 酸不安定性オメパラゾールを含有する新規組成物及びその製造方法<br>オメパラゾールを含有する経口投与用に好適な組成物、及びその製造方法。アルカリ性反応性化合物を含有せず、互いに圧縮された核及びベンゾイミダゾールから成るコアと、中間層と、腸溶性層とを備えている |
|                     | がん組織の識別       | 生体反応の利用<br>膜透過機構の利用 | 特許 3001381<br>(権利消滅)<br>94.09.16<br>C08B37/00<br>ディ ディ エス研究所                                    | 臓器移行性を有する多糖誘導体および薬物担体<br>臓器移向性を示す化合物によって抗腫瘍剤等を搬送する薬物担体                                                                            |
|                     |               | 生体反応の利用<br>抗体の利用    | 特許 3492373<br>93.08.21<br>C12P21/08<br>インペリアル キャンサー<br>リサーチ テクノロジー                              | モノクローナル抗体<br>膜結合性ヒト癌胎児性抗原を結合し、ヒト癌胎児性抗原に結合したヒトの胆汁糖タンパク質からなるハイブリッドポリペプチドを結合し、ヒトの胆汁糖タンパク質に結合しない分子                                    |
|                     |               |                     | 特許 2831852<br>93.05.21<br>C07K14/705<br>パーク ソン ホエ                                               | ヒト胸腺皮質細胞上に発現する細胞表面タンパク質及びその利用<br>分子量 120,000 の糖タンパク質であり、Tリンパ芽球性リンパ腫細胞および白血病細胞に発現する新規のタンパク質。Tリンパ芽球性リンパ腫および白血病の診断に有益                |
|                     |               |                     | 特許 3387929<br>94.06.08<br>C07K16/30<br>ベーリンガー インゲル<br>ハイム INTERN、フォルシ<br>ュングスツェントルム カ<br>ールスルーエ | CD44v6に対するモノクローナル抗体<br>CD44遺伝子のエキソンv6変異体によってコードされるエピトープに対して活性のある抗体。治療および診断の用途に適している                                               |

表 2.21 主要企業以外の技術要素別課題対応特許 (5/10)

| 技術要素<br>I<br>II     | 課題<br>I<br>II      | 解決手段 I<br>解決手段 II       | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]                                                                | 発明の名称<br>概要                                                                                                                                                  |
|---------------------|--------------------|-------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | がん組織の識別<br>患部の識別   | 生体反応の利用<br>抗体の利用        | 特許 3541296<br>92. 11. 13<br>C07K16/30<br>ルードヴィッヒ INST フ<br>ォア キャンサー リサー<br>チ、メモリアル スローネー<br>ケッターリング キャンサー<br>センター | 腫瘍血管内皮細胞に特異的に結合するモノ<br>クローナル抗体とその利用方法<br>腫瘍血管内皮細胞によって特徴付けられる<br>細胞表面抗体に特異的に結合するモノクロー<br>ナル抗体に関する。エンドシアリンと称さ<br>るこの抗体は、糖タンパク質である                              |
|                     |                    |                         | 特許 3268147<br>94. 12. 28<br>C07K16/18<br>大鵬薬品工業                                                                   | モノクローナル抗体<br>ヒトのチミジンホスホリラーゼおよび血小<br>板由来血管内皮細胞増殖因子を認識し、各種<br>腫瘍及びその転移、血管新生の異常増殖を伴<br>う疾患などの診断および治療に有用なモノク<br>ローナル抗体                                           |
|                     |                    |                         | 特許 3461365<br>93. 06. 11<br>C07K16/32<br>大鵬薬品工業                                                                   | モノクローナル抗体<br>ヒトの癌化因子である p120 蛋白中に存在す<br>るアミノ酸配列を含むペプチドに対するモノ<br>クローナル抗体。ヒト癌細胞に広く存在する<br>癌に対する抗原を認識し、ヒト正常細胞と反<br>応しないため、癌の免疫学的診断およびター<br>ゲッティング機能を持つ治療システムに有用 |
|                     |                    |                         | 特許 2087396<br>(権利消滅)<br>92. 10. 30<br>C07D207/452<br>同仁化学研究所                                                      | 新規なエチレンジアミン四酢酸誘導体<br>腫瘍の画像診断や治療に用いる放射性金属<br>核種の標識抗体を形成する化合物                                                                                                  |
|                     |                    | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利<br>用 | 特許 2800850<br>(権利消滅)<br>92. 07. 21<br>C12Q1/68<br>アイシス イノベーション                                                    | 新生物形成の検出方法<br>129bp の新規なエキソンの位置および配列<br>を決定し、そのものとして、および診断方法<br>に使用する                                                                                        |
|                     | 感染症の識別<br>患部の識別    | 生体反応の利用<br>抗体の利用        | 特許 2907552<br>92. 11. 23<br>C12N15/09<br>コンノート LAB                                                                | ヘモフィルス外膜タンパク質<br>ヘモフィルスの D 1 5 外膜タンパクの少な<br>くとも一部をコード化したインフルエンザ菌<br>の特定株から単離した核酸。診断および医療<br>に使用できる                                                           |
|                     | 自己免疫疾患の識別<br>患部の識別 | 生体反応の利用<br>受容体の利用       | 特許 2633467<br>(権利消滅)<br>93. 08. 17<br>C08B37/00<br>ディ ディ エス研究所                                                    | シアリルルイス X 誘導体<br>化合物は E L A M - 1 結合能を有しており、<br>血管内皮細胞などの炎症部位に抗炎症剤<br>などを搬送する炎症部認識素子として有用                                                                    |
|                     |                    |                         | 特許 2716657<br>(権利消滅)<br>93. 02. 26<br>C07H15/04<br>ディ ディ エス研究所                                                    | 接着分子 E L A M - 1 に特異的結合能を有す<br>る化合物<br>単糖残基をもち、E L M A - 1 と特異的に<br>結合する化合物                                                                                  |
|                     | その他の疾患の識別<br>患部の識別 | 生体適合性改良                 | 特許 3186418<br>93. 03. 26<br>C07C59/64<br>富士レビオ                                                                    | 4-フルオロビフェニル誘導体<br>極めて高い H M G - C o A リダクターゼ阻<br>害作用を有する 4-フルオロビフェニル誘導<br>体。適度な水溶性を有するため副作用の低減<br>が期待できる                                                     |
|                     |                    | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利<br>用 | 特許 3527200<br>97. 08. 13<br>C12Q1/68<br>アイシス PHARM                                                                | アンチセンスオリゴヌクレオチド組成物及び<br>J N K タンパク質のモジュレーション方法<br>J u n - N 末端キナーゼ (J N K タンパク<br>質) をコードする遺伝子の発現のモジュレ<br>ーションを介した処置に適した疾患または障害<br>の治療および診断のための組成物           |



表 2.21 主要企業以外の技術要素別課題対応特許 (6/10)

| 技術要素 I<br>技術要素 II   | 課題 I<br>課題 II | 解決手段 I<br>解決手段 II        | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]            | 発明の名称<br>概要                                                                                                      |
|---------------------|---------------|--------------------------|---------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | その他の疾患の識別     | 担体の利用<br>ベクターの利用         | 特許 3523879<br>94.05.31<br>A61K47/48<br>アラーガン                  | 輸送タンパク質用クロストリジウム属細菌毒素の修飾<br>標的細胞へ侵入する能力をもつ標的神経細胞に対して特異性のある活性もしくは不活性のクロストリジウム属細菌毒素を医薬または他の生物活性分子と結合               |
|                     | 直接送達方法開発      | 生体条件の利用<br>温度、pH、親水性等の利用 | 特許 3536106<br>92.04.24<br>A61K31/663<br>シェーリング                | 製剤及びその製造方法<br>有効成分としてジクロロメチレンビスホスホン酸の塩を含有する経口投与用の製剤                                                              |
|                     |               |                          | 特許 2917799<br>94.03.11<br>A61K45/00<br>田辺製薬                   | 消化管内適所放出型製剤<br>医薬活性成分を含有する内核、および（周囲に形成した腸溶性高分子からなる圧縮被覆層を有することを特徴とする経口用製剤                                         |
|                     | 直接送達方法開発      | マトリックスへ分散                | 特許 3054634<br>94.02.18<br>C12N15/09<br>ミシガン大学                 | 骨細胞を刺激するための方法および組成物<br>インサイチュで骨細胞中に核酸を導入するために骨前駆細胞を刺激する方法                                                        |
|                     |               |                          | 特許 3469926<br>93.11.04<br>A61K47/32<br>太田製薬                   | 大腸内放出型医薬製剤用粒状物<br>大腸において、薬物の効果を発揮させるために経口投与において投与時から大腸に至るまでの間の消化器内では放出されず、大腸に至ってはじめて放出が可能となるように設計した大腸放出型医薬製剤用粒状物 |
|                     |               | 担体の利用<br>コーティング          | 特許 2774080<br>(権利消滅)<br>94.03.23<br>A61K9/36<br>エフ ホフマン ラ ロシュ | 医薬組成物<br>腐食性ポリマー層の腐食後、標的部位、結腸に薬物を放出する                                                                            |
|                     |               |                          | 特許 3187502<br>92.01.09<br>A61K9/38<br>カネボウ                    | 腸溶性造粒物<br>造粒物が、胃では溶解せず、腸管内で溶解する。生理活性物質が、低 pH の胃液による影響を受けず、腸管内でその生理活性を発揮することができる。                                 |
|                     |               |                          | 特許 3202053<br>92.01.09<br>A61K9/42<br>カネボウ                    | 腸溶性造粒物<br>造粒物が、胃では溶解せず、腸管内で溶解する。生理活性物質が、低 pH の胃液による影響を受けず、腸管内でその生理活性を発揮することができる。                                 |
|                     |               |                          | 特許 2986217<br>94.06.21<br>A61K9/48<br>ダンバイオシスト ユー ケー          | 結腸用薬剤分配組成物<br>薬剤が結腸内でのみカプセルから放出されるように被覆が施されているデンプンカプセル                                                           |
|                     |               | 機械・器具の利用<br>装置の利用        | 特許 3145120<br>93.01.29<br>A61K47/02<br>エフ イー アール エックス         | 生物活性物質を運搬するための磁気応答組成物の製造方法<br>磁場の制御下、体内の治療ゾーンへ生物活性物質を運搬するもの                                                      |
|                     |               |                          | 特許 3176600<br>93.01.29<br>A61K47/02<br>エフ イー アール エックス         | 生物活性物質を運搬するための磁気応答組成物<br>磁気的に制御されるキャリア組成物得られた粒子は、粒子上に物質を吸収する                                                     |
|                     | がんの効発現        | 生体反応の利用<br>抗体の利用         | 特許 3095175<br>92.11.13<br>C07K16/46<br>アイデック PHARM            | B細胞リンパ腫の治療のためのヒトBリンパ球限定分化抗原に対するキメラ抗体と放射能標識抗体の療法利用<br>免疫学的に活性なマウス／ヒトキメラ抗CD20抗体または放射能標識抗CD20抗体を投与する                |

表 2.21 主要企業以外の技術要素別課題対応特許 (7/10)

| 技術要素<br>I<br>II                | 課題<br>I<br>II          | 解決手段 I<br>解決手段 II   | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]      | 発明の名称<br>概要                                                                                                             |
|--------------------------------|------------------------|---------------------|---------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 技術要素 I<br>能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術  | がんの治療<br>患者部での薬効発現     | 生体反応の利用<br>抗体の利用    | 特許 3490443<br>92.10.29<br>C07K16/28<br>オーストラリアン ナショナル大学 | 血管形成阻害性抗体<br>ヒト臍静脈内皮細胞およびヒト臍動脈内皮細胞などの増殖性／血管形成性ヒト内皮細胞に対して特異的なモノクローナル抗体を含む抗体は、血管形成の阻害または血管形成依存性疾患の治療に有用である                |
|                                |                        | 生体反応の利用<br>免疫反応の利用  | 特許 3541950<br>93.05.14<br>C12N5/06<br>ウイスター INST        | 癌およびウイルス性疾患を治療するための改変化 TALEN-104 細胞の使用<br>腫瘍細胞およびウイルス感染化細胞に対するインビトロおよびインビボでの二重活性を特徴とする改変化ヒト細胞障害性 T 細胞株                  |
|                                | がんの治療<br>患者部での薬効発現     | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利用 | 特許 2806634<br>92.06.16<br>A61K38/22<br>プロシオン バイオファルマ    | 前立腺癌、胃癌および乳癌に関連する腫瘍を抑制するための医薬製剤<br>前立腺、乳房もしくは胃腸管の腺癌における腫瘍の増殖を抑制する医薬組成物。制癌剤と、ヒト精漿インヒビンまたはデカペプチドを組み合わせて含む                 |
| 技術要素 II<br>能動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | 感染症の治療<br>患者部での薬効発現    | 生体反応の利用<br>遺伝子発現の利用 | 特許 3316216<br>95.01.13<br>C12N15/09<br>エール大学            | 安定化外部ガイド配列<br>特定の標的 RNA の切断を媒介する修飾された外部ガイド配列 (EGS) 分子                                                                   |
|                                | 自己免疫疾患の治療<br>患者部での薬効発現 |                     | 特許 3468773<br>94.07.15<br>C12N15/09<br>アイオワ大学           | 免疫調節オリゴヌクレオチド<br>免疫応答を刺激する能力に基づく治療に有用な非メチル化 CpG ジヌクレオチドを含むオリゴヌクレオチド                                                     |
|                                | その他の疾患の治療<br>患者部での薬効発現 | 生体条件の利用<br>酵素等の利用   | 特許 3492951<br>94.05.13<br>A61L24/00<br>クラレ              | 医療用高分子ゲル<br>酵素が産生される病巣部位においてのみ、治療に有効な量の薬剤を放出させることが可能な医療用高分子ゲル                                                           |
|                                |                        | 生体反応の利用<br>抗体の利用    | 特許 3436760<br>94.07.27<br>G01N33/543<br>ハーバート ピルグリム     | 超常磁性粒子<br>超常磁性 1 ドメイン粒子および超常磁性 1 ドメイン粒子の凝集物からなる超常磁性粒子。腫瘍を破壊するため、免疫増強に、磁気薬物標的などにつかうことができる                                |
|                                |                        |                     | 特許 3066983<br>95.01.18<br>C12N15/02<br>ロッシュ ディアグノスティクス  | 膜結合 CD30 抗原の蛋白質分解性開裂及び遊離を防ぐ抗 CD30 抗体<br>CD30 抗原に結合し、10%以下の量まで、ホジキン病細胞から sCD30 を遊離させ；B 細胞非ホジキン病リンパ腫に、または血漿細胞にほとんど結合しない抗体 |

表 2.21 主要企業以外の技術要素別課題対応特許 (8/10)

| 技術要素 I<br>技術要素 II   | 課題 I<br>課題 II            | 解決手段 I<br>解決手段 II  | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]                        | 発明の名称<br>概要                                                                                   |
|---------------------|--------------------------|--------------------|---------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------|
| 受動的標的化技術<br>薬剤標的化技術 | がんへの集積化                  | 担体の利用<br>リポソームの利用  | 特許 3270478<br>94. 06. 20<br>A61K9/127<br>イネックス PHARM                      | 強化されたドラッグ・デリバリーのためのスフィンゴソーム<br>スフィンゴミエリンとコレステロールから成るリポソーム。薬物保持、安定性をもつ                         |
|                     | その他の患部への集積化              | 生体適合性改良            | 特許 2545729<br>93. 05. 11<br>A61K47/48<br>産業技術総合研究所                        | メトトレキセート誘導体とピラン共重合体の高分子結合体及びその製造方法<br>低毒性でかつ抗癌効果に優れた新規メトトレキセート誘導体高分子結合体                       |
|                     |                          | 担体の利用<br>エマルジョンの利用 | 特許 3499604<br>94. 07. 25<br>A61K47/26<br>神奈川科学技術アカデミー                     | スフィンゴ糖脂質ミセルからなる薬物担体<br>ミセル状のスフィンゴ糖脂質からなる薬物担体及び該薬物担体を用いた医薬組成物。リポソームよりも容易に調製することができる            |
| 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 生体適合性改良                  |                    | 特許 2506543<br>92. 01. 22<br>A61K38/00<br>ベクトン ディッキンソン                     | イオントフォレーシスによる送達のための分子<br>静電荷またはマイナス 1 の電荷を有し、かつ約 4.0 より低いかまたは約 7.3 より高い等電点を有するようにアミノ酸集合体を修飾する |
|                     |                          |                    | 特許 2930421<br>(権利消滅)<br>94. 02. 28<br>A61K9/16<br>メディノバ メディカル<br>コンサルティング | 薬剤組成物、その製造方法及びその使用方法<br>血液-脳障壁または血液-神経障壁を透過して薬剤及び診断剤を配送する新規な方法                                |
|                     | 生体条件の利用<br>温度、pH、親水性等の利用 |                    | 特許 3549542<br>96. 03. 15<br>A61K38/23<br>ユニジェン LAB                        | 経口用ペプチド薬剤<br>経口投与されるべきペプチド活性剤のバイオアベイラビリティが、腸管内へのペプチドの目標とする放出を提供する医薬組成物により高められる                |
|                     | 生体反応の利用<br>受容体の利用        |                    | 特許 3516959<br>19951221<br>C07H19/06<br>アイ シー エヌ PHARM                     | 炭水化物複合生物活性化合物<br>グリコシド結合ではない結合を用いて、化学的リンカーを介して、生物活性化合物を炭水化物の部分と共有結合させることによる生物活性物質の細胞内取込みの増加方法 |
|                     | 生体反応の利用<br>膜透過機構の利用      |                    | 特許 2869396<br>92. 08. 21<br>A61K38/00<br>バイオジェン                           | T A T 由来の輸送ポリペプチド<br>カルボキシ末端カーゴ部分とアミノ末端輸送部分とからなる融合タンパク質                                       |
|                     | 促進剤の利用                   |                    | 特許 2847578<br>92. 12. 31<br>A61K31/54<br>スンキョン IND                        | 皮膚浸透力を高めた医薬組成物<br>ピロキシカムおよび浸透促進剤の浸透および溶解を著しく増加する吸収補助剤によって経皮吸収性を改良する                           |
|                     |                          |                    | 特許 3228341<br>95. 04. 26<br>A61K47/30<br>セラテック                            | 塩基性薬物を経皮的に送達するための透過増強剤としてのトリアセチン<br>トリアセチンから成る透過増強剤の有効量と、感圧接着剤を含むポリマー層とを含むマトリックスパッチ           |
|                     | 機械・器具の利用<br>装置の利用        |                    | 特許 2921987<br>93. 08. 27<br>A61K31/35<br>ジャンセン PHARM                      | 抗片頭痛薬のイオン電気導入式送達<br>ベンゾピランアルキルアミノアルキル置換グアニジンを片頭痛患者ヘイオン電気導入式送達する                               |

表 2.21 主要企業以外の技術要素別課題対応特許 (9/10)

| 技術要素Ⅰ<br>技術要素Ⅱ                | 課題Ⅰ<br>課題Ⅱ            | 解決手段Ⅰ<br>解決手段Ⅱ       | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]                                     | 発明の名称<br>概要                                                                                            |
|-------------------------------|-----------------------|----------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 薬剤吸入技術<br>薬剤吸収制御技術            | 吸収促進化                 | 機械・器具の利用<br>物理的刺激の利用 | 特許 3547453<br>95. 07. 28<br>A61M37/00<br>ザーズ、チャン ハオ                                   | 改善された非侵襲性の薬剤皮膚投与のための装置<br>改善された薬剤の皮膚透過のための装置、処方物製品および方法。不透過性の壁部によって分離される薄い薬剤処方物リザーバおよび熱発生チャンバを備える      |
|                               | 新規投与方法開発<br>経鼻投与方法開発  | 担体の利用<br>キャリアーの利用    | 特許 3533551<br>97. 02. 17<br>A61K31/445<br>東和薬品                                        | 水性点鼻剤<br>フマル酸ケチフェン含有の水性点鼻剤。増粘剤が配合されしかも安定性に問題がない                                                        |
|                               |                       | マトリックスへ分散            | 特許 3530532<br>95. 04. 07<br>A61K9/14<br>ペンウエスト PHARM                                  | 薬剤用放出制御吸入剤担体<br>薬剤と天然物起源の多糖ガムを含有する放出制御担体とを含有する粒子の凝集複合物を含有する放出制御粉末吸入剤                                   |
|                               | 新規投与方法開発<br>経粘膜投与方法開発 | マトリックスへ分散            | 特許 3143474<br>93. 09. 15<br>A61K31/57<br>コロムビア LAB バミューダ                              | 新規なプロゲステロン送達方法とその効果<br>架橋ポリカルボン酸ポリマーを用いてプロゲステロンを経腸送達することにより、子宮内膜癌の予防に比較的低レベルの血清中プロゲステロンを用いる            |
|                               | 新規投与方法開発<br>経皮投与方法開発  | 生体反応の利用<br>膜透過機構の利用  | 特許 3143885<br>97. 02. 13<br>A61K315/415<br>国立中国医薬研究所                                  | オキシカムの経皮吸収製剤<br>経皮ドラック・デリバリー・システムとして、対照薬物を持続的に放出し、表皮から毛細血管に吸収され、循環システムを通じて治療的に達し、治療目的を達成することができる経皮吸収製剤 |
|                               |                       | 促進剤の利用               | 特許 3527103<br>98. 06. 30<br>A61K31/519<br>祐徳薬品工業                                      | メトトレキサート経皮適用剤<br>経皮適用剤の基剤にメトトレキサートとともに有機アミンを配合することにより、これまで困難であったメトトレキサートの血中への送達を実現した                   |
| 薬剤吸入技術<br>遺伝子導入技術<br>薬剤吸収制御技術 | 吸収促進化                 | 生体適合性改良              | 特許 2918693<br>93. 11. 24<br>C07D23/364<br>メガバイオス                                      | 両親媒性イミダゾリニウム誘導体<br>宿主哺乳動物に対して無毒性のイミダゾリニウム環系含有両親媒性物質。巨大分子を細胞内に送達するための担体として有用なリポソームの製造に使用される             |
|                               |                       | 生体反応の利用<br>膜透過機構の利用  | 特許 2702285<br>92. 08. 21<br>C12N15/09<br>バイオジェン                                       | TAT由来の輸送ポリペプチド<br>カーゴ分子の HIF-1α タンパク質を含む遺伝子送達                                                          |
|                               |                       |                      | 特許 3415131<br>02. 06. 03<br>A61K31/282<br>メビオファーム                                     | リポソーム製剤<br>中性リン脂質を含むリポソームに銀杏葉抽出エキスを含有させた製剤                                                             |
|                               |                       | 促進剤の利用               | 特許 3411039<br>94. 03. 25<br>C12N15/09<br>アドバンスト リサーチ<br>アンド テクノロジー<br>INST、ノースウエスタン大学 | ウイルス仲介DNA導入の増強<br>細胞をフィブロネクチンまたはフィブロネクチンフラグメントの存在下で感染させ、レトロウイルスによる造血細胞その他の細胞の形質導入効率を増大させる              |
|                               |                       |                      | 特許 3499137<br>97. 07. 01<br>A61K48/00<br>トランスジーン                                      | 標的細胞へ治療学上活性な物質を輸送するのに有用な組成物及びその遺伝子治療における使用<br>ポリヌクレオチドを標的細胞の内部に転移させるための非プロトン性極性化合物                     |

表 2.21 主要企業以外の技術要素別課題対応特許 (10/10)

| 技術要素<br>I<br>II     | 課題<br>I<br>II | 解決手段 I<br>解決手段 II | 特許番号<br>(経過情報)<br>出願日<br>主 IPC<br>共同出願人<br>[被引用回数]    | 発明の名称<br>概要                                                                                                                    |
|---------------------|---------------|-------------------|-------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 薬剤吸収制御技術<br>遺伝子導入技術 | 吸収促進化         | 促進剤の利用            | 特許 3210019<br>92. 08. 28<br>C07C21/728<br>ライフ テクノロジー  | カチオン性脂質<br>高分子および他の化合物を細胞に送達するための脂質凝集物を作製するのに有用なカチオン性脂質。細胞の DNA 依存形質転換に特に有用である                                                 |
|                     |               |                   | 特許 3493608<br>01. 11. 28<br>C08G65/329<br>慶應義塾        | 医用高分子及びその用途<br>薬物送達システム用キャリアーとして利用可能な材料。分子量 1000~200000 の共重合体又はその塩                                                             |
|                     |               | 担体の利用<br>リポソームの利用 | 特許 2950520<br>93. 04. 02<br>A61K9/127<br>アンティキヤンサー    | 毛胞に有益な配合物を送達する方法<br>毛髪の胞細胞に有益な配合物を目標を定めて送達する方法。染髪料などをリポソーム中に包みこむ                                                               |
|                     |               |                   | 特許 3525393<br>96. 02. 13<br>C07C23/708<br>ソウロボイ アンドレイ | 脂質及び例えばリポソーム中でのその使用<br>細胞中の生物活性物質また分子の輸送に適する脂質。L-リシン<br>-bis-(0, 0'-cis-9-オクタデカノイル<br>-β-ヒドロキシエチル) アミド ジヒドロクロリドまたはその光学異性体の 1 つ |



## 2.22 公的研究機関・大学関係の特許番号一覧

### (1) 公的研究機関

表 2.22-1 に、ドラッグデリバリーシステムに関し、2 件以上出願した公的研究機関を示す。

表 2.22-1 公的研究機関からのドラッグデリバリーシステムに関する出願（1/3）

| 出願人（国名）（件数）                                | 技術要素Ⅰ<br>技術要素Ⅱ      | 特許番号           | 発明の名称                                             |
|--------------------------------------------|---------------------|----------------|---------------------------------------------------|
| 産業技術総合研究所（日本）<br>（11）                      | 薬剤放出技術<br>放出制御技術    | 特開 2002-226362 | リガンド応答性ゲル                                         |
|                                            |                     | 特開 2000-086729 | 上限溶液臨界温度を有する熱応答性高分子並びにそれを用いた刺激応答型分離材料及び薬剤放出カプセル   |
|                                            |                     | 特開 2002-060436 | コアセルベート形成能を持つ熱応答性高分子並びにそれを用いた、液液相分配法、固定化酵素及び薬物放出剤 |
|                                            |                     | 特開 2004-026636 | 徐放機能を有するメソポーラス無機材料                                |
|                                            | 薬剤放出技術<br>効果的放出技術   | 特許 3138733     | 安定化リポソーム及びその形成方法                                  |
|                                            |                     | 特開平 08-301791  | 機能性分子輸送体                                          |
|                                            |                     | 特開 2004-217739 | 水性ゲル構造体                                           |
|                                            | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特開 2003-226638 | 標的指向性リポソーム                                        |
|                                            |                     | 特開 2003-226647 | 腸管吸収制御性リポソーム                                      |
|                                            | 薬剤標的化技術<br>受動的標的化技術 | 特許 2545729     | メトトレキサート誘導体とピラン共重合体の高分子結合体及びその製造方法                |
|                                            | 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 特開 2003-040767 | リポソームおよびそれからなる細胞への物質導入担体                          |
| ルードビッヒ インスティテュート フォー キャンサー リサーチ（米国）<br>（9） | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表平 11-508767  | マウス腫瘍拒絶抗原前駆体 S M A G E - 3 をコードする単離核酸分子           |
|                                            |                     | 特表 2003-500072 | 癌関連薬剤およびその使用                                      |
|                                            |                     | 特表 2003-512057 | M A G E - A 1 2 抗原ペプチド及びその利用                      |
|                                            |                     | 特表 2003-527334 | A 3 3 抗原特異的免疫グロブリン産物を用いる A 3 3 抗原を発現する癌の影響を低減する方法 |
|                                            |                     | 特表 2003-527826 | 癌関連抗原およびその使用                                      |
|                                            |                     | 特表平 11-506904  | R A G E 腫瘍拒絶抗原                                    |
|                                            |                     | 特許 3541296     | 腫瘍血管内皮細胞に特異的に結合するモノクローナル抗体とその利用方法                 |
|                                            |                     | 特表平 10-506537  | M A G E - X p ファミリーのメンバーである単離核酸分子とその使用            |
|                                            |                     | 特表平 11-506435  | 腫瘍特異的抗体を利用する大腸ガンの治療方法                             |

表 2. 22-1 公的研究機関からのドラッグデリバリーシステムに関する出願 (2/3)

| 出願人 (国名) (件数)                                          | 技術要素 I<br>技術要素 II   | 特許番号           | 発明の名称                                                        |
|--------------------------------------------------------|---------------------|----------------|--------------------------------------------------------------|
| サントル ナショナル ド<br>ルシェルシュ シアンティフィ<br>ク (フランス)<br>(7)      | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表 2004-516848 | 細胞内化合物を標的とした修飾                                               |
|                                                        |                     | 特表 2002-543811 | ヒト腎細胞がんの細胞に対する<br>モノクローナル抗体                                  |
|                                                        |                     | 特表 2003-506335 | マンノースレセプターリガンド<br>を調製するためのキナ酸、シキミ<br>酸およびそれらの誘導体の使用          |
|                                                        | 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 特表 2004-526670 | 密着結合した上皮を介した担体<br>ベクター                                       |
|                                                        | 薬剤吸収制御技術<br>遺伝子導入技術 | 特表 2001-521747 | トランスフェクション用ペプチ<br>ドベクター、それを含む組成物、<br>及びそれらの適用方法              |
|                                                        |                     | 特表 2002-543810 | 外来性核酸を細胞に送達するた<br>めの核酸-抗体複合体                                 |
|                                                        |                     | 特表 2003-514912 | トランスフェクション薬剤とし<br>てのリン含有デンドリマー                               |
| アンスチチュ ナショナル ド<br>ラ サンテ エ ド ラ ルシ<br>エルシュ (フランス)<br>(5) | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表平 08-507757  | 腫瘍の治療並びにヒトと動物の<br>免疫化に使用する組成物                                |
|                                                        |                     | 特表平 08-509208  | 組み換えアデノウイルスおよび<br>眼疾患の治療のための遺伝子療<br>法におけるそれらの使用              |
|                                                        | 薬剤吸収制御技術<br>遺伝子導入技術 | 特表 2002-543097 | 肺動脈高血圧を治療するための<br>血管新生促進因子をコードする<br>核酸を含む組換え欠陥アデノウ<br>イルスの使用 |
|                                                        |                     | 特表平 10-503644  | 新規な内部リボソーム侵入部位、<br>これを含むベクター、および治療<br>への使用                   |
|                                                        |                     | 特表平 08-501686  | 中枢神経系、特に脳における細胞<br>への外来遺伝子の転移のための<br>アデノウイルスベクター             |
| スクリプス リサーチ インス<br>ティテュート (米国)<br>(5)                   | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表平 09-510455  | C型肝炎ウイルスに対して細胞<br>障害性Tリンパ球反応を誘発す<br>るペプチド                    |
|                                                        |                     | 特表 2000-506854 | 標的化治療剤または診断剤なら<br>びにその製造および使用方法                              |
|                                                        |                     | 特表 2004-502450 | ターゲッティング遺伝子送達<br>のための二官能性分子およびそれ<br>と複合化されたベクター              |
|                                                        | 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 特表 2003-518077 | 血管形成および血管透過性の調<br>節剤および阻害剤                                   |
|                                                        | 薬剤吸収制御技術<br>遺伝子導入技術 | 特表 2002-534130 | アデノウイルスベクター、パッケ<br>ージ細胞系、組成物および製法お<br>よび使用法                  |
| スローン ケタリング インス<br>ティテュート フォー<br>サー リサーチ (米国)<br>(5)    | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表 2002-501722 | 熱ショックタンパク質結合性コ<br>ンジュゲートペプチド                                 |
|                                                        |                     | 特表 2002-516297 | アルファ粒子放出構成物および<br>その使用方法                                     |
|                                                        |                     | 特表 2002-524081 | 前立腺-特異的膜抗原に特異的<br>な融合受容体およびその使用                              |
|                                                        |                     | 特表 2003-535913 | キレートアクチニウム-225<br>のリポソーム封入およびその使<br>用                        |
|                                                        |                     | 特表平 08-506005  | 前立腺に特異的な膜抗原                                                  |

表 2.22-1 公的研究機関からのドラッグデリバリーシステムに関する出願 (3/3)

| 出願人 (国名) (件数)                                            | 技術要素 I<br>技術要素 II   | 特許番号           | 発明の名称                                            |
|----------------------------------------------------------|---------------------|----------------|--------------------------------------------------|
| ドイチェス クレプスフォルシュ<br>ンクスツェントルム スチ<br>フトウ (ドイツ)<br>(5)      | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表 2004-513074 | 卵巣腫瘍および子宮内膜腫瘍に<br>対する L1 接着分子に基づく診<br>断および治療方法   |
|                                                          |                     | 特表平 10-505842  | 作用物質および外因性とはみな<br>されない天然蛋白質からなるコ<br>ンジュゲート       |
|                                                          | 薬剤標的化技術<br>受動的標的化技術 | 特表平 11-503433  | 炎症性、感染性及び／又は皮膚疾<br>患治療用コンジュゲート                   |
|                                                          |                     | 特表平 11-508565  | サツカリドコンジュゲート                                     |
|                                                          | 遺伝子導入技術             | 特表 2002-504318 | 糖結合薬物輸送体タンパク質                                    |
| フォルシュングスツェントルム<br>カールスルーエ (ドイツ)<br>(4)                   | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表 2002-506657 | 腫瘍疾患の治療及び免疫抑制の<br>ための薬剤の製法                       |
|                                                          |                     | 特表 2004-515221 | 転移性腫瘍細胞の同定方法                                     |
|                                                          |                     | 特許 3387929     | CD44v6 に対するモノクロ<br>ーナル抗体                         |
|                                                          |                     | 特表 2000-502067 | 扁平上皮細胞癌の診断および治<br>療法                             |
| マックス プランク ゲゼルシ<br>ャフト ツア フェルデルンク<br>デル ウィッセ (ドイツ)<br>(4) | 薬剤放出技術<br>効果的放出技術   | 特表 2001-515082 | リン脂質類似化合物                                        |
|                                                          | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表平 10-501402  | 肝臓特異的遺伝子治療のための<br>ベクター                           |
|                                                          |                     | 特表平 11-509412  | 肝臓特異的なアデノウイルス発<br>現ベクター                          |
|                                                          |                     | 特表平 07-509477  | 腫瘍診断または腫瘍治療のため<br>の新規プローブ                        |
| アンスティテュ パスツール<br>(フランス)<br>(3)                           | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表 2001-513335 | 細胞内の物質移送のための抗体<br>から誘導されたベクター                    |
|                                                          |                     | 特表 2004-508065 | CD11b 発現細胞に対する分子<br>送達用ベクター                      |
|                                                          | 薬剤放出技術<br>放出制御技術    | 特表平 08-508880  | 生体内に治療用化合物を発現・分<br>泌させるための生体適合移植片                |
| メディカル リサーチ カウン<br>シル (イギリス)<br>(3)                       | 薬剤放出技術<br>放出制御技術    | 特表平 08-508642  | HIV 及び細胞と関連する因子<br>により制御されるデリバリーシ<br>ステム         |
|                                                          | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表平 07-509237  | gp120 HIV エピトープを<br>模倣したペプチド                     |
|                                                          |                     | 特表 2004-518489 | 生物学的に活性な薬剤の送達                                    |
| コンセイユ ド ルシェルシュ<br>エ ダブリカシオン シャンテ<br>ィフィック (フランス)<br>(2)  | 薬剤放出技術<br>放出制御技術    | 特表 2002-521343 | 水溶性ペプチドのカプセル化                                    |
|                                                          |                     | 特許 3476775     | 生物分解性ポリエステルおよび<br>生物活性ポリペプチドのイオン<br>分子結合体        |
| ラ ホヤ キャンサー リサー<br>ファウンデーション (米国)<br>(2)                  | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特開 2003-155296 | インビボにおいて選択された器<br>官または組織に帰巢する分子お<br>よび同分子を同定する方法 |
|                                                          |                     | 特表平 10-502674  | インビボにおいて選択された器<br>官または組織に帰巢する分子お<br>よび同分子を同定する方法 |



## (2) 大学関係

表 2. 22-2 に、ドラッグデリバリーシステムに関し、2 件以上出願した大学関係を示す。

表 2. 22-2 大学関係からのドラッグデリバリーシステムに関する出願 (1/7)

| 出願人 (国名) (件数)                | 技術要素 I<br>技術要素 II   | 特許番号           | 発明の名称                                     |
|------------------------------|---------------------|----------------|-------------------------------------------|
| ミシガン大学 (米国)<br>(9)           | 薬剤放出技術<br>放出制御技術    | 特表平 07-509735  | 抗不整脈薬の放出制御用システム                           |
|                              |                     | 特表平 10-511957  | 表面改質ナノ微粒子並びにその製造及び使用方法                    |
|                              |                     | 特表 2001-524957 | 親油性画像診断剤用の血液プール運搬体                        |
|                              |                     | 特表 2002-527408 | ドラッグデリバリー用ヒドロゲル及び水溶性ポリマーキャリアー             |
|                              | 薬剤放出技術<br>効果的放出技術   | 特許 2948910     | 遺伝子治療のためのアデノウイルスベクター                      |
|                              | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表平 08-510761  | 生物活性及び/又はターゲッテッドデンドリマー複合体                 |
|                              |                     | 特表平 09-511240  | 動脈平滑筋細胞増殖の抑制                              |
|                              |                     | 特表平 08-509869  | 膵臓および胆管の上皮細胞への遺伝子導入                       |
|                              |                     | 特許 3054634     | 骨細胞を刺激するための方法および組成物                       |
| エール大学 (米国)<br>(7)            | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特許 3316216     | 安定化外部ガイド配列                                |
|                              |                     | 特表平 10-508181  | リボヌクレアーゼ P 標的化および切断配列を用いる RNA の標的化切断      |
|                              |                     | 特表平 11-507231  | アデノ関連ウイルスベクターの経口送達                        |
|                              |                     | 特表平 10-502051  | 薬物の標的化送達のためのヘムを有するマイクロパーティクル              |
|                              |                     | 特表 2001-510691 | 新規のエストロゲン受容体 $\beta$ およびそのイソ型タンパク質        |
|                              |                     | 特表 2002-500001 | 低下した毒性を有する遺伝子改変腫瘍標的化細菌                    |
|                              | 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 特表 2001-518295 | 真核細胞において膜タンパク質ディスプレイおよびタンパク質分泌を選択的に制御する方法 |
| ジョーンズ ホプキンス大学<br>(米国)<br>(7) | 薬剤放出技術<br>放出制御技術    | 特表平 10-505587  | 固形腫瘍を処置するための化学療法薬剤の制御された局所送達              |
|                              | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表平 11-505505  | ターゲッティングされた遺伝子輸送システム                      |
|                              |                     | 特表 2000-511410 | ナンセンス介在 RNA 崩壊の哺乳動物の調節因子                  |
|                              |                     | 特表平 08-508396  | 核マトリックスタンパク質                              |
|                              |                     | 特表平 11-508125  | 繊維芽細胞増殖因子相同因子-1 (FHF-1) および使用方法           |
|                              |                     | 特表 2004-524866 | 眼内薬剤送達装置                                  |
|                              | 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 特表 2002-506436 | 治療用ナノスフェア                                 |

表 2.22-2 大学関係からのドラッグデリバリーシステムに関する出願 (2/7)

| 出願人 (国名) (件数)         | 技術要素 I<br>技術要素 II   | 特許番号           | 発明の名称                                                    |
|-----------------------|---------------------|----------------|----------------------------------------------------------|
| ピッツバーグ大学 (米国)<br>(7)  | 薬剤放出技術<br>放出制御技術    | 特表平 08-508415  | 結合組織疾患の全身的遺伝子治療                                          |
|                       | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表平 09-508007  | 造血増進性細胞により発現された抗原に対するモノクローナル抗体                           |
|                       |                     | 特表 2003-527398 | 内皮特異性ターゲティング                                             |
|                       | 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 特表平 10-512882  | 安定な脂質含有薬剤送達複合体及びこれらの製造方法                                 |
|                       |                     | 特表平 11-512712  | 生物学的に活性な物質を細胞に送達するためのエマルジョンおよびミセル処方物                     |
|                       | 薬剤吸収制御技術<br>遺伝子導入技術 | 特表平 08-511507  | 哺乳動物宿主の結合組織を処置するための遺伝子導入                                 |
|                       |                     | 特表平 10-502526  | 分子トランスファー用 AAV キャプシド運搬体                                  |
| ジョージタウン大学 (米国)<br>(6) | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表平 10-506003  | プレイオトロフィンのアンチセンスオリゴヌクレオチド                                |
|                       |                     | 特表平 11-506931  | 腫瘍または細胞特異的な単純ヘルペスウイルスの複製                                 |
|                       |                     | 特表平 08-510714  | エプスタインバーウイルスからの免疫反応性ペプチド                                 |
|                       |                     | 特表 2001-513508 | 腫瘍治療を目的とするヘルペスベクターの使用                                    |
|                       |                     | 特表 2002-537318 | 全身性遺伝子送達のための抗体標的化フラグメントイムノリポソーム                          |
|                       | 薬剤標的化技術<br>受動的標的化技術 | 特表 2002-535290 | ターゲッティングした遺伝子移入のためのリガンド-PEG ポストコート安定化したリポプレックスおよびポリプレックス |
| バンダービルト大学 (米国)<br>(6) | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表平 08-505045  | tagA 遺伝子および消化性潰瘍形成素因の検出方法                                |
|                       |                     | 特表平 10-509864  | tagA 遺伝子、ならびに消化性潰瘍および胃ガンの形成素因の検出方法                       |
|                       |                     | 特表平 11-511032  | IceA 遺伝子および関連法                                           |
|                       | 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 特表 2003-514852 | 炎症反応を阻害する細胞透過性ペプチドおよび使用方法                                |
|                       | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表 2003-521523 | 病的脈管新生状態予防方法または減衰方法                                      |
|                       | 薬剤吸収制御技術<br>伝子導入技術  | 特表平 10-512255  | 粘膜免疫応答の誘導方法および組成物                                        |
| メリーランド大学 (米国)<br>(6)  | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表 2002-515455 | ワクチン送達系                                                  |
|                       | 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 特開 2003-155253 | 腸送達用経口投与組成物およびその使用方法                                     |
|                       |                     | 特表平 11-505844  | 腸送達用経口投与組成物およびその使用方法                                     |
|                       |                     | 特表 2001-524940 | 鼻送達のための投薬組成物およびその使用方法                                    |
|                       |                     | 特表 2001-527572 | 実質的に純粋なゾヌリン (zonulin)、哺乳動物密着結合の生理学的な調節因子                 |
|                       |                     | 特表 2003-530329 | 増大したバイオアベイラビリティを有する胆汁酸含有プロドラッグ                           |

表 2.22-2 大学関係からのドラッグデリバリーシステムに関する出願 (3/7)

| 出願人 (国名) (件数)                         | 技術要素 I<br>技術要素 II   | 特許番号           | 発明の名称                                                                       |
|---------------------------------------|---------------------|----------------|-----------------------------------------------------------------------------|
| ブラウン大学 リサーチ ファ<br>ウンデーション (米国)<br>(5) | 薬剤放出技術<br>放出制御技術    | 特表平 08-502949  | 生体接着性マイクロスフェア、なら<br>びに、薬物送達およびイメージ<br>ングシステムにおけるそれらの<br>使用                  |
|                                       |                     | 特表平 08-503472  | 微多孔性マクロカプセル                                                                 |
|                                       | 薬剤放出技術<br>効果的放出技術   | 特表平 11-510142  | 核酸負荷ポリマー微粒子を使用<br>した遺伝子治療法                                                  |
|                                       | 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 特表 2000-513355 | 有機賦型剤を使用する、ポリマー<br>の生体接着特性を増強するた<br>めの方法および組成物                              |
|                                       |                     | 特表 2000-504329 | ポリマーの生体接着特性を増強<br>するための方法および組成物                                             |
| ハーバード大学 (米国)<br>(5)                   | 薬剤放出技術<br>放出制御技術    | 特表 2002-541085 | 歯内治療用繊維およびその使用<br>方法                                                        |
|                                       | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表 2004-507236 | 骨粗鬆症の診断および治療に有<br>用な調節遺伝子および系                                               |
|                                       |                     | 特表 2003-512320 | 緩下剤製剤                                                                       |
|                                       | 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 特表 2000-503004 | 化合物を細胞に輸送するための<br>毒素ペプチドおよび／またはア<br>フィニティハンドルの使用                            |
|                                       |                     | 特表 2000-510461 | ターミナル補体成分を使用する<br>薬物送達                                                      |
| ベイラー大学 オブ メディシ<br>ン (米国)<br>(5)       | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表平 08-508166  | 広範囲腫瘍抑制遺伝子、遺伝子産<br>物および腫瘍抑制遺伝子治療                                            |
|                                       |                     | 特表平 09-504784  | 固型腫瘍、乳頭腫および疣贅の遺<br>伝子治療                                                     |
|                                       |                     | 特表 2003-512010 | 卵巣特異的遺伝子およびタンパ<br>ク質                                                        |
|                                       |                     | 特表平 09-502094  | 老化細胞由来 DNA 合成阻害因<br>子                                                       |
|                                       | 薬剤吸収制御技術<br>遺伝子導入技術 | 特表平 11-506722  | 細胞に核酸を送達するための核<br>酸運搬体                                                      |
| アイオワ大学 リサーチ ファ<br>ウンデーション (米国)<br>(5) | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表 2003-534787 | レンチウイルスベクターを使用<br>する神経細胞の形質導入の方法                                            |
|                                       |                     | 特許 3468773     | 免疫調節オリゴヌクレオチド                                                               |
|                                       |                     | 特表 2002-518041 | 抗癌細胞障害性リンパ細胞の再<br>ターゲッティングのための二重<br>特異性抗体およびそのためのハ<br>イブリドマおよびモノクロー<br>ナル抗体 |
|                                       | 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 特表平 11-511757  | 治療用分子を細胞内投与するた<br>めのカチオン両親媒性物質と補<br>助脂質とを含む組成物                              |
|                                       | 薬剤吸収制御技術<br>遺伝子導入技術 | 特開 2000-143548 | レトロウイルスの感染性を増大<br>させるための方法および組成物                                            |
| ブリティッシュ コロンビア大<br>学 (カナダ)<br>(5)      | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表平 10-505755  | 内在性ペプチドを有する MHC<br>クラス I 分子の発現を増強する<br>方法                                   |
|                                       |                     | 特表 2004-511572 | 標的化送達のための脂質製剤                                                               |
|                                       | 薬剤吸収制御技術<br>遺伝子導入技術 | 特表 2003-501111 | ウイルスベクターと荷電分子の<br>遺伝子治療への利用                                                 |
|                                       |                     | 特表 2002-501511 | 脂質小胞への荷電した治療剤の<br>高率封入                                                      |
|                                       |                     | 特表 2002-542341 | カチオン性 PEG 脂質および使<br>用方法                                                     |

表 2.22-2 大学関係からのドラッグデリバリーシステムに関する出願 (4/7)

| 出願人 (国名) (件数)                          | 技術要素 I<br>技術要素 II   | 特許番号                             | 発明の名称                                                                |
|----------------------------------------|---------------------|----------------------------------|----------------------------------------------------------------------|
| ペンシルバニア大学 (米国)<br>(5)                  | 薬剤放出技術<br>放出制御技術    | 特表平 09-505054                    | 均質なニューロン細胞移植片としての組成物とこれらの移植片の製造及び使用方法                                |
|                                        | 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 特表 2002-506046                   | 薬剤および遺伝子の細胞内送達および組織標的化の促進                                            |
|                                        | 薬剤吸収制御技術<br>遺伝子導入技術 | 特表平 10-507928                    | ハイブリッドアデノウイルス-AAVウイルスおよびその使用方法                                       |
|                                        |                     | 特表平 11-507240                    | 組み換えアデノウイルス及びアデノ随伴ウイルス、細胞株、並びに生産方法並びにその使用                            |
|                                        |                     | 特表 2003-523320                   | ウイルスベクターの迅速なPEG改変方法、高められた遺伝子形質導入のための組成物、高められた物理的安定性を伴う組成物、およびそのための用途 |
| コロムビア大学 (米国)<br>(4)                    | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表平 11-510490                    | ルイスYエпитーポの複合糖質の合成及びこれらの使用                                           |
|                                        |                     | 特表平 10-508461                    | 独特の関連したカボシ肉腫ウイルス配列およびその使用                                            |
|                                        |                     | 特表 2003-532378                   | リンパ腫/黒色腫の発症に関与する新規Fc受容体型黒色腫をコードする5つの新規遺伝子の単離                         |
|                                        |                     | 特表 2004-518630                   | 新規腫瘍関連マーカー                                                           |
| ロンドン大学 スクール オブ<br>ファーマシー (イギリス)<br>(4) | 薬剤放出技術<br>効果的放出技術   | 特表 2002-534455                   | 疎水性物質及び水感受性物質のための球状化自己乳化系                                            |
|                                        | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表 2004-522781                   | 腫瘍処置のためのプロドラッグとしてのインドリンおよびテトラヒドロキノリン                                 |
|                                        | 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 特表 2004-517834<br>特表 2002-526456 | 粒子吸入キャリア<br>カチオン性化合物およびマクロ分子担体としてのそれらの使用                             |
| トーマス ジェファーソン大学<br>(米国)<br>(4)          | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表平 08-505397                    | 平滑筋細胞の増殖を調節するためのc-mycのアンチセンス阻害                                       |
|                                        |                     | 特表平 09-500902                    | 細胞内免疫感作                                                              |
|                                        |                     | 特表平 10-509878                    | 突然変異上皮成長因子受容体を標的とする試薬および方法                                           |
|                                        |                     | 特表平 09-506340                    | 結腸直腸癌細胞に特異的に結合する組成物およびその使用方法                                         |
| ネブラスカ大学 (米国)<br>(4)                    | 薬剤放出技術<br>放出制御技術    | 特表平 10-501814                    | 生物的作用物質用のイン・シツゲル形成デリバリービヒクルおよびその使用方法                                 |
|                                        | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表 2002-520298                   | 標的化部位特異的薬物送達組成物および使用方法                                               |
|                                        |                     | 特表 2000-507931                   | 標的された部位特異的薬物送達組成物およびその使用                                             |
|                                        |                     | 特表 2000-515499                   | 生物学的薬剤の体内分布を改変させるための組成物および方法                                         |
| ノースカロライナ大学 アト<br>チャペルビル (米国)<br>(4)    | 薬剤放出技術<br>放出制御技術    | 特表 2004-501113                   | 組み換えパルボウイルスベクターの制御放出のための方法および配合物                                     |
|                                        | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表 2004-521074                   | 血小板の凝集を抑制する組成物と方法                                                    |
|                                        | 薬剤吸収制御技術<br>遺伝子導入技術 | 特表 2002-533110                   | Gタンパク質共役レセプターを使用した目的とする遺伝子の導入                                        |
|                                        |                     | 特表 2002-538770                   | ウイルスベクターとその製造及び投与の方法                                                 |

表 2.22-2 大学関係からのドラッグデリバリーシステムに関する出願 (5/7)

| 出願人 (国名) (件数)                                         | 技術要素 I<br>技術要素 II   | 特許番号           | 発明の名称                                                            |
|-------------------------------------------------------|---------------------|----------------|------------------------------------------------------------------|
| ユニバーシティ オブ メディシン アンド デンティストリー オブ ニュージャージー (米国)<br>(4) | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表平 10-501403  | 抗体-エンベロープ融合タンパク質および野生型エンベロープ融合タンパク質を含むレトロウイルスベクターを用いる細胞型特異的遺伝子移入 |
|                                                       |                     | 特表平 08-504098  | 抗体-エンベロープ融合蛋白を含有するレトロウイルスベクターを用いた細胞種特異的な遺伝子転移                    |
|                                                       | 薬剤標的化技術<br>受動的標的化技術 | 特表 2002-506833 | 治療薬の <i>in vivo</i> デリバリー用担体                                     |
|                                                       | 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 特表平 11-500443  | コクリエート送達ビヒクル                                                     |
| ユニバーシティ オブ ワシントン (米国)<br>(4)                          | 薬剤放出技術<br>放出制御技術    | 特表平 10-510815  | 肝臓の持続的な再生および C 型肝炎の処置のための組換えベクター                                 |
|                                                       |                     | 特開平 09-286921  | 疎水性基で修飾された生物学的接着性を有する高分子電解質およびそれに関連する方法                          |
|                                                       | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表平 10-509732  | 水溶性ユビキノン組成物、プロドラッグおよびこれに関連した方法                                   |
|                                                       | 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 特表 2002-500201 | 膜破壊剤を使用する増強された輸送                                                 |
| リーランド スタンフォードジュニア大学 (米国)<br>(4)                       | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表平 09-502981  | 自己免疫疾患における T 細胞レセプターと抗原の相互作用                                     |
|                                                       |                     | 特表平 09-504693  | 活性化された T 細胞の表面上のレセプター: A C T-4                                   |
|                                                       |                     | 特表平 09-509826  | 活性化 C D 4 上 T 細胞の表層上のレセプターに対するリガンド (A C T-4-L)                   |
|                                                       |                     | 特表 2003-525913 | 活性薬剤を宿主の間質空間に局所投与する方法およびキット                                      |
| オレゴン ヘルス サイエンスズ大学 (米国)<br>(3)                         | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表平 11-514009  | 軟膏において用いるための、生物学的に活性の成分との共有結合極性脂質結合体                             |
|                                                       |                     | 特表 2002-502822 | 骨芽細胞の前駆細胞による骨欠損の治療                                               |
|                                                       | 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 特表 2002-514188 | 標的とする共有結合極性脂質複合体                                                 |
| カリフォルニア工科大学 (米国)<br>(3)                               | 薬剤放出技術<br>放出制御技術    | 特表 2004-523502 | 包接複合体を含有する組成物                                                    |
|                                                       | 薬剤放出技術<br>効果的放出技術   | 特表 2002-531530 | 治療用薬剤を含む超分子錯体                                                    |
|                                                       | 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 特表平 10-508302  | 細胞特異的遺伝子供給ビヒクル                                                   |
| ケース ウェスタン リザーブ大学 (米国)<br>(3)                          | 薬剤放出技術<br>放出制御技術    | 特表平 08-510930  | 生理活性物質を連続的に適用するための包帯                                             |
|                                                       | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表 2003-505518 | セルピン酵素複合体受容体を介する増強された送達                                          |
|                                                       |                     | 特表 2003-522117 | 治療薬の送達のための二機能性分子                                                 |
| テンプル大学 (米国)<br>(3)                                    | 薬剤放出技術<br>放出制御技術    | 特表 2003-526598 | 制御された薬物放出のためのモノリシック錠剤                                            |
|                                                       | 薬剤放出技術<br>効果的放出技術   | 特表平 10-500889  | 水性溶媒封入法、装置およびマイクロカプセル                                            |
|                                                       | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表平 11-502817  | 所定のペプチド特異性のマイクロカプセル、それらの調製および使用                                  |



表 2.22-2 大学関係からのドラッグデリバリーシステムに関する出願 (6/7)

| 出願人 (国名) (件数)                      | 技術要素Ⅰ<br>技術要素Ⅱ      | 特許番号           | 発明の名称                                              |
|------------------------------------|---------------------|----------------|----------------------------------------------------|
| ベン グリオン大学 (イスラエル)<br>(3)           | 薬剤放出技術<br>放出制御技術    | 特表平 11-501306  | 可溶性レセプターの制御された放出のための医薬組成物                          |
|                                    |                     | 特表 2002-518315 | 多孔性マトリックスに基づく活性成分送達システムとデバイス                       |
|                                    | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表 2002-529083 | アンチセンスオリゴマー                                        |
| イリノイ大学 (米国)<br>(3)                 | 薬剤放出技術<br>放出制御技術    | 特表平 09-501932  | ヒト・骨形態形成蛋白を用いる神経再生                                 |
|                                    | 薬剤放出技術<br>効果的放出技術   | 特表 2003-535149 | 巨大分子薬物複合体およびそれを含有する組成物                             |
|                                    | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表平 07-507202  | ヒトMDR1マルチドラッグ耐性遺伝子産物に対するモノクローナル抗体およびその使用           |
| コネチカット大学 (米国)<br>(3)               | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表平 08-508645  | アンチセンスポリリボヌクレオチドをコードする遺伝子の標的を定めた送達                 |
|                                    |                     | 特表平 10-504709  | ポリヌクレオチドの細胞への標的を定めた送達を増大させるための細菌成分の利用              |
|                                    |                     | 特表 2004-514113 | 熱ショックタンパク質受容体としての $\alpha$ (2) マクログロブリン受容体およびその使用  |
| 南カリフォルニア大学 (米国)<br>(3)             | 薬剤放出技術<br>放出制御技術    | 特表平 11-507038  | 5-リボキシゲナーゼ阻害剤を用いる、術後癒着形成を低減又は阻止する方法                |
|                                    |                     | 特表平 11-500108  | 親水性分子の脂質化のための方法および組成物                              |
|                                    | 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 特表 2002-531543 | 可逆性水性pH感受性脂質化剤、組成物および使用方法                          |
| ユタ大学 (米国)<br>(3)                   | 薬剤放出技術<br>放出制御技術    | 特表 2001-501596 | バイオコンジュゲートおよび生物学的活性剤の送達                            |
|                                    |                     | 特表 2001-517603 | 薬物送達における使用のための注射可能な生分解性ブロックコポリマーゲル                 |
|                                    | 薬剤標的化技術<br>受動的標的化技術 | 特表 2000-500120 | ポリ (エチレングリコール) と抗グルタミン酸デカルボキシル化抗体の結合体の膵島細胞指向ターゲット化 |
| ピエール エ マリー キュリー大学 パリ (フランス)<br>(3) | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表平 08-506722  | 腫瘍を治療するためのレトロウイルスベクターおよびそれらを含む細胞系統                 |
|                                    |                     | 特表平 10-506007  | 機能修飾されたHSV1-TK                                     |
|                                    | 薬剤吸収制御技術<br>遺伝子導入技術 | 特表平 09-509060  | 遺伝子治療に使用できる宿主-ベクター系                                |
| ニュージャージー州立大学 ラトガーズ (米国)<br>(3)     | 薬剤放出技術<br>放出制御技術    | 特表 2000-501139 | チロシンベースのポリカーボネートとポリ (酸化アルキレン) とのコポリマー              |
|                                    |                     | 特表 2003-511550 | 生物学的に活性な分解産物を有するポリ酸無水物                             |
|                                    | 薬剤放出技術<br>効果的放出技術   | 特表 2001-522909 | 厳密な交互配置を有するポリ (アルキレンオキサライドエーテル) 共重合体               |
| ワシントン ユニバーシティ (米国)<br>(3)          | 薬剤放出技術<br>放出制御技術    | 特表平 08-500033  | 生細胞移植のためのポーチの使用                                    |
|                                    | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表 2002-505077 | 抗病原体システムおよびその使用方法                                  |
|                                    |                     | 特表 2002-518521 | 医用画像解析、診断および治療のための膜透過性ペプチド錯体                       |
| デ モントフォート大学 (イギリス)<br>(2)          | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表平 09-501416  | 薬物システム                                             |
|                                    |                     | 特表 2003-525851 | ヒドロキシル化により活性化された薬剤遊離                               |

表 2.22-2 大学関係からのドラッグデリバリーシステムに関する出願 (7/7)

| 出願人 (国名) (件数)                             | 技術要素Ⅰ<br>技術要素Ⅱ      | 特許番号           | 発明の名称                                       |
|-------------------------------------------|---------------------|----------------|---------------------------------------------|
| ボストン大学 (米国)<br>(2)                        | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表平 11-506755  | 局所適用DNA断片の使用                                |
|                                           | 薬剤吸収制御技術<br>遺伝子導入技術 | 特表平 09-512270  | 細胞形質転換のための組成物および方法                          |
| ニューヨーク大学 (米国)<br>(2)                      | 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 特表 2000-502885 | ストレプトアビジーン-プロテインA融合タンパク質を用いた高効率の組織特異的化合物送達系 |
|                                           | 薬剤吸収制御技術<br>遺伝子導入技術 | 特表平 07-509599  | キメラ受容体ポリペプチド、ヒトH13タンパク質、ならびにその使用            |
| ピクトリア 大学 オブ マン<br>チェスター (イギリス)<br>(2)     | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表 2001-520185 | 粒子                                          |
|                                           |                     | 特表 2002-523382 | 薬物ターゲティング                                   |
| レイクスユニベルシテート テ<br>フロニンゲン (オランダ)<br>(2)    | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表 2002-532384 | 星状細胞のためのペプチドを基剤としたキャリアーデバイス                 |
|                                           |                     | 特表平 07-507272  | 部位特異性デリバリー機能を有する医薬組成物                       |
| アクロン大学 (米国)<br>(2)                        | 薬剤放出技術<br>放出制御技術    | 特表平 11-503456  | 多糖結合ニトリックオキサイド-求核剤付加物                       |
|                                           | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表 2001-527077 | 薬理剤の生物学的に適合する担体としての金属コリノイド                  |
| ケンタッキー リサーチ ファ<br>ウンデーション (米国)<br>(2)     | 薬剤放出技術<br>放出制御技術    | 特表平 09-509151  | 制御されたドラッグデリバリーの方法としてのコドラッグ                  |
|                                           | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表平 11-500607  | マウスモノクローナル抗イデオタイプ抗体3H1                      |
| 南フロリダ大学 (米国)<br>(2)                       | 薬剤放出技術<br>放出制御技術    | 特表平 11-509170  | 細胞移植用の移植促進剤としてのセルトリー細胞                      |
|                                           | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表平 10-506879  | 錠と鍵のミセル                                     |
| シンシナティ大学 (米国)<br>(2)                      | 薬剤放出技術<br>能動的標的化技術  | 特表 2004-504264 | TH1又はTH2リンパ球に制御される免疫応答の選択的活性化               |
|                                           | 薬剤標的化技術<br>薬剤導入技術   | 特開平 07-010771  | 経口投与可能な治療用組成物                               |
| バージニア大学 (米国)<br>(2)                       | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表 2002-524533 | 癌細胞に診断薬及び治療薬をデリバリーするためのC3b(i)に対する抗体         |
|                                           |                     | 特表 2003-527128 | 治療のためのオステオカルシンプロモーター指令型アデノウイルスの複製           |
| フロリダ大学 (米国)<br>(2)                        | 薬剤放出技術<br>放出制御技術    | 特表 2003-516926 | コーティングされた薬物粒子及びその薬学的製剤を調製するための方法            |
|                                           | 薬剤放出技術<br>効果的放出技術   | 特表 2004-505033 | 薬物を可溶化するための新規なマイクロエマルジョンおよびミセルシステム          |
| リーズ大学 (イギリス)<br>(2)                       | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表 2002-541064 | 改変されたカリシン                                   |
|                                           |                     | 特表 2004-506439 | カリシン                                        |
| モントリオール大学 (カナダ)<br>(2)                    | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表平 10-506008  | HIV-1Vpr融合分子に基づいたHIVビリオン中へのタンパク質ターゲティング     |
|                                           | 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  | 特表平 10-511363  | 低剛性リポソーム抗菌組成物                               |
| ニューヨーク州立大学 リサ<br>ーチ ファウンデーション (米国)<br>(2) | 薬剤放出技術<br>放出制御技術    | 特表 2004-505675 | 脳障害治療用の複合型神経プロテアーゼ                          |
|                                           | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表 2004-500116 | 癌浸潤及び血管形成の阻害のための組成物及び方法                     |
| 京都大学総長 (日本)<br>(2)                        | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 | 特表 2003-516731 | ヒトFGF-21遺伝子および遺伝子発現産物                       |
|                                           | 薬剤吸収制御技術<br>遺伝子導入技術 | 特開 2004-049227 | 霊長類胎仔への遺伝子導入方法及びそのための複合体                    |

### **3．主要企業の技術開発拠点**

3.1 ドラッグデリバリーシステムの技術開発拠点

3.2 技術要素別の技術開発拠点



### 3. 主要企業の技術開発拠点

ドラッグデリバリーシステムの技術開発拠点は、北海道から関東、近畿、中国、四国、九州と全国に広がっている。また、海外の企業による海外の技術開発拠点多い。

本章では、1992 年 1 月～2002 年 12 月までに出版されたドラッグデリバリーシステムの特許 2,253 件について、上位出願人を抽出して、公報に記載されている発明者名と住所・居所を整理して、出願人別の技術開発拠点を地図上に紹介した。

また、技術要素ごとに上位出願人を抽出して、同じく出願人別の技術開発拠点を地図上に紹介した。

技術導入や売り込み先のアクセス情報の参考に資することを目的として、主要企業 20 社の技術開発拠点を特許明細書に記された発明者の住所から調査した。

### 3.1 ドラッグデリバリーシステムの技術開発拠点

ドラッグデリバリーシステムの研究開発は、大手製薬会社やベンチャー企業などによって行われているほか、大学や公的研究機関によって行われていることが特徴であり、開発拠点は米国、欧州をはじめとして世界に広がっている。

図 3.1 ドラッグデリバリーシステムの技術開発拠点

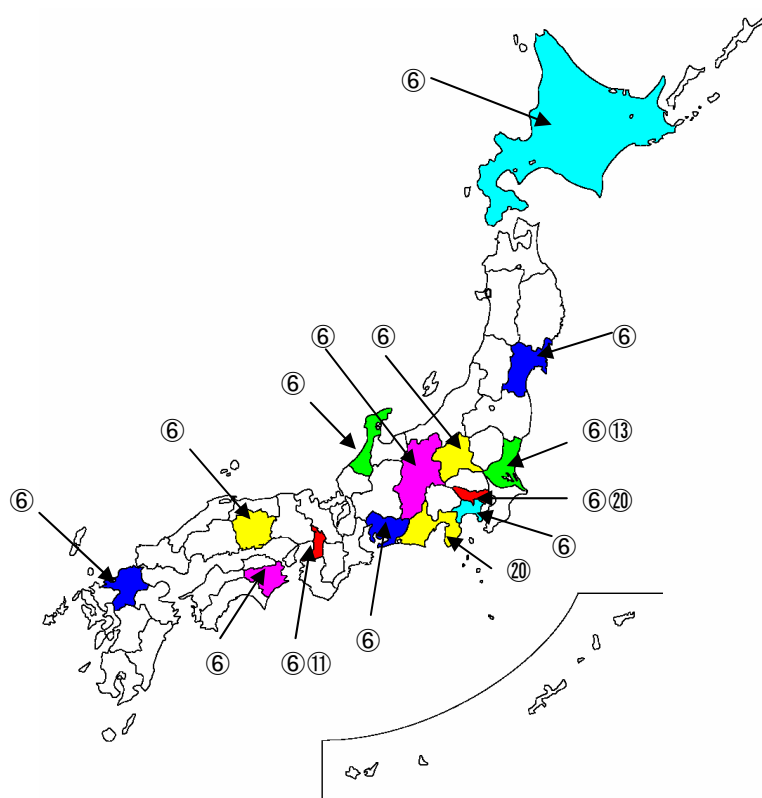
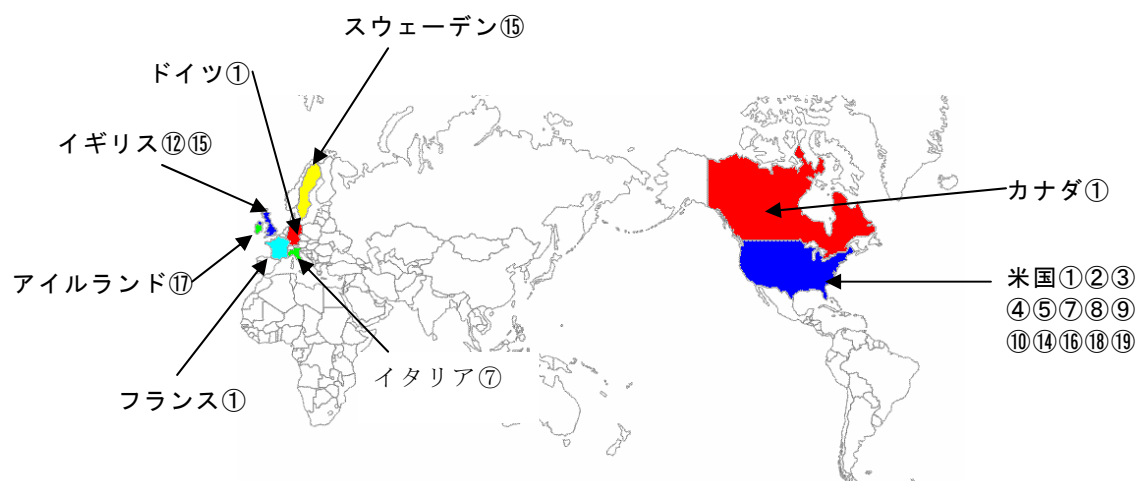


表 3.1 ドラッグデリバリーシステムの技術開発拠点一覧

| No. | 出願人名                                | 出<br>願<br>件<br>数 | 住所            |                                    |
|-----|-------------------------------------|------------------|---------------|------------------------------------|
|     |                                     |                  | 都道府県<br>または国名 | 所在地・事業所名                           |
| ①   | サノフィ・アベンティス<br>(フランス)               | 50               | フランス          | パリ市                                |
|     |                                     |                  | ドイツ           | マールブルグ市                            |
|     |                                     |                  | カナダ           | オンタリオ州                             |
|     |                                     |                  | 米国            | ニュージャージー州                          |
| ②   | ジョンソンアンドソン<br>(米国)                  | 36               | 米国            | カリフォルニア州                           |
| ③   | カリフォルニア大学 (米<br>国)                  | 28               | 米国            | カリフォルニア州                           |
| ④   | ジェネンテック (米国)                        | 26               | 米国            | カリフォルニア州                           |
| ⑤   | ファイザー (米国)                          | 25               | 米国            | コネチカット州                            |
| ⑥   | 科学技術振興機構                            | 23               | 北海道           | 札幌市                                |
|     |                                     |                  | 宮城県           | 仙台市                                |
|     |                                     |                  | 長野県           | 松本市                                |
|     |                                     |                  | 群馬県           | 前橋市                                |
|     |                                     |                  | 茨城県           | 牛久市                                |
|     |                                     |                  | 東京都           | 新宿区                                |
|     |                                     |                  | 神奈川県          | 川崎市                                |
|     |                                     |                  | 石川県           | 金沢市                                |
|     |                                     |                  | 愛知県           | 名古屋市                               |
|     |                                     |                  | 大阪府           | 吹田市                                |
|     |                                     |                  | 岡山県           | 岡山市                                |
|     |                                     |                  | 徳島県           | 徳島市                                |
|     |                                     |                  | 福岡県           | 福岡市                                |
| ⑦   | カイロン (米国)                           | 21               | 米国            | カリフォルニア州                           |
|     |                                     |                  | イタリア          | シエナ                                |
| ⑧   | ブリストルマイヤーズス<br>クイブ (米国)             | 20               | 米国            | ニュージャージー州                          |
| ⑨   | アメリカ合衆国 (米国)                        | 20               | 米国            | メリーランド州                            |
| ⑩   | テキサス大学 (米国)                         | 19               | 米国            | テキサス州                              |
| ⑪   | 武田薬品工業                              | 18               | 大阪府           | 大阪市淀川区十三本町二丁目17番85号 大<br>阪工場地区研究部門 |
| ⑫   | ウエスト ファーマ<br>シューティカル サービ<br>シズ (米国) | 17               | イギリス          | ノッチンガム                             |
| ⑬   | 久光製薬                                | 17               | 茨城県           | つくば市観音台1-25-15 久光製薬株式<br>会社筑波研究所   |
| ⑭   | メルク (米国)                            | 16               | 米国            | ニュージャージー州                          |
| ⑮   | アストラゼネカ (イギリ<br>ス)                  | 16               | イギリス          | ミアサイド                              |
|     |                                     |                  | スウェーデン        | メルンダール                             |
| ⑯   | イミュノメディックス<br>(米国)                  | 15               | 米国            | ニュージャージー州                          |
| ⑰   | エラン                                 | 15               | アイルランド        | ダブリン市                              |
| ⑱   | マサチューセッツ工科大<br>学 (米国)               | 15               | 米国            | マサチューセッツ州                          |
| ⑲   | エミスフェア・テクノロ<br>ジーズ (米国)             | 14               | 米国            | ニューヨーク州                            |
| ⑳   | 協和醗酵工業                              | 14               | 東京都           | 町田市旭町3-6-6協和醗酵工業株式会社 東<br>京研究所     |
|     |                                     |                  | 静岡県           | 駿東郡長泉町下土狩1188協和醗酵工業株式<br>会社医薬総合研究所 |

## 3.2 技術要素別の技術開発拠点

### (1) 薬剤放出技術

#### ①放出制御技術

薬剤放出技術の中の放出制御技術に関する技術開発拠点を図 3.2-1 に示す。また、放出制御技術に関する技術開発拠点の一覧表を表 3.2-1 に示す。

技術開発拠点は関東地方、東海地方、北陸地方、近畿地方、山陽地方、九州地方と広がっている。また、海外の技術開発拠が多い。

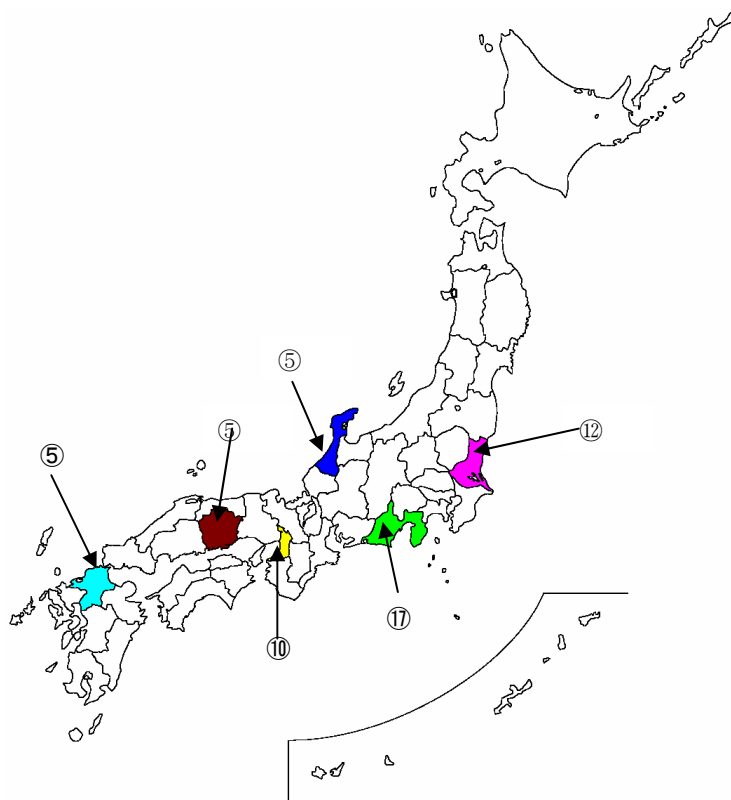
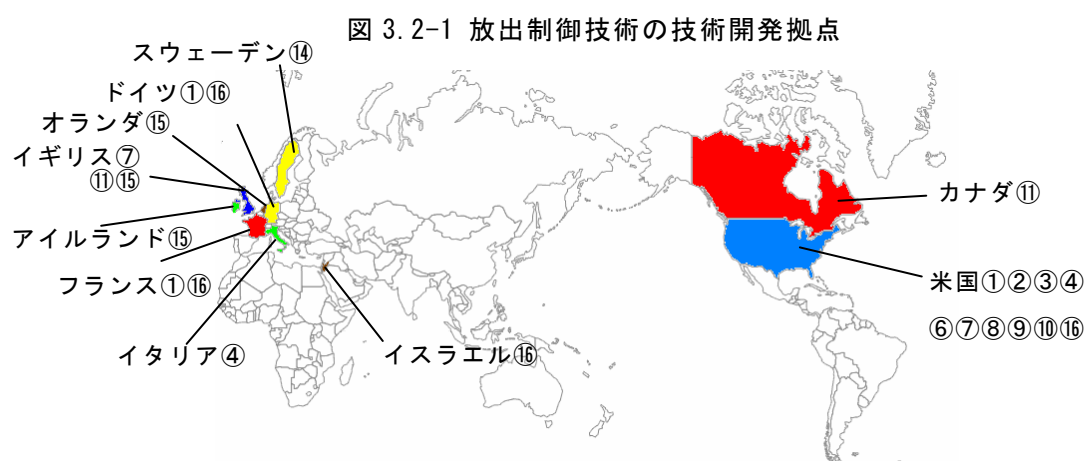


表 3. 2-1 放出制御技術の技術開発拠点一覧表

| No. | 出願人                            | 都道府県<br>または国名 | 所在地・事業所名                            |
|-----|--------------------------------|---------------|-------------------------------------|
| ①   | サノフィ・アベンティス（フランス）              | 米国            | ニュージャージー州                           |
|     |                                | ドイツ           | マールブルグ市                             |
|     |                                | フランス          | パリ市                                 |
| ②   | ジョンソンアンドジョンソン（米国）              | 米国            | ニュージャージー州                           |
| ③   | ジェネンテック（米国）                    | 米国            | カリフォルニア州                            |
| ④   | ファイザー（米国）                      | 米国            | コネチカット州                             |
|     |                                | イタリア          | ミラノ                                 |
| ⑤   | 科学技術振興機構                       | 石川県           | 能美郡                                 |
|     |                                | 岡山県           | 岡山市                                 |
|     |                                | 福岡県           | 福岡市                                 |
| ⑥   | カイロン（米国）                       | 米国            | カリフォルニア州                            |
| ⑦   | ブリストルマイヤーズスクイブ（米国）             | 米国            | ニュージャージー州                           |
|     |                                | イギリス          | オックスフォード                            |
| ⑧   | アメリカ合衆国（米国）                    | 米国            | メリーランド州                             |
| ⑨   | テキサス大学（米国）                     | 米国            | テキサス州                               |
| ⑩   | 武田薬品                           | 大阪府           | 大阪市淀川区十三本町二丁目 17 番 85 号 大阪工場地区研究部門  |
| ⑪   | ウエスト ファーマシューティカルム<br>サービスズ（米国） | カナダ           | ケベック州                               |
|     |                                | イギリス          | ノッティングム                             |
| ⑫   | 久光製薬                           | 茨城県           | つくば市観音台 1-25-15<br>久光製薬株式会社筑波研究所    |
| ⑬   | メルク（米国）                        | 米国            | ニュージャージー州                           |
| ⑭   | アストラゼネカ（イギリス）                  | スウェーデン        | メルンダール                              |
| ⑮   | エラン（アイルランド）                    | イギリス          | ケンブリッジ                              |
|     |                                | オランダ          | グロニンゲン                              |
|     |                                | アイルランド        | ダブリン市                               |
| ⑯   | マサチューセッツ工科大学（米国）               | 米国            | マサチューセッツ州                           |
|     |                                | ドイツ           | アーランゲン                              |
|     |                                | フランス          | ナンシー                                |
|     |                                | イスラエル         | エフラット                               |
| ⑰   | 協和醗酵工業                         | 静岡県           | 駿東郡長泉町下土狩 1188<br>協和醗酵工業株式会社医薬総合研究所 |

## ② 効果的放出技術

薬剤放出技術の中の効果的放出技術に関する技術開発拠点を図 3.2-2 に、また、一覧表を表 3.2-2 に示す。

技術開発拠点は東北地方、関東地方、近畿地方にある。また、海外の技術開発拠点多い。

図 3.2-2 効果的放出技術の技術開発拠点

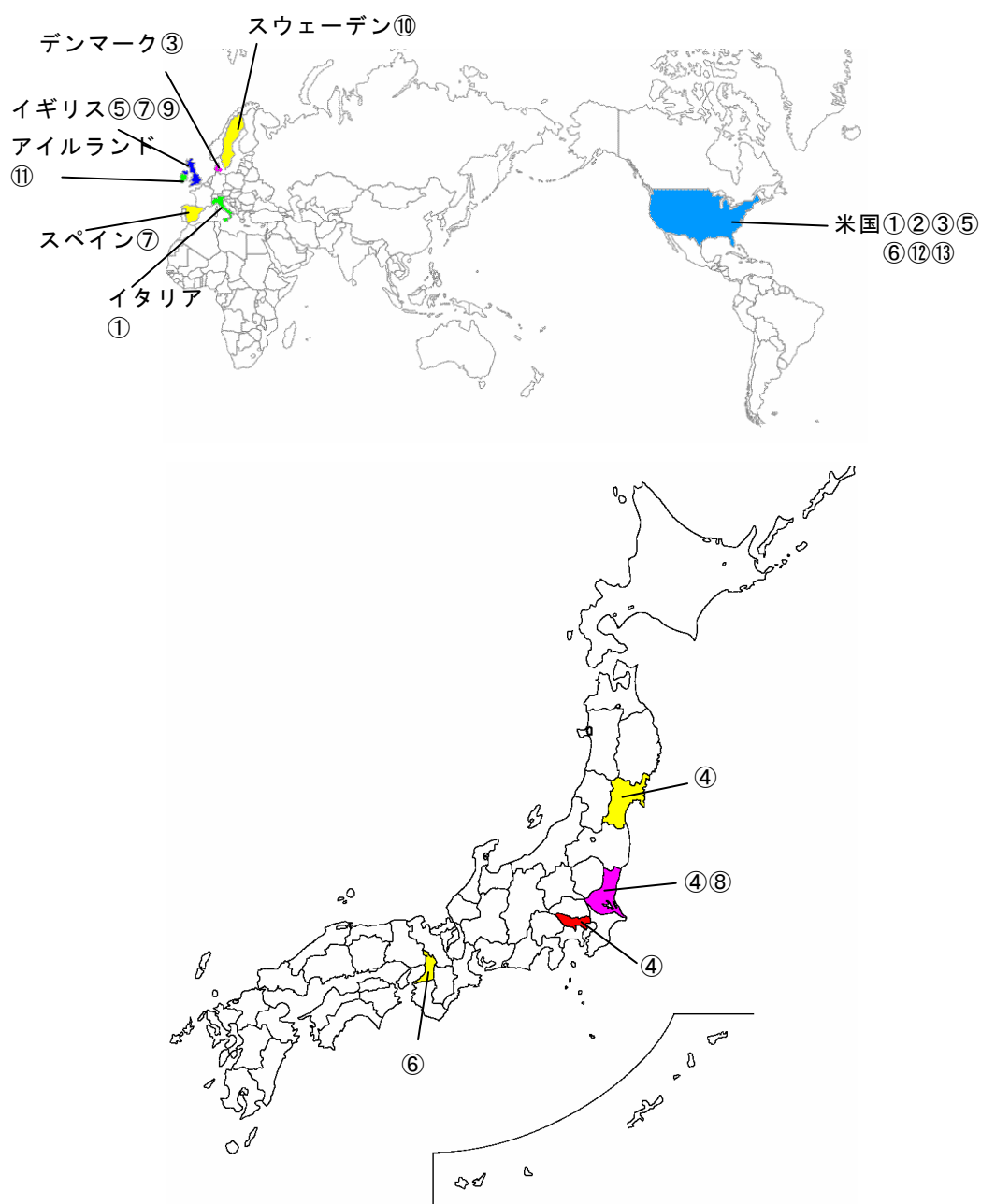


表 3.2-2 効果的放出技術の技術開発拠点一覧表

| No. | 出願人                            | 都道府県<br>または国名 | 所在地・事業所名                           |
|-----|--------------------------------|---------------|------------------------------------|
| ①   | ジョンソンアンドジョンソン（米国）              | 米国            | ニュージャージー州                          |
|     |                                | イタリア          | ローマ                                |
| ②   | ジェネンテック（米国）                    | 米国            | カリフォルニア州                           |
| ③   | ファイザー（米国）                      | 米国            | コネチカット州                            |
|     |                                | デンマーク         | アールハウムパーケン ヴァイ                     |
| ④   | 科学技術振興機構                       | 宮城県           | 仙台市                                |
|     |                                | 茨城県           | 牛久市                                |
|     |                                | 東京都           | 新宿区                                |
| ⑤   | アメリカ合衆国（米国）                    | 米国            | メリーランド州                            |
| ⑥   | 武田薬品                           | 大阪府           | 大阪市淀川区十三本町二丁目 17 番 85 号 大阪工場地区研究部門 |
|     |                                | 米国            | ジョージア州                             |
| ⑦   | ウエスト ファーマシューティカル サー<br>ビスズ（米国） | イギリス          | ノッチンガム                             |
|     |                                | スペイン          | ラグナ                                |
| ⑧   | 久光製薬                           | 茨城県           | つくば市観音台 1-25-12<br>久光製薬株式会社筑波研究所   |
| ⑨   | メルク（米国）                        | イギリス          | ロンドン                               |
| ⑩   | アストラゼネカ（イギリス）                  | イギリス          | ロンドン                               |
|     |                                | スウェーデン        | メルンダール                             |
| ⑪   | エラン（アイルランド）                    | アイルランド        | ダブリン市                              |
| ⑫   | マサチューセッツ工科大学（米国）               | 米国            | マサチューセッツ州                          |
| ⑬   | エミスフェア・テクノロジーズ（米国）             | 米国            | ニューヨーク州                            |

## (2) 薬剤標的化技術

### ①能動的標的化技術

薬剤標的化技術の中の能動的標的化技術に関する技術開発拠点を図 3.2-3 に示す。また、能動的標的化技術に関する技術開発拠点の一覧表を表 3.2-3 に示す。

技術開発拠点は関東地方、東海地方、北陸地方、近畿地方、山陽地方、四国地方、九州地方と広がっている。また、海外の技術開発拠が多い。

図 3.2-3 能動的標的化放出制御技術の技術開発拠点

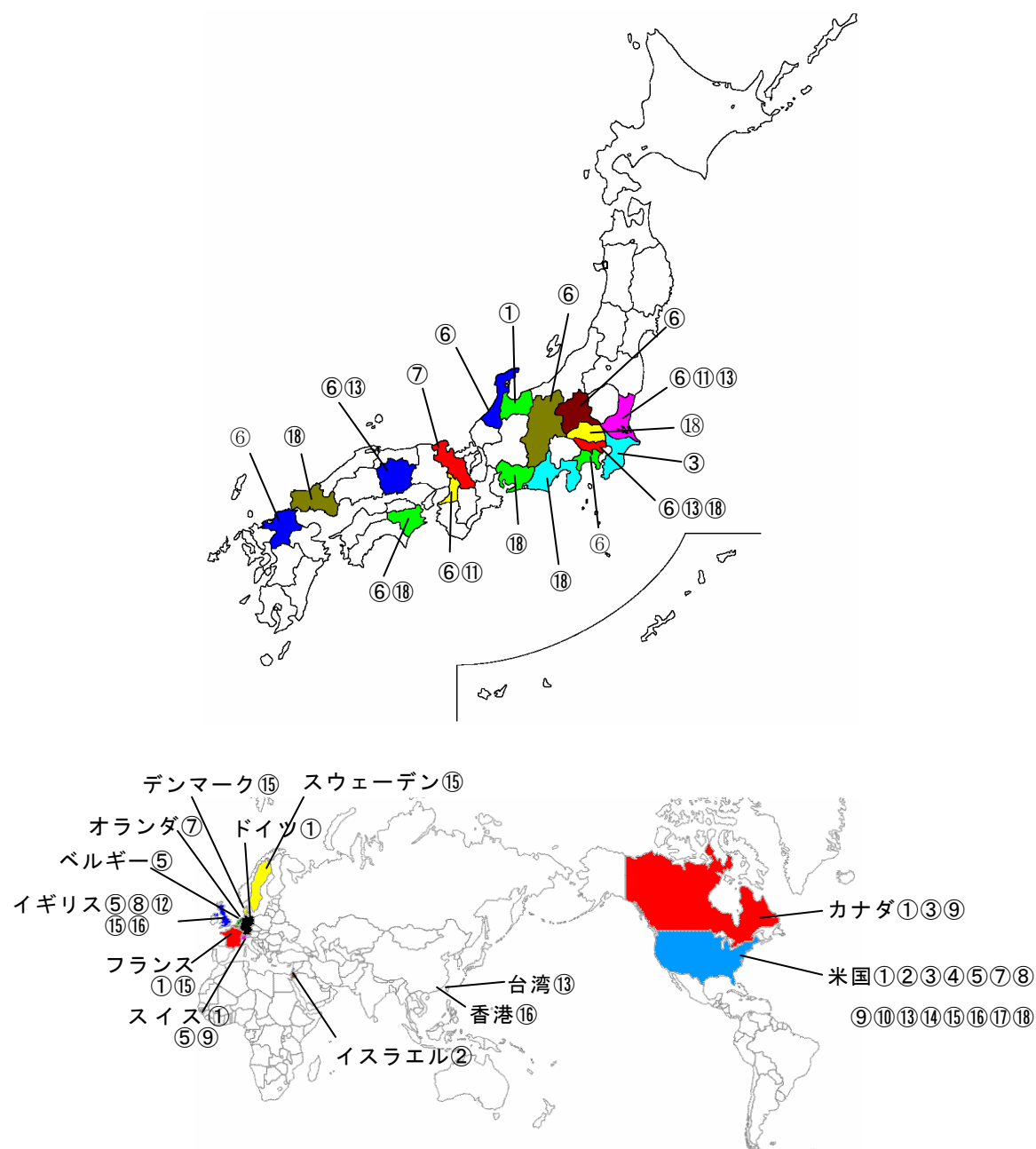




表 3.2-3 能動的標的化技術の技術開発拠点一覧表

| No. | 出願人                           | 都道府県<br>または国名 | 所在地・事業所名                             |
|-----|-------------------------------|---------------|--------------------------------------|
| ①   | サノフィ・アベンティス<br>(フランス)         | 富山県           | 富山市                                  |
|     |                               | 米国            | ニュージャージー州                            |
|     |                               | カナダ           | オンタリオ州                               |
|     |                               | ドイツ           | マールブルグ                               |
|     |                               | フランス          | パリ                                   |
|     |                               | スイス           | ヴァンドゥヴレ                              |
| ②   | ジョンソンアンドジョンソン (米国)            | イスラエル         | エルサレム                                |
|     |                               | 米国            | ニュージャージー州                            |
| ③   | カリフォルニア大学 (米国)                | 千葉県           | 千葉市                                  |
|     |                               | 米国            | カリフォルニア州                             |
|     |                               | カナダ           | ケベック州                                |
| ④   | ジェネンテック (米国)                  | 米国            | カリフォルニア州                             |
|     |                               | 米国            | コネチカット州                              |
| ⑤   | ファイザー (米国)                    | イギリス          | ケント                                  |
|     |                               | ベルギー          | ブス                                   |
|     |                               | スイス           | ホフシュテッテン                             |
|     |                               | 長野県           | 松本市                                  |
| ⑥   | 科学技術振興機構                      | 石川県           | 金沢市                                  |
|     |                               | 茨城県           | 土浦市                                  |
|     |                               | 群馬県           | 前橋市                                  |
|     |                               | 神奈川県          | 川崎市                                  |
|     |                               | 神奈川県          | 相模原市                                 |
|     |                               | 東京都           | 新宿区                                  |
|     |                               | 東京都           | 墨田区                                  |
|     |                               | 大阪府           | 吹田市                                  |
|     |                               | 岡山県           | 岡山市                                  |
|     |                               | 徳島県           | 徳島市                                  |
|     |                               | 福岡県           | 福岡市                                  |
|     |                               | 京都府           | 京都市                                  |
| ⑦   | カイロン (米国)                     | 米国            | カリフォルニア州                             |
|     |                               | オランダ          | ジェイジー アルメール                          |
| ⑧   | ブリストルマイヤーズスクイブ<br>(米国)        | 米国            | ニュージャージー州                            |
|     |                               | イギリス          | オックスフォード                             |
| ⑨   | アメリカ合衆国 (米国)                  | 米国            | メリーランド州                              |
| ⑩   | テキサス大学 (米国)                   | 米国            | テキサス州                                |
| ⑪   | 武田薬品                          | 大阪府           | 大阪市                                  |
|     |                               | 茨城県           | つくば市                                 |
| ⑫   | ウエスト ファーマシューティカル<br>サービス (米国) | イギリス          | ノッチンガム                               |
| ⑬   | 久光製薬                          | 茨城県           | つくば市観音台 1-25-17<br>久光製薬株式会社筑波研究所     |
|     |                               | 東京都           | 文京区                                  |
|     |                               | 岡山県           | 上房郡賀陽町                               |
|     |                               | 米国            | カリフォルニア州                             |
|     |                               | 台湾            | 高雄                                   |
| ⑭   | メルク (米国)                      | 米国            | ニュージャージー州                            |
|     |                               | カナダ           | ケベック州                                |
|     |                               | スイス           | フォルヒ                                 |
| ⑮   | アストラゼネカ (イギリス)                | 米国            | カリフォルニア州                             |
|     |                               | イギリス          | ミアサイド                                |
|     |                               | フランス          | ガリアン                                 |
|     |                               | デンマーク         | ファラム                                 |
|     |                               | スウェーデン        | メルンダール                               |
| ⑯   | イミュノメディクス (米国)                | 米国            | ニュージャージー州                            |
|     |                               | イギリス          | ノッチンガム                               |
| ⑰   | エミスフェア・テクノロジーズ (米国)           | 香港            | 香港                                   |
|     |                               | 米国            | ニューヨーク州                              |
| ⑱   | 協和醗酵工業                        | 東京都           | 町田市旭町 3-6-6<br>協和醗酵工業株式会社 東京研究所      |
|     |                               | 東京都           | 千代田区大手町 1-6-1<br>協和醗酵工業株式会社 本社       |
|     |                               | 静岡県           | 駿東郡長泉町下土狩 1188<br>協和醗酵工業株式会社 医薬総合研究所 |
|     |                               | 埼玉県           | 川口市                                  |
|     |                               | 愛知県           | 春日井市                                 |
|     |                               | 山口県           | 防府市                                  |
|     |                               | 徳島県           | 徳島市                                  |
|     |                               | 米国            | カリフォルニア州                             |

## ②受動的標的化技術

薬剤標的化技術の中の受動的標的化に関する技術開発拠点を図 3.2-4 に、また、一覧表を表 3.2-4 に示す。技術開発拠点は近畿地方にある。また、海外の技術開発拠が多い。

図 3.2-4 受動的標的化技術の技術開発拠点

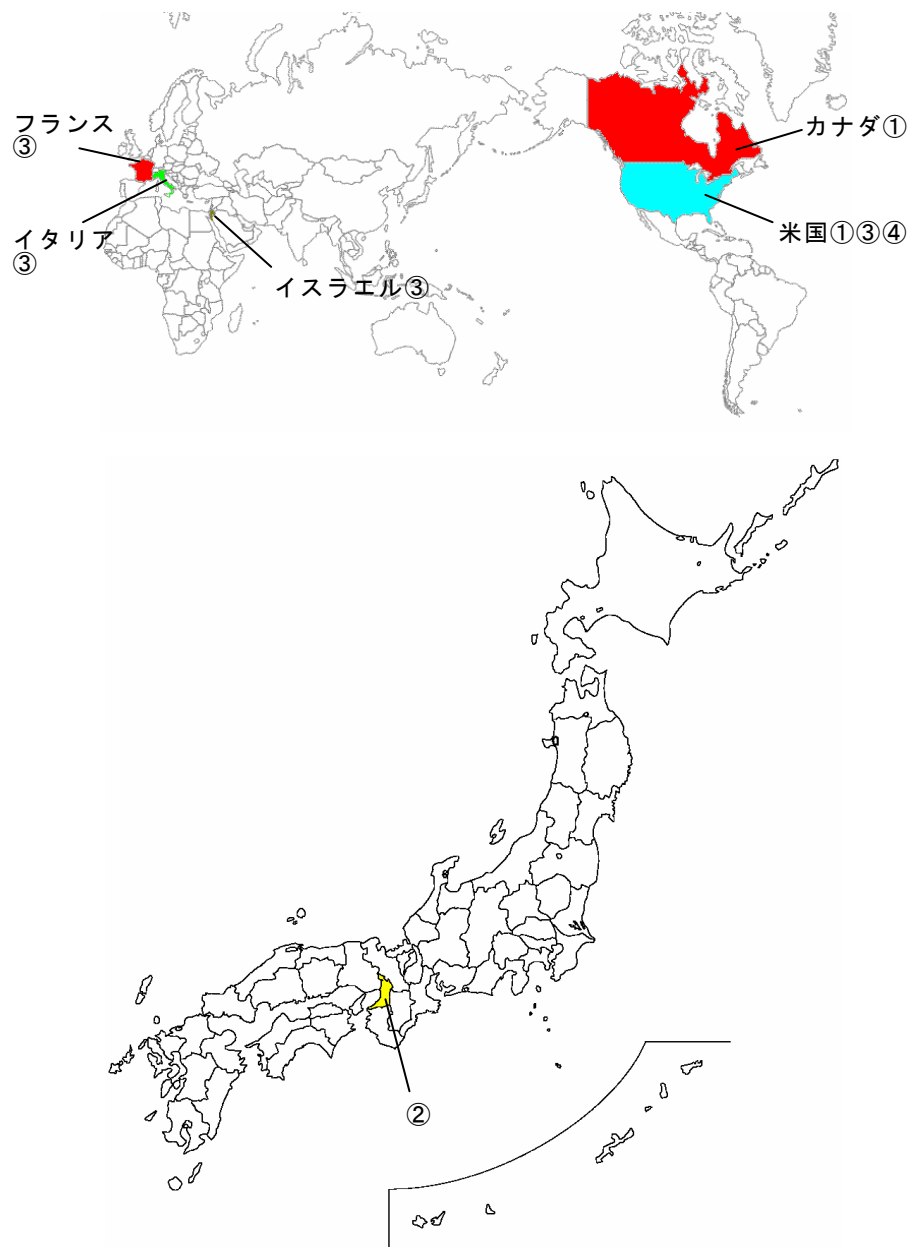


表 3.2-4 受動的標的化技術の技術開発拠点一覧表

| No. | 出願人                | 都道府県<br>または国名 | 所在地・事業所名                              |
|-----|--------------------|---------------|---------------------------------------|
| ①   | テキサス大学（米国）         | 米国            | テキサス州                                 |
|     |                    | カナダ           | ブリティッシュコロンビア州                         |
| ②   | 武田薬品               | 大阪府           | 大阪市淀川区十三本町二丁目 17 番<br>85 号 大阪工場地区研究部門 |
| ③   | マサチューセッツ工科大学（米国）   | 米国            | マサチューセッツ州                             |
|     |                    | フランス          | ナンシー                                  |
|     |                    | イスラエル         | エルサレム                                 |
|     |                    | イタリア          | ローマ                                   |
| ④   | エミスフェア・テクノロジーズ(米国) | 米国            | ニューヨーク州                               |

### (3) 薬剤吸収制御技術

#### ① 薬剤導入技術

薬剤吸収制御技術の中の薬剤導入技術に関する技術開発拠点を図 3.2-5 に、また、一覧表を表 3.2-5 に示す。技術開発拠点は、東北地方、関東地方、近畿地方にある。また、海外の技術開発拠が多い。

図 3.2-5 薬剤吸収制御技術の技術開発拠点

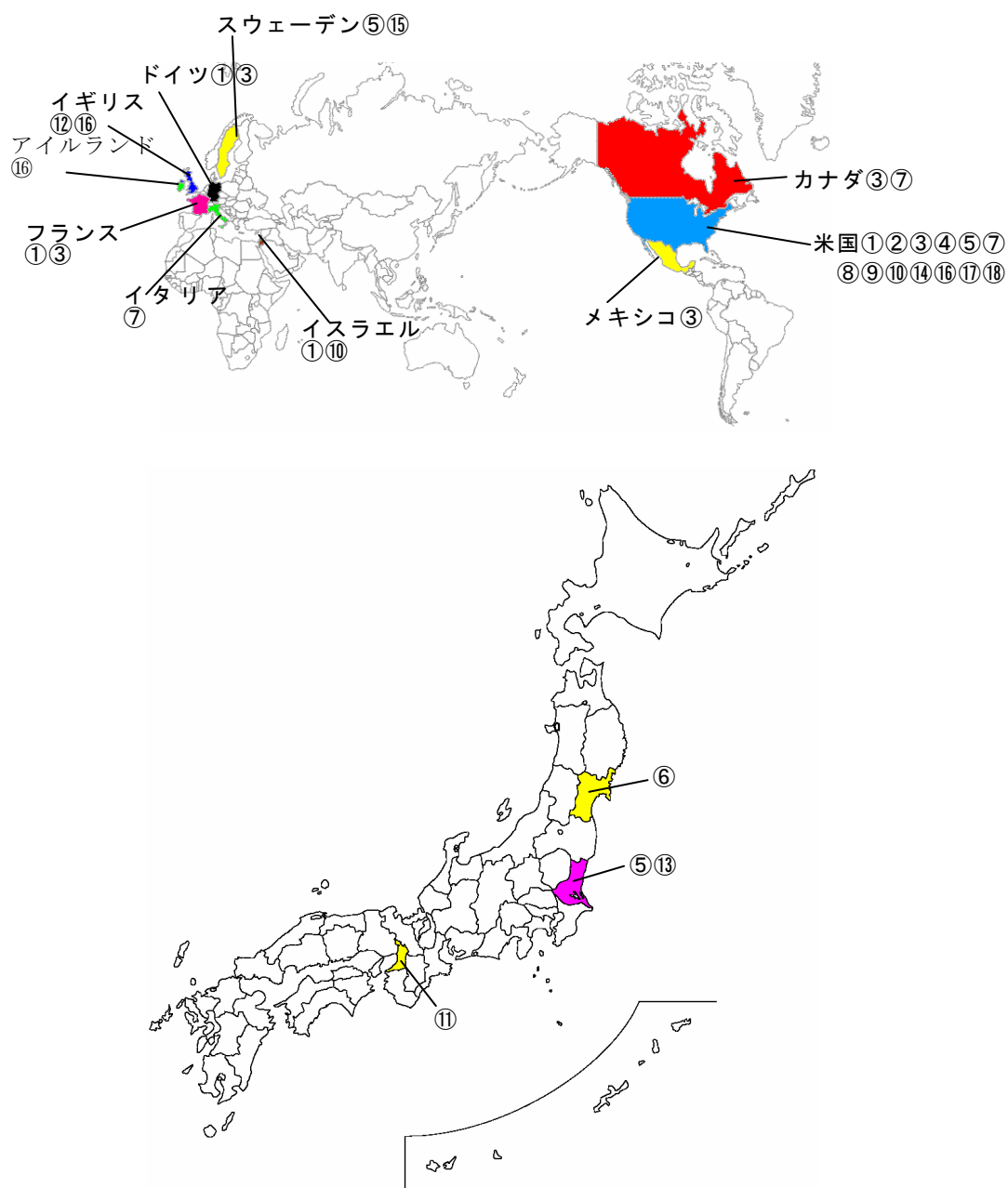


表 3.2-5 薬剤導入技術の技術開発拠点一覧表

| No. | 出願人                            | 都道府県<br>または国名 | 所在地・事業所名                                  |
|-----|--------------------------------|---------------|-------------------------------------------|
| ①   | サノフィ・アベンティス（フランス）              | 米国            | ニュージャージー州                                 |
|     |                                | ドイツ           | マールブルグ市                                   |
|     |                                | フランス          | パリ市                                       |
|     |                                | イスラエル         | キリアト・オノ                                   |
| ②   | ジョンソンアンドジョンソン（米国）              | 米国            | ニュージャージー州                                 |
| ③   | カリフォルニア大学（米国）                  | 米国            | カリフォルニア州                                  |
|     |                                | カナダ           | ケベック                                      |
|     |                                | ドイツ           | ブレーメン                                     |
|     |                                | フランス          | プティート                                     |
|     |                                | メキシコ          | モレロズ                                      |
| ④   | ジェネンテック（米国）                    | 米国            | カリフォルニア州                                  |
| ⑤   | ファイザー（米国）                      | 茨城県           | つくば市                                      |
|     |                                | 米国            | コネチカット州                                   |
|     |                                | スウェーデン        | ヘルシングボリ                                   |
| ⑥   | 科学技術振興機構                       | 宮城県           | 仙台市                                       |
| ⑦   | カイロン（米国）                       | 米国            | カリフォルニア州                                  |
|     |                                | カナダ           | ケベック州                                     |
|     |                                | イタリア          | シエナ                                       |
| ⑧   | ブリストルマイヤーズスクイブ（米国）             | 米国            | ニュージャージー州                                 |
| ⑨   | アメリカ合衆国（米国）                    | 米国            | メリーランド州                                   |
|     |                                | イスラエル         | テル アビブ                                    |
| ⑩   | テキサス大学（米国）                     | 米国            | テキサス州                                     |
| ⑪   | 武田薬品                           | 大阪府           | 大阪市淀川区十三本町二丁目<br>17 番 85 号 大阪工場地区研<br>究部門 |
| ⑫   | ウエスト ファーマシューティカル サービ<br>シズ（米国） | イギリス          | ノッティングム                                   |
| ⑬   | 久光製薬                           | 茨城県           | つくば市観音台 1-25-11<br>久光製薬株式会社筑波研究所          |
| ⑭   | メルク（米国）                        | 米国            | ニュージャージー州                                 |
| ⑮   | アストラゼネカ（イギリス）                  | スウェーデン        | メルンダール                                    |
| ⑯   | エラン（アイルランド）                    | アイルランド        | ダブリン市                                     |
|     |                                | イギリス          | ノッティングム                                   |
|     |                                | 米国            | ジョージア州                                    |
| ⑰   | マサチューセッツ工科大学（米国）               | 米国            | マサチューセッツ州                                 |
| ⑱   | エミスフェア・テクノロジーズ（米国）             | 米国            | ニューヨーク州                                   |

## ②遺伝子導入技術

薬剤吸収制御技術の中の遺伝子導入技術に関する技術開発拠点を図 3.2-6 に示す。また、遺伝子導入技術の技術開発拠点の一覧表を表 3.2-6 に示す。技術開発拠点は北海道、関東地方、東海地方にある。また、外国の技術開発拠が多い。

図 3.2-6 遺伝子導入技術の技術開発拠点

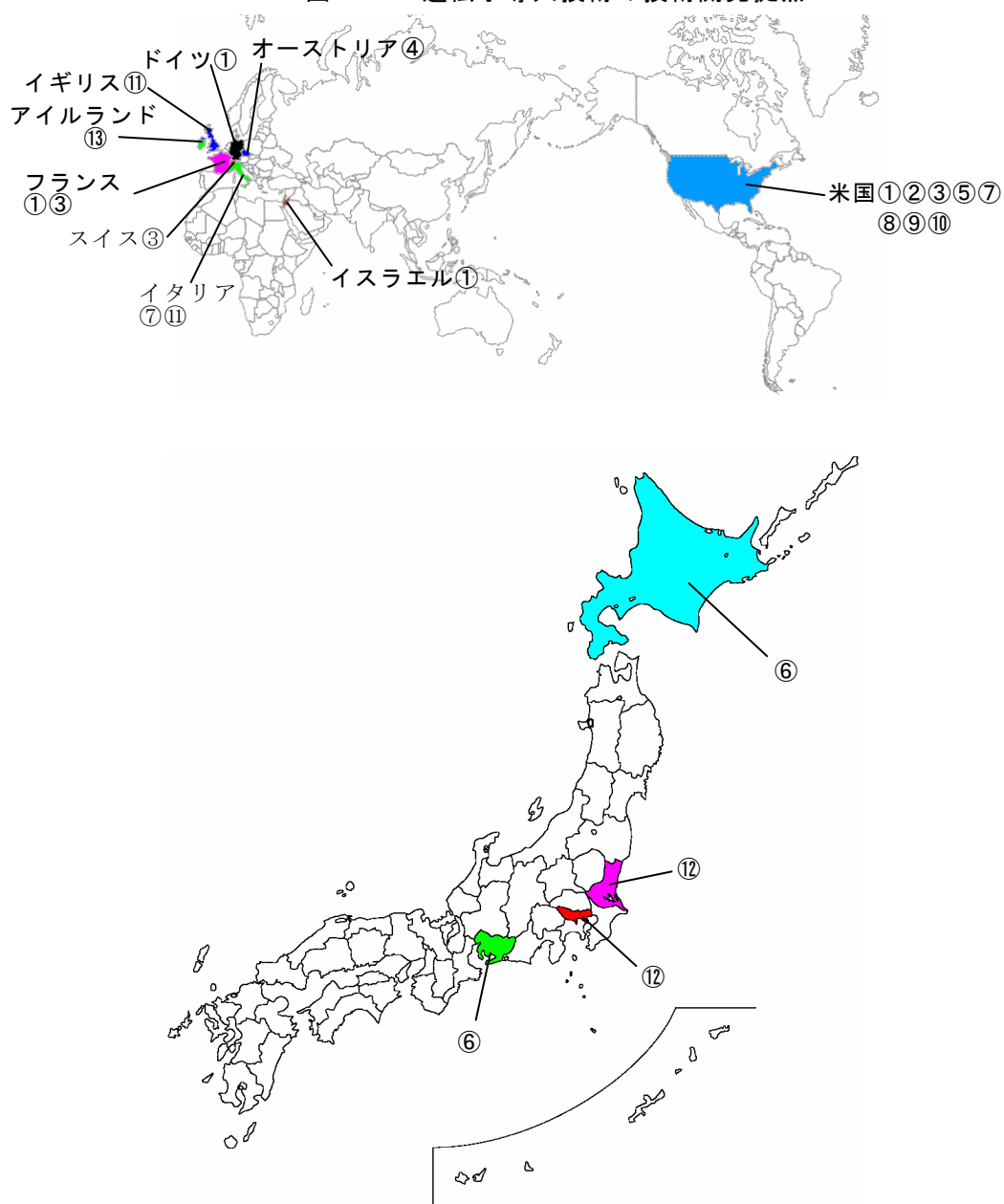


表 3. 2-6 遺伝子導入技術の技術開発拠点一覧表

| No. | 出願人                           | 都道府県<br>または国名 | 所在地・事業所名                         |
|-----|-------------------------------|---------------|----------------------------------|
| ①   | サノフィ・アベンティス（フランス）             | 米国            | ニュージャージー州                        |
|     |                               | ドイツ           | マールブルグ市                          |
|     |                               | フランス          | パリ市                              |
|     |                               | イスラエル         | キリアト・オノ                          |
| ②   | ジョンソンアンドジョンソン（米国）             | 米国            | ニュージャージー州                        |
| ③   | カリフォルニア大学（米国）                 | 米国            | カリフォルニア州                         |
|     |                               | フランス          | カストリース                           |
|     |                               | スイス           | ジュネーブ                            |
| ④   | ジェネンテック（米国）                   | オーストリア        | ランゲンツェルスドルフ                      |
| ⑤   | ファイザー（米国）                     | 米国            | コネチカット州                          |
| ⑥   | 科学技術振興機構                      | 北海道           | 札幌市                              |
|     |                               | 愛知県           | 名古屋市                             |
| ⑦   | カイロン（米国）                      | 米国            | カリフォルニア州                         |
|     |                               | イタリア          | シエナ                              |
| ⑧   | メルク（米国）                       | 米国            | ニュージャージー州                        |
| ⑨   | アメリカ合衆国（米国）                   | 米国            | メリーランド州                          |
| ⑩   | テキサス大学（米国）                    | 米国            | テキサス州                            |
| ⑪   | ウエスト ファーマシューティカル<br>サービスズ（米国） | イギリス          | ノッthingam                        |
|     |                               | イタリア          | ベディッツオーレ                         |
| ⑫   | 久光製薬                          | 茨城県           | つくば市観音台 1-25-13<br>久光製薬株式会社筑波研究所 |
|     |                               | 東京都           | 文京区                              |
| ⑬   | エラン（アイルランド）                   | アイルランド        | ダブリン市                            |

## 資料

資料 1. ライセンス提供の用意のある特許



## 資料 1. ライセンス提供の用意のある特許

特許流通データベース (<http://www.ncipi.go.jp>) を利用し、ドラッグデリバリーシステムに関する特許でライセンス提供の用意のあるもの抽出した。これらの特許がドラッグデリバリーシステムのどの技術要素に関するものかを付記して表に示す。

ライセンス提供の用意のあるドラッグデリバリーシステム関係特許（その 1）

| 公報番号           | 発明の内容                                                                               | 出願人                          | 技術要素 I<br>技術要素 II |
|----------------|-------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------|-------------------|
| 特許 3101711     | 有効成分を効率よく吸着させ、有効成分の徐放速度を制御できる吸着体および徐放体                                              | 農林水産省 蚕糸・昆虫農業技術研究所長          | 薬剤放出技術<br>放出制御技術  |
| 特許 3511238     | 食品工業、医薬品製造等に利用されるエマルション、マイクロカプセル担体などとして用いられる個体微粒子や液体微粒子であるマイクロスフィア（微粒子）の製造方法および製造装置 | 食品総合研究所、生物系特定産業技術研究推進機構、中嶋光敏 | 薬剤放出技術<br>効果的放出技術 |
| 特許 2967184     | グリシン、プロリン、サルコシンのアミノ酸残基を含むオリゴペプチドと長鎖ジカルボン酸とをアミド連結して得られるカルボキシル末端を両端にもつ双頭型脂質の製造方法      | 産業技術総合研究所                    | 薬剤放出技術<br>効果的放出技術 |
| 特許 2575199     | カーボネート共重合体の製造方法                                                                     | トクヤマ                         | 薬剤放出技術<br>効果的放出技術 |
| 特開 2003-147418 | シェル架橋型ミセルを鋳型とする金属ナノ粒子の調製                                                            | 科学技術振興機構                     | 薬剤放出技術<br>効果的放出技術 |
| 特許 3542883     | レゾルシノール構造を含有する環状化合物から成るベシクルとその製造方法                                                  | 科学技術振興機構                     | 薬剤放出技術<br>効果的放出技術 |
| 特許 3200623     | 中空球状ケイ酸塩クラスターの製造方法                                                                  | 産業技術総合研究所                    | 薬剤放出技術<br>効果的放出技術 |
| 特許 3051213     | 重合度 6～8 のマルトオリゴ糖の還元・非還元両末端にそれぞれ 2 つのアミノ基を有するマルトオリゴ糖誘導体（I）、その合成中間体及びその製造方法           | 理化学研究所                       | 薬剤放出技術<br>効果的放出技術 |

ライセンス提供の用意のあるドラッグデリバリーシステム関係特許（その２）

| 公報番号           | 発明の内容                                                             | 出願人          | 技術要素Ⅰ<br>技術要素Ⅱ      |
|----------------|-------------------------------------------------------------------|--------------|---------------------|
| 特許 2967925     | 微生物膜と動物細胞膜の構造を識別し、微生物膜に選択的作用を有する抗菌剤リード物質                          | 食品総合研究所、町田幸子 | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 |
| 特開 2004-248666 | 微生物細胞膜に特異的に作用するが、正常な動物細胞膜に作用しないペプチドおよびそのスクリーニング方法                 | 食品総合研究所      | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 |
| 特開 2003-250546 | 刺激応答型DNA組織体                                                       | 科学技術振興機構     | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 |
| 特開平 11-124414  | 相転移型光学活性高分子及びその製法                                                 | 科学技術振興機構     | 薬剤標的化技術<br>能動的標的化技術 |
| 特許 2785981     | 安定性に優れた、平均粒子径が0.010～0.070 μmであるリピッドスフェアが水相中に分散している乳化組成物           | 資生堂          | 薬剤標的化技術<br>受動的標的化技術 |
| 特許 2767401     | 医薬品への応用が期待される、酵母マンノースー１ーリン酸転移酵素遺伝子およびこれを利用するマンノースー１ーリン酸含有酸性糖鎖の製造法 | 産業技術総合研究所    | 薬剤吸収制御技術<br>薬剤導入技術  |
| 特開 2003-075349 | 膜融合の解析方法                                                          | 産業技術総合研究所    | 薬剤吸収制御技術<br>遺伝子導入技術 |
| 特開 2003-070468 | 細胞への遺伝子導入方法                                                       | 科学技術振興機構     | 薬剤吸収制御技術<br>遺伝子導入技術 |

特許流通支援チャート 化学 28

## ドラッグデリバリーシステム

---

2005 年 3 月 31 日発行

企画・発行 独立行政法人 工業所有権情報・研修館©  
〒100-0013 東京都千代田区霞が関 3-4-3  
電話 03-3580-6949（直通）

編 集 社団法人 発明協会  
〒105-0001 東京都港区虎ノ門 2-9-14  
電話 03-3502-5440（直通）

※本チャートの著作権は、独立行政法人工業所有権情報・研修館に帰属します。