

平成17年度 特許流通支援チャート

化学30

抗アレルギー剤

2006年3月

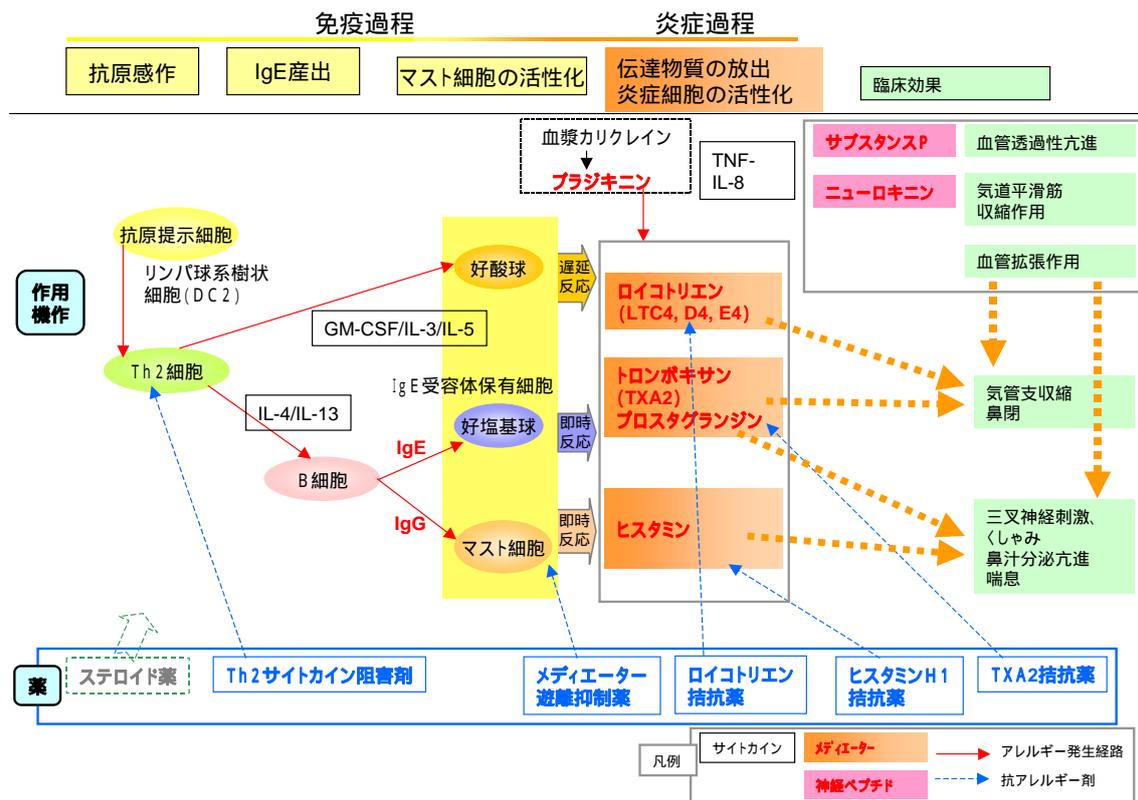
独立行政法人 工業所有権情報・研修館

根治療法を目指した抗アレルギー剤開発

抗アレルギー剤

近年、環境条件の悪化や生活様式の変化、社会生活の複雑化に伴うストレスの増加などにより、気管支喘息、花粉症、アレルギー性鼻炎、アトピー性皮膚炎、薬物による蕁麻疹(じんましん)などのアレルギー性疾患に悩む人が増加している。

これらアレルギー性疾患の治療法としては「抗アレルギー剤」とよばれる一連の薬剤や吸入用あるいは外用「ステロイド剤」が開発され大きく前進したが対症療法的な域を出ず、根治的な治療薬の創製が期待されている。



略語等については、本文 P.6、P.7 参照

合成医薬品を中心に研究開発が進展

1910年にヒスタミンが発見され、アレルギー性疾患の原因物質との認識から抗ヒスタミン剤の研究が開始された。その結果、1940年代からの抗ヒスタミン薬、1970年代のメディエーター抑制薬、1980年代から90年代にかけてのヒスタミンH1拮抗薬、1990年代の脂質メディエーター抑制薬、Th2サイトカイン阻害薬など、一連の新規作用メカニズムによる抗アレルギー薬が開発されてきた。既存薬の多くは合成医薬品であり、そのほか天然物医薬品、生薬なども認可されている。

特許出願動向をみると合成医薬品の出願が70%強を占め、開発の中心となっていることが推測される。また、近年新たな医薬品として注目を集めている抗体医薬や蛋白質医薬品、核酸医薬品など、低分子化合物以外の薬剤特許も出願が見られる。

新規薬剤開発が中心的課題

本調査における抗アレルギー剤は、IgE 抗体を介して炎症が起こる 型アレルギー治療薬に限定し（ステロイド剤は除く）、対象疾患としてはアトピー性皮膚炎、アレルギー性鼻炎、喘息の3つの疾患に特定した。

特許総数 2,188 件中、薬効向上のための新規薬剤が 2,003 件とほぼ 95% を占め、新規抗アレルギー剤の開発が中心的な課題といえる。

作用メカニズムが明確な抗アレルギー剤をめざした新規薬剤開発

薬効向上のための新規薬剤開発の中で、新規作用点、特に免疫系をターゲットにした治療薬が 2001 年以降増加しており、免疫系・炎症系双方に対する薬剤も入れると 54% と過半数を超える。免疫系の重要なメカニズムである B 細胞、T 細胞の機能調節などに着目した特許が多く、細胞間の相互作用や、細胞の挙動制御、各種生体内伝達物質（サイトカイン、ケモカイン、神経ペプチド）、核内転写因子などの阻害剤も出願されている。

近年、免疫学やゲノムデータの蓄積など、バイオテクノロジーの基礎が大きく進展し、いままで不明であったアレルギー発症のメカニズムが明らかになってきたことが背景と考えられる。

日本国内外製薬企業中心に研究開発

特許出願上位 21 位以内はすべて製薬会社（一部化学会社で製薬部門も保有）で、ファイザー、グラクソ・スミスクライン、シュering・プラウ、武田薬品工業、アストラゼネカなど大手製薬企業が中心となる。上位 21 社のうち、日本の製薬企業は、約半数である。

大学・公的研究機関においては、日本大学の 9 件がもっとも多く、以下、農業生物系特定産業技術研究機構が 4 件、産業技術総合研究所が 3 件、科学技術振興機構・近畿大学・慶應義塾、静岡県が各 2 件と続く。

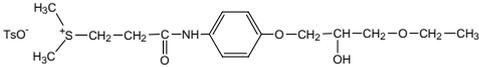
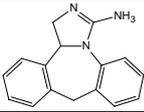
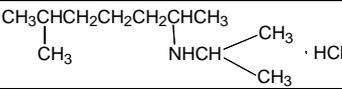
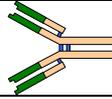
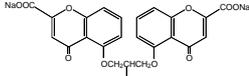
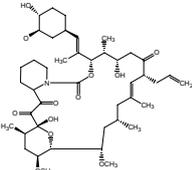
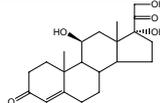
抗アレルギー剤の特許分布と周辺技術

抗アレルギー剤に関して、1993年1月以降、2003年12月までに出願された特許・実用新案は、2,188件である。

抗アレルギー剤を開発する薬剤の化学構造からみると、依然として合成医薬品に関する特許出願が多い。

薬剤開発のポイントとしては既知作用点に対応する薬剤開発より新規作用点に対する薬剤開発に対する出願が多くみられた。特に2001年～2003年においてはその傾向が強い。

抗アレルギー剤の特許分布と周辺技術

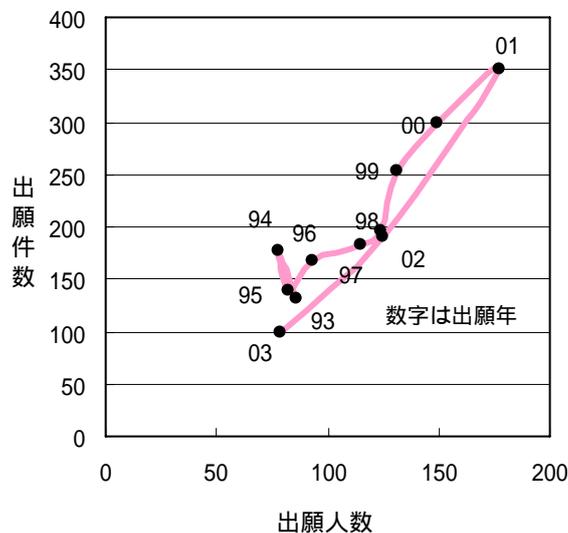
分類	詳細分類	件数
合成医薬品 	炭素環式 	219
	複素環式 	1313
	非環式 	66
高分子医薬品 	抗体医薬品 	52
	蛋白質医薬品 	51
	ペプチド医薬品 -Arg-Asp-Asp-	102
	核酸医薬品 -A-G-T-C-A-	26
天然物医薬品 	植物由来 	86
	微生物由来 	51
	動物由来 	24
生薬 		166
その他の抗アレルギー剤		32

急増する抗アレルギー剤

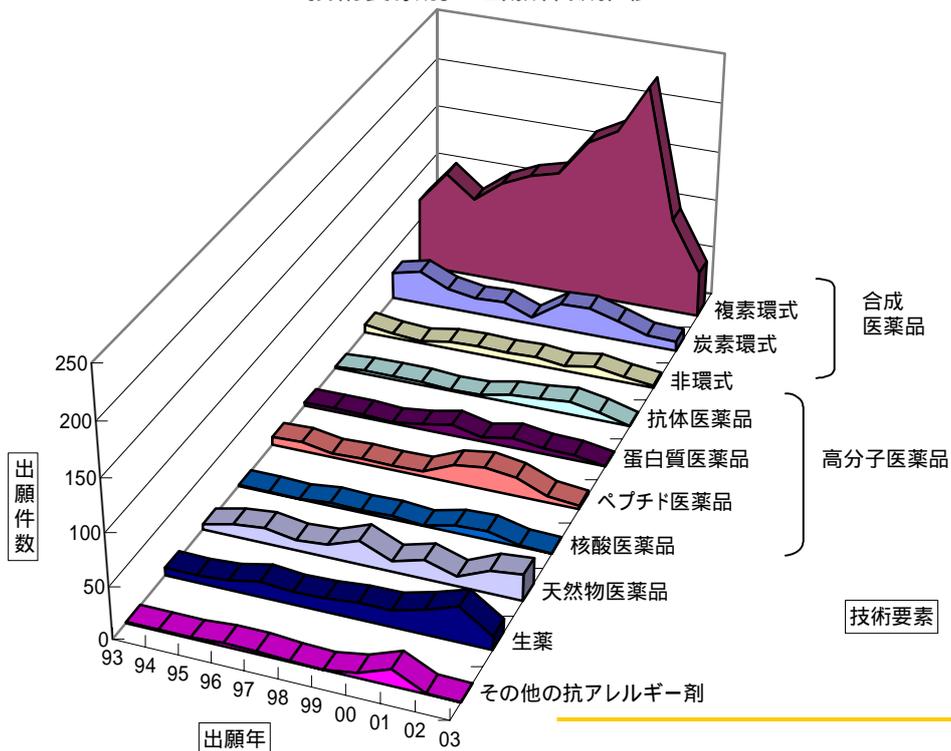
抗アレルギー剤に関しては、1997年までは出願件数の伸びない状況が続いたが、99年以降、出願人数・出願件数の大幅増加がみられる。02年、03年における減少はPCT国際出願の公表の遅れによるものであり、実質的には増加傾向が続いていると思われる。

その背景には、アレルギー疾患が増加している社会現象とともにゲノムデータなどの増加によりいままで不明であった生体メカニズムの解明が進み、既存薬とは違ったメカニズムの薬の開発が盛んになったことがあると推定される。

抗アレルギー剤の出願人数 - 出願件数推移



技術要素別の出願件数推移



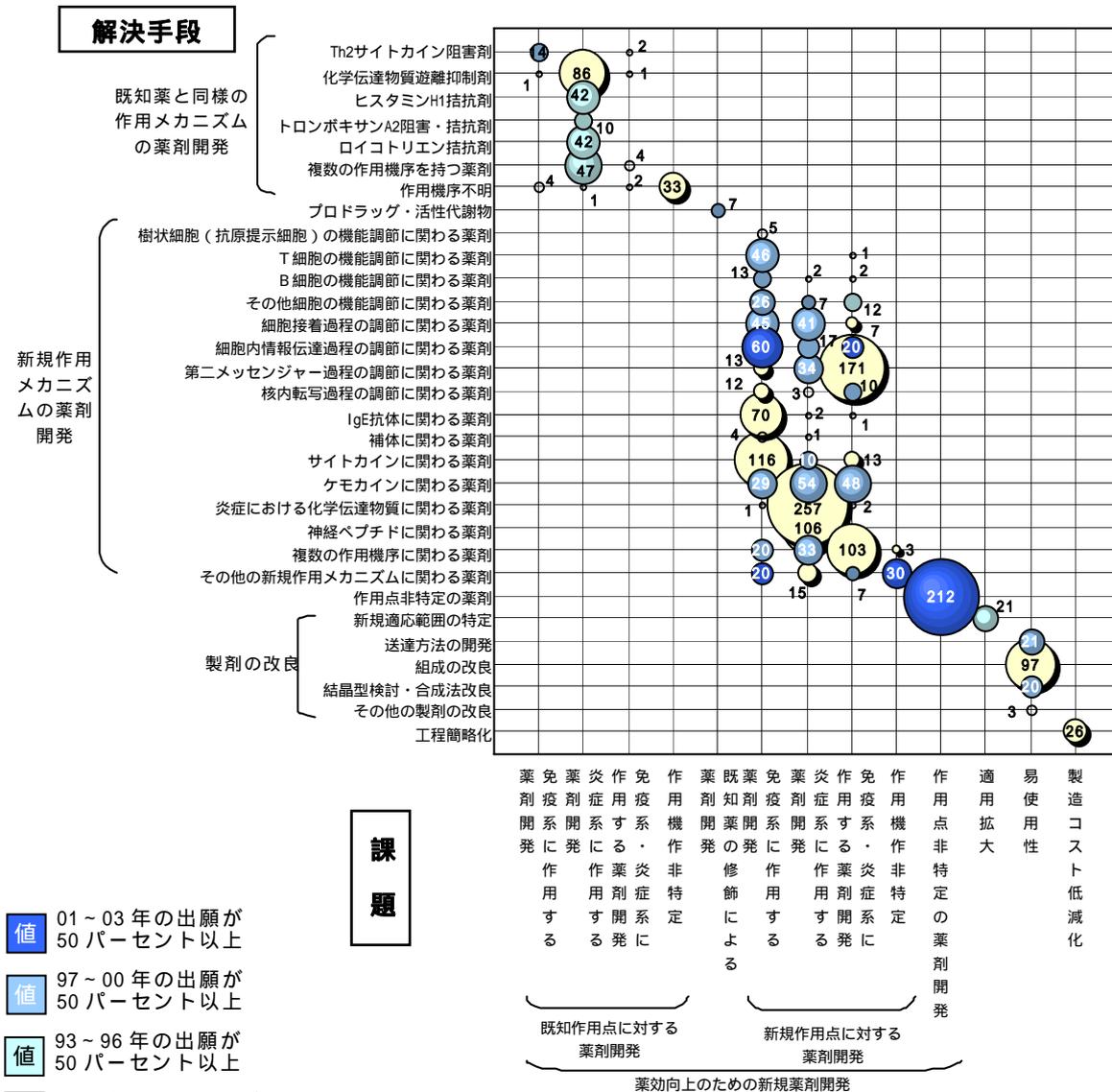
根治的な治療を目指した抗アレルギー剤開発

抗アレルギー剤に関する技術課題としては、薬効向上のための新規薬剤開発、適用拡大、易使用性、製造コスト低減化が挙げられるが、特に重要な課題は新規作用点に対する薬剤開発、その内でも免疫系に作用する薬剤開発が重要視されている。

既存の抗アレルギー剤の大部分はアレルギー症状を緩和する対処療法的薬剤であり、炎症系に作用する薬剤が多いが、新規薬剤開発においても「炎症における新規化学伝達物質に関わる薬剤」など、この種の薬剤開発に関する出願が多い。

一方、新しい流れとしては免疫系に作用する薬剤開発の出願も多く、具体的にはサイトカインやIgE抗体、T細胞、B細胞の機能調節、細胞接着過程、細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤開発など、アレルギーの発症を抑制することを目的とした根治的治療薬の開発が狙われていることが窺える。

抗アレルギー剤の課題と解決手段の分布図



1993年1月~2003年12月の出願

注目される特許の課題と解決手段および被引用回数

アレルギーに関する様々な作用メカニズムを標的として、種々の構造を有する物質（合成あるいは天然物由来の化合物、ペプチド、蛋白質・抗体など）について、抗アレルギー剤の研究開発が行われている。

医薬品は基本的に薬効をあらわす物質を特定した「物質特許」で規定されるため、すべての抗アレルギー剤に影響を及ぼす「基本特許」は特定しにくい。

注目される特許の課題と解決手段

解決手段	新規作用点に対する薬剤開発			件数 被引用回数
	免疫系に作用する 薬剤開発	炎症系に作用する 薬剤開発	免疫系・炎症系に 作用する薬剤開発	
Ｔ細胞の機能調節 に関わる 薬剤	W094/008943 三菱ウェルファーマ [11回]			1件 11回
細胞接着過程の調節 に関わる薬剤	W096/020216 ZENECA [13回] W095/019790 ATHENANEURO SCIENCES [9回] W096/022966 BIOGEN [11回]	W095/015973 CYTEL [16回] W096/000581 TEXASBIO TECHNOLOGY [9回] W094/015958 田辺製薬 [10回]	W096/006108 CYTEL [16回]	7件 84回
第二メッセンジャー 過程の調節に関 わる薬剤		W095/035283 CELLTECHTHERAPEUTICSLIMITED [10回]	W096/000215 CELLTECHTHERAPEUTICS [9回] W094/012461 PFIZER [14回]	3件 33回
サイトカインに関 わる薬剤		W093/014081 SMITHKLINEBEECHAM [10回]		1件 10回
ケモカインに関わ る薬剤			W000/035877 DUPONTPHARMACEUTICALS [9回] EP903349 F.HOFFMANN-LAROCHE [11回] W000/031033 F.HOFFMANN-LAROCHEAG [9回]	3件 29回
炎症における化学 伝達物質に関わる 薬剤		特許 3310687 エーザイ [9回] 特開平 6-571 グリユネンタール [9回] W096/033974 緑十字 [9回]	特許 3537231 サントリー [9回]	4件 36回
その他の新規作用メ カニズムに関わ る薬剤	W093/013798 BIOGEN [9回]			1件 9回
件数 回数	8件 77回	5件 47回	7件 77回	

被引用特許文献の出願人名表示は、特許公報に準じて表記した。

医薬品においては、特許出願から医薬品の臨床試験までは 10 年程度必要とされ、またその過程で多くがドロップアウトしていく。医薬品においての特許の価値とは、臨床試験において薬効が認められた時に生ずるといえる。本ページにおける「注目特許」は、あくまでも本調査の範囲内で被引用回数が多い特許を採り上げており、今後これらの特許がどのようなインパクトを持つかが現時点では予測できない。

グローバルな展開をみせる抗アレルギー剤開発

抗アレルギー剤に関する特許の出願人の住所から主要企業の技術開発の拠点をみると、5社中4社が海外企業である。抗アレルギー剤に関する特許出願においてはグローバルな展開がなされていることがわかる。大学・公的研究機関では、関東を中心に出願されていることがわかる。

主要出願人

番号	出願人	合計
①	ファイザー	120
②	グラクソ・スミスクライン	113
③	シュering・ブラウ	64
④	武田薬品工業	59
⑤	アストラゼネカ	47

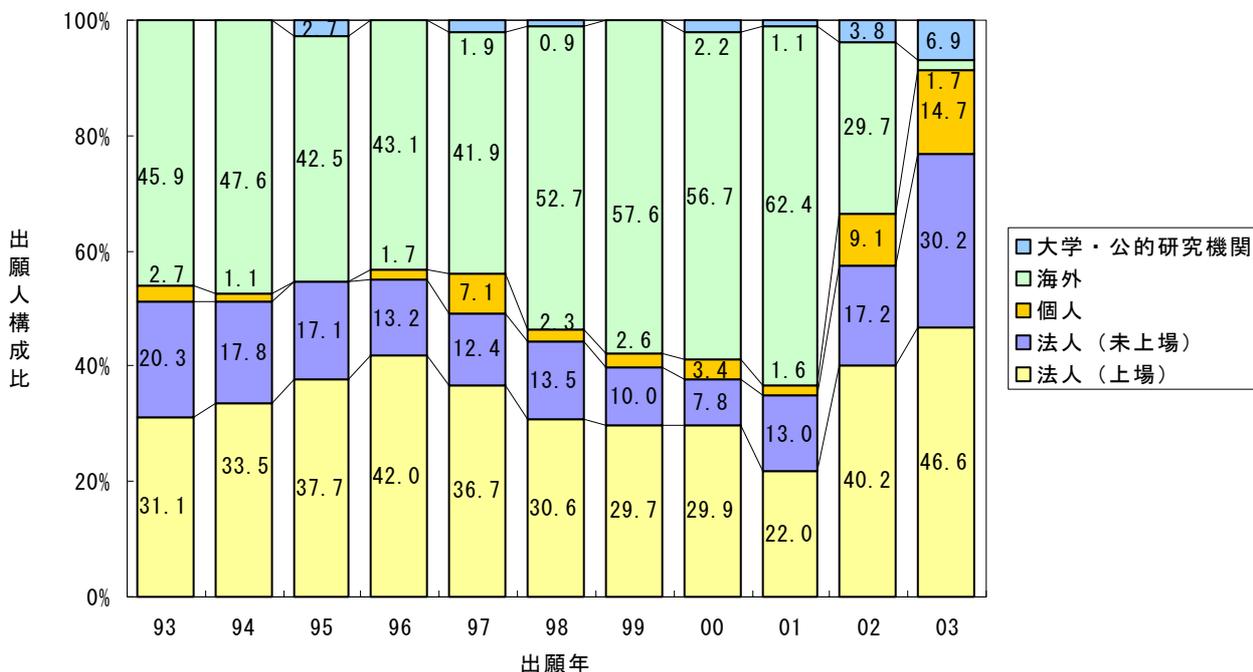
大学・公的研究機関出願人

番号	出願人	合計
⑥	日本大学	9
⑦	農業生物系特定産業技術研究機構	4
⑧	産業技術総合研究所	3
⑨	科学技術振興機構	2
⑩	近畿大学	2
⑪	慶応義塾	2
⑫	静岡県	2

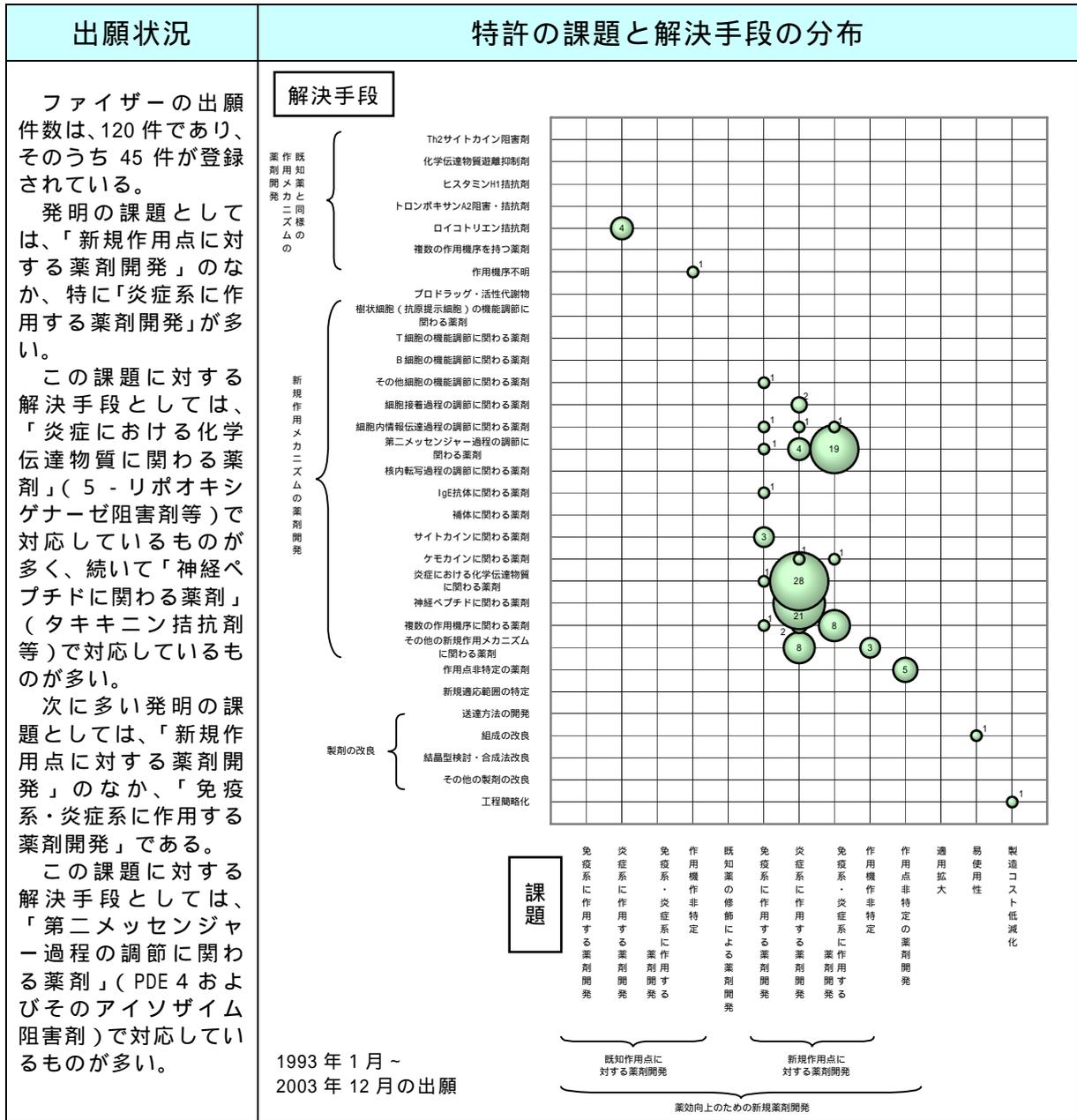
技術開発拠点地図



出願人構成比の推移

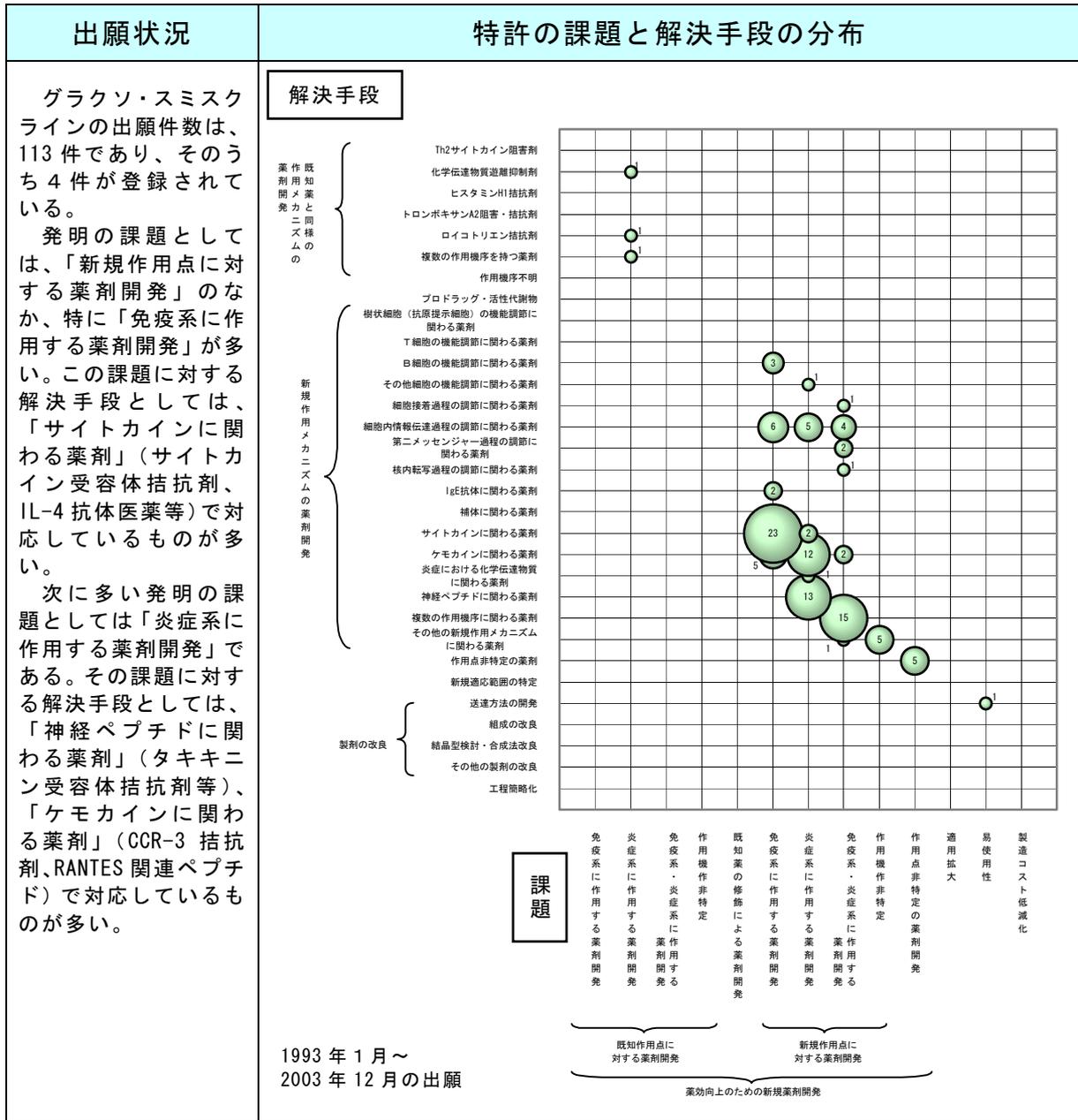


ファイザー



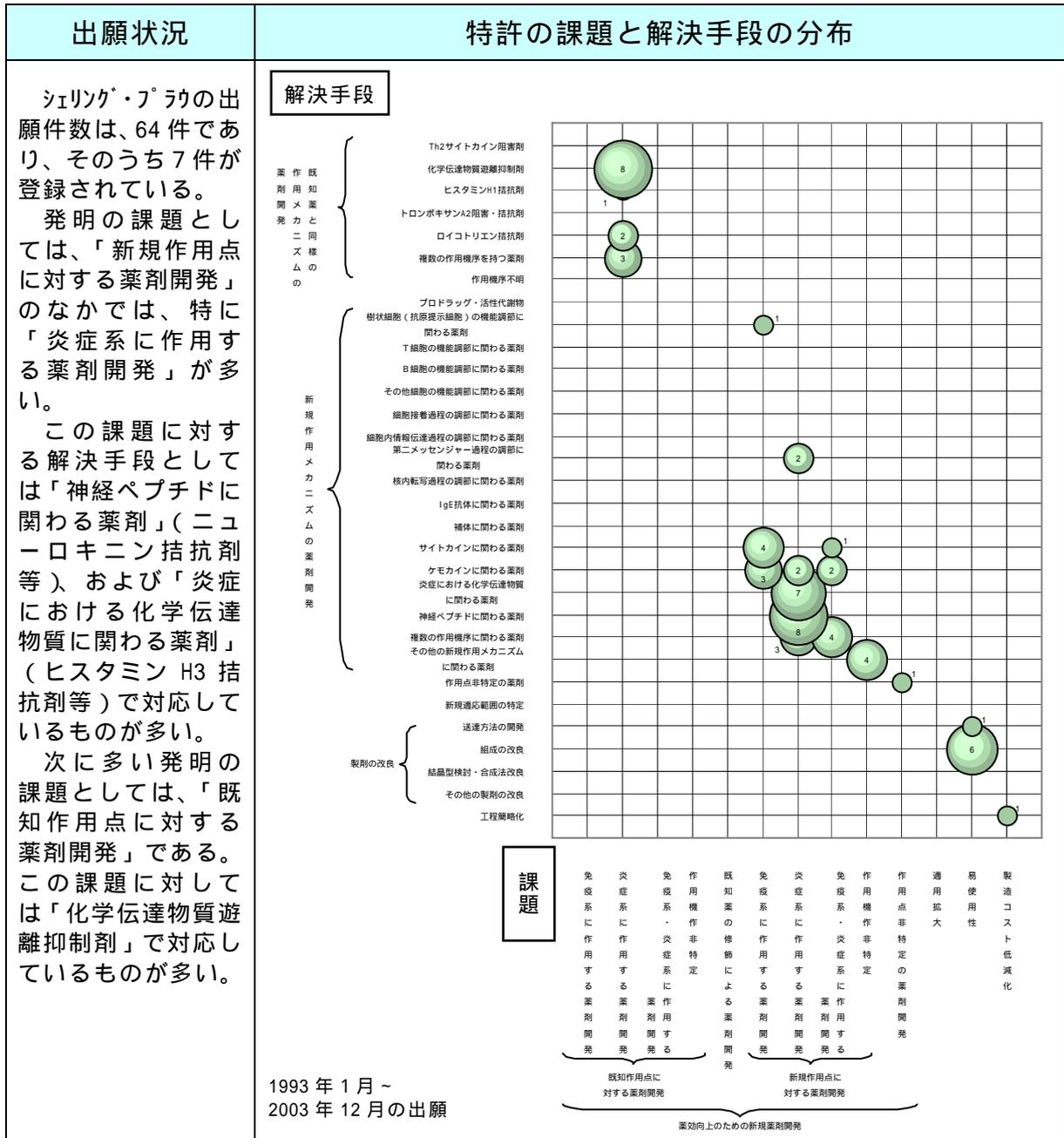
保有特許例				
特許番号 (経過情報) 出願日 主IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要	課題	解決手段	技術要素
特許 2794341 93.04.07 C07C275/64	<p>シクロアルキルヒドロキシ尿素類及びそれらのリボキシゲナーゼ阻害物質としての用途</p> <p>右記化学式(1)の新規なN-ヒドロキシ尿素化合物。炎症性疾患、アレルギーおよび心血管疾患の治療または緩和に有用。</p> <div style="text-align: center;"> </div>	炎症系に作用する薬剤開発	脂質メディエーターに関わる薬剤	炭素環式

グラクソ・スミスクライン



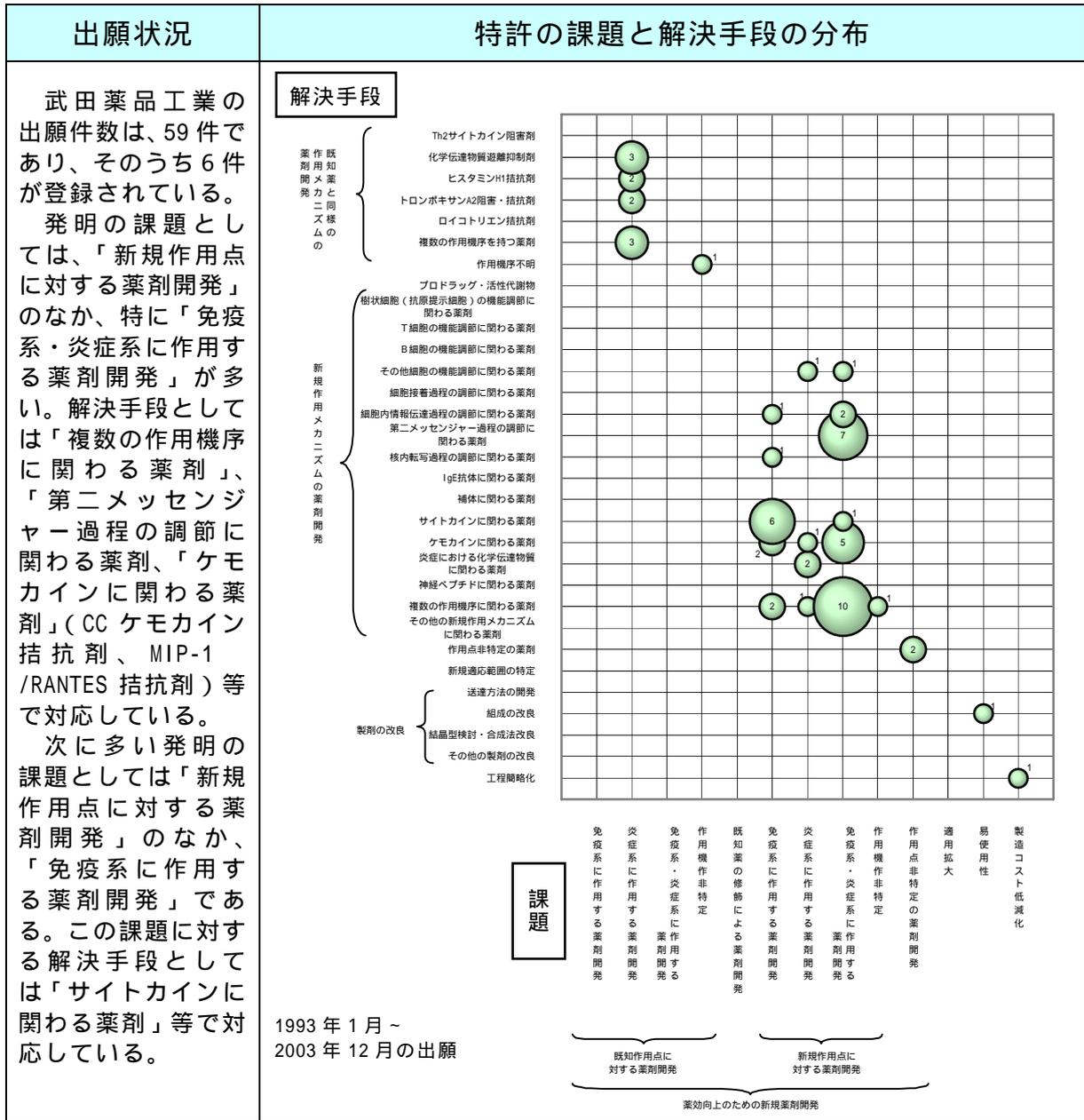
保有特許例				
特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要	課題	解決手段	技術要素
特表 2002-512957 98.04.27 A61K31/223 [被引用 7 回]	<p>CCR-3 受容体アンタゴニスト</p> <p>右式 (1) で示される CCR-3 受容体アンタゴニストおよび本化合物を投与することによる喘息、アレルギー性鼻炎、アトピー性皮膚炎などのアレルギー疾患の治療方法</p>	<p>炎症系に作用する薬剤開発</p>	<p>CC ケモカインに関わる薬剤</p>	<p>炭素環式</p>
	<p>式 (I)</p>			

シエリング・プラウ



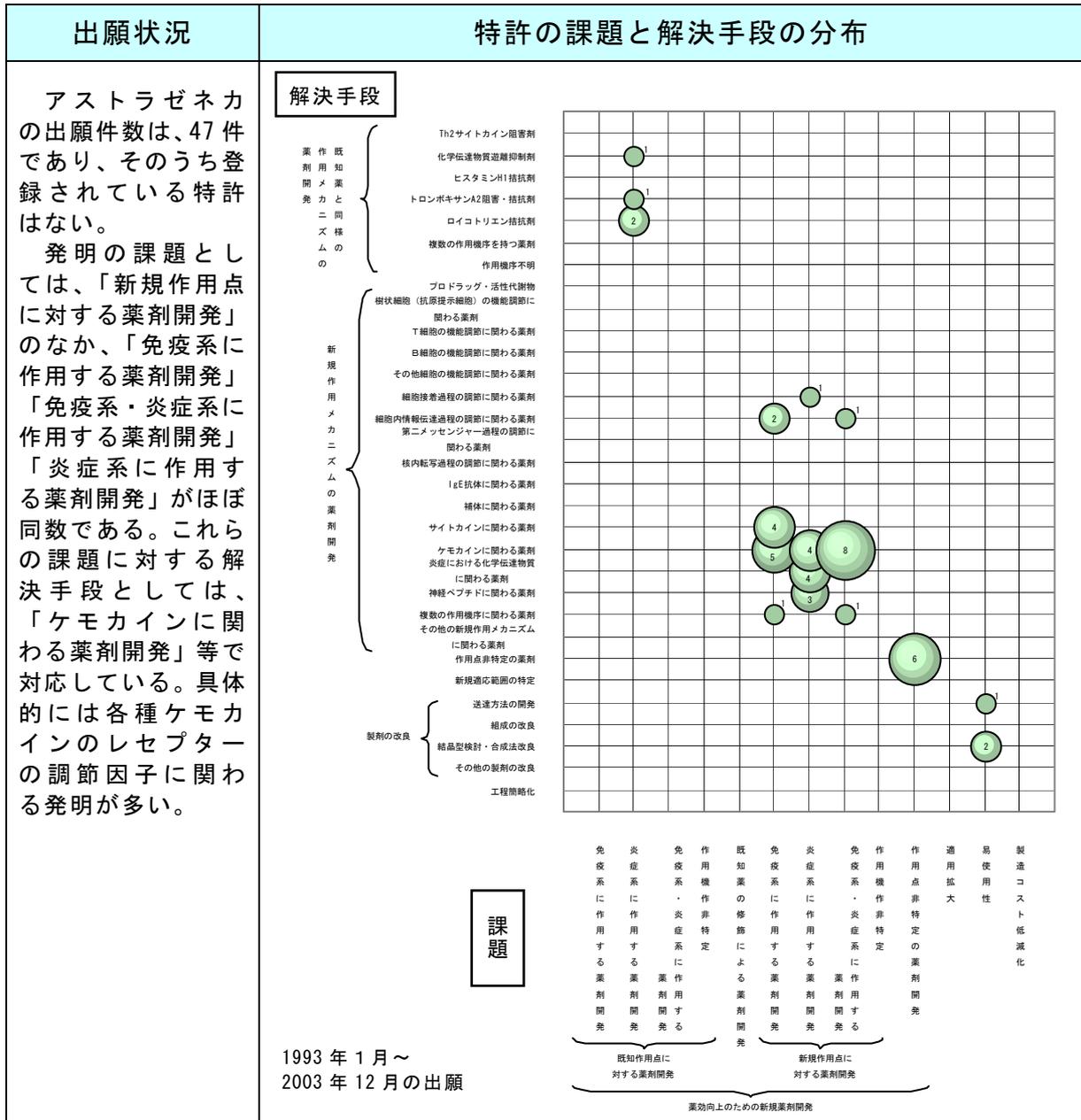
保有特許例				
特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要	課題	解決手段	技術要素
特許 3638289 97.08.13 A61K45/06 [被引用 1 回]	ヒスタミンレセプターアンタゴニストの組み合わせを用いる上気道アレルギー性応答の処置 (a) 抗ヒスタミン有効量のヒスタミン H1 レセプターアンタゴニストと、(b) 鼻充血除去効果を提供するための十分な量のヒスタミン H3 レセプターアンタゴニストとを同時に処置することによって、鼻炎の症状の緩和が得られる。	投与方法改善	組成の改良	複素環式

武田薬品工業株式会社



保有特許例				
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	課題	解決手段	技術要素
特許 3333774 99.04.23 C07D417/04	5-ピリジルー-1,3-アゾール化合物、その製造法及び用途 優れたアデノシン A3 受容体拮抗作用、p38MAP キナーゼ阻害作用、TNF- α 阻害作用を有する化合物、例えば N-[4-{2-エチル-4-(3-メチルフェニル)-1,3-チアゾール-5-イル}-2-ピリジル]ベンズアミドなど	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	複数の作用機序に関わる薬剤	複素環式

アストラゼネカ



保有特許例				
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	課題	解決手段	技術要素
特許 3553127 94.04.26 C07D405/12 シンジエンタ	<p>エーテル誘導体、その製造方法およびロイコトリエンが介在する疾患または症状に使用するためのそれを含有する調剤学的組成物</p> <p>右一般式 I のエーテル誘導体またはその塩、その製造方法ならびにその調剤学的組成物。アラキドン酸の 5-L0 による接触酸化が関係する多様な炎症及び/又はアレルギー性疾患の治療薬。</p>	炎症系に作用する薬剤開発	ロイコトリエン拮抗剤	複素環式

目次

1. 技術の概要	
1.1 抗アレルギー剤	3
1.1.1 抗アレルギー剤の概要	3
(1) アレルギー（過敏症）とは	3
(2) アレルギー疾患の現状	4
(3) アレルギー発症機序	5
1.1.2 本書で扱う抗アレルギー剤の範囲	8
(1) 対象疾患	8
(2) 抗アレルギー剤の定義	8
1.1.3 抗アレルギー剤の技術要素	9
(1) 合成医薬品	9
(2) 高分子医薬品	9
(3) 天然物医薬品	10
(4) 生薬	10
(5) その他の抗アレルギー剤	10
1.1.4 特許からみた技術の進展図	11
1.1.5 抗アレルギー剤開発の経緯と市場	16
(1) 抗アレルギー剤開発の経緯	16
(2) 抗アレルギー剤の市場	17
1.1.6 抗アレルギー剤開発の今後の展開	18
1.1.7 抗アレルギー剤の参考情報	25
1.2 抗アレルギー剤関連技術の特許情報へのアクセス	26
1.2.1 国際特許分類（IPC）、ファイル・インデックス（FI）	26
1.2.2 Fターム	28
1.2.3 キーワード	28
1.2.4 技術要素ごとのIPC	29
1.2.5 海外特許情報へのアクセス	29
1.3 技術開発活動の状況	30
1.3.1 抗アレルギー剤の技術開発活動の状況	30
(1) 出願人数と出願件数の推移	30
(2) 欧米の出願件数推移	33
(3) 出願件数上位出願人	35

1.3.2 抗アレルギー剤の技術要素別技術開発活動	36
(1) 合成医薬品	36
(2) 高分子医薬品	39
(3) 天然物医薬品	42
(4) 生薬	44
(5) その他の抗アレルギー剤	45
1.4 技術開発の課題と解決手段	46
(1) 技術開発の課題	46
(2) 解決手段	47
1.4.1 抗アレルギー剤の技術要素毎の課題	50
1.4.2 抗アレルギー剤の課題と解決手段	53
1.4.3 解決手段に関する特記事項	57
1.4.4 抗アレルギー剤の技術要素別の課題と解決手段	62
(1) 合成医薬品	62
(2) 高分子医薬品	98
(3) 天然物医薬品	117
(4) 生薬	122
(5) その他の抗アレルギー剤	127
1.4.5 抗アレルギー剤の疾患別出願動向	132
1.5 注目される特許	134
1.5.1 注目される特許の抽出	134
1.5.2 注目される特許の課題・解決手段対応の出願人	139
1.5.3 注目される特許の関連図	141
2. 主要企業、大学・公的研究機関等の特許活動	
2.1 ファイザー(米国)	150
2.1.1 企業の概要	150
2.1.2 製品例	150
2.1.3 技術開発拠点と研究者	150
2.1.4 技術開発課題対応特許の概要	151
2.2 グラクソ・スミスクライン(イギリス)	169
2.2.1 企業の概要	169
2.2.2 製品例	169
2.2.3 技術開発拠点と研究者	169
2.2.4 技術開発課題対応特許の概要	170

2.3 シェリング・ブラウ(米国)	181
2.3.1 企業の概要	181
2.3.2 製品例	181
2.3.3 技術開発拠点と研究者	182
2.3.4 技術開発課題対応特許の概要	182
2.4 武田薬品工業	190
2.4.1 企業の概要	190
2.4.2 製品例	190
2.4.3 技術開発拠点と研究者	190
2.4.4 技術開発課題対応特許の概要	191
2.5 アストラゼネカ(イギリス)	199
2.5.1 企業の概要	199
2.5.2 製品例	199
2.5.3 技術開発拠点と研究者	199
2.5.4 技術開発課題対応特許の概要	200
2.6 三共	207
2.6.1 企業の概要	207
2.6.2 製品例	207
2.6.3 技術開発拠点と研究者	207
2.6.4 技術開発課題対応特許の概要	208
2.7 大正製薬	214
2.7.1 企業の概要	214
2.7.2 製品例	214
2.7.3 技術開発拠点と研究者	215
2.7.4 技術開発課題対応特許の概要	215
2.8 サノフィ・アベンティス(フランス)	222
2.8.1 企業の概要	222
2.8.2 製品例	222
2.8.3 技術開発拠点と研究者	223
2.8.4 技術開発課題対応特許の概要	224
2.9 ベーリンガーインゲルハイム(ドイツ)	229
2.9.1 企業の概要	229
2.9.2 製品例	229
2.9.3 技術開発拠点と研究者	229
2.9.4 技術開発課題対応特許の概要	230

2.10 メルクアンドコー	235
2.10.1 企業の概要	235
2.10.2 製品例	235
2.10.3 技術開発拠点と研究者	235
2.10.4 技術開発課題対応特許の概要	236
2.11 アステラス製薬	241
2.11.1 企業の概要	241
2.11.2 製品例	241
2.11.3 技術開発拠点と研究者	241
2.11.4 技術開発課題対応特許の概要	242
2.12 協和醗酵工業	247
2.12.1 企業の概要	247
2.12.2 製品例	247
2.12.3 技術開発拠点と研究者	247
2.12.4 技術開発課題対応特許の概要	248
2.13 小野薬品工業	253
2.13.1 企業の概要	253
2.13.2 製品例	253
2.13.3 技術開発拠点と研究者	253
2.13.4 技術開発課題対応特許の概要	254
2.14 三菱ウエルファーマ	259
2.14.1 企業の概要	259
2.14.2 製品例	259
2.14.3 技術開発拠点と研究者	259
2.14.4 技術開発課題対応特許の概要	260
2.15 ジョンソン・アンド・ジョンソン(米国)	265
2.15.1 企業の概要	265
2.15.2 製品例	265
2.15.3 技術開発拠点と研究者	265
2.15.4 技術開発課題対応特許の概要	266
2.16 バイエル(ドイツ)	271
2.16.1 企業の概要	271
2.16.2 製品例	271
2.16.3 技術開発拠点と研究者	271
2.16.4 技術開発課題対応特許の概要	272

2.17 メルク(ドイツ)	277
2.17.1 企業の概要	277
2.17.2 製品例	277
2.17.3 技術開発拠点と研究者	277
2.17.4 技術開発課題対応特許の概要	278
2.18 大日本住友製薬	282
2.18.1 企業の概要	282
2.18.2 製品例	282
2.18.3 技術開発拠点と研究者	282
2.18.4 技術開発課題対応特許の概要	283
2.19 日研化学	287
2.19.1 企業の概要	287
2.19.2 製品例	287
2.19.3 技術開発拠点と研究者	287
2.19.4 技術開発課題対応特許の概要	288
2.20 イーライリリーアンドカンパニー(米国)	293
2.20.1 企業の概要	293
2.20.2 製品例	293
2.20.3 技術開発拠点と研究者	293
2.20.4 技術開発課題対応特許の概要	294
2.21 塩野義製薬	298
2.21.1 企業の概要	298
2.21.2 製品例	298
2.21.3 技術開発拠点と研究者	298
2.21.4 技術開発課題対応特許の概要	299
2.22 大学・公的研究機関等	303
2.23 主要企業等以外の特許番号一覧	309
3. 主要企業の技術開発拠点	
3.1 抗アレルギー剤の技術開発拠点	327
資料	
1. ライセンス提供の用意のある特許	331

【本チャートに関する留意事項】

- 1．一部の出願人の名称について略記を用いている場合がある。
- 2．特許リスト等における出願人については作成時点での最新情報を反映させている。
- 3．本チャート掲載の製品名等は、各企業等が所有する商標または登録商標である。
- 4．掲載されている特許についてライセンスできるかどうかは各企業、大学・公的研究機関等の状況により異なる。

1. 技術の概要

- 1.1 抗アレルギー剤
- 1.2 抗アレルギー剤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 注目される特許

1. 技術の概要

近年、環境条件の悪化などの諸事情により、気管支喘息、花粉症、アレルギー性鼻炎、アトピー性皮膚炎などのアレルギー性疾患に悩む人が増加している。これらアレルギー性疾患の治療法としては、「抗アレルギー剤」や「ステロイド剤」が開発され大きく前進したが、対症療法的な域を出ず、根治的な治療薬の創製が期待されている。

これらの期待の下、薬効向上のための新規薬剤開発が活発化している。顕著な動きとしては、新規作用点、特に免疫系をターゲットにした治療薬が2001年以降増加していることがあげられる。

1.1 抗アレルギー剤

近年、環境条件の悪化や生活様式の変化、社会生活様式の変化、社会生活の複雑化に伴うストレスの増加などにより、気管支喘息、花粉症、アレルギー性鼻炎、アトピー性皮膚炎、薬物による蕁麻疹などのアレルギー性疾患に悩む人が増加している。

これらアレルギー疾患の治療法としては「抗アレルギー剤」と呼ばれる一連の薬剤や吸入用あるいは外用「ステロイド剤」が開発され大きく前進したが対症療法的な域を出ず、根治的な治療薬の創製が期待されている。

1.1.1 抗アレルギー剤の概要

(1) アレルギー（過敏症）とは

アレルギーは「本来なら無害であるはずの抗原に対する免疫応答によって起こる疾患」と定義されており、免疫応答システムに関連した過敏反応によって起こる疾患（過敏症）である。すなわち、人がアレルゲン（抗原）に感作されると、体内に免疫グロブリンE（IgE）抗体が産生され、同じアレルゲンにもう一度触れると体内で抗原抗体反応が起こり、組織障害を起こす過敏性反応、すなわち、アレルギー症状を起こす疾患である。

アレルギー（過敏症）はその作用機作に応じて以下の4種に分類されている。

表 1.1.1-1 アレルギー(過敏症)の分類

型	抗体・補体	抗原	表現時間	関与する細胞・物質	標的器官	代表的疾患
型 アナフィラキシー型	IgE	外来性抗原	即時型・遅発型	肥満細胞、好塩基球 IgE	皮膚、肺、腸など	アナフィラキシーショック、喘息、蕁麻疹、鼻炎、花粉症など
型 細胞融解型	IgG・IgM	細胞や間質の抗原	即時型	IgG、IgM、補体網内系	赤血球、白血球、甲状腺など	Rh 不適合、溶血性貧血、薬物アレルギー、紫斑病、橋本病、バセドウ病など
型 抗原・抗体複合体型	免疫複合体	細胞外に存在する外因性・内因性抗原	即時型	好中球 抗原・抗体複合体、補体	血管、皮膚、関節、腎臓など	全身性エリテマトーデス、糸球体腎炎、慢性関節リウマチ、薬疹、血管炎など
型 細胞性免疫型	Tリンパ球	外因性・内因性抗原	遅延型	感作リンパ球 リンホカイン	皮膚、肺、中枢神経系など	感染症、接触性皮膚炎、過敏性肺炎、多発性硬化症、脊髄炎、脳炎など

* IgG は免疫グロブリン G の略、IgM は免疫グロブリン M の略

表 1.1.1-2 アレルギーの型の特徴

型 アナフィラキシー型 (IgE 型、アレルギー型)	多くのアレルギー疾患はこの型で起こる。IgE 抗体を介して炎症が起こるタイプで、気管支喘息、鼻炎、花粉症、蕁麻疹などの疾患があげられ、抗アレルギー薬が処方される。
型 細胞融解型	赤血球が抗原となって産生された自己抗体と反応し、赤血球が破壊されるなどの自己免疫溶血性貧血や Rh 不適合、薬剤アレルギーなどの疾患があげられる。
型 抗原・抗体複合体型	多くの自己免疫疾患はこの型に属する。「抗原 抗体 補体」複合物が周辺の細胞を障害、破壊するもので関節リウマチ、糸球体腎炎、全身性エリテマトーデスなどの疾患をおこす。
型 細胞性免疫型 (ツベルクリン型)	前三者は抗原と反応するのは抗体であるが、型ではリンパ球である。感作リンパ球が抗原と反応して種々のサイトカインを放出し障害を起こす。過敏性肺臓炎や接触性皮膚炎などがある。

一方、免疫系異常疾患の分類として 免疫反応に基づく組織障害でおこるアレルギー疾患、自分の体の構成細胞成分に対して抗体(自己抗体)をつくり抗原抗体反応を起こし組織を破壊していく自己免疫疾患、免疫機能自身の異常に基づく免疫不全、ならびに免疫増殖性症候群に大別されており、アレルギーは自己免疫疾患と区別されている。

(2) アレルギー疾患の現状

a. 患者動向

アレルギー性疾患の患者数は、3年ごとに実施される厚生労働省の患者調査によると平成 14 年は喘息患者は 107 万人、アレルギー性鼻炎は 40 万人、アトピー性皮膚炎は 28 万人、蕁麻疹 15 万人、結膜炎(アレルギー性に限らない) 32 万人である。喘息、アレルギー性鼻炎、アレルギー性皮膚炎(アトピー性皮膚炎、接触性蕁麻疹など含む)がこの分野の 3 大疾患とうかがえる。

表 1.1.1-3 アレルギー疾患の総患者数（単位：千人）

	平成 8 年	平成 11 年	平成 14 年
喘息	1,146	1,096	1,069
アレルギー性鼻炎	438	469	402
アトピー性皮膚炎	318	399	279
蕁麻疹	158	153	153

出典：厚生労働省「患者調査」

平成 8 年上巻第 92 表、平成 11 年上巻第 65 表、平成 14 年上巻第 65 表

b. 薬物療法の現状

アレルギー疾患の薬物療法における抗アレルギー剤の位置づけをみると、気管支喘息では予防維持薬として、アレルギー性鼻炎、蕁麻疹では第一選択薬として、アトピー性皮膚炎では内服薬として補助的に使用されている。表 1.1.1-4 に概要を示す。

表 1.1.1-4 薬物療法の現状

アレルギー性疾患	薬物療法の現状
気管支喘息	<ul style="list-style-type: none"> 厚生労働省免疫・アレルギー研究班「喘息予防・管理ガイドライン 2003」に重症度に応じた薬物療法の指針が提示されている。 急性発作時には気管支拡張剤（β_2-刺激薬、テオフィリン製剤、抗コリン剤）が使われる。 長期管理（予防維持薬）には吸入ステロイドが第一選択薬であるが、重症度に応じてテオフィリン製剤や抗アレルギー剤が併用薬として使われる。 抗アレルギー剤ではロイコトリエン拮抗剤が即効性あり有用とされている。
アレルギー性鼻炎	<ul style="list-style-type: none"> ハウスダスト・ダニなどによる通年性の鼻炎と花粉症などの季節性アレルギー性鼻炎がある。 治療法としては抗原除去、回避が基本であるが薬物療法としては予防には抗アレルギー剤がもっぱら使われ、軽症、中等症の治療には抗アレルギー剤が、重症ではステロイド剤が使われる。
アレルギー性皮膚炎	<ul style="list-style-type: none"> 植物や食物による接触蕁麻疹やアトピー性皮膚炎など。 蕁麻疹については抗アレルギー剤が使用され必要に応じてステロイド剤が内服される。 アトピー性皮膚炎についてはもっぱら外用ステロイドが使用され、厚生労働省「厚生科学班アトピー性皮膚炎治療ガイドライン 2002」では、その重症度によって各種外用ステロイド剤の使用指針が示されている。抗アレルギー剤は必要に応じて内服薬として使用される。 最近、免疫抑制剤のプロトピック（商品名）が上市され使用され始めた。

(3) アレルギー発症機序

型アレルギーの成立過程を概観すると三段階に分けられる。第一段階はアレルゲンの感作によって IgE が産生されるまでの過程、第二段階は IgE が肥満細胞や好塩基球の表面に結合し、さらに抗原と反応してこれらの細胞を活性化する過程、第三段階は活性化の結果、各種の起炎性化学伝達物質が放出されてアレルギー反応が起こる過程に大別できる。本報告書では第一段階、第二段階を免疫過程、第三段階を炎症過程と定義し整理した。以下に概説を加えると共に、アレルギーの発生機序と薬の作用点に関する模式図を図 1.1.1-1 に示す。

a. 免疫過程

（第一段階）

型アレルギーは IgE 抗体の過剰産生によって引き起こされるとされており、実際、

アレルギー患者では IgE 抗体が高いことが知られている。IgE 抗体はヒトがアレルゲン (抗原)によって感作されると、抗原提示細胞、ヘルパーT2 (Th2) 細胞の活性化を経て、B細胞によって生成される。そして、その制御は、ヘルパーT細胞、すなわち、Th2 細胞の産生するインターロイキン4 (IL-4) によって増強され、ヘルパーT1 (Th1) 細胞の産生するインターフェロン (IFN- γ) によって抑制されることによって行われている。

(第二段階)

型アレルギー (即時型反応) では生成された IgE 抗体は粘膜や結合組織に存在する肥満細胞 (マスト細胞) や血液中に存在する好塩基球の表面の IgE 分子の Fc 部分のレセプターである高親和性 IgE 受容体 (Fc ϵ R) に結合する。そして、この IgE 抗体が結合した細胞にさらに抗原が結合すると、IgE 抗体の結合した受容体が架橋形成し、高次構造に変化が生じ細胞を活性化する。

b. 炎症過程

(第三段階)

活性化された肥満細胞や好塩基細胞では、細胞内へのカルシウムの流入が起き、細胞内に存在する顆粒の放出がおこる (脱顆粒現象)。顆粒内にはヒスタミン、セロトニン、好酸球遊走因子 (ECF-A)、好中球遊走因子 (NCF) などの化学伝達物質が蓄積されており、放出されることにより周囲の細胞に対し、血管透過性の亢進、平滑筋の収縮、粘液分泌亢進などの炎症作用を起こさせ、アレルギー状態となる。

脱顆粒によって新たに合成される生理活性物質もあり、それらは、プロスタグランジン (トロンボキサン、ロイコトリエンなど)、血小板活性化因子 (PAF : platelet-activating factor)、インターロイキン3 (IL-3)、IL-4、インターロイキン5 (IL-5)、インターロイキン6 (IL-6)、などであり、炎症の原因物質となる。

型アレルギーは即時型反応であるが、関与する細胞の種類と時間経過に伴って、即時型反応、遅発型反応、後遅発型反応に分けて考えられている。大部分の型アレルギーは即時型反応であるが、喘息では遅発型反応そして慢性化には後遅発型反応が関与している。

・遅発型反応 - 好酸球の関与

アトピー型喘息患者の場合、抗原吸入後に起こる即時型の攣縮 (れんしゅく) に続いて、6 ~ 10 時間後に遅発型の発作 (遅発型喘息) が起こる。遅発型反応には好酸球が関与している。

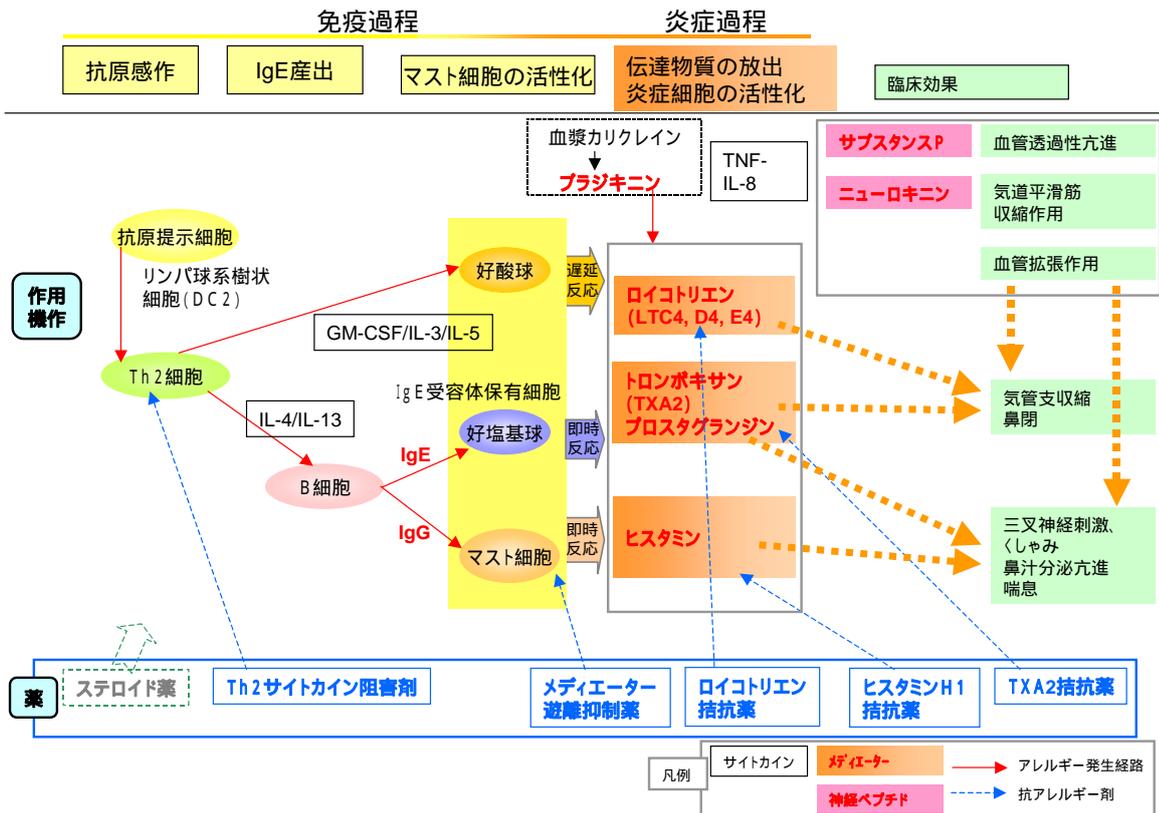
肥満細胞は好酸球遊走因子 (ECF-A) を産生し、感作T細胞も IL-5 を産生して、好酸球を引き寄せる。この好酸球への IgE の結合 (低親和性の IgE 受容体 (Fc ϵ R) を介する) と抗原による架橋によって、再度、脱顆粒が起こり主要塩基性蛋白質 (MBP : major basic protein)、好酸球カチオン蛋白質 (ECP : eosinophil cationic protein)、ペルオキシダーゼ、ロイコトリエン、血小板活性化因子などの細胞障害因子が放出され、気道を傷害し喘息発作を起こす。本過程においても脱顆粒以後を炎症過程、以前を免疫過程とした。

・後遅発型反応

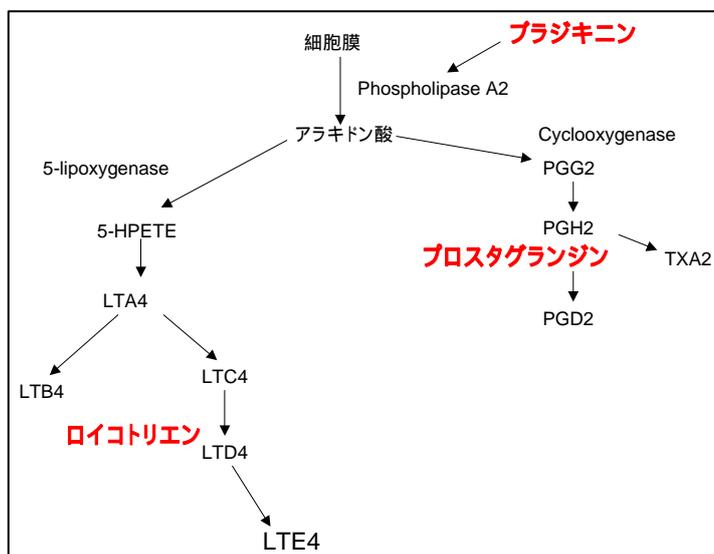
気管支喘息では慢性化を伴うことが多い。これは好酸球の浸潤とこれに続く脱顆粒に

よって生じた MBP、ECP などの成分による気道上皮の障害に起因するもので、この障害により迷走神経末端が露出し、刺激受容器 (irritant receptor) や無髄線維である C-線維受容体が刺激され、この刺激が知覚神経より中枢へ、そして、軸索反射により神経末端に伝達され、サブスタンス P、ニューロキニンなどの神経ペプチドの産生が促され、気管平滑筋の収縮、血管透過性の亢進、粘膜での分泌亢進を持続させ、炎症の慢性化が起こる。この過程を炎症過程とした。

図 1.1.1-1 型アレルギーの発症機序と既存抗アレルギー剤の作用点



* TNF- は腫瘍壊死因子の略、IL-8 はインターロイキン 8 の略、GM-CSF は (顆粒球マクロファージコロニー刺激因子 granulocyte-macrophage colony-stimulating factor) の略



* 略号
PG : プロスタグランジン、
LT : ロイコトリエン、
TX : トロンボキサン、
5-HPETE : 5-ヒドロペルオキシ
エイコサテトラエン酸

c. 抗アレルギー剤の作用点

現在、上市されている抗アレルギー剤は、メディエーター遊離抑制剤、ヒスタミン H1 拮抗剤、トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤、ロイコトリエン拮抗剤、Th2 サイトカイン阻害剤に分類されている。これらの市販の抗アレルギー薬の特徴を表 1.1.1-5 に整理した。

表 1.1.1-5 市販の抗アレルギー薬

	特徴
メディエーター遊離抑制薬	IgE が結合した肥満細胞は脱顆粒によって化学伝達物質を放出するが、メディエーター遊離抑制薬は細胞の膜安定化などにより脱顆粒を抑制、化学伝達物質の遊離過程を抑えることにより抗アレルギー作用を発揮する。
ヒスタミン H1 拮抗薬	放出された化学伝達物質ヒスタミンの作用を細胞のヒスタミン受容体レベルで拮抗的に抑制することによって抗アレルギー作用を発揮する。
トロンボキサン A2 阻害・拮抗薬	炎症性プロスタグランジンのトロンボキサンの作用を、トロンボキサン合成酵素の阻害によりトロンボキサンの生成を抑制する（阻害剤）か、トロンボキサン作用細胞の受容体レベルで拮抗的に抑制（拮抗剤）し、抗アレルギー作用を発揮する。
ロイコトリエン拮抗薬	喘息の増悪因子のロイコトリエンの作用を細胞の受容体レベルで拮抗的に抑制し、抗アレルギー作用を示す。
Th2 サイトカイン阻害薬	アイピーディ（製品名）は IgE 産生抑制薬とも呼ばれ、ヘルパー T 細胞からの IL-4、IL-5 の産生を抑制し、IgE 抗体の産生を抑えることによって抗アレルギー効果を発揮する。

1.1.2 本書で扱う抗アレルギー剤の範囲

本チャートで取り上げる抗アレルギー剤とは、Ⅰ型（アナフィラキシー型：IgE 型）アレルギー疾患（過敏症）の医療用医薬品に関するものであり、減感作療法、遺伝子治療などの治療法剤や、臨床検査薬、診断薬、動物薬、食品、化粧品などは対象としない。

(1) 対象疾患

Ⅰ型アレルギーの代表的疾患には気管支喘息、アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、胃腸管アレルギー、アレルギー性結膜炎などがあり、アトピー性皮膚炎の発生機序はまだ良くわかっていないがⅠ型とⅡ型が関与しているといわれている。本調査においては、アレルギー疾患のうちでも、特に患者数が多く重要疾患の気管支喘息、アレルギー性鼻炎、アレルギー性皮膚炎を対象疾患とした。

(2) 抗アレルギー剤の定義

抗アレルギー剤は、一時、慢性関節リウマチなどの膠原病（自己免疫疾患）も含めて、すべてのアレルギー反応（Ⅰ～Ⅳ型）を抑える薬剤（広義の抗アレルギー剤）と定義されたこともあるが、現在ではⅠ型アレルギー反応を抑える薬剤（狭義の抗アレルギー剤）として捉えられている。実際、1998 年の喘息予防・管理ガイドライン（厚生省免疫・アレルギー研究班編）でも、「抗アレルギー剤」としてメディエーター遊離抑制剤、ヒスタミン H1 拮抗剤、トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤、ロイコトリエン拮抗剤、Th2 サイトカイン阻害剤の 5 種が挙げられており、いずれもⅠ型アレルギー発症機序に関わる薬剤である。表 1.1.2-1 に概要を示す。

表 1.1.2-1 抗アレルギー剤定義の変遷

広義の抗アレルギー剤 (1983 年)	狭義の抗アレルギー剤 (現在の定義)
1. メディエーター遊離抑制剤 2. 抗ヒスタミン剤 3. 抗 SRS-A 剤 4. リボキシゲナーゼ抑制剤 5. グルココルチコイド 6. 気管支拡張剤 7. ヒスタミン加ヒト グロブリン製剤 8. 金製剤 9. グリチルリチン	1. メディエーター遊離抑制剤 2. ヒスタミン H1 拮抗剤 3. トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤 4. ロイコトリエン拮抗剤 5. Th2 サイトカイン阻害剤

* SRS-A は slow reacting substance of anaphylaxis の略

したがって、本チャートでは 型アレルギー発症の過程にかかわり、アレルギーを抑制するすべての薬剤を抗アレルギー剤と定義する。ただし、ステロイド（副腎皮質ホルモン）剤、免疫抑制剤は通常、抗アレルギー剤に分類されていないので本書でも対象外とした。

1.1.3 抗アレルギー剤の技術要素

医薬品（製剤化された製品）の主成分である生理活性物質、すなわち原薬の種類は、合成医薬品、高分子医薬品、天然物医薬品、生薬である。本書では技術要素として原薬の種類から、技術要素として原薬の化学構造上の特徴から分類した。

表 1.1.3-1 抗アレルギー剤の技術要素

技術要素	技術要素
合成医薬品	炭素環式
	複素環式
	非環式
高分子医薬品	抗体医薬品
	蛋白質医薬品
	ペプチド医薬品
	核酸医薬品
天然物医薬品	植物由来
	微生物由来
	動物由来
生薬	
その他の抗アレルギー剤	

(1) 合成医薬品

合成医薬品の特徴は、医薬品の大半は合成医薬品であり、探索には有機合成手法が使われ、化学的、代謝的安定性もよく、経口可能な錠剤が多い。生産は化学合成法を基本とし大量生産も比較的容易。さらに化学構造式から炭素環式、複素環式、非環式化合物に大別される。その基本骨格には複素環式構造をもつ化合物が多い。

(2) 高分子医薬品

高分子医薬品の特徴は、近年の分子生物学の進歩により遺伝子レベルまで遡って病因

が解明され、抗体医薬品、蛋白質医薬品が実用化された。化学的、代謝的安定性は不安定で経口剤は難しく、静脈注射、筋肉注射などの製剤となる。生産には遺伝子組み換えなどのバイオ技術が中心となる。また、化学構造上などから抗体医薬、蛋白質医薬、ペプチド、核酸に分類される。

(3) 天然物医薬品

天然物医薬品の特徴は、天然物に含まれる生理活性物質は抗生物質に代表されるように多くの優れた医薬品を生んだ。植物由来、微生物由来、動物由来とその起源によって分類できる。生産には天然物抽出技術、発酵技術、酵素技術、天然物を原料とした半合成技術などが使われる。

(4) 生薬

生薬の特徴は、漢方薬として広く使われるが、伝承薬も含めてその成分、またはその化学修飾した物質も含む。

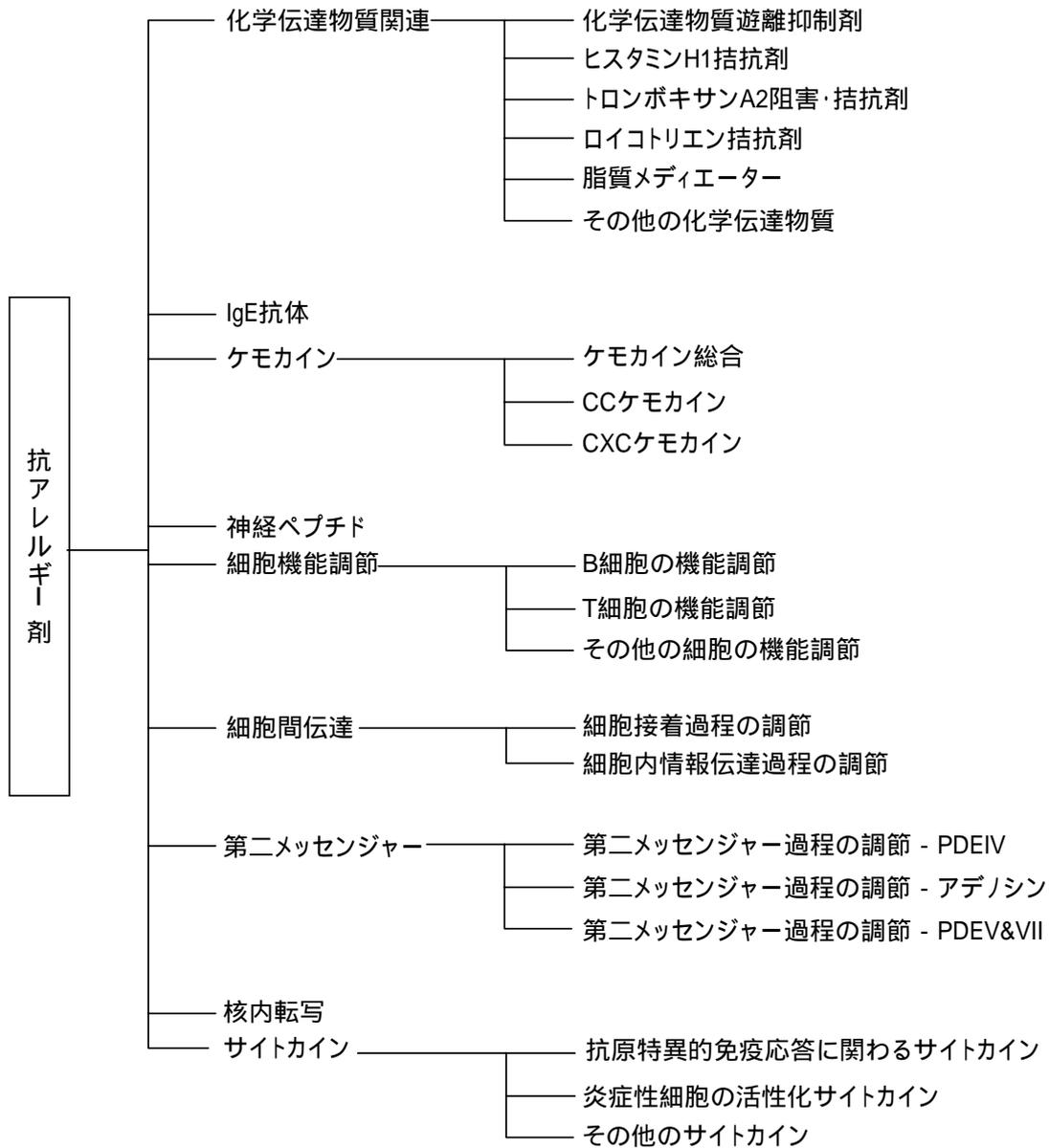
(5) その他の抗アレルギー剤

その他の抗アレルギー剤としては、ドラッグデリバリーに関する薬剤や海洋ミネラル成分などを指す。

1.1.4 特許からみた技術の進展図

図 1.1.4-1 に、抗アレルギー剤利用技術に関連する技術の進展の全体像を示す。医薬品開発においては特に核となる新規医薬品開発における薬剤標的の観点から特許を整理した。

図 1.1.4 -1 抗アレルギー剤利用技術に関連する技術の進展の全体像



以下に各技術について、特許をもとにした技術の進展を図 1.1.4-2 に示す。

図の中で、二重の枠線で囲んだ特許は、「1.5 注目される特許」にでてくる引用回数が多い特許である。太線で囲んだ特許は、市販されている医薬品の特許である。

化学伝達物質の標的選択は、既存薬の標的と同様であるが、各社合成化合物の構造的な特徴を変えて、より効果の高い医薬品の開発を行い、特許出願をしている。化学伝達物質関連においては、キッセイ薬品工業や武田薬品工業、小野薬品などから既存薬が発売されており、既存薬に関する特許を 70 年代、80 年代前半に出願している。しかしながら、それに続く薬剤開発は、アストラゼネカやファイザーなど海外の企業からの出願が多くみられる。

IgE 抗体やケモカイン、神経ペプチド、細胞機能調節、細胞間伝達や第二メッセンジャー、核内転写、サイトカイン・ケモカインなどは、抗アレルギー剤の新たな標的として注目され、それぞれ標的に効果的に働く薬剤の化学構造を探索して研究開発が進展している。

なお、医薬品における薬剤の重要性は、その薬剤の薬効が認められてから生じるため同一標的に対して最初に開発された薬剤が強い権利を持つとは断定できない。

図 1.1.4-2 特許からみた技術の進展図(1)

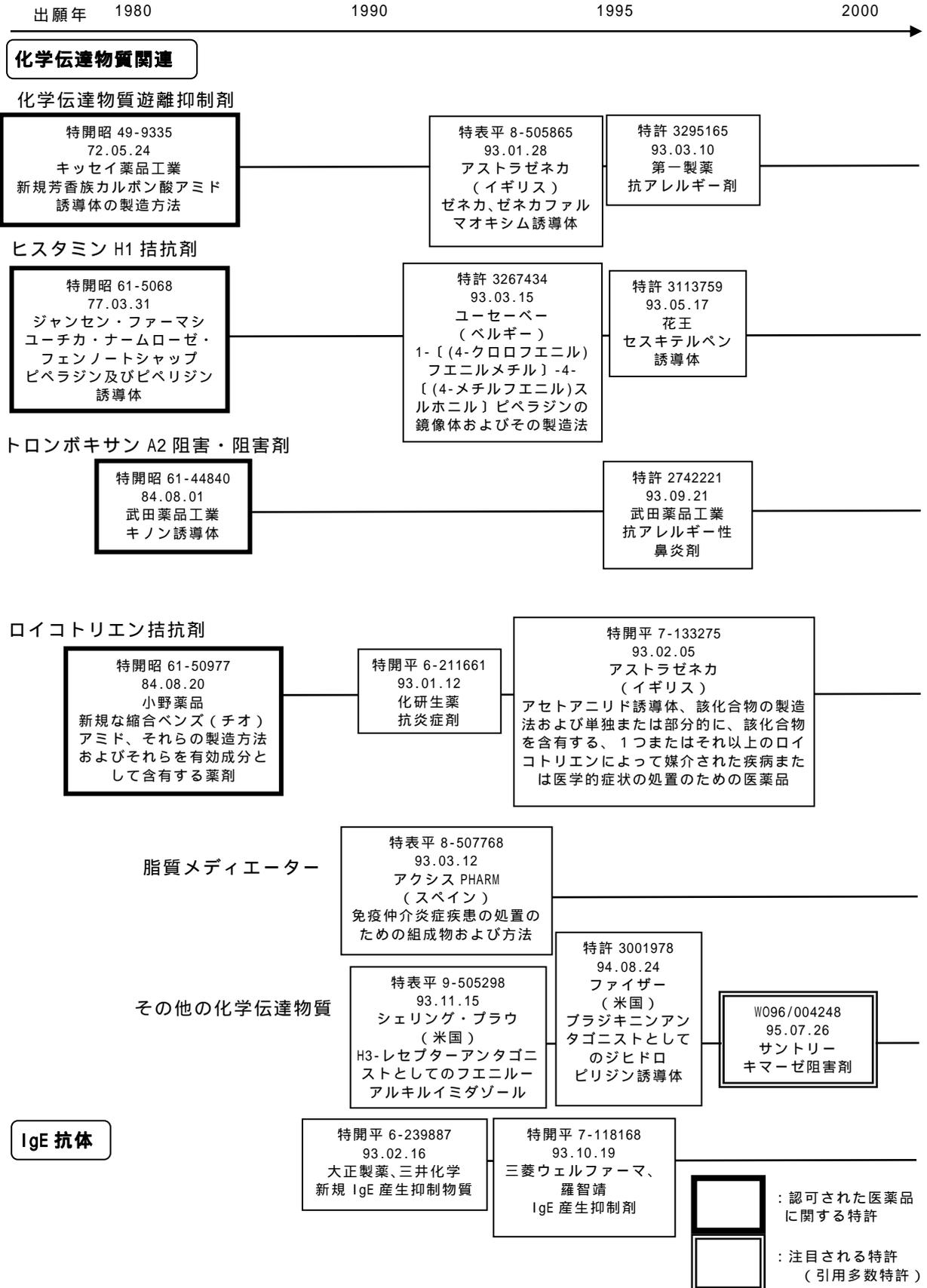


図 1.1.4-2 特許からみた技術の進展図(2)

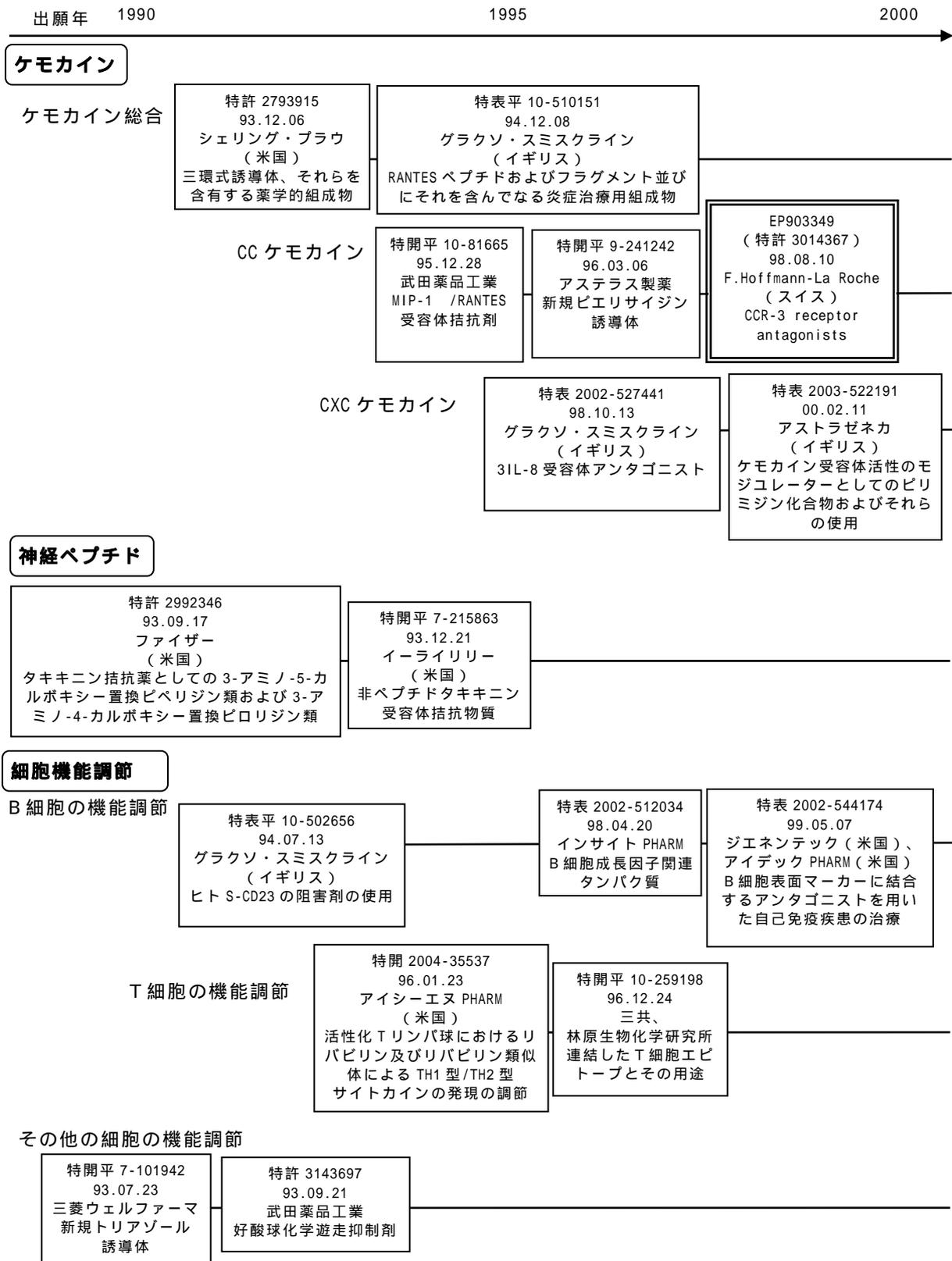
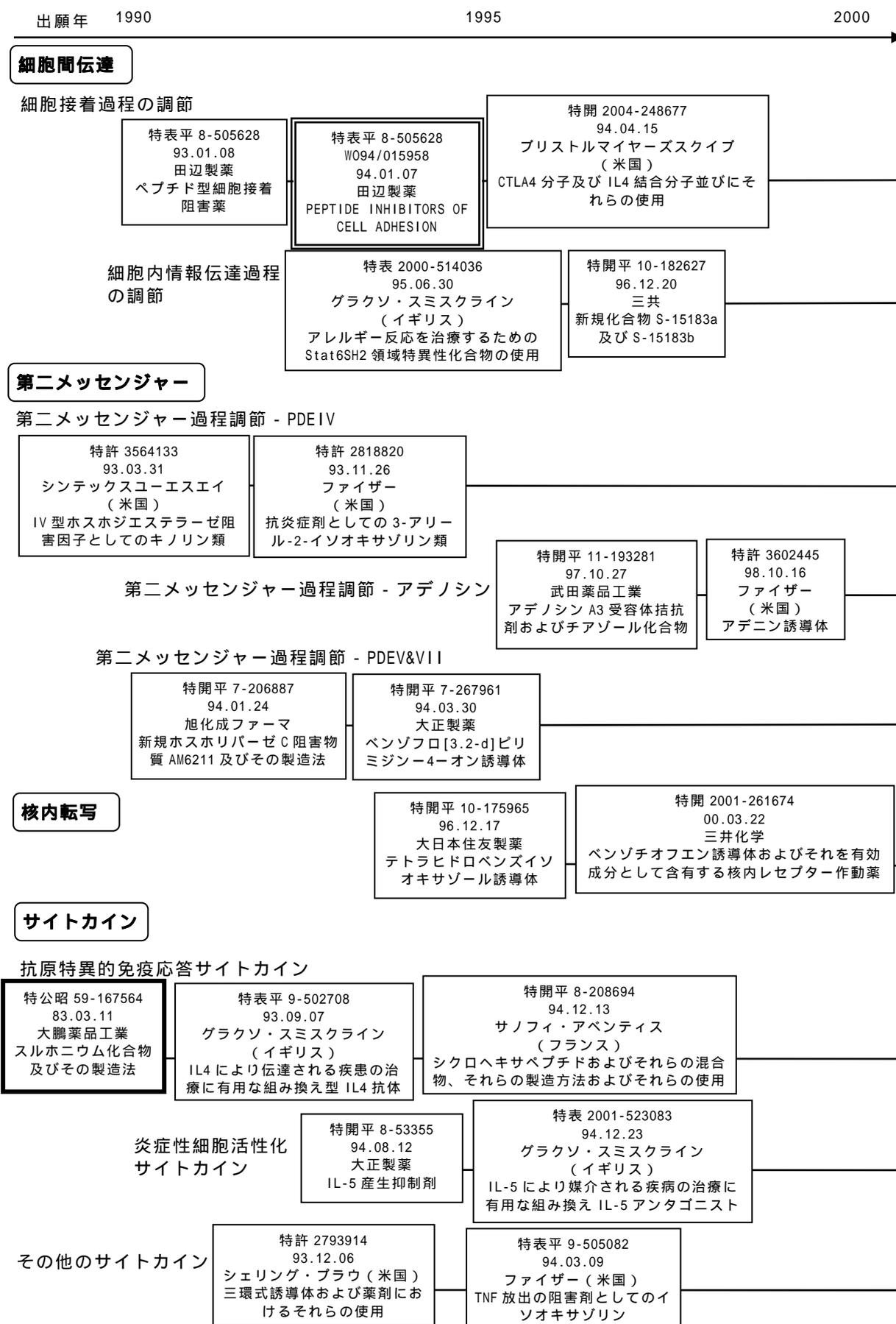


図 1.1.4-2 特許からみた技術の進展図(3)



1.1.5 抗アレルギー剤開発の経緯と市場

(1) 抗アレルギー剤開発の経緯

抗アレルギー剤開発の歴史的経緯を以下に概説する。

1910年にヒスタミンが発見され、アレルギー疾患の原因物質との認識から抗ヒスタミンの研究が開始された。その結果、1940年代のフェンベンザミンの発見を契機に1970年代までに多くの抗ヒスタミン薬が開発された。これらの抗ヒスタミン薬はいわゆる、第一世代と呼ばれ、抗ヒスタミン作用は強いが抗コリン作用、局所麻酔作用、中枢抑制作用の副作用を示すものが多いことから治療薬としては限定的なものであった。

・メディエーター遊離抑制剤

1965年に植物成分の研究からクロモグリク酸ナトリウム(DSCG)が肥満細胞を安定化、アレルギー性ケミカルメディエーターの遊離を抑制することが発見され、抗アレルギー剤開発の端緒が開かれた。1970年代に上市された本薬は非経口型の化合物であったが、吸入など投与方法の改良、点眼、点鼻、エアゾール剤の開発により、当初喘息だけだった適応症も、アレルギー性鼻炎、アトピー性皮膚炎へと広がり、息の長いトップクラスの医薬品(ベンジャーズ社のインタール)になった。その後、この分野では1982年に至り、非経口剤の欠点を克服した経口投与型メディエーター遊離抑制剤のトラニラスト(キッセイ薬品のリザベン)が開発された。

・第二世代：ヒスタミン H1 拮抗剤

1983年に至り、所謂、第二世代の抗ヒスタミン剤と呼ばれるケトチフェン(ノバルティスのザジテン)が上市された。本剤は化学伝達物質の一つであるヒスタミン作用をレセプターレベルで阻害するヒスタミン H1 拮抗作用薬であり、中枢移行性が低く、局麻作用などの副作用が分離された特徴を持つ。そして、ザジテン以降のヒスタミン H1 拮抗剤は H1 受容体に対する特異性が向上して気管支喘息、アレルギー性鼻炎、皮膚科領域にも適用されるようになり、オキサトミド(協和発酵のセルテクト)などの大型製品が開発された。

・第三世代：ヒスタミン H1 拮抗剤

1990年代に入り、ヒスタミン H1 拮抗剤の欠点とされた「眠気」の副作用を大幅に少なくした「第三世代のヒスタミン H1 拮抗剤」が次々と開発された。第一はテルフェナジン(サノフィ・アベンティスのトリルダン)であり、続いて94年にエピナスチン(日本ベーリンガーインゲルハイムのアレジオン)が登場した。本剤は、一日一回投与型の特徴をもち、大型商品になった。96年にはエバスチン(大日本製薬のエバステル)、98年には塩酸セチリジン(ユーシービージャパンのジルテック 販売会社は第一製薬、住友製薬)などが発売された。しかし、第三世代の扉を開いたテルフェナジン(トリルダン)は重篤な副作用のため現在発売中止となっている。

・脂質メディエーター抑制剤

同じく90年代に入って、トロンボキサン、ロイコトリエンなどの脂質メディエーターをターゲットとする新しい作用メカニズムをもつ抗アレルギー剤が開発された。トロンボキサン A2 阻害剤の塩酸オザグレル(キッセイのドメナン、小野薬品のベガ)、トロンボキサン拮抗阻害剤のセラトロダスト(武田薬品のプロニカ)、ロイコトリエン受容体拮抗剤のプランルカスト(小野薬品のオノン)である。ロイコトリエン受容体拮抗剤は1960

年代に喘息の発作誘発物質と同定された SRS-A が 1980 年に至ってその本態がロイコトリエンであることが明らかにされた。これを契機に開発が進み日本で開発された気管支喘息治療薬であり、大型医薬となった。

・免疫過程を制御する Th2 サイトカイン阻害剤

1995 年に Th2 サイトカイン阻害剤のトシル酸プラタスト（大鵬薬品のアイピーディ）が開発された。同剤は IgE 産生抑制剤ともいわれアレルギー反応過程のうち Th2 細胞からの IL-4 の産生を抑制して IgE の産生を押さえる。また、気道の好酸球浸潤に関与する IL-5 の産生も抑制する。すなわち、アレルギー反応の引き金となる免疫過程の最初の段階に作用することから、アレルギー疾患の本質に迫る薬剤ともいわれる。

また近年、免疫抑制剤（FK-506 タクロリムス水和物 アステラス製薬）がアトピー性皮膚炎（プロトピッククリーム）で著効を示し新しい展開があった。

(2) 抗アレルギー剤の市場

表 1.1.5-1 に国内市販抗アレルギー剤主要製品の一覧および販売高を示す。

現在国内で上市されている抗アレルギー剤はメディエーター（化学伝達物質）遊離抑制剤が一般名で 7 品目、ヒスタミン H1 拮抗薬が 13 品目、トロンボキサン阻害・拮抗剤が 3 品目、ロイコトリエン拮抗剤 3 品目、Th2 サイトカイン阻害剤が 1 品目、計 27 品目になり、総販売高も 2003 年度で約 2,300 億円の規模にある。

メディエーター遊離抑制剤の総販売高は 260 億円強である。クロモグリク酸ナトリウム（アステラス製薬のインタール）がトップ商品であり、経口吸収性がないことから喘息分野では吸入剤として、眼科領域では点眼剤として主に使用されている。第二はトラニラスト（キッセイのりザベン）であり経口剤として特徴があり喘息、花粉症などアレルギー疾患一般に使用されている。

ヒスタミン H1 拮抗剤の総販売高は 1,440 億円弱に上る。主力製品としては塩酸エピナスチン（日本ベーリンガーと三共のアレジオン）、塩酸セチリジン（第一製薬、大日本住友のジルテック）、塩酸フェキソフェナジン（サノフィ・アベンティスのアレグラ）など年商 200 億円以上の製品が並ぶ。主として花粉症などのアレルギー性鼻炎に使用されている。

トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤の総販売高は 17 億円程度にとどまる。

ロイコトリエン拮抗剤の総販売高は 480 億円弱であり、主力製品はプランルカスト（小野薬品オノン）とモンテルカスト（万有製薬のシングレア、杏林製薬のキプレス）である。それらは、もっぱら喘息疾患に使われている。

Th2 サイトカイン阻害剤はトシル酸プラタスト（大鵬薬品のアイピーディー）1 品目で、40 億円の販売高である。

その他、第一世代の抗ヒスタミン剤が 40 億円程度、免疫抑制剤の外用剤（アステラス製薬のプロトピック）が 24 億円である。

表 1.1.5-1 国内市販抗アレルギー剤・主要製品一覧

分類	一般名	製品名	販売	発売年月	販売高総額 (2003年) 億円
メディエーター 遊離抑制剤	クロモグリク酸ナトリウム	インタール	アステラス製薬	71・6	129
	トラニラスト	リザベン	キッセイ	82・8	72
	イブジラスト	アイピナール	万有製薬	89・5	8
	ベミロラストカリウム	アレギサル	三菱ウェルファーマ・ 日研化学	91・3	16
		ベミラストン	ブリistolマイヤーズ スクイブ(米国)	91・3	21
その他				20	
ヒスタミン H1 拮 抗剤	フマル酸ケトチトフェン	ザジテン	ノバルティス(スイス)	83・2	146
	塩酸アゼラスチン	アゼブチン	エーザイ	86・6	10
	オキサトミド	セルテクト	協和醗酵工業	87・6	77
	塩酸エピナスチン	アレジオン	日本ベーリンガー	94・6	163
			三共製薬	94・6	72
	エバスチン	エバステル	大日本住友製薬	96・6	96
			明治製菓	96・6	37
	塩酸セチリジン	ジルテック	第一製薬	98・9	99
			大日本住友製薬	98・9	98
	塩酸レボカバスチン	リボスチン	日本新薬	99・8	10
			参天製薬	99・8	35
	ベシル酸ベポタスチン	タリオン	田辺製薬	00・10	45
	塩酸フェキソフェナジン	アレグラ	サノフィ・アベンティ ス(フランス)	00・11	218
	塩酸オロパタジン	アレロック	協和醗酵工業	01・3	126
ロラタジン	クラリチン	シオノギ	02・9	50	
		シェーリングブラウ (米国)	02・9	46	
その他				110	
トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤	ラマトロバン	バイナス	バイエル(ドイツ)・ 杏林製薬	00・5	15
	その他				2
ロイコトリエン 拮抗剤	ブランルカスト	オノン	小野薬品	95・6	278
	ザフィルルカスト	アコレート	アストラゼネカ (イギリス)	01・2	16
			万有製薬	01・8	106
モンテルカスト	シングレア	杏林製薬	01・8	78	
キプレス					
Th2 サイトカイン 阻害剤	トシル酸プラタスト	アイピーディ	大鵬薬品	95・4	40
抗ヒスタミン剤	全体				40
合計					2,279

出典：富士経済「2004 医療用医薬品データブック No.3」より引用。整理編集。

1.1.6 抗アレルギー剤開発の今後の展開

抗アレルギー剤開発の今後を展望するために開発情報も加えて、作用機序別にトップランナーを中心に整理した。結果を表 1.1.6-1 に開発中の抗アレルギー剤の進展を示す。現在認可されている薬剤は、炎症過程に限定されているが、開発中の薬剤は、炎症系から免疫系まで広く分布している。海外では日本にさきがけて抗アレルギー剤として IgE に関わる抗体医薬品であるヒト化抗 IgE 抗体が承認されている。

表 1.1.6-1 開発中の抗アレルギー剤の進展 (1/2)

(承認後)

作用機序		認可						
		1970年代	1980年代		1990年代		2000年代	
炎症過程	化学伝達物質遊離抑制剤	インターール ('71) アステラス製薬	リザベン ('82) キッセイ薬品 経口剤	ケタス ('89) 杏林製薬	インターール ('91) アステラス製薬 吸入用噴霧剤			
	ヒスタミン H1 拮抗剤	第一世代 局麻作用あり	第二世代 ザジテン ('83) ノバルティス (スイス) 局麻作用分離	セルテクト ('87) 協和醗酵工業 工業 鼻炎・皮膚炎	第三世代 トリルダン ('90) サノフィ・アベンティス (フランス) 眠気副作用低減	アレジオン ('94) 日本ベーリンガー 服用回数低減	エバステル ('96) 大日本住友製薬・明治製菓 鼻炎・皮膚炎	
	脂質メディエーター抑制剤	TXA2 阻害・拮抗剤				ドメナン ('92) キッセイ薬品 TXA2 酵素阻害	プロニカ ('95) 武田薬品工業 TXA2 拮抗	
		ロイコトリエン拮抗剤					オノン ('95) 小野薬品	シングレア ('01) 万有製薬
		5-リポオキシゲナーゼ阻害剤 PGD2 受容体拮抗剤						
	サイトカイン	PAF 受容体拮抗						
		IL-5 受容体拮抗剤						
	ケモカイン	CCR3 拮抗剤						
	化学伝達物質	ブラジキニン B2 拮抗剤						
		ヒスタミン H3 拮抗剤						
	神経ペプチド	NK1, NK2, NK3 拮抗剤						
	免疫過程	Th2 サイトカイン阻害剤					アイビーディ ('95) 大鵬薬品	
		T細胞	T細胞抑制 Th1/Th2 バランス調節剤					
抗T細胞受容体抗体								
細胞接着		VLA 拮抗剤						
細胞内情報伝達		チロシンキナーゼ阻害剤						
核内転写		NF- B 阻害剤						
IgE		ヒト化抗 IgE 抗体						
		ヒト化 CD23 抗体						
		IgE 抗体産生阻害剤						
免疫抑制剤						プロトピック ('99) アステラス製薬		
第二メッセンジャー	PDE4 阻害剤							
	アデノシン A2 アゴニスト アデノシン A1 受容体拮抗剤							

表 1.1.6-1 開発中の抗アレルギー剤の進展(2/2)

(承認前)

作用機序		パイプライン(フェーズ)				
		申請中	P-	P-	P-	前臨床
炎症過程	化学伝達物質遊離抑制剤					
	ヒスタミン H1拮抗剤					
	脂質メディエーター抑制剤	TxA2 阻害・拮抗剤				
		ロイコトリエン拮抗剤				
		5-リボオキシゲナーゼ阻害剤			TA-270 大日本インキ化学工業	
		PGD2 受容体拮抗剤			S-5751 シオノギ製薬	
	サイトカイン	PAF 受容体拮抗			Ilexipafant Dev Co pharm (英国)	
		IL-5 受容体拮抗剤		Mepolizum グラクソ・スミスクライン(イギリス)		
	ケモカイン	CCR3 拮抗剤			766994 グラクソ・スミスクライン(イギリス)	
	化学伝達物質	ブラジキニン B2 拮抗剤		Icatibant サノフィ・アベンティス(フランス)		
ヒスタミン H3 拮抗剤				BP-294 バイオプロジェクト(フランス)		
神経ペプチド	NK1, NK2, NK3 拮抗剤				R-113281* 三共製薬	
免疫過程	Th2 サイトカイン阻害剤					
	T細胞	T細胞抑制		ビメクロリムス ノバルティス(スイス)		
		Th1/Th2 バランス調節剤 抗T細胞受容体抗体				SCP5002 堺化学 抗T細胞受容体抗体 協和発酵工業
	細胞接着	VLA 拮抗剤			RBx-7796 Ranbaxy (インド)	
	細胞内情報伝達	チロシンキナーゼ阻害剤		R-112 Rigel Pharm (米国)		
	核内転写	NF- B 阻害剤			NF B decoy Corgentech (米国)	
	IgE	ヒト化抗 IgE 抗体		オマリズマム 米・03 発売 ノバルティス(スイス)		
		ヒト化 CD23 抗体			Lumiliximab Biogen Idec (米国)	
		IgE 抗体産生阻害剤				AVP-1335 Avanir Pharm (米国)
	免疫抑制剤			シクロスポリン ノバルティス(スイス)		
第二メッセンジャー	PDE4 阻害剤			ロフルミラスト 田辺製薬		
	アデノシン A2 アゴニスト			GW-32826 グラクソ・スミスクライン(イギリス)		
	アデノシン A1 受容体拮抗剤				EPI-2010 大正製薬	

*印は臨床準備中

出典：「明日の新薬」、富士経済「2004 医療用医薬品データブック No.3」より引用。整理編集。

開発中の抗アレルギー剤に関して詳細な開発状況（創製企業と開発企業、開発ステージ、作用機序、対象疾患）を表 1.1.6-2 に示した。以下に各薬剤の開発に関する概況を記す。

炎症過程に関わる薬剤としては化学伝達物質遊離抑制、ヒスタミン H1 拮抗、トロンボキサン A2 阻害・拮抗、ロイコトリエン拮抗など、既知作用機序に基づく薬剤に関しては、より治療効果にすぐれ、副作用が少なく安全性の高い新規薬剤の開発が進むものと考えられる。例えば、化学伝達物質遊離抑制剤では経口性で高活性のものが求められるし、ヒスタミン H1 拮抗剤では認知機能障害のないものが標的となると言われている。

脂質メディエーター抑制剤としては、トロンボキサン、ロイコトリエン生成のアラキドン酸カスケードの上流過程を制御する酵素 5-リポオキシゲナーゼ阻害剤、プロスタグランジン D2 受容体拮抗剤など新規作用機序の薬剤が開発される可能性がある。また、ヒスタミン H1 拮抗作用に加えて抗炎症作用を示す種々の薬理作用をもつものや、トロンボキサン拮抗作用とロイコトリエン拮抗作用など複数の作用をもつ薬剤の開発も治療効果を高める観点から追求されている。しかし、最近（2001～2003 年）の特許出願状況を見ると激減しているところからこの分野の開発は峠を越したと思われる。

さらに、炎症過程に関わる薬剤としては、サイトカインの作用を抑制する PAF 受容体拮抗剤や IL-5 受容体拮抗剤、ケモカインの抑制剤としてはエオタキミンレセプター（CCR3）拮抗剤、起炎性化学伝達物質ではブラジキニン B2 拮抗剤、ヒスタミン H3 拮抗剤、神経ペプチド関係ではニューロキニン受容体阻害剤などが有望視されている。

Th2 サイトカイン阻害剤は、免疫過程をコントロールする意味で、根治療法的薬剤として注目されている。その意味で、今後の流れとしては免疫過程を制御する薬剤の開発が期待されている。

他にも免疫過程で制御する薬剤開発は多い。T 細胞の機能調節に関わるものとしては T 細胞抑制剤、Th1/Th2 バランス調節剤など、細胞接着抑制では VLA 拮抗剤（VLA：Very Late activation antigen）、細胞内情報伝達抑制ではチロシンキナーゼ阻害剤の登場が期待される。核内転写因子関係では NF- κ B 阻害剤（NF- κ B：Nuclear Factor κ B）などが開発される可能性がある。また、近年の分子生物学、遺伝子組み換え技術の進歩によって抗体医薬など、例えばヒト化抗 IgE 抗体、ヒト化 CD23 抗体、抗 T 細胞受容体抗体などの生物製剤も期待される。

広義の抗アレルギー剤としては、喘息薬として第二メッセンジャー関係の PDE4 阻害剤（PDE4：Phosphodiesterase type 4）、アデノシン A2 アゴニスト、アデノシン A1 受容体拮抗剤が注目される。特に PDE4 阻害剤に関する出願が極めて多いことから次世代の喘息薬として注目される。

表 1.1.6-2 開発中の抗アレルギー剤一覧(1/3)

作用機序の分類	開発番号 (または製品名)	創製企業	開発企業	開発 ステージ	作用機序 (薬理作用)	対象疾患
化学伝達物質遊離抑制剤	andolast	Rotta Research Laboratorium (イタリア)	Rotta Research Laboratorium (イタリア)	Phase II	ヒスタミン遊離抑制	アレルギー性鼻炎、喘息
	ME3301	明治製菓	明治製菓	Phase II	メディエーター遊離抑制	喘息
ヒスタミンH1拮抗剤	efletirizine dihydrochloride	UCB(ベルギー)	UCB(ベルギー)	Phase III	ヒスタミンH1拮抗	アレルギー性鼻炎
	ミゾラスチン	サノフィ・サンテラボ(フランス)	サノフィ・アベンティス(フランス)	Phase III	ヒスタミンH1拮抗	アレルギー性鼻炎、皮膚炎
	Hivenyl	Barrier Therapeutics (米国)		Phase II	ヒスタミンH1拮抗	皮膚そう痒症
	K-123	興和	興和	Phase II	ヒスタミンH1拮抗	アレルギー性結膜炎
	FY-609	アポットジャパン(米国)	富士薬品 アポットジャパン(米国)	Phase II	ヒスタミンH1拮抗	鼻炎、じんま疹、アレルギー性鼻炎
	LAS-36509	Almirall Prodesfarma (スペイン)	Almirall Prodesfarma (スペイン)	前臨床	ヒスタミンH1拮抗	アレルギー、鼻炎
ロイコトリエン拮抗剤	MCC-847	アストラゼネカ(イギリス)	三菱ウェルファーマ AstraZeneca (イギリス)	Phase III	LTD4 受容体拮抗	気管支喘息、アレルギー性鼻炎
	MN001	メディシノバ(米国)・杏林	メディシノバ(米国)・杏林	Phase III	LTD4 受容体拮抗	喘息
	KCA-757	杏林製薬	杏林製薬	Phase II	LT 受容体拮抗	喘息
	CS-615	三共	三共	Phase	LT 受容体拮抗	喘息
	CR-3465	Rottapharm (イタリア)	Rottapharm (イタリア)	前臨床	LTD4 受容体拮抗	喘息、アレルギー疾患
Th2 サイトカイン阻害		ワイズセラ ビューテックス	ワイズセラビューテックス	Phase II	Th2 サイトカイン抑制	喘息
複数	cipamfylline	グラクソ・スミスクライン (イギリス)	LEO Pharma (デンマーク) グラクソ・スミスクライン(イギリス)	Phase II	TNF- 拮抗 + PDE IV 阻害	アトピー性皮膚炎、喘息
	TAK-427	武田薬品	武田薬品	Phase II	ヒスタミンH1拮抗 + 好酸球浸潤抑制	皮膚炎、アトピー性皮膚炎
	NIK-639	日研化学	日研化学	Phase	TXA2 合成酵素阻害 + 5-L0 阻害	喘息
	KP-496	科研製薬	科研製薬	Phase	LTD4 受容体拮抗 + TXA2 拮抗	喘息、鼻炎
	NIP-531	日産化学	日産化学	前臨床	ヒスタミンH1拮抗 + サブスタンスP拮抗	アトピー性皮膚炎
	SOA-132	富士レビオ	そーせい UCB ジャパン 日本ケミファ	前臨床	ヒスタミンH1拮抗 + TX 合成酵素阻害 + 5-L0 阻害	喘息気管支喘息
	H1/NK1 dual antagonist	サノフィ・アベンティス (フランス)	InflaZyme Pharmaceuticals (カナダ)	前臨床	ヒスタミンH1拮抗 + ニューロキニンNK拮抗	アレルギー性鼻炎、アレルギー性結膜炎
T細胞の機能調節	ビメクロリムス	ノバルティス(スイス)	ノバルティス(スイス)	Phase III	T細胞および肥満細胞抑制	アトピー性皮膚炎
	SCP5002	堺化学		前臨床	Th1/Th2 バランス調節	アトピー性皮膚炎
	抗T細胞受容体抗体	協和醗酵工業	協和醗酵工業	前臨床	抗T細胞受容体抗体	喘息
	SOA-002	そーせい		前臨床	蛋白質 CRTh2 の阻害完全ヒトモノクロナール抗体	喘息

表 1.1.6-2 開発中の抗アレルギー剤一覧(2/3)

作用機序の分類	開発番号 (または製品名)	創製企業	開発企業	開発 ステージ	作用機序 (薬理作用)	対象疾患
細胞接着過程の調節	RBx-7796	Ranbaxy Laboratories (インド)	Ranbaxy Laboratories (インド)	Phase II	VLA 拮抗	気管支喘息、アレルギー性鼻炎
	DW-908e		第一製薬	前臨床	VLA-4 阻害	気管支喘息、アレルギー性鼻炎
細胞内情報伝達	R-112	Rigel Pharmaceuticals (米国)	Rigel Pharmaceuticals (米国)	Phase III	チロシンキナーゼ阻害	アレルギー性鼻炎
	BAY61-3606	バイエル (ドイツ)	バイエル (ドイツ)	前臨床	Syk チロシンキナーゼ阻害	喘息
PDE4 阻害剤	NT-702	日産化学・大正製薬	日産化学・大正製薬	Phase II	PDE4 阻害 + PDE3 阻害	喘息、COPD
	ONO-6126	小野薬品	小野薬品	Phase II	PDE4 阻害	喘息、COPD
	シロミラスト SB207499	グラクソ・スミスクライン (イギリス)		Phase II	PDE4 阻害	喘息、COPD
	ロフルミラスト	田辺製薬 (アルタナファーマ)		Phase II	PDE4 阻害	喘息、COPD
	atizoram	ファイザー (米国)	ファイザー (米国)	Phase II	PDE4 阻害	アトピー性皮膚炎、乾癬、喘息
	Atopik	Barrier Therapeutics (米国)	Barrier Therapeutics (米国)	Phase I	PDE4 阻害	アトピー性皮膚炎
	NIP-520	日産化学	日産化学	Phase	PDE 3 阻害	喘息
	Bay19-8004	バイエル (ドイツ)	バイエル (ドイツ)	Phase	PDE4 阻害	喘息、COPD
	KW-4490	協和醗酵工業	協和醗酵工業	Phase I	PDE4 阻害	喘息
	NIK-616	日研化学	日研化学	前臨床	PDE4 阻害	喘息
アデノシン	GW-328267	グラクソ・スミスクライン (イギリス)	グラクソ・スミスクライン (イギリス)	Phase II	アデノシン A1 アゴニスト	喘息、慢性閉塞性肺疾患、気道炎、アレルギー性鼻炎
	EPI-2010	大正製薬	大正製薬	前臨床	アデノシン A1 受容体拮抗	喘息ほか
	PJ-1165	Inotek Pharmaceuticals (米国)	Inotek Pharmaceuticals (米国)	前臨床	アデノシン A1 アゴニスト	アトピー性皮膚炎、喘息
核内転写	NF- B decoy	Corgentech (米国)	Corgentech (米国)	Phase II	NF- B 阻害	アトピー性皮膚炎
	NF- B decoy oligonucleotide	アンジェス MG	アンジェス MG 生化学工業 アルフレッサファーマ	Phase I	NF- B 阻害	慢性関節リウマチ、アトピー性皮膚炎、冠動脈再狭窄、変形性関節症、乾癬、炎症性腸疾患
IgE	ゾレア	ジェネンティック (米国)	ノバルティス (スイス)・三共	Phase III	ヒト化抗 IgE 抗体 (オマリズマム)	喘息、鼻炎
	Iumiliximab	Biogen Idec (米国)	生化学工業 Biogen Idec (米国)	Phase II	IgE 抗体産生阻害	アレルギー性鼻炎、アレルギー疾患喘息、慢性リンパ性白血病
	AVP-13358	Avanir Pharmaceuticals (米国)	Avanir Pharmaceuticals (米国)	Phase I	IgE 抗体産生阻害	喘息、アレルギー
	E-26	ジェネンティック (米国)	ジェネンティック (米国) Tanox (米国) ノバルティス (スイス)	Phase I	IgE 抗体産生阻害	喘息、アレルギー性鼻炎
	GK-07294	日研化学	日研化学	前臨床	IgE 依存性耳介浮腫モデルで有効	アトピー性皮膚炎
	JTP-27536	日本たばこ産業	日本たばこ産業	前臨床	IgE 抗体産生阻害	アレルギー疾患

表 1.1.6-2 開発中の抗アレルギー剤一覧(3/3)

作用機序の分類	開発番号 (または製品名)	創製企業	開発企業	開発 ステージ	作用機序 (薬理作用)	対象疾患
サイトカイン	mepolizum	グラクソ・スミスクライン (イギリス)	グラクソ・スミスクライン (イギリス)	Phase III	IL-5 拮抗	喘息、アトピー性皮膚炎
	lexipafant	Vernalis (イギリス)	DevCo Pharmaceuticals (イギリス)	Phase II	PAF 拮抗	臓器損傷、神経損傷急性 性膵炎、多発性硬化症、 アレルギー性結膜炎
	BAY36-1677	バイエル (ドイツ)	バイエル (ドイツ)	Phase II	IL-4 拮抗 (組 換 IL-4 変異蛋白)	喘息
ケモカイン	bertilimumab	Cambridge Antibody Technology (イギリス)	Cambridge Antibody Technology (イギリス)	Phase II	CCR3 拮抗	アレルギー性鼻炎、 アレルギー性結膜炎
	766994	グラクソ・スミスクライン (イギリス)	グラクソ・スミスクライン (イギリス)	Phase II	CCR3 拮抗	アレルギー性鼻炎喘息
	DPC-168	Bristol-Myers Squibb Pharma (米国)	Bristol-Myers Squibb Pharma (米国)	Phase I	CCR3 拮抗	喘息、アレルギー性 鼻炎
	W-56750	三菱ウェルファーマ	三菱ウェルファーマ	前臨床	CCR3 拮抗	アトピー性皮膚炎
脂質メディエーター抑制剤	TA-270	大日本インキ化学工業	大日本インキ化学工業	Phase II	5-L0 阻害	喘息、アレルギー性 鼻炎、慢性閉塞性肺疾患
	L-888839	Merck Frosst (カナダ)	Merck Frosst (カナダ)	Phase I	PGD 受容体拮抗	アレルギー性鼻炎
	ONO-4127Na	小野薬品工業	小野薬品工業	Phase I	PGD 受容体拮抗	アレルギー性鼻炎
	S-5751	塩野義製薬	塩野義製薬	Phase	PGD2 受容体拮抗	鼻炎、結膜炎
	LDP-977	大正製薬	大正製薬	前臨床	5-L0 阻害	喘息
	LDP-392	Millennium Pharmaceuticals (米国)	あすか製薬 Millennium Pharmaceuticals (米国) Stiefel Laboratories (米国)	前臨床	5-L0 阻害	アトピー性皮膚炎、 乾癬アトピー性皮膚炎 乾癬
	SOA-002	そーせい	そーせい Abgenix (米国)	前臨床	PGD 受容体拮抗	アレルギー
その他の化学伝達物質	icatibant acetate	サノフィ・アベンティス (フランス)	サノフィ・アベンティスグループ (フランス) JeriniSanofi- Aventis(フランス)	Phase III	ブラジキニン B2 拮抗	アレルギー性鼻炎、血管 性浮腫肝硬変、血管性 浮腫、変形性関節症、 疼痛喘息
	BP-294	Bioprojet (米国)	Bioprojet (米国)	Phase II	ヒスタミン H3 アゴニスト	喘息
神経ペプチド	R-113281	三共	三共	前臨床	NK1, NK2, NK3 拮抗	喘息
	NIP-531	日産化学工業	日産化学工業	前臨床	NK1 拮抗	アトピー性皮膚炎
その他	シクロスポリン	ノバルティス (スイス)	ノバルティス (スイス)	Phase III	免疫抑制	アトピー性皮膚炎

出典：「明日の新薬」、富士経済「2004 医療用医薬品データブック No.3」より引用。整理編集。

1.1.7 抗アレルギー剤の参考情報

表 1.1.7 に抗アレルギー剤関連の情報源を示す。

表 1.1.7 抗アレルギー剤関連の情報源

名称 / ホームページ URL	備考
厚生労働省 http://www.mhlw.go.jp/	患者統計を公表している。
日本製薬工業協会 http://www.jpma.or.jp/	製薬協（日本製薬工業協会）は、新薬の開発によって社会への貢献をめざす研究開発志向型の製薬会社が加盟している任意団体である。平成 17 年 10 月現在、外資系企業を含む 75 社が会員となっている。また、医薬品製造業者の全国組織である日本製薬団体連合会や国際的な製薬産業の団体である IFPMA（国際製薬団体連合会）に加盟している。
日本アレルギー学会 http://www.jsaweb.jp/	アレルギーおよび臨床免疫を共通の研究テーマとしている基礎医学者および臨床医より構成されている学会である。学会および学会誌を公表している。
日本小児アレルギー学会 http://www.iscb.net/JSPACI/	研究論文（原著、症例報告、学会シンポジウム）、教育論文（綜説、学会特別講演、診療技術の解説など）、日本小児アレルギー学会発表演題抄録などを公表している。
日本耳鼻咽喉科免疫アレルギー学会 http://jjiao.umin.jp/	耳鼻咽喉科およびその関連領域の臨床免疫学およびアレルギー学の進歩発展を図るとともに、会員相互の交流および親睦を促進することを目的とする学会である。学会誌などを公表している。
日本皮膚アレルギー学会 http://www.jsda-net.jp/	アレルギー性皮膚疾患に関する研究およびそれに関連する医学の発展を促進することを目的とする学会である。学会や学会誌を公表している。

（参考文献）

- 1) 宿前利郎編、大野尚仁・安達禎之著：免疫学概説，1994，廣川書店
- 2) 笹月健彦訳、Charles A. Janeway, Jr., Paul Travers, Mark Walport, Mark J. Shlomchik 著：免疫生物学 免疫系の正常と病理，2003，南江堂
- 3) 橋本信也編：各科・専門のお医者さんによる薬と病気の本，2004，保険同人社
- 4) 中川武正：抗アレルギー薬の変遷，アレルギー・免疫，11，1370，2004
- 5) 永井博式：抗アレルギー薬の開発の変遷，アレルギー・免疫，11，1512，2004
- 6) 粒来崇博、秋山一男：成人気管支喘息と抗アレルギー薬，アレルギー・免疫，11，1654，2004
- 7) 西間三馨：小児気管支喘息と抗アレルギー薬，アレルギー・免疫，12，126，2004
- 8) 岡本美孝：アレルギー性鼻炎・花粉症と抗アレルギー薬，アレルギー・免疫，12，338，2004
- 9) 古江増隆：アレルギー性皮膚疾患と抗アレルギー薬，アレルギー・免疫，12，550，2004
- 10) 星岡明、河野陽一：小児アレルギー性疾患と抗アレルギー薬，アレルギー・免疫，12，675，2004
- 11) 斉藤博久：抗アレルギー薬とテーラーメイド医療，アレルギー・免疫，12，938，2004
- 12) 河野茂勝：抗アレルギー薬開発の展望，アレルギー・免疫，12，816，2004
- 13) 2004 医療用医薬品データブック No.3，富士経済
- 14) 明日の新薬

1.2 抗アレルギー剤関連技術の特許情報へのアクセス

1.2.1 国際特許分類 (IPC)、ファイル・インデックス (FI)

抗アレルギー剤に関連する IPC、FI、ファセット分類記号を表 1.2.1-1～表 1.2.1-3 に示す。

抗アレルギー剤に関する特許は、主に『A61K: 医薬用製剤』に分類されている。A61K は医薬用製剤に付与されるもので、薬理効果による分類としてファセット分類記号 ABF: 抗アレルギー剤を使用することができる。IPC 第 6 版までの検索 (～1999 年) には IPC とファセット分類記号を組み合わせて検索を行うのが有効である。

また、IPC 第 7 版 (2000 年～) には『A61P: 化合物または医薬組成物の治療』が新設され、サブグループとして『A61P37/08: 抗アレルギー剤』、『A61P27/14: 眼科用抗アレルギー剤』を用いることができる。

なお FI には『A61P: 化合物または医薬組成物の治療』が 1999 年以前に遡って付与されているので、期間を通して使用できる。

表 1.2.1-1 抗アレルギー剤関連の IPC および FI (医薬品製剤) (1/2)

IPC	FI	内容
A61K	A61K	有機活性成分を含有する医薬品製剤
・ 31/00	・ 31/00	
・ 31/01	・ 31/01	・ 炭化水素
・ 31/02	・ 31/02	・ ハロゲン化炭化水素
・ 31/04	・ 31/04	・ ニトロ化合物
・ 31/045	・ 31/045	・ ヒドロキシ化合物
・ 31/075	・ 31/075	・ エーテルまたはアセタール
・ 31/095	・ 31/095	・ 硫黄
・ 31/11	・ 31/11	・ アルデヒド
・ 31/12	・ 31/12	・ ケトン
・ 31/13	・ 31/13	・ アミン
・ 31/16	・ 31/16	・ アミド
・ 31/185	・ 31/185	・ 酸; その無水物, ハロゲン化物または塩
・ 31/21	・ 31/21	・ エステル
・ 31/275	・ 31/275	・ ニトリル; イソニトリル
・ 31/28	・ 31/28	・ 重金属を含有する化合物
・ 31/325	・ 31/325	・ カルバミン酸; チオカルバミン酸; それらの無水物または塩
・ 31/327	・ 31/327	・ パーオキシ化合物
・ 31/33	・ 31/33	・ 複素環式化合物
・ 31/557	・ 31/557	・ エイコサノイド
・ 31/56	・ 31/56	・ シクロペンタ「a」ヒドロフェナントレン環系を含む化合物
・ 31/59	・ 31/59	・ 9,10 - セコ - シクロペンタ「a」ヒドロ - フェナントレン環系を含有する化合物
・ 31/60	・ 31/60	・ サリチル酸; その誘導体
・ 31/63	・ 31/63	・ パラ-N-ベンゼンスルホニル-N-基を含有する化合物
・ 31/64	・ 31/64	・ スルホニル尿素
・ 31/65	・ 31/65	・ テトラサイクリン
・ 31/655	・ 31/655	・ アゾ, ジアゾ, アゾキシ, アジドまたはジアゾアミノ化合物

表 1.2.1-1 抗アレルギー剤関連の IPC および FI (医薬品製剤) (2/2)

IPC	FI	内容
・ 31/66	・ 31/66	・ リン化合物
・ 31/69	・ 31/69	・ ほう素化合物
・ 31/695	・ 31/695	・ けい素化合物
・ 31/70	・ 31/70	・ 炭水化物；糖；その誘導体
・ 31/74	・ 31/74	・ 合成の重合材料
・ 35/00	・ 35/00	構造未知の物質または反応生成物を含有する医薬品製剤
・ 35/02	・ 35/02	・ 無生物体からのもの
・ 35/12	・ 35/12	・ 哺乳動物または鳥類からの物質
・ 35/56	・ 35/56	・ 哺乳動物または鳥類以外の動物からの物質
・ 35/66	・ 35/66	・ 微生物からの物質
・ 35/78	・ 35/78	・ 植物からの物質
・ 38/00	・ 38/00	ペプチドを含有する医療製剤
・ 38/01	・ 38/01	・ 加水分解した蛋白質；その誘導体
・ 38/02	・ 38/02	・ 不確定数のアミノ酸のペプチド；その誘導体
・ 38/03	・ 38/03	・ 不確定配列または部分的にのみ確定した配列中に 20 以下のアミノ酸をもつペプチド；その誘導体
・ 38/04	・ 38/04	・ 完全に確定した配列中に 20 以下のアミノ酸をもつペプチド；その誘導体
・ 38/16	・ 38/16	・ 21 以上のアミノ酸をもつペプチド；ガストリン；ソマトスタチン；メラノトロピン；その誘導体
・ 39/00	・ 39/00	抗原または抗体を含有する医薬品製剤
・ 39/002	・ 39/002	・ 原生動物抗原
・ 39/02	・ 39/02	・ バクテリアの抗原
・ 39/118	・ 39/118	・ クラミジア
・ 39/12	・ 39/12	・ ウイルス抗原
・ 39/35	・ 39/35	・ アレルゲン
・ 39/38	・ 39/38	・ 蛇からの抗原
・ 39/385	・ 39/385	・ 担体に結合したハプテンまたは抗原
・ 39/39	・ 39/39	・ 免疫促進付加物によって特徴づけられたもの
・ 39/395	・ 39/395	・ 抗体；免疫グロブリン；免疫血清
・ 41/00	・ 41/00	波動エネルギーまたは粒子線で物質を処理することによって得られる
・ 45/00	・ 45/00	31/00 ~ 41/00 に属さない活性成分を含有する医薬品製剤
・ 45/06	・ 45/06	・ 化学的特性をもたない活性成分の混合物
・ 45/08	・ 45/08	・ 活性物質と化学的に特徴のない補助物質
A61P27/00	A61P27/00	感覚器系疾患の治療剤
・ 27/14	・ 27/14	・ 眼科用うっ血除去剤または抗アレルギー剤
A61P37/00	A61P37/00	免疫またはアレルギー疾患の治療薬
・ 37/08	・ 37/08	・ 抗アレルギー剤

表 1.2.1-2 抗アレルギー剤関連のファセット分類記号 (医薬品製剤)

ファセット	適用範囲	内容
ABA	A61K6/00 ~ A61K49/00	・ 生体防御機構に作用する医薬
ABF		・ 抗アレルギー剤

この他、物質特許および製造法特許は C07、C08 に分類されている。

表 1.2.1-3 抗アレルギー剤関連の IPC および FI (化合物)

IPC	FI	内容
C07C	C07C	非環式化合物または炭素環式化合物
C07D	C07D	複素環式化合物
C07F	C07F	炭素，水素，ハロゲン，酸素，窒素，硫黄，セレンまたはテルル以外の元素を含有する非環式，炭素環式または複素環式化合物
C07G	C07G	構造不明の化合物
C07H	C07H	糖類；その誘導体；ヌクレオシド；ヌクレオチド；核酸
C07J	C07J	ステロイド
C07K	C07K	ペプチド
C08B	C08B	多糖類，その誘導体

1.2.2 F ターム

抗アレルギー剤に関連する F タームを表 1.2.2-1 に示す。

表 1.2.2-1 抗アレルギー剤関連の F ターム

テーマコード	テーマコード名称	F ターム
4C084	蛋白脂質酵素含有：その他の医薬	4C084ZB13：・・・アレルギー剤
4C086	他の有機化合物及び無機化合物含有医薬	4C086ZB13：・・・アレルギー剤
4C087	動物，微生物物質含有医薬	4C087ZB13：・・・アレルギー剤
4C088	植物物質含有医薬	4C088ZB13：・・・アレルギー剤
4C206	非環式または炭素環式化合物含有医薬	4C206ZB13：・・・アレルギー剤
4H048	第 - 族元素を含む化合物及びその製造	4H048AB20：・・・医薬（診断薬，抗アレルギー剤）
4H050	第 - 族元素を含む化合物及びその製造	4H050AB20：・・・医薬（診断薬，抗アレルギー剤）
4C084	蛋白脂質酵素含有：その他の医薬	4C084ZB13：・・・アレルギー剤

1.2.3 キーワード

抗アレルギー剤に関連するキーワードを表 1.2.3-1 に示す。

1.2.1 で示した IPC および FI の掛け合わせ等により目的の特許文献にアクセスすることができる。

表 1.2.3-1 抗アレルギー剤関連のキーワード（一例）

抗アレルギー
抗ヒスタミン
ロイコトリン拮抗、LT 拮抗
Th2 サイトカイン阻害
トロンボキサン A2 阻害、TXA2 阻害、トロンボキサン A2 拮抗、TXA2 拮抗
メディエーター遊離抑制
ヒスタミン H1 拮抗

1.2.4 技術要素ごとの IPC

抗アレルギー剤に関連する技術要素ごとの IPC の一覧を表 1.2.4-1 に示す。これらは本調査の特許に付与されている IPC を解析し、それを基に作成したものである。

ここに示す IPC は医薬品の構造等を示すものであり、抗アレルギー剤の検索には、これらの IPC と表 1.2.3-1 で示すキーワード、あるいは表 1.2.1-2 で示すファセット分類記号および表 1.2.1-1 で示す IPC および FI 『A61P37/08、A61P27/14』を掛け合わせることになる。

表 1.2.4-1 抗アレルギー剤関連技術要素別 IPC

技術要素	IPC	内容
合成医薬品	A61K31/00	有機活性成分を含有する医薬品製剤
	A61K45/00	31/00～41/00 に属さない活性成分を含有する医薬品製剤
	C07C	非環式化合物または炭素環式化合物
	C07D	複素環式化合物
高分子医薬品	A61K38/00	ペプチドを含有する医療製剤
	A61K39/00	抗原または抗体を含有する医薬品製剤
	A61K45/00	31/00～41/00 に属さない活性成分を含有する医薬品製剤
	C07K	ペプチド
	C07H21/00	ヌクレオシドの糖類基が結合しているリン酸またはポリリン酸エステルを、それぞれ別々に有する 2 個以上のモノヌクレオチド単位を含有する化合物
天然物医薬品	A61K35/00	構造未知の物質または反応生成物を含有する医薬品製剤
	A61K31/00	有機活性成分を含有する医薬品製剤
	C07D	複素環式化合物
	C07C	非環式化合物または炭素環式化合物
	C07H	糖類；その誘導体；ヌクレオシド；ヌクレオチド；核酸
生薬	A61K35/78	構造未知の物質または反応生成物を含有する医薬品製剤 ・植物からの物質
	A61K35/80	・藻類
	A61K35/82	・地衣類
	A61K35/84	・高等真菌類
	C07G	構造不明の化合物

1.2.5 海外特許情報へのアクセス

米国特許は、米国特許分類、IPC、キーワードにより検索を行う。一方欧州特許は IPC、キーワードにより検索を行う。抗アレルギー剤のアクセスに使用する米国特許分類（米国特許のみ検索に利用）、IPC、キーワードを表 1.2.5-1 に示す。

表 1.2.5-1 抗アレルギー剤の海外特許へのアクセス

米国特許分類	IPC	キーワード
<ul style="list-style-type: none"> ・ 424 : DRUG, BIO-AFFECTING AND BODY TREATING COMPOSITIONS ・ 514 : DRUG, BIO-AFFECTING AND BODY TREATING COMPOSITIONS ・ 530 CHEMISTRY: NATURAL RESINS OR DERIVATIVES; PEPTIDES OR PROTEINS; LIGNINS OR REACTION PRODUCTS THEREOF 	<ul style="list-style-type: none"> ・ A61K ・ A61P 	<ul style="list-style-type: none"> ・ ALLERGY ・ RHINITIS ・ ASTHMA ・ ANTI-ASTHMATIC ・ ATOPIC DERMATITIS ・ ATOPY

1.3 技術開発活動の状況

1.3.1 抗アレルギー剤の技術開発活動の状況

(1) 出願人数と出願件数の推移

抗アレルギー剤に関して、対象疾患が喘息、アレルギー性鼻炎、アレルギー性皮膚炎に係る特許・実用新案は1993年1月から2003年12月まで、11年間で2,188件あった。

図1.3.1-1に抗アレルギー剤の出願人数・出願件数の推移を示す。2001年まで出願件数、出願人数ともに増加傾向を示し、研究活動が活発に行われていることがうかがえる。2002年、2003年の出願人数、出願件数の減少は、図1.3.1-2に示すように、この分野の出願において特許協力条約に基づく国際出願の割合が高く、これらの出願の国内での公表が遅れていることによる。

図 1.3.1-1 抗アレルギー剤の出願人数 - 出願件数推移

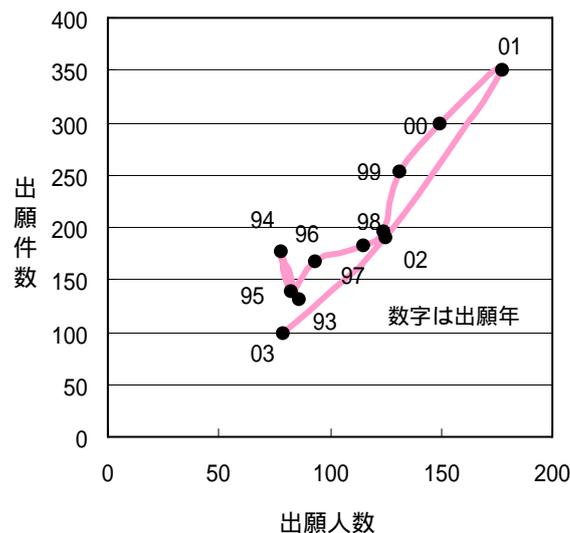


図 1.3.1-2 抗アレルギー剤の出願件数の出願年別推移 - 公表 / 再公表

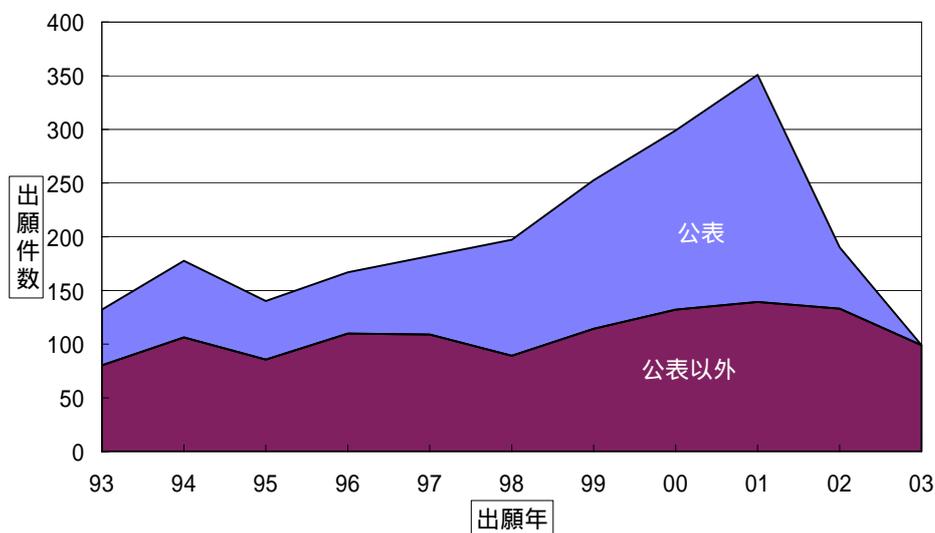


図 1.3.1-3 に抗アレルギー剤に関する出願人の構成比を示す。2001 年の出願では、海外からの出願が 6 割を占め、上場・未上場を含め企業（法人）の割合は 4 割以下である。大学および公的研究機関の出願の占める割合はあまり大きくない。

図 1.3.1-3 抗アレルギー剤に関する出願人構成比の推移

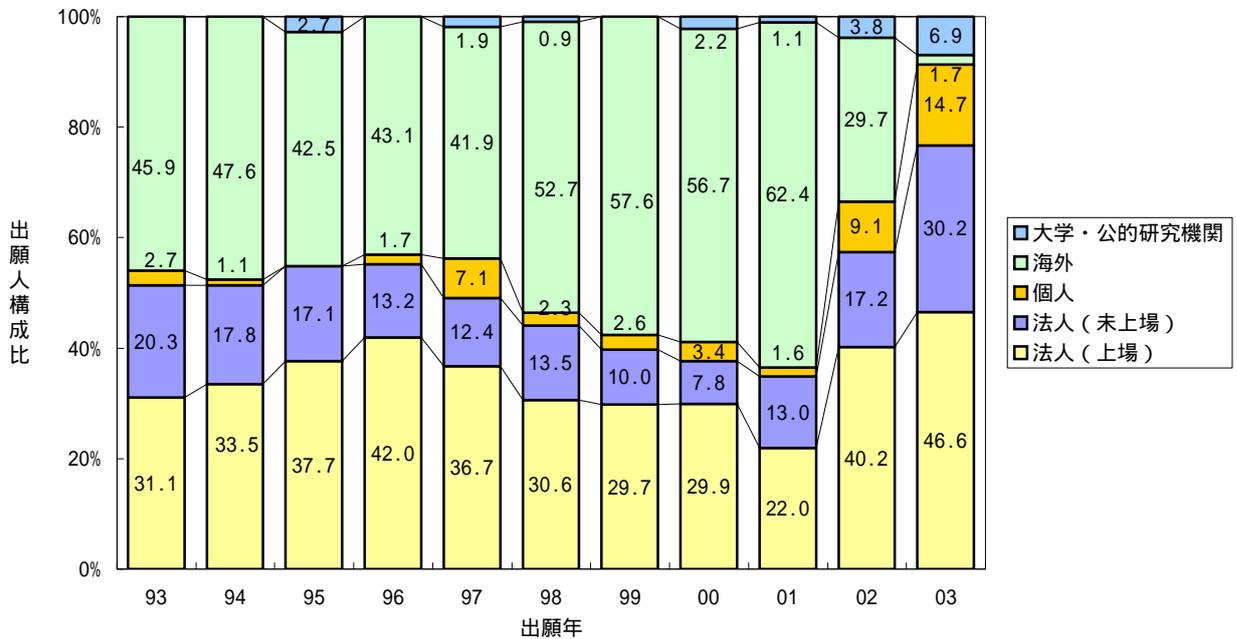


表 1.3.1-1 および表 1.3.1-2 に抗アレルギー剤の主要出願人と出願件数の推移を示す。総出願数について上位 30 社まで見ると日本国出願人 14 社に対し海外の出願人は 16 社とほぼ拮抗しているが、上位 10 社では海外大手製薬メーカーが占めており、国内勢は武田薬品工業、三共、大正製薬の 3 社である。出願件数の推移についての一般的傾向見られず、各社まちまちである。

表 1.3.1-1 抗アレルギー剤の主要出願人出願件数推移

	出願人	年次別出願件数										計	
		93	94	95	96	97	98	99	00	01	02		03
1	ファイザー（米国）	12	14	8	11	10	11	18	13	18	5		120
2	グラクソ・スミスクライン（イギリス）	5	27	7	4	7	6	9	26	19	3		113
3	シェリング・プラウ（米国）	4		3	5	10	7	8	8	14	4	1	64
4	武田薬品工業	4	4	3	7	7	5	13	5	5	3	3	59
5	アストラゼネカ（イギリス）	6	1	1	2	5	7	3	9	11	2		47
6	三共		1	3	6	5	2	7	4	4	3	10	45
7	大正製薬	2	12	1	2	1	3	5	2	3	9	3	43
8	サノフィ・アベンティス（フランス）	2	5	7	6	5	2	3	2	7			39
9	ベーリンガーインゲルハイム（ドイツ）	1	3	1	1		1	11	6	6	7	1	38
10	メルクアンドコー（米国）	2	1	3	2	8		6	6	6	2		36
11	アステラス製薬	1	6	4	2	3	4	3	5	5	2		35
12	協和醗酵工業	1		1	5	4	4	3	2	3	8	3	34
13	小野薬品工業	1	2	1	1	2	2	3	8	7	5	1	33
14	三菱ウェルファーマ	6	4	3	2	7	1	2		4	2		31
15	ジョンソン・エンド・ジョンソン（米国）	1		2	1	2	3	3	8	5	1		26
15	バイエル（ドイツ）		2		1		1	1	10	8	3		26
15	メルク（ドイツ）			3			2	8	7	6			26
18	大日本住友製薬				2	7	4	1	1	4	5	1	25
18	日研化学		4	2	3	4		6	4	1	1		25
20	イーライリリーアンドカンパニー（米国）	2	4	2	4	3	4	1	1	1			22
20	塩野義製薬	1		2	4	1	2	7	2	2		1	22
22	ノバルティス（スイス）		1	2	4			3	4	3	4		21
22	興和	2		2	5	4	1			7			21
24	アボットラボラトリーズ（米国）	4	3	1	3		2	3		1	2	1	20
24	第一製薬	3		2	5		5	1	1	2	1		20
26	花王	2	5	2	2	1	3	1		2	1		19
26	田辺製薬	1			1		2		4	2	4	5	19
28	アルタナファルマ（ドイツ）				1	1	2	3	2	6	2		17
28	帝人	1	2	1	1	1		1	8		2		17
30	エフホフマンラロシュウント（スイス）		2			2				12			16

表 1.3.1-2 抗アレルギー剤の大学・公的機関出願件数推移

	出願人	年次別出願件数										計	
		93	94	95	96	97	98	99	00	01	02		03
45	日本大学								1	3	4	1	9
86	農業生物系特定産業技術研究機構						1		2		1		4
105	産業技術総合研究所			2		1							3
150	科学技術振興機構										1	1	2
150	近畿大学											2	2
150	慶応義塾大学								1	1			2
150	静岡県						1		1				2
257	技術研究組合生物分子工学研究所											1	1
257	桐蔭横浜大学					1							1
257	京都大学											1	1
257	産学連携機構九州											1	1
257	東京都医学研究機構						1						1
257	農林水産省中国農業試験場長			1									1

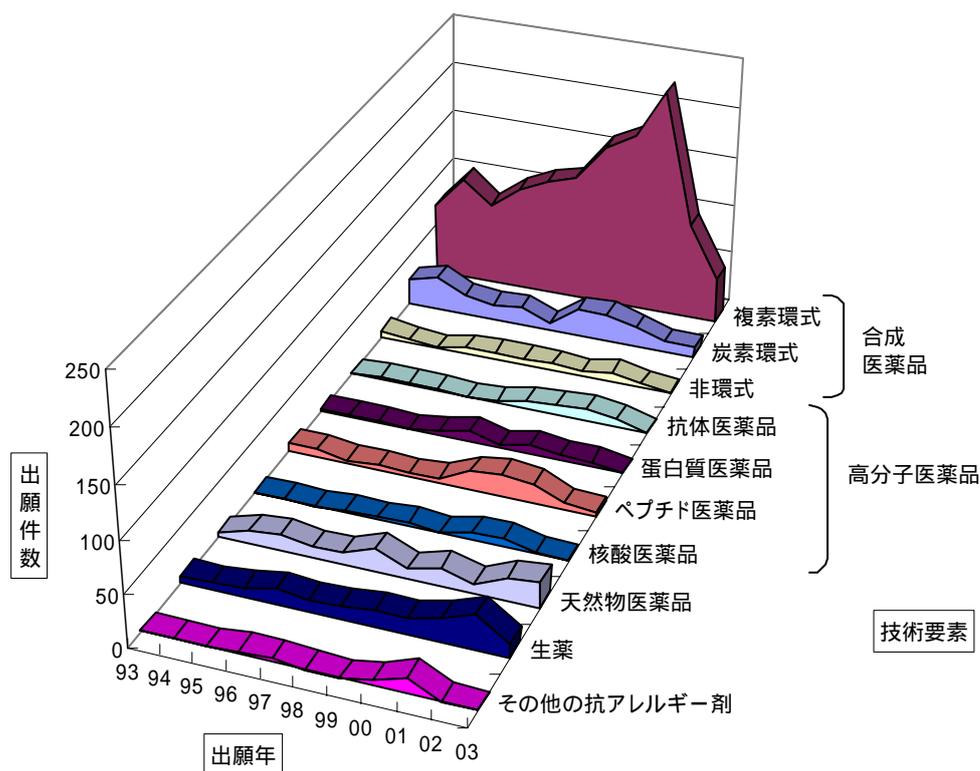
表 1.3.1-3 に抗アレルギー剤の技術要素と出願件数を示す。合成医薬品が 73%、高分子医薬品（バイオ医薬品）が 11%、天然物医薬品と生薬合わせて 15%と合成医薬品が圧倒的に多い。また、合成医薬品のうちでも複素環式化合物が 82%とほとんどであり、この傾向は医薬品一般にいえる傾向である。

表 1.3.1-3 抗アレルギー剤の技術要素と出願件数

技術要素	技術要素	件数
合成医薬品	炭素環式	219
	複素環式	1,313
	非環式	66
高分子医薬品	抗体医薬品	52
	蛋白質医薬品	51
	ペプチド医薬品	102
	核酸医薬品	26
天然物医薬品	植物由来	86
	微生物由来	51
	動物由来	24
生薬		166
その他の抗アレルギー剤		32
合 計		2,188

図 1.3.1-4 に抗アレルギー剤の技術要素別出願件数推移を示す。主流の複素環式合成医薬品についてみると 2002 年、2003 年の急激な落ち込みを除いてほぼ毎年増加している。この傾向は他の要素でもほぼ変わらない。ただ、天然物医薬品では 2002 年、2003 年は増加しており国内健康食品ブームとの関連が考えられる。

図 1.3.1-4 抗アレルギー剤の技術要素別出願件数推移



(2) 欧米の出願件数推移

図 1.3.1-5~7 に抗アレルギー剤の米国特許、欧州特許、日本特許における出願件数推移を示す。米国においては、公開制度が開始されてから 2001 年以降出願件数は急増しており、2003 年には 600 件を超える出願が行われている。参考までに示した登

登録件数推移では若干増加しているものの、登録はほぼ横ばいと見ることができる。

1999 年米国特許法改正により出願公開制度が始まり、登録と公開でデータベースが異なるため集計を分けている。

欧州においては 2000 年に 697 件の出願が行われたが、2000 年をピークに減少傾向にある。

米国における出願件数は公開件数の増加に対し登録件数は減少しているように見えるが、今後登録審査が進むにつれ、この傾向は変化するものと考えられる。

いずれにしても、日米欧の出願件数を比較する中で、特に欧米については、欧州特許分類、米国特許分類から抽出しているために単純な件数の比較はできないことに留意が必要である。

また、この分野の特許出願において特許協力条約に基づく国際特許出願の割合が高く、これらの出願の各国での公表がおこなわれていることにより、2003 年の出願件数の減少が生じていると推測する。

図 1.3.1-5 米国における抗アレルギー剤の出願件数の推移

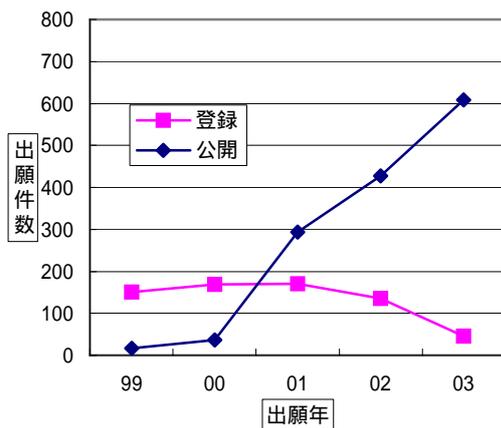
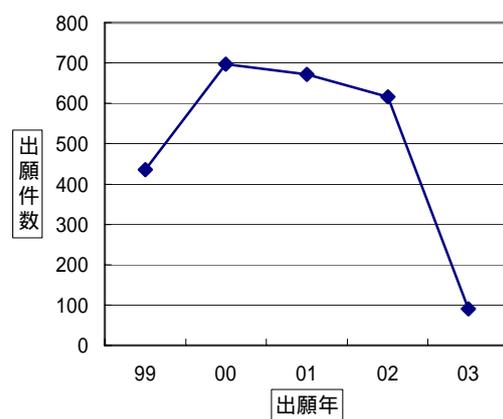


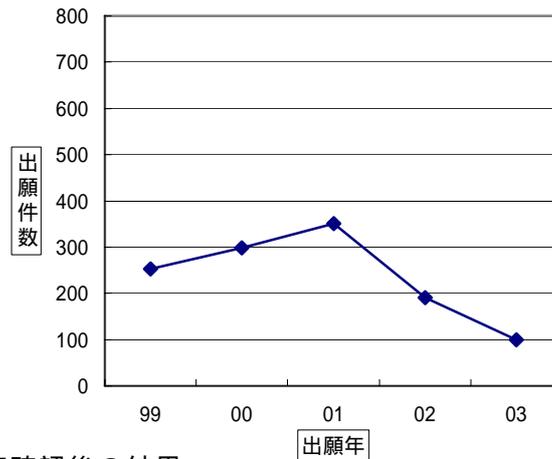
図 1.3.1-6 欧州における抗アレルギー剤の出願件数の推移



米国特許：米国特許分類と IPC、キーワードでの検索結果。

欧州特許：IPC、キーワードでの検索結果。

図 1.3.1-7 日本における抗アレルギー剤の出願件数の推移



日本特許：特許公報内容確認後の結果。

(3) 出願件数上位出願人

表 1.3.1-4 に抗アレルギー剤の米国における登録件数上位 5 の出願人を示す。2004 年度製薬企業の総売上高において第 1 位である米国 PFIZER 社が第 1 位を占めている。第 2 ~ 4 位までは米国の大手製薬が占めており、第 5 位はイギリスの大手製薬企業 GLAXO SMITHKLINE 社である。

表 1.3.1-5 に抗アレルギー剤の欧州における出願件数上位 5 の出願人を示す。欧州においても米国 PFIZER 社が第 1 位を占めている。次いでイギリスに本社のあるグローバル製薬企業 GLAXO SMITHKLINE 社、ASTRAZENECA 社が第 2、3 位を占める。第 4 位は米国のベンチャー企業 INCYTE 社、第 5 位はドイツの大手製薬企業 BOEHRINGER INGELHEIM PHARMA 社である。

表 1.3.1-4 米国における抗アレルギー剤の上位出願人

順位	上位出願人(Assignee)	登録件数
1	PFIZER INC(米国)	47
2	BRISTOL-MYERS SQUIBB PHARMA COMPANY(米国)	35
3	SCHERING-PLOUGH(米国)	33
4	MERCK & CO., INC.(米国)	25
5	GLAXO SMITHKLINE(イギリス)	23

表 1.3.1-5 欧州における抗アレルギー剤の上位出願人

順位	上位出願人	出願件数
1	PFIZER INC(米国)	205
2	GLAXO SMITHKLINE(イギリス)	133
3	ASTRAZENECA AB(イギリス)	103
4	INCYTE CORPORATION(米国)	94
5	BOEHRINGER INGELHEIM PHARMA GMBH & CO KG(ドイツ)	66

海外企業の企業名表示は、検索結果に準じ英語表記とした。

1.3.2 抗アレルギー剤の技術要素別技術開発活動

(1) 合成医薬品

a. 炭素環式

図 1.3.2-1 に技術要素「炭素環式」に関する出願人数と出願件数の年次別推移を、表 1.3.2-1 に炭素環式の主要出願人の年次別出願件数推移を示す。年間の出願人数は 15~20 社程度、出願件数は 15~30 件で安定している。出願件数ではグラクソ・スミスクラインの出願が飛び抜けている。

図 1.3.2-1 炭素環式の出願人数 - 出願件数推移

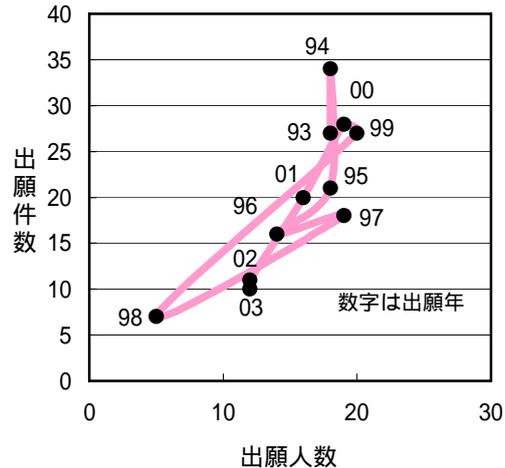


表 1.3.2-1 炭素環式の主要出願人の年次別出願件数推移

出願人	年次別出願件数											計
	93	94	95	96	97	98	99	00	01	02	03	
1 グラクソ・スミスクライン (イギリス)	4	16	3	1	1	2	3	7	4			41
2 ファイザー (米国)	4		1	1	1		1	1	1			10
2 大正製薬	1	1		2		1	1	1	1	1	1	10
4 塩野義製薬			2				3	2	1			8
5 アストラゼネカ (イギリス)	2				1	2	1					6
5 アボットラボラトリーズ (米国)	2	1	1	1			1					6
5 レオファーマ (デンマーク)							5	1				6
5 花王	2	1	1			1	1					6
5 帝人	1	1	1	1	1			1				6
10 三菱ウェルファーマ	2	1	1		1							5
10 大鵬薬品工業		2	1						1		1	5
12 イーライリリーアンドカンパニー (米国)			2	1				1				4
12 ベーリンガーインゲルハイム (ドイツ)		2					1			1		4
12 小野薬品工業			1		1		2					4
12 武田薬品工業	1	1	1				1					4
16 キッコーマン								3				3
16 杏林製薬									2		1	3
18 アクシス PHARM (スペイン)		1		1								2
18 サノフィ・アベンティス (フランス)	1			1								2
18 カロバイオ AB (スウェーデン)							1		1			2
18 シェリング・ブラウ (米国)					2							2
18 セイエールデガルデルマ (フランス)			2									2
18 ノバルティス (スイス)				2								2
18 ロート製薬											2	2
18 宇部興産							1		1			2
18 科研製薬					1		1					2
18 佐藤史衛										1	1	2
18 三井化学			1					1				2
18 三共										1	1	2
18 相模中央化学研究所		2										2

b. 複素環式

図 1.3.2-2 に技術要素「複素環式」に関する出願人数と出願件数の年次別推移を、表 1.3.2-2 に複素環式の主要出願人の年次別出願件数推移を示す。出願人数、出願件数とも増加傾向を示しており、2001 年の出願人数は 84 社、出願件数は 227 件に達している。出願件数ではファイザーが飛び抜けている。

図 1.3.2-2 複素環式の出願人数 - 出願件数推移

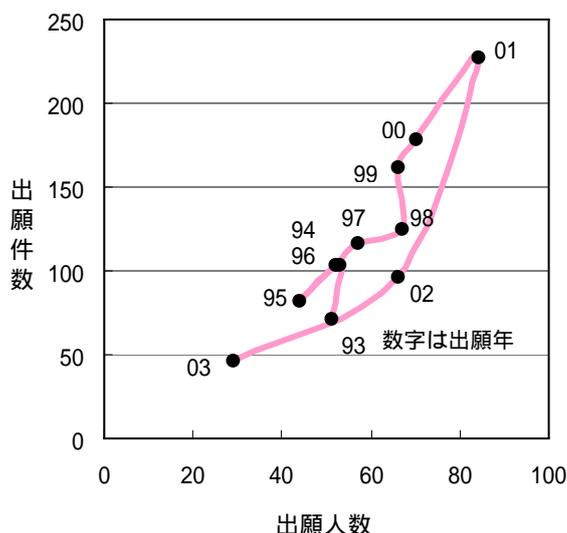


表 1.3.2-2 複素環式の主要出願人の年次別出願件数推移

出願人	年次別出願件数											計
	93	94	95	96	97	98	99	00	01	02	03	
1ファイザー（米国）	8	14	7	10	9	11	15	11	15	5		105
2シェリング・プラウ（米国）	4		3	5	8	7	8	7	13	3	1	59
3グラクソ・スミスクライン（イギリス）		4	3		4	3	4	16	15	3		52
4武田薬品工業	3	2	1	7	7	5	13	4	5	2	3	52
5アストラゼネカ（イギリス）	2	1	1	2	4	4	2	8	11	2		37
6三共		1	3	4	4	2	6		4	2	9	35
6ベーリンガーインゲルハイム（ドイツ）	1	1	1	1		1	10	6	6	6	1	34
8メルクアンドコー（米国）	2	1	3	2	5		6	6	6	2		33
9サノフィ・アベンティス（フランス）	1	4	6	5	4	2	2	1	7			32
10アステラス製薬	1	5	3	1	3	4	2	5	4	2		30
11小野薬品工業	1	2		1	1	2	3	6	7	5	1	29
12メルク（ドイツ）			3			2	8	7	6			26
13協和醗酵工業	1		1	5	4	4	2	1	2	3	3	26
13 ジョンソン・エンド・ジョンソン（米国）	1		1	1	2	3	3	8	5	1		25
15日研化学		4	2	3	3		5	4	1	1		23
16大日本住友製薬				2	6	4	1	1	4	3	1	22
17興和	2		2	4	4	1			7			20
17三菱ウェルファーマ	3	3		2	6	1	1		3	1		20
19バイエル（ドイツ）		1		1		1	1	6	6	3		19
19大正製薬		6	1			2	3	1	1	4	1	19
21イーライリリーアンドカンパニー（米国）	2	4		3	3	4	1		1			18
22田辺製薬				1		2		4	2	3	5	17
23アルタナファルマ（ドイツ）				1	1	2	3	2	6	1		16
23エフホフマンラロシュ（スイス）		2			2				12			16
25ノバルティス（スイス）		1	1	1			2	4	2	3		14
25パーテックス PHARM（米国）						1		1	11	1		14
25ブリストルマイヤーズスクイブ（米国）		1			1	2	1	8	1			14
28ダーウィンディスカバリー（イギリス）			4	2	1	3		3				13
29ユーロセルティク（ルクセンブルク）	1	5	1		2		2	1				12
29大日本インキ化学工業	2	2	2	1	1	1	1		1		1	12

c. 非環式

図 1.3.2-3 に技術要素「非環式」に関する出願人数と出願件数の年次別推移を、表 1.3.2-3 に非環式の主要出願人の年次別出願件数推移を示す。1996 年～2000 年における出願人数は 7～10 社、出願件数は 7～10 件で安定している。

図 1.3.2-3 非環式の出願人数 - 出願件数推移

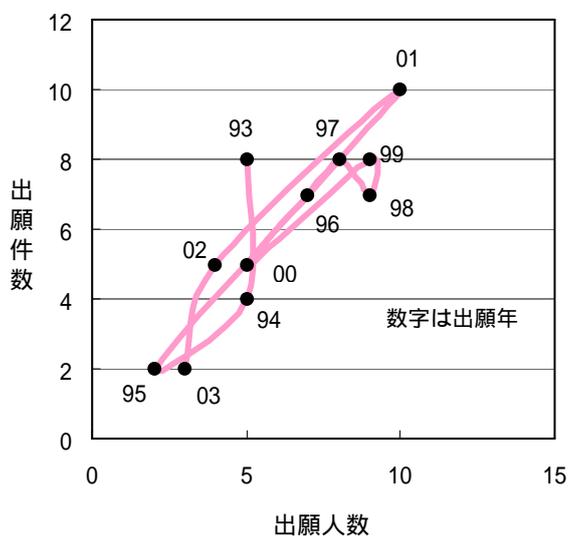


表 1.3.2-3 非環式の主要出願人の年次別出願件数推移

出願人	年次別出願件数										計	
	93	94	95	96	97	98	99	00	01	02		03
1 グラクソ・スミスクライン (イギリス)				1	1	1						3
2 プリガムアンドウイメンズホスピタル (米国)	3											3
2 大正製薬		1					1				1	3
2 第一製薬	1					2						3
2 日本油脂		1		1		1						3
2 アクシス PHARM (スペイン)	1						1					2
7 アストラゼネカ (イギリス)	2											2
7 キッコーマン									2			2
7 ペプテック (オーストラリア)				1			1					2
7 ポーラ化成工業										2		2
7 メルクアンドコー (米国)					2							2
7 ラボ. エクспанシオンス (フランス)								1	1			2
7 相模中央化学研究所				2								2

(2) 高分子医薬品

a. 抗体医薬品

図 1.3.2-4 に技術要素「抗体医薬品」に関する出願人数と出願件数の年次別推移を、表 1.3.2-4 に抗体医薬品の主要出願人の年次別出願件数推移を示す。1998 年以降出願人数、出願件数とも増加傾向を示しており、2001 年の出願人数は 18 社、出願件数は 13 件に達している。出願件数では抗体医薬を戦略としている協和醗酵工業、グラクソ・スミスクラインの出願が多い。

図 1.3.2-4 抗体医薬品の出願人数 - 出願件数推移

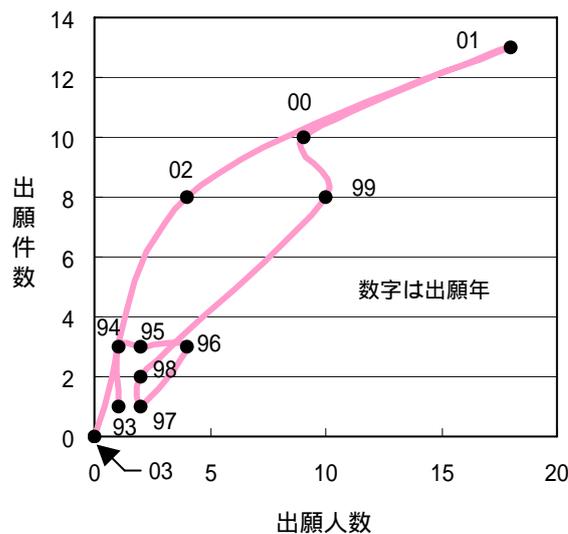


表 1.3.2-4 抗体医薬品の主要出願人の年次別出願件数推移

出願人	年次別出願件数											計
	93	94	95	96	97	98	99	00	01	02	03	
1 協和醗酵工業							1	1	1	5		8
2 グラクソ・スミスクライン (イギリス)	1	3		1				2				7
3 ジェネンテック (米国)			2	1			1		1			5
4 アイデック PHARM (米国)					1		2					3
4 アボットラボラトリーズ (米国)				1					1	1		3
4 ノバルティス (スイス)							1		1	1		3
7 ジョーンズホプキンズユニバーシティ (米国)				1				1				2
7 三共								2				2

b. 蛋白質医薬品

図 1.3.2-5 に技術要素「蛋白質医薬品」に関する出願人数と出願件数の年次別推移を、表 1.3.2-5 に蛋白質医薬品の主要出願人の年次別出願件数推移を示す。1998 年の出願人数は 11 社、出願件数は 11 件で出願人数、出願件数とも 1998 年をピークに減少傾向である。出願件数ではグラクソ・スミスクラインの出願が多い。

図 1.3.2-5 蛋白質医薬品の出願人数 - 出願件数推移

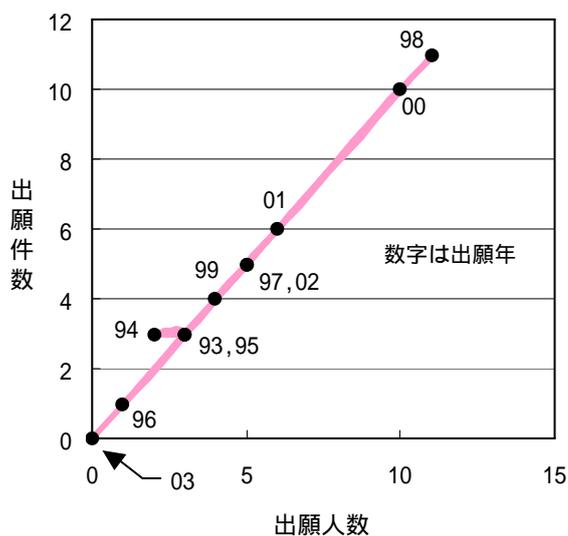


表 1.3.2-5 蛋白質医薬品の主要出願人の年次別出願件数推移

出願人	年次別出願件数											計	
	93	94	95	96	97	98	99	00	01	02	03		
1グラクソ・スミスクライン (イギリス)		2						1					3
2サノフィ・アベンティス (フランス)							1	1					2
2シェリング・プラウ(米国)								1	1				2
2ノバルティス(スイス)			1	1									2
2塩野義製薬						2							2
2三菱ウェルファーマ									1	1			2
2明治乳業							1	1					2

c. ペプチド医薬品

図 1.3.2-6 に技術要素「ペプチド医薬品」に関する出願人数と出願件数の年次別推移を、表 1.3.2-6 にペプチド医薬品の主要出願人の年次別出願件数推移を示す。出願人数、出願件数とも 1999 年～2000 年にかけて急増、2000 年の出願人数は 21 社、出願件数は 22 件に達している。出願件数ではグラクソ・スミスクライン、ジェネンテックが 5 件である。

図 1.3.2-6 ペプチド医薬品の出願人数 - 出願件数推移

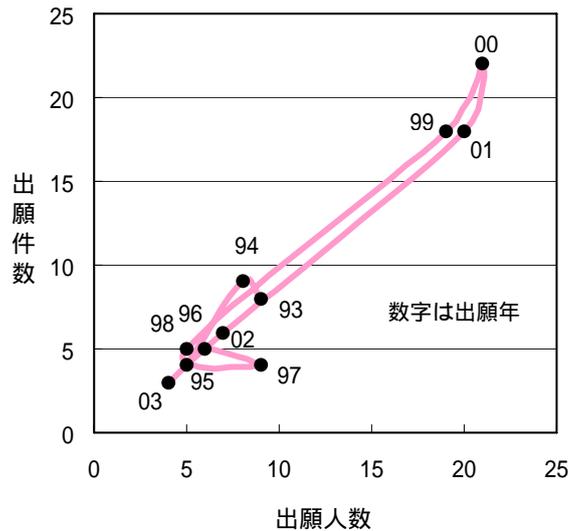


表 1.3.2-6 ペプチド医薬品の主要出願人の年次別出願件数推移

出願人	年次別出願件数											計
	93	94	95	96	97	98	99	00	01	02	03	
1 グラクソ・スミスクライン (イギリス)		2	1					2				5
1 ジェネンテック (米国)							1	2	1	1		5
3 ペプチドセラピューティクス (イギリス)	1	1						2				4
3 林原生物化学研究所			1	1	1				1			4
5 ヒューマンジェノムサイエンス (米国)		1			1			1				3
5 三共				1	1				1			3
7 アステラス製薬								1		1		2
7 アレルゲン (イスラエル)								1	1			2
7 セルーサイ (米国)								1			1	2
7 ヒスタテクエルエルシー (米国)							1	1				2
7 ファイザー (米国)								1	1			2
7 メドベットサイエンス PTY (オーストラリア)				2								2
7 ユニバーシティオブカリフォルニア (米国)		1								1		2
7 ラホヤ INST フォアアレルギーアンド免疫ロジー (米国)			1					1				2
7 杏林製薬									2			2
7 奈良先端科学技術大学院大学									2			2
7 日立化成工業	1									1		2
7 明治乳業	2											2

d. 核酸医薬品

図 1.3.2-7 に技術要素「核酸医薬品」に関する出願人数と出願件数の年次別推移を、表 1.3.2-7 に核酸医薬品の主要出願人の年次別出願件数推移を示す。出願人数、出願件数とも増加傾向を示しており、2001 年の出願人数は 8 社、出願件数は 8 件に達している。出願件数ではバイエルの出願が多い。

図 1.3.2-7 核酸医薬品の出願人数 - 出願件数推移

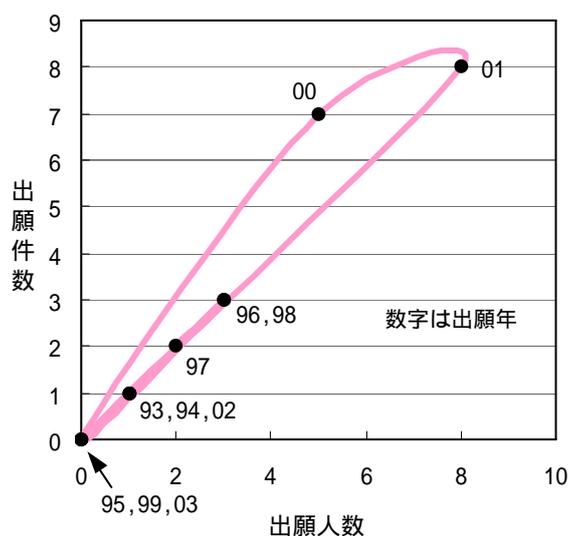


表 1.3.2-7 核酸医薬品の主要出願人の年次別出願件数推移

出願人	年次別出願件数											計
	93	94	95	96	97	98	99	00	01	02	03	
1) バイエル (ドイツ)								3	1			4
2) アイシーエヌ PHARM (米国)				1	1							2
2) アボンテック (ドイツ)								1	1			2
2) コーリー PHARM (米国)									2			2
2) ダイナバックステクノロジーズ (米国)									2			2
2) トピジエン PHARM (カナダ)							1			1		2

(3) 天然物医薬品

図 1.3.2-8 に技術要素「天然物医薬品」に関する出願人数と出願件数の年次別推移を表 1.3.2-8 に天然物医薬品の主要出願人の年次別出願件数推移を示す。出願人数、出願件数とも増減を繰り返し推移しており、2003 年の出願人数は 29 社、出願件数は 25 件に達している。出願件数では日本大学の出願が最も多く、国内の製薬企業、化学企業、食品企業の出願人が上位に見られる。

図 1.3.2-8 天然物医薬品の出願人数 - 出願件数推移

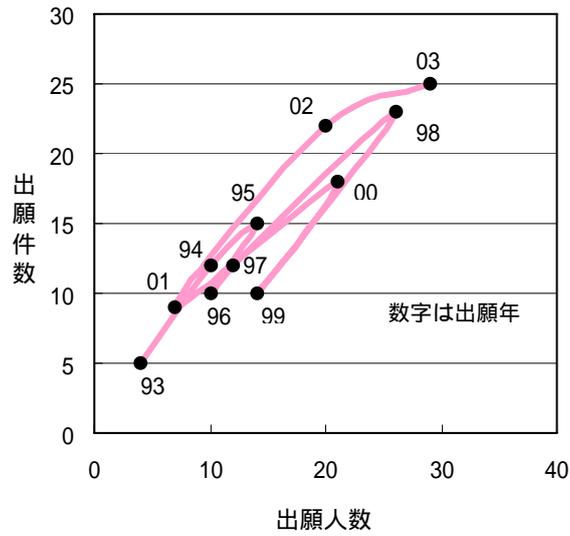


表 1.3.2-8 天然物医薬品の主要出願人の年次別出願件数推移

出願人	年次別出願件数											計
	93	94	95	96	97	98	99	00	01	02	03	
1日本大学								1	3	2	1	7
2大正製薬		4			1							5
2日本化薬			2		3							5
4ニツカウキスキー	2						2					4
5キッコーマン			1	1				1				3
5ニチニチ製薬					1	1			1			3
5ライオン			1		1			1				3
5花王			1				1		1			3
5三共				1				1	1			3
5大森斉					2	1						3
5第一製薬	1		1				1					3
5羅智靖							2	1				3
13アステラス製薬			1	1								2
13アビ							1		1			2
13エウロピタ(デンマーク)							2					2
13エフエクト											2	2
13オリザ油化					1	1						2
13カンズ研究開発											2	2
13サントクロレラ											2	2
13サンスター								1		1		2
13ティーエフティー					1	1						2
13ファンケル										1	1	2
13ヤクルト本社			1					1				2
13ユニチカ										1	1	2
13旭化成		1		1								2
13協同乳業			1	1								2
13近畿大学											2	2
13三菱ウェルファーマ			2									2
13森永製菓											2	2
13静岡県							1	1				2

(4) 生薬

図 1.3.2-9 に技術要素「生薬」に関する出願人数と出願件数の年次別推移を、表 1.3.2-9 に生薬の主要出願人の年次別出願件数推移を示す。出願人数、出願件数とも増加傾向を示しており、2002 年の出願人数は 28 社、出願件数は 34 件に達している。出願件数では化粧品原料、健康食品原料、医薬部外品原料の研究開発を行っている一丸ファルコスからの出願が最も多く、その他国内の化学企業、製薬企業の出願が多い。

図 1.3.2-9 生薬の出願人数 - 出願件数推移

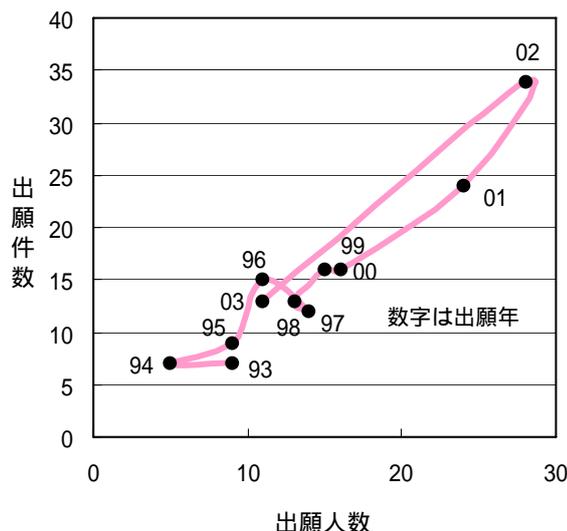


表 1.3.2-9 生薬の主要出願人の年次別出願件数推移

出願人	年次別出願件数											計
	93	94	95	96	97	98	99	00	01	02	03	
1一丸ファルコス		1	2	2		2	1		3	1		12
2ノエビア				2	1	1	1			3		8
2花王		2		2	1	1			1	1		8
4サンスター				2		2	1	1				6
4丸善製薬			1				2		2		1	6
6シーシーアイ										3		3
6ニチニチ製薬		1	1						1			3
6資生堂							1	1		1		3
6小川香料					1					2		3
6大正製薬										3		3
11カルビス							1			1		2
11キッコーマン								1	1			2
11ジャニフテック						1	1					2
11ファンケル										2		2
11ポーラ化成工業		2										2
11ヤクルト本社					1			1				2
11ユニチカ											2	2
11ライオン						1			1			2
11三省製薬			1							1		2
11山東哲夫										2		2
11小林製薬										2		2
11第一製薬				2								2
11田中雅也					1						1	2
11東洋発酵				1				1				2
11日本油脂			1	1								2
11武蔵野免疫研究所											2	2
11福田光次								2				2

(5) その他の抗アレルギー剤

図 1.3.2-10 に技術要素「その他の抗アレルギー剤」に関する出願人数と出願件数の年次別推移を、表 1.3.2-10 にその他の抗アレルギー剤の主要出願人の年次別出願件数推移を示す。2001 年の出願人数は 15 社、出願件数は 16 件で出願人数、出願件数とも突出している。

図 1.3.2-10 その他の抗アレルギー剤の出願人数 - 出願件数推移

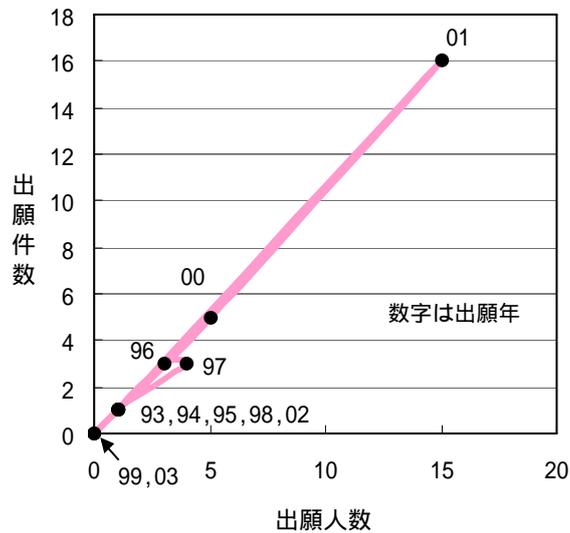


表 1.3.2-10 その他の抗アレルギー剤の主要出願人の年次別出願件数推移

出願人	年次別出願件数										計	
	93	94	95	96	97	98	99	00	01	02		03
1ピジョン									3			3
2日本臓器製薬		1				1			1			3
3旭化成									2			2
4大正製薬										1	1	2

1.4 技術開発の課題と解決手段

(1) 技術開発の課題

本書では、対象疾患としては、喘息、アレルギー性鼻炎、アレルギー性皮膚炎とした。抗アレルギー剤の技術課題を、各技術要素に共通的な言葉として表 1.4-1 に示したように創薬、製剤、生産と技術分野ごとに整理した。

a . 薬効向上のための新規薬剤開発

医薬品開発の中心課題は治療効果の高い新規医薬品の創製である。すなわち「薬効向上のための新規薬剤開発」が開発の中心となる。「薬効向上のための新規薬剤開発」の中には、「既知作用点に対する薬剤開発」、「既知薬の修飾による薬剤開発」、「新規作用点に対する薬剤開発」および「作用点非特定な薬剤開発」が存在する。

既知作用点に対する薬剤開発

「既知作用点に対する薬剤開発」とは、既存の抗アレルギー剤と作用機序（作用点）が同じではあるが、副作用が少なく治療効果が高い薬剤開発を指す。販売された薬剤を例にとると、ヒスタミン H1 拮抗剤のように、眠気や服用回数が改良され第二世代、第三世代と発展してきた医薬品をいう。なお、既存の抗アレルギー剤は、メディエーター遊離抑制剤、ヒスタミン H1 拮抗剤、トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤、ロイコトリエン拮抗剤、Th2 サイトカイン阻害剤である。

既知薬の修飾による薬剤開発

「既知薬の修飾による薬剤開発」とは、既存薬と同様の作用点を持つ医薬品で、かつ代謝により分解されて既存薬と同様の薬剤の骨格を持つように設計された薬剤をいう。

新規作用点に対する薬剤開発

「新規作用点に対する薬剤開発」とは、既存医薬とはまったく異なる新規の作用機序を有する新規生理活性物質の創製である。同じ対象疾患治療薬であっても、新規の作用点に対する薬剤開発により治療効果は向上し、市場も急拡大する例も多く、医薬品会社の研究開発のターゲットとなることが多い。

新規作用点に対する薬剤の作用メカニズムはアレルギー発症過程の観点から見た場合、免疫系に作用する薬剤開発、炎症系に作用する薬剤開発、免疫系・炎症系に関する薬剤開発などが挙げられる。既存薬では、Th2 サイトカイン阻害剤以外は炎症過程に作用する薬剤である。

b . 適用拡大

「適用拡大」とは、既知化合物で、他の治療領域の医薬でも抗アレルギー作用が認められれば、抗アレルギー剤となるように、薬剤の適応症例が増加することをいう。たとえば免疫抑制剤のタクロリムスがアトピー性皮膚炎外用薬として薬効拡大された。このような薬効拡大も課題のひとつである。

c . 易使用性

製剤分野については「易使用性」、例えば投与法の改善、投与量、投与回数の低減、副作用の低減、品質安定化などが課題となる。具体的には、気管支喘息、アレルギー性鼻炎、アレルギー性皮膚炎分野では経皮、経鼻製剤が、蛋白・抗体医薬では送達方法に関する製剤技術などが重要となる。

d . 製造コスト低減化

生産分野については「製造コスト低減」を課題として、品質保証、費用対効果の観点から製造法の改善が検討される。

表 1.4-1 抗アレルギー剤に関する技術開発課題

課題	課題	課題
薬効向上のための新規薬剤開発	既知作用点に対する薬剤開発	免疫系に作用する薬剤開発
		炎症系に作用する薬剤開発
		免疫系・炎症系に作用する薬剤開発
		作用機作非特定
	既知薬の修飾による薬剤開発	
	新規作用点に対する薬剤開発	免疫系に作用する薬剤開発
炎症系に作用する薬剤開発		
免疫系・炎症系に作用する薬剤開発		
作用機作非特定		
	作用点非特定の薬剤開発	
適用拡大		
易使用性	投与法の改善	
	投与量・投与回数の低減化	
	副作用低減化	
	保存安定性	
製造コスト低減化	原体コストの低減化	
	製剤コスト低減化	

(2) 解決手段

抗アレルギー剤開発における課題に対する解決手段としては、新規薬剤開発、製剤改良および製造工程改良が重要である。新規薬剤開発において解決手段としては、「既知薬と同様の作用メカニズムの新規薬剤の開発」、「新規作用メカニズムの薬剤開発」、「プロドラッグ・活性代謝物」、「作用点非特定の薬剤開発」、「新規適応範囲の特定」が挙げられる。また、製剤分野の課題については「工程簡略化」具体例としては「送達方法の開発」などが挙げられる。製造分野の解決手段に対しては「製造法の改良」などが挙げられる。

表 1.4-2 に抗アレルギー剤に関する技術開発課題に対する解決手段を示す。

表 1.4-2 抗アレルギー剤に関する技術開発課題に対する解決手段

解決手段	解決手段
既知薬と同様の作用メカニズムの薬剤開発	Th2 サイトカイン阻害剤
	化学伝達物質遊離抑制剤
	ヒスタミン H1 拮抗剤
	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤
	ロイコトリエン拮抗剤
	複数の作用機序を持つ薬剤
	作用機序不明
プロドラッグ・活性代謝物	
新規作用メカニズムの薬剤開発	樹状細胞（抗原提示細胞）の機能調節に関わる薬剤
	T細胞の機能調節に関わる薬剤
	B細胞の機能調節に関わる薬剤
	その他細胞の機能調節に関わる薬剤
	細胞接着過程の調節に関わる薬剤
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤
	核内転写過程の調節に関わる薬剤
	IgE抗体に関わる薬剤
	補体に関わる薬剤
	サイトカインに関わる薬剤
	ケモカインに関わる薬剤
	炎症における化学伝達物に関わる薬剤
	神経ペプチドに関わる薬剤
	複数の作用機序に関わる薬剤
	その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤
作用点非特定の薬剤開発	
新規適応範囲の特定	
製剤の改良	送達方法の開発
	組成の改良
	結晶型検討・合成法改良
	その他の製剤の改良
工程簡略化	

表 1.4-2 に示した解決手段について概説する。

a . 既知薬と同様の作用メカニズムの新規薬剤の開発

既存医薬品の作用機序は化学伝達物質遊離抑制、ヒスタミン H1 拮抗、トロンボキサン A2 阻害・拮抗、ロイコトリエン拮抗、Th2 サイトカイン阻害の 5 種類であるが、これらの作用機序でさらに治療効果の高い新規化合物の探索が解決手段となる。また、ロイコトリエン拮抗 + トロンボキサン A2 合成阻害、ヒスタミン H1 拮抗 + ヒスタミン H3 拮抗、ヒスタミン H1 拮抗 + タキキニン拮抗、トロンボキサン A2 合成酵素阻害 + 5 - リポオキシゲナーゼ阻害、など複数の作用機序によって薬効を高める方向も考えられる。

上記 5 種類の既存薬のうち Th2 サイトカイン阻害剤のみは免疫過程に作用する薬剤であり、他の 4 種は炎症過程に作用する薬剤である。

b . プロドラッグ・活性代謝物

既存薬のプロドラッグや代謝物の検討から副作用の低減を図る方向も考えられる。

c . 新規作用メカニズムの薬剤開発

抗アレルギー剤とは、アレルギー発症を抑える薬剤であり、アレルギー発症の作用機序がターゲットとなる。ターゲットとして薬剤が関係する因子としては、大きくは、以下の3つに分けられる。即ち細胞、細胞間および細胞内情報伝達過程、情報伝達物質である。上記以外に、複数の作用点をターゲットとしている「複数の作用機序に関わる薬剤」、
「そのほかの新規作用メカニズムに関わる薬剤」があげられる。

細胞

(樹状細胞の機能調節に関わる薬剤 / T細胞の機能調節に関わる薬剤 / B細胞の機能調節に関わる薬剤 / その他細胞の機能調節に関わる薬剤)

細胞としては樹状細胞(抗原提示細胞)、T細胞、B細胞などの免疫過程に関与する細胞と、その他の細胞として肥満細胞、好塩基球、好酸球、好中球、上皮細胞など炎症過程に関わる細胞に分類できる。特に 型アレルギーではIgE抗体の過剰産生が根本原因であることから、その産生細胞のB細胞、B細胞を制御するT細胞が重要であり、これら細胞の機能を抑制する物質は重要なターゲットになる。

細胞間および細胞内情報伝達過程

(細胞接着過程の調節に関わる薬剤 / 細胞内情報伝達過程に関わる薬剤 / 第二メッセンジャー過程に関わる薬剤 / 核内転写過程の調節に関わる薬剤)

情報伝達は大きく、細胞内と細胞間に分けられる。細胞間における情報伝達過程は、一つは細胞接着により制御されており、細胞内における伝達過程は、第二メッセンジャーや核まで移行して遺伝子レベルで情報伝達を制御する核内転写過程による制御などがある。

情報伝達物質

(IgE抗体に関わる薬剤 / 補体に関わる薬剤 / サイトカインに関わる薬剤 / ケモカインに関わる薬剤 / 炎症に関わる化学伝達物質に関わる薬剤 / 神経ペプチドに関わる薬剤)

細胞間の情報伝達を行う上で、細胞同士が接着して情報伝達を行う以外に、情報伝達物質を介した情報伝達システムが存在する。アレルギー発症のメカニズムを考えると薬のターゲットとなりうる情報伝達物質は、アレルギーを認識するIgE抗体、免疫関連物質である補体、免疫反応の強さと期間を調節するホルモン様低分子蛋白質であるサイトカイン、白血球運動を誘引するケモカイン、脂質メディエーターや起炎性プロテアーゼなどの炎症症状を示す化学伝達物質、血管収縮に関係する神経ペプチドなどが挙げられる。

複数の作用機序に関わる薬剤

複数の作用機序をもつ薬剤開発が解決手段の一つとなる。例えば、ロイコトリエン拮抗剤とTh2サイトカイン阻害の両方の作用を持つものなどである。複数の作用点でアレルギーの発症を抑制し、より効果の高い薬剤開発をめざしている。

その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤

上記以外の作用メカニズムであるノシセプチンレセプターなど各社が種々開発している薬剤をまとめた。

d . 作用点非特定の薬剤開発

「作用点非特定の薬剤開発」には生薬などのように複数の成分で症状を改善する薬剤開発が含まれる。

e . 新規適応範囲の特定

「新規適応範囲の特定」には、既存の適応症からさらに適応症を増やしていくような用途の拡大に関する特許が含まれる。

f . 製剤の改良

「製剤の改良」は、既存薬の製剤上での改良を意味し「送達方法の開発」「組成の改良」「結晶型の検討・合成法改良」などが解決手段となる。「結晶型の検討・合成法改良」は、合成法、特に反応温度や反応条件などの検討により結晶型の検討を行う技術を意味する。

g . 工程の簡略化

薬剤の製造法の改良については、製造工程を効率化する「工程簡略化」などを意味する。

1.4.1 抗アレルギー剤の技術要素毎の課題

抗アレルギー剤に関する技術要素毎の課題の分布を図 1.4.1-1 に、さらに時期的変化を図 1.4.1-2 に示す。

技術要素においては、合成医薬品が多く、その中でも複素環式化合物がほとんどである。複素環式の合成医薬品においては、「新規作用点に対する薬剤開発」が多く、その中では、「炎症系に作用する薬剤開発」が 428 件、「免疫系・炎症系に作用する薬剤開発」が 300 件、「免疫系に作用する薬剤開発」が 201 件と続く。複素環式の合成医薬品において、「既知作用点に対する薬剤開発」の中で多数出願されているのは、「炎症系に作用する薬剤開発」で 135 件である。抗体医薬品や蛋白質医薬品、ペプチド医薬品、核酸医薬品、天然物医薬品からなるバイオ系高分子医薬品および天然物医薬品においては、「新規作用点に対する薬剤開発」の中で「免疫系に作用する薬剤」が目立って多くなるのが、合成医薬品との差異である。

図 1.4.1-1 抗アレルギー剤に関する技術要素と課題の分布

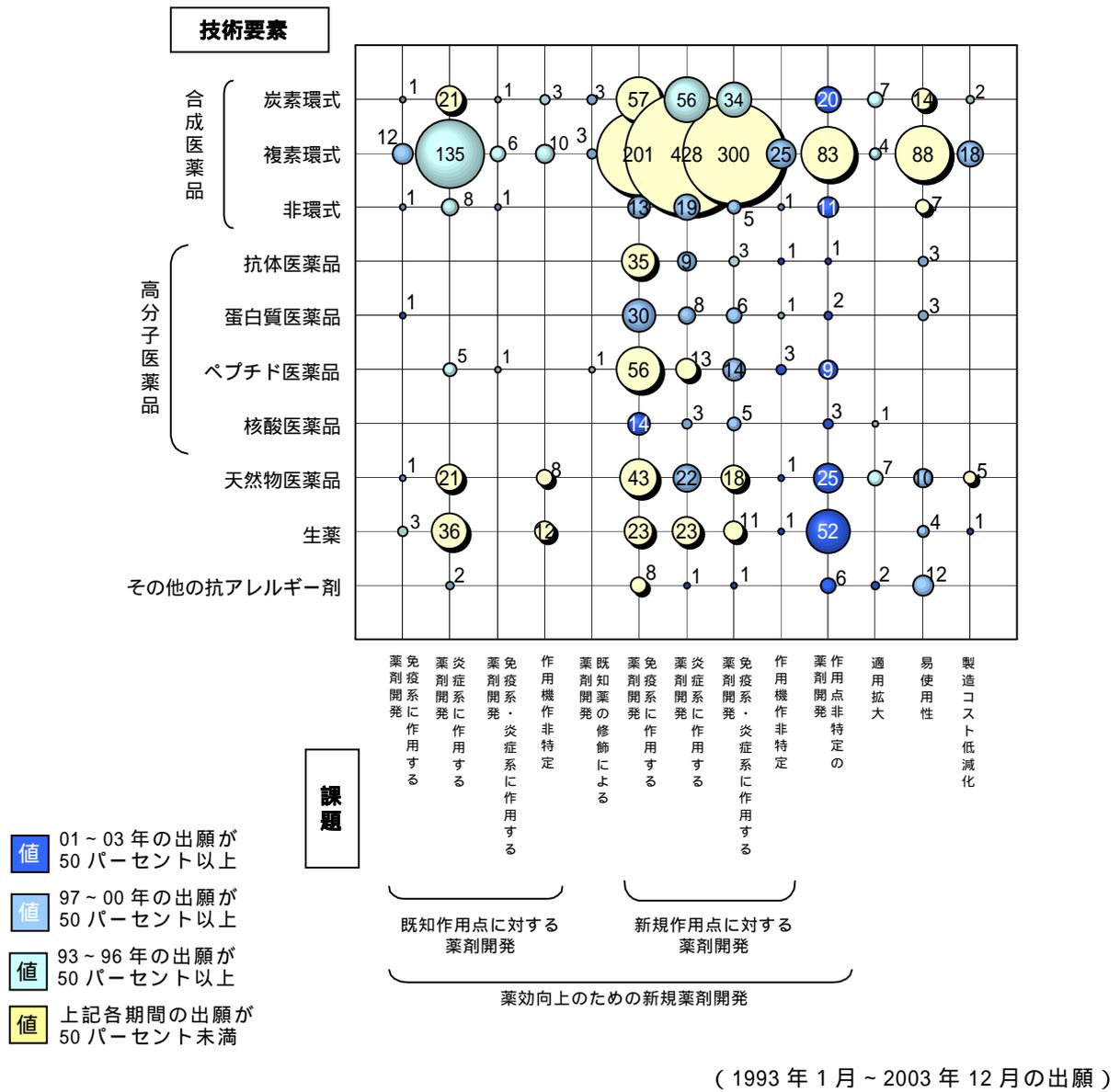
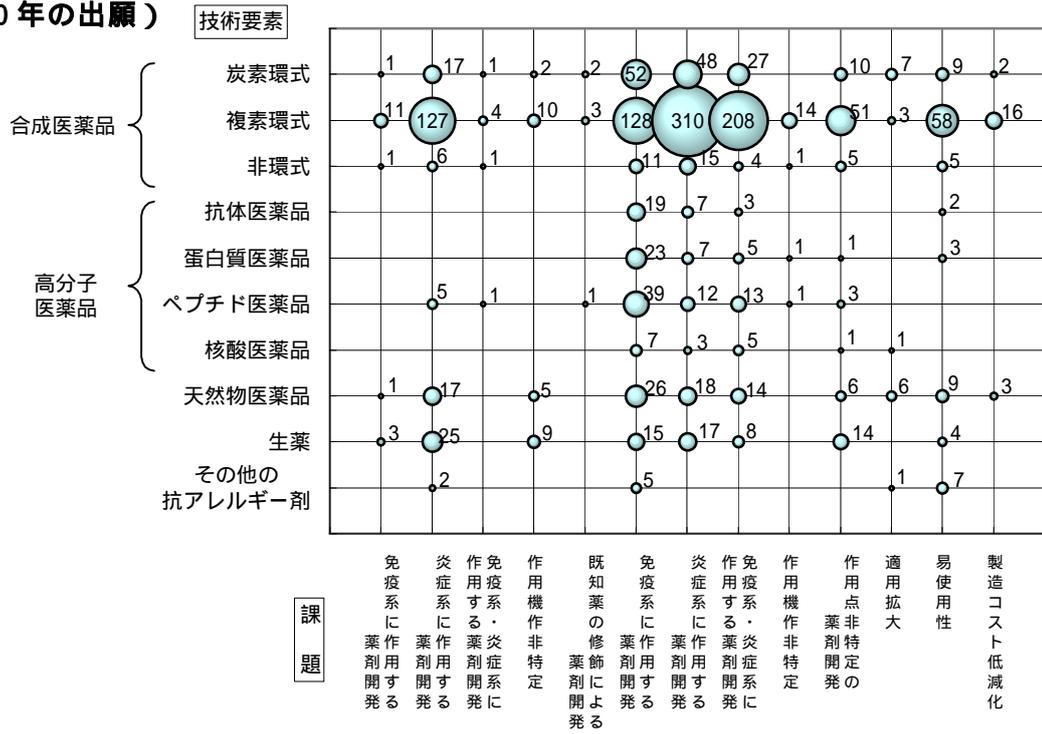


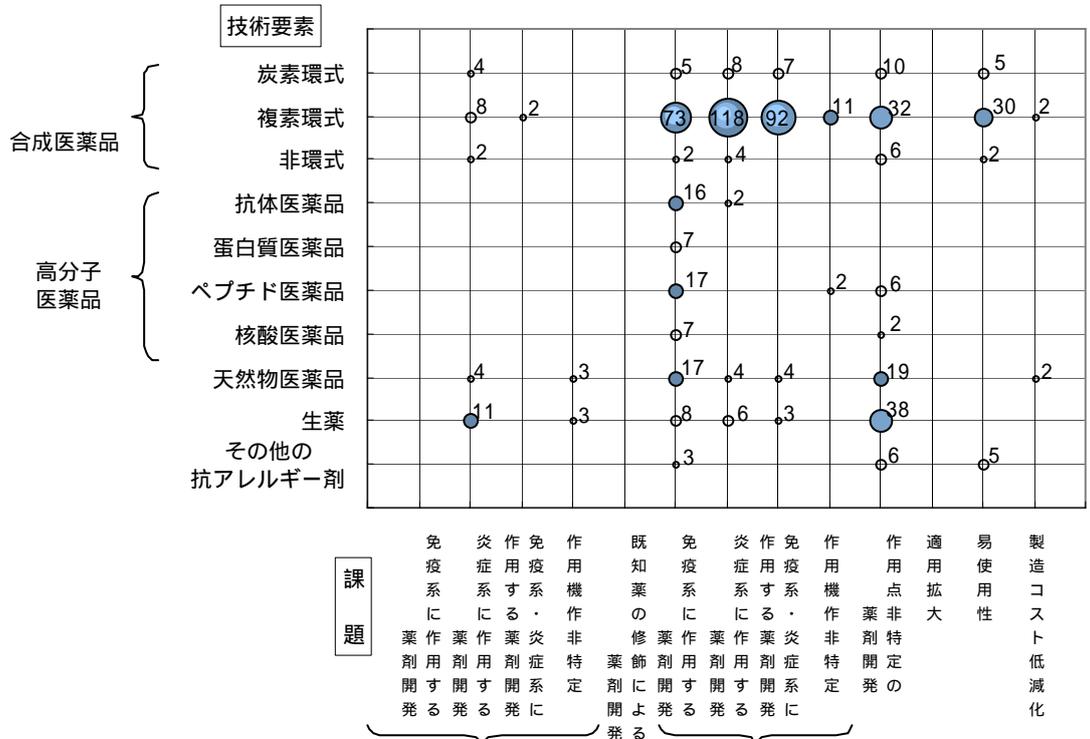
図 1.4.1-2 のとおり 1993 年～2000 年までと 2001 年～2003 年までの期間を比較するとどの技術要素においても、最近では「既知作用点に対する薬剤開発」が激減し、「新規作用点に対する薬剤開発」へと移行している。また、全技術要素において、近年は「免疫系に作用する薬剤開発」の割合も増える傾向にある。

図 1.4.1-2 期間ごとにみた技術要素と課題の分布

(93~00年の出願)



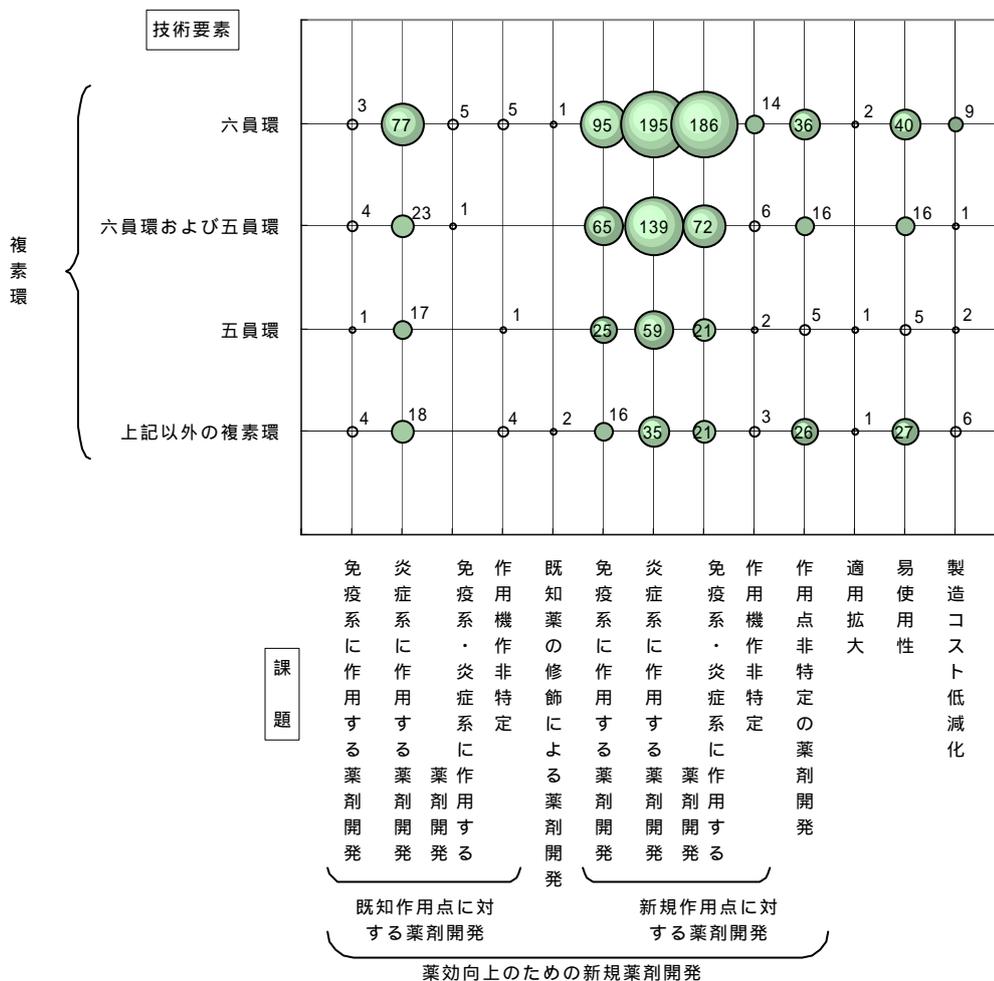
(01~03年の出願)



(1993年1月~2003年12月の出願)

合成医薬品の研究開発の中心は複素環であり、その現実を反映して複素環に関する特許出願が多く見られた。図 1.4.1-3 には、複素環をさらに構造によって細分化した結果を示す。多くの医薬品の構造である縮合環を、FI を利用し、「六員環」、「六員環および五員環」、「五員環」、「上記以外の複素環」に大別した。

図 1.4.1-3 複素環の構造による細分化



(1993年1月～2003年12月の出願)

1.4.2 抗アレルギー剤の課題と解決手段

抗アレルギー剤開発の課題と解決手段の分布を図 1.4.2-1 に示す。また、期間毎にみた課題と解決手段の分布を図 1.4.2-2 に示す。

全体としては新規薬剤の課題に関するものが大部分である。

さらに課題毎にみると、「既知作用点に対する薬剤開発」の課題に対しては「炎症系に作用する薬剤開発」が大部分であり、「化学伝達物質遊離抑制剤」、「ヒスタミン H1 拮抗剤」、「ロイコトリエン拮抗剤」が多く、「トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤」は少ない。「免疫系に作用する薬剤」である「Th2 サイトカイン阻害剤」も比較的少ない。一方、複数の作用機序をもつ薬剤が多く、既存薬に対して何らかの特徴を見出そうとの動きがみてとれる。

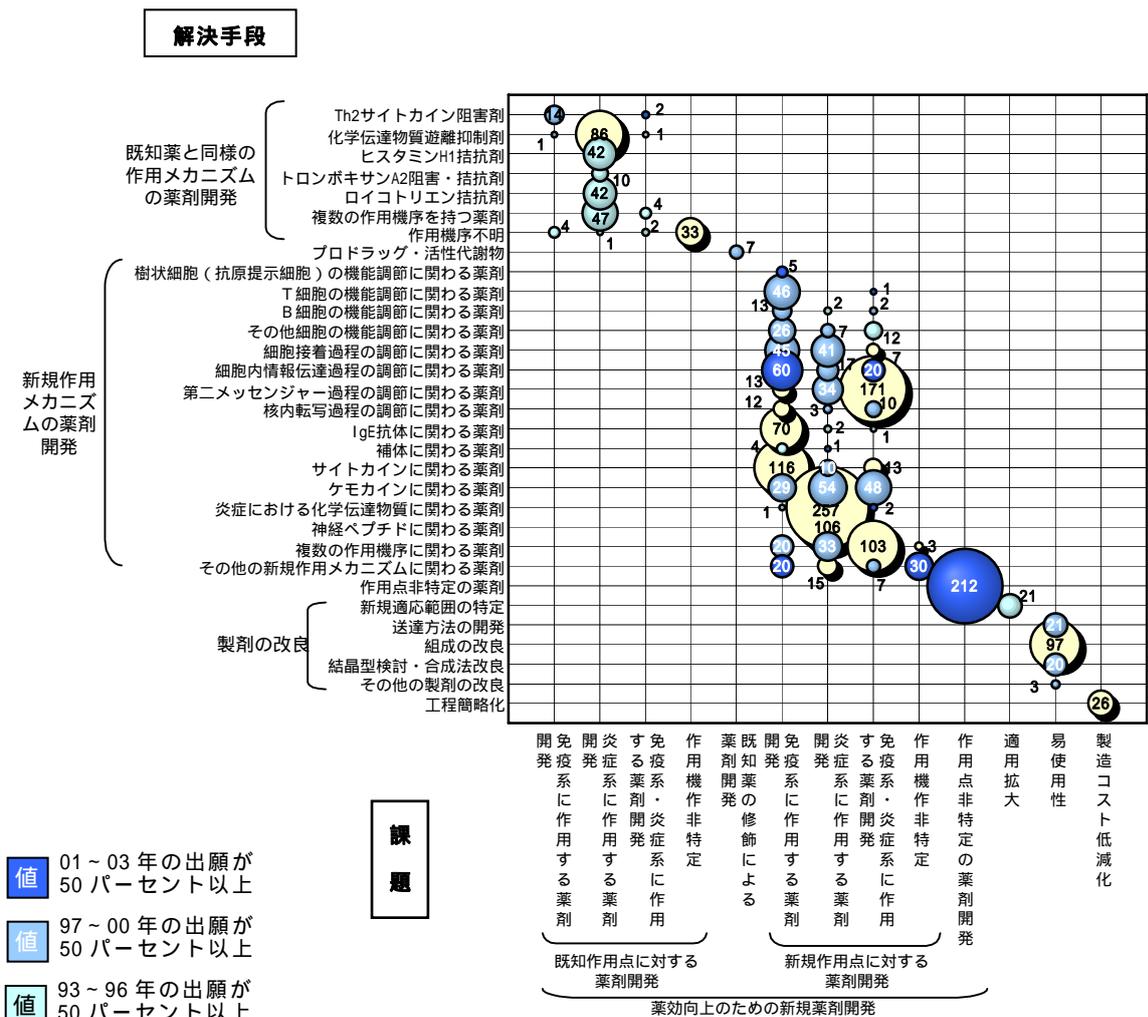
「新規作用点に対する薬剤開発」の課題に対しては、「炎症系に作用する薬剤開

発」では「化学伝達物質に関わる薬剤」が圧倒的に多く、その詳細は脂質メディエーターに関わる薬剤と起炎性プロテアーゼに関わる薬剤である。続いて「神経ペプチドに関わる薬剤」、「ケモカインに関わる薬剤」が多い。「免疫系に作用する薬剤」では「サイトカインに関わる薬剤」、「IgE抗体に関わる薬剤」、「細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤」が多い。「免疫系・炎症系に作用する薬剤」では「第二メッセンジャー過程の調節」に関わる薬剤が多く、その大部分はホスホジエステラーゼ4 (PDE4) 阻害剤である。さらに、複数の作用機序に関わる薬剤も多い。

易使用性については製剤組成に関するものが多い。

次いで期間毎に見ると、最近(2001~2003年)では「既知作用点に対する薬剤開発」(ヒスタミンH1拮抗剤、ロイコトリエン拮抗剤など)が激減しており、この分野の薬剤開発は完全に峠を越したものと思われる。また、「第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤」(PDE4阻害剤)の開発も件数的には多いが、近年わずかながら減少傾向が見受けられる。一方、「細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤」が増加するなどの新しい流れも見て取れる。

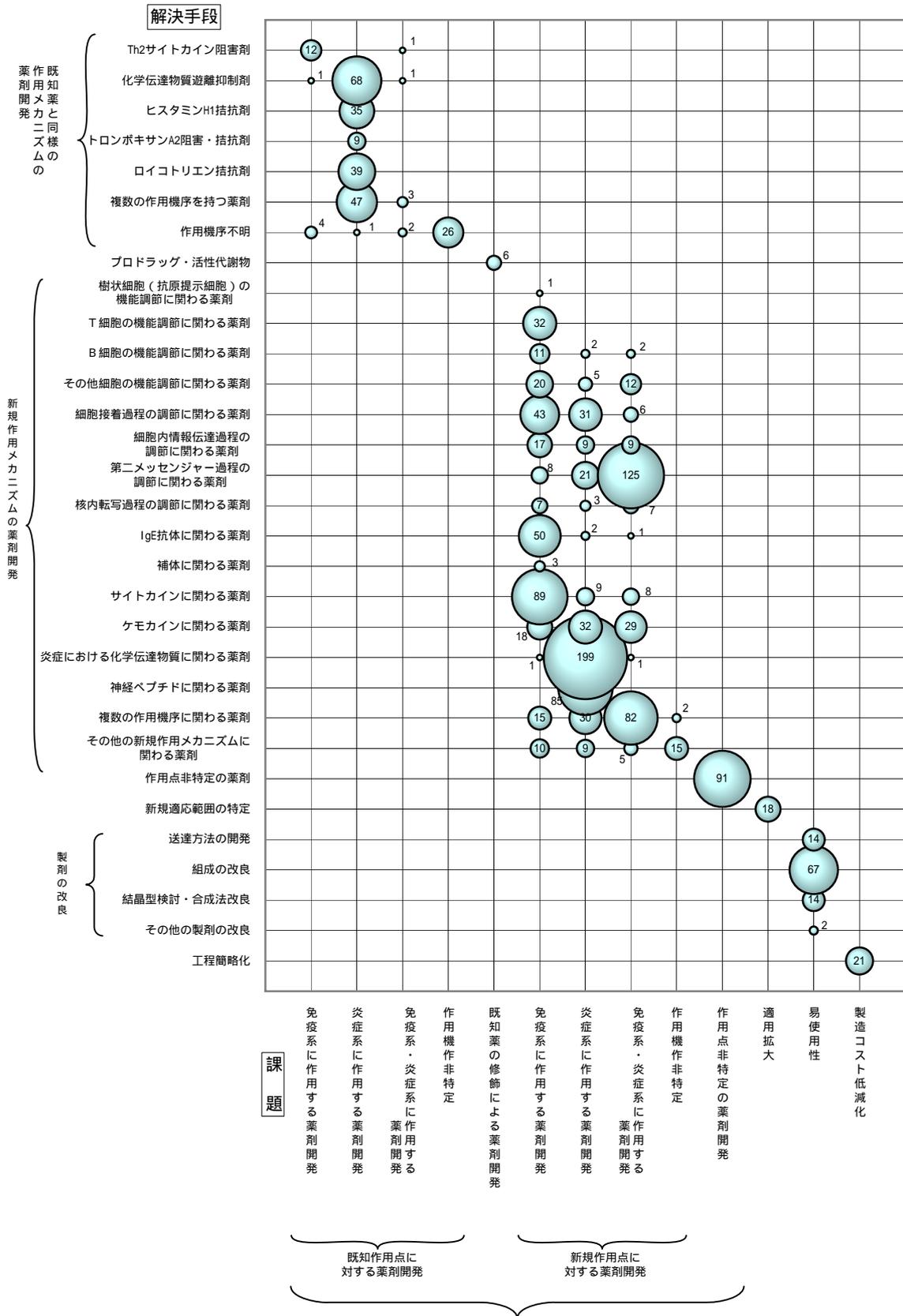
図 1.4.2-1 抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布



(1993年1月~2003年12月の出願)

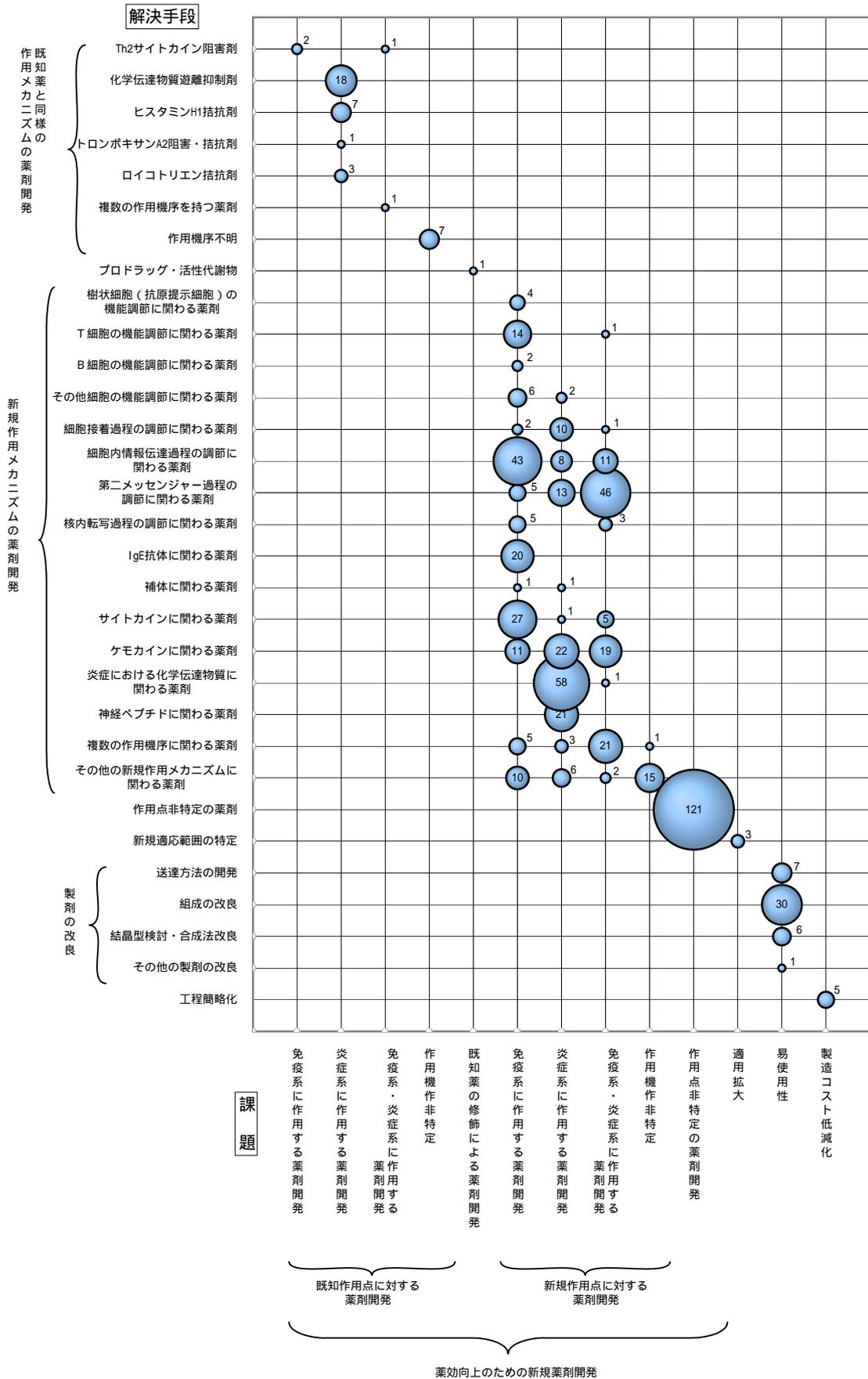
図 1.4.2-2 期間毎にみた課題と解決手段の分布

(93~00年の出願)



(1993年1月~2003年12月の出願)

(01~03年の出願)



(1993年1月~2003年12月の出願)

1.4.3 解決手段に関する特記事項

特許出願状況の主体である「新規作用メカニズムの薬剤開発」に関して、出願が多い解決手段について述べる。

<細胞>

(樹状細胞の機能調節に関わる薬剤 / T細胞の機能調節に関わる薬剤 / B細胞の機能調節に関わる薬剤 / その他細胞の機能調節に関わる薬剤)

型アレルギーでは IgE 抗体の過剰産生が根本原因であることから、その産生細胞の B細胞、B細胞を制御する T細胞が重要であり、これら細胞の機能を抑制する物質は重要な医薬品標的になる。具体的には細胞の増殖を抑制するもの、活性化を抑制するもの、機能を阻害するものなどであり、T細胞では抗 CD30 抗体、抗 T細胞受容体抗体、Ick チロシンキナーゼ阻害剤など、B細胞についてはヒト s-CD23 形成阻害剤や、ヒト B細胞成長因子阻害蛋白質など、好酸球では好酸球の脱顆粒抑制剤、遊走阻害剤、ドメイン 4 (D4 c) 領域に対するモノクローナル抗体など、好中球ではペルオキシゾーム増殖因子活性化受容体 - (PPAR)アゴニストなどの出願がみられる。

<細胞間および細胞内情報伝達過程>

(細胞接着過程の調節に関わる薬剤 / 細胞内情報伝達過程に関わる薬剤 / 第二メッセンジャー過程に関わる薬剤 / 核内転写過程の調節に関わる薬剤)

細胞接着過程の調節に関わる薬剤

白血球の内皮細胞または細胞外マトリックスプロテインへの接着は免疫および炎症の基礎的プロセスとされており、セクレチン、インテグリン、免疫グロブリン、CD44 などの接着分子が関与しており、これらの接着分子の阻害物質が標的となる。具体的には 4 インテグリン阻害剤、P - セレクチンのリガンド PSGL の拮抗剤 (例えば可溶性 PSGL , PSGL 抗体、拮抗剤)、ICAM-1 発現抑制剤、シアロアドヘジンファクター 2 (SAF-2) と結合するモノクローナル抗体などである。

細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤

細胞一般において、外部刺激 (情報) は細胞膜を介して細胞内に伝達され、DNA 結合蛋白の活性化、蛋白質の合成を通して細胞機能が発揮される。この過程の最初の過程を細胞内情報伝達過程というが、この過程を制御することにより細胞の機能をコントロールできると考えられている。この過程には各種のキナーゼ酵素が関与しているのでこれら酵素の阻害剤が標的とされる。具体的には src チロシンキナーゼの阻害剤、c-kit チロシン蛋白キナーゼ阻害剤、p-38 キナーゼ阻害剤、チロシンホスファターゼ阻害剤、スフィンゴシンキナーゼ (SPHK) 阻害剤などが出願されている。

第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤

・ PDE4 阻害剤

ホスホジエステラーゼ (PDE) は細胞内情報伝達物質 (第二メッセンジャー) である c-AMP や c-GMP を加水分解して不活化する加水分解酵素群であり、PDE1 から PDE11 まで 11 種のファミリーが存在する。そのうち PDE4 は気道平滑筋、上皮細胞、炎症

細胞（マクロファージ、好中球、好酸球）、T-リンパ球に局在し、それら細胞の c-AMP レベルを調節し、細胞機能の制御を行なっている。PDE4 阻害剤は PDE4 による c-AMP の分解を抑制することによって、細胞内 c-AMP を蓄積することができることから抗喘息薬としての出願が多い。

・ アデノシン受容体関連

アデノシンレセプターは A1、A2a、A2b、A3 に分類され、その活性化により信号伝達機構を開始する。A1 および A3 レセプター（Gi 蛋白と結合する）はアデニレートシクラーゼを阻害し c-AMP 濃度を減少させ、また、ホスホリパーゼ C を刺激し、細胞内カルシウム濃度を上昇させる。また、A3 の活性化はマストセルからの脱顆粒を引き起こす。A2a、A2b レセプターは（Gs 蛋白質と結合し）アデニレートシクラーゼを活性化し c-AMP を増加させる。アデノシンは喘息患者に対して気道狭窄反応を示し、一方、喘息治療薬のテオフィリンはアデノシン拮抗作用を示す。このことから A2a のアゴニスト、A3 の拮抗剤は喘息性の疾患に有用であり、出願も多い。

< 情報伝達物質 >

（IgE 抗体に関わる薬剤 / 補体に関わる薬剤 / サイトカインに関わる薬剤 / ケモカインに関わる薬剤 / 炎症に関わる化学伝達物質に関わる薬剤 / 神経ペプチドに関わる薬剤）

IgE 抗体に関わる薬剤

IgE（免疫グロブリン）は抗原が進入したとき B 細胞により産生分泌され、I 型の即時型アレルギーをおこす。肥満細胞、好塩基球はその表面に高親和性 IgE 受容体（FC_εRI）をもち、この受容体に IgE が結合（Fc 部分で結合）し、さらにアレルゲンが結合することにより肥満細胞の脱顆粒が起こり、ヒスタミンなど化学伝達物質が放出される。これらは炎症細胞の活性化を促し、アレルギーを誘発する。また、樹状細胞、T 細胞、B 細胞、各種炎症性細胞上に、CD23 としても知られている、低親和性の IgE 受容体（FC_εR₂）を誘導する。実際、アレルギー患者では IgE レベルが高いと言われており、IgE のコントロールは抗アレルギー剤の重要な標的と考えられている。具体的には IgE に対するモノクローナル抗体、IgE 抗体の Fc 領域を標的とする抗 IgE 抗体や阻害剤、高親和性 IgE 受容体（FC_εRI）の拮抗剤、その他、動物モデルで IgE 産生を抑制するなどの出願がある。

サイトカインに関わる薬剤

サイトカインは免疫系に関わる細胞によって産生され、免疫系を調節したり、炎症反応を引き起こしたりする蛋白質であり、自然免疫に関わるサイトカイン、抗原特異的免疫応答に関わるサイトカイン、炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカイン、造血系を活性化させるサイトカインに大別される。I 型アレルギー性疾患については主として抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインと炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインが重要である。

・ 抗原特異的免疫応答に関わるサイトカイン

IL-4 は炎症の発生、進展に関与し、特に、アトピー性皮膚炎では増悪要因とされているので炎症のコントロールには重要なサイトカインである。

IL-9 は Th2 タイプの T 細胞から産生される因子で、主に Th2 細胞の増殖を誘導し、アトピーと喘息患者の遺伝的研究から、アトピー性アレルギー特に喘息の病因とされている。このことから、IL-4 活性阻害剤、たとえば JAK-STAT6 リン酸化抑制剤や、IL-9 活性阻害剤、たとえばチロシンリン酸化経路に関与する酵素の阻害剤などが出願されている。

- ・炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカイン

IFN- γ 、リンフォトキシン (LT)、IL-5 などがあげられるが、特に IL-5 は抗原で活性化された B 細胞の増殖を刺激したり、好酸球の増殖と分化を刺激するなどの作用があり、特に好酸球を介した炎症反応を調節するので、その作用を調節する阻害剤は良き医薬品標的となる。具体的には IL-5 の産生阻害剤、レセプター拮抗剤が出願されている。

- ・その他のサイトカイン (自然免疫に関わるサイトカインなど)

TNF- α (産生抑制剤、機能阻害剤)やインターロイキン - 1 (IL-1 レセプター拮抗剤、IL-1 変換酵素阻害剤)に関する出願が多く見られ、I 型アレルギー疾患への適応も記載はされているが、主として慢性関節リュウマチなどの自己免疫疾患などが適応の中心と考えられる。

ケモカインに関わる薬剤

- ・CC ケモカイン

CC ケモカインレセプターには 9 種が同定されているが、特に重要なのは好酸球上で、さらにまた、好塩基球、肥満細胞、および Th2 細胞上で、おもに発現される CCR-3 レセプターである。このレセプターに CC ケモカイン (RANTES、MCP-3、MCP-4、エオタキシン、エオタキシン - 2) が作用し好酸球を動員、活性化するので、喘息のようなアレルギー性疾患の発症において中心的な役割を担うことが示唆されている。実際、抗 CCR-3 抗体は喘息の動物モデルで有効である。これらのことから CCR-3 レセプターの拮抗剤は気管支喘息、アレルギー性鼻炎、アトピー性皮膚炎に有効と考えられ、出願が多い。その他、CCR1、CCR5 の拮抗剤が出願されている。また、レセプター拮抗剤ではなく、ケモカインの低親和性 GAG 結合ドメインに結合し、サイトカインの作用を抑制する MCP-1 (単球走化性蛋白) 機能の拮抗剤も出願されている。

- ・CXC ケモカイン

CXC ケモカインは好中球の蓄積と活性化を促進する。癌新脈管形成を誘導するなどの作用により、乾癬 (かんせん)、リュウマチ性関節炎を含む広範囲の急性、慢性炎症疾患に、また、癌の増殖に関与している。(CXCR3 ケモカイン受容体拮抗剤)

炎症における化学伝達物質に関わる薬剤

- ・脂質メディエーター

ロイコトリエンやトロンボキサンが喘息の病態を悪化させることから、その作用を抑制するロイコトリエン拮抗剤やトロンボキサン合成酵素阻害剤、受容体拮抗剤が抗アレルギー剤として上市されていることは既に述べたとおりである。これらロイコトリエンやト

ロンボキサンは、アラキドン酸カスケードと呼ばれる経路にしたがって、細胞膜からのアラキドン酸の切り出しをスタートに産生される。5-リポオキシゲナーゼ(5-LO)はロイコトリエンの産生に関して、シクロオキシゲナーゼはトロンボキサンの産生に関して、カスケードの上流に位置する酵素であり、ホスホリパーゼ A2 は膜のリン脂質を加水分解するアラキドン酸カスケードの律速酵素である。いずれの酵素もロイコトリエン、トロンボキサン生成に関し川上にある酵素であり、これらの酵素の阻害剤は新しい標的となる。

実際、シクロオキシゲナーゼの阻害剤、COX-2 阻害剤は炎症性のプロスタグランジン類の生成を抑制することから強力な副作用の少ない抗炎症剤として近年上市され(メロキシカム：モービック 日本ベーリンガー、第一製薬)、関節リュウマチの治療薬として使用されている。

また、アレルギー性鼻炎治療剤、鼻閉治療剤として、PGD2 受容体拮抗剤も出願されている。

・起炎性プロテアーゼ

トリプターゼ阻害剤：トリプターゼは肥満細胞の分泌プロテイナーゼで、肥満細胞の刺激と脱顆粒によって放出され、上皮細胞においては IL-8 の産生を刺激し、肥満細胞からのヒスタミン放出を刺激、また、化学誘引物質として好酸球カチオン性蛋白を誘引するとされている。また、喘息、アレルギー性結膜炎、アレルギー性鼻炎、リュウマチ性関節炎などでトリプターゼ値の上昇がみられることから、トリプターゼ阻害剤は喘息など、アレルギー性疾患の治療薬として多くの出願がなされている。

キマーゼ阻害剤：キマーゼは主として肥満細胞顆粒中に蓄えられ、心臓、血管、皮膚などの組織に分泌されるキモトリプシン様セリンプロテアーゼである。本酵素は肥満細胞の脱顆粒促進、エンドセリンやコラゲナーゼの産生、ブラジキニン、サブスタンス P などの生理活性ペプチドの代謝、コラーゲン、フィブロネクチン、ビトロネクチンなどの細胞外マトリックスの限定分解、気道粘膜分泌腺の分泌反応亢進、マクロファージの泡沫細胞化の促進作用を有することが知られており、喘息、リュウマチ、血栓症、気管支炎の治療に有用性が期待されている。

また、最近、アンジオテンシン変換酵素と同様、アンジオテンシン を産生することが判明、特にヒト心臓左心室ではその 80%以上がキマーゼによることが判った。これらのことからキマーゼ阻害剤は上記の喘息などアレルギー疾患のみならず心肥大、心不全、動脈硬化の治療薬、予防薬として期待され出願が多い。

ヒアルロニダーゼ阻害剤：ヒアルロニダーゼは皮膚の潤滑性、柔軟性、老化を防ぐヒアルロン酸を分解する酵素である。その阻害剤は皮膚の小じわや、かさつきを防ぎ、免疫系(腸管免疫)においては IgA 生産能を賦活化する。また、この酵素は炎症時に活性化され、結合組織のマトリックスを破壊し、炎症系組織への浸潤、血管透過性を亢進するので、その阻害剤は抗炎症作用も持つとされ出願が多い。

カテプシン S 阻害剤：カテプシンはシステインプロテアーゼの酵素ファミリーに属する酵素であり、カテプシン K, B, H, L, N, S が知られている。結合組織の蛋白分解に関与し高レベルの体内蓄積はさまざまな疾患を誘発する。その阻害剤は喘息、自己免疫疾患に有効と考えられている。

・その他の化学伝達物質

ブラジキニン受容体（B2 受容体）拮抗剤：ブラジキニンは組織障害時に産生され、炎症性伝達物質として作用する血管作動性ペプチドであり、その受容体（B2 受容体）を介して炎症プロセスを惹起する。このことから炎症過程を抑制する薬剤としてブラジキニン受容体（B2 受容体）拮抗剤が出願されている。

ヒスタミン H3 受容体拮抗剤：ヒスタミン H3 は新規受容体であり、主に大脳のヒスタミン作動性神経終末に観察され、眠り - 覚醒の調節に関与する。たとえばアゴニストは除波睡眠を増進し、拮抗剤は覚醒を促進する。さらに、胃腸管内や気道ニューロン上には H3 ヘテロレセプターが存在することが示され、その拮抗剤は喘息、鼻炎、気道充血、炎症の治療に有用となる可能性がある。

ヒスタミン H4 受容体拮抗剤：ヒスタミンにより誘導されるヒト好酸球の走化性は H3 ではなく、H4 受容体によって媒介されることが最近判明した。その拮抗剤は好酸球の鼻への浸潤を阻害し、鼻の充血を除外する。また、好酸球の肺への浸潤を阻害し、喘息に関連する炎症に有効としてヒスタミン H4 受容体拮抗剤が出願されている。

神経ペプチドに関わる薬剤

神経ペプチドは、気道知覚神経 C 線維より分泌される神経伝達物質で、その標的細胞膜上のレセプター NK-1、2、3 を介して作用する。

・タキキニン

タキキニンはサブスタンス P（SP）、ニューロキニン A（NKA）、ニューロキニン B（NKB）からなる、神経系に広く分布する神経ペプチドである。その生理活性は気道収縮、気道過敏性誘発、粘液過分泌、血管透過性亢進、肥満細胞からのヒスタミン遊離、咳誘発、発痛などであり、これらは NK1、NK2、NK3 を介してその作用を発現する。

具体的には、SP（NK-1 受容体）、NKA（NK-2 受容体）は喘息や鼻アレルギーにおける気道や鼻の過敏症に関与している。また、NKB（NK-3 受容体）は、気道、皮膚、脊髄、一次求心性線維終末における神経入力調節をおこなう。したがって、これらのタキキニン受容体の拮抗剤は喘息、慢性気管支炎などの肺疾患、アトピー性皮膚炎のような皮膚炎、関節リウマチ、過敏性腸症候群、神経性炎症ならびにパーキンソン病などの中枢性（CNS）疾患に有効とされ多くの出願がなされている。

1.4.4 抗アレルギー剤の技術要素別の課題と解決手段

(1) 合成医薬品

a. 炭素環式

次に技術要素毎に課題と解決手段の分布、その詳細、出願人を示す。図 1.4.4-1 に合成医薬品の内、炭環式に関する課題と解決手段の分布を、表 1.4.4-1 に課題と解決手段の詳細を示し、最も件数の多い課題と解決手段に網掛けをしている。

炭素環式では、「新規作用点に対する薬剤開発」で「炎症系に作用する薬剤開発」の課題に対し、解決手段として「炎症における化学伝達物質の薬剤開発」が 36 件、その中で脂質メディエーターに関わる薬剤開発が多く、出願件数は 28 件である。

図 1.4.4-1 炭素環式に関する課題と解決手段の分布

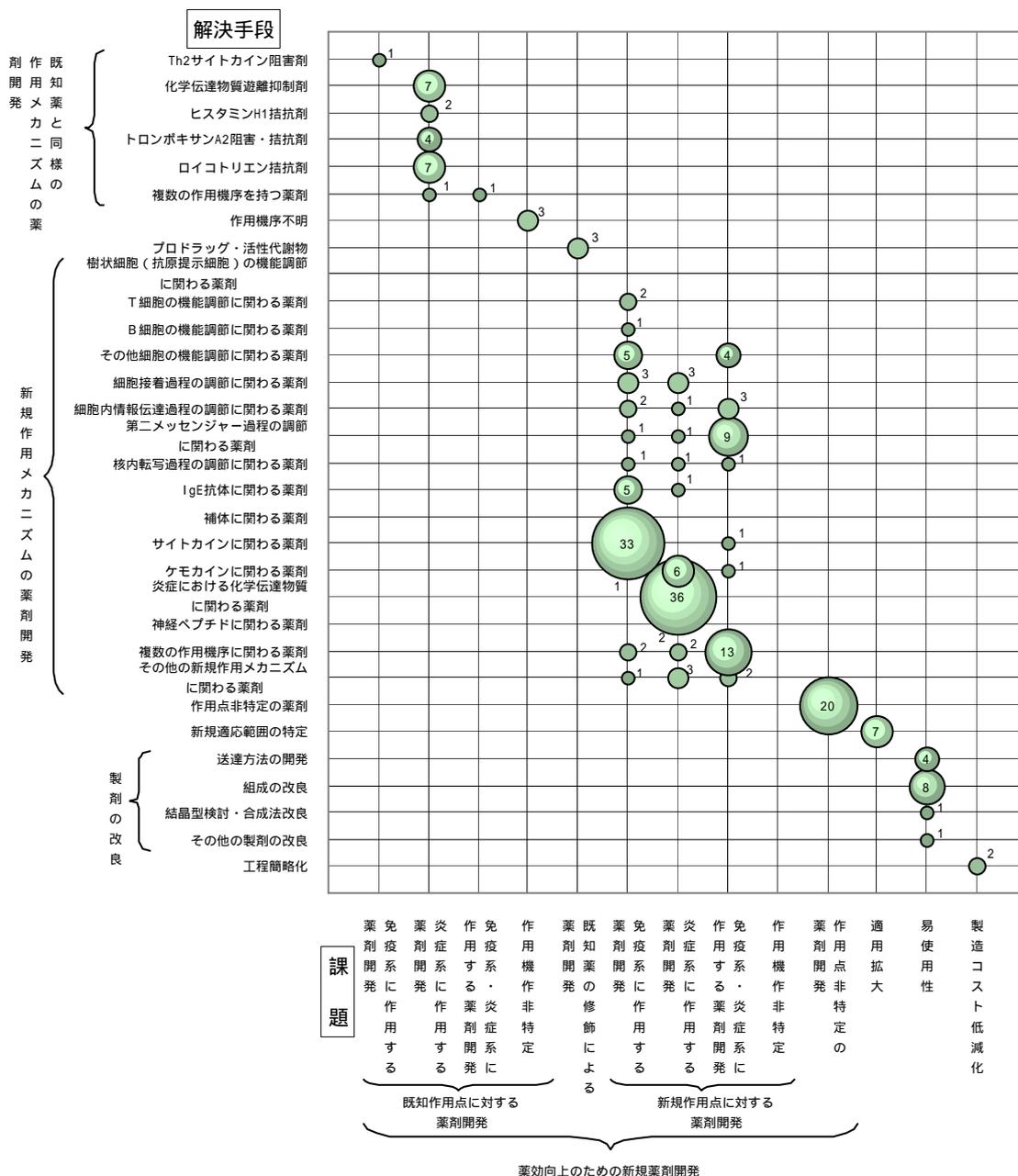


表 1.4.4-1 炭素環式の課題に対する解決手段の詳細(1/3)

課題		薬効向上のための新規薬剤開発											
		既知作用点に対する薬剤開発					既知薬の修飾による薬剤開発	新規作用点に対する薬剤開発					作用点非特定の薬剤開発
		免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定	プロドラッグ・活性代謝物		免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定		
解決手段		1											
メカニズムと同様の薬剤の開発	Th2 サイトカイン阻害剤	1											
	化学伝達物質遊離抑制剤		7										
	ヒスタミン H1 拮抗剤		2										
	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤		4										
	ロイコトリエン拮抗剤		7										
	複数の作用機序を持つ薬剤		1	1									
	作用機序不明				3								
プロドラッグ・活性代謝物						3							
新規作用メカニズムの薬剤開発	樹状細胞（抗原提示細胞）の機能調節に関わる薬剤												
	T細胞の機能調節に関わる薬剤						2						
	B細胞の機能調節に関わる薬剤						1						
	その他細胞の機能調節に関わる薬剤						5		4				
	細胞接着過程の調節に関わる薬剤						3	3					
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤						2	1	3				
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤	PDE 4 に関わる薬剤							1	9			
		アデノシンに関わる薬剤											
		その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤						1					
	核内転写過程の調節に関わる薬剤							1	1	1			
	IgE 抗体に関わる薬剤							5	1				
	補体に関わる薬剤												
	サイトカインに関わる薬剤	抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤						6					
		炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤								1			
		その他のサイトカインに関わる薬剤						27					
	ケモカインに関わる薬剤	CC ケモカインに関わる薬剤						1	3				
CXC ケモカインに関わる薬剤								3					
その他のケモカインに関わる薬剤									1				
炎症における化学伝達物質に関わる薬剤	脂質メディエーターに関わる薬剤							28					
	起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤							7					
	その他の化学伝達物質に関わる薬剤							1					

表 1.4.4-1 炭素環式の課題に対する解決手段の詳細(2/3)

課題			薬効向上のための新規薬剤開発									
			既知作用点に対する薬剤開発				既知薬の修飾による薬剤開発	新規作用点に対する薬剤開発			作用点非特定の薬剤開発	
			免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定		免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発		作用機作非特定
解決手段			免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定	プロドラッグ・活性代謝物	免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定	作用点非特定の薬剤開発
新規作用メカニズム	神経ペプチドに関わる薬剤	タキキニンに関わる薬剤							1			
		その他の神経ペプチドに関わる薬剤							1			
	複数の作用機序に関わる薬剤								2	2	13	
	その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤								1	3	2	
作用点非特定の薬剤												20
新規適応範囲の特定												
製剤の改良	送達方法の開発											
	組成の改良											
	結晶型検討・合成法改良											
	その他の製剤の改良											
工程簡略化												

表 1.4.4-1 炭素環式の課題に対する解決手段の詳細(3/3)

解決手段	課題	適用拡大	易使用性				製造コスト低減化	
			投与方法改善	投与量・投与回数 の低減化	副作用低減化	保存安定性	原体コストの 低減化	製剤コスト低減化
発症メカニズムの作用薬と剤力開二様	Th2 サイトカイン阻害剤							
	化学伝達物質遊離抑制剤							
	ヒスタミン H1 拮抗剤							
	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤							
	ロイコトリエン拮抗剤							
	複数の作用機序を持つ薬剤							
	作用機序不明							
プロドラッグ・活性代謝物								
新規作用メカニズムの薬剤開発	樹状細胞（抗原提示細胞）の機能調節に関わる薬剤							
	T細胞の機能調節に関わる薬剤							
	B細胞の機能調節に関わる薬剤							
	その他細胞の機能調節に関わる薬剤							
	細胞接着過程の調節に関わる薬剤							
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤							
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤	PDE 4 に関わる薬剤						
		アデノシンに関わる薬剤						
		その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤						
	核内転写過程の調節に関わる薬剤							
	IgE 抗体に関わる薬剤							
	補体に関わる薬剤							
	サイトカインに関わる薬剤	抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤						
		炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤						
		その他のサイトカインに関わる薬剤						
	ケモカインに関わる薬剤	CC ケモカインに関わる薬剤						
		CXC ケモカインに関わる薬剤						
		その他のケモカインに関わる薬剤						
	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤	脂質メディエーターに関わる薬剤						
		起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤						
		その他の化学伝達物質に関わる薬剤						
	神経ペプチドに関わる薬剤	タキキニンに関わる薬剤						
		その他の神経ペプチドに関わる薬剤						
複数の作用機序に関わる薬剤								
その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤								
作用点非特定の薬剤								
新規適応範囲の特定		7						
製剤の改良	送達方法の開発		4					
	組成の改良		5	1		2		
	結晶型検討・合成法改良					1		
	その他の製剤の改良					1		
工程簡略化						2		

表 1.4.4-1 で色を付けた箇所について、表 1.4.4-2 に課題と解決手段の出願人を示す。解決手段として最も件数の多い脂質メディエーターに関わる薬剤について、出願人では、イーライリリーアンドカンパニーとファイザーの両者の出願であり各 4 件である。

表 1.4.4-2 炭素環式の課題に対する解決手段の出願人

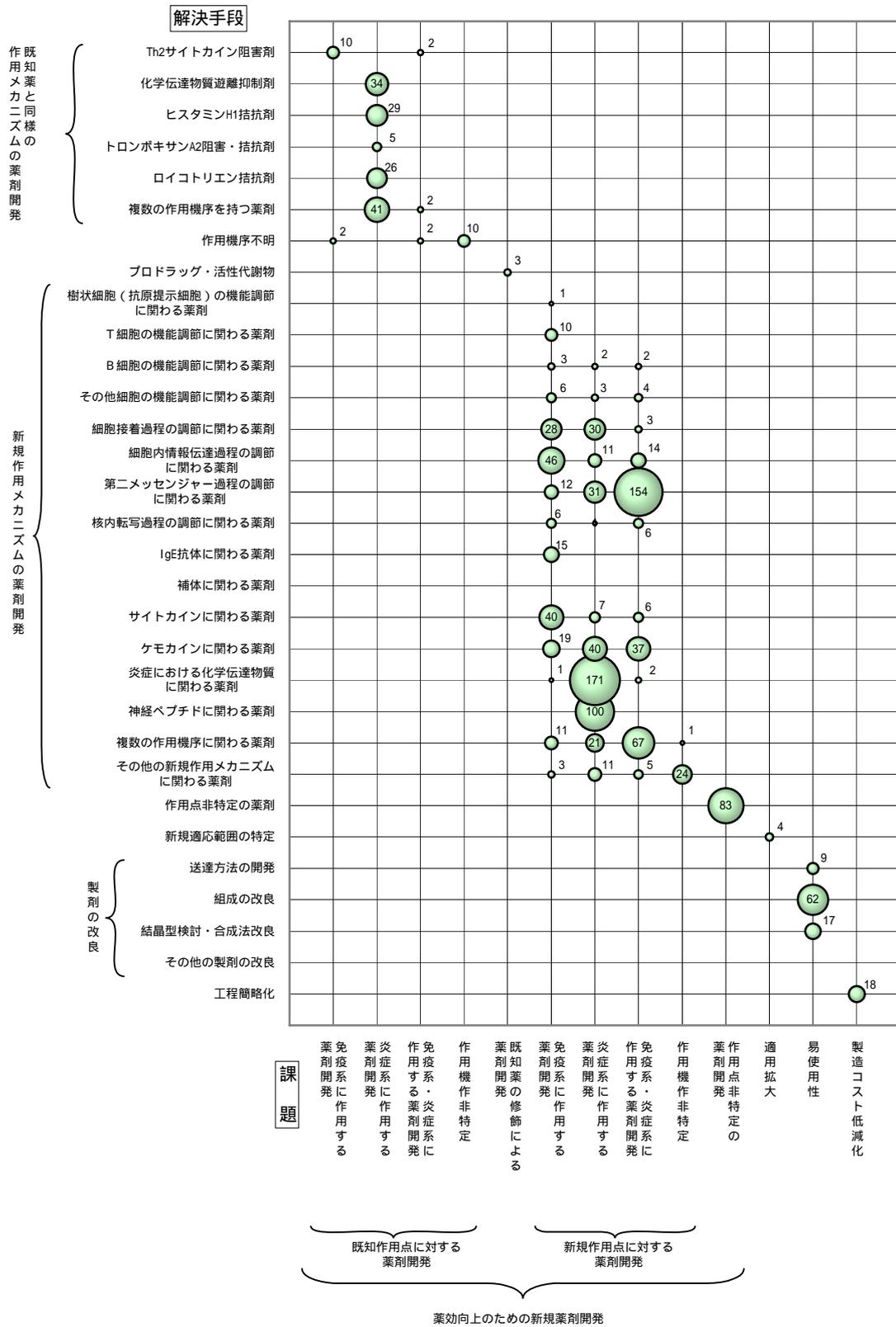
課題		薬効向上のための新規薬剤開発		
		新規作用点に対する薬剤開発		
解決手段		炎症系に作用する薬剤開発		
新規作用メカニズムの薬剤開発	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤	脂質メディエーターに関わる薬剤	アストラゼネカ(イギリス) アボット LAB(米国)(3) イーライリリーアンドカンパニー(米国)(4) ジョーンズホプキンス UNIV(米国)、グラクソ・スミスクライン(イギリス)(共願) ゾンゴークーシュエユエンチエンドウセンウイエンチュウ(中国)、東レ(共願) ツムラ テバ PHARMIND(イスラエル) ファイザー(米国)(4) ボベル 246 エスエル(スペイン) 塩野義製薬(3) 花王 大正製薬、佐藤史衛(共願) 三井化学 生命科学研究所 相模中央化学研究所 大正製薬、相模中央化学研究所(共願) 東亜合成 日本新薬	特表平 8-511011 特表平 9-501650 特表平 9-505274 特表 2000-515883 特表 2000-502083 特表 2000-501739 特表 2001-505882 特表 2003-519198 特表平 10-506092 特開平 9-157206 特開平 7-17859 特表平 8-502521 特許 2794341 特表平 8-511029 特許 2794343 特許 2756732 特表平 8-511561 特許 3195361 特開 2001-288160 W002/36583 特開平 7-53359 特開 2005-2024 特開平 8-325154 特開平 7-267895 特開平 7-233110 特開平 7-233052 特開 2005-41840 W001/89504

b. 複素環式

図 1.4.4-2 に複素環式に関する課題と解決手段の分布を、表 1.4.4-3 に課題と解決手段の詳細を示し、薬剤開発において重要である、薬剤の作用点が明確になっている課題と解決手段に関する上位 3 項目に対して網掛けをしている。

複素環式に関する課題と解決手段の分布で件数が多いのは、「新規作用点に対する薬剤開発」の内、「免疫系・炎症系に作用する薬剤開発」の課題に対し、解決手段として、「第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤」が 154 件、その中でも PDE4 に関わる薬剤開発が 127 件と多い。「炎症系に作用する薬剤開発」の課題では、解決手段として「炎症における化学伝達物質の薬剤」が 171 件、その中で脂質メディエーターに関わる薬剤が 76 件と多い。さらに「神経ペプチドに関わる薬剤」で解決しているものが 100 件、その中でもタキキニンに関わる薬剤開発で解決しているものが 86 件と多い。

図 1.4.4-2 複素環式に関する課題と解決手段の分布



(1993年1月～2003年12月の出願)

表 1.4.4-3 複素環式の課題に対する解決手段の詳細(1/3)

課題 解決手段		薬効向上のための新規薬剤開発																			
		既知作用点に対する薬剤開発				既知薬の修飾による薬剤開発	新規作用点に対する薬剤開発				作用点非特定の薬剤開発										
		剤開発	免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発		作用機作非特定	代謝物	プロドラッグ・活性	剤開発		免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定						
既知薬と同様の作用メカニズムの薬剤開発	Th2 サイトカイン阻害剤	10		2																	
	化学伝達物質遊離抑制剤		34																		
	ヒスタミン H1 拮抗剤		29																		
	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤		5																		
	ロイコトリエン拮抗剤		26																		
	複数の作用機序を持つ薬剤		41	2																	
	作用機序不明	2		2	10																
プロドラッグ・活性代謝物							3														
新規作用メカニズムの薬剤開発	樹状細胞（抗原提示細胞）の機能調節に関わる薬剤										1										
	T細胞の機能調節に関わる薬剤										10										
	B細胞の機能調節に関わる薬剤										3	2	2								
	その他細胞の機能調節に関わる薬剤										6	3	4								
	細胞接着過程の調節に関わる薬剤										28	30	3								
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤										46	11	14								
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤	PDE 4 に関わる薬剤										5	1	127							
		アデノシンに関わる薬剤											12	17							
		その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤										7	18	10							
	核内転写過程の調節に関わる薬剤											6	1	6							
	IgE 抗体に関わる薬剤											15									
	補体に関わる薬剤																				
	サイトカインに関わる薬剤	抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤										8	1								
		炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤										2	6								
		その他のサイトカインに関わる薬剤										30		6							
ケモカインに関わる薬剤	CC ケモカインに関わる薬剤										11	35	16								
	CXC ケモカインに関わる薬剤										5	4									
	その他のケモカインに関わる薬剤										3	1	21								
炎症における化学伝達物質に関わる薬剤	脂質メディエーターに関わる薬剤										1	76									
	起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤											53	2								
	その他の化学伝達物質に関わる薬剤											42									

表 1.4.4-3 複素環式の課題に対する解決手段の詳細(2/3)

課題		薬効向上のための新規薬剤開発												
		既知作用点に対する薬剤開発					既知薬の修飾による薬剤開発	新規作用点に対する薬剤開発				作用点非特定の薬剤開発		
		剤開発	免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機非特定		代謝物	プロドラッグ・活性	剤開発	免疫系に作用する薬剤開発		炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発
解決手段														
新規作用メカニズムの薬剤開発 (つづき)	神経ペプチドに関わる薬剤	タキキニンに関わる薬剤									86			
		その他の神経ペプチドに関わる薬剤										14		
	複数の作用機序に関わる薬剤										11	21	67	1
	その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤										3	11	5	24
作用点非特定の薬剤														83
新規適応範囲の特定														
製剤の改良	送達方法の開発													
	組成の改良													
	結晶型検討・合成法改良													
	その他の製剤の改良													
工程簡略化														

表 1.4.4-3 複素環式の課題に対する解決手段の詳細(3/3)

解決手段	課題	適用拡大	易使用性				製造コスト低減化		
			投与方法改善	投与回数・投与量の低減化	副作用低減化	保存安定性	原体コストの低減化	製剤コスト低減化	
開発の既知薬と同一作用メカニズムの薬剤	Th2 サイトカイン阻害剤								
	化学伝達物質遊離抑制剤								
	ヒスタミン H1 拮抗剤								
	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤								
	ロイコトリエン拮抗剤								
	複数の作用機序を持つ薬剤								
	作用機序不明								
プロドラッグ・活性代謝物									
新規作用メカニズムの薬剤開発	樹状細胞（抗原提示細胞）の機能調節に関わる薬剤								
	T細胞の機能調節に関わる薬剤								
	B細胞の機能調節に関わる薬剤								
	その他細胞の機能調節に関わる薬剤								
	細胞接着過程の調節に関わる薬剤								
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤								
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤	PDE 4 に関わる薬剤							
		アデノシンに関わる薬剤							
		その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤							
		核内転写過程の調節に関わる薬剤							
	IgE 抗体に関わる薬剤								
	補体に関わる薬剤								
	サイトカインに関わる薬剤	抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤							
		炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤							
		その他のサイトカインに関わる薬剤							
	ケモカインに関わる薬剤	CC ケモカインに関わる薬剤							
		CXC ケモカインに関わる薬剤							
	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤	脂質メディエーターに関わる薬剤							
		起炎症プロテアーゼに関わる薬剤							
		その他の化学伝達物質に関わる薬剤							
神経ペプチドに関わる薬剤	タキキニンに関わる薬剤								
	その他の神経ペプチドに関わる薬剤								
複数の作用機序に関わる薬剤									
その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤									
作用点非特定の薬剤									
新規適応範囲の特定									
製剤の改良	送達方法の開発	4	8		1				
	組成の改良		31	3	7	21			
	結晶型検討・合成法改良		2	2		13			
	その他の製剤の改良								
工程簡略化									
						18			

表 1.4.4-3 で色を付けた箇所について、表 1.4.4-4 に課題と解決手段の出願人を示す。解決手段として 127 件と最も多い「PDE 4 に関わる薬剤」について出願人を見ると、ファイザーの出願が 16 件で多い。また、「脂質メディエーターに関わる薬剤開発」の 76 件では、イーライリリーアンドカンパニーの出願が 12 件、「タキキニンに関わる薬剤開発」の 86 件では、グラクソ・スミスクラインの出願が 10 件で多い。

表 1.4.4-4 複素環式の課題に対する解決手段の出願人 (1/7)

解決手段		課題	薬効向上のための新規薬剤開発	
			新規作用点に対する薬剤	
			免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	
新規作用メカニズムの薬剤開発	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤	PDE 4 に関わる薬剤	アイコス(米国)(10)	特表平 9-508113 特表 2003-518090 特表 2003-518110 特表 2003-518116 特表 2003-519122 特表 2003-519123 特表 2003-519135 特表 2003-519138 特表 2003-519139 特開 2004-217674 特表平 11-503445 特表 2003-505376 特開 2003-12671
			アステラス製薬(3)	特表平 10-504550 特表 2001-504462 特表 2002-534508 特表 2003-512459 特表 2004-518727 特表 2004-526712 特表 2004-526785 特表 2004-526789
			サノフィ・アベンティス(フランス) アルタナファルマ(ドイツ)(7)	特表 2001-512121 特表平 10-507447 特表 2002-543138 特表 2002-524456 特表 2000-504303 特表 2004-512337 特表平 11-503136 特許 3068208 特表 2002-509927 W001/42244 W002/00859
			アルミラルプロデスファルマ(スペイン) アンスチ・ドルシエルシュジュベイナル(フランス) イーエルマネージメント(米国) インフラジム PHARM(カナダ) エフホフマンラロシュウント(スイス) エルピオン(ドイツ) ジョンソン・エンド・ジョンソン(米国)(3)	特表 2001-526264 特表 2001-526270 特表 2002-528549 特許 3564133 特表 2003-518060 特表平 9-511496 特表 2001-505586 特表 2000-510848 特表 2003-522770 W003/86396 特表 2005-507947 特表 2002-534506 特表 2002-534507 特許 2818820 特許 2802547 特開平 9-291032 特許 3106118 特表 2000-510481 特表 2001-522367 特表 2001-521925 特表 2002-543199 特表 2003-522165 特表 2003-522176 特開 2002-284766 特表 2004-520386 特表 2004-518689 特表 2004-518691 特開 2004-83583 特表 2005-502662
			グレラン製薬(2)	
			ザンボングループ(イタリア)(3)	
			シンテックスユーエスエイ(米国) セルジーン(米国) セルセラビューティックス(米国) セルテックセラビューティックス(イギリス) ダーウインディスカバリー(イギリス)(2)	
			ツムラ ノバルティス(スイス) ビクグルデンロンベルグヒエーミッシュェファブリーク(ドイツ)(2) ファイザー(米国)(16)	

表 1.4.4-4 複素環式の課題に対する解決手段の出願人 (2/7)

解決手段		課題		
		薬効向上のための新規薬剤開発(つづき)		
		新規作用点に対する薬剤(つづき)		
		免疫系・炎症系に作用する薬剤開発(つづき)		
新規作用メカニズムの薬剤開発(つづき)	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤(つづき)	PDE 4 に関わる薬剤(つづき)	ベーリンガーインゲルハイム(ドイツ) メモリーPHARM(米国) メモリファーマセチカル(米国)(2) メルクアンドコー(米国)(12) メルク(ドイツ)(6) メルシャン ユーロセルティク(ルクセンブルグ)(10) レ LAB セルビエ(フランス) 協和醗酵工業(10) 三菱ウェルファーマ 小野薬品工業(3) 大正製薬(2) 大塚製薬工場 田辺製薬(5)	特表 2002-532411 特表 2005-507365 特表 2004-528391 特表 2005-508961 特許 3468777 特表 2002-537383 特表 2002-543064 特表 2002-544193 特表 2002-544259 特表 2003-525273 特表 2003-528099 特表 2003-534328 特表 2004-521921 特表 2004-534773 特表 2005-501822 特表 2005-508313 特開平 9-124611 特表 2002-528536 特表 2003-504358 特表 2004-519450 特表 2005-515975 特表 2005-511595 特開 2002-161036 特許 3350550 特許 3219412 特表平 10-508032 特表 2001-523213 特表 2001-520629 特許 3520226 特開 2001-316314 特表 2001-525412 特許 3504234 特表 2003-506467 特開平 10-114724 特開平 10-147585 W098/22455 W098/22452 特開 2000-239277 W099/16768 特許 3589985 W001/64666 特開 2004-196785 特開 2005-60375 特開 2005-60376 特開平 7-300455 特開 2002-20386 特開 2003-300960 W003/66591 特開平 8-143571 特開平 8-253484 特許 3406689 特開 2003-119195 特開 2003-119196 特開 2004-256526 特開 2004-256527 特開 2004-256528

表 1.4.4-4 複素環式の課題に対する解決手段の出願人 (3/7)

解決手段		課題	薬効向上のための新規薬剤開発(つづき)	
			新規作用点に対する薬剤(つづき)	
			免疫系・炎症系に作用する薬剤開発(つづき)	
新規作用メカニズムの薬剤開発(つづき)	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤(つづき)	PDE 4 に関わる薬剤(つづき)	日研化学 日本臓器製薬(3)	特開 2003-81926 特許 3276762 特開 2002-308774 特開 2002-179570 特開 2000-327663 特開 2000-95759 特開 2001-233875 特開 2001-335579 W001/27105 特開平 11-189586
			富士写真フイルム 武田薬品工業(4)	
			麒麟麦酒	

表 1.4.4-4 複素環式の課題に対する解決手段の出願人 (4/7)

解決手段		課題	薬効向上のための新規薬剤開発(つづき)	
			新規作用点に対する薬剤開発(つづき)	
			炎症系に作用する薬剤開発	
新規作用メカニズムの薬剤開発(つづき)	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤	脂質メディエーターに関わる薬剤	アステラス製薬(2)	特表 2002-503247 特表 2002-525361 特表 2005-525327 特表 2001-518050 特表 2000-506874 特許 3621128 特許 3109974 特表 2002-515053 特表 2001-505915 特開平 11-322713 特表 2001-520991 特表 2001-520998 特表 2002-513761 特表 2002-522385 特表 2002-522386 特表 2002-544256 特表 2004-525154 特開平 9-12566 特表 2004-529899 特表 2004-526721 特開平 6-247972 特表 2005-508380 特開 2000-38380 特表平 8-510252 特表平 8-510253 特開平 10-251246
			アストラゼネカ(イギリス) アボット LAB(米国) アルツナイミッテルベルクドレスデン(ドイツ) イーライリリーアンドカンパニー(米国)(12)	
			エジトギオギスゼルベギエスゼチギアル(ハンガリー) エフホフマンラロシュウント(スイス)(2)	
			カリヒエミーファルマ(ドイツ) シェリング・プラウ(米国) ジャパンエナジー セブラコア(米国)(2)	
			東レ、ゾンゴークーシュエユエンチエンドウセンウイ エンチュウ(中国)(共願) テルモ ニトロメド(米国) ノバルティス(スイス) ファイザー(米国)(8)	特開平 8-12659 特表 2005-502587 特開平 8-113567 特許 2843920 特表平 9-505081 特許 2841120 特表平 10-506649 特許 3110049 特許 3400392 特許 3602436 特表 2005-522491 特開平 7-2841 特開平 7-2868 特表 2003-530426 特表 2004-534774
			ホタウリアツチイ(スペイン)(2)	
			メルクアンドコー(米国)(2)	

表 1.4.4-4 複素環式の課題に対する解決手段の出願人 (5/7)

解決手段		課題		
		薬効向上のための新規薬剤開発(つづき)		
新規作用メカニズムの薬剤開発(つづき)		新規作用点に対する薬剤開発(つづき)		
		炎症系に作用する薬剤開発(つづき)		
新規作用メカニズムの薬剤開発(つづき)	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤(つづき)	脂質メディエーターに関わる薬剤(つづき)	<p>メルクル(ドイツ)(2)</p> <p>大阪バイオサイエンス研究所、医薬分子設計研究所(共願)</p> <p>塩野義製薬(4)</p> <p>科学技術振興機構</p> <p>花王</p> <p>関西酵素</p> <p>大正製薬、佐藤史衛(共願)</p> <p>三共(2)</p> <p>三菱ウェルファーマ、日本たばこ産業(共願)</p> <p>小野薬品工業(10)</p> <p>相模中央化学研究所</p> <p>大正製薬、相模中央化学研究所(共願)</p> <p>日研化学</p> <p>日本曹達(4)</p> <p>日本臓器製薬</p> <p>武田薬品工業</p> <p>明治乳業(2)</p>	<p>特表 2000-515529</p> <p>特表 2003-505390</p> <p>特開 2004-51600</p> <p>特許 3215441</p> <p>W001/14378</p> <p>W001/26653</p> <p>W001/36420</p> <p>特開 2004-2248</p> <p>特許 3586481</p> <p>特開 2004-231587</p> <p>W003/70252</p> <p>特許 3268242</p> <p>特開 2001-89468</p> <p>特開平 6-312978</p> <p>特開平 7-316150</p> <p>特開平 7-112980</p> <p>W001/62708</p> <p>W001/66520</p> <p>W002/16311</p> <p>W002/20462</p> <p>W003/22813</p> <p>W003/22814</p> <p>W003/74483</p> <p>W003/78409</p> <p>特開平 7-233157</p> <p>特開平 7-233069</p> <p>特開 2002-20289</p> <p>特開 2002-80368</p> <p>W001/72723</p> <p>W003/00668</p> <p>W003/31414</p> <p>特開平 8-3164</p> <p>特開平 6-345767</p> <p>W095/29906</p> <p>特開平 9-208573</p>
	神経ペプチドに関わる薬剤	タキキニンに関わる薬剤	<p>アステラス製薬(6)</p> <p>アストラゼネカ(イギリス)</p> <p>サノフィ・アベンティス(フランス)(3)</p> <p>イーライリリーアンドカンパニー(米国)(5)</p> <p>エフホフマンラロシュウント(スイス)(2)</p>	<p>特許 3129123</p> <p>W095/28389</p> <p>特許 3071829</p> <p>特許 3454427</p> <p>特表 2004-501903</p> <p>特表 2004-517873</p> <p>特表 2002-526410</p> <p>特開平 9-124600</p> <p>特表平 11-503449</p> <p>特表 2004-529968</p> <p>特開平 7-215863</p> <p>特開平 7-330736</p> <p>特開平 8-59457</p> <p>特表平 10-502640</p> <p>特表 2001-512717</p> <p>特表 2004-525892</p> <p>特表 2005-500354</p>

表 1.4.4-4 複素環式の課題に対する解決手段の出願人 (6/7)

課題		薬効向上のための新規薬剤開発(つづき)		
		新規作用点に対する薬剤開発(つづき)		
解決手段		炎症系に作用する薬剤開発(つづき)		
新規作用メカニズムの薬剤開発(つづき)	神経ペプチドに関わる薬剤(つづき)	タキキニンに関わる薬剤(つづき)	グラクソ・スミスクライン(イギリス)(10)	特許 3499243 特許 3664492 特表平 10-511973 特開 2002-179594 特表 2004-517062 特表 2004-517082 特表 2004-526753 特表 2004-525183 特表 2004-525184 特表 2005-502655
			シェリング・プラウ(米国)(6)	特表平 11-504921 特開平 10-251228 特表 2001-507351 特表 2002-509151 特表 2003-505420 特表 2005-508367
			ソルベイ PHARM(オランダ)(2)	特表 2004-536851 特表 2005-525395
			ハールンドベック(デンマーク)	特表 2005-518378
			ファイザー(米国)(16)	特許 2992346 特許 3172461 特表平 10-501228 特許 3159389 特許 2918508 特許 3026945 特許 3283222 特許 3273750 特許 2978566 特許 3140063 特許 3163298 特許 3091844 特許 3280993 特許 3394239 特表 2002-511467 特表 2005-514389
			ベーリンガーインゲルハイム(ドイツ)(4)	特表平 10-505826 特表平 11-503441 特許 3465795 特表 2004-513096
			メルクアンドコー(米国)(2)	特表平 11-508553 特表 2001-501203
			メレルダウ PHARM(米国)	特許 3424174
			ユーセーバー(ベルギー)	特表 2003-518108
			レ LAB セルビエ(フランス)(2)	特開平 7-300495 特開平 9-227554
			杏林製薬	特開 2003-321461
			協和醗酵工業	特開平 9-40662
			三共(14)	特許 3088672 特開平 10-152478 特開平 10-182650 特開平 10-273489 特開平 11-43490 特許 3192631 特開 2000-34288 特開平 11-286443 特開 2000-344670 特開 2001-31570 特開 2000-103791 特開 2000-229968 特開 2001-187790 特開 2002-316987

表 1.4.4-4 複素環式の課題に対する解決手段の出願人 (7/7)

解決手段		課題		
		薬効向上のための新規薬剤開発(つづき)		
		新規作用点に対する薬剤開発(つづき)		
		炎症系に作用する薬剤開発(つづき)		
新規作用メカニズム(つづき)	神経ペプチドに関わる薬剤(つづき)	タキキニンに関わる薬剤(つづき)	寿製薬 田辺製薬(5)	特開平 9-104674 特開 2002-234874 特開 2002-220386 特開 2003-277263 特開 2004-2334 特開 2005-154380
			日産化学工業 日本臓器製薬	特開平 11-315071 特開 2003-313173

b-1 複素環の細分化

医薬品における現状を反映して、発明の対象となる医薬品の種別は、合成医薬品が多く、特に複素環式化合物が多い。本調査においては、多数出願されている複素環式化合物の細分類を目的に、FI を利用した細分化を補足的に実施した。医薬品の多くは縮合環であるが、その構造を大まかに、「六員環」「六員環および五員環」「五員環」「上記以外の複素環」と四つに分類した。

技術要素に関して、基本的には、特許文献を人が精査して分類しているが、b-1 に関しては、FI を利用して機械的に分類した結果であり、補完的に実施した調査である。他の項においては、件数の多い課題と解決手段の組み合わせに対して網掛けをし、その箇所に関して、課題と解決手段の出願人を解析しているが、本項では実施していない。網掛けすべき中心的な課題と解決手段の組み合わせは、複素環式の課題に対する解決手段(表 1.4.4-4)に現れていると考える。

六員環

図 1.4.4-3 に六員環に関する課題と解決手段の分布を、表 1.4.4-5 に課題と解決手段の詳細を示す。

複素環の内、六員環に関する課題と解決手段の分布で件数が多いのは、「新規作用点に対する薬剤開発」の内、「免疫系・炎症系に作用する薬剤開発」の課題に対し、解決手段として「第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤」が 95 件、その中で PDE 4 に関わる薬剤が多く、出願件数は 75 件である。

表 1.4.4-5 六員環の課題に対する解決手段の詳細(1/3)

課題		薬効向上のための新規薬剤開発									
		既知作用点に対する薬剤開発				既知薬の修飾による薬剤開発	新規作用点に対する薬剤開発				作用点非特定の薬剤開発
		免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定		免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定	
解決手段		免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定	プロドラッグ・活性代謝物	免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定	
メカニズムと同様の薬剤の開発	Th2 サイトカイン阻害剤	3		1							
	化学伝達物質遊離抑制剤		20								
	ヒスタミン H1 拮抗剤		20								
	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤		3								
	ロイコトリエン拮抗剤		11								
	複数の作用機序を持つ薬剤		23	2							
	作用機序不明			2	5						
プロドラッグ・活性代謝物						1					
新規作用メカニズムの薬剤開発	樹状細胞（抗原提示細胞）の機能調節に関わる薬剤										
	T細胞の機能調節に関わる薬剤						6				
	B細胞の機能調節に関わる薬剤						1	1			
	その他細胞の機能調節に関わる薬剤						2	1	2		
	細胞接着過程の調節に関わる薬剤						10	9			
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤						23	4	10		
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤	PDE 4 に関わる薬剤						3		76	
		アデノシンに関わる薬剤							8	11	
		その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤						2	14	8	
	核内転写過程の調節に関わる薬剤							1	1	2	
	IgE 抗体に関わる薬剤							7			
	補体に関わる薬剤										
	サイトカインに関わる薬剤	抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤						3	1		
		炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤						2	4		
		その他のサイトカインに関わる薬剤						16		4	
ケモカインに関わる薬剤	CC ケモカインに関わる薬剤						7	19	13		
	CXC ケモカインに関わる薬剤						4	1			
	その他のケモカインに関わる薬剤						1		11		
炎症における化学伝達物質に関わる薬剤	脂質メディエーターに関わる薬剤							16			
	起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤							20	1		
	その他の化学伝達物質に関わる薬剤							18			

表 1.4.4-5 六員環の課題に対する解決手段の詳細(2/3)

課題		薬効向上のための新規薬剤開発												
		既知作用点に対する薬剤開発					既知薬の修飾による薬剤開発	新規作用点に対する薬剤開発				作用点非特定の薬剤開発		
		剤開発	免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定		代謝物	プロドラッグ・活性	剤開発	免疫系に作用する薬剤開発		炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発
解決手段														
新規作用メカニズムの薬剤開発 (つづき)	神経ペプチドに関わる薬剤	タキキニンに関わる薬剤									58			
		その他の神経ペプチドに関わる薬剤									6			
	複数の作用機序に関わる薬剤									6	11	45	1	
	その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤									1	3	3	13	
作用点非特定の薬剤														36
新規適応範囲の特定														
製剤の改良	送達方法の開発													
	組成の改良													
	結晶型検討・合成法改良													
	その他の製剤の改良													
工程簡略化														

表 1.4.4-5 六員環の課題に対する解決手段の詳細(3/3)

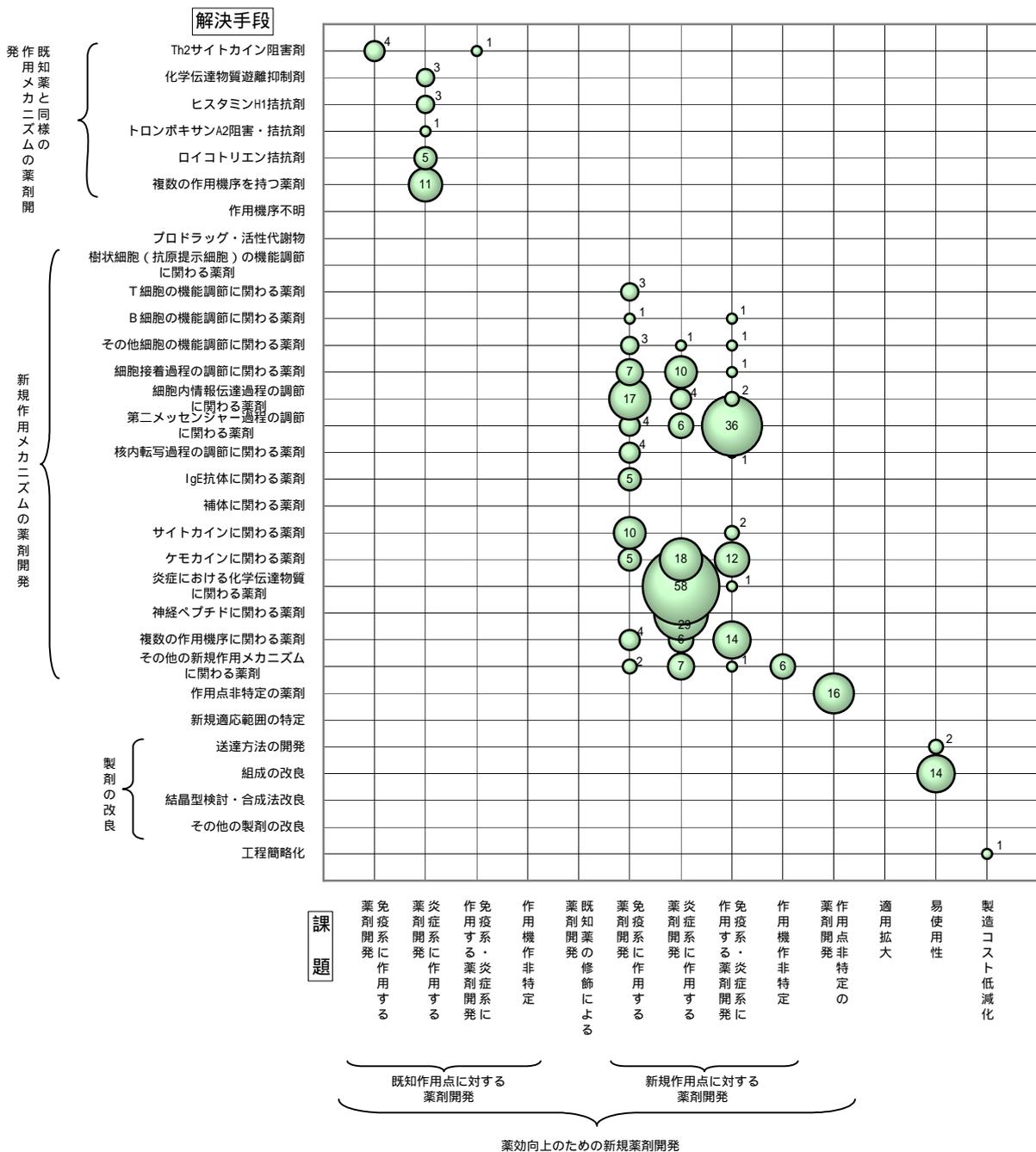
解決手段	課題	適用拡大	易使用性				製造コスト低減化		
			投与方法改善	投与回数・投与量の低減化	副作用低減化	保存安定性	原体コストの低減化	製剤コスト低減化	
開発の既知薬と同様の作用メカニズムの薬剤	Th2 サイトカイン阻害剤								
	化学伝達物質遊離抑制剤								
	ヒスタミン H1 拮抗剤								
	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤								
	ロイコトリエン拮抗剤								
	複数の作用機序を持つ薬剤								
	作用機序不明								
プロドラッグ・活性代謝物									
新規作用メカニズムの薬剤開発	樹状細胞（抗原提示細胞）の機能調節に関わる薬剤								
	T細胞の機能調節に関わる薬剤								
	B細胞の機能調節に関わる薬剤								
	その他細胞の機能調節に関わる薬剤								
	細胞接着過程の調節に関わる薬剤								
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤								
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤	PDE 4 に関わる薬剤							
		アデノシンに関わる薬剤							
		その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤							
		核内転写過程の調節に関わる薬剤							
	IgE 抗体に関わる薬剤								
	補体に関わる薬剤								
	サイトカインに関わる薬剤	抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤							
		炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤							
		その他のサイトカインに関わる薬剤							
	ケモカインに関わる薬剤	CC ケモカインに関わる薬剤							
		CXC ケモカインに関わる薬剤							
		その他のケモカインに関わる薬剤							
	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤	脂質メディエーターに関わる薬剤							
		起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤							
その他の化学伝達物質に関わる薬剤									
神経ペプチドに関わる薬剤	タキキニンに関わる薬剤								
	その他の神経ペプチドに関わる薬剤								
複数の作用機序に関わる薬剤									
その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤									
作用点非特定の薬剤									
新規適応範囲の特定									
製剤の改良	送達方法の開発	2	3		1				
	組成の改良		10	1	5	12			
	結晶型検討・合成法改良		1	1		6			
	その他の製剤の改良								
工程簡略化									
						9			

六員環および五員環

図 1.4.4-4 に六員環および五員環に関する課題と解決手段の分布を、表 1.4.4-6 に課題と解決手段の詳細を示す。

複素環の内、六員環および五員環に関する課題と解決手段の分布で件数が多いのは、「新規作用点に対する薬剤開発」の内、「炎症系に作用する薬剤開発」の課題に対し、解決手段として「炎症における化学伝達物質に関わる薬剤」が 58 件、その中で脂質メディエーターに関わる薬剤開発が多く、出願件数は 25 件である。

図 1.4.4-4 六員環および五員環に関する課題と解決手段の分布



(1993年1月～2003年12月の出願)

表 1.4.4-6 六員環および五員環の課題に対する解決手段の詳細(1/3)

課題		薬効向上のための新規薬剤開発										
		既知作用点に対する薬剤開発				作用機作非特定	プロドラッグ・活性代謝物	新規作用点に対する薬剤開発				作用点非特定の薬剤開発
		免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定			免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定	
解決手段												
メカニズムと同様の薬剤の開発	Th2 サイトカイン阻害剤	4		1								
	化学伝達物質遊離抑制剤		3									
	ヒスタミン H1 拮抗剤		3									
	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤		1									
	ロイコトリエン拮抗剤		5									
	複数の作用機序を持つ薬剤		11									
	作用機序不明											
プロドラッグ・活性代謝物												
新規作用メカニズムの薬剤開発	樹状細胞（抗原提示細胞）の機能調節に関わる薬剤											
	T細胞の機能調節に関わる薬剤						3					
	B細胞の機能調節に関わる薬剤						1		1			
	その他細胞の機能調節に関わる薬剤						3	1	1			
	細胞接着過程の調節に関わる薬剤						7	10	1			
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤						17	4	2			
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤	PDE 4 に関わる薬剤						2		31		
		アデノシンに関わる薬剤							2	3		
		その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤						2	4	2		
	核内転写過程の調節に関わる薬剤							4		1		
	IgE 抗体に関わる薬剤							5				
	補体に関わる薬剤											
	サイトカインに関わる薬剤	抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤						3				
		炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤										
		その他のサイトカインに関わる薬剤						7		2		
ケモカインに関わる薬剤	CC ケモカインに関わる薬剤						3	15	2			
	CXC ケモカインに関わる薬剤							3				
	その他のケモカインに関わる薬剤						2		10			
炎症における化学伝達物質に関わる薬剤	脂質メディエーターに関わる薬剤							25				
	起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤							15	1			
	その他の化学伝達物質に関わる薬剤							18				

表 1.4.4-6 六員環および五員環の課題に対する解決手段の詳細(2/3)

課題		薬効向上のための新規薬剤開発																			
		既知作用点に対する薬剤開発					既知薬の修飾による薬剤開発	新規作用点に対する薬剤開発				作用点非特定の薬剤開発									
		剤開発	免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機非特定		代謝物	プロドラッグ・活性	剤開発	免疫系に作用する薬剤開発		炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機非特定						
解決手段																					
新規作用メカニズムの薬剤開発 (つづき)	神経ペプチドに関わる薬剤	タキキニンに関わる薬剤										22									
		その他の神経ペプチドに関わる薬剤											7								
	複数の作用機序に関わる薬剤												4	6	14						
	その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤												2	7	1	6					
作用点非特定の薬剤																				16	
新規適応範囲の特定																					
製剤の改良	送達方法の開発																				
	組成の改良																				
	結晶型検討・合成法改良																				
	その他の製剤の改良																				
工程簡略化																					

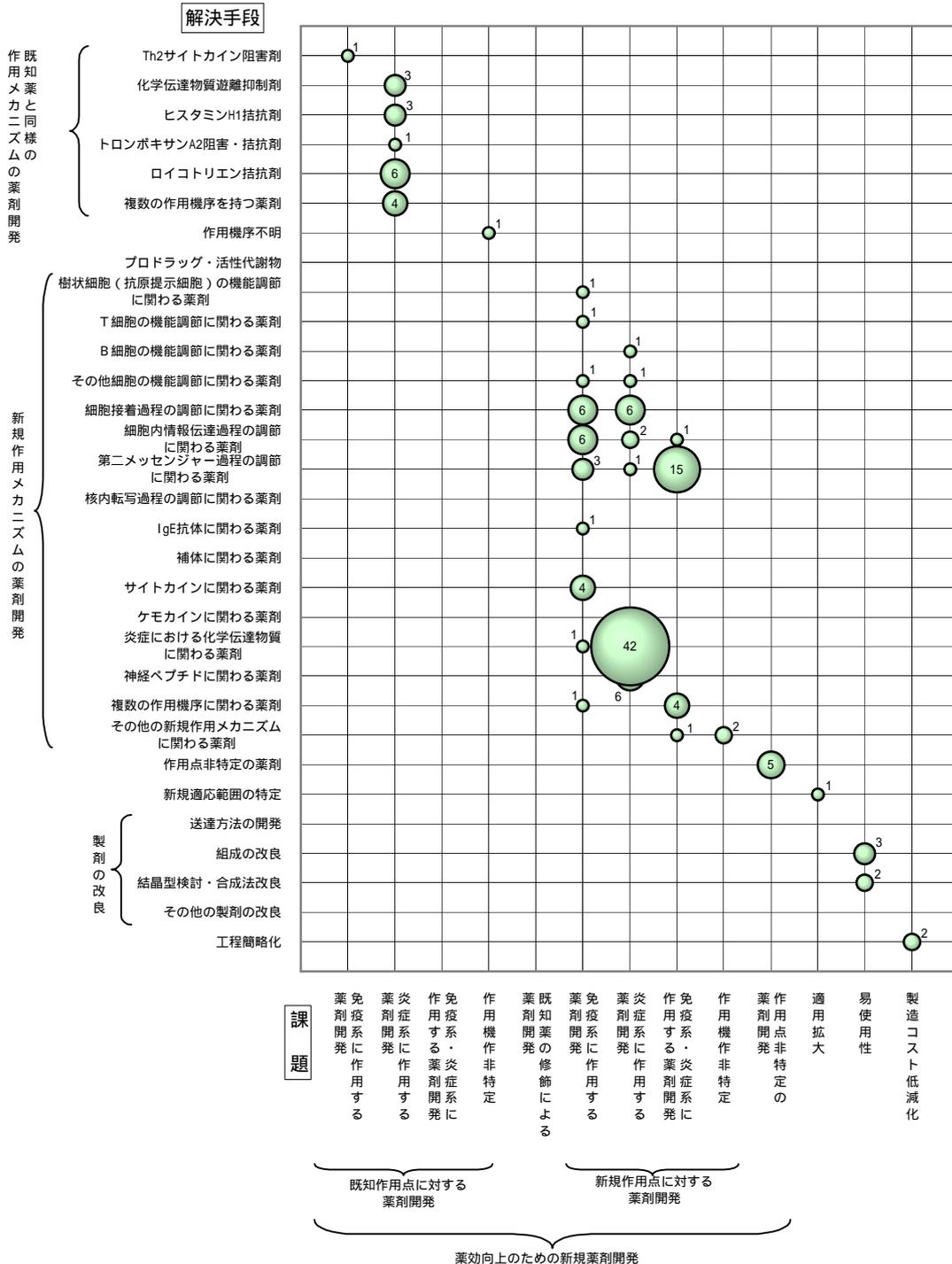
表 1.4.4-6 六員環および五員環の課題に対する解決手段の詳細(3/3)

解決手段	課題	適用拡大	易使用性				製造コスト低減化		
			投与方法改善	投与回数・投与量の低減化	副作用低減化	保存安定性	原体コストの低減化	製剤コスト低減化	
開発中の作用メカニズムの薬剤	Th2 サイトカイン阻害剤								
	化学伝達物質遊離抑制剤								
	ヒスタミン H1 拮抗剤								
	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤								
	ロイコトリエン拮抗剤								
	複数の作用機序を持つ薬剤								
	作用機序不明								
プロドラッグ・活性代謝物									
新規作用メカニズムの薬剤開発	樹状細胞（抗原提示細胞）の機能調節に関わる薬剤								
	T細胞の機能調節に関わる薬剤								
	B細胞の機能調節に関わる薬剤								
	その他細胞の機能調節に関わる薬剤								
	細胞接着過程の調節に関わる薬剤								
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤								
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤	PDE 4 に関わる薬剤							
		アデノシンに関わる薬剤							
		その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤							
		核内転写過程の調節に関わる薬剤							
	IgE 抗体に関わる薬剤								
	補体に関わる薬剤								
	サイトカインに関わる薬剤	抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤							
		炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤							
		その他のサイトカインに関わる薬剤							
	ケモカインに関わる薬剤	CC ケモカインに関わる薬剤							
		CXC ケモカインに関わる薬剤 その他のケモカインに関わる薬剤							
	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤	脂質メディエーターに関わる薬剤							
		起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤 その他の化学伝達物質に関わる薬剤							
	神経ペプチドに関わる薬剤	タキキニンに関わる薬剤							
その他の神経ペプチドに関わる薬剤									
複数の作用機序に関わる薬剤									
その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤									
作用点非特定の薬剤									
新規適応範囲の特定									
製剤の改良	送達方法の開発		2						
	組成の改良		8	2	1	3			
	結晶型検討・合成法改良								
	その他の製剤の改良								
工程簡略化									
							1		

五員環

図 1.4.4-5 に五員環に関する課題と解決手段の分布を、表 1.4.4-7 に課題と解決手段の詳細を示す。複素環の内、五員環に関する課題と解決手段の分布で件数が多いのは、「新規作用点に対する薬剤開発」の内、「炎症系に作用する薬剤開発」の課題に対し、解決手段として「炎症における化学伝達物質に関わる薬剤」が 42 件、その中で脂質メディエーターに関わる薬剤が多く、出願件数は 26 件である。

図 1.4.4-5 五員環に関する課題と解決手段の分布



(1993年1月～2003年12月の出願)

表 1.4.4-7 五員環の課題に対する解決手段の詳細(1/3)

解決手段		薬効向上のための新規薬剤開発																			
		既知作用点に対する薬剤開発					既知薬の修飾による薬剤開発	新規作用点に対する薬剤開発				作用点非特定の薬剤開発									
		剤開発	免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定		代謝物	プロドラッグ・活性	剤開発	免疫系に作用する薬剤開発		炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定						
既知薬と同様の作用メカニズムの薬剤開発	Th2 サイトカイン阻害剤	1																			
	化学伝達物質遊離抑制剤		3																		
	ヒスタミン H1 拮抗剤		3																		
	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤		1																		
	ロイコトリエン拮抗剤		6																		
	複数の作用機序を持つ薬剤		4																		
	作用機序不明					1															
プロドラッグ・活性代謝物																					
新規作用メカニズムの薬剤開発	樹状細胞（抗原提示細胞）の機能調節に関わる薬剤										1										
	T細胞の機能調節に関わる薬剤										1										
	B細胞の機能調節に関わる薬剤											1									
	その他細胞の機能調節に関わる薬剤										1	1									
	細胞接着過程の調節に関わる薬剤										6	6									
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤										6	2	1								
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤	PDE 4 に関わる薬剤											1	14							
		アデノシンに関わる薬剤												1							
		その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤										3									
	核内転写過程の調節に関わる薬剤																				
	IgE 抗体に関わる薬剤											1									
	補体に関わる薬剤																				
	サイトカインに関わる薬剤	抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤																			
		炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤																			
		その他のサイトカインに関わる薬剤										4									
	ケモカインに関わる薬剤	CC ケモカインに関わる薬剤																			
		CXC ケモカインに関わる薬剤																			
その他のケモカインに関わる薬剤																					
炎症における化学伝達物質に関わる薬剤	脂質メディエーターに関わる薬剤										1	26									
	起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤											12									
	その他の化学伝達物質に関わる薬剤											4									

表 1.4.4-7 五員環の課題に対する解決手段の詳細(2/3)

解決手段		課題		薬効向上のための新規薬剤開発										
				既知作用点に対する薬剤開発				既知薬の修飾による薬剤開発	新規作用点に対する薬剤開発				作用点非特定の薬剤開発	
				剤開発	免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発		作用機非特定	代謝物	プロドラッグ・活性	剤開発		免疫系に作用する薬剤開発
新規作用メカニズムの薬剤開発 (つづき)	神経ペプチドに関わる薬剤	タキキニンに関わる薬剤								5				
		その他の神経ペプチドに関わる薬剤								1				
	複数の作用機序に関わる薬剤									1		4		
	その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤											1	2	
作用点非特定の薬剤														5
新規適応範囲の特定														
製剤の改良	送達方法の開発													
	組成の改良													
	結晶型検討・合合法改良													
	その他の製剤の改良													
工程簡略化														

表 1.4.4-7 五員環の課題に対する解決手段の詳細(3/3)

解決手段	課題	適用拡大	易使用性				製造コスト低減化		
			投与方法改善	投与回数・投与量の低減化	副作用低減化	保存安定性	原体コストの低減化	製剤コスト低減化	
発症メカニズムの薬剤開発	Th2 サイトカイン阻害剤								
	化学伝達物質遊離抑制剤								
	ヒスタミン H1 拮抗剤								
	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤								
	ロイコトリエン拮抗剤								
	複数の作用機序を持つ薬剤								
	作用機序不明								
プロドラッグ・活性代謝物									
新規作用メカニズムの薬剤開発	樹状細胞（抗原提示細胞）の機能調節に関わる薬剤								
	T細胞の機能調節に関わる薬剤								
	B細胞の機能調節に関わる薬剤								
	その他細胞の機能調節に関わる薬剤								
	細胞接着過程の調節に関わる薬剤								
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤								
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤	PDE 4 に関わる薬剤							
		アデノシンに関わる薬剤							
		その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤							
		核内転写過程の調節に関わる薬剤							
	IgE 抗体に関わる薬剤								
	補体に関わる薬剤								
	サイトカインに関わる薬剤	抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤							
		炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤							
		その他のサイトカインに関わる薬剤							
	ケモカインに関わる薬剤	CC ケモカインに関わる薬剤							
		CXC ケモカインに関わる薬剤 その他のケモカインに関わる薬剤							
	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤	脂質メディエーターに関わる薬剤							
		起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤							
		その他の化学伝達物質に関わる薬剤							
神経ペプチドに関わる薬剤	タキキニンに関わる薬剤								
	その他の神経ペプチドに関わる薬剤								
複数の作用機序に関わる薬剤									
その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤									
作用点非特定の薬剤									
新規適応範囲の特定		1							
製剤の改良	送達方法の開発								
	組成の改良		2			1			
	結晶型検討・合成法改良		1			1			
	その他の製剤の改良						2		
工程簡略化									

上記以外の複素環

図 1.4.4-6 に上記以外の複素環に関する課題と解決手段の分布を、表 1.4.4-8 に課題と解決手段の詳細を示す。複素環の内、上記以外の複素環に関する課題と解決手段の分布で件数が多いのは、「作用点非特定の薬剤開発」の課題に対し、解決手段として「作用点非特定の薬剤」で解決しているものが 26 件である。

図 1.4.4-6 上記以外の複素環に関する課題と解決手段の分布

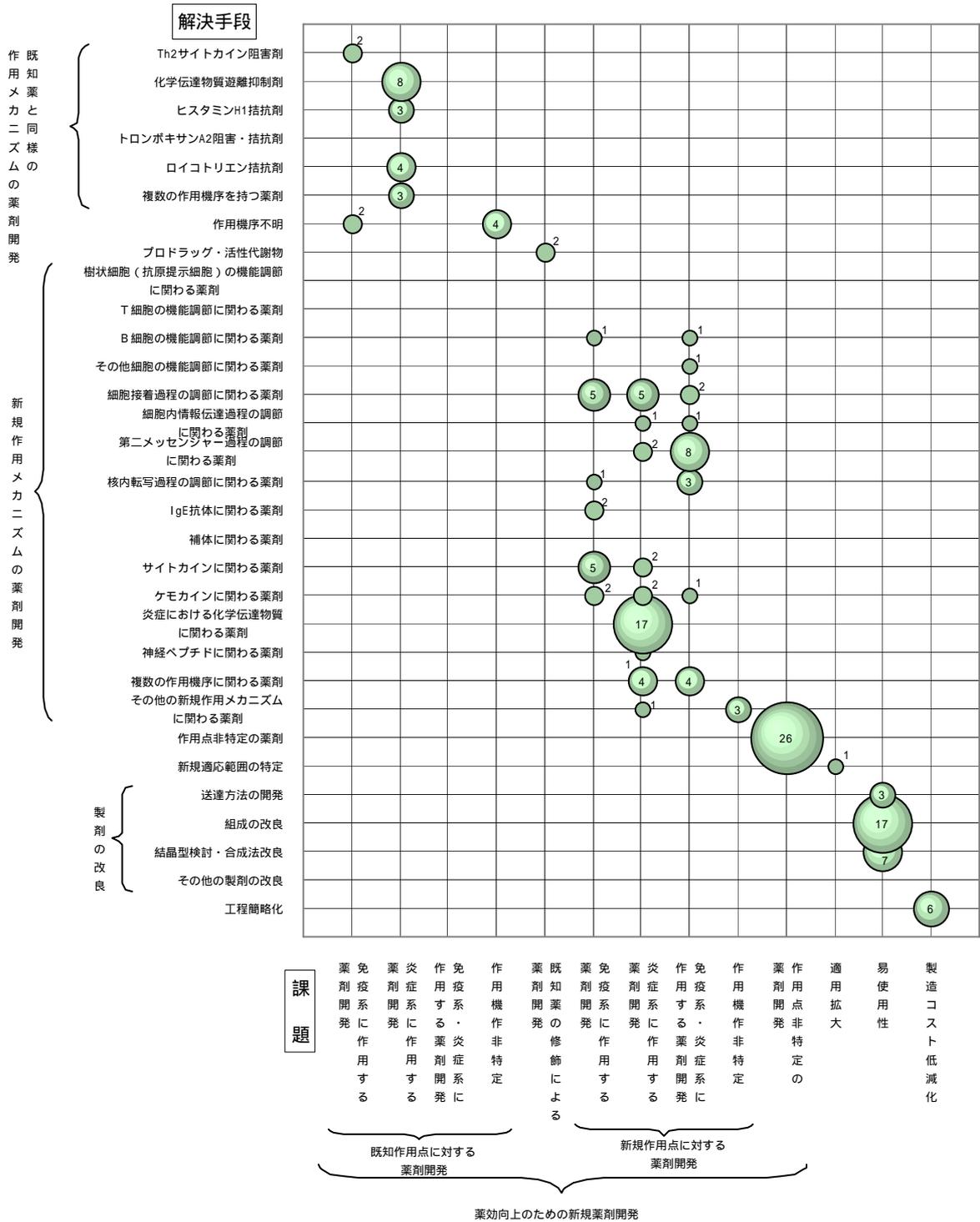


表 1.4.4-8 上記以外の複素環の課題に対する解決手段の詳細(1/3)

解決手段		薬効向上のための新規薬剤開発													
		既知作用点に対する薬剤開発					既知薬の修飾による薬剤開発	新規作用点に対する薬剤開発				作用点非特定の薬剤開発			
		剤開発	免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定		代謝物	プロドラッグ・活性	剤開発	免疫系に作用する薬剤開発		炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定
既知薬と同様の作用メカニズムの薬剤開発	Th2 サイトカイン阻害剤	2													
	化学伝達物質遊離抑制剤		8												
	ヒスタミン H1 拮抗剤		3												
	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤														
	ロイコトリエン拮抗剤		4												
	複数の作用機序を持つ薬剤		3												
	作用機序不明	2				4									
プロドラッグ・活性代謝物							2								
新規作用メカニズムの薬剤開発	樹状細胞（抗原提示細胞）の機能調節に関わる薬剤														
	T細胞の機能調節に関わる薬剤														
	B細胞の機能調節に関わる薬剤								1			1			
	その他細胞の機能調節に関わる薬剤											1			
	細胞接着過程の調節に関わる薬剤								5	5		2			
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤										1	1			
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤	PDE 4 に関わる薬剤											6		
		アデノシンに関わる薬剤									2	2			
		その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤													
	核内転写過程の調節に関わる薬剤										1		3		
	IgE 抗体に関わる薬剤										2				
	補体に関わる薬剤														
	サイトカインに関わる薬剤	抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤								2					
		炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤										2			
		その他のサイトカインに関わる薬剤										3			
	ケモカインに関わる薬剤	CC ケモカインに関わる薬剤									1	1	1		
		CXC ケモカインに関わる薬剤									1				
その他のケモカインに関わる薬剤											1				
炎症における化学伝達物質に関わる薬剤	脂質メディエーターに関わる薬剤											9			
	起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤											6			
	その他の化学伝達物質に関わる薬剤												2		

表 1.4.4-8 上記以外の複素環の課題に対する解決手段の詳細(2/3)

解決手段			薬効向上のための新規薬剤開発								作用点非特定の薬剤開発		
			既知作用点に対する薬剤開発				既知薬の修飾による薬剤開発	新規作用点に対する薬剤開発					
			剤開発	免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発		作用機非特定	代謝物	プロドラッグ・活性		免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発
ムの新規作用メカニズム	神経ペプチドに関わる薬剤	タキキニンに関わる薬剤								1			
		その他の神経ペプチドに関わる薬剤											
	複数の作用機序に関わる薬剤									4	4		
	その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤									1		3	
作用点非特定の薬剤													26
新規適応範囲の特定													
製剤の改良	送達方法の開発												
	組成の改良												
	結晶型検討・合合法改良												
	その他の製剤の改良												
工程簡略化													

表 1.4.4-8 上記以外の複素環の課題に対する解決手段の詳細(3/3)

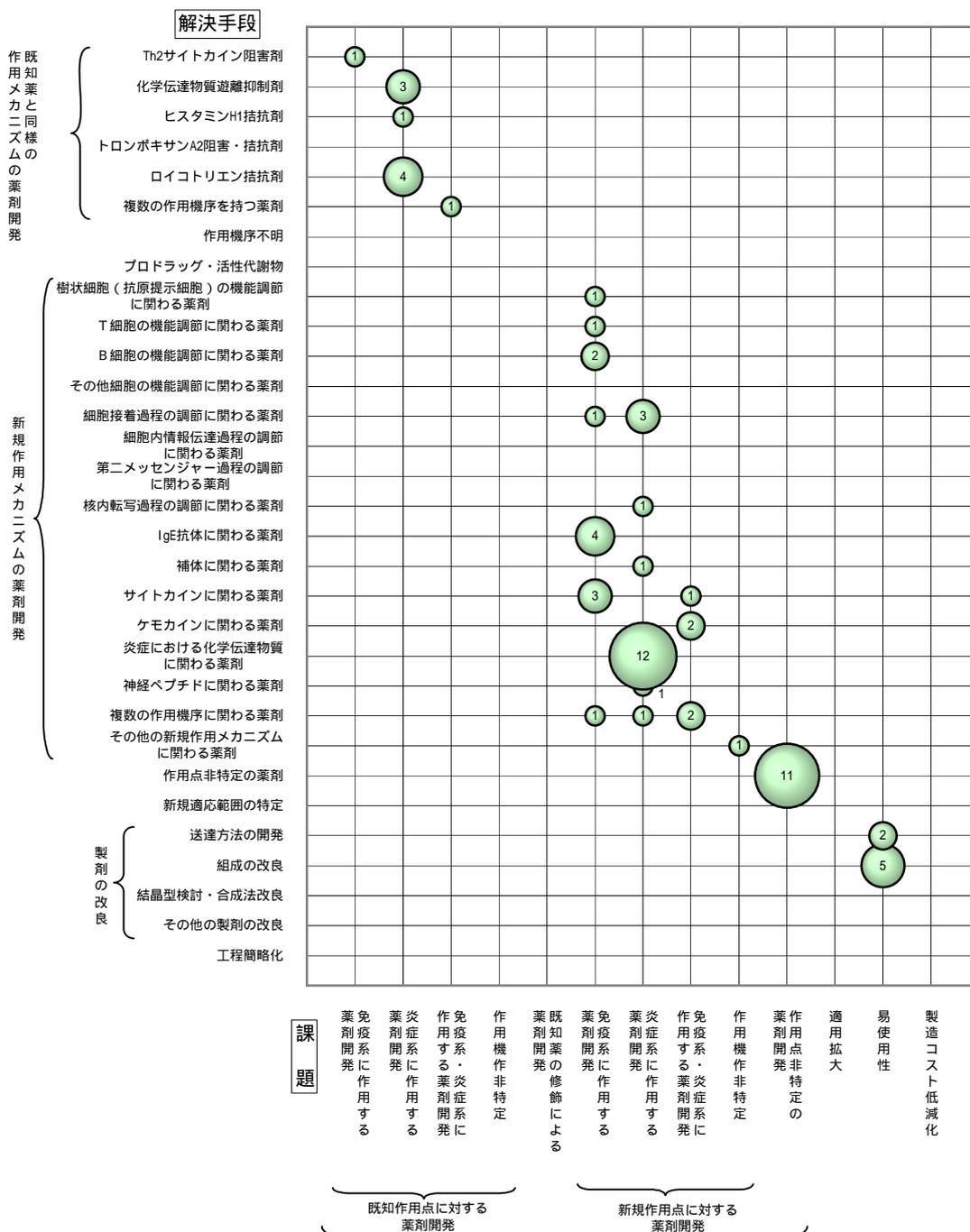
解決手段	課題	適用拡大	易使用性				製造コスト低減化		
			投与方法改善	投与回数・投与量の低減化	副作用低減化	保存安定性	低減化 原体コストの	減化 製剤コスト低	
発症メカニズムの作用薬と剤力開二様	Th2 サイトカイン阻害剤								
	化学伝達物質遊離抑制剤								
	ヒスタミン H1 拮抗剤								
	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤								
	ロイコトリエン拮抗剤								
	複数の作用機序を持つ薬剤								
	作用機序不明								
プロドラッグ・活性代謝物									
新規作用メカニズムの薬剤開発	樹状細胞（抗原提示細胞）の機能調節に関わる薬剤								
	T細胞の機能調節に関わる薬剤								
	B細胞の機能調節に関わる薬剤								
	その他細胞の機能調節に関わる薬剤								
	細胞接着過程の調節に関わる薬剤								
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤								
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤	PDE 4 に関わる薬剤							
		アデノシンに関わる薬剤							
		その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤							
	核内転写過程の調節に関わる薬剤								
	IgE 抗体に関わる薬剤								
	補体に関わる薬剤								
	サイトカインに関わる薬剤	抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤							
		炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤							
		その他のサイトカインに関わる薬剤							
	ケモカインに関わる薬剤	CC ケモカインに関わる薬剤							
		CXC ケモカインに関わる薬剤							
		その他のケモカインに関わる薬剤							
	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤	脂質メディエーターに関わる薬剤							
		起炎性プロテアーゼに関わる薬剤							
その他の化学伝達物質に関わる薬剤									
神経ペプチドに関わる薬剤	タキキニンに関わる薬剤								
	その他の神経ペプチドに関わる薬剤								
複数の作用機序に関わる薬剤									
その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤									
作用点非特定の薬剤									
新規適応範囲の特定									
		1							
製剤の改良	送達方法の開発		3						
	組成の改良		11	1	5				
	結晶型検討・合成法改良			1	6				
	その他の製剤の改良								
工程簡略化									
						6			

c. 非環式

図 1.4.4-7 に複素環式に関する課題と解決手段の分布を、表 1.4.4-9 に課題と解決手段の詳細を示し、薬剤の開発において重要である薬剤の作用点が明確になっている課題と解決手段について、件数の多い上位 2 項目に対して網掛けをしている。

合成医薬品の内、非環式に関する課題と解決手段の分布で件数が多いのは、「新規作用点に対する薬剤開発」の内、「炎症系に作用する薬剤開発」の課題に対し、解決手段として「炎症における化学伝達物質に関わる薬剤」が 12 件、具体的には脂質メディエーターに関わる薬剤開発が 5 件、起炎性プロテアーゼに関わる薬剤が 7 件である。

図 1.4.4-7 非環式に関する課題と解決手段の分布



薬効向上のための新規薬剤開発

(1993年1月～2003年12月の出願)

表 1.4.4-9 非環式の課題に対する解決手段の詳細(1/3)

解決手段		薬効向上のための新規薬剤開発													
		既知作用点に対する薬剤開発					既知薬の修飾による薬剤開発	新規作用点に対する薬剤開発				作用点非特定の薬剤開発			
		剤開発	免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定		剤開発	免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発		作用機作非特定		
既知薬と同様の作用メカニズムの薬剤開発	Th2 サイトカイン阻害剤	1													
	化学伝達物質遊離抑制剤		3												
	ヒスタミン H1 拮抗剤		1												
	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤														
	ロイコトリエン拮抗剤		4												
	複数の作用機序を持つ薬剤			1											
	作用機序不明														
プロドラッグ・活性代謝物															
新規作用メカニズムの薬剤開発	樹状細胞（抗原提示細胞）の機能調節に関わる薬剤									1					
	T細胞の機能調節に関わる薬剤									1					
	B細胞の機能調節に関わる薬剤									2					
	その他細胞の機能調節に関わる薬剤														
	細胞接着過程の調節に関わる薬剤									1	3				
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤														
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤	PDE 4 に関わる薬剤													
		アデノシンに関わる薬剤													
		その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤													
	核内転写過程の調節に関わる薬剤										1				
	IgE 抗体に関わる薬剤									4					
	補体に関わる薬剤										1				
	サイトカインに関わる薬剤	抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤													
		炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤													
		その他のサイトカインに関わる薬剤									3		1		
	ケモカインに関わる薬剤	CC ケモカインに関わる薬剤											1		
		CXC ケモカインに関わる薬剤													
その他のケモカインに関わる薬剤													1		
炎症における化学伝達物質に関わる薬剤	脂質メディエーターに関わる薬剤										5				
	起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤										7				
	その他の化学伝達物質に関わる薬剤														

表 1.4.4-9 非環式の課題に対する解決手段の詳細(2/3)

解決手段		課題		薬効向上のための新規薬剤開発													
				既知作用点に対する薬剤開発				既知薬の修飾による薬剤開発	新規作用点に対する薬剤開発				作用点非特定の薬剤開発				
				剤開発	免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発		作用機作非特定	代謝物	プロドラッグ・活性	剤開発		免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定
（ム新規作用メカニクス） （つづき）	神経ペプチドに関わる薬剤	タキキニンに関わる薬剤										1					
		その他の神経ペプチドに関わる薬剤															
	複数の作用機序に関わる薬剤											1	1	2			
	その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤															1	
作用点非特定の薬剤																	11
新規適応範囲の特定																	
製剤の改良	送達方法の開発																
	組成の改良																
	結晶型検討・合成法改良																
	その他の製剤の改良																
工程簡略化																	

表 1.4.4-9 非環式の課題に対する解決手段の詳細(3/3)

解決手段	課題	適用拡大	易使用性				製造コスト低減化		
			投与方法改善	投与回数・投与量の低減化	副作用低減化	保存安定性	原体コストの低減化	製剤コスト低減化	
発症メカニズムの薬剤開発	Th2 サイトカイン阻害剤								
	化学伝達物質遊離抑制剤								
	ヒスタミン H1 拮抗剤								
	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤								
	ロイコトリエン拮抗剤								
	複数の作用機序を持つ薬剤								
	作用機序不明								
プロドラッグ・活性代謝物									
新規作用メカニズムの薬剤開発	樹状細胞（抗原提示細胞）の機能調節に関わる薬剤								
	T細胞の機能調節に関わる薬剤								
	B細胞の機能調節に関わる薬剤								
	その他細胞の機能調節に関わる薬剤								
	細胞接着過程の調節に関わる薬剤								
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤								
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤	PDE 4 に関わる薬剤							
		アデノシンに関わる薬剤							
		その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤							
		核内転写過程の調節に関わる薬剤							
	IgE 抗体に関わる薬剤								
	補体に関わる薬剤								
	サイトカインに関わる薬剤	抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤							
		炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤							
		その他のサイトカインに関わる薬剤							
	ケモカインに関わる薬剤	CC ケモカインに関わる薬剤							
		CXC ケモカインに関わる薬剤							
		その他のケモカインに関わる薬剤							
	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤	脂質メディエーターに関わる薬剤							
		起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤							
その他の化学伝達物質に関わる薬剤									
神経ペプチドに関わる薬剤	タキキニンに関わる薬剤								
	その他の神経ペプチドに関わる薬剤								
複数の作用機序に関わる薬剤									
その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤									
作用点非特定の薬剤									
新規適応範囲の特定									
製剤の改良	送達方法の開発			2					
	組成の改良		4			1			
	結晶型検討・合成法改良								
	その他の製剤の改良								
工程簡略化									

表 1.4.4-9 で色を付けた箇所について、表 1.4.4-10 に課題と解決手段の出願人を示す。「脂質メディエーターに関わる薬剤」の 5 件の出願は、全て異なる出願人によるものである。「起炎性プロテアーゼに関わる薬剤」の 7 件では、第一製薬の出願が 2 件、他は各 1 件である。

表 1.4.4-10 非環式の課題に対する解決手段の出願人

解決手段		課題	薬効向上のための新規薬剤開発	
			新規作用点に対する薬剤開発	
			炎症系に作用する薬剤開発	
新規作用メカニズムの薬剤開発	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤	脂質メディエーターに関わる薬剤	アステラス製薬	特表平 9-508363
			アストラゼネカ(イギリス)	特表平 8-511254
			ファイザー(米国)	特表 2003-506324
			ブライハムアンドウイミンスホスピタル(米国)	特表 2005-511592
			相模中央化学研究所	特開平 9-268153
		起炎性プロテアーゼに関わる薬剤	アクシス PHARM(米国)	特表平 8-507768
			ビクグルデンロンベルグヒエーミッシュェファブリーク(ドイツ)、マックスプランク G ツアフェルデルンクデルウイツセ(ドイツ)(共願)	特表 2002-502845
			モルキューラースキンケア(イギリス)	
			三菱ウェルファーマ	特表 2005-508361
			持田製薬	W001/23349
			第一製薬(2)	W003/11812
				W000/03703
			W000/03734	

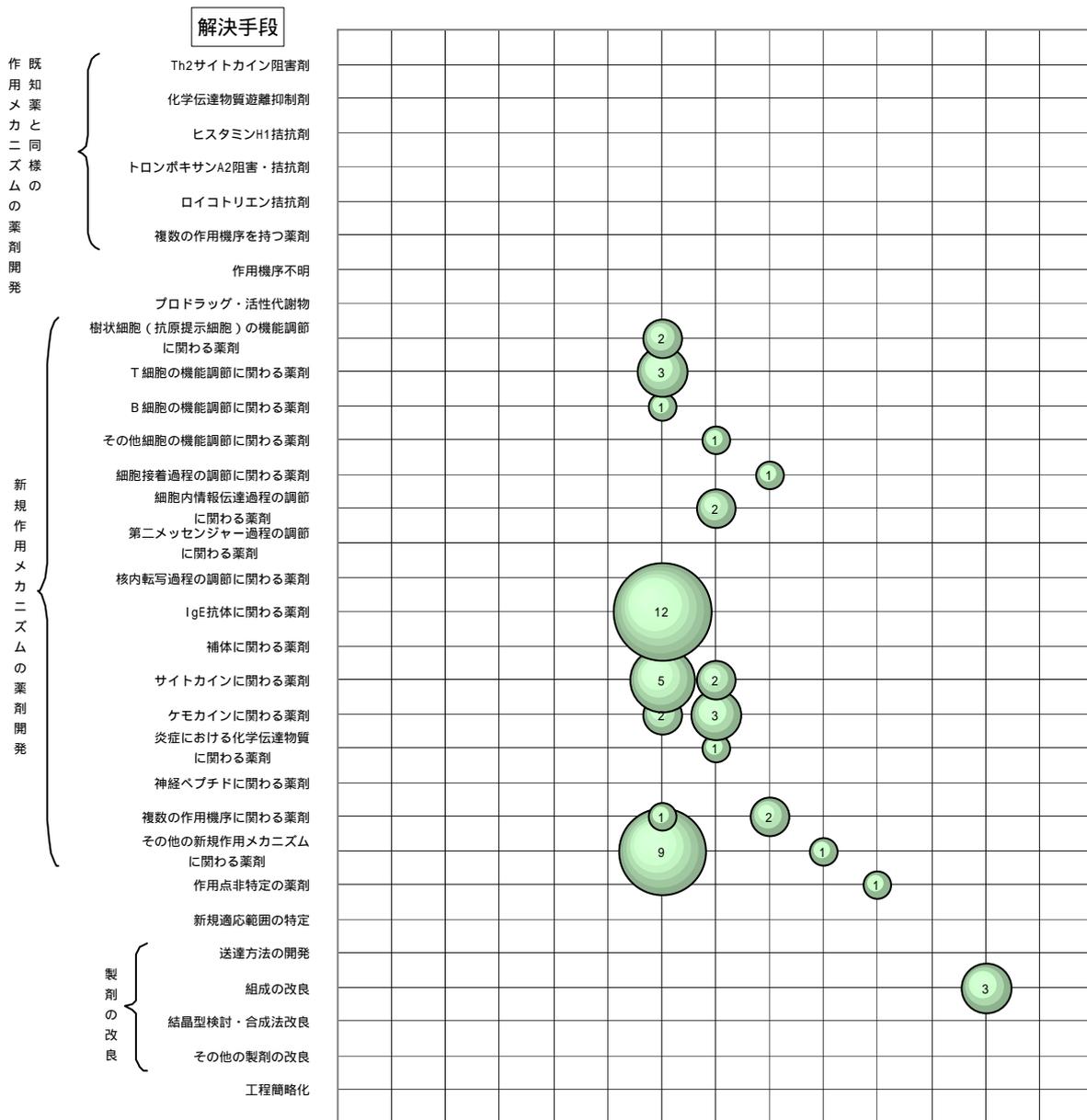
(2) 高分子医薬品

a. 抗体医薬品

図 1.4.4-8 に抗体医薬に関する課題と解決手段の分布を、表 1.4.4-11 に課題と解決手段の詳細を示し、件数が最も多い課題と解決手段に対して網掛けをしている。

高分子医薬品の中で、抗体医薬に関する課題と解決手段の分布で件数が多いのは、「新規作用点に対する薬剤開発」の内、「免疫系に作用する薬剤開発」の課題に対し、「IgE 抗体に関わる薬剤」で解決しているものが多く、出願件数は 12 件である。

図 1.4.4-8 抗体医薬品に関する課題と解決手段の分布



(1993年1月～2003年12月の出願)

表 1.4.4-11 抗体医薬品の課題に対する解決手段の詳細(1/3)

解決手段		薬効向上のための新規薬剤開発												
		既知作用点に対する薬剤開発					既知薬の修飾による薬剤開発	新規作用点に対する薬剤開発				作用点非特定の薬剤開発		
		免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定	免疫系に作用する薬剤開発		炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定				
既知薬と同様の作用メカニズムの薬剤開発	Th2 サイトカイン阻害剤													
	化学伝達物質遊離抑制剤													
	ヒスタミン H1 拮抗剤													
	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤													
	ロイコトリエン拮抗剤													
	複数の作用機序を持つ薬剤													
	作用機序不明													
プロドラッグ・活性代謝物														
新規作用メカニズムの薬剤開発	樹状細胞（抗原提示細胞）の機能調節に関わる薬剤							2						
	T細胞の機能調節に関わる薬剤							3						
	B細胞の機能調節に関わる薬剤							1						
	その他細胞の機能調節に関わる薬剤								1					
	細胞接着過程の調節に関わる薬剤									1				
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤								2					
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤	PDE 4 に関わる薬剤												
		アデノシンに関わる薬剤												
		その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤												
	核内転写過程の調節に関わる薬剤													
	IgE 抗体に関わる薬剤								12					
	補体に関わる薬剤													
	サイトカインに関わる薬剤	抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤							1					
		炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤								2				
		その他のサイトカインに関わる薬剤								4				
	ケモカインに関わる薬剤	CC ケモカインに関わる薬剤							2	2				
CXC ケモカインに関わる薬剤									1					
その他のケモカインに関わる薬剤														
炎症における化学伝達物質に関わる薬剤	脂質メディエーターに関わる薬剤													
	起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤									1				
	その他の化学伝達物質に関わる薬剤													

表 1.4.4-11 抗体医薬品の課題に対する解決手段の詳細(2/3)

解決手段		課題		薬効向上のための新規薬剤開発							作用点非特定の薬剤開発	
				既知作用点に対する薬剤開発				既知薬の修飾による薬剤開発	新規作用点に対する薬剤開発			
				剤開発	免疫系に作用する薬	炎症系に作用する薬	作用機非特定		代謝物	免疫系に作用する薬		炎症系に作用する薬
ム新規作用メカニクス (つづき)	神経ペプチドに関わる薬剤	タキキニンに関わる薬剤										
		その他の神経ペプチドに関わる薬剤										
	複数の作用機序に関わる薬剤							1		2		
	その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤							9			1	
作用点非特定の薬剤											1	
新規適応範囲の特定												
製剤の改良	送達方法の開発											
	組成の改良											
	結晶型検討・合成法改良											
	その他の製剤の改良											
工程簡略化												

表 1.4.4-11 抗体医薬品の課題に対する解決手段の詳細(3/3)

解決手段	課題	適用拡大	易使用性				製造コスト低減化		
			投与方法改善	投与回数・投与量の低減化	副作用低減化	保存安定性	原体コストの低減化	製剤コスト低減化	
発症メカニズムの薬剤開発	Th2 サイトカイン阻害剤								
	化学伝達物質遊離抑制剤								
	ヒスタミン H1 拮抗剤								
	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤								
	ロイコトリエン拮抗剤								
	複数の作用機序を持つ薬剤								
	作用機序不明								
プロドラッグ・活性代謝物									
新規作用メカニズムの薬剤開発	樹状細胞（抗原提示細胞）の機能調節に関わる薬剤								
	T細胞の機能調節に関わる薬剤								
	B細胞の機能調節に関わる薬剤								
	その他細胞の機能調節に関わる薬剤								
	細胞接着過程の調節に関わる薬剤								
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤								
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤	PDE 4 に関わる薬剤							
		アデノシンに関わる薬剤							
		その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤							
		核内転写過程の調節に関わる薬剤							
	IgE 抗体に関わる薬剤								
	補体に関わる薬剤								
	サイトカインに関わる薬剤	抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤							
		炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤							
		その他のサイトカインに関わる薬剤							
	ケモカインに関わる薬剤	CC ケモカインに関わる薬剤							
		CXC ケモカインに関わる薬剤							
	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤	脂質メディエーターに関わる薬剤							
		起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤							
		その他の化学伝達物質に関わる薬剤							
神経ペプチドに関わる薬剤	タキキニンに関わる薬剤								
	その他の神経ペプチドに関わる薬剤								
複数の作用機序に関わる薬剤									
その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤									
作用点非特定の薬剤									
新規適応範囲の特定									
製剤の改良	送達方法の開発								
	組成の改良		3						
	結晶型検討・合成法改良								
	その他の製剤の改良								
工程簡略化									

表 1.4.4-11 で色を付けた箇所について、表 1.4.4-12 に課題と解決手段の出願人を示す。解決手段として最も多い「IgE 抗体に関わる薬剤」について出願人を見ると、ノバルティスが 2 件、他は各 1 件である。

表 1.4.4-12 抗体医薬品の課題に対する解決手段の出願人

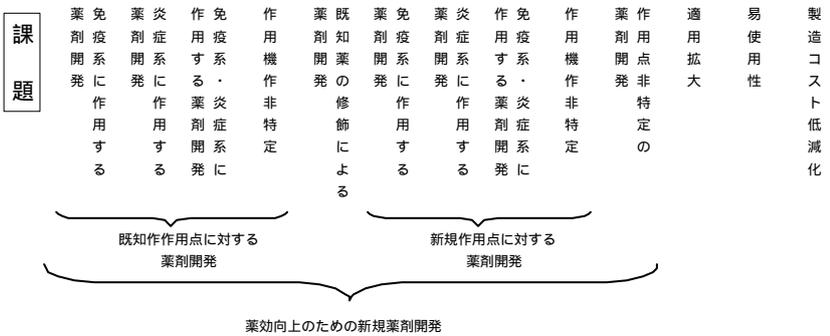
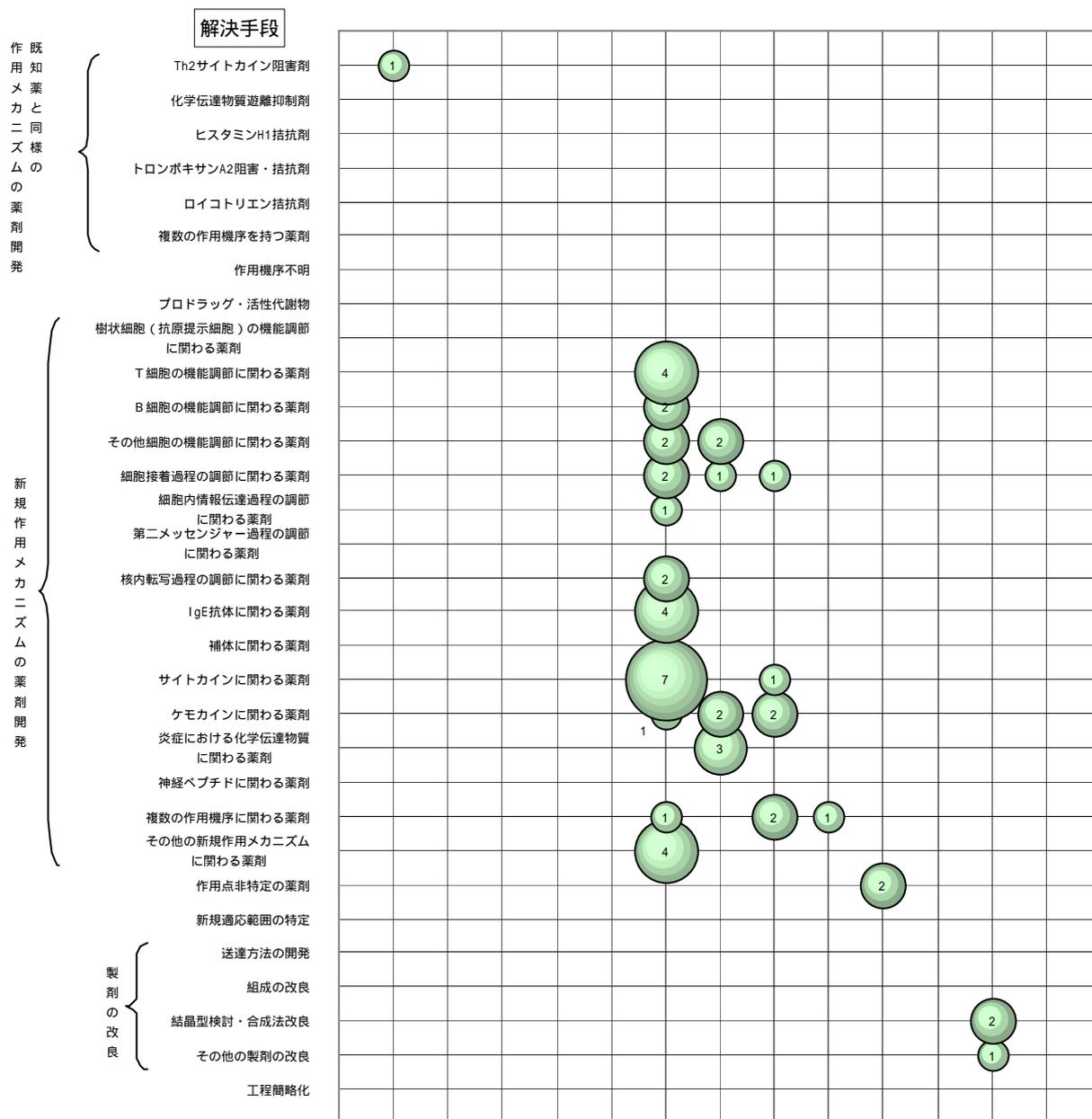
解決手段	課題	薬効向上のための新規薬剤開発	
		新規作用点に対する薬剤開発	
		炎症系に作用する薬剤開発	
新規作用メカニズムの薬剤開発	IgE 抗体に関わる薬剤	生化学工業、アイデック PHARM(米国)(共願)	特表 2002-514071
		シアトルジエネティクス(米国)	特表 2005-511627
		ジエネンテック(米国)	特表平 11-510172
		ジヨーンズホプキンズ UNIV(米国)、ジエネンテック(米国)(共願)	特表 2001-505181
		ダイナバックステクノロジー(米国)	特表 2003-524602
		タノックス(米国)	特表 2002-501905
		ノースウエスタン UNIV(米国)	特表 2003-526372
		ノバルティス(スイス)(2)	特表 2002-544125
		バルティオンテクニリーネントウトキムスケクス(フィンランド)	特表 2004-529180
		ファイザー(米国)	特表 2005-500992
	化学及血清療法研究所	W003/08584	

b. 蛋白質医薬品

図1.4.4-9に蛋白質医薬品に関する課題と解決手段の分布を、表1.4.4-13に課題と解決手段の詳細を示した。その結果、件数の多かった解決手段が複数あがったが、その中で他の技術要素には見られなかった特徴的な解決手段がみられた。その解決手段である「T細胞の機能調節に関わる薬剤」を網掛けしている。

高分子医薬品の内、蛋白質医薬に関する課題と解決手段の分布で件数が多いのは、「新規作用点に対する薬剤開発」の内、「免疫系に作用する薬剤開発」の課題に対し、解決手段として、「サイトカインに関わる薬剤」が 7 件、その中で、抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤が 4 件と多い。

図 1.4.4-9 蛋白質医薬品に関する課題と解決手段の分布



(1993年1月～2003年12月の出願)

表 1.4.4-13 蛋白質医薬品の課題に対する解決手段の詳細(1/3)

解決手段		薬効向上のための新規薬剤開発												
		既知作用点に対する薬剤開発					既知薬の修飾による薬剤開発	新規作用点に対する薬剤開発				作用点非特定の薬剤開発		
		免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定	免疫系に作用する薬剤開発		炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定				
課題		1												
メカニズムと同様の薬剤の開発	Th2 サイトカイン阻害剤													
	化学伝達物質遊離抑制剤													
	ヒスタミン H1 拮抗剤													
	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤													
	ロイコトリエン拮抗剤													
	複数の作用機序を持つ薬剤													
	作用機序不明													
プロドラッグ・活性代謝物														
新規作用メカニズムの薬剤開発	樹状細胞（抗原提示細胞）の機能調節に関わる薬剤													
	T細胞の機能調節に関わる薬剤							4						
	B細胞の機能調節に関わる薬剤							2						
	その他細胞の機能調節に関わる薬剤							2	2					
	細胞接着過程の調節に関わる薬剤							2	1	1				
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤							1						
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤	PDE 4 に関わる薬剤												
		アデノシンに関わる薬剤												
		その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤												
	核内転写過程の調節に関わる薬剤								2					
	IgE 抗体に関わる薬剤								4					
	補体に関わる薬剤													
	サイトカインに関わる薬剤	抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤							4					
		炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤							1					
		その他のサイトカインに関わる薬剤							2		1			
ケモカインに関わる薬剤	CC ケモカインに関わる薬剤							1		1				
	CXC ケモカインに関わる薬剤								1					
	その他のケモカインに関わる薬剤								1	1				
炎症における化学伝達物質に関わる薬剤	脂質メディエーターに関わる薬剤													
	起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤								3					
	その他の化学伝達物質に関わる薬剤													

表 1.4.4-13 蛋白質医薬品の課題に対する解決手段の詳細(2/3)

解決手段			薬効向上のための新規薬剤開発								作用点非特定の薬剤開発	
			既知作用点に対する薬剤開発				既知薬の修飾による薬剤開発	新規作用点に対する薬剤開発				
			剤開発	免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	作用機非特定		代謝物	免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発		作用機非特定
（ム新規作用メカニクス） （つづき）	神経ペプチドに関わる薬剤	タキニンに関わる薬剤										
		その他の神経ペプチドに関わる薬剤										
	複数の作用機序に関わる薬剤							1		2	1	
	その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤							4				
作用点非特定の薬剤											2	
新規適応範囲の特定												
製剤の改良	送達方法の開発											
	組成の改良											
	結晶型検討・合成法改良											
	その他の製剤の改良											
工程簡略化												

表 1.4.4-13 蛋白質医薬品の課題に対する解決手段の詳細(3/3)

解決手段	課題	適用拡大	易使用性				製造コスト低減化		
			投与方法改善	投与回数・投与量の低減化	副作用低減化	保存安定性	原体コストの低減化	製剤コスト低減化	
発症メカニズムの薬剤開発	Th2 サイトカイン阻害剤								
	化学伝達物質遊離抑制剤								
	ヒスタミン H1 拮抗剤								
	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤								
	ロイコトリエン拮抗剤								
	複数の作用機序を持つ薬剤								
	作用機序不明								
プロドラッグ・活性代謝物									
新規作用メカニズムの薬剤開発	樹状細胞（抗原提示細胞）の機能調節に関わる薬剤								
	T細胞の機能調節に関わる薬剤								
	B細胞の機能調節に関わる薬剤								
	その他細胞の機能調節に関わる薬剤								
	細胞接着過程の調節に関わる薬剤								
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤								
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤	PDE 4 に関わる薬剤							
		アデノシンに関わる薬剤							
		その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤							
		核内転写過程の調節に関わる薬剤							
	IgE 抗体に関わる薬剤								
	補体に関わる薬剤								
	サイトカインに関わる薬剤	抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤							
		炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤							
		その他のサイトカインに関わる薬剤							
	ケモカインに関わる薬剤	CC ケモカインに関わる薬剤							
		CXC ケモカインに関わる薬剤							
		その他のケモカインに関わる薬剤							
	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤	脂質メディエーターに関わる薬剤							
		起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤							
その他の化学伝達物質に関わる薬剤									
神経ペプチドに関わる薬剤	タキキニンに関わる薬剤								
	その他の神経ペプチドに関わる薬剤								
複数の作用機序に関わる薬剤									
その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤									
作用点非特定の薬剤									
新規適応範囲の特定									
製剤の改良	送達方法の開発								
	組成の改良								
	結晶型検討・合成法改良					2			
	その他の製剤の改良		1						
工程簡略化									

表 1.4.4-13 で色を付けた箇所について、表 1.4.4-14 に課題と解決手段の出願人を示す。解決手段として最も多い「T細胞の機能調節に関わる薬剤」について出願人を見ると、ノバルティスが2件出願しているが、他の出願人は各々1件に留まっている。

表 1.4.4-14 蛋白質医薬品の課題に対する解決手段の出願人

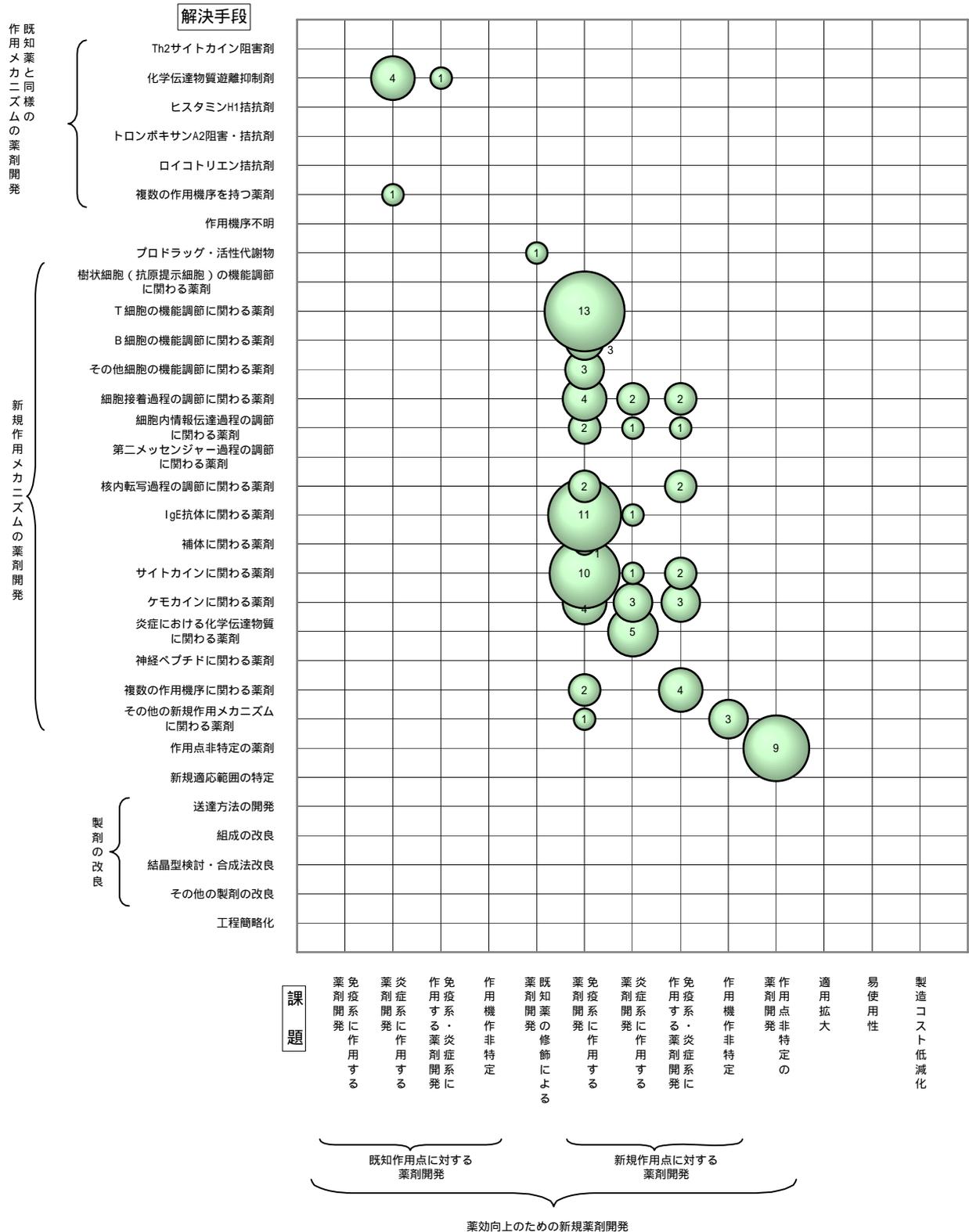
解決手段		課題	
		薬効向上のための新規薬剤開発	
		新規作用点に対する薬剤開発	
		免疫系に作用する薬剤開発	
新規作用メカニズムの薬剤開発	T細胞の機能調節に関わる薬剤	アンスチ.ナシオナルドラサンテドラルシエル (フランス)	特表 2004-516034
		イツサムリサーチ DEV オブザヒーブル-UN (イスラエル)	特表 2000-516570
		ルードビツヒ INST フォーキヤンサーリサーチ (米国) 塩野義製薬	特表 2002-528066 W099/53947

c. ペプチド医薬品

図 1.4.4-10 に複素環式に関する課題と解決手段の分布を、表 1.4.4-15 に課題と解決手段の詳細を示し、件数が上位2位までの課題と解決手段に対して網掛けをしている。

ペプチド医薬品に関する課題と解決手段の分布で件数が多いのは、「新規作用点に対する薬剤開発」の内、「免疫系に作用する薬剤開発」の課題に対し、解決手段として、「T細胞の機能調節に関わる薬剤」が13件、「IgE抗体に関わる薬剤」が11件と続く。

図 1.4.4-10 ペプチド医薬品に関する課題と解決手段の分布



(1993年1月～2003年12月の出願)

表 1.4.4-15 ペプチド医薬品の課題に対する解決手段の詳細(1/2)

解決手段		薬効向上のための新規薬剤開発												
		既知作用点に対する薬剤開発					既知薬の修飾による薬剤開発	新規作用点に対する薬剤開発				作用点非特定の薬剤開発		
		免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定	免疫系に作用する薬剤開発		炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定				
メカニズムと同様の薬剤開発	Th2 サイトカイン阻害剤													
	化学伝達物質遊離抑制剤		4	1										
	ヒスタミン H1 拮抗剤													
	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤													
	ロイコトリエン拮抗剤													
	複数の作用機序を持つ薬剤		1											
	作用機序不明													
プロドラッグ・活性代謝物						1								
新規作用メカニズムの薬剤開発	樹状細胞（抗原提示細胞）の機能調節に関わる薬剤													
	T細胞の機能調節に関わる薬剤						13							
	B細胞の機能調節に関わる薬剤						3							
	その他細胞の機能調節に関わる薬剤						3							
	細胞接着過程の調節に関わる薬剤						4	2	2					
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤						2	1	1					
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤	PDE 4 に関わる薬剤												
		アデノシンに関わる薬剤												
		その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤												
	核内転写過程の調節に関わる薬剤							2		2				
	IgE 抗体に関わる薬剤							11	1					
	補体に関わる薬剤							1						
	サイトカインに関わる薬剤	抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤							4					
		炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤								1				
		その他のサイトカインに関わる薬剤							6		2			
ケモカインに関わる薬剤	CC ケモカインに関わる薬剤							2	1					
	CXC ケモカインに関わる薬剤													
	その他のケモカインに関わる薬剤							2	2	3				
炎症における化学伝達物質に関わる薬剤	脂質メディエーターに関わる薬剤													
	起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤								2					
	その他の化学伝達物質に関わる薬剤									3				

表 1.4.4-15 ペプチド医薬品の課題に対する解決手段の詳細(2/2)

解決手段		課題		薬効向上のための新規薬剤開発											
				既知作用点に対する薬剤開発				既知薬の修飾による薬剤開発	新規作用点に対する薬剤開発				作用点非特定の薬剤開発		
				剤開発	免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	作用機非特定		剤開発	免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	作用機非特定			
ム新規作用メカニズ (つづき)	神経ペプチドに関わる薬剤	タキキニンに関わる薬剤													
		その他の神経ペプチドに関わる薬剤													
	複数の作用機序に関わる薬剤								2		4				
	その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤								1				3		
作用点非特定の薬剤														9	
新規適応範囲の特定															
製剤の改良	送達方法の開発														
	組成の改良														
	結晶型検討・合成法改良														
	その他の製剤の改良														
工程簡略化															

表 1.4.4-15 で色を付けた箇所について、表 1.4.4-16 に課題と解決手段の出願人を示す。解決手段として 13 件と最も多い「T細胞の機能調節に関わる薬剤」について出願人を見ると、三共、林原生物化学研究所の共同出願によるものが3件で多い。また、「IgE 抗体に関わる薬剤」の 11 件では、ペプチドセラピューティクス、グラクソスミスクラインの共同出願によるものが2件で、他は各1件である。

表 1.4.4-16 ペプチド医薬品の課題に対する解決手段の出願人

解決手段		課題	薬効向上のための新規薬剤開発
			新規作用点に対する薬剤開発
			免疫系に作用する薬剤開発
新規作用メカニズムの薬剤開発	T細胞の機能調節に関わる薬剤	インスチ・ヒューアメディツインテクノロジーマグデブルク(ドイツ) ウトウクナラン(ドイツ) エラスムスユニフェルシテイトロットテルダム(オランダ) ガルファーマ ジェネンテック(米国) セルーサイ(米国) バイエル(ドイツ) ヘルパーバイセラピューティクス(イギリス) ユニバーシティオブアリゾナファウンデーション(米国) ユニバーシティオブカリフォルニア(米国) 三共、林原生物化学研究所(共願)(3)	特表 2004-520330 特表 2004-512371 特表 2004-503468 特開 2004-244411 特表 2003-512824 特表 2003-514828 特表 2004-527228 特表 2004-513925 特表 2004-516240 特表平 10-511541 特開平 11-92497 特開平 10-259198 特開 2003-2897
	IgE抗体に関わる薬剤	カルロスアドリエルデルカルピオ、小島泰樹、小林 証樹、東成見(共願) ペプチドセラピューティクス(イギリス)、グラクソ・スミスクライン(イギリス)(共願)(2) ジェネンテック(米国) タノックス(米国) ヒスタテクエルエルシー(米国) ペプチドセラピューティクス(イギリス) ユニバーシティオブカリフォルニア(米国) 大正製薬、三井化学(共願) 雪印乳業 明治製菓	特開平 11-12298 特表 2004-538238 特表 2002-537403 特表 2004-517816 特表 2004-537991 特表 2003-504412 特表平 9-505563 特表 2005-508138 特開平 6-239887 特開平 7-215851 特開 2004-99457

d. 核酸医薬品

図 1.4.4-11 に核酸医薬品に関する課題と解決手段の分布を、表 1.4.4-17 に課題と解決手段の詳細を示し、薬剤の開発において重要である薬剤の作用点が明確になっている課題と解決手段に対して網掛けをしている。

核酸医薬品に関する課題と解決手段の分布では、課題のほとんどは「新規作用点に対する薬剤開発」であり、その中で特に多い「免疫系に作用する薬剤開発」の課題に対し、解決手段として「T細胞の機能調節に関わる薬剤」などを用いている。

図 1.4.4-11 核酸医薬品に関する課題と解決手段の分布

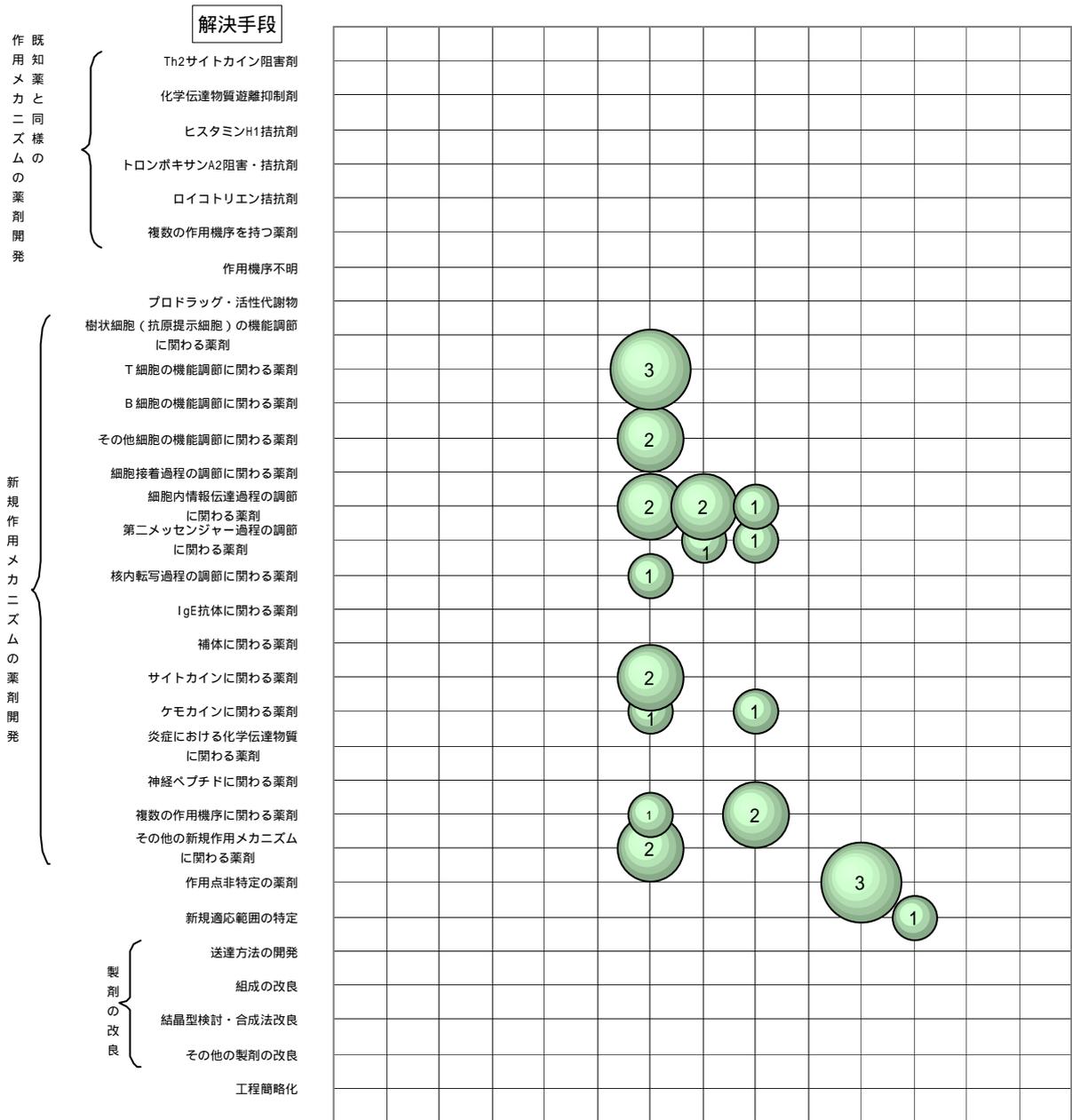


表 1.4.4-17 核酸医薬品の課題に対する解決手段の詳細(1/3)

解決手段		薬効向上のための新規薬剤開発											
		既知作用点に対する薬剤開発					既知薬の修飾による薬剤開発	新規作用点に対する薬剤開発				作用点非特定の薬剤開発	
		免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定	免疫系に作用する薬剤開発		炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定			
既知薬と同様の作用メカニズムの薬剤開発	Th2 サイトカイン阻害剤												
	化学伝達物質遊離抑制剤												
	ヒスタミン H1 拮抗剤												
	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤												
	ロイコトリエン拮抗剤												
	複数の作用機序を持つ薬剤												
	作用機序不明												
プロドラッグ・活性代謝物													
新規作用メカニズムの薬剤開発	樹状細胞（抗原提示細胞）の機能調節に関わる薬剤												
	T細胞の機能調節に関わる薬剤							3					
	B細胞の機能調節に関わる薬剤												
	その他細胞の機能調節に関わる薬剤							2					
	細胞接着過程の調節に関わる薬剤												
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤							2	2	1			
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤	PDE 4 に関わる薬剤									1		
		アデノシンに関わる薬剤								1			
		その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤											
	核内転写過程の調節に関わる薬剤							1					
	IgE 抗体に関わる薬剤												
	補体に関わる薬剤												
	サイトカインに関わる薬剤	抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤											
		炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤											
		その他のサイトカインに関わる薬剤							2				
ケモカインに関わる薬剤	CC ケモカインに関わる薬剤												
	CXC ケモカインに関わる薬剤												
	その他のケモカインに関わる薬剤							1		1			
炎症における化学伝達物質に関わる薬剤	脂質メディエーターに関わる薬剤												
	起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤												
	その他の化学伝達物質に関わる薬剤												

表 1.4.4-17 核酸医薬品の課題に対する解決手段の詳細(2/3)

解決手段			薬効向上のための新規薬剤開発									
			既知作用点に対する薬剤開発				既知薬の修飾による薬剤開発	新規作用点に対する薬剤開発				作用点非特定の薬剤開発
			剤開発	免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	作用機非特定		剤開発	免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	作用機非特定	
（つづき） 新規作用メカニズムの薬剤開発	神経ペプチドに関わる薬剤	タキキニンに関わる薬剤										
		その他の神経ペプチドに関わる薬剤										
	複数の作用機序に関わる薬剤							1		2		
	その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤							2				
作用点非特定の薬剤											3	
新規適応範囲の特定												
製剤の改良	送達方法の開発											
	組成の改良											
	結晶型検討・合成法改良											
	その他の製剤の改良											
工程簡略化												

表 1.4.4-17 核酸医薬品の課題に対する解決手段の詳細(3/3)

解決手段	課題	適用拡大	易使用性				製造コスト低減化		
			投与方法改善	投与回数・投与量の低減化	副作用低減化	保存安定性	原体コストの低減化	製剤コスト低減化	
開発の既知薬と同一作用メカニズムの薬剤	Th2 サイトカイン阻害剤								
	化学伝達物質遊離抑制剤								
	ヒスタミン H1 拮抗剤								
	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤								
	ロイコトリエン拮抗剤								
	複数の作用機序を持つ薬剤								
	作用機序不明								
プロドラッグ・活性代謝物									
新規作用メカニズムの薬剤開発	樹状細胞（抗原提示細胞）の機能調節に関わる薬剤								
	T細胞の機能調節に関わる薬剤								
	B細胞の機能調節に関わる薬剤								
	その他細胞の機能調節に関わる薬剤								
	細胞接着過程の調節に関わる薬剤								
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤								
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤	PDE 4 に関わる薬剤							
		アデノシンに関わる薬剤							
		その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤							
		核内転写過程の調節に関わる薬剤							
	IgE 抗体に関わる薬剤								
	補体に関わる薬剤								
	サイトカインに関わる薬剤	抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤							
		炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤							
		その他のサイトカインに関わる薬剤							
	ケモカインに関わる薬剤	CC ケモカインに関わる薬剤							
		CXC ケモカインに関わる薬剤							
		その他のケモカインに関わる薬剤							
	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤	脂質メディエーターに関わる薬剤							
		起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤							
その他の化学伝達物質に関わる薬剤									
神経ペプチドに関わる薬剤	タキキニンに関わる薬剤								
	その他の神経ペプチドに関わる薬剤								
複数の作用機序に関わる薬剤									
その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤									
作用点非特定の薬剤									
新規適応範囲の特定		1							
製剤の改良	送達方法の開発								
	組成の改良								
	結晶型検討・合成法改良								
	その他の製剤の改良								
工程簡略化									

表 1.4.4-17 で色を付けた箇所について、表 1.4.4-18 に課題と解決手段の出願人を示す。「T細胞の機能調節に関わる薬剤」について出願人を見ると、アイシーエヌ PHARM が 2 件、ヘルパーバイセラピューティクスが 1 件である。

表 1.4.4-18 核酸医薬品の課題に対する解決手段の出願人

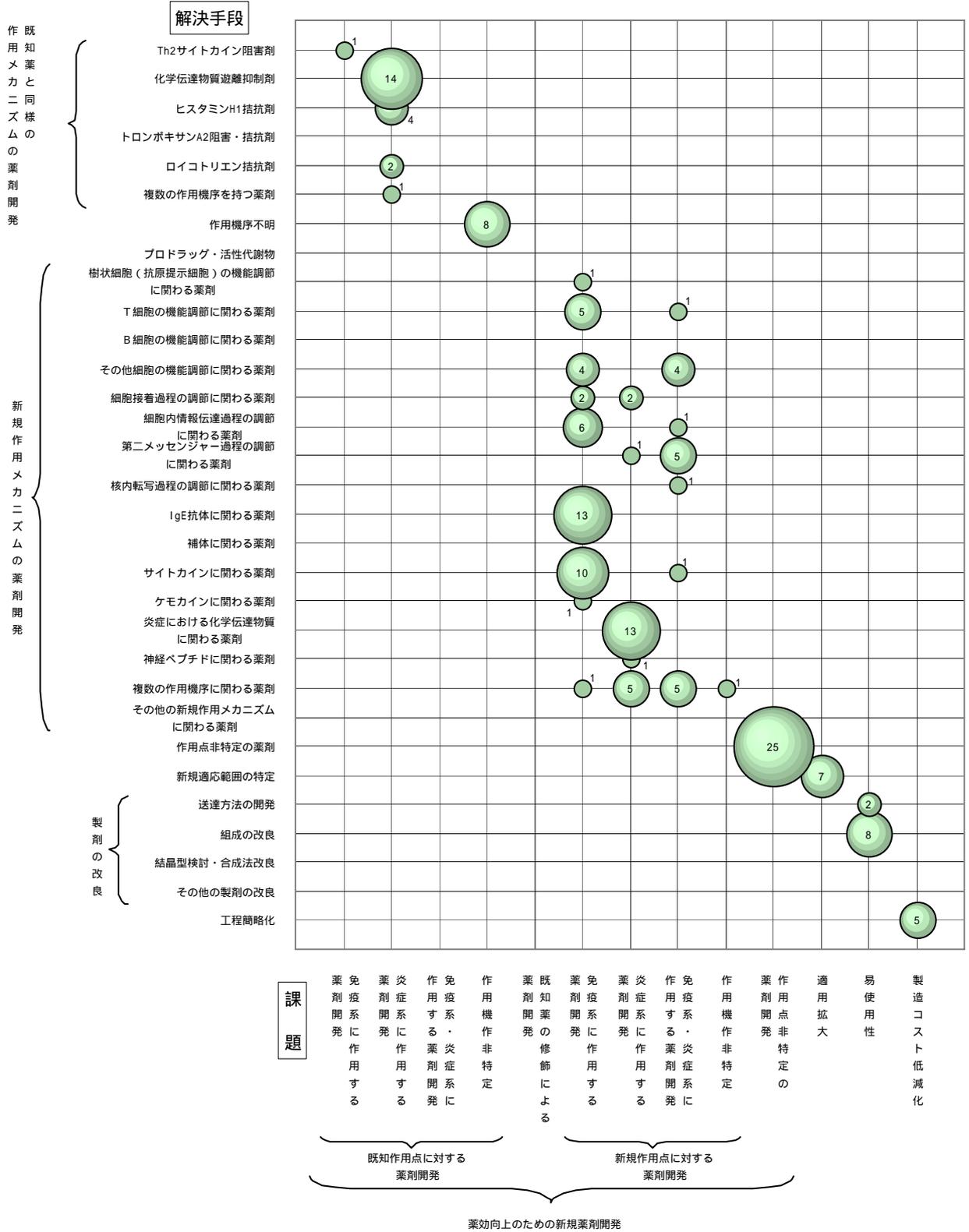
課題		薬効向上のための新規薬剤開発	
		新規作用点に対する薬剤開発	
解決手段		免疫系に作用する薬剤開発	
開二新 発ズ規 ム作 の用 薬メ 剤カ	T細胞の機能調節に関わる薬剤	アイシーエヌ PHARM(米国)(2)	特表 2002-515892 特開 2004-35537
		ヘルパーバイセラピューティクス(イギリス)	特表 2004-525085

(3) 天然物医薬品

図 1.4.4-12 に天然物医薬品に関する課題と解決手段の分布を、表 1.4.4-19 に課題と解決手段の詳細を示した。薬剤の開発において重要である薬剤の作用点が明確になっているもので、より開発に重点を置いている「新規作用点に対する薬剤開発」の課題と解決手段に関して、最も件数の多いところに網掛けをしている。

天然物医薬品に関する課題と解決手段の分布では、「作用点非特定の薬剤開発」の課題に対し、解決手段として、「作用点非特定の薬剤」が 25 件である。また、「新規作用点に対する薬剤開発」の内、「免疫系に作用する薬剤開発」の課題に対し、解決手段として「IgE 抗体に関わる薬剤」「サイトカインに関わる薬剤」などが中心的に用いられている。

図 1.4.4-12 天然物医薬品に関する課題と解決手段の分布



(1993年1月～2003年12月の出願)

表 1.4.4-19 天然物医薬品の課題に対する解決手段の詳細(1/3)

解決手段		薬効向上のための新規薬剤開発												
		既知作用点に対する薬剤開発					既知薬の修飾による薬剤開発	新規作用点に対する薬剤開発				作用点非特定の薬剤開発		
		免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定	プロドラッグ・活性代謝物		免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定			
メカニズムと同様の薬剤の開発	Th2 サイトカイン阻害剤	1												
	化学伝達物質遊離抑制剤		14											
	ヒスタミン H1 拮抗剤		4											
	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤													
	ロイコトリエン拮抗剤		2											
	複数の作用機序を持つ薬剤		1											
	作用機序不明				8									
プロドラッグ・活性代謝物														
新規作用メカニズムの薬剤開発	樹状細胞（抗原提示細胞）の機能調節に関わる薬剤							1						
	T細胞の機能調節に関わる薬剤							5		1				
	B細胞の機能調節に関わる薬剤													
	その他細胞の機能調節に関わる薬剤							4		4				
	細胞接着過程の調節に関わる薬剤							2	2					
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤							6		1				
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤	PDE 4 に関わる薬剤									5			
		アデノシンに関わる薬剤												
		その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤								1				
	核内転写過程の調節に関わる薬剤										1			
	IgE 抗体に関わる薬剤								13					
	補体に関わる薬剤													
	サイトカインに関わる薬剤	抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤							6					
		炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤							1		1			
		その他のサイトカインに関わる薬剤							3					
ケモカインに関わる薬剤	CC ケモカインに関わる薬剤							1						
	CXC ケモカインに関わる薬剤													
	その他のケモカインに関わる薬剤													
炎症における化学伝達物質に関わる薬剤	脂質メディエーターに関わる薬剤									3				
	起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤									6				
	その他の化学伝達物質に関わる薬剤									4				

表 1.4.4-19 天然物医薬品の課題に対する解決手段の詳細(2/3)

解決手段			薬効向上のための新規薬剤開発											
			既知作用点に対する薬剤開発					既知薬の修飾による薬剤開発	新規作用点に対する薬剤開発				作用点非特定の薬剤開発	
			剤開発	免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機非特定		代謝物	プロドラッグ・活性	剤開発	免疫系に作用する薬剤開発		炎症系に作用する薬剤開発
（つづき） 新規作用メカニズムの薬剤開発	神経ペプチドに関わる薬剤	タキキニンに関わる薬剤								1				
		その他の神経ペプチドに関わる薬剤												
	複数の作用機序に関わる薬剤									1	5	5	1	
	その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤													
作用点非特定の薬剤														25
新規適応範囲の特定														
製剤の改良	送達方法の開発													
	組成の改良													
	結晶型検討・合成法改良													
	その他の製剤の改良													
工程簡略化														

表 1.4.4-19 天然物医薬品の課題に対する解決手段の詳細(3/3)

解決手段	課題	適用拡大	易使用性				製造コスト低減化		
			投与方法改善	投与回数・投与量の低減化	副作用低減化	保存安定性	原体コストの低減化	製剤コスト低減化	
発症メカニズムの薬剤開発	Th2 サイトカイン阻害剤								
	化学伝達物質遊離抑制剤								
	ヒスタミン H1 拮抗剤								
	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤								
	ロイコトリエン拮抗剤								
	複数の作用機序を持つ薬剤								
	作用機序不明								
プロドラッグ・活性代謝物									
新規作用メカニズムの薬剤開発	樹状細胞（抗原提示細胞）の機能調節に関わる薬剤								
	T細胞の機能調節に関わる薬剤								
	B細胞の機能調節に関わる薬剤								
	その他細胞の機能調節に関わる薬剤								
	細胞接着過程の調節に関わる薬剤								
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤								
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤	PDE 4 に関わる薬剤							
		アデノシンに関わる薬剤							
		その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤							
		核内転写過程の調節に関わる薬剤							
	IgE 抗体に関わる薬剤								
	補体に関わる薬剤								
	サイトカインに関わる薬剤	抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤							
		炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤							
		その他のサイトカインに関わる薬剤							
	ケモカインに関わる薬剤	CC ケモカインに関わる薬剤							
		CXC ケモカインに関わる薬剤							
		その他のケモカインに関わる薬剤							
	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤	脂質メディエーターに関わる薬剤							
		起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤							
その他の化学伝達物質に関わる薬剤									
神経ペプチドに関わる薬剤	タキキニンに関わる薬剤								
	その他の神経ペプチドに関わる薬剤								
複数の作用機序に関わる薬剤									
その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤									
作用点非特定の薬剤									
新規適応範囲の特定		7							
製剤の改良	送達方法の開発		1	1					
	組成の改良		7		1				
	結晶型検討・合成法改良								
	その他の製剤の改良								
工程簡略化						5			

表 1.4.4-19 で色を付けた箇所について、表 1.4.4-20 に天然物医薬品に関する課題と解決手段の出願人を示す。

「IgE 抗体に関わる薬剤」について出願人を見ると、13 件とも異なった出願人で、業種は国内の食品企業が多く見られる。

表 1.4.4-20 天然物医薬品の課題に対する解決手段の出願人

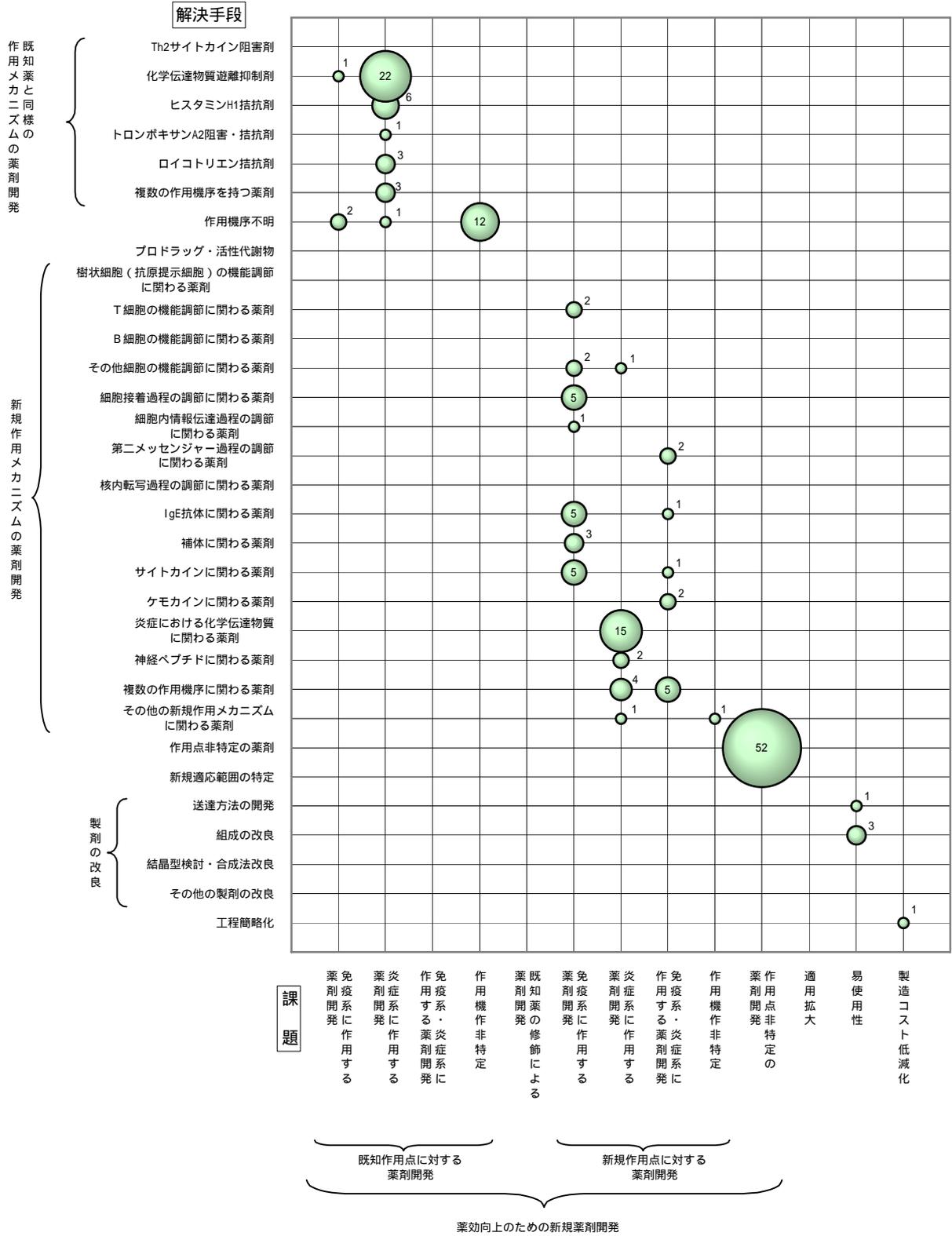
課題		薬効向上のための新規薬剤開発	
		新規作用点に対する薬剤開発	
解決手段		免疫系に作用する薬剤開発	
新規作用メカニズムの薬剤	IgE 抗体に関わる薬剤	羅智靖、アサヒビール(共願)	特開 2001-172177
		サンスター	W000/57888
		ティーエフティー、大森斉(共願)	特開平 10-298084
		テイカ、大森斉(共願)	特開平 10-194979
		東洋発酵、ニツカウヰスキー、羅智靖(共願)	特開平 11-269075
		ニツカウヰスキー、羅智靖(共願)	特開平 11-269192
		プロデュイネツスル(スイス)	特表 2004-528034
		ヤクルト本社	特開平 9-2959
		旭化成	特開平 9-309859
		清水化学、秀道広、西川ゴム工業(共願)	特開 2005-145831
		森永製菓	特開 2005-112785
		日本甜菜製糖	特開 2001-288093
		明治乳業	特許 3647895

(4) 生薬

図 1.4.4-13 に生薬に関する課題と解決手段の分布を、表 1.4.4-21 に課題と解決手段の詳細を示し、薬剤開発として重要な作用点が明確である課題の中で、一番件数が多い課題と解決手段に対して網掛けをしている。

生薬に関する課題と解決手段の分布では、「作用点非特定の薬剤開発」の課題に対し、解決手段として、「作用点非特定の薬剤」が 52 件である。また、「既知作用点に対する薬剤開発」の内、「炎症系に作用する薬剤開発」の課題に対し、中心的な解決手段としては「化学伝達物質遊離抑制剤」を用いており、出願件数は 22 件である。

図 1.4.4-13 生薬に関する課題と解決手段の分布



(1993年1月～2003年12月の出願)

表 1.4.4-21 生薬の課題に対する解決手段の詳細(1/3)

解決手段		薬効向上のための新規薬剤開発													
		既知作用点に対する薬剤開発					既知薬の修飾による薬剤開発	新規作用点に対する薬剤開発				作用点非特定の薬剤開発			
		剤開発	免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定		剤開発	免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発		作用機作非特定		
メカニズムと同様の薬剤の開発	Th2 サイトカイン阻害剤														
	化学伝達物質遊離抑制剤	1	22												
	ヒスタミン H1 拮抗剤		6												
	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤		1												
	ロイコトリエン拮抗剤		3												
	複数の作用機序を持つ薬剤		3												
	作用機序不明	2	1		12										
プロドラッグ・活性代謝物															
新規作用メカニズムの薬剤開発	樹状細胞（抗原提示細胞）の機能調節に関わる薬剤														
	T細胞の機能調節に関わる薬剤							2							
	B細胞の機能調節に関わる薬剤														
	その他細胞の機能調節に関わる薬剤							2	1						
	細胞接着過程の調節に関わる薬剤							5							
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤							1							
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤	PDE 4 に関わる薬剤										2			
		アデノシンに関わる薬剤													
		その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤													
	核内転写過程の調節に関わる薬剤														
	IgE 抗体に関わる薬剤								5		1				
	補体に関わる薬剤								3						
	サイトカインに関わる薬剤	抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤							4						
		炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤										1			
		その他のサイトカインに関わる薬剤							1						
ケモカインに関わる薬剤	CC ケモカインに関わる薬剤														
	CXC ケモカインに関わる薬剤														
	その他のケモカインに関わる薬剤										2				
炎症における化学伝達物質に関わる薬剤	脂質メディエーターに関わる薬剤									6					
	起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤									9					
	その他の化学伝達物質に関わる薬剤														

表 1.4.4-21 生薬の課題に対する解決手段の詳細(2/3)

解決手段			薬効向上のための新規薬剤開発												
			既知作用点に対する薬剤開発					既知薬の修飾による薬剤開発	新規作用点に対する薬剤開発				作用点非特定の薬剤開発		
			剤開発	免疫系に作用する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機非特定		代謝物	プロドラッグ・活性	剤開発	免疫系に作用する薬剤開発		炎症系に作用する薬剤開発	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発
（つづき） 新規作用メカニズムの薬剤開発	神経ペプチドに関わる薬剤	タキキニンに関わる薬剤									1				
		その他の神経ペプチドに関わる薬剤										1			
	複数の作用機序に関わる薬剤											4	5		
	その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤												1		1
作用点非特定の薬剤															52
新規適応範囲の特定															
製剤の改良	送達方法の開発														
	組成の改良														
	結晶型検討・合成法改良														
	その他の製剤の改良														
工程簡略化															

表 1.4.4-21 生薬の課題に対する解決手段の詳細(3/3)

解決手段	課題	適用拡大	易使用性				製造コスト低減化		
			投与方法改善	投与回数・投与量の低減化	副作用低減化	保存安定性	原体コストの低減化	製剤コスト低減化	
開発中の既知薬と同等の作用メカニズムの薬剤	Th2 サイトカイン阻害剤								
	化学伝達物質遊離抑制剤								
	ヒスタミン H1 拮抗剤								
	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤								
	ロイコトリエン拮抗剤								
	複数の作用機序を持つ薬剤								
	作用機序不明								
プロドラッグ・活性代謝物									
新規作用メカニズムの薬剤開発	樹状細胞（抗原提示細胞）の機能調節に関わる薬剤								
	T細胞の機能調節に関わる薬剤								
	B細胞の機能調節に関わる薬剤								
	その他細胞の機能調節に関わる薬剤								
	細胞接着過程の調節に関わる薬剤								
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤								
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤	PDE 4 に関わる薬剤							
		アデノシンに関わる薬剤							
		その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤							
		核内転写過程の調節に関わる薬剤							
	IgE 抗体に関わる薬剤								
	補体に関わる薬剤								
	サイトカインに関わる薬剤	抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤							
		炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤							
		その他のサイトカインに関わる薬剤							
	ケモカインに関わる薬剤	CC ケモカインに関わる薬剤							
		CXC ケモカインに関わる薬剤							
		その他のケモカインに関わる薬剤							
	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤	脂質メディエーターに関わる薬剤							
		起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤							
その他の化学伝達物質に関わる薬剤									
神経ペプチドに関わる薬剤	タキキニンに関わる薬剤								
	その他の神経ペプチドに関わる薬剤								
複数の作用機序に関わる薬剤									
その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤									
作用点非特定の薬剤									
新規適応範囲の特定									
製剤の改良	送達方法の開発		1						
	組成の改良		2		1				
	結晶型検討・合成法改良								
	その他の製剤の改良								
工程簡略化									
							1		

表 1.4.4-21 で色を付けた箇所について、表 1.4.4-22 に生薬に関する課題と解決手段の出願人を示す。

「化学伝達物質遊離抑制剤」について出願人を見ると、一丸ファルコスが 5 件である。

表 1.4.4-22 生薬の課題に対する解決手段の出願人

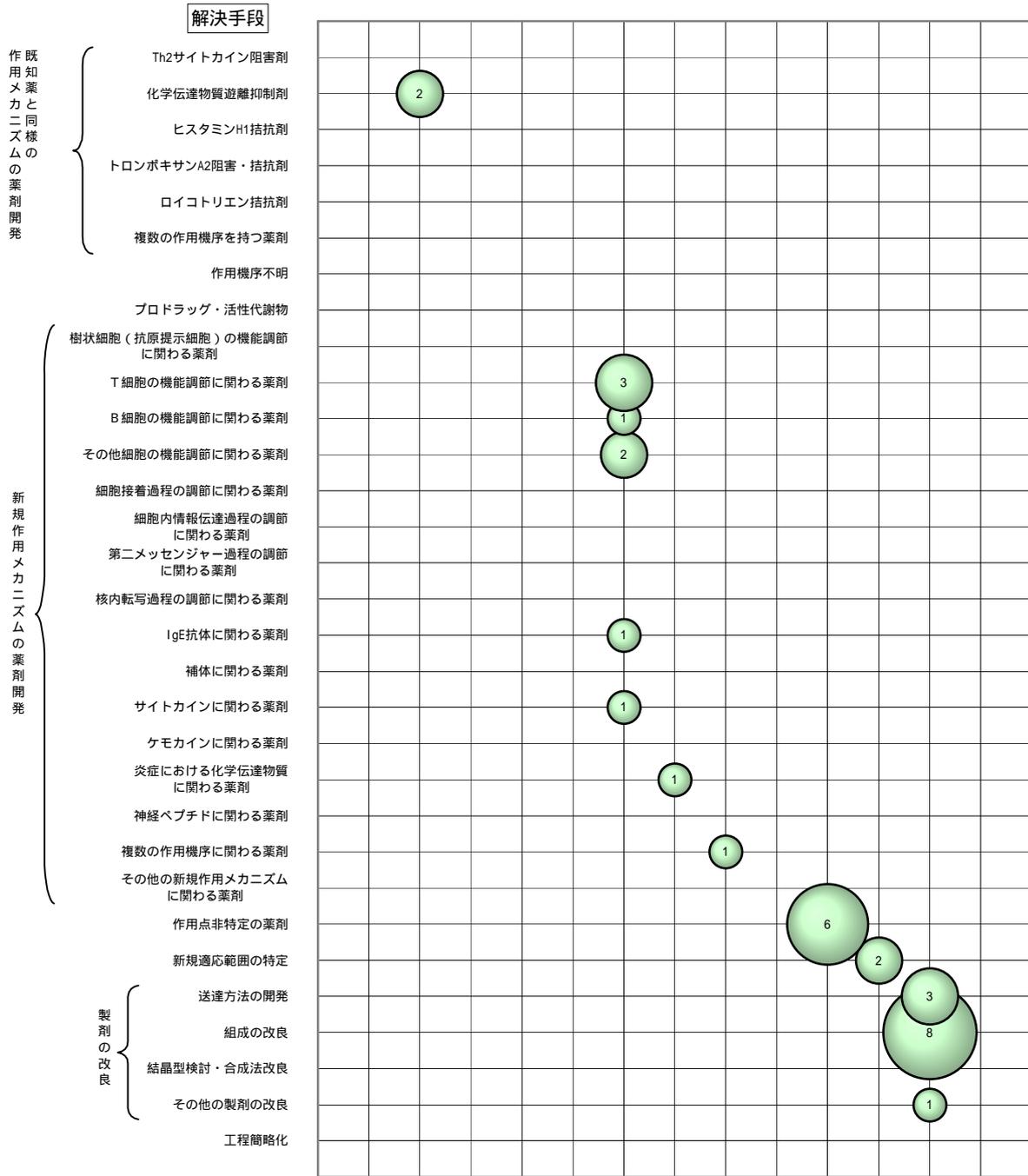
課題		薬効向上のための新規薬剤開発	
		既知作用点に対する薬剤開発	炎症系に作用する薬剤開発
解決手段	化学伝達物質遊離抑制剤	オーエス工業 サンスター(2)	特開平 9-2969 特開平 9-263526 特開 2000-139406
		サントレック、三邦(共願) ナチュラルレメディーズ・プライベート ノエビア(2)	特開 2003-252786 特表 2003-524653 特開平 10-120583 特開平 10-139679
既知薬と同様の作用メカニズムの薬剤開発	化学伝達物質遊離抑制剤	ロッテ 一丸ファルコス(5)	特開 2005-179285 特開 2000-136142 特開 2000-169383 特開 2001-139489 特開 2003-95967 特開 2004-18492
		稲畑香料 漢方閣薬品、北中進(共願) 丸善製薬(2)	特開 2004-262905 特許 3192617 特開 2000-239145 特開 2004-345982
		今中ひろみ 三生製薬 小川香料 創研 日本メナード化粧品	特開 2005-170829 特開平 6-211673 特開平 10-287582 特開平 7-252158 特開 2003-171298

(5) その他の抗アレルギー剤

図 1.4.4-14 にその他の抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布を、表 1.4.4-23 に課題と解決手段の詳細を示す。

その他の抗アレルギー剤における出願特許としては、課題としては「易使用性」が多く、その解決手段としては、「組成の改良」や「送達方法の改良」で対応している。二番目に多い課題としては、「作用点非特定の薬剤開発」である。その課題の解決手段としては、「新規作用メカニズムの薬剤開発」であり、そのなかでも特に「作用点非特定の薬剤」が多い。

図 1.4.4-14 その他の抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布



課題

- 薬剤開発に作用する
- 炎症系に作用する
- 作用メカニズム・炎症系に作用する
- 作用メカニズム非特定
- 既知薬の修飾による
- 薬剤開発に作用する
- 炎症系に作用する
- 作用メカニズム・炎症系に作用する
- 作用メカニズム非特定
- 作用点非特定の
- 適用拡大
- 易使用性
- 製造コスト低減化

既知作用点に対する薬剤開発

新規作用点に対する薬剤開発

薬効向上のための新規薬剤開発

(1993年1月～2003年12月の出願)

表 1.4.4-23 その他の抗アレルギー剤の課題に対する解決手段の詳細(1/3)

解決手段		薬効向上のための新規薬剤開発												
		既知作用点に対する薬剤開発					既知薬の修飾による薬剤開発	新規作用点に対する薬剤開発				作用点非特定の薬剤開発		
		剤開発	免疫系に作用する薬	炎症系に作用する薬	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	作用機作非特定		剤開発	免疫系に作用する薬	炎症系に作用する薬	免疫系・炎症系に作用する薬剤開発		作用機作非特定	
メカニズムと同様の薬剤の開発	Th2 サイトカイン阻害剤													
	化学伝達物質遊離抑制剤		2											
	ヒスタミン H1 拮抗剤													
	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤													
	ロイコトリエン拮抗剤													
	複数の作用機序を持つ薬剤													
	作用機序不明													
プロドラッグ・活性代謝物														
新規作用メカニズムの薬剤開発	樹状細胞（抗原提示細胞）の機能調節に関わる薬剤													
	T細胞の機能調節に関わる薬剤							3						
	B細胞の機能調節に関わる薬剤							1						
	その他細胞の機能調節に関わる薬剤							2						
	細胞接着過程の調節に関わる薬剤													
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤													
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤	PDE 4 に関わる薬剤												
		アデノシンに関わる薬剤												
		その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤												
	核内転写過程の調節に関わる薬剤													
	IgE 抗体に関わる薬剤								1					
	補体に関わる薬剤													
	サイトカインに関わる薬剤	抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤												
		炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤												
		その他のサイトカインに関わる薬剤							1					
ケモカインに関わる薬剤	CC ケモカインに関わる薬剤													
	CXC ケモカインに関わる薬剤													
	その他のケモカインに関わる薬剤													
炎症における化学伝達物質に関わる薬剤	脂質メディエーターに関わる薬剤													
	起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤													
	その他の化学伝達物質に関わる薬剤								1					

表 1.4.4-23 その他の抗アレルギー剤の課題に対する解決手段の詳細 (2/3)

解決手段		課題		薬効向上のための新規薬剤開発												
				既知作用点に対する薬剤開発				既知薬の修飾による薬剤開発	新規作用点に対する薬剤開発				作用点非特定の薬剤開発			
				剤開発	免疫系に作用する薬	炎症系に作用する薬	免疫系・炎症系に作用する薬		作用機非特定	代謝物	プロドラッグ・活性	剤開発		免疫系に作用する薬	炎症系に作用する薬	免疫系・炎症系に作用する薬
（つづき） 新規作用メカニズムの薬剤開発	神経ペプチドに関わる薬剤	タキキニンに関わる薬剤														
		その他の神経ペプチドに関わる薬剤														
	複数の作用機序に関わる薬剤													1		
	その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤															
作用点非特定の薬剤															6	
新規適応範囲の特定																
製剤の改良	送達方法の開発															
	組成の改良															
	結晶型検討・合成法改良															
	その他の製剤の改良															
工程簡略化																

表 1.4.4-23 その他の抗アレルギー剤の課題に対する解決手段の詳細 (3/3)

解決手段	課題	適用拡大	易使用性				製造コスト低減化		
			投与方法改善	投与回数・投与量の低減化	副作用低減化	保存安定性	原体コストの低減化	製剤コスト低減化	
開発中の既知薬と同一作用メカニズムの薬剤	Th2 サイトカイン阻害剤								
	化学伝達物質遊離抑制剤								
	ヒスタミン H1 拮抗剤								
	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤								
	ロイコトリエン拮抗剤								
	複数の作用機序を持つ薬剤								
	作用機序不明								
プロドラッグ・活性代謝物									
新規作用メカニズムの薬剤開発	樹状細胞（抗原提示細胞）の機能調節に関わる薬剤								
	T細胞の機能調節に関わる薬剤								
	B細胞の機能調節に関わる薬剤								
	その他細胞の機能調節に関わる薬剤								
	細胞接着過程の調節に関わる薬剤								
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤								
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤	PDE 4 に関わる薬剤							
		アデノシンに関わる薬剤							
		その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤							
		核内転写過程の調節に関わる薬剤							
	IgE 抗体に関わる薬剤								
	補体に関わる薬剤								
	サイトカインに関わる薬剤	抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤							
		炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤							
		その他のサイトカインに関わる薬剤							
	ケモカインに関わる薬剤	CC ケモカインに関わる薬剤							
		CXC ケモカインに関わる薬剤							
		その他のケモカインに関わる薬剤							
	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤	脂質メディエーターに関わる薬剤							
		起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤							
その他の化学伝達物質に関わる薬剤									
神経ペプチドに関わる薬剤	タキキニンに関わる薬剤								
	その他の神経ペプチドに関わる薬剤								
複数の作用機序に関わる薬剤									
その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤									
作用点非特定の薬剤									
新規適応範囲の特定									
製剤の改良	送達方法の開発	2	2	1					
	組成の改良		4	1	3				
	結晶型検討・合成法改良								
	その他の製剤の改良		1						
工程簡略化									

1.4.5 抗アレルギー剤の疾患別出願動向

アレルギー剤の代表的な適応症である気管支喘息、アレルギー性鼻炎、アレルギー性皮膚炎に対して、該当する特許を抽出し疾患別出願動向を調査した。

医薬品においての特許出願は、研究の初期段階で出願されるため、可能な限り対象疾患を広く権利化するために、特許に記載される対象疾患は複数記載されることが多い。そのため、疾患別解析は、延べ数でカウントした。

表 1.4.5-1 に抗アレルギー剤の疾患別に見た特許件数に関する解析結果を記載する。延べ数として解析した結果では、気管支喘息に関する出願が特に多い。その他のアレルギー性疾患とは、上記3つの疾患名の明記がなく、総称として抗アレルギー剤と総称的に書かれている特許を指す。

図 1.4.5-1 に抗アレルギー剤の技術要素と対象疾患との分布の結果を示す。どの疾患に対しても、合成医薬品、特に複素環式に関する特許出願が多くみられた。アレルギー性皮膚炎に関しては、天然物医薬品（植物・微生物・動物各宿主）や生薬など、合成医薬品以外の構造の割合が多いのが特徴である。

図 1.4.5-2 に抗アレルギー剤の対象疾患と課題の分布を示した。分布としては、気管支喘息、アレルギー性鼻炎、アレルギー性皮膚炎、どの疾患においても「新規作用点に関わる薬剤開発」に対して集中的に出願がなされており、その中でも「炎症系に作用する薬剤開発」が一番多い。また、3つのどの疾患においても「既知作用点に対する薬剤開発」においては、「炎症系に作用する薬剤開発」が多い。

表 1.4.5-1 抗アレルギー剤の疾患別にみた特許件数

対象疾患	件数
気管支喘息	1,218 件
アレルギー性鼻炎	910 件
アレルギー性皮膚炎	953 件
その他のアレルギー性疾患	622 件

図 1.4.5-1 抗アレルギー剤の技術要素と対象疾患との分布

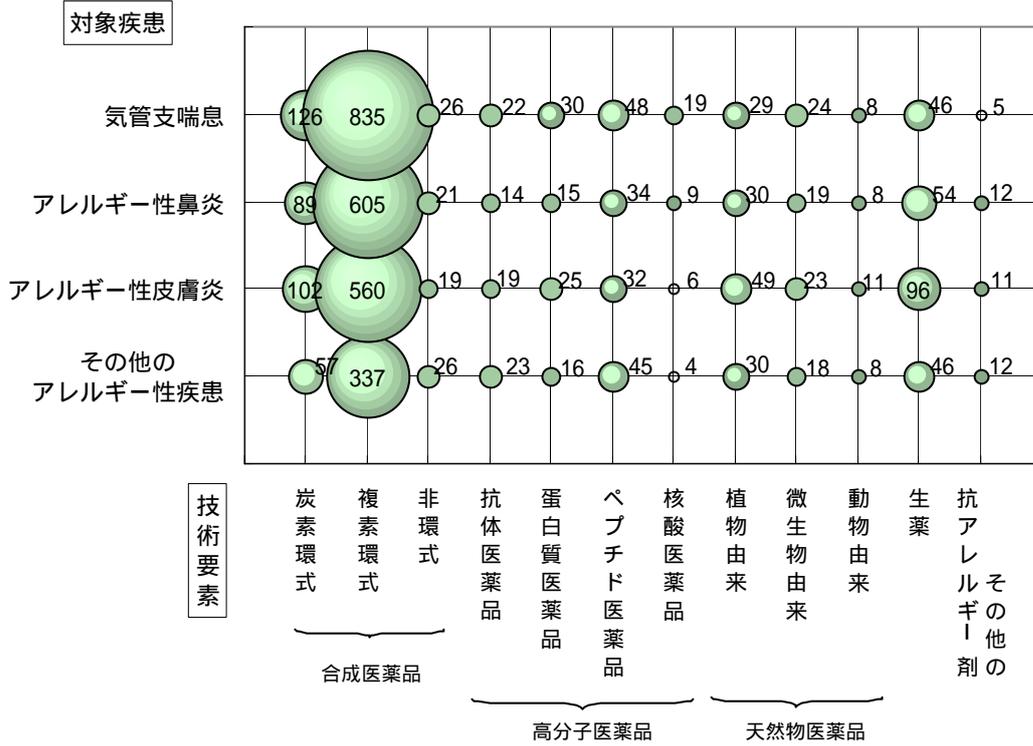
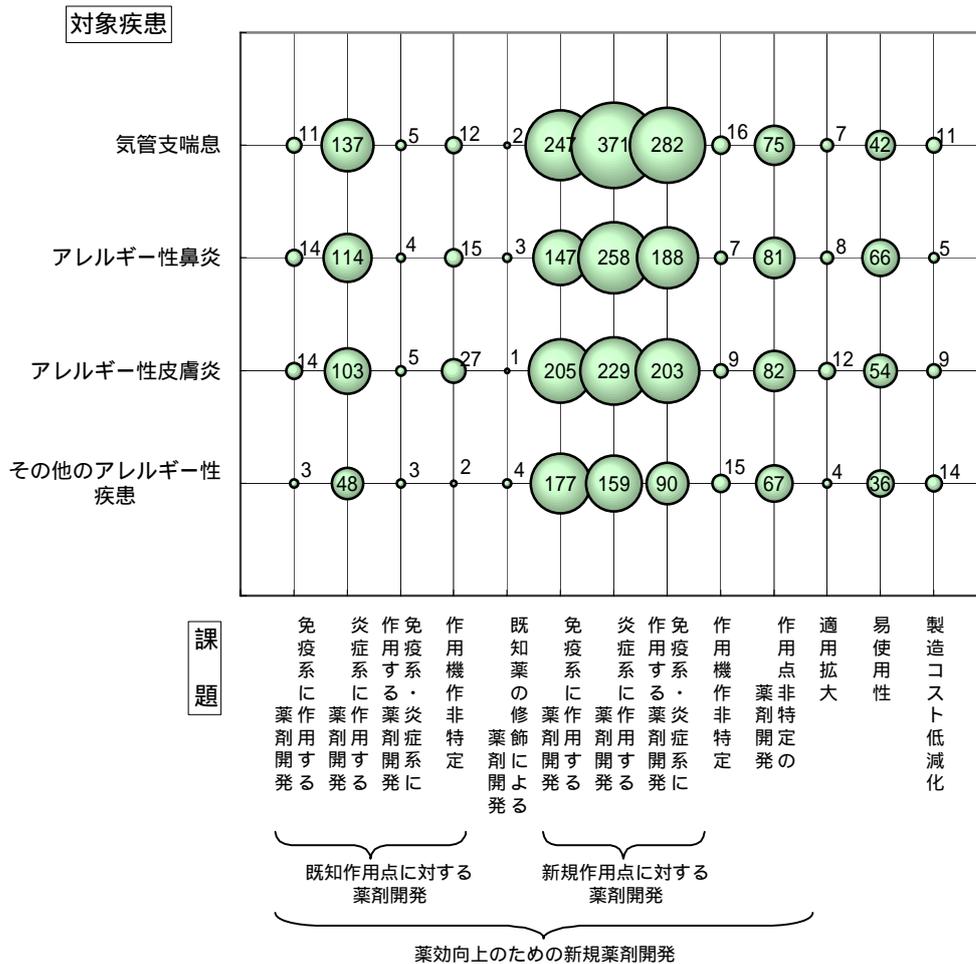


図 1.4.5-2 抗アレルギー剤の対象疾患と課題の分布



(1993年1月～2003年12月の出願)

1.5 注目される特許

1.5.1 注目される特許の抽出

ここでは、本チャートが対象とする特許等において、①出願人自身により引用された文献公知発明、②特許公報・公告公報上に参考文献として掲載された特許文献、および③特許庁審査官の拒絶理由通知書に記載された先行技術文献の中で、引用頻度が高い特許・実用新案（外国特許および1993年以前の出願を含む）を紹介する。

表 1.5.1 に示す特許は、9回以上引用のあったものである。引用回数が多い特許は、細胞接着因子である VLA-4 や炎症における化学伝達物質に関わる因子である起炎性キマーゼ、第二メッセンジャーに関わる因子である PDE4 などである。上位 10 位（計 13 特許）のうち、日本の会社は 4 社（5 特許）であり、海外の出願人による特許の引用が目立っている。

表 1.5.1 抗アレルギー剤の注目される特許 (1/6)

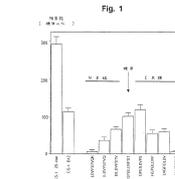
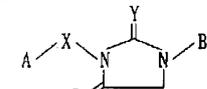
No	被引用特許文献番号 出願人 発明の名称 出願日 (対応日本特許)	被引用回数	自社特許数	他社特許数	引用した特許の出願人	概要
1	W095/015973 CYTEL (米国) CS-1 PEPTIDOMIMETICS, COMPOSITIONS AND METHODS OF USING THE SAME 94.12.05 (特表平 9-509146)	16	0	16	メルクアンドコー (4) サノフィ・アベンティス (3) ヘキスト (3) テキサスバイオテクノロジー (2) ヘキストマリオンセル (2) エンサインプ PHARM (1) ジエノメッドエルエルシー (1)	炎症白血球上で発現した VLA-4 レセプターと、免疫炎症疾患状態に関連する内皮細胞上で発現したフィブロネクチン CS-1 ペプチドとの間の結合を阻害するペプチド、その薬学的組成物および結合阻害ペプチドを用いた免疫炎症症状を治療するプロセスが開示される。 
1	W096/006108 CYTEL (米国) CYCLIC CS-1 PEPTIDOMIMETICS, COMPOSITIONS AND METHODS OF USING THE SAME 95.08.25	16	0	16	メルクアンドコー (4) サノフィ・アベンティス (3) ヘキスト (3) テキサスバイオテクノロジー (2) ヘキストマリオンセル (2) エンサインプ PHARM (1) ジエノメッドエルエルシー (1)	本発明は、炎症性白血球上に発現する VLA-4 受容体と、免疫炎症疾患状態に関与する頸管内膜細胞上に発現するフィブロネクチン CS-1 との結合を阻害する環状ペプチド及び、免疫炎症疾患状態の治療法に関する。
3	W096/004248 サントリー IMIDAZOLIDINE DERIVATIVE AND USE THEREOF 95.07.26 (特願平 7-528847)	15	0	15	帝人 (5) 塩野義製薬 (2) 千寿製薬 (2) トーアエイヨー (1) 三菱化学 (1) 第一製薬 (1) 明治製菓 (1) 明治製菓、帝人 (1) 湧永製薬 (1)	下記で表されるイミダゾリジン誘導体、これを有効成分とするキマーゼ阻害剤およびこれを有効成分とするアンジオテンシン II 生産の異常昂進に起因する心臓・循環器系疾患の予防・治療剤に代表される医薬に関する。 

表 1.5.1 抗アレルギー剤の注目される特許 (2/6)

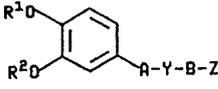
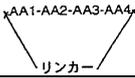
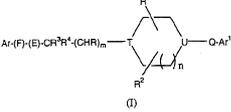
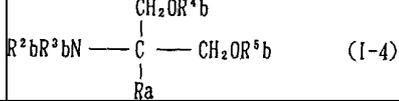
No	被引用特許文献番号 出願人 発明の名称 出願日 (対応日本特許)	被引用回数	自社特許数	他社特許数	引用した特許の出願人	概要
4	W094/012461 PFIZER (米国) CATECHOL DIETHERS AS SELECTIVE PDEIV INHIBITORS 93.10.29 (特許 3100984)	14	0	14	アルタナファルマ(6) ジャンセン PHARM(2) ユーロセルテック(2) 協和醗酵工業(2) 大鵬薬品工業(1) 日研化学(1)	本発明は、ホスホジエステラーゼ(PDE) IV 型の選択的阻害物質である 4-置換カテコールジエーテル化合物に関する。エイズ、喘息、関節炎、気管支炎、慢性閉塞性気道疾患、乾せん、アレルギー性鼻炎、皮膚炎およびおよび他の炎症性疾患の治療に有用である。  (I)
5	W096/020216 ZENECA (イギリス) FIBRONECTIN ADHESION INHIBITORS 95.12.21 (特許 3248584)	13	0	13	メルクアンドコー(4) サノフィ・アベンティス(3) ヘキスト(3) ヘキストマリオンセル(2) ジェノメッドエルエルシー(1)	下記の環状ペプチド。このペプチドは、血管細胞接着分子-1とインテグリンの非常の後の抗原 4 を有するフィブロネクチンとの相互作用を抑制し、かつ例えば関節リウマチ又は多発性硬化の治療の使用を含む。 
6	EP903349 F. HOFFMANN-LA ROCHE (スイス) CCR-3 receptor antagonists 98.08.10 (特許 3014367)	11	3	8	エフホフマンラロシュアント(3) 帝人(3) グラクソ・スミスクライン(2) アステラス製薬、東レ(2) ブリistolマイヤーズスクイブファーマ(1)	CCR-3 受容体アンタゴニストである、下記で表される環状アミン誘導体、及びそれを含有する医薬組成物、それらの用途と製法に関する。喘息のような好酸球誘導疾患の治療に有用である。  (I)
6	W094/008943 三菱ウェルファーマ 2-AMINO-1,3- PROPANEDIOL COMPOUND AND IMMUNOSUPPRESSANT 93.10.18 (特許 2579602)	11	2	9	杏林製薬(5) 三共(4) メルクアンドコー(3) 三菱ウェルファーマ(2)	式(1-4)で表される 2-アミノ-1,3-プロパンジオール化合物またはその塩からなる免疫抑制剤。自己免疫疾患、リウマチ、乾癬またはアトピー性皮膚炎、気管支喘息または花粉症の治療/予防に有効。  (I-4)
6	W096/022966 BIOGEN (米国) CELL ADHESION INHIBITORS 96.01.18 (特表平 10-513160)	11	0	11	テキサスバイオテクノロジー(2) 科研製薬(2) アストラゼネカ(1) エンサイシブ PHARM(1) バイエル(1) アステラス製薬(1)	本発明は、細胞接着および細胞接着媒介性の病状の阻害および予防に対して有用な新規の化合物およびその使用に関する。これらの化合物は特に多くの炎症および自己免疫疾患の処置に対して非常に適切である。
6	W098/004554 萬有製薬 CHEMOKINE RECEPTOR ANTAGONISTS 97.07.23 (特願平 10-508681)	11	0	11	帝人(3) テリック、三和化学研究所(2) 三菱ウェルファーマ(2) アステラス製薬、東レ(2) 大正製薬(1) 東レ、アステラス製薬(1)	空気清浄フィルターの担体の表面に、酵素を固定化させることにより、従来のフィルターでは困難であった空中に浮遊する微生物を直接殺菌浄化でき、フィルター上に捕集した微生物をも殺菌・滅菌除去することができる。

表 1.5.1 抗アレルギー剤の注目される特許 (3/6)

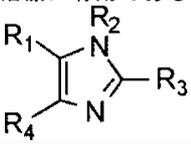
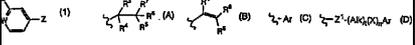
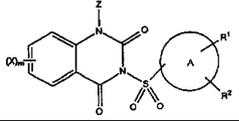
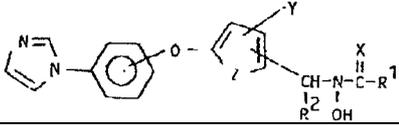
No	被引用特許文献番号 出願人 発明の名称 出願日 (対応日本特許)	被引用回数	自社特許数	他社特許数	引用した特許の出願人	概要
10	W093/014081 SMITHKLINE BEECHAM (イギリス) IMIDAZOLE DERIVATIVES AND THEIR USE AS CYTOKINE INHIBITORS 93.01.13 (特許 3298641)	10	0	10	武田薬品工業(6) アムジエン(2) ジョンソン・エンド・ジョンソン (1) メルクル(1)	下記(I)で表されるイミダゾール誘導体化合物。炎症性サイトカイン介在疾患の治療に有用である。  (I)
10	W094/015958 田辺製薬 PEPTIDE INHIBITORS OF CELL ADHESION 94.01.07 (特表平 8-505628)	10	0	10	サノフィ・アベンティス(3) ヘキスト(3) ヘキストマリオンセル(2) ジェノメッドエルエルシー(1) バイオジェン(1)	内皮細胞への白血球の接着に加えてフィブロネクチンに関連する接着を含む、細胞接着の制御に有用である環状インテグリン受容体拮抗薬を開示する。またその合成し、検査、製剤化、及び治療薬としての使用方法も開示する。 
10	W095/035283 CELLTECH THERAPEUTICS (イギリス) TRI-SUBSTITUTED PHENYL DERIVATIVES USEFUL AS PDE IV INHIBITORS 95.06.21 (特表平 10-503174)	10	1	9	メルクアンドコー(4) 協和醗酵工業(2) サノフィ・アベンティス(1) セルテックセラピューティックス(1) ロレアル(1) ファイザー(1)	PDE IV インヒビターとして有用なトリ置換フェニル誘導体で、下記の化合物、その塩、溶媒和物、水和物、プロ薬物および N-オキシドが記載されている。 
10	W097/011941 サントリー QUINAZOLINE DERIVATIVES AND USE THEREOF 96.09.27 (特願平 9-513296)	10	0	10	帝人(5) 千寿製薬(2) トーアエイヨー(1) 第一製薬(1) 湧永製薬(1)	下記で示されるキナゾリン誘導体もしくはその塩並びにそれらを有効成分とするキマーゼ阻害剤及び、Ang II 産生の異常昂進に起因する心臓・循環器系疾患の予防・治療剤。 
14	特開平 6-9571 グリュネンター イミダゾリルフェノール誘導体、これを含有する薬剤並びにこの化合物及び薬剤を製造する方法 92.02.17	9	0	9	日研化学(9)	下記で表される 3-又は 4-(1H-イミダゾール-1-イル)フェノール誘導体、その塩、これを含有する薬剤、並びにそれらの製造方法。本化合物は無毒性で、5-リボキシゲナーゼ及びトロンボキサシンターゼを同時に阻害することができ、喘息の予防、治療に有用。 

表 1.5.1 抗アレルギー剤の注目される特許(4/6)

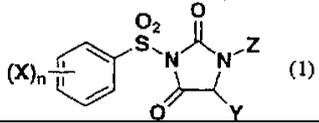
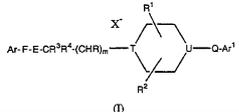
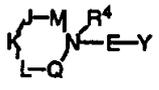
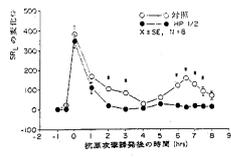
No	被引用特許文献番号 出願人 発明の名称 出願日 (対応日本特許)	被引用回数	自社特許数	他社特許数	引用した特許の出願人	概要
14	特許 3310687 エーザイ キノン誘導体 91.03.11	9	0	9	日研化学(9)	下記(1a)または式(IIa)で表されるキノン誘導体またはその塩、及びそれらを有効成分とする5-リボキシゲナーゼ阻害剤、トロンボキサン合成酵素阻害剤。喘息あるいは肝疾患の予防・治療に有用。 $A-CH=C-B \quad (I)$ 〔式中、Aは式  〕 (式中 R ² , R ³ , R ⁴ は同一または
14	特許 3537231 サントリー ヒダントイン誘導体およびその用途 95.07.24	9	0	9	帝人(5) 千寿製薬(2) 第一製薬(1) 湧永製薬(1)	下記(1)で表されるヒダントイン誘導体およびそれを有効成分とする、キマーゼ阻害を作用機作とする、アンジオテンシン I Ⅰ生産の異常昂進に起因する心臓・循環器系疾患の予防・治療剤。  (1)
14	W000/031033 F. HOFFMANN-LA ROCHE (スイス) PIPERIDINE CCR-3 RECEPTOR ANTAGONISTS 99.11.08 (特許 3421323)	9	0	9	帝人(3) グラクソ・スミスクライン(2) 三菱ウエルファーマ(2) アステラス製薬、東レ(2)	本発明は、CCR-3 受容体拮抗薬である、下記のピペリジン第四級塩、それを含有する製剤組成物、それを用いる方法、及びこれらの化合物の製造方法に関する。  (I)
14	W000/035877 DU PONT (米国) PHARMACEUTICALS HETEROCYCLIC PIPERIDINES AS MODULATORS OF CHEMOKINE RECEPTOR ACTIVITY 99.12.17	9	0	9	帝人(3) アストラゼネカ AB(2) グラクソ・スミスクライン(2) アステラス製薬、東レ(2)	下記で表される CCR3 調節剤、またはその薬学的に許容できる塩。本発明の化合物は喘息及び他のアレルギー疾患の阻害剤として有用である。 
14	W093/013798 BIOGEN(米国) TREATMENT FOR ASTHMA 93.01.12 (特開 2003-176239; 特表平 7-506091)	9	0	9	サノフィ・アベンティス(3) ヘキスト(3) ヘキストマリオンセル(2) ジエノメッドエルエルシー(1)	抗体、ポリペプチド、又は VLA-4 を認識する他の分子、好酸球のような白血球の表面に発現する蛋白質を投与することによる喘息の治療方法。 
14	W093/015764 BIOGEN(米国) TREATMENT FOR INFLAMMATORY BOWEL DISEASE 93.02.02 (特開 2004-002472; 特表平 7-506566)	9	0	9	サノフィ・アベンティス(3) ヘキスト(3) ヘキストマリオンセル(2) ジエノメッドエルエルシー(1)	VLA-4 (大抵の種類の白血球で発現されて消化管における内皮および他の組織への白血球付着に関与する表面分子)を認識する抗体、ポリペプチドまたは他の分子を投与することからなる、炎症性腸病 (IBD) の処置方法。

表 1.5.1 抗アレルギー剤の注目される特許 (5/6)

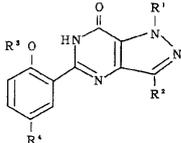
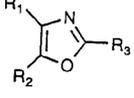
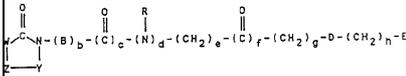
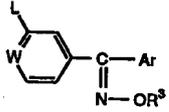
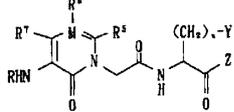
No	被引用特許文献番号 出願人 発明の名称 出願日 (対応日本特許)	被引用回数	自社特許数	他社特許数	引用した特許の出願人	概要
14	W094/028902 PFIZER(米国) PYRAZOLOPYRIMIDINONES FOR THE TREATMENT OF IMPOTENCE 94.05.13 (特開平 11-263728; 特開平 11-286444; 特開 2005-097304; 特許 2925034)	9	0	9	メルク (8) シェリング・プラウ (1)	下記の化合物又はその塩又はその医薬組成物。本剤による勃起機能不全の治療的又は予防的処置方法、及びそれらの医薬品の製造と使用。 
14	W095/013067 SMITHKLINE BEECHAM (イギリス) OXAZOLES FOR TREATING CYTOKINE MEDIATED DISEASES 94.11.08 (特表平 9-505055)	9	0	9	武田薬品工業 (6) 塩野義製薬 (2) バイエル (1)	下記 (I) で示される新規オキサゾール化合物並びにその希釈剤または担体からなる医薬組成物、及び本発明の化合物を用いる、哺乳動物におけるサイトカインの阻害方法およびサイトカイン媒介疾患の治療方法にも関する。 
14	W095/014008 CASSELLA (ドイツ) SUBSTITUTED 5-RING HETEROCYCLES, THEIR PREPARATION AND THEIR USE 94.10.24 (特表平 9-505062)	9	0	9	サノフィ・アベンティス (3) ヘキスト (3) ヘキストマリオンセル (2) ジェノメッドエルエルシー (1)	本発明は、下記の 5-環状ヘテロ環類、その製造方法及びこれを血小板凝集、癌細胞の転移及び骨表面での食骨細胞形成の阻害物質として使用する方法に関する。 
14	W095/019790 ATHENA NEUROSCIENCES (米国) HUMANIZED ANTIBODIES AGAINST LEUKOCYTE ADHESION MOLECULE VLA-4 95.01.25 (特表 2000-500501; 特表平 9-508272)	9	0	9	サノフィ・アベンティス (3) ヘキスト (3) ヘキストマリオンセル (2) ジェノメッドエルエルシー (1)	本発明は、VLA-4 リガンドに対して特異的に結合するヒト化免疫グロブリン及び、これを用いた治療方法を提供する。これらの方法は、多発性硬化症の治療のために特に有用である。 
14	W096/000215 CELLTECH THERAPEUTICS (イギリス) SUBSTITUTED OXIME DERIVATIVES USEFUL AS PDE IV INHIBITORS 95.06.23	9	0	9	メルクフロストカナダアンド (3) メルク (2) 協和醗酵工業 (2) サノフィ・アベンティス (1) ロリアル (1)	下記で表される置換オキシム誘導体で、これらはフォスホジエステラーゼ IV の阻害剤であり、予期しない炎症応答または筋痙攣を伴う喘息等の治療に有効である。 

表 1.5.1 抗アレルギー剤の注目される特許 (6/6)

No	被引用特許文献番号 出願人 発明の名称 出願日 (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
14	W096/000581 TEXAS BIOTECHNOLOGY (米国) PROCESS TO INHIBIT BINDING OF THE INTEGRIN ALPHA 4 BETA 1 TO VCAM-1 OR FIBRONECTIN 95.06.27 (特表平 10-502349)	9	0	9	サノフィ・アベンティス (3) ヘキスト (3) ヘキストマリオンセル (2) ジエノメッドエルエルシー (1)	本発明は、CS1 ペプチドの一部をモデルとして作られる、5～約 13 個の残基の単離精製した環状ペプチドに関し、 $\alpha 4 \beta 1$ インテグリンの、VCAM-1、フィブロネクチンまたはインペシンのタンパク質への結合を選択的に阻害する方法を提供する。
14	W096/033974 緑十字 HETEROCYCLIC AMIDE COMPOUNDS AND MEDICINAL USE OF THE SAME 96.04.26 (特願平 8-532376)	9	0	9	帝人 (5) 千寿製薬 (2) 第一製薬 (2)	下記で表される複素環式アミド化合物またはその塩、その医薬組成物、および医薬用途。この複素環式アミド化合物およびは、優れたキマーゼ阻害作用を有し、経口および非経口投与が可能。アンジオテンシン II に起因する各種疾患等、キマーゼに起因する疾患の予防・治療に有用。 

※被引用特許文献の出願人名表示は、特許公報に準じて表記した。

1.5.2 注目される特許の課題・解決手段対応の出願人

表 1.5.2 に注目される特許の課題と解決手段および被引用回数を示す。

アレルギーに関する様々な作用メカニズムを標的として、種々の構造を有する物質（合成あるいは天然物由来の化合物、ペプチド、蛋白質・抗体など）について、抗アレルギー剤の研究開発が行われている。医薬品は基本的に薬効をあらわす物質を特定した「物質特許」で規定されるため、全ての抗アレルギー剤に影響を及ぼす「基本特許」は特定しにくい。特許出願から医薬品の臨床試験までは 10 年程度必要とされ、またその過程で多くがドロップアウトしていく。医薬品における基本特許は、臨床試験において薬効が認められたときに生じるといえる。表 1.5.2 で示した「注目される特許」は、あくまでも本調査の範囲内で被引用回数が多い特許を採り上げており、今後これらの特許がどのようなインパクトを持つか現時点では予測できない。

表 1.5.2 注目される特許の課題と解決手段および被引用回数

解決手段	課題	新規作用点に対する薬剤開発			件数 被引用 回数
		免疫系に作用する 薬剤開発	炎症系に作用する 薬剤開発	免疫系・炎症系に 作用する薬剤開発	
T細胞の機能調節に関わる 薬剤	W094/008943 三菱ウエルファーマ [11回]				1件 11回
細胞接着過程の調節に関わ る薬剤	W096/020216 ZENECA [13回] W095/019790 ATHENANEUROSCIENCES [9回] W096/022966 BIOGEN [11回] W095/015973 CYTEL [16回] W096/000581 TEXASBIOTECHNOLOGY [9回] W094/015958 田辺製薬 [10回]			W096/006108 CYTEL [16回]	7件 84回
第二メッセンジャー過程の 調節に関わる薬剤		W095/035283 CELLTECHTHERAPEUTICSLIM ITED [10回]	W096/000215 CELLTECHTHERAPEUTICS [9回] W094/012461 PFIZER [14回]		3件 33回
サイトカインに関わる薬剤		W093/014081 SMITHKLINEBEECHAM [10回]			1件 10回
ケモカインに関わる薬剤			W000/035877 DUPONTPHARMACEUTICALS [9回] EP903349 F. HOFFMANN-LAROCHE [11回] W000/031033 F. HOFFMANN-LAROCHEAG [9回]		3件 29回
炎症における化学伝達物質 に関わる薬剤		特許 3310687 エーザイ [9回] 特開平 6-9571 グリュネンタール [9回] W096/033974 緑十字 [9回]	特許 3537231 サントリー [9回]		4件 36回
その他の新規作用メカニズ ムに関わる薬剤	W093/013798 BIOGEN [9回]				1件 9回
件数 回数	8件 77回	5件 47回	7件 77回		

※被引用特許文献の出願人名表示は、特許公報に準じて表記した。

1.5.3 注目される特許の関連図

抗アレルギー剤において引用回数の多い3つの特許（W095/015973、W0096/00618、W096/004248）に関して、引用関係を図 1.5.3-1～図 1.5.3-3 に示す。

W095/015973 は、解決手段が「新規作用メカニズムの薬剤開発」であり、標的としては細胞接着因子である VLA-4 アンタゴニストに関する米国ベンチャー企業であるサイテル社の特許である。なお、このサイテル社は、細胞接着因子に関する薬剤開発を行っていたが、1990 年終わりに、臨床試験の失敗により、薬剤開発を中断している。引用しているのは、ヘキスト、メルクアンドコー、サノフィ・アベンティスなどの大手製薬企業である。

W0096/00618 も W095/015973 と同様サイテル社が出願している細胞接着因子に関する特許である。この特許を引用している会社は、W095/015973 とまったく同様である。

W096/004248 は、「新規作用メカニズムの薬剤開発」であり炎症における化学伝達物質に関わる因子である起炎性キマーゼに対する特許である。サントリー社が出願している。引用は、帝人、塩野義製薬他、全て日本の企業である。

図 1.5.3-1 特許 W095/015973 の引用関連図 (1/2)

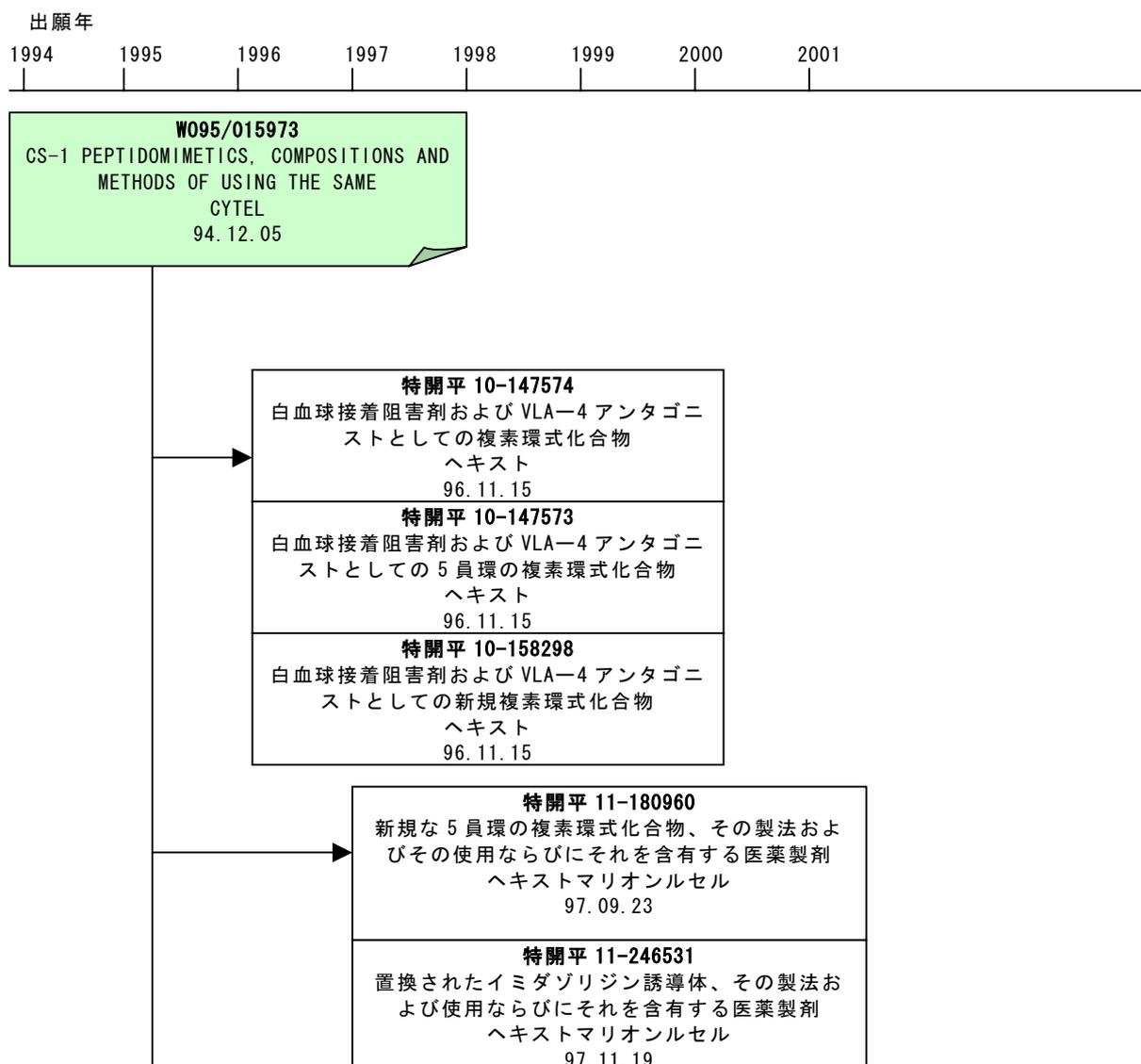


図 1.5.3-2 特許 W096/006108 の引用関連図 (1/2)

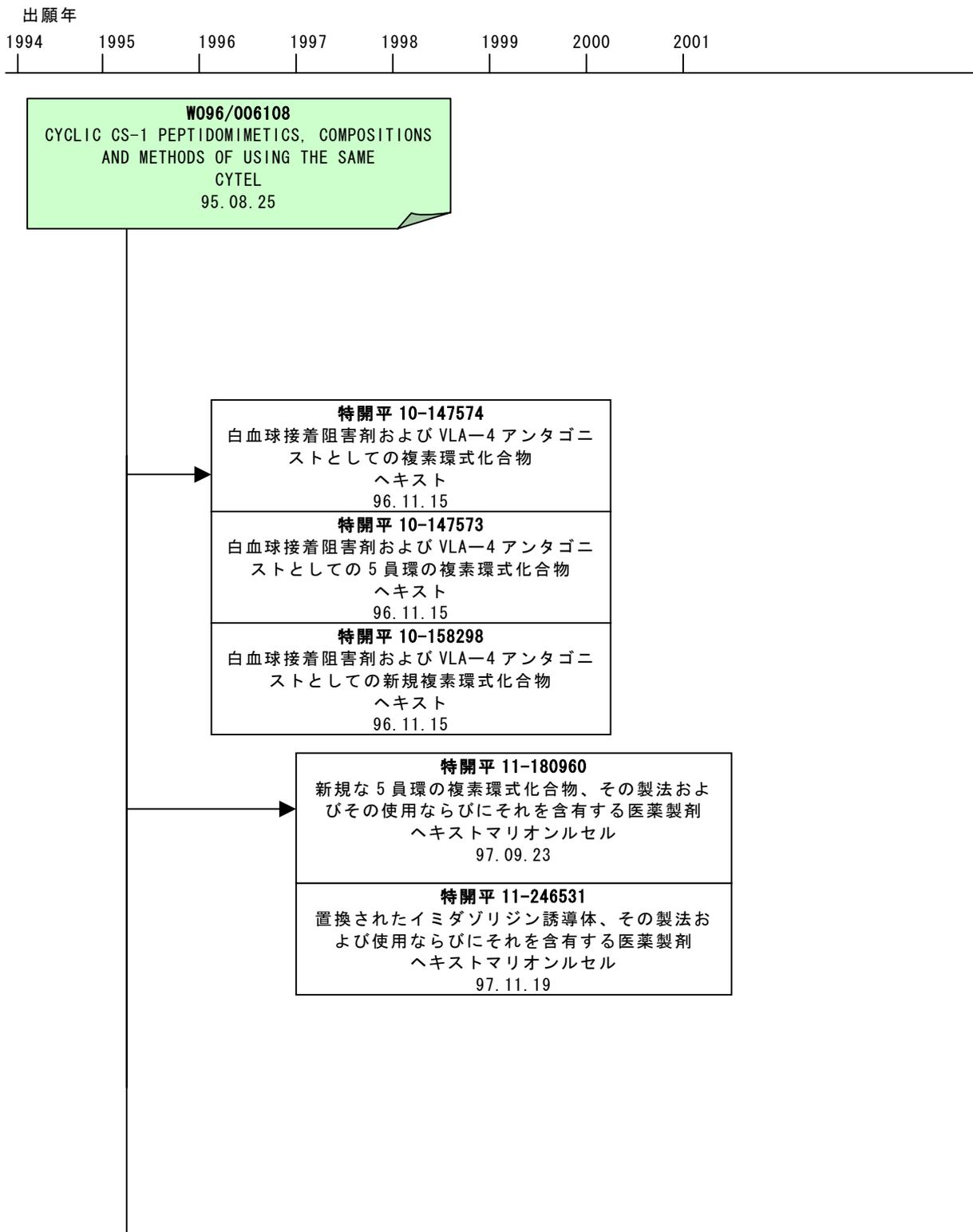


図 1.5.3-3 特許 W096/004248 の引用関連図 (1/2)

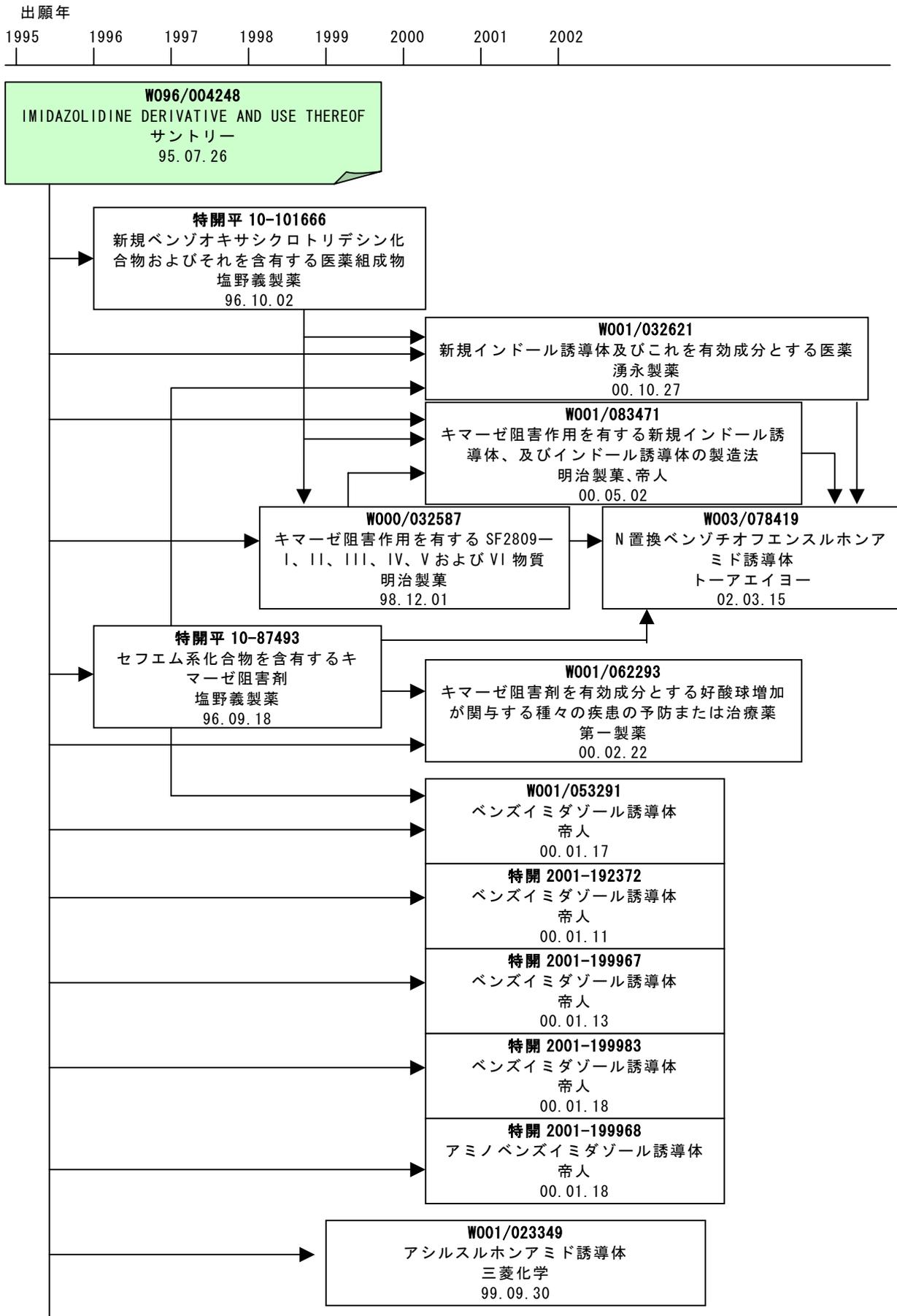
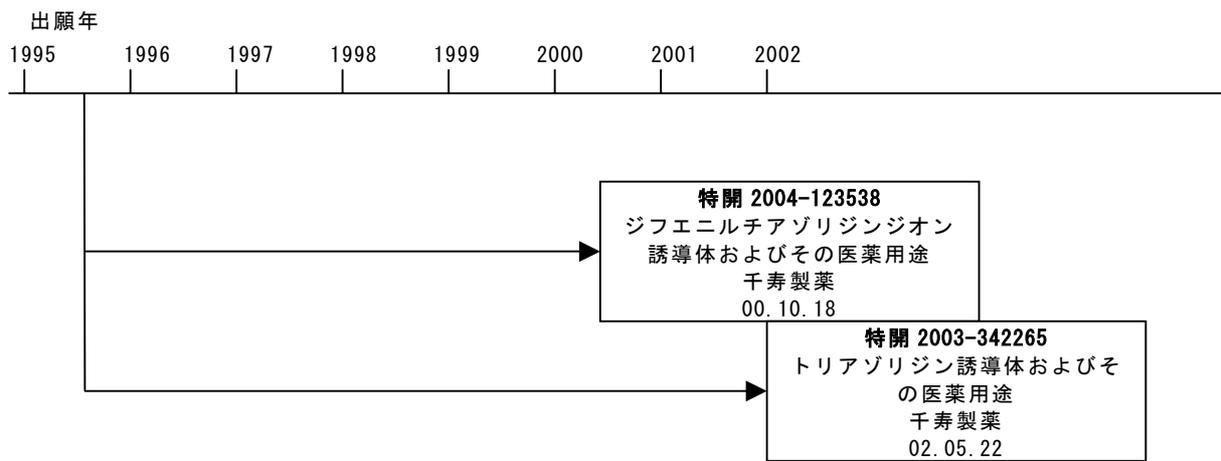


図 1.5.3-3 特許 W096/004248 の引用関連図 (2/2)



2. 主要企業、大学・公的研究機関等の 特許活動

- 2.1 ファイザー（米国）
- 2.2 グラクソ・スミスクライン（イギリス）
- 2.3 シェリング・プラウ（米国）
- 2.4 武田薬品工業
- 2.5 アストラゼネカ（イギリス）
- 2.6 三共
- 2.7 大正製薬
- 2.8 サノフィ・アベンティス（フランス）
- 2.9 ベーリンガーインゲルハイム（ドイツ）
- 2.10 メルクアンドコー（米国）
- 2.11 アステラス製薬
- 2.12 協和醗酵工業
- 2.13 小野薬品工業
- 2.14 三菱ウェルファーマ
- 2.15 ジョンソン・エンド・ジョンソン（米国）
- 2.16 バイエル（ドイツ）
- 2.17 メルク（ドイツ）
- 2.18 大日本住友製薬
- 2.19 日研化学
- 2.20 イーライリリーアンドカンパニー（米国）
- 2.21 塩野義製薬
- 2.22 大学・公的研究機関等
- 2.23 主要企業等以外の特許番号一覧

2. 主要企業、大学・公的研究機関等の特許活動

出願上位企業は、20位まで全て日本国内外の製薬企業、（一部製薬部門を持つ化学企業を含む）である。上位出願人21社のうち海外企業は約半数、また海外からの出願も多い。出願上位企業21社の出願件数は909件であり、このうち登録特許は103件、係属中の特許は746件である。
大学・公的研究機関からの出願は、最高9件である。

抗アレルギー剤に関する出願件数の多い企業について、企業ごとに企業の概要、主要製品・技術の分析を行う。表1.3.1-1に示した中から主要企業21社(表2)を選出し、主要21社の特許出願・実用新案登録出願の解析を行う。

最近11年間の抗アレルギー剤に関する出願件数は2,188件で、主要企業21社の出願件数は909件であり、全体の42%になる。主要企業21社の出願件数909件の内訳は、登録特許が103件、実用新案登録はない。

また、主要企業21社以外の特許・登録リストを2.23に技術要素別に解析して示す。主要企業21社以外の出願件数は1,279件であり、全体の58%を占めているが、その内登録特許が85件、実用新案登録はない。

これら主要企業21社、主要大学・公的研究機関および主要企業21社以外の特許要素別課題対応特許リストのうち、登録特許については概要と図を付加した。各社の製品例は、抗アレルギー剤および抗アレルギー剤と関連の深い治療薬を合わせ、広義の抗アレルギー剤として示した。具体的には、抗アレルギー剤、抗ヒスタミン剤、アレルギー性鼻炎剤、アレルギー性皮膚治療薬などである。

なお、主要企業21社の代表的な開発拠点を、特許公報を元に会社情報より入手して記載した。経過情報については、2006年1月末の状況を掲載しており、最近特許になったものは特許番号のみを表示している。

表2 抗アレルギー剤の主要出願人

No.	主要出願人	出願件数	No.	主要出願人	出願件数
1	ファイザー(米国)	120	12	協和醗酵工業	34
2	グラクソ・スミスクライン(イギリス)	113	13	小野薬品工業	33
3	シェリング・プラウ(米国)	64	14	三菱ウェルファーマ	31
4	武田薬品工業	59	15	ジョンソン・エンド・ジョンソン(米国)	26
5	アストラゼネカ(イギリス)	47	15	バイエル(ドイツ)	26
6	三共	45	15	メルク(ドイツ)	26
7	大正製薬	43	18	大日本住友製薬	25
8	サノフィ・アベンティス(フランス)	39	18	日研化学	25
9	ベーリンガー・インゲルハイム(ドイツ)	38	20	イーライリリー・アンドカンパニー(米国)	22
10	メルク・アンド・コー(米国)	36	20	塩野義製薬	22
11	アステラス製薬	35		合計	909

2.1 ファイザー（米国）

2.1.1 企業の概要

商号	Pfizer Inc.
本社所在地	2.25 East 42 nd Street, New York, NY 10017, U.S.A.
設立年	1849年
資本金	N/A
従業員数	約115,000名（連結：2004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 Warner-Lambert、03年に Pharmacia を買収して、世界有数の医薬品メーカーとなっている。

解析にはファイザー名義の出願のほか、「ファイザープロダクツ（Pfizer Products）」、ファイザーの買収した「ジーディーサール（G.D.Searle）」、「ファルマシアアンドアップジョン（Pharmacia & Upjohn）」、「ワーナーランバート（Warner-Lambert）」名義の出願を統合して解析を行った。

主力製品には「LIPITOR」（高コレステロール血症薬）、「Zolofit」（選択的セロトニン再取り込み阻害剤）、「Genotropin」（成長ホルモン欠損症などが適応の組換え成長ホルモン製剤）、「SOMAVERT」（末端肥大症適応の成長ホルモン受容体拮抗剤）などがある。（出典：<http://www.pfizer.com/>）

2.1.2 製品例

現在、抗アレルギー剤関連製品はない。

2.1.3 技術開発拠点と研究者

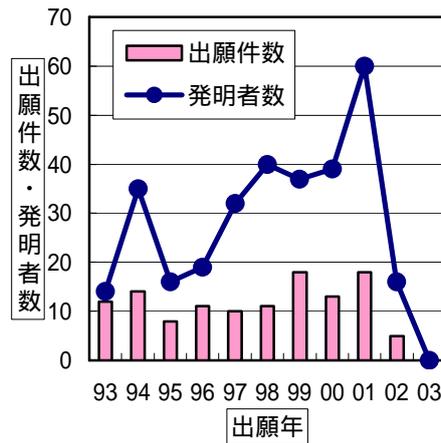
開発拠点：米国

研究者数：12,500名

図 2.1.3 にファイザーの抗アレルギー剤の出願件数と発明者数の年次推移を示す。

出願件数は98年まで10件程度であるが99年より20件弱と増加、それにともなって発明者数も40名以上に増加している。01年以降は国際出願のため未公表となっているが継続的に出願がおこなわれているものと考えられる。

図 2.1.3 ファイザーの抗アレルギー剤の出願件数と発明者数

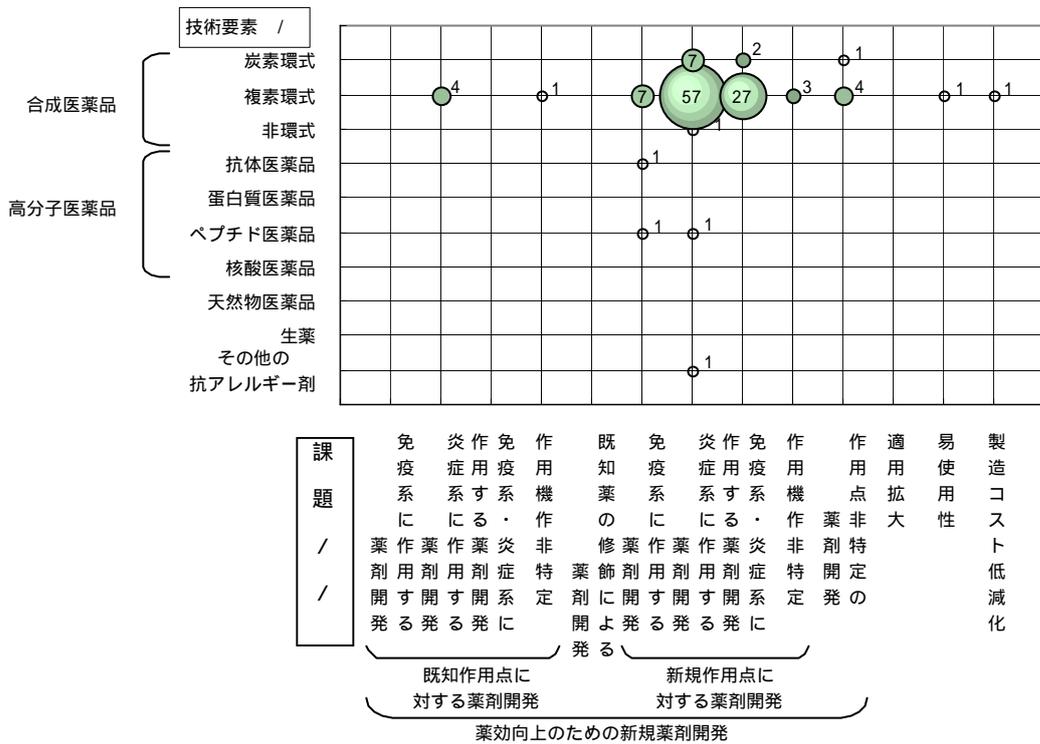


2.1.4 技術開発課題対応特許の概要

図 2.1.4-1 に抗アレルギー剤に対する技術要素と課題の分布を示す。

ファイザーでは合成医薬品の開発が主流であり、化合物としては複素環式化合物が 57 件と圧倒的に多い。また、抗アレルギー剤開発戦略としては新規作用点に対する薬剤開発、なかでも炎症系に作用する薬剤開発に力点をとおいていると考えられる。

図 2.1.4-1 ファイザーの抗アレルギー剤の技術要素と課題

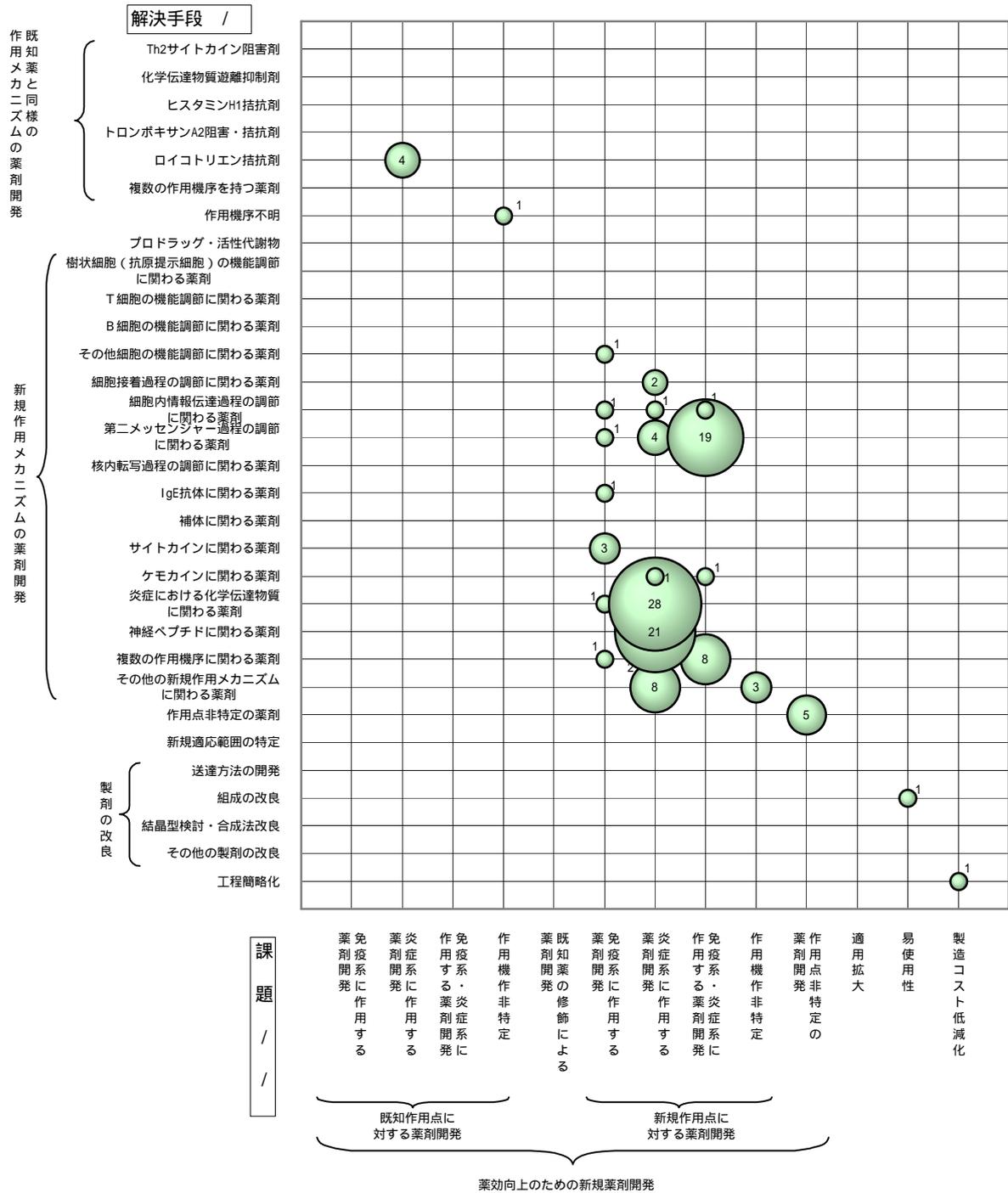


(1993年1月～2003年12月の出願)

図 2.1.4-2 に抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布を示す。

「既知作用点に対する薬剤開発」に対しては「炎症系に作用する薬剤開発」(ロイコトリエン拮抗剤)で対応するものが4件、「新規作用点に対する薬剤開発」については、「炎症系に作用する薬剤開発」が多く、そのうち「炎症における化学伝達物質に関わる薬剤」(5-リポオキシゲナーゼ阻害剤、シクロオキシゲナーゼ-2阻害剤、マトリックスメタロプロティナーゼ阻害剤、ブラジキニン拮抗剤)で対応しているものが28件、「神経ペプチドに関わる薬剤」(タキキニン拮抗剤、サブスタンスP拮抗剤)で対応しているものが21件である。「免疫系・炎症系に作用する薬剤開発」については、「第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤」(PDE4およびそのアイソザイム阻害剤)が19件である。

図 2.1.4-2 ファイザーの抗アレルギー剤の課題と解決手段の分布



(1993年1月～2003年12月の出願)

表 2.1.4 にファイザーの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許を示す。出願件数は 120 件であり、そのうち登録になっている特許は 45 件である。

なお、表 2.1.4 では図 2.1.4-2 の解決手段 を細展開した解決手段 まで分析している。

表 2.1.4 ファイザーの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(1/15)

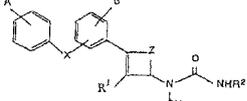
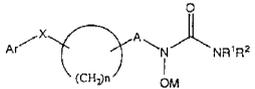
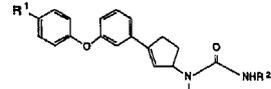
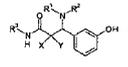
技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 炭素環式	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 脂質メディエーターに関わる薬剤	特許 2756732 93.12.22 C07C317/32	リボキシゲナーゼ阻害剤としてのフェニルチオフェニルシクロアルケニルヒドロキシ尿素 5 - リボキシゲナーゼ酵素を阻害する能力を持ち、下記とその薬剤学的に許容される塩とからなる新規なフェニルチオフェニルシクロアルケニルヒドロキシ尿素。炎症性疾患、アレルギーおよび心臓血管疾患の治療または緩和に有用である。 
			特許 2794341 93.04.07 C07C275/64	シクロアルキルヒドロキシ尿素類及びそれらのリボキシゲナーゼ阻害物質としての用途 下記(1)の新規なN-ヒドロキシ尿素化合物。炎症性疾患、アレルギーおよび心臓血管疾患の治療または緩和に有用。 
			特許 2794343 93.08.19 C07C275/26	フェノキシフェニルシクロペンテニルヒドロキシ尿素 下記を有する化合物の右旋性異性体である新規フェニル置換シクロペンテニルヒドロキシ尿素化合物で、5 - リボキシゲナーゼ酵素を阻害する。炎症性疾患、アレルギー及び心臓血管疾患の予防、治療又は緩和に有用。 
			特表平 8-511029 (拒絶査定確定) 93.07.20 C07D307/52	ヘテロアリールシクロアルケニルヒドロキシ尿素
	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	複数の作用機序に関わる薬剤	特表 2000-505445 96.02.13 A61K31/415,601	シクロオキシゲナーゼ-2 インヒビターとロイコトリエン B4 受容体アンタゴニストの投与の免疫抑制作用
		その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤	特許 3627975 99.05.28 C07C237/20	3-(3-ヒドロキシフェニル)-3-アミノ-プロピオンアミド誘導体 神経性および胃腸障害の治療に使用することのできる下記(1)の化合物。具体例には3(3-ヒドロキシフェニル)-3-メチルアミノ-プロピオンアミドがある。 
			特表 2005-524605 01.10.26 A61K45/00	第 4 級アンモニウム化合物および抗ムスカリン剤としてのそれらの使用

表 2.1.4 ファイザーの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(2/15)

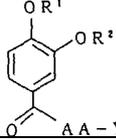
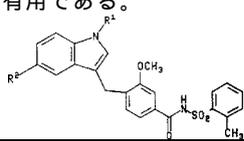
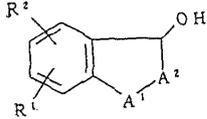
技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 炭素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	複数の作用機序に関わる薬剤	特許 3131225 95.07.26 C07C235/52	<p>N-(アロイル)グリシンヒドロキサム酸誘導体および関連化合物 下記式(1)の化合物およびそれらの塩は、ホスホジエステラーゼ IV を阻害または腫瘍壊死因子の生成を阻害し、ぜん息、関節炎および敗血症を含む特定の状態および疾患の治療に有用である。</p>  <p style="text-align: center;">I</p>
	作用点非特定の薬剤開発	(作用点非特定の薬剤)	特表 2001-523712 97.11.25 A61K31/18	PDE-IV のベンゼンスルホンアミド阻害剤およびそれらの治療的使用
			特表 2004-513099 00.10.24 A61K31/137	喘息を治療するためのトルテロジンの使用
合成医薬品 / 複素環式	(易使用性)投与量・投与回数の低減化	組成の改良	特表 2005-511657 01.12.07 A61K31/437	選択的 PDE4 阻害剤とアドレナリン作動性 2 受容体アゴニストとの組み合わせ物
	(製造コスト低減化)原体コストの低減化	工程簡略化	特開 2001-106682 (拒絶査定確定) 99.08.31 C07D3098	種々のヘテロ環リングシステムを有する 5-リボキシゲナーゼ阻害剤を製造するための方法
	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	ロイコトリエン拮抗剤	特許 3020612 95.10.10 C07D209/18	<p>ロイコトリエンアンタゴニストとしてのインドールカルバメート類 下記式(1)の化合物は、ロイコトリエン D4 を遮断し、喘息、慢性関節リウマチ、変形性関節症、気管支炎、慢性閉塞性気道疾患、乾癬、アレルギー性鼻炎、アトピー性皮膚炎、ショックおよび他の炎症性疾患の治療に有用である。</p>  <p style="text-align: center;">I</p>
		特許 3012339 (権利消滅) 94.10.13 C07D311/22	<p>ベンゾピランおよびベンゾ縮合化合物、それらの製造、並びにロイコトリエン B 下 4(LTB 下 4)アンタゴニストとしてのそれらの用途 下記の新規なベンゾピランおよび他のベンゾ縮合化合物ロイコトリエン B4(LTB4)アンタゴニスト。慢性関節リウマチ、変形性関節症、炎症性腸疾患、乾癬および他の皮膚疾患、および他の再灌流傷害、移植拒絶、自己免疫疾患、ぜん息、および著しい好中球浸潤が生じる他の症状を含めた炎症性疾患の治療に有用。</p>  <p style="text-align: center;">(I)</p>	

表 2.1.4 ファイザーの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(3/15)

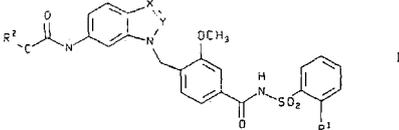
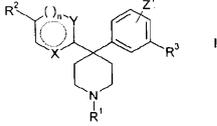
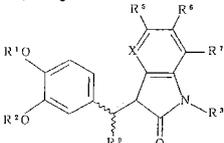
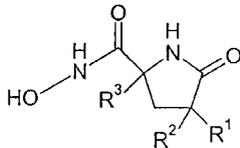
技術要素 /	(課題)課題 /課題	(解決手段)解決手段 /解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発 (つづき)	ロイコトリエン拮抗剤(つづき)	特許 2818976 94.03.01 C07D209/08	ロイコトリエン D4 拮抗薬としての二環式カルバメート 喘息、リウマチ性関節炎、変形性関節炎、気管支炎、慢性閉鎖性気道疾患、乾癬、アレルギー性鼻炎、アトピー性皮膚炎、ショック等に役立つ、ロイコトリエン D4 レセプター阻害剤である二環式カルバメート化合物。 
			特開 2002-30080 (拒絶査定確定) 00.06.08 C07D311/22	(3S-トランス)-2-[3,4-ジヒドロ-4-ヒドロキシ-3-(フェニルメチル)-2H-1-ベンゾピラン-7-イル]-4-(トリフルオロメチル)-安息香酸の新規結晶形体
	既知作用点に対する薬剤開発 / 作用機作非特定	作用機序不明	特許 3370038 99.02.22 C07D401/04	4-フェニル-4-ヘテロアリアルピペリジン誘導体 オピオイド受容体のリガンドとしての有用性を有する 4-フェニル-4-ヘテロアリアルピペリジン誘導体(下記式の化合物)で、神経障害及び胃腸障害の治療剤として有用。 
新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特表 2003-515602 99.11.30 C07D401/04	免疫抑制薬として有用な 2,4-ジアミノピリミジン化合物
		第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / PDE 4 に関わる薬剤	特許 2747116 93.11.26 C07D209/34 [被引用 2 回]	IV 型ホスホジエステラーゼ阻害剤としての置換インドール類 下記式(1)の新規な置換オキシインドール類からなる IV 型ホスホジエステラーゼ(“PDE”)の阻害剤。エイズ、ぜん息、慢性関節リウマチ、変形性関節症、気管支炎、慢性閉塞性気道疾患、乾癬、アレルギー性鼻炎、アトピー性皮膚炎、ショック等の処置に有用である。 
	サイトカインに関わる薬剤 / その他のサイトカインに関わる薬剤	サイトカインに関わる薬剤	特許 3188883 98.11.05 C07D207/277	5-オキソ-ピロリジン-2-カルボン酸・ヒドロキシアミド誘導体 マトリックス・メタロプロテイナーゼ阻害によって治療することのできる、下記式 1 によって示される化合物、製薬組成物および治療方法。 

表 2.1.4 ファイザーの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(4/15)

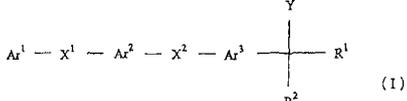
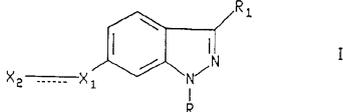
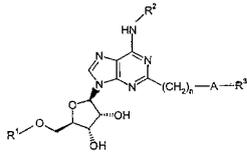
技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段)解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発 (つづき)	サイトカインに関わる薬剤 / その他のサイトカインに関わる薬剤(つづき)	特開平 8-134073 (拒絶査定確定) 94.09.21 C07D513/04,343 特表平 9-505082 (拒絶査定確定) 94.03.09 C07D261/04 [被引用 2 回]	哺乳動物における腫瘍壊死因子の生成を抑える方法 TNF 放出の阻害剤としてのイソオキサゾリン
		炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 脂質メディエーターに関わる薬剤	特許 3032579 94.10.18 C07D233/60,103 [被引用 1 回]	5-リボキシゲナーゼ阻害剤 5 - リボキシゲナーゼ酵素を阻害する能力を有する下記式 (1) で表わされる新規化合物。炎症性疾患、アレルギー、及び心臓血管疾患の治療又は緩和に有用である。  (1)
		複数の作用機序に関わる薬剤	特許 3032840 96.06.27 C07D231/56	置換インダゾール誘導体 下記式 I で示されるホスホジエステラーゼ IV 型または腫瘍壊死因子生産を阻害する化合物、およびホスホジエステラーゼ IV 型または腫瘍壊死因子生産を阻害する方法。  I
	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	細胞接着過程の調節に関わる薬剤	特表 2002-518491 98.06.23 C07D205/04 田辺製薬 [被引用 1 回] 特表 2003-524614 98.12.22 C07C233/87 田辺製薬、ファイザー [被引用 1 回]	4 1 媒介細胞接着のインヒビター 4 1 媒介細胞接着のインヒビター
		細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特表 2005-509653 01.11.12 C07D211/40	P2X7 受容体アンタゴニストとしてのベンズアミドおよびヘテロアリアルアミド
		第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / アデノシンに関わる薬剤	特許 3602445 98.10.16 C07H19/167	アデニン誘導体 アデノシン A2a 受容体アゴニスト活性を有する、下記のアデニン誘導体、その塩、それらの製造方法、それらを含む組成物、その使用、並びに中間体製造法に関する。 
			特表 2003-502339 99.06.15 C07H19/167	プリン誘導体

表 2.1.4 ファイザーの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(5/15)

技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) / 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発 (つづき)	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / アデノシンに関わる薬剤 (つづき)	特表 2004-509130 00.09.15 C07H19/16	プリン誘導体
		第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤	特開 2002-322180 01.03.16 C07D487/04, 138	薬学的に活性化化合物
		ケモカインに関わる薬剤 / CC ケモカインに関わる薬剤	特表 2005-511486 01.06.20 C07D241/04	新規なスルホン酸誘導体
		炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 脂質メディエーターに関わる薬剤	特許 2841120 94.03.28 C07D417/12, 309	5-リポオキシゲナーゼ生成阻害剤としてのベンゾイソチアゾール類誘導体 5-リポオキシゲナーゼ(5-L0)の選択的阻害剤である新規複素環化合物。喘息、関節炎、気管支炎、慢性閉塞性肺疾患、乾癬、アレルギー性鼻炎、皮膚炎、ショック、アトピー性皮膚炎、リウマチ性関節炎或いは変形性関節炎の治療に役立つ。
			特許 3400392 94.10.18 A61K31/4164	5-リポキシゲナーゼ阻害剤及び新規医薬組成物 5-リポキシゲナーゼ阻害剤及び新規医薬組成物(特に、アレルギー又は炎症状態の治療用医薬組成物)を提供する。5-リポキシゲナーゼ阻害剤は、下記式(1)で表される新規化合物又はその塩を有効成分として含有する。
			特許 2843920 93.06.14 C07D405/12, 233 [被引用1回]	イミダゾールリポキシゲナーゼ阻害剤 リポキシゲナーゼ酵素を阻害する作用を有し、下記で表される、新規イミダゾール化合物。気管支喘息、皮膚障害、及び関節症の治療用に有用。
			特許 3602436 99.12.03 C07D231/12	抗炎症剤/鎮痛剤としてのアセチレン誘導体 下記で示される化合物及びその医薬組成物及びその製造方法。シクロオキシゲナーゼ酵素作用に介入し、プロスタグランジンの生合成を阻害し、炎症関節炎、神経変性、大腸癌等の疾患の治療又は緩和に有用。

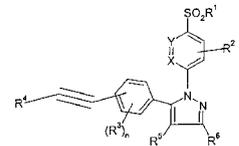
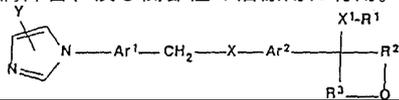
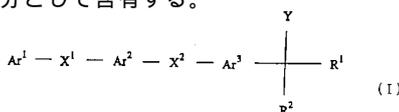
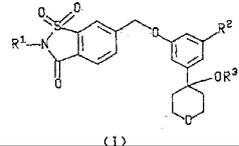


表 2.1.4 ファイザーの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(6/15)

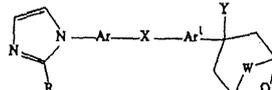
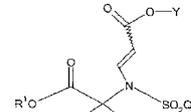
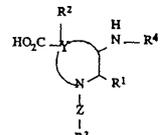
技術要素 /	(課題) 課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発 (つづき)	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 脂質メディエーターに関わる薬剤 (つづき)	特許 3110049 95.09.18 C07D493/08	新規イミダゾールリボキシゲナーゼ阻害剤 下記式(1)で表わされる化合物及び薬剤学的に許容することのできるその塩。加えて、式(1)で表される化合物及び薬剤学的に許容することのできる担体を含む、アレルギー又は炎症性疾患の治療用医薬組成物。  (1)
			特表平 9-505081 (拒絶査定確定) 94.03.09 C07D261/04	5-リボキシゲナーゼ阻害物質としてのイソキサゾリン化合物
			特表平 10-506649 (拒絶査定確定) 95.06.07 C07D263/14 [被引用 2 回]	抗炎症剤としての N-ヒドロキシ尿素
			特表 2005-522491 02.02.20 C07D233/60, 101	抗炎症薬および鎮痛薬としてのイミダゾール化合物
	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 起炎性プロテアーゼに関わる薬剤	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 起炎性プロテアーゼに関わる薬剤	特許 3479511 98.04.10 C07C303/40	マトリックスメタロプロテイナーゼ阻害薬の製造に有用なヒンダードスルホンアミド類のアルキル化方法 マトリックスメタロプロテイナーゼ阻害薬の製造における中間体として有用な下記の化合物の製造方法。 
			特開 2001-261656 00.03.13 C07D233/32	マトリックスメタロプロテイナーゼを阻害する 2-オキシソイミダゾリジン-4-カルボン酸ヒドロキサミド化合物
			特表 2004-512327 00.10.26 C07D239/62	ピリミジン-2,4,6-トリオン・メタロプロテイナーゼ阻害剤
			特表 2004-518635 00.10.26 C07D471/10, 102	スピローピリミジン-2,4,6-トリオンメタロプロテイナーゼ阻害剤
			特表 2005-527598 02.02.20 C07D487/10	トリアリール-オキシアリール-スピローピリミジン-2,4,6-トリオンメタロプロテイナーゼ阻害剤
	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / その他の化学伝達物質に関わる薬剤	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / その他の化学伝達物質に関わる薬剤	特許 3001978 94.08.24 C07D211/90 [被引用 2 回]	ブラジキニンアンタゴニストとしてのジヒドロピリジン誘導体 下記の新規なジヒドロピリジン化合物は、優れたブラジキニンアンタゴニスト活性を有し、従って哺乳類、特にヒトにおける、炎症、心臓血管の疾病、疼痛、普通の風邪、アレルギー、ぜんそく、膵臓炎、やけど、ウイルス感染、頭部損傷、多重外傷等の治療に有用である。 

表 2.1.4 ファイザーの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(7/15)

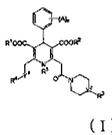
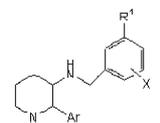
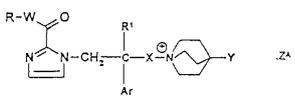
技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) / 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発 (つづき)	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / その他の化学伝達物質に関わる薬剤 (つづき)	特許 3651885 99.12.10 C07D417/14	ブラジキニンアンタゴニストとしての 5-員のヘテロアリアル置換 1,4-ジヒドロピリジン化合物 下記式(1)で示される、炎症、アレルギー性鼻炎、疼痛等のようなブラジキニンにより仲介される医学的症状の治療に有用な化合物の提供。  (1)
			特開平 11-106375 (拒絶査定確定) 97.08.18 C07D211/90	ブラジキニンアンタゴニストとしての光学的に活性な 1,4-ジヒドロピリジン化合物
			特開 2001-192382 (拒絶査定確定) 99.12.10 C07D417/06	ブラジキニンアンタゴニストとしての置換 1,4-ジヒドロピリジン化合物
			特開 2003-171377 (取下) 01.12.05 C07D401/12	ブラジキニンアンタゴニストとしての N-ベンゼンスルホニル L-プロリン化合物
			特開 2002-220387 00.12.05 C07D401/14	ブラジキニンアンタゴニストとしての N-ベンゼンスルホニル L-プロリン化合物
			特表 2004-505973 00.08.10 C07D211/90	ブラジキニンアンタゴニストとしての 1,4-ジヒドロピリジン類
			特開 2005-120107 02.02.20 C07D495/10, CSP	ブラジキニンアンタゴニストとしての 5-員のヘテロアリアル置換 1,4-ジヒドロピリジン化合物
			特許 3172461 96.12.18 C07D211/56	サブスタンス P アンタゴニストとしての 3-[(5-置換ベンジル)アミノ]-2-フェニルピペリジン サブスタンス P アンタゴニストとしての下記式で表される化合物、例えば、(2S, 3S)-3-(5-(1-シアノシクロプロピル)-2-メトキシベンジル)アミノ-2-フェニルピペリジン二塩酸塩。  (i)
			特許 3280993 97.06.18 C07D453/02	タキキニンアンタゴニストとしての第四級アンモニウム化合物 タキキニンアンタゴニストである下記の化合物が提供される。  (ii)

表 2.1.4 ファイザーの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(8/15)

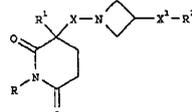
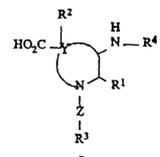
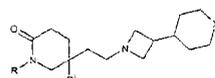
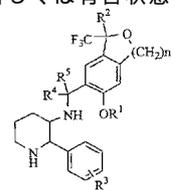
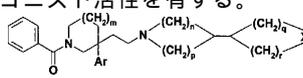
技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) / 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発 (つづき)	神経ペプチドに関わる薬剤 / タキキニンに関わる薬剤(つづき)	特許 2918508 96.01.27 C07D401/06,205	アゼチジン類 タキキニンアンタゴニストとして有効な、下記式(1)で示される新規アゼチジニルアルキルグルタルイミド誘導体。 
			特許 2992346 93.09.17 C07D207/16	タキキニン拮抗薬としての 3-アミノ-5-カルボキシ-置換ピペリジン類および 3-アミノ-4-カルボキシ-置換ピロリジン類 下記の新たな置換アザヘテロサイクルカルボン酸は、卓越した P 物質拮抗薬活性を有しており、胃腸疾患、中枢神経系疾患、アレルギー、炎症性疾患、喘息、疼痛、嘔吐または片頭痛の治療に有用である。 
			特許 3163298 98.06.04 C07D401/14	ピペリドン 下記式(1)の化合物またはその塩、それらの製造方法、その中間体、これらを含む組成物およびこれらの使用。本化合物は、ヒト NK2 受容体で作用する NKA、NKB およびサブスタンス P を含めたタキキニンの強力且つ選択的なアンタゴニストであり、関節炎、乾癬、喘息または炎症性腸疾患などの治療に有効。 
			特許 3394239 97.11.19 C07D405/12	サブスタンス P アンタゴニストとしてのピペリジニルアミノメチルトリフルオロメチル環状エーテル化合物 下記式(1)の化合物及びその塩。鎮痛剤又は抗炎症剤として、或いは心血管疾患、アレルギー疾患、脈管形成、CNS 障害、嘔吐、胃腸障害、日光皮膚炎、尿失禁、又はヘリコバクター・ピロリで引き起こされる疾病、疾患若しくは有害状態等の治療に有用。 
			特許 3091844 (権利消滅) 98.10.08 C07D211/96	複素環式化合物 下記式(1)で表される 1-ベンゾイルピペリジン及び 1-ベンゾイルピロリジン誘導体、並びにそれらの調製方法、及びそれらの使用。タキキニンレセプターアンタゴニスト活性を有する。 

表 2.1.4 ファイザーの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(9/15)

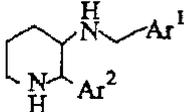
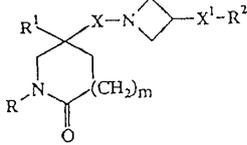
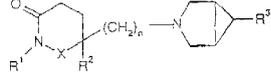
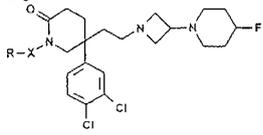
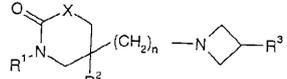
技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) / 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発 (つづき)	神経ペプチドに関わる薬剤 / タキキニンに関わる薬剤(つづき)	特許 3283222 96.08.14 C07D471/04, 101	<p>サブスタンス P アンタゴニストとしてのピペリジニルアミノ三環式化合物</p> <p>下記式 (I) で表されるサブスタンス P アンタゴニストとしてのピペリジニルアミノ三環式化合物、[例えば、(2S, 3S) - 3 - [(7 - メトキシ - 4, 5 - ジヒドロ - [1, 2, 3, 4] テトラゾロ [1, 5 - a] キノリン - 8 - イル) メチル] アミノ - 2 - フェニルピペリジン] を提供する。</p>  <p style="text-align: right;">(I)</p>
			特許 3159389 94.08.09 C07D401/06 [被引用 2 回]	<p>タキキニンアンタゴニストとしての(アゼチジン-1-イルアルキル)</p> <p>下記式 (I) で表されるタキキニンアンタゴニスト化合物、およびそれらの薬学的に許容しうる塩、このような誘導体を含む組成物の製造およびこのような誘導体の使用において用いられる中間体を提供する。</p>  <p style="text-align: center;">(I)</p>
			特許 2978566 95.11.25 C07D401/06	<p>ノイロキニンレセプター拮抗薬としての 5-アザピシクロ[3.1.0]ヘキシルアルキル-2-ピペリドンおよびグルタルイミド</p> <p>下記式 (I) で表される化合物およびこれらの塩は、尿失禁、喘息および関連症状を含む様々な医学的症候の治療において有用なノイロキニンレセプター拮抗薬である。</p>  <p style="text-align: center;">(I)</p>
			特許 3140063 96.01.22 C07D40/14 [被引用 1 回]	<p>ピペリドンタキキニンアンタゴニスト</p> <p>下記式 (I) で表される化合物およびその酸付加塩、それらの製造方法、その製造で用いられる中間体、それらを含む組成物およびそれらの使用に関する。これら化合物は、タキキニンアンタゴニストとして有用である。</p>  <p style="text-align: center;">(I)</p>
			特許 3026945 96.01.27 C07D403/06	<p>3-アザ及び3-オキサピペリドンタキキニン拮抗薬</p> <p>下記式 (I) の化合物は尿失禁、喘息、及びその関連症状を含む様々な症候の治療に有用なニューロキニン受容体拮抗薬である。</p>  <p style="text-align: right;">(I)</p>

表 2.1.4 ファイザーの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許 (10/15)

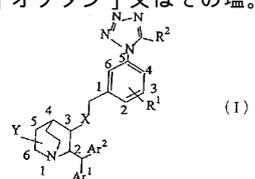
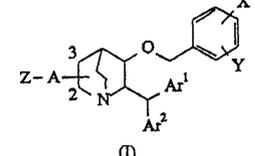
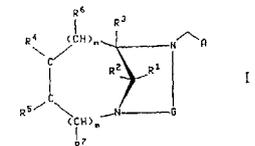
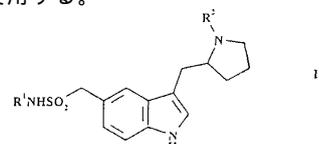
技術要素 /	(課題) 課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発 (つづき)	神経ペプチドに関わる薬剤 / タキキニンに関わる薬剤(つづき)	特許 3273750 (経過情報) 96.09.12 C07D453/02	サブスタンス P アンタゴニストとしてのテトラゾリル置換キヌクリジン 下記式で表されるサブスタンス P アンタゴニストとしてのテトラゾリル置換キヌクリジン。例えば、(2S,3S) - 3 - [2 - メトキシ - 5 - (5 - トリフルオロメチルテトラゾール - 1 - イル) - ベンジルアミノ] - 2 - ジフェニルメチル - 1 - アザピシクロ [2.2.2] オクタン] 又はその塩。  (I)
			特表平 10-501228 94.06.06 C07D209/18	タキキニン(NK 下 1)受容体アンタゴニスト
			特表 2002-511467 98.04.15 C07D405/12	ベンゾフランイルメチルカルバメート NK1 拮抗物質のプロドラッグ
			特表 2005-514389 01.12.18 C07D401/04	タキキニンのアンタゴニストとしてのラクタム
	神経ペプチドに関わる薬剤 / その他の神経ペプチドに関わる薬剤	神経ペプチドに関わる薬剤 / その他の神経ペプチドに関わる薬剤 [被引用 1 回]	特許 2843921 (経過情報) 93.07.15 C07D453/02 [被引用 1 回]	P 物質拮抗剤としてのベンジルオキシキヌクリジン 下記(1)で表される新規なベンジルオキシキヌクリジン化合物。P 物質拮抗作用を有し、哺乳類特にヒトの胃腸障害、中枢神経系障害、アレルギー、炎症性疾患、喘息、疼痛、等の治療に有用。  (1)
			特許 2895630 (権利消滅) 93.12.29 C07D471/08	ジアザピシクロニューロキニンアンタゴニスト 下記式(1)で表されるジアザピシクロ化合物。炎症性疾患、中枢神経系疾患及び他の疾患の治療に有用である。  (1)
			特許 3096306 (権利消滅) 94.10.12 A61K31/404	新規な治療方法 下記式(1)の化合物またはその塩を、皮膚障害；末梢神経障害；関節炎；胃腸管または尿生殖器疾患；緊張性頭痛；小児片頭痛；外傷後自律神経不全性頭痛；口顔痛；アレルギー性および慢性閉塞性気道疾患；緑内障もしくは眼性炎症の処置；または片頭痛の予防に使用する。  (1)

表 2.1.4 ファイザーの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許 (11/15)

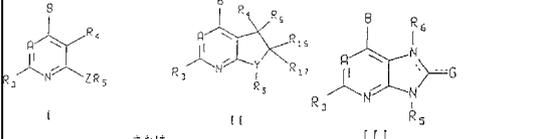
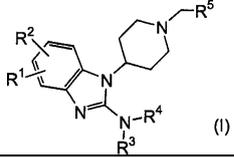
技術要素 /	(課題) 課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 複素環式 (つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発 (つづき)	神経ペプチドに関わる薬剤 / その他の神経ペプチドに関わる薬剤 (つづき)	特表 2000-511207 (拒絶査定確定) 97.07.04 C07D401/06	アゼチジニルプロピルピペリジン誘導体、中間体、およびタキキニン拮抗薬としての使用
			特表 2002-533338 98.12.18 C07D209/20	非ペプチド NK1 レセプターアンタゴニスト
	複数の作用機序に関わる薬剤	その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤	特表 2001-506574 96.02.13 A61K31/10	シクロオキシゲナーゼ-2 阻害剤およびロイコトリエン A4 ヒドロラーゼ阻害剤を含有する免疫抑制効果をもつ配合物
			特許 3193055 94.06.08 C07D213/69 [被引用 1 回]	コルチコトロピン放出因子(CRF)アンタゴニスト 下記式 (I)、(II) または (III) を持つ、コルチコトロピン - 放出因子 (CRF) アンタゴニスト、およびそれらの製造方法。これら化合物およびそれらの塩は、CNS およびストレス関連病の治療に有効である。 
			特許 3276111 99.07.16 C07D401/04 [被引用 1 回]	ORL1-レセプターアゴニストとしての 2-ベンズイミダゾリルアミン化合物 下記の化合物又はその製薬的に許容可能な塩。ORL1-レセプターアゴニスト活性を有しており、哺乳動物対象において鎮痛剤等として有用である。 
			特開 2000-1434 (放棄) 94.06.08 A61K31/44	コルチコトロピン放出因子アンタゴニストを含む医薬組成物
			特開 2001-39974 (取下) 99.07.16 C07D401/04 [被引用 1 回]	ORL1-レセプターアゴニストとしての 2-ベンズイミダゾリルアミン化合物
			特開 2001-172281 99.11.23 C07D487/04, 140	置換された複素環式誘導体
		特表 2005-526090 02.02.20 C07D471/04	神経伝達物質調節因子としてのピラゾロ (1.5-A) ピリジン誘導体	
	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特表 2004-534047 01.05.31 C07D487/04, 140	(1-ベンジル-4-メチルピペリジン-3-イル)-メチルアミンの光学分割および蛋白質キナーゼ阻害剤としてのピロロ 2.3-ピリミジン誘導体製造のためのその使用

表 2.1.4 ファイザーの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許 (12/15)

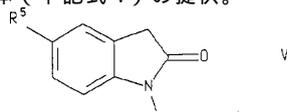
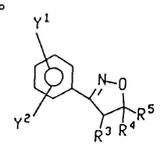
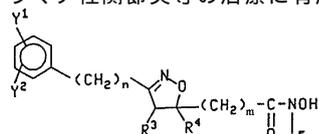
技術要素 /	(課題) 課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発(つづき)	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / PDE 4 に関わる薬剤	特許 3106118 93.11.26 C07D209/34	オキシンドール化合物製造用中間体 エイズ、ぜん息、慢性関節リウマチ、変形性関節症、気管支炎、慢性閉塞性気道疾患、乾癬、アレルギー性鼻炎、アトピー性皮膚炎、ショック、および他の炎症性疾患の治療に有用な、IV 型ホスホジエステラーゼ阻害剤としての置換オキシンドール化合物の製造中間体(下記式 V)の提供。 
			特許 2818820 93.11.26 C07D261/04 [被引用 2 回]	抗炎症剤としての 3-アリール-2-イソオキサゾリン類 ホスホジエステラーゼ IV 型(PDEIV)の選択的阻害剤である 3-アリール-2-イソオキサゾリン化合物。AIDS、喘息、関節炎、気管支炎、慢性閉塞性肺疾患、乾癬、アレルギー性鼻炎、皮膚炎、ショック、アトピー性皮膚炎、慢性関節リウマチ、及び骨関節炎の治療に有用。 
			特許 2802547 (権利消滅) 93.11.26 C07D261/08 [被引用 2 回]	抗炎症剤としてのイソキサゾリン化合物 ホスホジエステラーゼ 型(PDEIV)の選択的阻害剤である新規なイソキサゾリン化合物。エイズ、喘息、関節炎、気管支炎、慢性閉塞性肺疾患、乾癬、アレルギー性鼻炎、皮膚炎、ショック、アトピー性皮膚炎、リウマチ性関節炎等の治療に有用。 
			特開平 9-291032 (拒絶査定確定) 95.10.27 A61K31/455, ACP	急性および慢性の炎症性疾患の治療剤
			特表 2000-510481 (拒絶査定確定) 97.04.04 C07D213/82 [被引用 5 回]	ニコチンアミド誘導体
			特表 2001-522367 97.04.30 C07D487/04, 152	ホスホジエステラーゼ 4-阻害ジアゼピノインドロン
			特表 2001-521925 97.11.04 A61K31/416	PDE4 阻害剤におけるカテコールのインダゾールバイオイソステル置換に基づく治療学的に活性化化合物
			特表 2002-543199 99.04.28 C07D487/04, 146 [被引用 1 回]	ホスホジエステラーゼ IV を阻害する 1-アミノトリアゾロ[4.3-a]キナゾリン-5-オン、および/または-5-チオン

表 2.1.4 ファイザーの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許 (13/15)

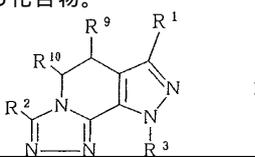
技術要素 /	(課題) 課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 複素環式 (つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発 (つづき)	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / PDE 4 に関わる薬剤 (つづき)	特表 2003-522165 00.01.31 C07D239/34 [被引用 1 回]	PDE4 アイソザイムの阻害剤として有用なピリミジンカルボキサミド
			特表 2003-522176 00.01.31 C07D413/12 [被引用 1 回]	PDE4 アイソザイムの選択的阻害薬として有用なニコチンアミドベンゾ縮合複素環誘導体
			特開 2002-284766 00.01.31 C07D213/82	PDE4 アイソザイムの阻害剤として活性なニコチンアミド酸類、アミド類およびそれらの模倣剤
			特表 2004-520386 00.01.31 C07D213/82	PDE4 アイソザイムの阻害剤として有用なニコチンアミドピアリール誘導体
			特表 2004-518689 00.01.31 C07D405/12	PDE4 アイソザイム阻害剤として有用なエーテル誘導体
			特表 2004-518691 00.01.31 C07D277/20	PDE4 アイソザイムの阻害剤として有効なチアゾリル、オキサゾリル、ピロリル、イミダゾリル酸アミド誘導体
			特開 2004-83583 97.04.04 C07D213/64	ニコチンアミド誘導体
			特表 2005-502662 01.08.13 C07D487/04, 145	ホスホジエステラーゼ阻害剤としての 1-アルキルまたは 1-シクロアルキルトリアゾロ [4.3-a] キナゾリン-5-オン類
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / アデノシンに関わる薬剤		特表 2003-511459 99.10.14 C07D473/34, 361	プリン誘導体
			特表 2003-511460 99.10.14 C07H19/167	プリン誘導体
			特表 2005-513043 01.12.06 C07H19/167, CSP	結晶形リポフラノシルウロナミド誘導体及びヒトアデノシン A2a 受容体アゴニスト
	ケモカインに関わる薬剤 / CC ケモカインに関わる薬剤	複数の作用機序に関わる薬剤	特表 2003-522164 00.02.04 C07D215/54	ヘテロ環式アミド誘導体
			特許 3107827 95.06.06 C07D471/14, 102 [被引用 2 回]	<p>トリサイクリック 5,6-ジヒドロ-9H-ピラゾロ [3,4-c]-1,2,4-トリアゾロ [4,3-a] ピリジン類</p> <p>ホスホジエステラーゼ (PDE) IV 型及び腫瘍壊死因子 (TNF) の生成阻害により、喘息、関節炎、気管支炎、慢性閉塞性気道疾患、乾せん、アレルギー性鼻炎、皮膚炎等、その他 AIDS、敗血症、敗血性ショック及び悪液質のような疾患の治療に有効な下記式 (I) で示される化合物。</p> <div style="text-align: center;">  <p style="text-align: right;">I</p> </div>

表 2.1.4 ファイザーの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許 (14/15)

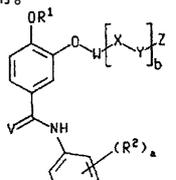
技術要素 /	(課題) 課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 複素環式 (つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発 (つづき)	複数の作用機序に関する薬剤 (つづき)	特許 3410104 95.06.07 C07D213/75	薬剤として有用なカテコールジエーテル誘導体 下記(1)の化合物。ホスホジエステラーゼ(PDE)タイプ IV の阻害し、腫瘍壊死因子(TNF)産生の阻害により、喘息、関節炎、気管支炎、慢性閉塞性気道疾患、乾癬、アレルギー性鼻炎、皮膚炎、及び AIDS、敗血症、敗血性ショック、並びにカヘキシーなどの疾患の治療に有用。 
			特表 2002-522541 98.08.11 C07D471/04, 114	ホスホジエステラーゼ 4 阻害剤としての置換 1.8-ナフチリジン-4(1H)-オン
			特表 2005-522449 02.02.11 C07D213/82, CSP	PDE4 阻害剤として有用なニコチンアミド誘導体
			特表 2005-522450 02.02.11 C07D213/82	PDE4 阻害剤として有用なニコチンアミド誘導体
			特開 2004-217668 02.02.20 A61K38/44	インダゾール誘導体、およびホスホジエステラーゼ(PDE)タイプ IV と腫瘍壊死因子(TNF)産生の阻害剤としてのインダゾール誘導体の使用
新規作用点に対する薬剤開発 / 作用機非特定	その他の新規作用メカニズムに関する薬剤	特開 2002-20385 (拒絶査定確定) 00.05.31 C07D413/14	特開 2002-20385 (拒絶査定確定) 00.05.31 C07D413/14	新規なイソオキサゾール-スルホンアミドエンドセリンアンタゴニスト
			特開 2003-34689 99.05.28 C07D401/04	4-複素環式環縮合アリールピペリジン誘導体
			特開 2003-73360 01.07.24 C07D231/12	オピオイド受容体リガンドとしての 1-ジフェニルメチル-ピラゾール誘導体
作用点非特定の薬剤開発	(作用点非特定の薬剤)	特表 2002-511061 97.01.08 C07D487/04, 140 [被引用 2 回]	特表 2002-511061 97.01.08 C07D487/04, 140 [被引用 2 回]	医薬上活性な三環式アミン
			特表 2002-515486 98.05.18 C07D211/28	掻痒性皮膚病の治療用の新規 4-フェニルピペリジン
			特開 2003-183274 01.11.02 C07D401/04	ヒドラジニルピラゾール及び窒素オキシドピラゾール
			特開 2005-47930 02.02.20 A61K47/44	置換された 6.5-ヘテロ二環式誘導体
非環式 合成医薬品 /	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	炎症における化学伝達物質に関する薬剤 / 脂質メディエーターに関する薬剤	特表 2003-506324 99.07.09 A61K31/231	共役脂肪酸化合物を用いるシクロオキシゲナーゼ-2 媒介障害の治療

表 2.1.4 ファイザーの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許 (15/15)

技術要素 /	(課題) 課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
抗体医薬品 / 高分子医薬品 /	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	IgE 抗体に関する薬剤	特表 2005-500992 01.03.28 C07K16/42	アレルギーおよび喘息の治療用新規化合物
ペプチド医薬品 / 高分子医薬品 /		その他細胞の機能調節に関わる薬剤	特開 2001-211889 99.10.29 C12N15/09, ZNA	新規ポリペプチド
	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / その他の化学伝達物質に関わる薬剤	特開 2002-330762 00.04.27 C12N15/09, ZNA	ADAMTS ポリペプチド、それをコードする核酸、及びその使用
その他の抗アレルギー剤			特表 2004-517883 (取下) 01.01.17 A61K45/06	ヒスタミン受容体アンタゴニスト

2.2 グラクソ・スミスクライン（イギリス）

2.2.1 企業の概要

商号	GlaxoSmithKline plc
本社所在地	980 Great West Road, Brentford, Middlesex TW8 9GS, England
設立年	2000年（Glaxo WellcomeとSmithKline Beechamが合併して設立）
資本金	N/A
従業員数	100,000名（連結：2004年12月末）
事業内容	医療用医薬品

グラクソ・スミスクラインは、医療用医薬品、consumer healthcare 製品（一般用医薬品、歯磨などのオーラルケア製品他）を持つ製薬企業である。特に抗アレルギー剤は保有していないようであるが、アレルギー関連の薬としては、気管支喘息薬やアレルギー性鼻炎薬、皮膚炎用の薬などを販売している。

研究開発におけるアレルギー関連の薬としては、Allermist(鼻炎)と Mepolizum がフェーズ3、766994 と GW-32826 がフェーズ2 に進捗中である。

グラクソ・スミスクライン名義の出願には、合併前の「スミスクラインビーチャム (SmithKline Beecham)」、「グラクソグループ (Glaxo Group)」名義の出願を併せて解析を行った。

主力製品には、「アバンディア」「アバングメット」(2型糖尿病治療薬)、「ラミクタール」(てんかん：双極性障害)、「バルトレックス」(ヘルペス)、「コレグ」(心臓病)などがある。

(出典：http://www.gsk.com/products/prescription_medicines/uk/medicines-ae.htm)

2.2.2 製品例

抗アレルギー剤関連製品

医療用医薬品

- 「セレタイド」「アドベアー」「フルタイド」(喘息)
- 「フルナーゼ」「ジルテック」(アレルギー性鼻炎)
- 「キンダベート」「デルモベート」(皮膚炎)

(http://www.gsk.com/products/prescription_medicines/uk/medicines-ae.htm)

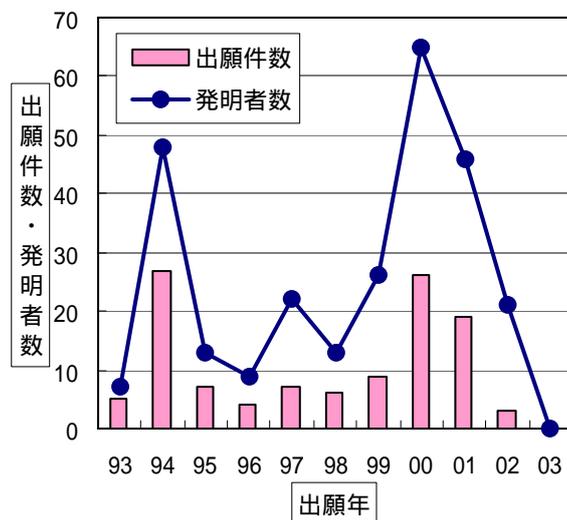
2.2.3 技術開発拠点と研究者

開発拠点：イギリス

研究者数：15,000名

図 2.2.3 にグラクソ・スミスクラインの抗アレルギー剤の出願件数と発明者数の年次推移を示す。1999 年以降出願が増加する傾向にある。01、02 については、国際出願のため未公表となっているが、継続的に出願が行われているものと考えられる。

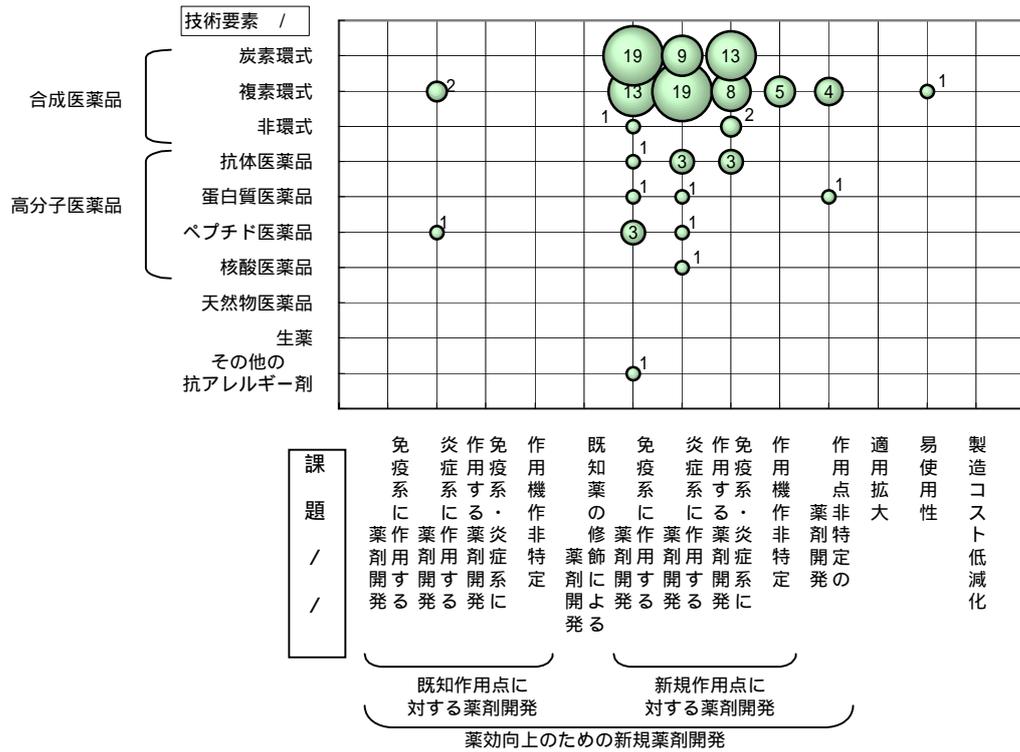
図 2.2.3 グラクソ・スミスクラインの抗アレルギー剤に関する出願件数と発明者数



2.2.4 技術開発課題対応特許の概要

図 2.2.4-1 に抗アレルギー剤に対する技術要素と課題の分布を示す。グラクソ・スミスクラインでは合成医薬品の開発が主流であり、化合物としては複素環式化合物、炭素環式化合物が主である。また、抗体医薬品（IL-4、IL-5、シアロアドヘジンファクター - 2 などの抗体医薬）、ペプチド医薬品にも注力している。抗アレルギー剤開発戦略としては「炎症系に作用する薬剤開発」もさることながら、「免疫系に作用する薬剤開発」にも力点をおいている。

図 2.2.4-1 グラクソ・スミスクラインの抗アレルギー剤の技術要素と課題

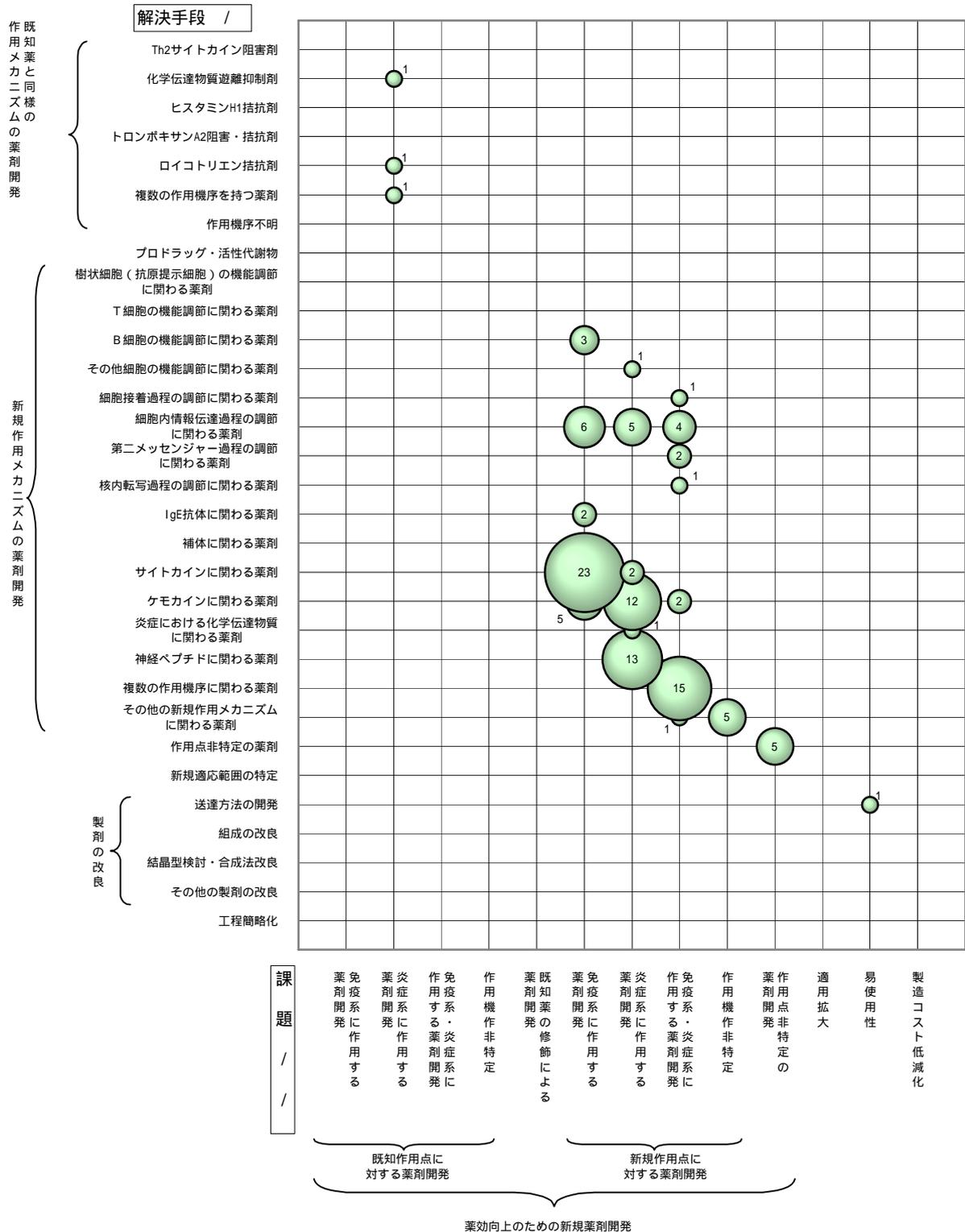


(1993年1月～2003年12月の出願)

図 2.2.4-2 に抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布を示す。

「新規作用点に対する薬剤開発」が中心的課題である。その内一番多い課題は、「免疫系に作用する薬剤開発」であり、「サイトカインに関わる薬剤」(サイトカイン受容体拮抗剤、IL-4 抗体医薬)で対応している特許が 23 件である。「炎症系に作用する薬剤開発」では「神経ペプチドに関わる薬剤」(タキキニン受容体拮抗剤)、「ケモカインに関わる薬剤」(CCR-3 拮抗剤、RANTES 関連ペプチド)で対応している特許がそれぞれ 13 件、12 件あり、「免疫系・炎症系に作用する薬剤開発」では「複数の作用機序に関わる薬剤」で対応しているものが 15 件である。

図 2.2.4-2 グラクソ・スミスクラインの抗アレルギー剤の課題と解決手段の分布



(1993年1月～2003年12月の出願)

表 2.2.4 にグラクソ・スミスクラインの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許を示す。出願件数は113件のうち登録になったものは4件である。

なお、表 2.2.4 では図 2.2.4-2 の解決手段 を細展開した解決手段 まで分析している。

表 2.2.4 グラクソ・スミスクラインの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(1/8)

技術要素 /	(課題)課題 /課題	(解決手段)解決手段 /解決手段	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
合成医薬品 / 炭素環式	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系に作用する薬剤開発	B細胞の機能調節に関わる薬剤	特表平 10-502656 94.07.13 A61K45/00 [被引用 5 回]	ヒト S - CD23 の阻害剤の使用
		サイトカインに関わる薬剤/その他のサイトカインに関わる薬剤	特表平 10-511387 94.12.23 C07C43/23 [被引用 1 回]	1.3.3 - (三置換)シクロヘキサダイマーおよび関連化合物
			特表平 10-511388 94.12.23 C07C62/34 [被引用 1 回]	3.3 - (二置換)シクロヘキサン - 1 - カルボキシレートダイマーおよび関連化合物
			特表平 10-511389 94.12.23 C07C43/23	4.4 - (二置換)シクロヘキサン - 1 - オール二量体および関連化合物
			特表平 10-511390 94.12.23 C07C43/243	1.4.4 - (三置換)シクロヘクス - 1 - エンダイマーおよび関連化合物
			特表平 10-511391 94.12.23 C07C43/23	3.3 - (二置換)シクロヘキサン - 1 - オール二量体および関連化合物
			特表平 10-511656 (みなし取下げ) 94.12.23 C07C69/734	4.4 - (二置換)シクロヘキサン - 1 - イリジンアセテート二量体および関連化合物
			特表平 10-511657 (みなし取下げ) 94.12.23 C07C49/753	3.3 - (二置換)シクロヘキサン - 1 - オン二量体および関連化合物
			特表平 10-511661 (みなし取下げ) 94.12.23 C07C43/243	1.3.3 - (三置換)シクロヘキサ - 1 - エン二量体および関連化合物
			特表平 10-511662 94.12.23 C07C43/23	1.4.4 - (三置換)シクロヘキサン二量体および関連化合物
			特表平 10-511664 94.12.23 C07C43/23	3.3 - (2 置換) - シクロヘキサン - 1 - オール単量体と関連化合物
			特表平 10-511665 (みなし取下げ) 94.12.23 C07C69/734	3.3 - (二置換)シクロヘキサン - 1 - イリジンアセテート二量体および関連化合物
			特表平 11-507331 95.05.31 C07C49/753	4.4 - (二置換)シクロヘキサン - 1 - オール類モノマ - および関連化合物
			特表 2003-500356 99.05.25 C07C255/46	シス - [4 - シアノ - 4 - (3 - シクロペンチルオキシ - 4 - メトキシフェニル)シクロヘキサン - 1 - カルボン酸]の塩
	特表 2003-512450 99.10.27 C07C259/06	可溶性ヒト CD23 形成阻害剤としてのヒドロキサム酸誘導体		

表 2.2.4 グラクソ・スミスクラインの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(2/8)

技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品 / 炭素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系に作用する薬剤開発(つづき)	サイトカインに関わる薬剤/その他のサイトカインに関わる薬剤(つづき)	特表 2004-504270 00.03.10 C07C335/18	IL - 8 受容体アンタゴニスト
			特表 2003-527361 00.03.14 C07C311/47	IL - 8 受容体アンタゴニスト
			特表 2004-508287 00.03.24 C07C311/47	IL - 8 受容体アンタゴニスト
			特表 2004-509070 00.05.30 C07C225/20	IL - 8 受容体アンタゴニスト
	新規作用点に対する薬剤開発/炎症系に作用する薬剤開発	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特表 2004-529108 01.03.07 A61K31/56	R - サルメテロールおよびプロピオン酸フルチカゾンを含んでなる医薬製剤
		ケモカインに関わる薬剤/CC ケモカインに関わる薬剤	特表 2002-511879 (みなし取下) 97.07.03 A61K31/165	化合物および方法
			特表 2002-512957 98.04.27 A61K31/223 [被引用 7 回]	CCR - 3 受容体アンタゴニスト
			特表 2002-512960 98.04.27 A61K31/223 [被引用 5 回]	CCR - 3 受容体アンタゴニスト
		ケモカインに関わる薬剤/CXC ケモカインに関わる薬剤	特表 2003-524655 00.03.01 C07C307/10	IL - 8 受容体アンタゴニスト
			特表 2003-525242 00.03.01 C07C255/59	IL - 8 受容体アンタゴニスト
			特表 2003-525302 00.03.01 C07F9/24	IL - 8 受容体アンタゴニスト
		炎症における化学伝達物質に関わる薬剤/脂質メディエーターに関わる薬剤	特表平 10-506092 94.06.02 C07C309/42 ジヨーンズホブキンズ UNIV	抗炎症化合物
		神経ペプチドに関わる薬剤/その他の神経ペプチドに関わる薬剤	特表 2002-511836 (みなし取下げ) 96.09.09 C07C233/65	化合物および方法
	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特表 2005-511531 01.10.17 C07C237/42	5' - アシルアミノ - 1.1' - ビフェニル - 4 - カルボキサミド誘導体および p38 キナーゼ阻害剤としてのそれらの使用
			特表 2005-511532 01.10.17 C07D213/40, CSP	5' - カルバモイル - 1.1 - ビフェニル - 4 - カルボキサミド誘導体及びその p38 キナーゼ阻害薬としての使用
特表 2005-505618 01.10.17 C07D261/18			p38 キナーゼ阻害剤としてのビフェニル誘導体	

表 2.2.4 グラクソ・スミスクラインの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(3/8)

技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品 / 炭素環式 (つづき)	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系・炎症系に作用する薬剤開発(つづき)	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / PDE 4 に関わる薬剤	特表平 9-510213 94.03.11 C07C47/47 [被引用 2 回]	シアノ化合物およびその製造方法
		複数の作用機序に関わる薬剤	特表 2003-522129 99.08.10 C07D239/28	1.4 - 置換 4.4 - ジアリールシクロヘキサン類
			特表平 9-501420 (拒絶査定確定) 93.07.30 C07C255/46 [被引用 2 回]	3 - シアノ - 3 - (3.4 - 二置換)フエニルシクロヘキシル - 1 - カルボキシレート類
			特表平 9-502170 93.08.19 C07C233/18 [被引用 2 回]	フエネチルアミン化合物
			特表平 9-503503 (拒絶査定確定) 93.10.01 C07C255/46 [被引用 2 回]	化合物、組成物ならびにアレルギーおよび炎症の治療
			特表平 9-503505 (拒絶査定確定) 93.10.01 C07C255/46 [被引用 2 回]	化合物、組成物ならびにアレルギーおよび炎症の治療
			特表 2002-503200 94.12.23 C07C49/683	3.3 - (二置換)シクロヘキサン - 1 - イリジンアセテート単量体および関連する化合物
			特表平 10-512552 94.12.23 C07C49/753	4.4 - (二置換)シクロヘキサン - 1 - オン二量体および関連化合物
			特表 2002-516601 95.05.31 C07C49/753	4.4 - (二置換)シクロヘキサン - 1 - オン単量体および関連化合物
		その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤	特許 3205343 95.05.19 C07C215/76	ジアリールジアミン誘導体およびそれらのデルタオピオイド(アント) - アゴニストとしての使用 下記(1)で示される一群のジアリールジアミン誘導体類は、有効かつ選択的なデルタオピオイドアゴニストおよびアンタゴニストであり、鎮痛薬として、および慣例上デルタオピオイドレセプターのアゴニストおよびアンタゴニストで治療することができる病状を治療するのに有用である。
素環式 合成医薬品 / 複	(易使用性)投与法の改善	送達方法の開発	特表 2004-503488 00.06.16 A61K31/445	医薬用抗炎症エアゾ - ル製剤
	既知作用点に対する薬剤開発/炎症系に作用する薬剤開発	化学伝達物質遊離抑制剤	特表 2001-524132 (みなし取下) 97.05.09 C07D205/085	CoA - IT のベーターラクタム阻害剤



表 2.2.4 グラクソ・スミスクラインの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(4/8)

技術要素 / /	(課題)課題 / /課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品/ 複素環式(つづき)	既知作用点に対する薬剤開発/炎症系に作用する薬剤開発(つづき)	ロイコトリエン拮抗剤	特表平 11-501038 (みなし取下げ) 95.03.02 A61K31/44,ABF	アトピー性皮膚炎および接触性皮膚炎の治療方法
	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系に作用する薬剤開発	B細胞の機能調節に関わる薬剤	特表 2004-501108 00.05.25 C07C317/28	ビスイクリルまたはヘテロビスイクリルメタンスルホニルアミノ-置換 N-ヒドロキシホルムアミド
		細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特表 2005-509622 01.10.17 C07C255/60	5'-カルバモイル-2'-メチル-1.1'-ピフェニル-4-カルボキサミド誘導体及びその p38 キナーゼ阻害薬としての使用
			特表 2005-508960 01.10.17 C07D211/26	5'-カルバモイル-1.1'-ピフェニル-4-カルボキサミド誘導体およびその p38 キナーゼ阻害薬としての使用
			特表 2005-507910 01.10.17 C07D271/10	2'-メチル-5'-(1.3.4-オキサジアゾール-2-イル)-1.1'-ピフェニル-4-カルボキサミド誘導体および p38 キナーゼ阻害薬としてのそれらの使用
			特表 2005-508962 01.10.17 C07D271/10,CSP	2'-メチル-5'-(1.3.4-オキサジアゾール-2-イル)-1.1'-ピフェニル-4-カルボキサミド誘導体および p38 キナーゼ阻害薬としてのそれらの使用
			特表 2005-508967 01.10.17 C07D213/81,CSP	p38 キナーゼ阻害薬としてのピフェニルカルボン酸アミド誘導体
	サイトカインに関わる薬剤/その他のサイトカインに関わる薬剤	特表 2002-521368 98.07.23 C07D275/06 [被引用 1 回]	IL-8 受容体アンタゴニスト	
	ケモカインに関わる薬剤/CC ケモカインに関わる薬剤	特表 2003-519211 99.12.29 C07C311/13	CD23 形成の阻害薬として使用のための 2-.3-アミノ-4-(N-ヒドロキシアミノ)-スクシニルアミノ-アセトアミド	
		特表 2001-509152 (みなし取下げ) 97.01.08 A61K31/015	CCR5 受容体リガンド、抗炎症薬および抗-ウイルス薬としての置換ビス-アクリジンおよび関連化合物	
		特表 2001-518505 97.10.07 C07D401/04	化合物および方法	
	ケモカインに関わる薬剤/その他のケモカインに関わる薬剤	特表 2002-521436 98.07.28 A61K31/167	置換アニリド化合物および方法	
		特表 2003-519119 99.12.24 C07C303/40	(ヘテロ)ビスイクリルメタンスルホニルアミノ置換ヒドロキサム酸誘導体	
	新規作用点に対する薬剤開発/炎症系に作用する薬剤開発	その他細胞の機能調節に関わる薬剤	特表 2003-516310 99.04.15 A61K31/4439	新規治療方法
		細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特表 2004-524308 01.02.14 C07C311/27	呼吸器疾患の治療のためのフエネタノールアミン誘導体
特表 2004-538259 01.03.22 C07C311/29			2-アドレナリン受容体アゴニストとしてのホルムアニリド誘導体	

表 2.2.4 グラクソ・スミスクラインの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(5/8)

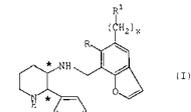
技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発/炎症系に作用する薬剤開発(つづき)	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤(つづき)	特表 2005-519083 02.02.20 A61K45/00	呼吸器疾患の治療のためのフエネタノールアミン誘導体
		ケモカインに関わる薬剤/CC ケモカインに関わる薬剤	特表 2004-509952 00.09.29 C07D265/30	炎症性疾患を処置するためのモルホリン - アセトアミド誘導体
			特表 2004-509953 00.09.29 C07D265/30	炎症性疾患の処置に有用な化合物
		ケモカインに関わる薬剤/CXC ケモカインに関わる薬剤	特表 2002-527441 98.10.13 C07D513/04,343	IL - 8 受容体アンタゴニスト
		神経ペプチドに関わる薬剤/タキキニンに関わる薬剤	特許 3499243 94.08.25 C07D405/12	タキキニンアンタゴニストとしてのベンゾフラン誘導体 下記式(1)のベンゾフラン誘導体、およびその塩または溶媒和物。その製造方法、およびそのタキキニンにより媒介される症状の治療における使用に関する。  (I)
			特許 3664492 94.05.27 C07D215/52 [被引用 2 回]	タキキニン NK3 受容体アンタゴニストとしてのキノリン誘導体 特に、肺疾患、CNS 疾患および神経変性疾患の治療に有用な NK3 受容体アンタゴニスト。(図なし)
			特表平 10-511973 95.01.12 C07D401/12,257	タキキニンアタゴニスト活性を有するピペリジン誘導体
			特開 2002-179594 94.05.27 A61K45/00	タキキニン NK3 受容体アンタゴニストとしてのキノリン誘導体
			特表 2004-517062 00.11.13 C07D215/52	NK - 3 および NK - 2 アンタゴニストとしてのキノリン誘導体
			特表 2004-517082 00.11.28 C07D215/52 [被引用 1 回]	NK - 3 アンタゴニストとしてのキノリン誘導体
			特表 2004-526753 01.04.05 C07D243/08,507	[1.4] - ジアゼパン - 1 - カルボン酸誘導体、それらの製造方法およびタキキニンアンタゴニストとしてのそれらの使用
			特表 2004-525183 01.04.11 C07D215/52	NK - 3 および NK - 2 受容体アンタゴニストとしてのキノリン - 4 - カルボキサミド誘導体
			特表 2004-525184 01.04.11 C07D215/52 特表 2005-502655 01.08.14 C07D241/04	NK - 3 および NK - 2 受容体アンタゴニストとしての 3 - 置換キノリン - 4 - カルボキサミド誘導体 タキキニンアンタゴニストおよび/またはセロトニン再摂取阻害剤としての 2 - 置換 1 - アリ - ルピペラジン

表 2.2.4 グラクソ・スミスクラインの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(6/8)

技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発/炎症系に作用する薬剤開発(つづき)	神経ペプチドに関わる薬剤/その他の神経ペプチドに関わる薬剤(つづき)	特表 2002-500645 97.05.23 C07D215/50 [被引用 2 回] 特開 2005-68155 02.02.20 A61K47/44	NK - 2 および NK - 3 レセプター - アンタゴニストとしてのキノリン - 4 - カルボキシアミド誘導体 タキキニン NK3 受容体アンタゴニストとしてのキノリン誘導体
	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特表 2004-532797 00.10.12 A61K31/4164	NF - B 阻害剤
		核内転写過程の調節に関わる薬剤	特表 2004-523476 00.10.12 C07D333/38	NF - B 阻害剤
		ケモカインに関わる薬剤/CC ケモカインに関わる薬剤	特表 2005-526808 02.02.20 C07D265/30	炎症状態の治療において CCR - 3 拮抗薬として使用するためのモルホリン尿素誘導体のベンゼンスルホン酸塩
			特表 2005-527564 02.02.20 C07D413/12	抗炎症性モルホリン - アセトアミド誘導体
		複数の作用機序に関わる薬剤	特表 2003-532727 00.05.11 C07D211/96	CD23 の阻害剤としての N - スルホニルヒドロキサム酸誘導体
			特表 2005-507905 01.10.05 A61K45/06	呼吸器疾患の治療
			特表 2005-513034 01.11.27 C07D215/12, CSP	スルホン誘導体ならびに自己免疫疾患およびアレルギーの治療におけるその使用
			特表 2005-513036 01.11.27 C07D405/12, CSP	キノリン誘導体、それらの製造方法、ならびに s - CD23 により媒介される障害の治療におけるそれらの使用
	新規作用点に対する薬剤開発/作用機作非特定	その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤	特表平 11-512396 (みなし取下げ) 95.09.05 C07D453/04	化合物および方法
			特表 2002-542247 99.04.20 C07D471/18	モルフィノイド化合物
			特表 2004-511486 (取下) 00.10.12 C07D489/00	デルタ - オピオイドアゴニストおよびアンタゴニストとしてのモルフィノイド誘導体
			特表 2004-511487 (取下) 00.10.12 C07D489/09	ピロール - 縮合モルフィノイド誘導体
			特表 2005-500321 01.06.27 C07D207/273	ジペプチジルペプチダーゼ阻害剤としてのフルオロピロリジン類
作用点非特定の薬剤開発	(作用点非特定の薬剤)	特表 2004-526662 00.04.18 C07D401/12	プロテアーゼ阻害剤	
		特表 2004-503486 00.06.16 A61K31/445	新規な水性抗炎症医薬製剤	

表 2.2.4 グラクソ・スミスクラインの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(7/8)

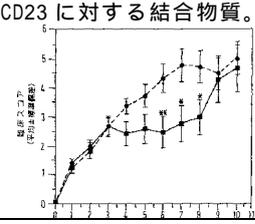
技術要素 /	(課題) 課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
複素環式(つづき) / 合成医薬品 /	作用点非特定の薬剤開発(つづき)	(作用点非特定の薬剤) (つづき)	特表 2004-503489 00.06.16 A61K38/00	新規な水性抗炎症医薬製剤
			特表 2004-503505 00.06.16 A61K31/445	医薬用抗炎症エアゾール製剤
合成医薬品 / 非環式	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系に作用する薬剤開発	サイトカインに関わる薬剤/その他のサイトカインに関わる薬剤	特表 2002-518470 98.06.22 C07C259/06 [被引用 1 回]	ヒト CD23 の産生およびその放出の阻害剤としてのヒドロキサム酸誘導体
	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	複数の作用機序に関わる薬剤	特表 2000-510138 (みなし取下げ) 96.05.10 C07C323/60	ヒドロキサム酸をベースとする CD23 および TNF 形成の阻害剤
			特表 2001-518922 (みなし取下げ) 97.03.26 C07C311/19	アリアル - またはヘテロアリアル - スルホンアミドで置換されたヒドロキサム酸誘導体、その製法およびその医薬としての使用
(高分子医薬品) 抗体医薬品	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系に作用する薬剤開発	サイトカインに関わる薬剤/抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤	特表平 9-502708 93.09.07 C07K16/46	IL4 により伝達される疾患の治療に有用な組み換え型 IL4 抗体
	新規作用点に対する薬剤開発/炎症系に作用する薬剤開発	サイトカインに関わる薬剤/炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤	特表 2001-523083 94.12.23 C12N15/09,ZNA	IL - 5 により媒介される疾病の治療に有用な組み換え IL - 5 アンタゴニスト
			特表 2000-515494 96.06.21 A61K39/395	IL - 5 介在障害を治療および診断するための改良方法
		ケモカインに関わる薬剤/CXC ケモカインに関わる薬剤	特表 2004-509147 00.09.25 A61K38/00	ウイルス感染の治療における IL - 8 タンパク質モジュレーターの使用
	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	細胞接着過程の調節に関わる薬剤	特表 2003-525615 00.03.07 C12N15/09,ZNA ジヨーンズホブキンス UNIV	シアロアドヘジンファクター - 2 抗体
複数の作用機序に関わる薬剤		特許 3323508 94.10.25 A61K39/395 [被引用 1 回]	CD23 に対する結合物質 炎症疾患、自己免疫疾患またはアレルギー疾患の治療に有益な、CD23 に対する結合物質。 	
		特開 2001-316291 94.10.25 A61K45/00	CD23 に対する結合物質	

表 2.2.4 グラクソ・スミスクラインの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(8/8)

技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
高分子医薬品 / 蛋白質医薬品	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系に作用する薬剤開発	サイトカインに関わる薬剤/抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤	特表平 10-503371 94.07.29 C12N15/09,ZNA	新規化合物
	新規作用点に対する薬剤開発/炎症系に作用する薬剤開発	ケモカインに関わる薬剤/CXC ケモカインに関わる薬剤	特表 2004-509852 00.07.18 A61K45/00	ウイルス感染の治療における IL-8 受容体アンタゴニストの使用
	作用点非特定の薬剤開発	(作用点非特定の薬剤)	特表平 10-507460 (みなし取下げ) 94.10.25 C07K16/28	炎症、自己免疫疾患、アレルギー疾患治療用の結合性物質
高分子医薬品 / ペプチド医薬品	既知作用点に対する薬剤開発/炎症系に作用する薬剤開発	複数の作用機序を持つ薬剤	特表平 9-511988 94.04.12 A61K45/06,ABB	アレルギー性鼻炎の治療方法
	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系に作用する薬剤開発	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特表 2000-514036 (拒絶査定確定) 95.06.30 A61K45/00	アレルギー反応を治療するための Stat6SH2 領域特異性化合物の使用
		IgE 抗体に関わる薬剤	特表 2004-538238 99.02.25 C07K7/00,ZNA ペプチドセラピューティクス	IgE の C-イプシロン-2 ドメインから由来のエピトープまたはミモトープ、そのアンタゴニストおよびその治療的使用
			特表 2002-537403 99.02.25 C07K7/00,ZNA ペプチドセラピューティクス	IgE の C-イプシロン-3 または C-イプシロン-4 ドメイン由来のエピトープまたはミモトープ、その拮抗薬、及びそれらの治療的使用
	新規作用点に対する薬剤開発/炎症系に作用する薬剤開発	ケモカインに関わる薬剤/その他のケモカインに関わる薬剤	特表平 10-510151 (放棄) 94.12.08 C12N15/09,ZNA [被引用 2 回]	RANTES ペプチドおよびフラグメント並びにそれを含んでなる炎症治療用組成物
高分子医薬品 / 核酸医薬品		細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特開平 11-169187 (拒絶査定確定) 97.12.08 C12N15/09,ZNA	新規化合物
その他のアレルギー剤	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系に作用する薬剤開発	B 細胞の機能調節に関わる薬剤	特表 2000-503313 96.01.17 A61K45/00	医薬的使用

2.3 シェリング・プラウ（米国）

2.3.1 企業の概要

商号	Schering-Plough
本社所在地	2000 Galloping Hill Road, Kenilworth, N.J. 07033-0530
設立年	1800年代後半
資本金	N/A
従業員数	30,500名（2004年）
事業内容	医療用医薬品：アレルギーや呼吸器疾患、感染症、ガン、心疾患

米国の大手医薬品メーカーであるシェリング・プラウにおいては、抗ヒスタミン剤「CLARITIN」が主要製品のの一つである。研究においては、サイトカイン系の医薬品にも力をいれており、対象疾患としては喘息に注力している。

シェリング・プラウ名義の出願には、合併前の「シェーリング（Schering）」名義の出願を併せて解析を行った。

主力製品には「INTRONA」（インターフェロン）、「REBETRON」（抗ウイルス剤）、「INTEGRIN」（血栓形成予防剤）、「REMICADE」（抗腫瘍壊死因子抗体）などがある。

（出典：http://www.schering-plough.com/schering_plough/about/sp_worldwide.jsp#central_america）

（出典：http://www.schering-plough.com/schering_plough/research/product_pipeline.jsp）

2.3.2 製品例

抗アレルギー剤関連製品

医療用医薬品

- 「CLARITIN」（抗ヒスタミン剤）

（出典：<http://www.schering-plough.co.jp/product/index.html>）

（出典：http://www.schering-plough.com/schering_plough/pc/products_care.jsp）

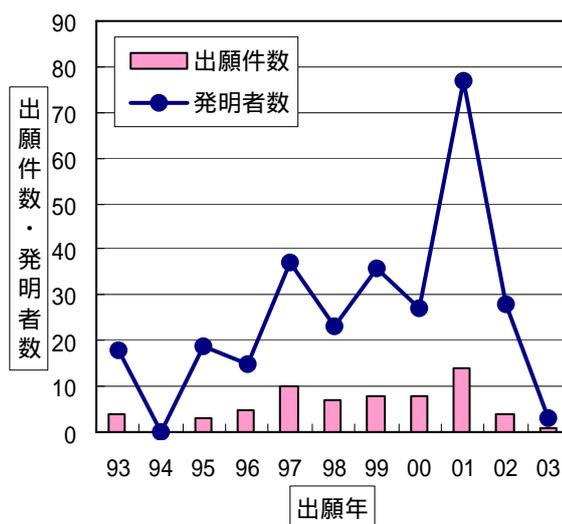
2.3.3 技術開発拠点と研究者

開発拠点：米国

図 2.3.3 にシェリング・プラウの抗アレルギー剤の出願件数と発明者数の年次推移を示す。

01 年以降は国際出願のため未公表の問題もあるが、出願件数は 01 年以降増加の傾向が窺える。

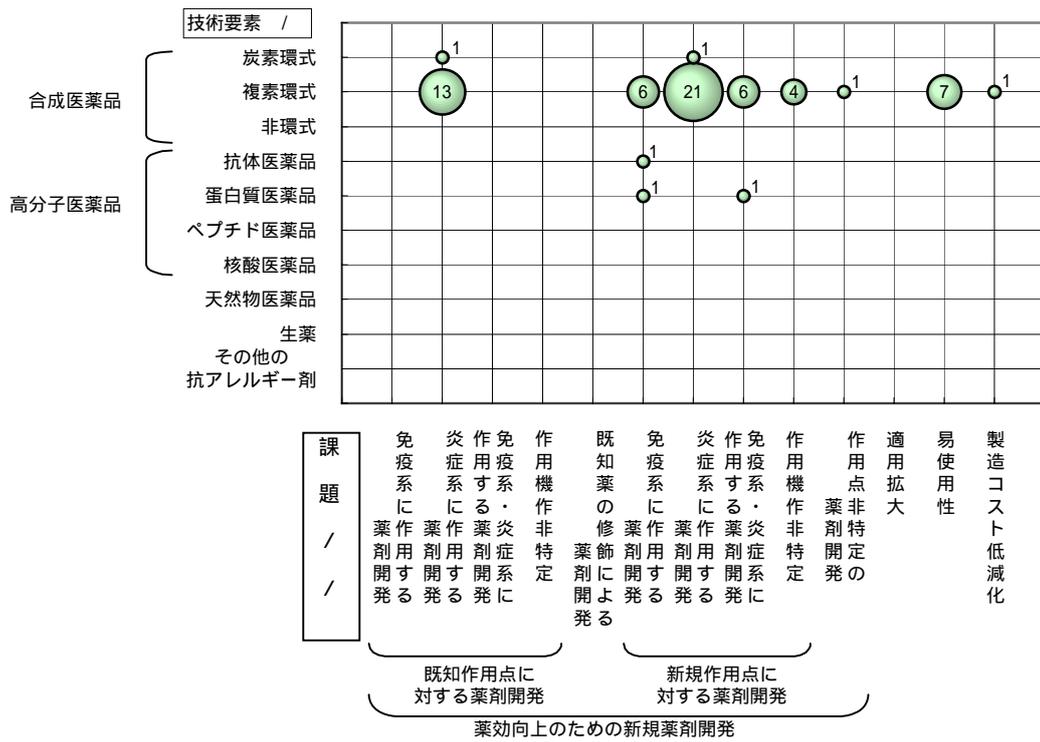
図 2.3.3 シェリング・プラウの抗アレルギー剤に関する出願件数と発明者数



2.3.4 技術開発課題対応保有特許の概要

図 2.3.4-1 に抗アレルギー剤に対する技術要素と課題の分布を示す。シェリング・プラウでは合成医薬品が主流であり、化合物としては複素環式化合物が大部分である。

図 2.3.4-1 シェリング・プラウの抗アレルギー剤に関する技術要素と課題



(1993年1月～2003年12月の出願)

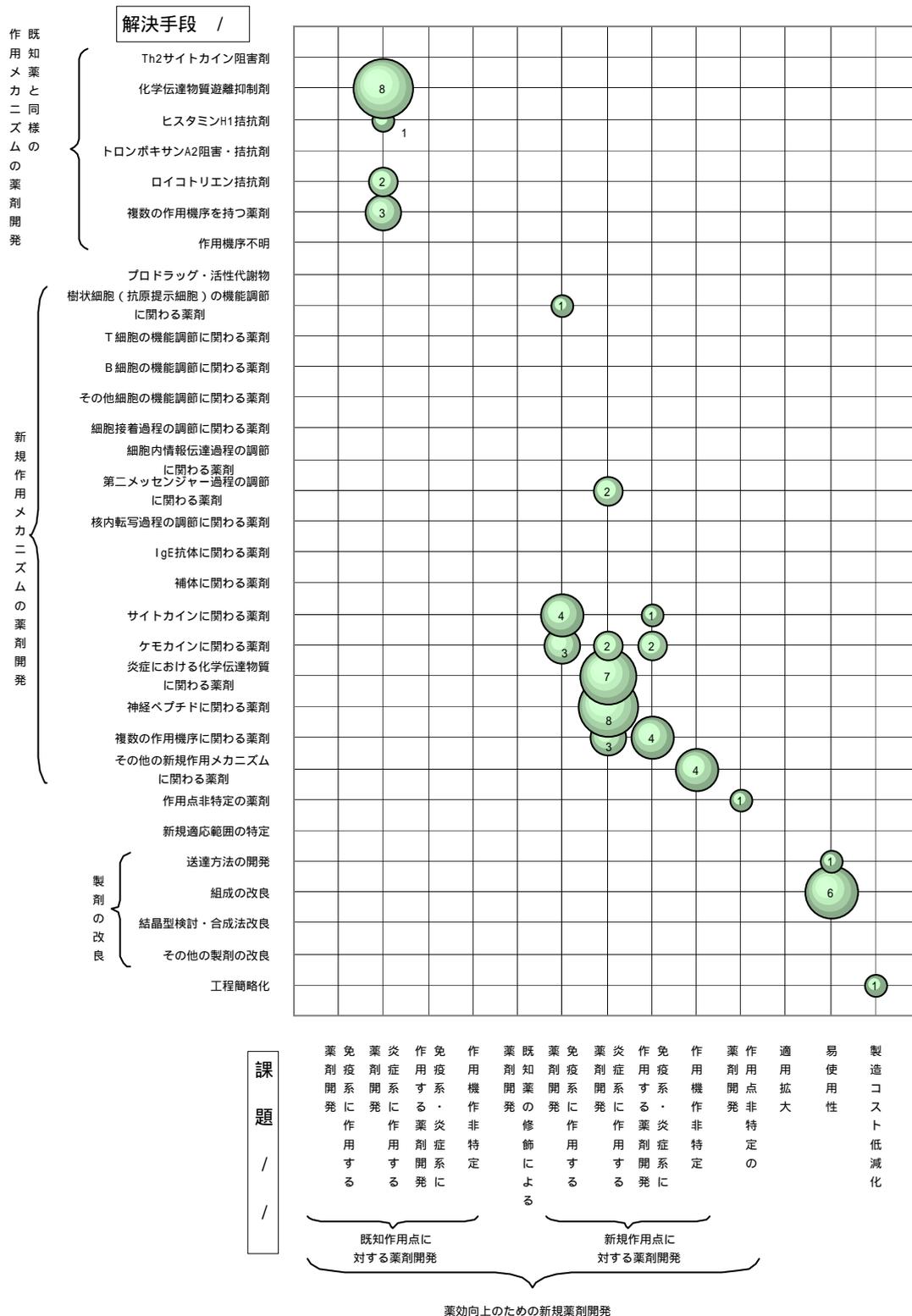
図 2.3.4-2 に抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布を示す。

「既知作用点に対する薬剤開発」に対しては「化学伝達物質遊離抑制剤」で対応しているものが8件である。

「新規作用点に対する薬剤開発」のなかでは、「炎症系に作用する薬剤開発」が多く、解決手段としては「神経ペプチドに関わる薬剤」(ニューロキニン拮抗剤、ノシセプチンレセプターリガンド)8件、「炎症における化学伝達物質に関わる薬剤」(ヒスタミン H3 拮抗剤)7件となっている。「第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤」、「ケモカインに関わる薬剤」は同じ2件である。

「易使用性」に対しては「組成の改良」で対応しているものが多い。

図 2.3.4-2 シェリング・プラウの抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布



(1993年1月～2003年12月の出願)

表 2.3.4 にシェリング・プラウの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許を示す。
出願件数は 64 件であり、そのうち登録になっている特許は 7 件である。

なお、表 2.3.4 では図 2.3.4-2 の解決手段 を細展開した解決手段 まで分析している。

表 2.3.4 シェリング・プラウの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(1/5)

技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品 / 炭素環式	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	ロイコトリエン拮抗剤	特表 2001-525842 97.05.23 C07C405/00,501	ロイコトリエン-B 下 4-誘導体、特に 7-メチルシクロヘキシル-LTB 下 4-拮抗体
	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / その他の化学伝達物質に関わる薬剤	特表 2001-522845 97.11.07 C07D401/06	1 個の窒素原子を含有する 5、6、または 7 員複素環式環で置換されたイミダゾイルアルキル
合成医薬品 / 複素環式	(易使用性)投与法の改善	送達方法の開発	特開 2005-60265 03.08.08 A61K31/4545 塩野義製薬	ロラタジンを含むドライシロップ剤
			特許 3638289 96.08.16 A61K45/06 [被引用 1 回]	ヒスタミンレセプターアンタゴニストの組み合わせを用いる上気道アレルギー性応答の処置 (a)抗ヒスタミン有効量のヒスタミン H1 レセプターアンタゴニストと、(b)鼻充血除去効果を提供するための十分な量のヒスタミン H3 レセプターアンタゴニストとの一組の処置によって、鼻炎の症状からの緩和が得られる。(図なし)
			特許 3224379 98.07.10 A61K31/4545	8-クロロ-6.11-ジヒドロ-11-(4-ピペリジリデン)-5H-ベンゾ[5.6]シクロヘプタ[1.2-b]ピリジンの経口用組成物 8 - クロロ - 6,11 - ジヒドロ - 11 - (4 - ピペリジリデン) - 5H - ベンゾ [5,6]シクロヘプタ [1,2-b]ピリジン (「DCL」)およびその塩基性塩、(例えば、二塩基性リン酸カルシウム)、ならびに崩壊剤 (例えば、微結晶性セルロースおよびスターチ)を含有し、アレルギー反応を処置するための経口投与に適切な安定な薬学的組成物。(図なし)
	特開 2002-68983 98.07.10 A61K31/4545	8-クロロ-6.11-ジヒドロ-11-(4-ピペリジリデン)-5H-ベンゾ[5.6]シクロヘプタ[1.2-b]ピリジンの経口用組成物		
	(易使用性)副作用低減化		特開 2003-95979 96.08.16 A61K45/06	ヒスタミンレセプターアンタゴニストの組み合わせを用いる上気道アレルギー性応答の処置
(易使用性)保存安定性		特表 2005-502675 01.08.28 A61K31/573	喘息治療用の製薬組成物	
(製造コスト低減化)原体コストの低減化	工程簡略化	特開 2001-206846 99.12.20 A61K31/4545 [被引用 1 回]	延長放出経口用量組成物	
		特表 2005-521743 02.02.20 C07D401/14,CSP	CCR5 アンタゴニストとしてのピペリジン化合物およびピペラジン化合物の合成	

表 2.3.4 シェリング・プラウの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(2/5)

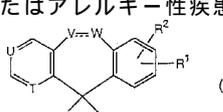
技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	化学伝達物質遊離抑制剤	特表 2002-507991 97.07.02 C07D401/04	8-クロロ-6,11-ジヒドロ-11-(4-ピペリジリデン)-5H-ベンゾ[5.6]シクロヘプタ[1.2-b]ピリジンの多形物
			特表 2001-519428 97.10.10 C07D401/04	エチル 4-(8-クロロ-5,6-ジヒドロ-11H-ベンゾ[5.6]シクロヘプタ[1.2-b]ピリジン-11-イリデン)-1-ピペリデンカルボキシレート多形物
			特表 2003-509459 99.09.22 A61K31/435	アレルギー状態および炎症状態の処置
			特表 2003-512429 99.10.22 A61K31/4545	デスロラタジンをを用いた睡眠障害処置
			特表 2003-518045 99.12.21 A61K31/444	小児患者におけるアレルギー性状態および炎症性状態の処置のためのデスロラタジンの使用
			特表 2003-521515 00.02.03 A61K31/4545	アレルギー状態および炎症状態の処置
			特表 2003-528823 00.02.03 A61K31/444	アレルギー状態および炎症状態の処置のためのデスロラタジンの使用
			特表 2004-534820 01.06.20 A61K31/4545	鼻うつ血および鼻閉塞の処置のための抗ヒスタミン薬
	ヒスタミン H1 拮抗剤	拮抗剤	特表 2001-522835 97.11.07 C07D233/64, 105 [被引用 1 回]	フェニル-アルキル-イミダゾール型の H3 レセプターリガンド
	ロイコトリエン拮抗剤	拮抗剤	特表 2002-500646 (みなし取下) 97.05.23 C07C405/00, 501	ロイコトリエン-B 下 4-誘導体、特にオキシモ-LTB 下 4-拮抗剤
	複数の作用機序を持つ薬剤	複数の作用機序を持つ薬剤	特表 2001-526232 97.12.23 A61K31/47	少なくとも一つのロイコトリエンアンタゴニストおよび少なくとも一つの抗ヒスタミン剤を含有する呼吸器および皮膚疾患処置のための組成物
			特表 2004-509870 00.09.20 C07D403/12	ヒスタミン H1 およびヒスタミン H3 双方のアゴニストまたはアンタゴニストとしての置換イミダゾール
			特表 2004-509871 00.09.20 C07D401/12	二重ヒスタミン H1 および H3 のアゴニストまたはアンタゴニストとしての置換イミダゾール
	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	サイトカインに関わる薬剤 / 抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤	特表 2002-501472 96.06.20 C07D471/04, 113	IL-4 および G-CSF に影響するナフチリジン類
			特表 2003-530351 00.04.07 A61K31/4545	サイトカイン生成の阻害
	サイトカインに関わる薬剤 / その他のサイトカインに関わる薬剤	特許 2965357 93.12.06 C07D211/14	<p>三環式誘導体および薬剤におけるそれらの使用 式(1)の化合物を含有する薬学的組成物、腫瘍壊死因子 - の阻害方法、および敗血症性ショック、炎症、またはアレルギー性疾患の治療方法。</p> 	

表 2.3.4 シェリング・プラウの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(3/5)

技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発 (つづき)	ケモカインに関わる薬剤 / CC ケモカインに関わる薬剤	特表 2002-543185 (特許 3722700) 99.05.04 C07D401/04 [被引用 3 回]	CCR5 アンタゴニストとして有用なピペラジン誘導体
			特表 2002-543186 99.05.04 C07D211/58 [被引用 3 回]	CCR5 アンタゴニストとして有用なピペラジン誘導体
		ケモカインに関わる薬剤 / CXC ケモカインに関わる薬剤	特表 2004-529911 01.02.02 C07C221/00 ファーマコペイア	CXC ケモカインレセプターアンタゴニストとしての 3,4-二置換シクロブテン-1,2-ジオン
新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤	特表 2005-502682 01.08.29 C07D401/14	CCR5 アンタゴニストとして有用なピペリジン誘導体	
		特表 2005-502684 01.08.28 C07D487/14	多環式グアニンホスホジエステラーゼ V 阻害剤	
	ケモカインに関わる薬剤 / CC ケモカインに関わる薬剤	特表 2004-525157 01.03.29 C07D401/14	AIDS の処置に有用な CCR5 アンタゴニスト	
	ケモカインに関わる薬剤 / CXC ケモカインに関わる薬剤	特表 2005-505595 01.10.12 C07D207/456 ファーマコペイア	CXC-ケモカインレセプターアンタゴニストとしての 3,4-二置換マレイミド化合物	
	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 脂質メディエーターに関わる薬剤	特表 2005-508380 01.11.06 C07C59/135	リポキシン A4 類似体	
	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / その他の化学伝達物質に関わる薬剤	特表平 9-505298 93.11.15 C07D233/64, 103 [被引用 7 回]	H3-レセプターアンタゴニストとしてのフェニル-アルキルイミダゾール	
		特表 2001-522836 97.11.07 C07D233/64, 106	H3 レセプターアンタゴニストとしてのフェニル-アルキル-イミダゾール	
		特表 2002-527513 98.10.16 C07D401/06	ヒスタミン-H3 アゴニストまたはアンタゴニストとしての N-(イミダゾリルアルキル)置換環式アミン	
		特表 2002-539121 99.03.08 C07D233/64, 105	ヒスタミン H3 リガンドとしてのイミダゾール化合物	
		特表 2004-520435 01.03.13 C07D211/34 ファーマコペイア	新規非イミダゾール化合物	
	神経ペプチドに関わる薬剤 / タキキニンに関わる薬剤	特表平 11-504921 95.05.02 C07D401/12, 241 [被引用 1 回]	ニューロキニンアンタゴニストとしてのピペラジン誘導体	
		特開平 10-251228 97.03.06 C07D211/14	ニューロキニンアンタゴニストとしてのピペリジン誘導体	

表 2.3.4 シェリング・プラウの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(4/5)

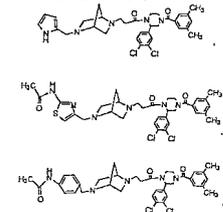
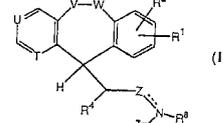
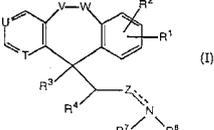
技術要素 /	(課題)課題 /課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発(つづき)	神経ペプチドに関わる薬剤 / タキキニンに関わる薬剤(つづき)	特表 2001-507351 (みなし取下げ) 96.12.20 C07D471/10,101	ニューロキニンアンタゴニストとしてのスピロ置換アザ環式置換ピペラジノ誘導体
			特表 2002-509151 98.01.14 C07D487/08	ニューロキニンアンタゴニストとしてのピペラジノ誘導体
			特表 2003-505420 99.07.26 A61K45/06 [被引用 1 回]	咳を処置するのに使用するノシセプチンレセプタ ORL-1
			特表 2005-508367 01.11.07 C07D451/06	ノシセプチンレセプタ ORL-1 用の優れたリガンドとしてのヘテロアリアル誘導体
	神経ペプチドに関わる薬剤 / その他の神経ペプチドに関わる薬剤	神経ペプチドに関わる薬剤 / その他の神経ペプチドに関わる薬剤	特許 3447745 95.08.31 C07D401/12 [被引用 1 回]	ニューロキニンアンタゴニストとしてのピペラジノ誘導体 本発明の化合物は、ニューロキニンアンタゴニストである。これらの化合物は、喘息などの慢性気道疾患の処置に有用である。
				
			特許 3315970 95.08.31 C07D401/12	ニューロキニンアンタゴニストとしてのピペラジノ誘導体 ニューロキニンアンタゴニストであって、喘息などの慢性気道疾患の処置に有用である、式(1)の化合物もしくはその任意のエナンチオマー、またはその薬学的に受容可能な塩。
	複数の作用機序に関わる薬剤	複数の作用機序に関わる薬剤	特表 2002-527381 98.10.09 A61K45/06	アレルギー性疾患を処置するための組成物および方法
			特表 2002-527406 98.10.09 A61K45/06	アレルギー性疾患を処置するための組成物および方法
			特表 2004-514709 00.09.20 C07D213/38	ヒスタミン H1 および H3 の二重アゴニストまたは二重アンタゴニストとしての置換イミダゾール
新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	サイトカインに関わる薬剤 / その他のサイトカインに関わる薬剤	特許 2793914 93.12.06 C07C211/31	三環式誘導体および薬剤におけるそれらの使用 式(1)の化合物、及びこれを含有する薬学的組成物、腫瘍壊死因子- の阻害方法、および敗血症性ショック、炎症、またはアレルギー性疾患の治療方法。	
				

表 2.3.4 シェリング・プラウの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(5/5)

技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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	
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系・炎症系に作用する薬剤開発(つづき)	ケモカインに関わる薬剤/その他のケモカインに関わる薬剤	特許 2793915 93.12.06 C07C217/52	<p>三環式誘導体、それらを含む薬学的組成物 式(1)の化合物、及びこれを含む薬学的組成物、腫瘍壊死因子- の阻害方法、敗血症性ショック、炎症、またはアレルギー性疾患の治療方法。</p>  <p>(1)</p>	
		複数の作用機序に関わる薬剤	特表 2000-510105 96.04.23 C07D307/33 [被引用 6 回]	PDE-IV 抑制剤としてのキラルフェニルジヒドロフラン	
			特表 2005-513125 01.12.20 C07C61/39	炎症性障害を治療する化合物	
			特表 2005-522447 02.02.15 A61K45/00	インターロイキン 12 及び IFN により介在される免疫反応を中断するための微小グリア細胞インヒビター	
			特表 2005-521686 02.02.15 C07D401/04, CSP	1-フェニル-2-ヘテロアリアル-置換されたベンズイミダゾール誘導体類、免疫学的疾患の処理のための薬物の調製のためへのそれらの使用	
高分子医薬品 / 抗体医薬品 /	新規作用点に対する薬剤開発/作用機作非特定	その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤	特表 2002-504145 97.06.17 C07D471/04, 112 特表 2002-521472 98.07.27 C07D211/52 [被引用 2 回] 特表 2004-536123 01.07.09 C07D235/26 特表 2005-509674 01.11.16 C07D205/04	<p>ファルネシルタンパク質トランスフェラーゼの阻害のために有用なビスピロ-シクロヘプタン化合物</p> <p>ノシセプチンレセプター-ORL-1 に対する高親和性リガンド</p> <p>小グリア細胞-活性化-関連疾患、例えば炎症、アレルギー感染又は自己免疫疾患を処理するためのベンズイミダゾール誘導体類</p> <p>ノシセプチンレセプター-ORL-1 の配位子として有用なアゼチジニルジアミン</p>	
	作用点非特定の薬剤開発	(作用点非特定の薬剤)	特表 2004-511553 00.10.17 C07D213/73	抗アレルギー剤としてのピペリジン化合物	
	高分子医薬品 / 蛋白質医薬品 /	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系に作用する薬剤開発	樹状細胞(抗原提示細胞)の機能調節に関わる薬剤	特表 2005-516606 02.02.01 C12N5/06, ZNA	哺乳動物のサイトカイン;関連する試薬の使用
			サイトカインに関わる薬剤/その他のサイトカインに関わる薬剤	特表 2004-501088 00.04.18 A61K45/00, ZNA	サイトカインの使用;組成物;方法
	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	ケモカインに関わる薬剤/その他のケモカインに関わる薬剤	特表 2005-502723 01.09.20 A61K45/00	免疫応答のアジュバントとしてのケモカイン	

2.4 武田薬品工業

2.4.1 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（2005年3月末）
従業員数	5,937名（2005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、2002年度までに医薬外事業の自立化をほぼ完了し、03年度から医薬に特化した展開を進めている。

生活習慣病、癌・泌尿器疾患、中枢神経系疾患、消化器疾患 LCM（LCM：Life Cycle Management）の4つの領域を研究開発の重点疾患領域としている。

主力製品には「リュープリン」（前立腺がん・子宮内膜症治療剤）、「タケプロン」（消化性潰瘍治療剤）、「プロプレス」（高血圧症治療剤）、「アクトス」（糖尿病治療剤）などがある。

（出典：<http://www.takeda.co.jp/>）

2.4.2 製品例

抗アレルギー剤関連製品

医療用医薬品

- 「プロニカ」（気管支喘息治療薬）
- 「ソルファ」（気管支喘息治療薬、アレルギー性鼻炎治療薬）

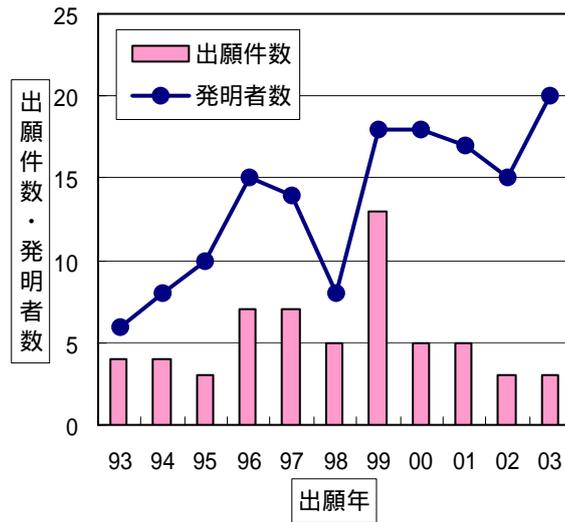
（出典：<http://www.takeda.co.jp/>）

2.4.3 技術開発拠点と研究者

開発拠点：茨城県つくば市和台10 武田薬品工業株式会社 筑波地区研究部門
大阪府大阪市淀川区十三本町2-17-85 武田薬品工業株式会社 大阪工場地区研究部門

図2.4.3に武田薬品工業の抗アレルギー剤の出願件数と発明者数の年次推移を示す。2000年以降、出願件数、発明者とも急増し安定的に出願されている。

図 2.4.3 武田薬品工業の抗アレルギー剤に関する出願件数と発明者数

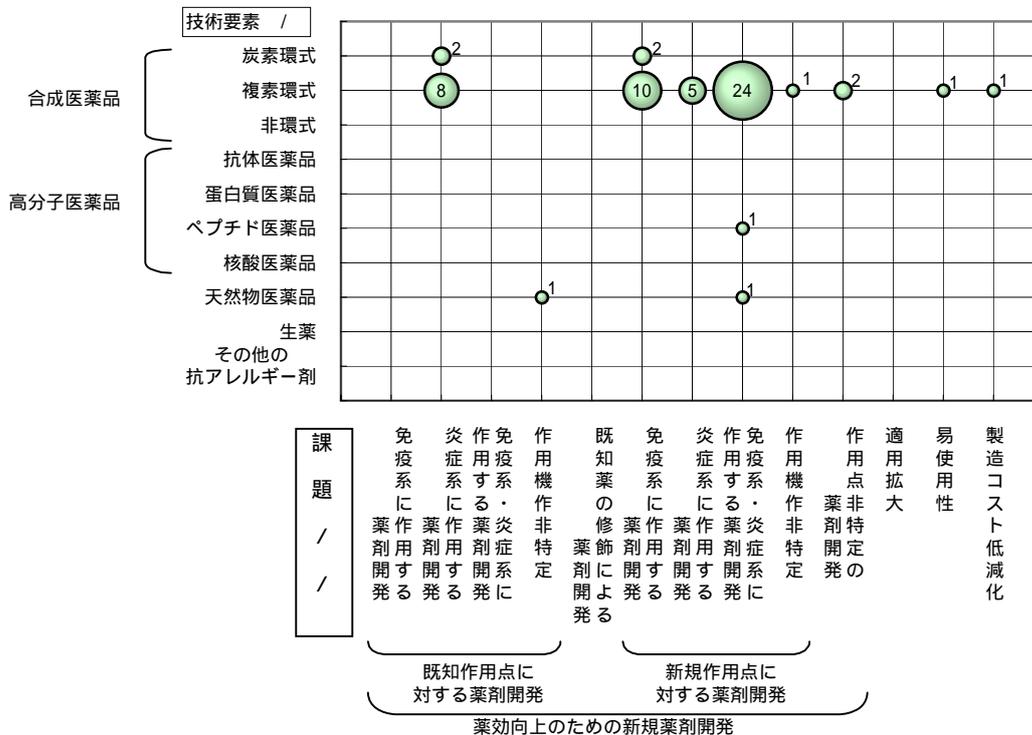


2.4.4 技術開発課題対応特許の概要

図 2.4.4-1 に抗アレルギー剤に対する技術要素と課題の分布を示す。

武田薬品工業では合成医薬品の開発が主流であり、化合物としては複素環式化合物が大部分である。ペプチド医薬品、天然物医薬品の出願もある。

図 2.4.4-1 武田薬品工業の抗アレルギー剤の技術要素と課題の分布



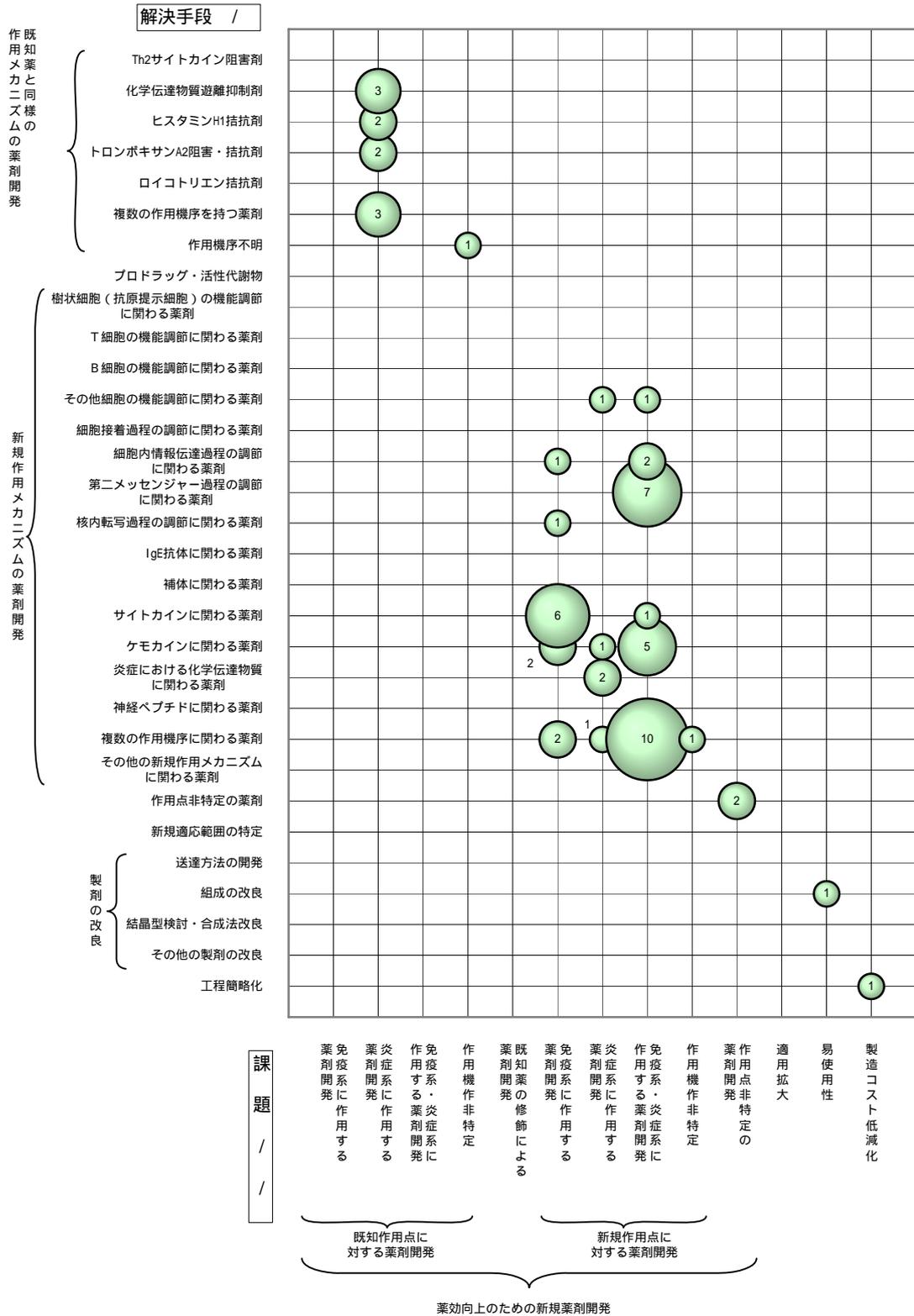
(1993年1月～2003年12月の出願)

図 2.4.4-2 に抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布を示す。

「新規作用点に対する薬剤開発」の課題では、「免疫系・炎症系に作用する薬剤開発」が主で、解決手段としては「複数の作用機序に関わる薬剤」10 件、「第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤」7 件、「ケモカインに関わる薬剤」5 件（CC ケモカイン拮抗剤、MIP-1 /RANTES 拮抗剤）で対応している。

課題の中で「既知作用点に対する薬剤開発」については、「炎症系に作用する薬剤開発」が主で、解決手段としては、「化学伝達物質遊離抑制剤」3 件、「ヒスタミン H1 拮抗剤」2 件、「トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤」2 件などで対応している。

図 2.4.4-2 武田薬品工業の抗アレルギー剤の課題と解決手段の分布



(1993年1月～2003年12月の出願)

表 2.4.4 に武田薬品工業の抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許を示す。出願件数は 59 件であり、そのうち登録になっている特許は 6 件である。

なお、表 2.4.4 では図 2.4.4-2 の解決手段 を細展開した解決手段 まで分析している。

表 2.4.4 武田薬品工業の抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許 (1/5)

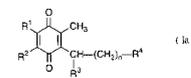
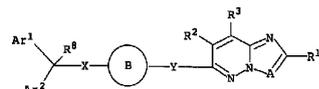
技術要素 /	(課題)課題 /課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 炭素環式	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤	特許 2742221 (権利消滅) 93.09.21 A61K31/12, ABF [被引用 1 回]	抗アレルギー性鼻炎剤 アレルギー性鼻炎に対して優れた治療効果を奏する抗アレルギー性鼻炎剤で、下記 (Ia) で表されるキノン誘導体またはそのヒドロキノン体を有効成分とする。 
			特開 2002-47177 00.05.26 A61K31/192	気管支作用剤
	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	サイトカインに関わる薬剤 / 抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤	特開平 8-217731 (みなし取下げ) 95.02.10 C07C225/24	キノン誘導体
特開平 8-231389 (みなし取下げ) 94.12.26 A61K31/19, AED [被引用 1 回]			抗皮膚炎剤	
合成医薬品 / 複素環式	(易使用性) 保存安定性	組成の改良	特開 2003-252762 01.12.25 A61K31/4545	酸配合製剤
	(製造コスト低減化) 原体コストの低減化	工程簡略化	特開 2000-191663 98.10.21 C07D487/04, 144	縮合ピリダジン誘導体の製造法
	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	化学伝達物質遊離抑制剤	特開平 7-149650 (みなし取下げ) 93.09.24 A61K31/505, ABF 富士産業	抗アレルギー剤
			特許 2961534 97.04.25 C07D487/04, 144	縮合ピリダジン誘導体、その製造法および用途 優れた抗喘息作用、抗アレルギー作用を有する縮合ピリダジン誘導体、その製造法及びその医薬組成物。例えば、2-[6-[3-[4-(ジフェニルメトキシ)ピペリジノ]プロピルアミノ]イミダゾ[1,2-b]ピリダジン-2-イル]-2-メチルプロピオン酸またはその塩。 
		特開平 11-310582 97.04.25 C07D487/04, 144 [被引用 1 回]	縮合ピリダジン誘導体、その製造法および用途	

表 2.4.4 武田薬品工業の抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(2/5)

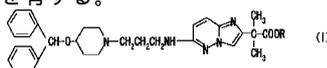
技術要素 / /	(課題)課題 / /課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要	
合成医薬品/ 複素環式(つづき)	既知作用点に対する薬剤開発/炎症系に作用する薬剤開発(つづき)	ヒスタミン H1 拮抗剤	特許 3484115 98.10.21 C07D487/04, 144	縮合ピリダジン誘導体、その製造法および用途 下記(1)で表される安定な縮合ピリダジン誘導体の水和物、コハク酸塩またはクエン酸塩、またはそのプロドラッグ。優れた抗喘息作用、アレルギー作用を有する。  (1)	
			特開 2000-198735 98.10.28 A61K31/5025	縮合ピリダジン誘導体を含有してなる医薬	
			特開平 11-152275 97.09.16 C07D239/96	含窒素縮合環化合物、その製造法および剤	
			特開 2000-178277 98.10.06 C07D487/04, 145	縮合ピリダジン化合物、その製造法および用途	
			特開 2001-199889 (取下) 99.11.11 A61K31/5025	縮合ピリダジン誘導体を含有してなる点鼻用剤	
	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系に作用する薬剤開発	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	核内転写過程の調節に関わる薬剤	特開 2004-346059 02.02.20 C07K4/00	受容体作動薬
			サイトカインに関する薬剤/抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関する薬剤	特開 2005-194198 03.12.26 A61K9/10	チエノピリジン化合物
		サイトカインに関する薬剤/炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関する薬剤	サイトカインに関する薬剤/抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関する薬剤	特開平 10-158261 (みなし取下げ) 96.03.05 C07D311/86	キサンテン誘導体、その製造法および用途
			サイトカインに関する薬剤/炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関する薬剤	特開 2001-97979 99.07.28 C07D495/14	縮合複素環化合物、その製造法および用途
		サイトカインに関する薬剤/その他のサイトカインに関する薬剤	サイトカインに関する薬剤/炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関する薬剤	特開平 9-301980 (取下) 96.03.13 C07D513/04, 375	縮合チアジン誘導体、その製造法および用途
サイトカインに関する薬剤/その他のサイトカインに関する薬剤			特開 2003-183283 (みなし取下げ) 01.12.18 C07D487/04, 140	縮合インドール化合物、その製造法および用途	
ケモカインに関する薬剤/CC ケモカインに関する薬剤		ケモカインに関する薬剤/CC ケモカインに関する薬剤	特開 2002-284777 01.03.26 C07D311/78	生理活性物質、その製造法および用途	
		ケモカインに関する薬剤/CC ケモカインに関する薬剤	特開 2003-335776 01.08.08 C07D403/12	二環性化合物、その製造法および用途	
		複数の作用機序に関わる薬剤	特開 2001-158740 99.09.20 A61K31/5025	ケモカイン・サイトカイン発現抑制剤	
複数の作用機序に関わる薬剤		置換 1,3-チアゾール化合物、その製造法および用途	特開 2002-302488 00.03.30 C07D417/04		

表 2.4.4 武田薬品工業の抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(3/5)

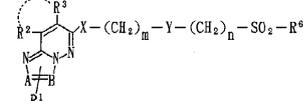
技術要素 / /	(課題)課題 / /課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品/ 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発/炎症系に作用する薬剤開発	その他細胞の機能調節に関わる薬剤	特開 2005-35993 02.02.20 A61K31/196	カンナビノイド受容体調節剤
		ケモカインに関わる薬剤/CC ケモカインに関わる薬剤	特開 2004-2402 02.04.24 A61K31/445	CCR 拮抗作用を有する化合物の用途
		炎症における化学伝達物質に関わる薬剤/脂質メディエーターに関わる薬剤	特開平 6-345767 (拒絶査定確定) 93.04.12 C07D487/04,145	トリアゾロピリダジン誘導体、その製造法および製剤
		炎症における化学伝達物質に関わる薬剤/その他の化学伝達物質に関わる薬剤	W000/44756 (却下) 99.01.28 C07D513/04,355	チアゾロピリミジン化合物、その製造法および用途
		複数の作用機序に関わる薬剤	W099/14203 (却下) 97.09.16 C07D239/96	含窒素縮合環化合物、その製造法および剤
	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	その他細胞の機能調節に関わる薬剤	特許 3143697 (権利消滅) 93.09.21 A61K31/5025	好酸球化学遊走抑制剤 下記で表される化合物またはその塩を含有すること好酸球化学遊走抑制剤。アレルギー性鼻炎またはアトピー性皮膚炎などの治療剤または予防剤として有用である。 
		細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特開 2001-114690 99.08.06 A61K31/4439	p38MAP キナーゼ阻害剤
		第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤/PDE4に関わる薬剤	特開 2000-95759 98.07.21 C07D209/66	三環性化合物、その製造法および剤
			特開 2001-233875 99.10.12 C07D401/14	ピリミジン-5-カルボキサミド化合物、その製造法およびその用途
			特開 2001-335579 00.03.23 C07D491/048	フロイソキノリン誘導体、その製造法および用途
		W001/27105 (却下) 99.10.12 C07D403/04	ピリミジン-5-カルボキサミド化合物、その製造法および用途	
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤/アデノシンに関わる薬剤	特開平 11-193281 97.10.27 C07D417/04,213	アデノシン A3 受容体拮抗剤およびチアゾール化合物	
		特開 2000-281685 99.01.28 C07D513/04,355	チアゾロピリミジン化合物、その製造法および用途	
		特開 2004-67690 02.07.26 C07D491/048	フロイソキノリン誘導体およびその用途	

表 2.4.4 武田薬品工業の抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(4/5)

技術要素 /	(課題)課題 /課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系・炎症系に作用する薬剤開発(つづき)	ケモカインに関わる薬剤/CC ケモカインに関わる薬剤	特開平 9-249570 (みなし取下げ) 96.03.19 A61K31/55, AED	ベンゾジアゼピン化合物含有ケモカイン受容体拮抗剤
			特開平 9-249566 (みなし取下げ) 96.03.19 A61K31/445, AED [被引用 2 回]	ピペリジン化合物含有ケモカイン受容体拮抗剤
			特開平 9-255572 (みなし取下げ) 96.03.26 A61K31/435, AED	ケモカイン受容体拮抗剤
			特開平 10-81665 (みなし取下げ) 95.12.28 C07D207/12	MIP-1 /RANTES 受容体拮抗剤
			特開平 11-71350 (みなし取下) 97.06.17 C07D211/52	ヒドロキシピペリジン化合物およびその剤
	複数の作用機序に関わる薬剤		特許 2949473 94.09.16 C07D487/04, 145 [被引用 3 回]	トリアゾロピリダジン誘導体、その製造法、中間体および剤 優れた抗喘息作用、抗アレルギー作用を有するトリアゾロピリダジン誘導体、その製造法及びその医薬組成物で、例えば 6-(2,2-ジメチル-3-スルファモイル-1-プロポキシ)-7-イソプロピル [1,2,4]トリアゾロ [1,5-b]ピリダジンまたはその塩 (図なし)
			特開平 9-263586 (みなし取下げ) 96.01.23 C07D487/04, 144	イミダゾピリダジン誘導体、その製造法、中間体および剤
			特開平 9-328485 (取下) 94.09.16 C07D487/04, 145	トリアゾロピリダジン誘導体、その製造法、中間体および剤
			特開平 10-204087 (みなし取下げ) 96.11.25 C07D487/04, 145	縮合ピリダジン誘導体、その製造法および剤
			特開平 11-240882 97.12.24 C07D487/04, 146	縮合ピリダジン誘導体、その製造法および用途
			特許 3333774 99.04.23 C07D417/04	5-ピリジル-1,3-アゾール化合物、その製造法及び用途 優れたアデノシン A3 受容体拮抗作用、p38MAP キナーゼ阻害作用、TNF- α 阻害作用を有する化合物、例えば N-[4-{2-エチル-4-(3-メチルフェニル)-1,3-チアゾール-5-イル}-2-ピリジル}ベンズアミド、等 (図なし)
			特開 2001-342188 00.03.27 C07D471/04, 106	縮合ピラゾール誘導体、その製造法および用途

表 2.4.4 武田薬品工業の抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(5/5)

技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発 (つづき)	複数の作用機序に関わる薬剤 (つづき)	特開 2002-302458 00.12.26 A61K45/06	併用薬
			W001/10865 (却下) 99.08.06 C07D417/04	p38MAP キナーゼ阻害剤
	新規作用点に対する薬剤開発 / 作用機作非特定	(作用点非特定の薬剤)	特開 2002-363179 99.04.23 C07D417/04	5-ピリジル-1,3-アゾール化合物、その製造法及び用途
			W001/21177 (却下) 99.09.20 A61K31/5025	ケモカイン・サイトカイン発現抑制剤
	作用点非特定の薬剤開発	(作用点非特定の薬剤)	W001/34152 (却下) 99.11.11 A61K31/5025	縮合ピリダジン誘導体を含有してなる点鼻用剤
		特開 2003-252797 01.12.25 A61K45/08	酸配合製剤	
高分子医薬品 / ペプチド医薬品	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特開 2005-34131 02.11.07 C12N15/09, ZNA	新規な FPRL1 リガンドおよびその用途
天然物医薬品 / 植物由来	既知作用点に対する薬剤開発 / 作用機作非特定	作用機序不明	特開平 7-215846 (みなし取下げ) 94.01.28 A61K31/015, ABF	抗アレルギー剤
天然物医薬品 / 微生物由来	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	サイトカインに関わる薬剤 / 炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤	特開平 9-176105 (みなし取下げ) 95.12.27 C07C259/06	TAN-2451 関連化合物、その製造法および用途

2.5 アストラゼネカ（イギリス）

2.5.1 企業の概要

商号	AstraZeneca PLC
本社所在地	15 Stanhope Gate W1K 1LN, London
設立年	1999年4月
資本金	N/A
従業員数	約64,000名（グループ全体）
事業内容	循環器、消化器、神経科学、癌、呼吸器・炎症等の分野の医薬品の開発、製造、販売

アストラゼネカは総合医薬品メーカーである。抗アレルギー剤では、経口ロイコトリエン受容体拮抗薬を販売。アレルギー関連では、ステロイド剤を販売している。

アストラゼネカ名義の出願には、合併前の「アストラ PHARM (Astra Pharm)」、「ゼネカ (Zeneca)」、「ゼネカファルマ (Zeneca Pharm)」名義の出願を併せて解析を行った。

主力製品には「Exanta」（経口抗トロンピン直接阻害剤：循環器障害）、「Plendil」（カルシウム拮抗剤：高血圧、狭心症、薬）、「Seloken/Toprol-XL」（βブロッカー：高血圧、狭心症、心不全薬）、「Losec/PriLOSEC, Nexium」（プロトンポンプ阻害剤：胃酸関連消化器疾患用）、「Diprivan」（静脈麻酔剤）、「Naropin, Xylocaine」（局所麻酔剤）、「Arimidex」（アロマターゼ阻害剤：乳癌）、「Casodex」（抗アンドロゲン剤：前立腺癌）、「Faslodex, Nolvadex」（抗エストロゲン薬：乳癌）などがある

（出典：<http://www.astrazeneca.co.jp/company/aboutus/world04.html>）

2.5.2 製品例

抗アレルギー剤関連製品

医療用医薬品

- 「Accolate」（経口ロイコトリエン受容体拮抗薬：喘息）
- 「Rhinocort」（ステロイド剤：喘息、鼻炎）

（出典：<http://www.astrazeneca.co.jp/company/aboutus/world04.html>）

2.5.3 技術開発拠点と研究者

開発拠点：

AstraZeneca R&D, Alderley Park, UK

AstraZeneca R&D, Charnwood, UK

AstraZeneca R&D, MoeIndal, Sweden

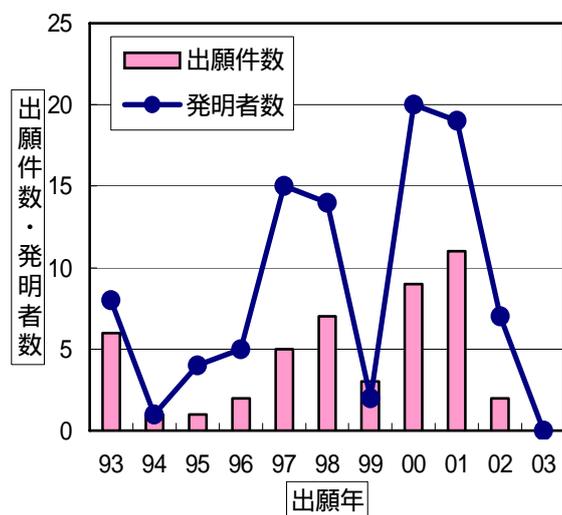
AstraZeneca R&D, Boston USA, , Wilmington USA

(<http://www.astrazeneca.co.jp/company/aboutus/world05.html>)

研究者数：11,900名

図 2.5.3 にアストラゼネカの抗アレルギー剤の出願件数と発明者数の年次推移を示す。出願件数は 99 年を除いて 93～2001 年まで比例的に増加している。

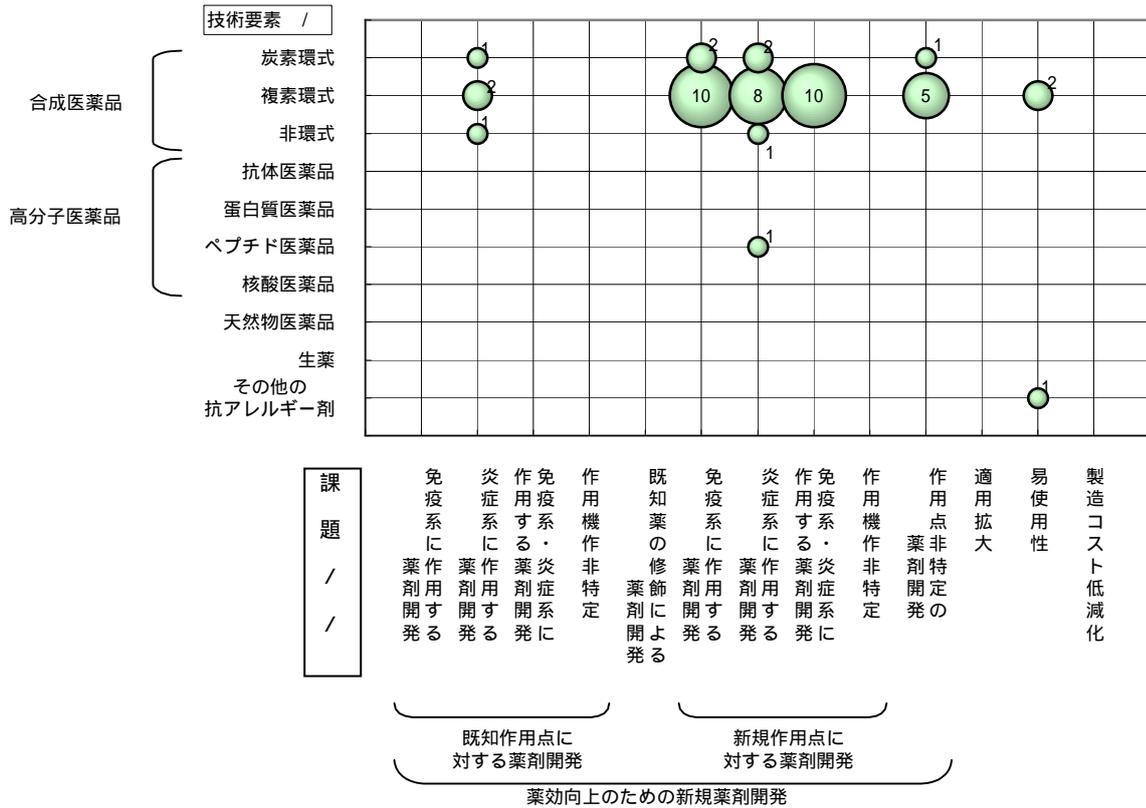
図 2.5.3 アストラゼネカの抗アレルギー剤に関する出願件数と発明者数



2.5.4 技術開発課題対応保有特許の概要

図 2.5.4-1 に抗アレルギー剤に対する技術要素と課題の分布を示す。アストラゼネカでは合成医薬品の開発が主流であり、化合物としては複素環式化合物が主である。

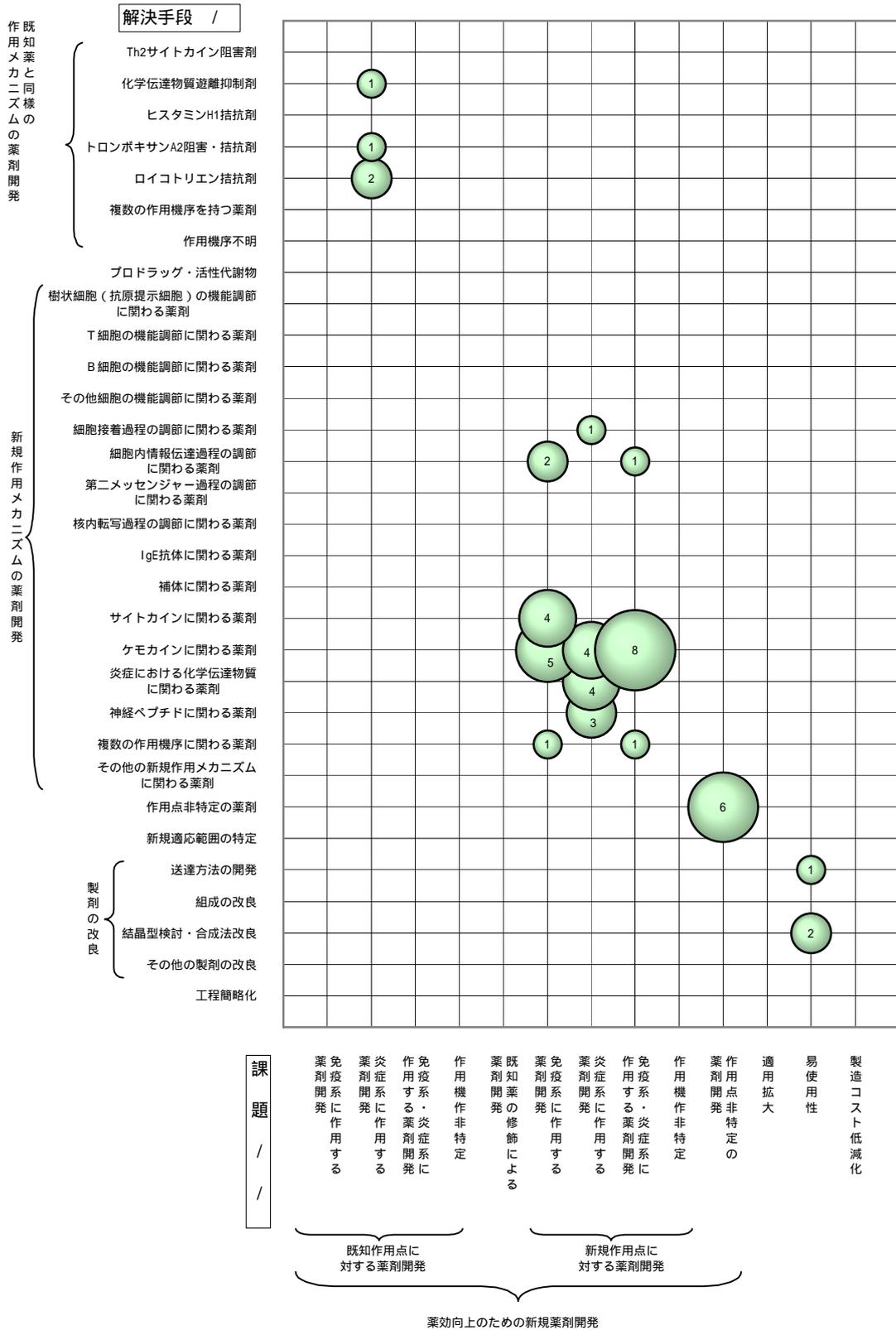
図 2.5.4-1 アストラゼネカの抗アレルギー剤に関する技術要素と課題



(1993年1月～2003年12月の出願)

図 2.5.4-2 にアストラゼネカに関する課題と解決手段の分布を示す。中心的な課題は「新規作用点に対する薬剤開発」で、その内で特に「炎症系に作用する薬剤開発」の解決手段としては「ケモカインに関わる薬剤」4件、「炎症における化学伝達物質に関わる薬剤」4件、「神経ペプチドに関わる薬剤」3件で対応している。また、「免疫系・炎症系に作用する薬剤開発」については、「ケモカインに関わる薬剤」で対応しているものが8件である。

図 2.5.4-2 アストラゼネカの抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布



(1993年1月～2003年12月の出願)

表 2.5.4 にアストラゼネカの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許を示す。出願件数は 47 件であり、そのうち登録になっている特許は 1 件である。

なお、表 2.5.4 では図 2.5.4-2 の解決手段 を細展開した解決手段 まで分析している。

表 2.5.4 アストラゼネカの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(1/4)

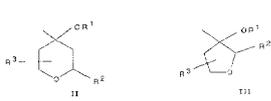
技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 炭素環式	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	ロイコトリエン拮抗剤	特開平 7-133275 (みなし取下げ) 93.02.05 C07D409/04,317	アセトアニリド誘導体、該化合物の製造法および単独または部分的に、該化合物を含有する、1つまたはそれ以上のロイコトリエンによって媒介された疾病または医学的症狀の処置のための医薬品
	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	サイトカインに関わる薬剤 / その他のサイトカインに関わる薬剤	特表 2002-522421 98.08.04 C07D213/82 特表 2002-525358 98.09.25 C07D213/81	サイトカイン産生の阻害剤として有用なアミド誘導体 ベンズアミド誘導体及びサイトカイン阻害剤としてのその使用
	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 脂質メディエーターに関わる薬剤	特表平 8-511011 (みなし取下げ) 93.06.07 C07D405/12,215	アニリン誘導体
		神経ペプチドに関わる薬剤 / タキキニンに関わる薬剤	特表 2002-541137 99.04.06 C07C255/57	ニューロキニン-1 受容体アンタゴニストとしての N-(2-フェニル-4-アミノ-ブチル)-1-ナフトアミド
	作用点非特定の薬剤開発	(作用点非特定の薬剤)	特表 2002-508319 97.12.12 A61K31/167	上気道における炎症 / アレルギーのための薬物でのホルモテロールの使用
	合成医薬品 / 複素環式	(易使用性)保存安定性	結晶型検討・合成法改良	特表 2002-530318 98.11.23 C07C231/22 特表 2002-530319 98.11.23 C07B63/00
既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発		トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤	特開平 7-53378 (みなし取下げ) 93.07.27 A61K31/47, AED	チアゾール誘導体、その製造方法およびロイコトリエンが介在する疾患または症状に使用するためのそれを含有する調剤学的組成物
		ロイコトリエン拮抗剤	特許 3553127 93.04.29 C07D405/12 シンジエンタ	エーテル誘導体、その製造方法およびロイコトリエンが介在する疾患または症状に使用するためのそれを含有する調剤学的組成物 下記 I のエーテル誘導体またはその塩、その製造方法ならびにその調剤学的組成物。アラキドン酸の 5-L0 による接触酸化が関係する多様な炎症及び / 又はアレルギー性疾患の治療薬 
新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発		細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特表 2004-524361 01.03.30 C07D215/08 特表 2004-533452 01.05.11 C07D215/54	STAT6-モジュレーターとしてのテトラヒドロキノリン誘導体、それらの製造および使用 新規 4-アニリノキノリン-3-カルボキサミド

表 2.5.4 アストラゼネカの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(2/4)

技術要素 /	(課題)課題 /課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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	
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発 (つづき)	サイトカインに関わる薬剤 / その他のサイトカインに関わる薬剤	特表 2002-540112 99.03.23 C07D471/04,117 特表 2003-511442 99.10.13 C07D239/42	ピリジンおよびピリミジン誘導体、およびサイトカインに媒介される疾患の阻害物質としてのそれらの使用 ピリミジン誘導体	
		ケモカインに関わる薬剤 / CC ケモカインに関わる薬剤	特表 2004-520423 01.03.01 C07D211/58 特表 2005-513017 01.11.15 C07D211/58,CSP	CCR5 モジュレーターとしての N-ピペリジニル化合物 ケモカイン受容体(特に CCR)活性のモジュレーターとしてのピペリジン誘導体とその使用	
		ケモカインに関わる薬剤 / CXC ケモカインに関わる薬剤	特表 2005-510522 01.11.15 C07D211/58	ピペリジン誘導体およびケモカイン・レセプター(特に CCR5)活性モジュレーターとしてのその使用	
		ケモカインに関わる薬剤 / CXC ケモカインに関わる薬剤	特表 2003-522189 00.02.11 C07D473/24 特表 2003-522191 00.02.11 C07D473/24	ケモカインレセプター活性のモジュレーターとしてのピリミジン化合物およびそれらの使用 ケモカイン受容体活性のモジュレーターとしてのピリミジン化合物およびそれらの使用	
		複数の作用機序に関わる薬剤	特表 2001-501180 (みなし取下げ) 96.09.05 C07D231/54	新規なアリアルピリダジン	
		新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	細胞接着過程の調節に関わる薬剤	特表 2003-520790 00.01.21 C07C275/42	VLA-4 のためのインヒビターとしての尿素化合物
		ケモカインに関わる薬剤 / CC ケモカインに関わる薬剤	特表 2003-535079 00.05.31 C07D211/46 [被引用 2 回] 特表 2004-536112 01.07.02 C07D211/46 特表 2005-511621 01.11.16 C07D211/58,CSP	化学化合物 ケモカイン受容体活性のモジュレーターとして有用なピペリジン誘導体 ケモカインレセプターの調節物質としての新規ピペリジン誘導体	
ケモカインに関わる薬剤 / CXC ケモカインに関わる薬剤	特表 2004-500420 00.04.07 C07D249/12,509	新規化合物			
炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 脂質メディエーターに関わる薬剤	特表 2005-525327 02.02.05 A61K38/00,ZNA	喘息、COPD、および他の疾患の処置におけるインドール-3-酢酸の使用			
神経ペプチドに関わる薬剤 / タキキニンに関わる薬剤	特表 2002-526410 98.10.07 C07D211/76	タキキニン受容体拮抗剤としてのナフタレンカルボキサミド			
神経ペプチドに関わる薬剤 / その他の神経ペプチドに関わる薬剤	特開平 8-208605 94.10.25 C07D211/52 [被引用 1 回]	治療用複素環式化合物			
新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特表 2002-526538 98.10.01 C07D239/94	化学化合物		

表 2.5.4 アストラゼネカの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(3/4)

技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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	
合成医薬品/複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系・炎症系に作用する薬剤開発(つづき)	ケモカインに関わる薬剤/CC ケモカインに関わる薬剤	特表 2005-521650 02.01.16 C07H21/00	N-ピラジニルーフエニルスルホンアミド、およびケモカイン介在疾患の処置におけるそれらの使用	
		ケモカインに関わる薬剤/その他のケモカインに関わる薬剤	特表 2001-518090 (みなし取下) 97.03.28 C07D215/22	腫瘍壊死因子の阻害に有用な複素環により置換したヒドロキサム酸	
			特表 2003-523998 00.02.25 C07D207/12	新規化合物	
			特表 2003-523999 00.02.25 C07D207/12	新規化合物	
			特表 2004-518742 01.02.19 C07D413/12	化学化合物	
			特表 2004-524347 01.03.22 C07D211/58	ケモカイン受容体の調節剤としての新規ピペラジン誘導体	
			特表 2005-503394 01.07.23 C07D211/18	ケモカインレセプター活性の調節剤として有用なピペリジン誘導体	
			特表 2005-501869 01.08.22 C07D413/04	ケモカインレセプター活性の調節物質としての新規なピペリジニル-モルホリニル誘導体	
			複数の作用機序に関わる薬剤	特表 2003-530393 00.04.08 C07D211/56 [被引用 1 回]	化学化合物
		作用点非特定の薬剤開発	(作用点非特定の薬剤)		特表 2000-501700 (みなし取下げ) 95.12.06 C07D213/30
	特表 2000-516206 (みなし取下げ) 96.07.09 C07D239/70 [被引用 1 回]			新規な化合物	
	特表 2001-517228 (みなし取下) 97.04.01 C07D405/12			新規なピリジン誘導体およびそれを含有する医薬組成物	
	特表 2001-518115 (みなし取下) 97.03.25 C07D213/30			新規なピリジン誘導体およびそれを含有する医薬組成物	
	特表 2001-509509 (みなし取下) 97.07.09 C07D471/04,101 [被引用 1 回]			新規な化合物	

表 2.5.4 アストラゼネカの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(4/4)

技術要素 /	(課題)課題 /課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品 / 非環式	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	化学伝達物質遊離抑制剤	特表平 8-505865 (みなし取下げ) 93.01.28 C07D309/10	オキシム誘導体
	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 脂質メディエーターに関わる薬剤	特表平 8-511254 (みなし取下げ) 93.06.07 C07D405/12,215	2-オキソ-1.2.3.4-テトラヒドロキノリン誘導体
ペプチド医薬品 / 高分子医薬品		炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 起炎性プロテアーゼに関わる薬剤	特表 2002-523486 98.08.31 C07C259/06	N-ヒドロキシアシルアミノ化合物、それらの製造方法、およびそれらを含む医薬組成物
その他の抗アレルギー剤	(易使用性)投与法の改善	送達方法の開発	特表 2004-502719 00.07.11 A61K47/06	極性のフッ素化された分子を含む新規エアゾール製剤

2.6 三共

2.6.1 企業の概要

商号	三共 株式会社
本社所在地	〒103-8426 東京都中央区日本橋本町3 - 5 - 1
設立年	1913年（大正2年）
資本金	687億93百万円（2005年3月末）
従業員数	5,401名（2005年3月末）（連結：11,520名）
事業内容	医療用医薬品の製造・販売、他

三共は、2005年9月28日、第一製薬と経営統合して、持株会社「第一三共」を設立した。三共は、この持株会社傘下の事業子会社として事業を継続して、2007年4月1日に第一製薬株式会社と事業を完全統合する予定である。

循環器系疾患（動脈硬化、心疾患、腎疾患他）をフランチャイズ領域とし、糖代謝疾患（糖尿病、肥満他）、骨・関節性疾患（骨粗鬆症、慢性関節リウマチ；RA、変形性関節症；OA、他）、免疫・アレルギー性疾患（自己免疫疾患、アレルギー性疾患他）の3つ領域を研究開発の重点領域としている。

国内の研究開発品目は、ノバルティスファーマ社と共同開発している、気管支喘息、アレルギー性鼻炎治療薬IGE025（ゾレア）がPhaseIII、スギ花粉症治療薬CS-712がPhaseIIである。

主力製品には「オルメテック」（血圧降下剤）、「メバロチン」（高脂血症治療剤）「クラビット」（経口抗菌剤）、「カルプロック」（血圧降下剤）などがある。

（出典：<http://www.sankyo.co.jp/>、第151期事業報告書）

2.6.2 製品例

現在、抗アレルギー剤関連製品はない。

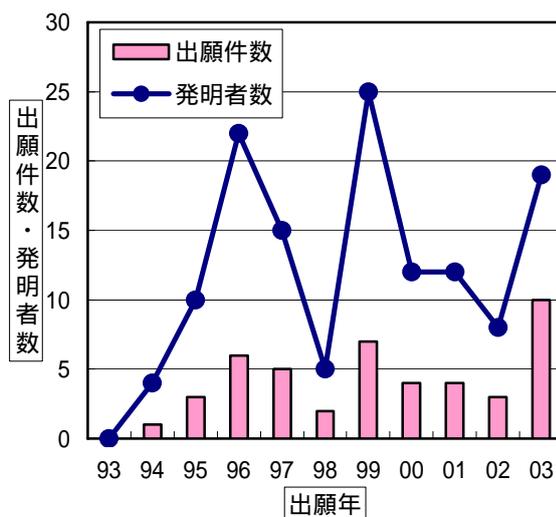
2.6.3 技術開発拠点と研究者

開発拠点：東京都品川区広町1-2-58 研究開発センター

研究者数：1,800名

図2.6.3に三共の抗アレルギー剤の出願件数と発明者数の年次推移を示す。出願件数は02年には数件程度であったが03年には10件まで増加している。

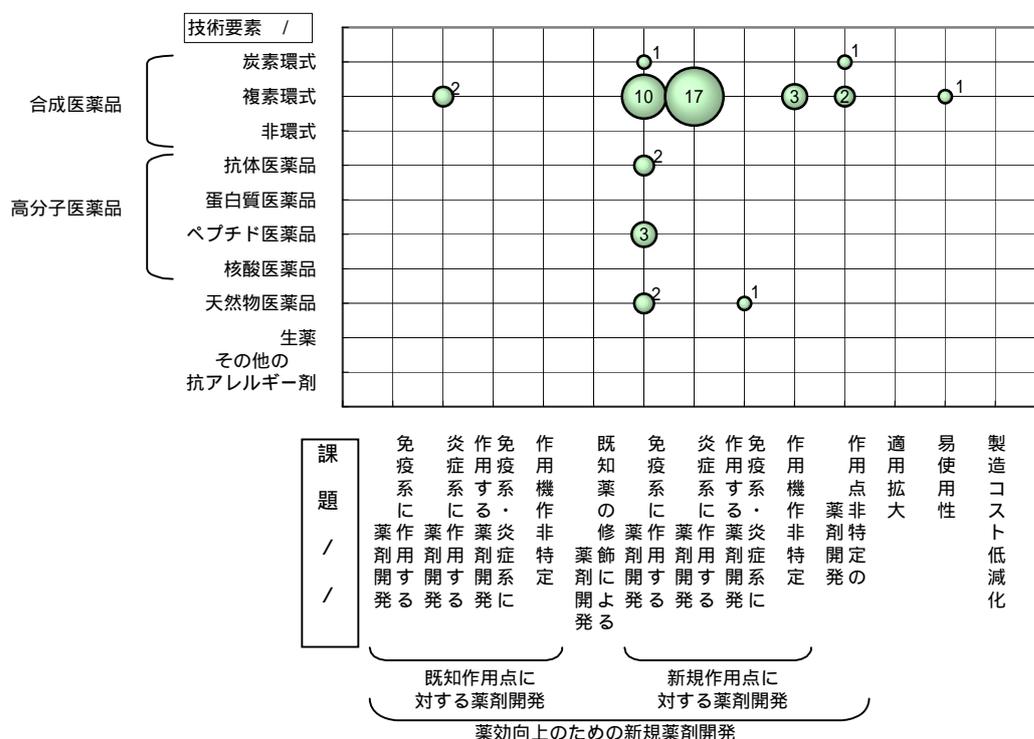
図 2.6.3 三共の抗アレルギー剤に関する出願件数と発明者数



2.6.4 技術開発課題対応保有特許の概要

図 2.6.4-1 に抗アレルギー剤に対する技術要素と課題の分布を示す。三共では合成医薬品の開発が主流であり、化合物としては複素環式化合物が大部分であるが、抗体医薬、ペプチド医薬、天然物医薬も出願されている。

図 2.6.4-1 三共の抗アレルギー剤に関する技術要素と課題

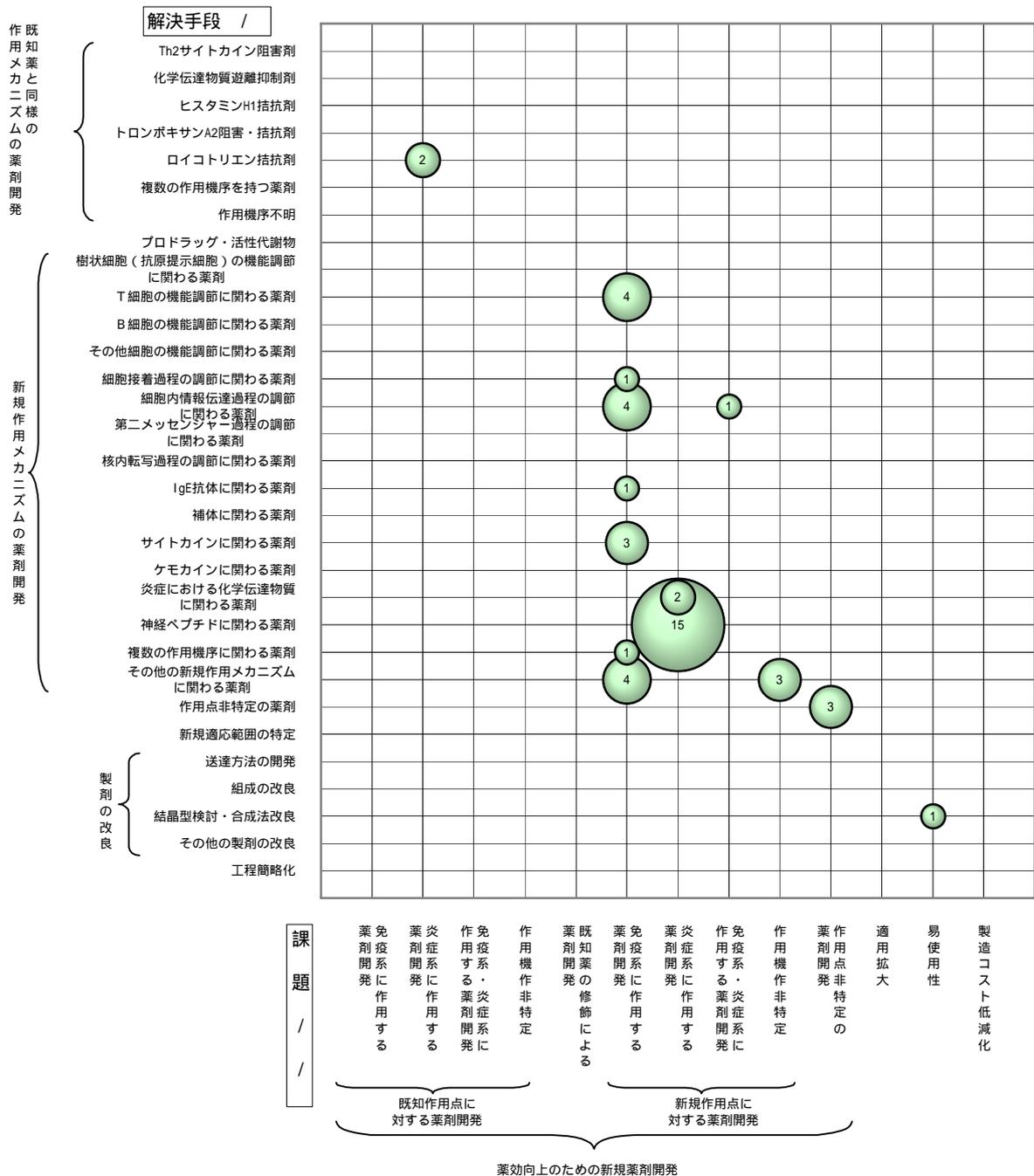


(1993年1月～2003年12月の出願)

図 2.6.4-2 に抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布を示す。「新規作用点に対する薬剤開発」については、「神経ペプチドに関わる薬剤」(サブスタンスP拮抗剤、

ニューロキニンA拮抗剤)が15件出願されている。「免疫系に作用する薬剤開発」では「T細胞の機能調節に関わる薬剤」としてペプチド医薬が4件出願されている。同じく「免疫系に作用する薬剤開発」は、「細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤」4件(微生物由来物質であるスフィンゴシンキナーゼ阻害剤)などで対応している例もある。

図 2.6.4-2 三共の抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布



(1993年1月～2003年12月の出願)

表 2.6.4 に三共の抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許を示す。出願件数は 45 件であり、そのうち登録になっている特許は 4 件である。

なお、表 2.6.4 では図 2.6.4-2 の解決手段 を細展開した解決手段 まで分析している。

表 2.6.4 三共の抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(1/4)

技術要素 /	(課題)課題 /課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
炭素環式 合成医薬品 /	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系に作用する薬剤開発	その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤	特開 2005-206586 03.12.25 C07C217/28, CSP	エーテル誘導体
	作用点非特定の薬剤開発	(作用点非特定の薬剤)	特開 2003-267936 02.01.11 C07C215/28	ベンゼン環化合物
合成医薬品 / 複素環式	(易使用性)保存安定性	結晶型検討・合成法改良	特開 2005-187459 03.12.05 C07D495/10, CSP	スルホキシド誘導体の塩酸塩の結晶
	既知作用点に対する薬剤開発/炎症系に作用する薬剤開発	ロイコトリエン拮抗剤	特開平 8-67675 (みなし取下げ) 94.08.31 C07D277/28	ビニルチアゾール誘導体
			特開平 8-198849 (みなし取下げ) 95.01.20 C07D209/18	インドール誘導体
	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系に作用する薬剤開発	T細胞の機能調節に関わる薬剤	特開 2004-2360 02.04.05 C07D498/10	オキサゾリジノン誘導体
			特開 2004-256429 03.02.26 C07D217/26	イソキノリン誘導体
			特開 2004-256435 03.02.26 C07C235/52	3-置換アミノ-2-ヒドロキシ-4-フェニル酪酸類
			特開 2004-256443 03.02.26 C07C251/60	フェニルエチリデンアミノオキシ酢酸類
		IgE 抗体に関わる薬剤	特開 2001-89452 99.09.22 C07D213/85 [被引用 1 回]	ピリミジン誘導体
		サイトカインに関わる薬剤/その他のサイトカインに関わる薬剤	特開 2001-181187 99.12.27 A61K31/4439	5員ヘテロアリアル化合物を含有する組成物
			特開 2002-284779 (みなし取下げ) 01.01.18 C07D401/04	ヘテロアリアル置換ピロール誘導体を含有する医薬
		特開 2002-284780 01.01.22 C07D401/14	4 又は 5 置換ピロール誘導体	

表 2.6.4 三共の抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(2/4)

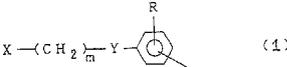
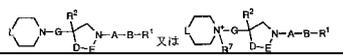
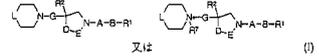
技術要素 / /	(課題)課題 / /課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品/ 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系に作用する薬剤開発(つづき)	複数の作用機序に関わる薬剤	特開 2003-40888 01.07.30 C07D401/06	イミダゾール誘導体
		その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤	特開 2004-2391 02.04.23 C07D239/49	ピリミジン誘導体
	新規作用点に対する薬剤開発/炎症系に作用する薬剤開発	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤/脂質メディエーターに関わる薬剤	特許 3268242 96.11.14 C07D235/12	縮合複素環化合物を含有する医薬 下記(1)を有する縮合複素環化合物またはその塩を有効成分として含有する医薬で、優れた血糖低下作用等を有する。 
		神経ペプチドに関わる薬剤/タキキニンに関わる薬剤	特開 2001-89468 99.07.06 C07D311/58	クロマン類縁体
			特許 3088672 95.12.01 C07D263/04	飽和複素環化合物 サブスタンス P 及びニューロキニン A 受容体拮抗作用を有する、下記(1)で示される飽和複素環化合物。 
			特開平 10-152478 (取下) 95.12.01 C07D263/04 [被引用 1 回]	飽和複素環化合物
			特開平 10-182650 (取下) 96.11.08 C07D495/10 [被引用 1 回]	光学活性スルホキシド誘導体
			特開平 10-273489 (みなし取下げ) 97.01.31 C07D495/10	ピロリジン誘導体
			特開平 11-43490 97.05.30 C07D495/10	光学活性スルホキシド誘導体の塩
			特許 3192631 97.05.28 A61K31/535	飽和複素環化合物からなる医薬 下記(1)を有する、サブスタンス P 及びニューロキニン A 受容体拮抗作用を有する医薬。 
			特開 2000-34288 98.01.23 C07D413/06, 221	スピロピペリジン誘導体
			特開平 11-286443 (みなし取下) 97.05.28 A61K31/445, 614	飽和複素環化合物からなる医薬
		特開 2000-344670 99.06.03 A61K31/535, 606	脂環式アシル化複素環誘導体を含有する医薬	

表 2.6.4 三共の抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許 (3/4)

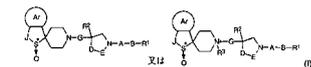
技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要	
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発/炎症系に作用する薬剤開発(つづき)	神経ペプチドに関わる薬剤/タキニンに関わる薬剤(つづき)	特開 2001-31570 99.07.21 A61K31/5377	スピロペリジン誘導体を含有する医薬	
			特開 2000-103791 96.11.08 C07D495/10	医薬合成のための光学活性スルホキシド誘導体	
			特開 2000-229968 98.12.10 C07D413/06	シクロヘキシルペリジン誘導体	
			特開 2001-187790 99.10.22 C07D401/10	2-アルコキシベンゼン誘導体	
			特開 2002-316987 01.04.20 C07D471/10,101	2-アルコキシベンゼン誘導体を含有する医薬	
		神経ペプチドに関わる薬剤/その他の神経ペプチドに関わる薬剤	特許 3017147 96.11.08 C07D495/10	光学活性スルホキシド誘導体 サブスタンス P 及びニューロキニン A 受容体拮抗作用を有する、式(I)の光学活性スルホキシド誘導体。 	
新規作用点に対する薬剤開発/作用機作非特定	その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤	(作用点非特定の薬剤)	特開 2005-120046 03.10.20 C07D239/46	ピリミジン誘導体を含有する医薬	
			特開 2005-139170 03.10.16 A61K47/44	5-アリアルピリミジン誘導体	
			特開 2005-145956 03.10.21 A61K31/164	ピリミジン化合物	
		作用点非特定の薬剤開発	(作用点非特定の薬剤)	特開 2005-41867 03.07.08 A61K31/196	アミノアルコール誘導体又はホスホン酸誘導体を含有する医薬組成物
				特開 2005-47899 03.07.11 A61K31/196	アミノアルコール化合物
高分子医薬品 / 抗体	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系に作用する薬剤開発	その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤	特開 2001-342148 00.03.29 A61K39/395	ヒト化抗 Fas 抗体を含有する医薬	
			特開 2001-342149 00.03.29 A61K39/395	ヒト化抗 Fas 抗体を含有する医薬	
ペプチド医薬品 /		T細胞の機能調節に関わる薬剤	特開平 11-92497 97.09.17 C07K7/06,ZNA 林原生物化学研究所	ペプチド及びその用途	
			特開平 10-259198 96.12.24 C07K14/415,ZNA 林原生物化学研究所 [被引用 2 回]	連結した T 細胞エピトープとその用途	

表 2.6.4 三共の抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(4/4)

技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
ペプチド医薬品 / (つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発 (つづき)	T細胞の機能調節に関わる薬剤 (つづき)	特開 2003-289700.09.14 C07K7/08, ZNA 林原生物化学研究所	ペプチドおよびその用途
微生物由来 / 天然物医薬品 /	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	細胞接着過程の調節に関わる薬剤	特開 2001-12284699.10.28 C07C305/24	スフィンゴシンキナーゼ阻害剤
		細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特開 2002-11474100.10.11 C07C69/28	新規化合物 F-16053A
			特開平 10-182627 (みなし取下げ) 96.12.20 C07D311/76	新規化合物 S-15183a 及び S-15183b

2.7 大正製薬

2.7.1 企業の概要

商号	大正製薬 株式会社
本社所在地	〒170-8633 東京都豊島区高田 3 丁目24番 1 号
設立年	1928 (昭和 3) 年 5 月 5 日
資本金	298億400万円
従業員数	連結 : 5,339名、単体 : 3,312名
事業内容	一般用医薬品、健康関連商品からなるセルフメディケーション事業、及び医療用医薬品事業

大正製薬は一般用医薬品と健康関連商品からなるセルフメディケーション事業を基盤とし、第二の柱として医療用医薬品事業を位置付けている。医療用医薬品事業では、「感染症」「精神神経」「脳循環」「免疫アレルギー」「糖尿病」の5つの領域を研究開発の重点領域としている。

2002年10月に富山化学工業と共同で医療用医薬品の販売会社「大正富山医薬品」を設立した。

主力製品には医療用として「クラリス」（マクロライド系抗生物質）があるほか、一般用医薬として「大正漢方胃腸薬、大正健胃胃腸薬」（胃腸薬）、「コーラック」（便秘剤）、「プリザエース」（痔疾薬）、「ダマリン」（水虫薬）ほか「リポビタミンD」（ドリンク剤）、「リアップ」（毛髪用剤）などがある。

（出典：<http://www.taisho.co.jp/index-j.htm>）

（出典：http://www.taisho.co.jp/outline/rls/htm/in_pdt-j.htm）

（出典：<http://www.taisho.co.jp/outline/outln/htm/zk-j.htm>）

2.7.2 製品例

抗アレルギー剤関連製品

一般用医薬

- 「パブロン」（点鼻薬、うがい薬）

（出典：<http://www.taisho.co.jp/index-j.htm>）

（出典：http://www.taisho.co.jp/outline/rls/htm/in_pdt-j.htm）

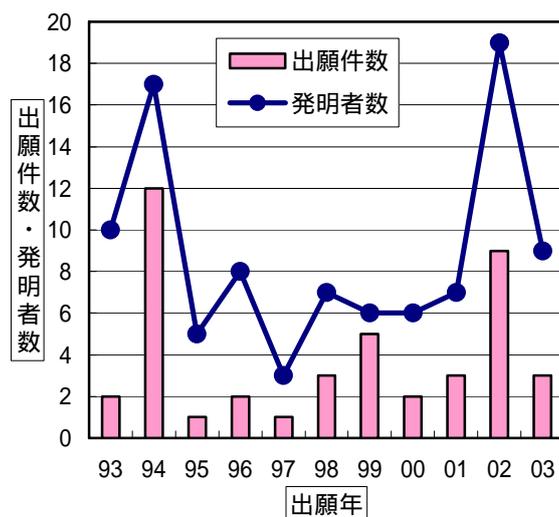
（出典：<http://www.taisho.co.jp/outline/outln/htm/zk-j.htm>）

2.7.3 技術開発拠点と研究者

開発拠点：埼玉県さいたま市北区吉野町 1 - 403 大正製薬 総合研究所

図 2.7.3 に大正製薬の抗アレルギー剤の出願件数と発明者数の年次推移を示す。出願件数は毎年数件であるが 02 年は 9 件と多い。

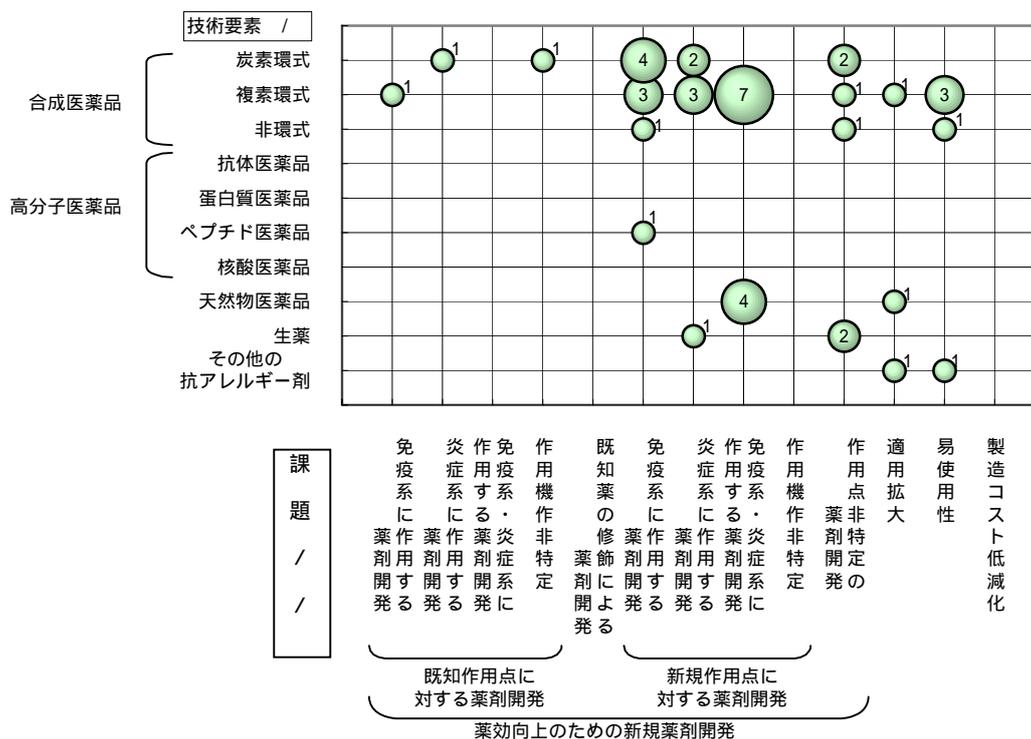
図 2.7.3 大正製薬の抗アレルギー剤に関する出願件数と発明者数



2.7.4 技術開発課題対応保有特許の概要

図 2.7.4-1 に抗アレルギー剤に対する技術要素と課題の分布を示す。大正製薬では合成医薬品の開発が主流であり、化合物としては複素環式化合物、炭素環式化合物が主であるが、天然物医薬、生薬も比較の出願されている。

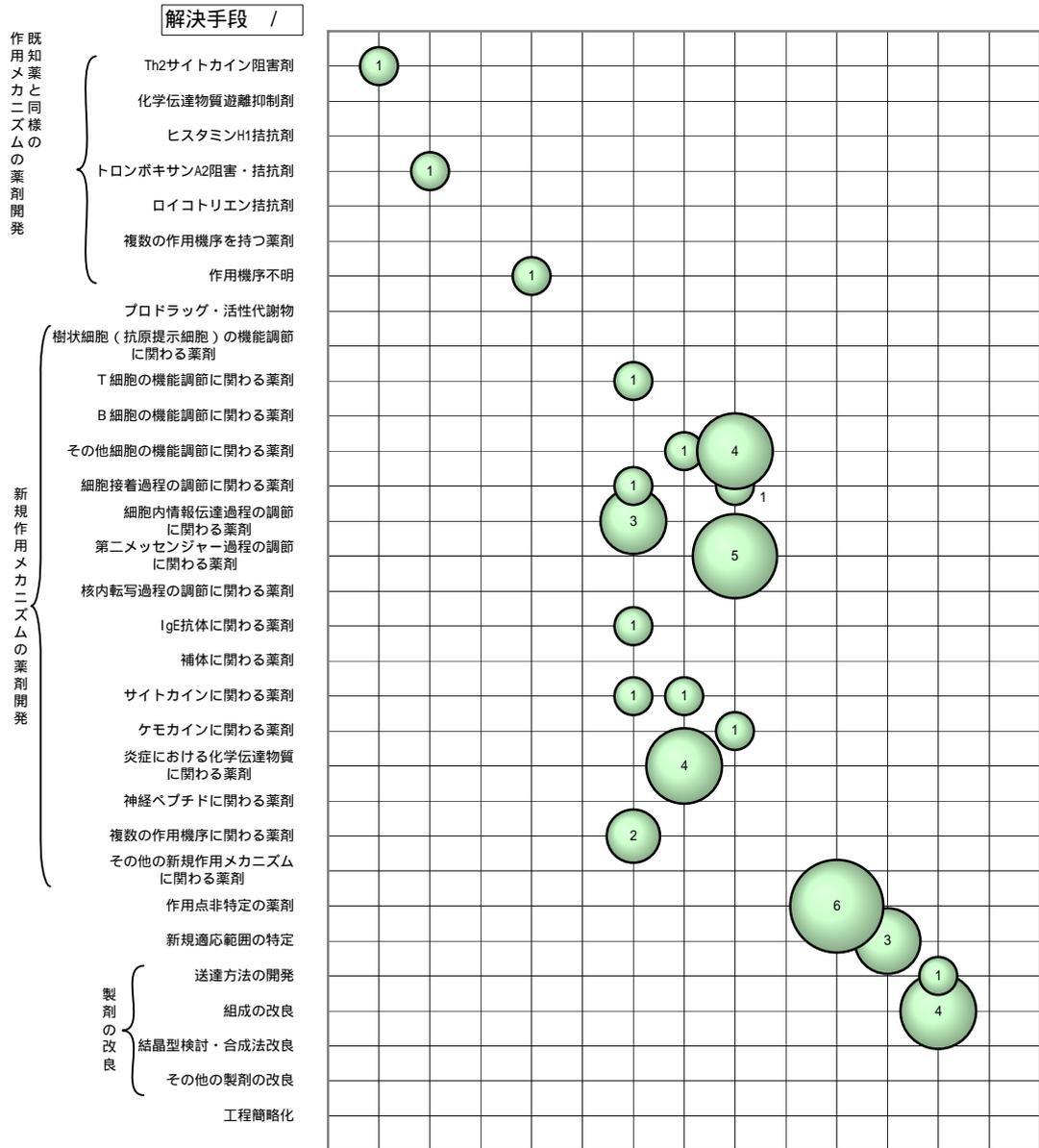
図 2.7.4-1 大正製薬の抗アレルギー剤に関する技術要素と課題



(1993年1月～2003年12月の出願)

図 2.7.4-2 に抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布を示す。課題においては「新規作用点に対する薬剤開発」の中で特に「免疫系に作用する薬剤開発」の解決手段としては「細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤」3件（チロシン脱リン酸化酵素阻害剤）や「IgE 抗体に関わる薬剤」1件（IgE 産生抑制剤）などに対応している。「炎症系に作用する薬剤開発」に対しては、「第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤」5件、「免疫系・炎症系に作用する薬剤開発」では、「炎症における化学伝達物質に関わる薬剤」4件（5 - リポオキシゲナーゼ阻害剤）で対応している。また、「易使用性」の課題に関しては「組成の改良」などで対応しており、製剤特許が5件ある。

図 2.7.4-2 大正製薬の抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布



(1993年1月～2003年12月の出願)

表 2.7.4 に大正製薬の抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許を示す。出願件数は 43 件であり、そのうち登録になっている特許は 1 件である。

なお、表 2.7.4 では図 2.7.4-2 の解決手段 を細展開した解決手段 まで分析している。

表 2.7.4 大正製薬の抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許 (1/4)

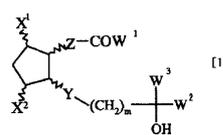
技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 炭素環式	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤	特開平 6-199791 (拒絶査定確定) 93.01.06 C07D213/42 日本ゼオン	ベンゼンスルホンアミド誘導体
	既知作用点に対する薬剤開発 / 作用機序非特定	作用機序不明	特許 3678366 02.02.20 A61K31/5575 佐藤史衛	止痒剤 下記 [1] で表されるプロスタグランジン誘導体、その製薬学的に許容される塩またはその水和物を有効成分とする掻痒性症状の予防または治療用薬剤。  [1]
	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	細胞接着過程の調節に関わる薬剤	特開平 10-42887 (みなし取下げ) 96.08.07 C12P15/00	イソテトラセノン系化合物
		細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特開 2001-114678 99.10.19 A61K31/167	チロシン脱リン酸化酵素阻害剤
		サイトカインに関わる薬剤 / その他のサイトカインに関わる薬剤	特開平 10-77260 (みなし取下げ) 96.09.03 C07C317/36	4-アリアルオキシ-5-アリアルチオニトロアニリン化合物
		複数の作用機序に関わる薬剤	特開 2000-7626 98.06.25 C07C217/84	N-置換ニトロアニリン誘導体
	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 脂質メディエーターに関わる薬剤	特開平 7-233052 (みなし取下げ) 94.02.18 A61K31/05, AED 相模中央化学研究所	1-ナフトール誘導体を有効成分とする 5-リボキシゲナーゼ阻害剤
			特開 2005-2024 03.06.11 A61K31/5575 佐藤史衛	止痒剤
	作用点非特定の薬剤開発	(作用点非特定の薬剤)	特開 2002-212107 01.01.22 A61K47/44	局所適用組成物
			特開 2002-205942 00.11.07 A61K31/167	局所適用組成物
(易使用性) 投与法の改善	組成の改良	特開 2003-48848 01.08.01 A61K35/78	医薬組成物	

表 2.7.4 大正製薬の抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(2/4)

技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品 / 複素環式	(易使用性)投与量・投与回数の低減化	組成の改良 (つづき)	特開 2001-261561 00.03.17 A61K31/431 [被引用 1 回]	鼻閉改善薬
	(易使用性)保存安定性		特開平 11-209305 98.01.21 A61K47/08	メキタジン配合固形製剤
	既知作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	Th2 サイトカイン阻害剤	特開 2001-187734 99.12.28 A61K31/4188	2 型 T ヘルパー細胞分化抑制剤
	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特開 2001-114689 99.10.19 A61K31/4166	チロシン脱リン酸化酵素阻害剤
			特開 2001-114753 99.10.19 C07C327/42	N-アリールチオオキサミド誘導体
		複数の作用機序に関わる薬剤	特開 2000-26430 98.07.02 C07D235/18	2、5、6-置換ベンズイミダゾール化合物誘導体
	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	サイトカインに関わる薬剤 / 炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤	特開平 8-53355 (みなし取下げ) 94.08.12 A61K31/70, AED [被引用 2 回]	IL-5 産生抑制剤
			特開平 7-233069 (みなし取下げ) 94.02.18 A61K31/41, AED 相模中央化学研究所	1,2,3-チアジアゾール誘導体を有効成分とする 5-リボキシゲナーゼ阻害剤
			W003/70252 02.02.22 A61K45/00 佐藤史衛	止痒剤
	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	細胞接着過程の調節に関わる薬剤	特開 2004-59506 02.07.29 C07H13/04	セレクチン及びケモカインに作用する過硫酸化オリゴ糖
			第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / PDE4 に関わる薬剤	特開平 8-143571 94.09.20 C07D495/04, 105 特開平 8-253484 (特許 3713783) 95.01.20 C07D487/04, 143
	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤	特開平 7-267961 (みなし取下げ) 94.03.30 C07D491/048	ベンゾフロ [3.2-d]ピリミジン-4-オン誘導体
特開平 7-330777 (みなし取下げ) 94.06.08 C07D495/04, 105 [被引用 1 回]			チエノ [3.2-d]ピリミジン-4-オン誘導体	

表 2.7.4 大正製薬の抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(3/4)

技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発 (つづき)	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤 (つづき)	特開平 8-104679 (特許 3702493) 94.08.12 C07D239/91	キナゾリン-4(3H)-オン誘導体
		ケモカインに関わる薬剤 / CC ケモカインに関わる薬剤	特開 2005-194193 (みなし取下) 02.06.11 A61K31/56	ケモカイン受容体拮抗化合物
	作用点非特定の薬剤開発	(作用点非特定の薬剤)	特開 2005-97264 02.02.20 A61K31/196	点鼻剤組成物
	(適用拡大)	(新規適応範囲の特定)	特開 2004-175786 02.10.01 A61K31/4535	I型アレルギー疾患治療用組成物
合成医薬品 / 非環式	(易使用性)投与量・投与回数 の低減化	送達方法の開発	特許 3470131 94.03.16 A61K9/107 [被引用 3 回]	持効性点鼻剤 血管収縮剤および抗ヒスタミン剤を有効成分として含有する pH が 6.5~8.5 の O/W 型エマルション点鼻剤。鼻腔内での滞留性を改善し、効果が持続する。(図なし)
	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	T細胞の機能調節に関わる薬剤	W001/28991 99.10.19 C07C327/42	N-シクロアルキルチオオキサミド誘導体
	作用点非特定の薬剤開発	(作用点非特定の薬剤)	特開 2005-112813 03.10.10 A61K9/113	点鼻剤
高分子医薬品 / ペプチド医薬品	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	IgE抗体に関わる薬剤	特開平 6-239887 (みなし取下げ) 93.02.16 C07K7/08,ZNA 三井化学 [被引用 2 回]	新規 IgE 産生抑制物質
天然物医薬品 / 微生物由来	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	その他細胞の機能調節に関わる薬剤	特開平 8-104641 (みなし取下げ) 94.08.12 A61K31/71,AED	IL-5 産生抑制剤
			特開平 8-104638 (みなし取下げ) 94.08.12 A61K31/70,AED	IL-5 産生抑制剤
			特開平 8-104639 (みなし取下げ) 94.08.12 A61K31/70,AED	IL-5 産生抑制剤
			特開平 8-104640 (みなし取下げ) 94.08.12 A61K31/70,AED	IL-5 産生抑制剤

表 2.7.4 大正製薬の抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(4/4)

技術要素 /	(課題)課題 /課題	(解決手段) / 解決手段 / 解決手段	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
天然物医薬品 / 動物由来	(適用拡大)	(新規適応範囲の 特定)	特開平 11-60494 (みなし取下げ) 97.08.21 A61K33/30, ADA	アトピー性皮膚炎再発防止剤
生薬	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	その他細胞の機能調節に関わる薬剤	特開 2004-26813 02.05.07 A61K35/78	医薬組成物
	作用点非特定の薬剤開発	(作用点非特定の薬剤)	特開 2003-342186 02.05.24 A61K35/78	鼻炎用内服液剤組成物
			特開 2004-91477 02.07.10 A61K35/78	アレルギー疾患治療薬
その他の抗アレルギー剤	(易使用性)投与方法の改善	組成の改良	特開 2003-89644 01.09.17 A61K31/495	医薬組成物
	(適用拡大)	(新規適応範囲の 特定)	特開 2004-189731 02.11.26 A61K47/18	点鼻剤

2.8 サノフィ・アベンティス(フランス)

2.8.1 企業の概要

商号	SANOFI-AVENTIS
本社所在地	174, av. de France, 75013 PARIS, FRANCE
設立年	N/A
資本金	N/A
従業員数	96,439名(2004年末現在)
事業内容	医薬品開発、製造、販売企業

サノフィ・アベンティスは、医薬品企業である。7つの主要治療領域(循環器系、血栓症、癌、内科系、代謝性疾患、中枢神経系、ワクチン)に注力している。抗アレルギー剤として「トリルダン」を販売している。研究開発におけるアレルギー関連の薬としては、Icatibant がフェーズ3に進捗中である。

サノフィ・アベンティス名義の出願には、合併前の「アベンティス PHARM」、「アベンティスベーリング」、「アベンテスファルマドイチュラント」、「サノフィサンテラボ」、「ヘキスト」、「ヘキストマリオンルセル」、「ヘキストマリオンルセルドイチュラント」名義の出願を併せて解析を行った。

主力製品には「Lovenox」(抗凝血薬)、「Plavix」(抗血栓症薬)、「Myslee」(催眠薬：非ベンゾジアゼピン系)、「Avapro」(降圧剤：アンジオテンシン II 変換酵素阻害剤)、「Eloxatin」(制癌剤：大腸癌)、「Ketek」(経口抗菌剤：ケトライド系)、「Lantus」(糖尿病薬：インシュリン)、「Actonel」(骨吸収抑制剤：リセドロロンサンナトリウム)、「Taxotere」抗癌剤(タキソイド系抗悪性腫瘍剤：乳癌、肺癌、前立腺癌)などがある。

(出典：<http://www.sanofi-aventis.co.jp/live/jp/ja/layout.jsp?cnt=F506BFF9-7223-4F80-9D77-B267ACC9B6B2>)

2.8.2 製品例

抗アレルギー剤関連製品

医療用医薬品

- 「トリルダン」(抗アレルギー剤)
- 「Allegra」(抗ヒスタミン剤)

(出典：<http://www.sanofi-aventis.co.jp/live/jp/ja/layout.jsp?cnt=F506BFF9-7223-4F80-9D77-B267ACC9B6B2>)

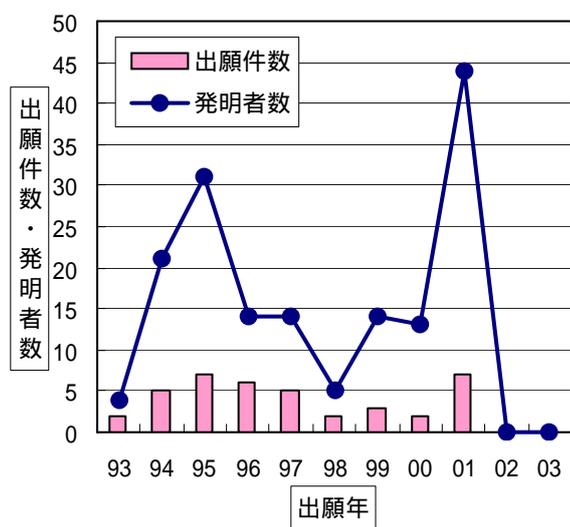
2.8.3 技術開発拠点と研究者

開発拠点：France, USA, Canada

研究者数：11,000名

図 2.8.3 にサノフィ・アベンティスの抗アレルギー剤の出願件数と発明者数の年次推移を示す。出願件数は毎年数件程度である。

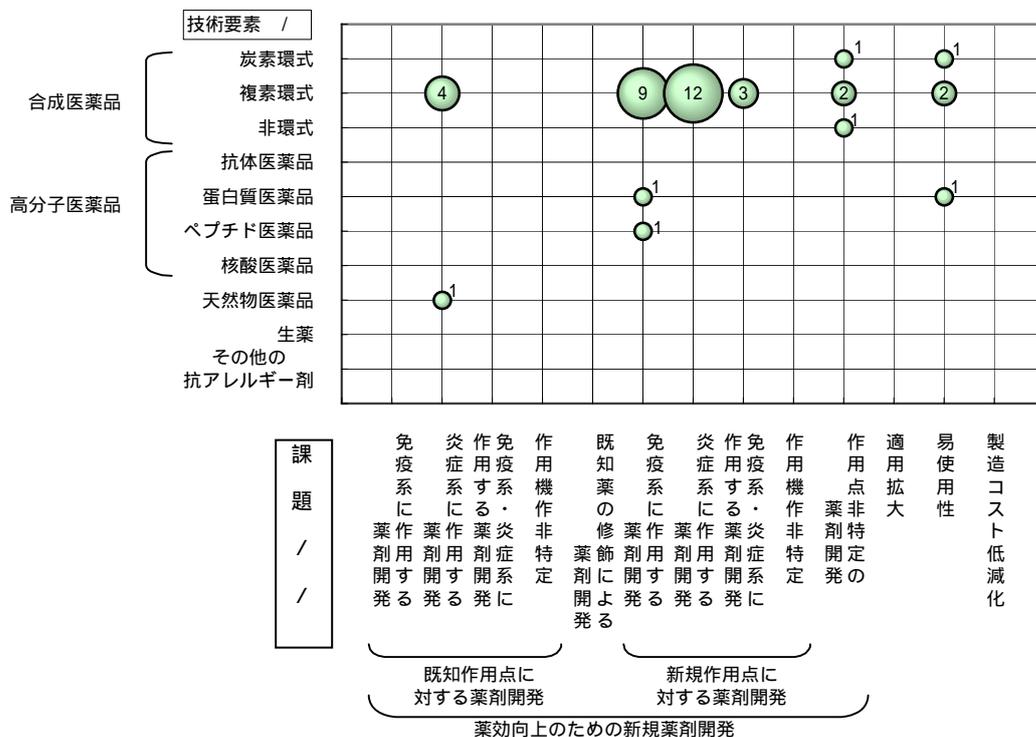
図 2.8.3 サノフィ・アベンティスの抗アレルギー剤に関する出願件数と発明者数



2.8.4 技術開発課題対応保有特許の概要

図 2.8.4-1 に抗アレルギー剤に対する技術要素と課題の分布を示す。サノフィ・アベンティスでは合成医薬品の開発が主流であり、化合物としては複素環式化合物が主であるが、蛋白医薬、ペプチド医薬、天然物医薬も出願されている。

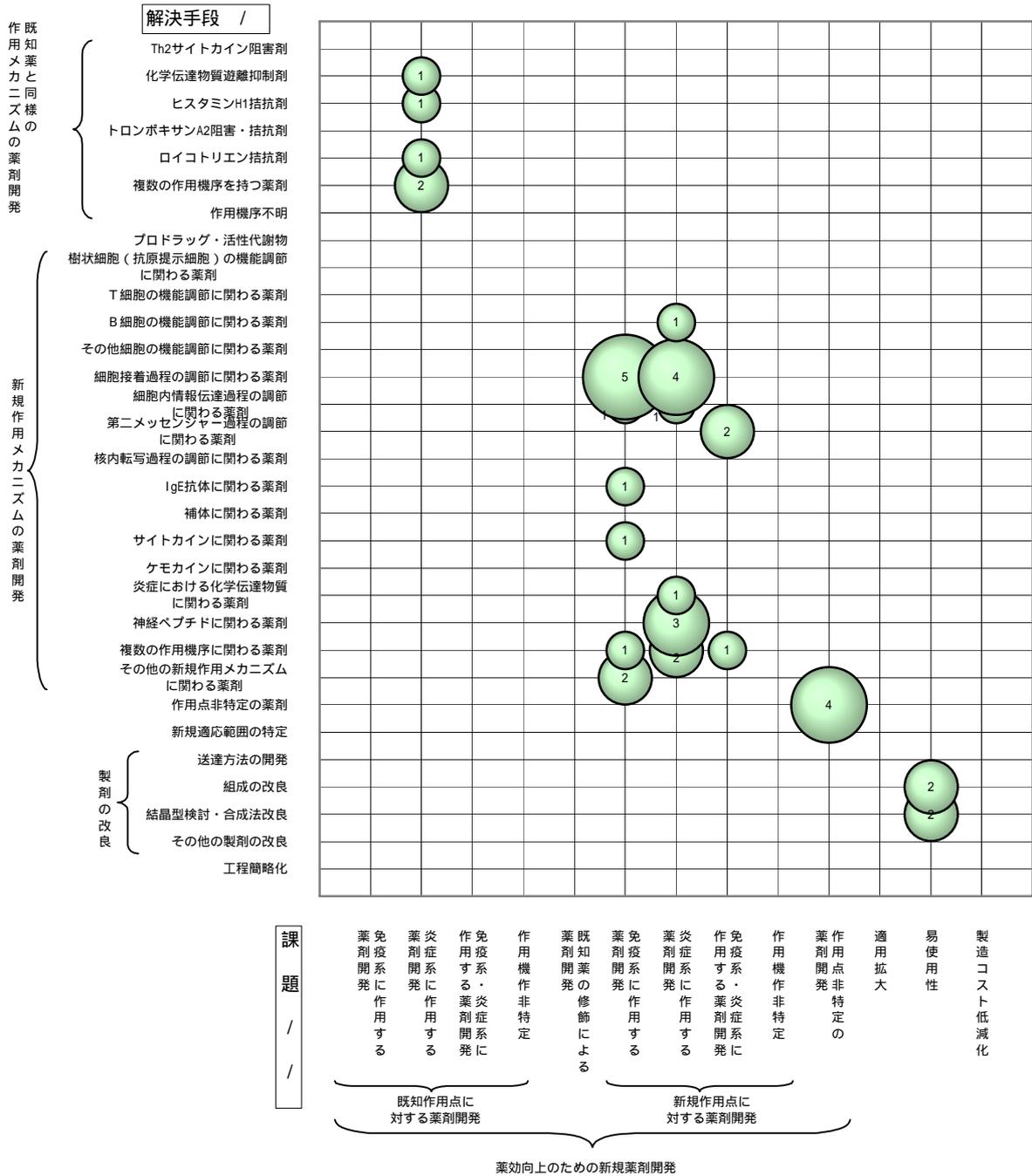
図 2.8.4-1 サノフィ・アベンティスの抗アレルギー剤に関する技術要素と課題



(1993年1月～2003年12月の出願)

図 2.8.4-2 に抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布を示す。「新規作用点に対する薬剤開発」については、「免疫系に作用する薬剤開発」の中で、「細胞接着過程の調節に関わる薬剤」(VLA-4拮抗剤)で対応している。その他、「炎症系に作用する薬剤開発」として「細胞接着過程の調節に関わる薬剤」4件(蛋白キナーゼ阻害剤)、「神経ペプチドに関わる薬剤」3件(タキキニン受容体拮抗剤)、「免疫・炎症系に作用する薬剤開発」として、「第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤」2件(PDE4阻害剤)などの出願が認められる。

図 2.8.4-2 サノフィ・アベンティスの抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布



(1993年1月～2003年12月の出願)

表 2.8.4 にサノフィ・アベンティスの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許を示す。出願件数は 39 件であり、そのうち登録になっている特許は 1 件である。

なお、表 2.8.4 では図 2.8.4-2 の解決手段 を細展開した解決手段 まで分析している。

表 2.8.4 サノフィ・アベンティスの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(1/3)

技術要素 / 炭素環式 / 合成医薬品 / 複素環式	(課題)課題 / 課題	(解決手段) / 解決手段 / 解決手段	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
炭素環式 / 合成医薬品 / 複素環式	(易使用性)投与量・投与回数の低減化	組成の改良	特表平 9-506078 (みなし取下げ) 93.10.15 A61K31/445, ABF	ターフエナジンカルボキシレートによるアレルギー性疾患の処置方法
	作用点非特定の薬剤開発	(作用点非特定の薬剤)	特表 2000-510440 96.03.20 A61K31/275	5-メチルイソオキサゾール-4-カルボン酸(4-トリフルオロメチル)アニリドおよびN-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-シアノ-3-ヒドロキシクロトン酸アミドからなる配合製剤
合成医薬品 / 複素環式	(易使用性)投与法の改善	結晶型検討・合成法改良	特開平 11-124372 97.08.08 C07D261/18	N-(4-トリフルオロメチルフェニル)-5-メチルイソオキサゾール-4-カルボキサミドの結晶形態
	(易使用性)投与量・投与回数の低減化	組成の改良	特表 2001-515041 97.08.14 A61K31/445	フェキソフェナジンおよびその誘導体のバイオアベイラビリティを強化する方法
	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	化学伝達物質遊離抑制剤	特表平 10-500134 94.05.18 C07D211/22 [被引用 1 回]	抗ヒスタミン性ペリジン誘導体の無水および水和形態、それらの多形態および擬似形態の製造方法
		ロイコトリエン拮抗剤	特表 2000-500772 (放棄) 95.12.20 C07D403/14, 207	アレルギー性疾患の治療に有用な新規な置換 4-(1H-ベンズイミダゾール-2-イル)[1.4]ジアゼパン類
		複数の作用機序を持つ薬剤	特表平 11-504650 95.05.08 C07D211/22	アルファ-(置換アルキルフェニル)-4-(ヒドロキシフェニルメチル)-1-ピペリジンブタノール誘導体、その製造および抗ヒスタミン剤、抗アレルギー剤および気管支拡張剤としてのその使用
			特表平 11-513991 (放棄) 95.11.17 C07D401/14, 207	アレルギー性疾患の治療に有用な置換 4-(1H-ベンズイミダゾール-2-イル-アミノ)ピペリジン
新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	細胞接着過程の調節に関わる薬剤	特開平 10-147574 96.11.15 C07D233/76	白血球接着阻害剤および VLA-4 アンタゴニストとしての複素環式化合物	
		特開平 10-147573 96.11.15 C07D233/00	白血球接着阻害剤および VLA-4 アンタゴニストとしての 5 員環の複素環式化合物	
		特開平 10-158298 96.11.15 C07K5/078	白血球接着阻害剤および VLA-4 アンタゴニストとしての新規複素環式化合物	
		特開平 11-180960 97.09.23 C07D233/76	新規な 5 員環の複素環式化合物、その製法およびその使用ならびにそれを含有する医薬製剤	
		特開平 11-246531 97.11.19 C07D233/72	置換されたイミダゾリジン誘導体、その製法および使用ならびにそれを含有する医薬製剤	

表 2.8.4 サノフィ・アベンティスの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(2/3)

技術要素 /	(課題)課題 /課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品/複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系に作用する薬剤開発(つづき)	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特表 2003-519144 99.12.24 C07D471/04,104	アザインドール
		IgE 抗体に関わる薬剤	W096/11682 94.10.17 A61K31/275, ABF [被引用 2 回]	I 型のアレルギー性疾患の予防および治療剤
		複数の作用機序に関わる薬剤	特表 2004-536074 01.05.31 C07D215/54	アミノキノリンおよびアミノピリジン誘導体およびそのアデノシン A3 リガンドとしての使用
	その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤	特許 2930281 93.03.31 A61K31/275	皮膚疾患処置用薬剤 下記 I、下記 II の化合物あるいは式 II の化合物の生理的に耐受性のある塩を活性成分とする医薬組成物をレシピエントに投与することからなる、皮膚疾患の予防・治療方法。  I: <chem>R1-C(=O)-N(R2)-C(R3)(R4)-N(R5)-X(R6)</chem> II: <chem>R1-C(=O)-N(R2)-C(R3)(R4)-N(R5)-X(R6)</chem>	
	新規作用点に対する薬剤開発/炎症系に作用する薬剤開発	B 細胞の機能調節に関わる薬剤	特表平 9-510983 94.04.05 A61K31/52, ABF	好酸球の顆粒球の病理学的な過剰反応性を減少するためのキサンチン誘導体の使用、新規なキサンチン化合物およびそれらの製法
			細胞接着過程の調節に関わる薬剤	特表 2002-515509 98.05.14 C07D233/74 [被引用 4 回]
		細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特表 2002-544261 99.05.17 C07D235/02 [被引用 2 回]	スピロイミダゾリジン誘導体、それらの製造、それらの使用およびそれらを含有する医薬製剤
			特表 2004-523574 01.03.10 C07D233/74	イミダゾリジン誘導体、それらの製造法、および抗炎症剤としてのそれらの使用。
			特表 2005-504033 01.08.01 C07D233/74	新規なイミダゾリジン誘導体、その調製および VLA-4 拮抗剤としてのその使用
		細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特表 2005-508300 01.06.23 C07D487/04, 140 [被引用 1 回]	蛋白キナーゼ阻害剤としてのピロロピリミジン
炎症における化学伝達物質に関わる薬剤/起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤		特表 2004-510697 00.05.22 C07D211/26	トリプターゼ阻害剤として使用するためのアリアルメチルアミン誘導体	
神経ペプチドに関わる薬剤/タキキニンに関わる薬剤	特開平 9-124600 95.08.28 C07D211/48 [被引用 1 回]	新規なピペリジン誘導体、これらを得るための方法及びこれらを含有する薬学的組成物		
	特表平 11-503449 95.04.13 C07D241/04	タキキニン受容体アンタゴニスト活性を有する新規な置換されたピペラジン誘導体		
	特表 2004-529968 01.05.21 C07D413/06	新規なピペリジンカルボキシアミド誘導体、それらの製造方法およびそれらを含む医薬組成物		

表 2.8.4 サノフィ・アベンティスの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(3/3)

技術要素 /	(課題)課題 /課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品 / 複素環式 (つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発 (つづき)	複数の作用機序に関わる薬剤	特表 2001-504798 (放棄) 96.02.21 C07D401/12	アレルギー疾患の治療に有用な新規な置換された N-メチル-N-(4-(4-(1H-ベンズイミダゾール-2-イル-アミノ)ピペリジン-1-イル)-2-(アリール)ブチル)ベンズアミド
			特表 2002-504082 (放棄) 96.02.21 C07D211/22	アレルギー疾患の治療に有用な新規な置換された N-メチル-N-(4-(ピペリジン-1-イル)-2-(アリール)ブチル)ベンズアミド
	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / PDE4に関わる薬剤	特表平 10-504550 94.08.25 A61K31/44, ABC	免疫疾患に使用するための複合製剤
			特表 2005-516956 01.12.21 C07D215/54, CSP	イミダゾキノリン誘導体
	作用点非特定の薬剤開発	(作用点非特定の薬剤)	特開 2003-63995 01.07.06 A61K45/06	免疫学的疾患の治療のための配合製剤
特表 2002-519411 98.07.02 C07D211/22			新規な抗ヒスタミン性ピペリジン誘導体およびその製造のための中間体	
/ 非環式 合成医薬品			特開 2004-292459 02.02.20 A61K31/196	ピペリジノアルコール化合物のための医薬組成物
			特開平 9-132560 95.09.19 C07C323/51	2-シアノ-3-メルカプトクロトンアミド
高分子医薬品 / 蛋白質医薬品	保存安定性	結晶型検討・合成法改良	特開 2001-64200 99.08.13 A61K38/55	疾患の予防および治療のためのアンチトロンピン III の使用
	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤	特開 2001-253900 00.01.11 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
高分子医薬品 / ペプチド医薬品		サイトカインに関わる薬剤 / 抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤	特開平 8-208694 94.12.13 C07K7/64	シクロヘキサペプチドおよびそれらの混合物、それらの製造方法およびそれらの使用
微生物由来 / 天然物医薬品	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	ヒスタミン H1 拮抗剤	特開平 10-259191 97.03.11 C07F9/59	4-(4-(4-(ヒドロキシジフェニル)-1-ピペリジニル)-1-ヒドロキシブチル)-N-ジメチルフェニル酢酸およびホスホリル化誘導体の製法

2.9 ベーリンガーインゲルハイム（ドイツ）

2.9.1 企業の概要

商号	Boehringer Ingelheim GmbH
本社所在地	Binger Str. 173, 55216 Ingelheim, Germany
設立年	1885年
資本金	N/A
従業員数	35,529名（2004年末現在）
事業内容	医療用医薬品、一般医薬品、及び動物薬の開発、製造、販売

ベーリンガーインゲルハイムはドイツに拠点を置く医薬品会社である。ベーリンガーインゲルハイム名義の出願には、合併前の「ベーリンガーインゲルハイム INTERN」、「ベーリンガーインゲルハイム PHARM」、「日本ベーリンガーインゲルハイム」名義の出願を併せて解析を行った。

主力製品には、医療用医薬品として「Actilyse、Metalyse」（抗血栓薬）、「Mobic、Mobec、Mobicox、Movalis、Movatec」（変形性関節症薬）、「Fromax、Alna、Josir、Pradif、Secotex、Urolosin」（良性前立腺過形成薬）、「Berotec、Berodual、Atrovent」（慢性閉塞性肺疾患薬）、「Viramune」（AIDS薬）、「Micardis」（降圧薬）、「Sifrol、Mirapex」（パーキンソン病薬）があるほか、一般医薬品としては「Silomat、Mucoangin」（風邪薬）、「Dulcolax、Buscopan」（胃腸薬）、「Anador、Thomapyrin、Prontalgine、Finalgon、Lonol」（鎮痛薬）などがある。

（出典：http://www.boehringer-ingelheim.com/corporate/products/prod_prescr_copd.htm）

2.9.2 製品例

現在、抗アレルギー剤関連製品はない。

2.9.3 技術開発拠点と研究者

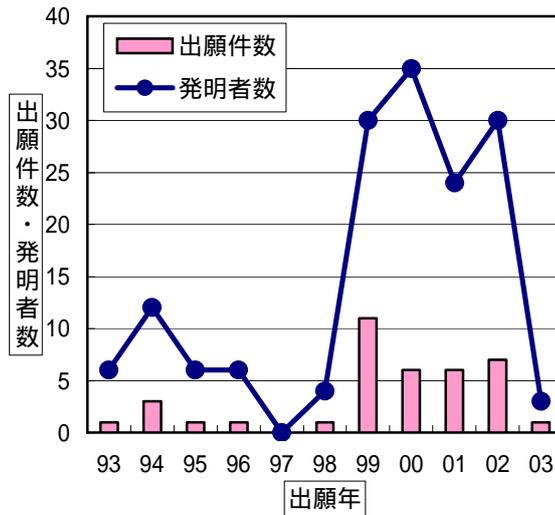
開発拠点：Biberach an der Riss(Baden-Wuerttemberg,Germany)

研究者数：5,471名

（出典：http://www.boehringer-ingelheim.com/corporate/career/emploee_statistics.htm）

図 2.9.3 にベーリンガーインゲルハイムの抗アレルギー剤の出願件数と発明者数の年次推移を示す。出願件数は毎年数件程度であるが 99 年以降増加している。

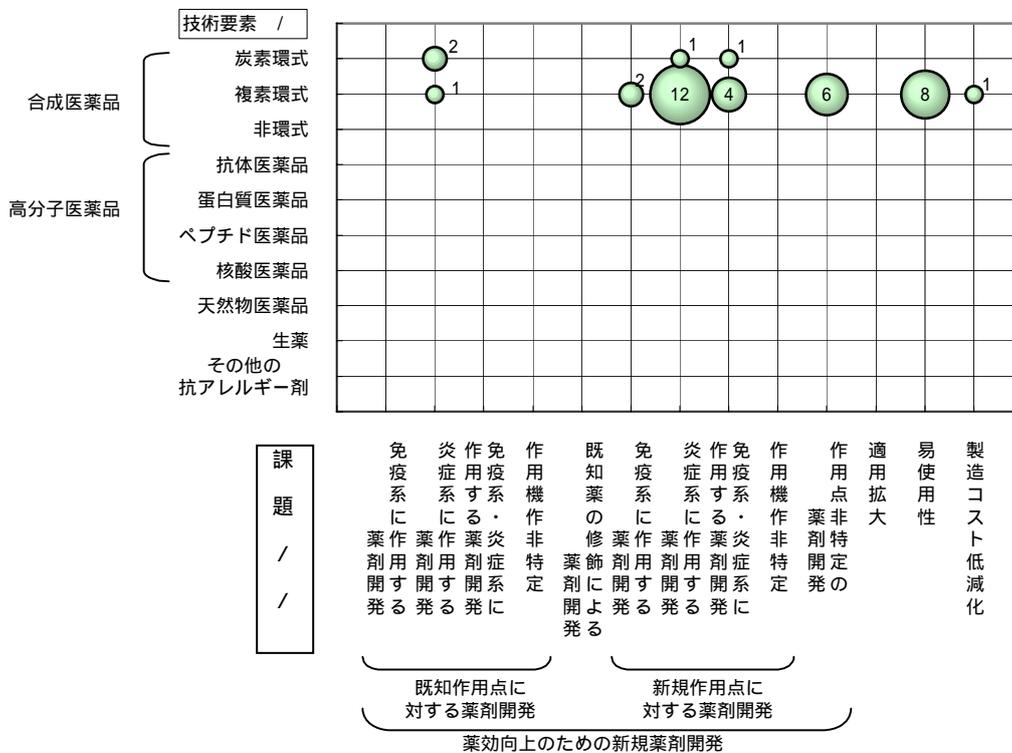
図 2.9.3 ベーリンガーインゲルハイムの抗アレルギー剤に関する出願件数と発明者数



2.9.4 技術開発課題対応保有特許の概要

図 2.9.4-1 に抗アレルギー剤に対する技術要素と課題の分布を示す。ベーリンガーインゲルハイムでは合成医薬品の開発が主流であり、化合物としては大部分が複素環式化合物である。

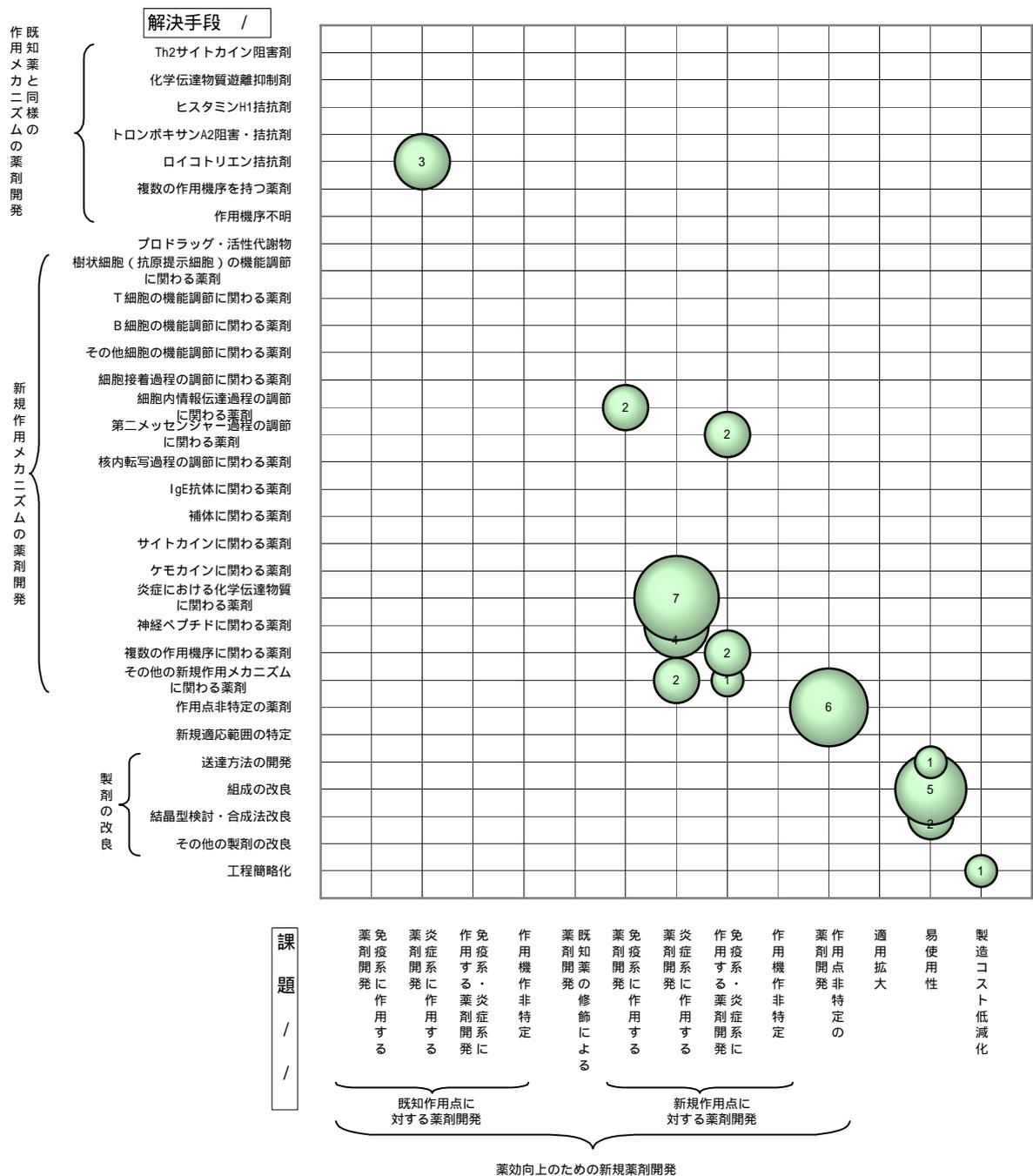
図 2.9.4-1 ベーリンガーインゲルハイムの抗アレルギー剤に関する技術要素と課題



(1993 年 1 月 ~ 2003 年 12 月の出願)

図 2.9.4-2 に抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布を示す。「新規作用点に対する薬剤開発」については、「炎症における化学伝達物質に関わる薬剤」7件（起炎性プロテアーゼ、トリプターゼ阻害剤）、「神経ペプチドに関わる薬剤」4件（ニューロキニン拮抗剤）で対応している。他には「第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤」2件（アデノシン A2a アゴニスト）、「その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤」3件（グルココルチコイドミメティクス）などの出願がある。「易使用性」の課題ではエピナスチン製剤に関するものが主で、「組成の改良」5件で対応している。

図 2.9.4-2 ベーリンガーインゲルハイムの抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布



(1993年1月～2003年12月の出願)

表 2.9.4 にベーリンガーインゲルハイムの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許を示す。出願件数は 38 件であり、そのうち登録になっている特許は 2 件である。

なお、表 2.9.4 では図 2.9.4-2 の解決手段 を細展開した解決手段 まで分析している。

表 2.9.4 ベーリンガーインゲルハイムの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(1/3)

技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品 / 炭素環式	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	ロイコトリエン拮抗剤	特許 2931410 94.07.13 C07C257/18	置換ベンズアミジン類、その製法及びそれらの医薬品としての使用 下記(1)で表される新規化合物は、通常法により製造でき、治療に、とりわけ L T B 4 拮抗剤として使用できる。

表 2.9.4 ベーリンガーインゲルハイムの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許 (2/3)

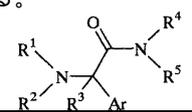
技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	ロイコトリエン拮抗剤	特表平 8-508467 (みなし取下げ) 93.03.23 C07D213/61	複素環式基を含むアミジン誘導体、その製造方法及びそれらの使用
	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特表 2004-506636 00.08.11 C07D487/04,144 特表 2005-509003 01.11.09 C07D235/30	チロシンキナーゼのインヒビターとして有用な複素環化合物 タンパク質キナーゼインヒビターとして有用なベンゾイミダゾール化合物
	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 起炎性プロテアーゼに関わる薬剤	特表 2003-507459 99.08.20 C07D235/14 特表 2003-510309 99.09.24 C07D235/16 特表 2003-510310 99.09.24 C07D235/16 特表 2003-513959 99.11.10 C07D235/14 特表 2004-525920 01.03.20 A61K45/06 特表 2005-501017 01.06.08 C07C255/29	アミノカルボニル置換ベンゾイミダゾール誘導体、それらの調製方法及び医薬組成物としてのそれらの使用 置換ベンゾイミダゾール誘導体、その製造方法及びその医薬組成物としての使用 アリールスルホンアミド置換ベンゾイミダゾール誘導体、それらの調製方法及び医薬組成物としてのそれらの使用 カルボキサミド置換ベンゾイミダゾール誘導体、それらの調製方法及び医薬組成物としてのそれらの使用 抗コリン作動薬及びエンドテリンアンタゴニストを主成分とする新規薬剤組成物 システインプロテアーゼの可逆的阻害剤として有効な新規なニトリル
	神経ペプチドに関わる薬剤 / タキキニンに関わる薬剤	神経ペプチドに関わる薬剤 / タキキニンに関わる薬剤	特表平 10-505826 94.09.17 C07D295/12 特表平 11-503441 95.04.14 C07D211/58 [被引用 1 回]	ニューロキニン拮抗剤 新規アリールグリシニアミド誘導体、その製造方法、及び該化合物を含有する医薬組成物
			特許 3465795 96.03.06 C07D211/58	新規なアリールグリシニアミド誘導体、その製造方法及び該誘導体を含む医薬組成物 下記 I で表される新規なアリールグリシニアミド誘導体及びその薬学的に許容される塩、及びその製造方法及びその使用に関する。この新規化合物は有用なニューロキニン(タキキニン)アンタゴニストである。 
			特表 2004-513096 00.10.17 C07D211/58	新規なニューロキニンアンタゴニストとしての(4-アシルアミノピペリジン-1-イル)アセトアミド
		その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤	特表 2005-519897 02.01.14 C07H21/00	グルココルチコイドミメチックス、その製造方法、それを含む医薬製剤及びその使用

表 2.9.4 ベーリンガーインゲルハイムの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(3/3)

技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発(つづき)	その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤 (つづき)	特表 2005-527555 02.02.20 C07D209/12	グルココルチコイドミメテイクス、その製法、医薬組成物、及び使用
	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / PDE4に関わる薬剤	特表 2002-532411 98.12.17 A61K31/519	PDEIV 抑制剤としての三環窒素複素環化合物
		第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / アデノシンに関わる薬剤	特表 2004-534767 01.05.25 A61K456	閉塞性気道疾患及びその他の炎症性疾患を治療するためのアデノシン A2A 受容体アゴニスト及びチオトロピウム又はその誘導体の組合せ
		複数の作用機序に関わる薬剤	特表 2005-525322 02.01.31 C07D209/44 特表 2005-520832 02.02.20 C07D451/10, CSP	M3 アンタゴニストとしてのトロペノール及びスコピンのキサンテンカルボン酸エステル、その製造方法及び薬物としてのその使用 抗コリンエステラーゼ薬として使用するジフリルグリコール酸トロペノールエステル
作用点非特定の薬剤開発	(作用点非特定の薬剤)		特表 2003-513087 99.10.29 C07D4014	CGRP アンタゴニストとしての新規なシクロプロパン化合物、前記化合物を含む医薬及びその製造方法
		特表 2003-513088 99.10.29 C07C237/20	アリーラルカン、アリーラルケン及びアリールアザアルカン、これら化合物を含有する製薬組成物及びその調製方法	
		特表 2003-519222 99.12.30 C07D4014	置換ピペリジン、これを含む医薬組成物及び製法	
		特表 2004-521864 00.10.06 A61K31/55	エピナスチン及びシユードエフエドリンを含む新規医薬組成物	
		特表 2004-511556 00.10.14 C07D451/10	新規な抗コリン作用薬、それらの調製方法及び医薬組成物としてのそれらの使用	
		特表 2004-528305 01.03.13 A61K31/439	炎症性疾患を治療するための化合物	

2.10 メルク アンド コー（米国）

2.10.1 企業の概要

商号	Merck & Co.
本社所在地	Whitehouse Station, New Jersey, USA
設立年	1891年
資本金	N/A
従業員数	62,000名
事業内容	医薬用医薬品の開発、製造・販売

メルク アンド コーは米国に拠点を置く医薬品メーカーである。特に医家向けの医薬品に注力している。米国、欧州、日本に 10 箇所の主要な研究所を持ち、31 施設で製品を製造、100 カ国以上で販売を行っている。2004 年度、研究開発に 40 億ドルを投入しており過去 10 年間で 200 億ドル以上を費やしている。

高血圧、高コレステロール症、骨粗しょう症、喘息、良性前立腺過形成、関節炎、痛み、片頭痛、緑内障、胃潰瘍、感染症（抗菌薬、抗真菌剤、抗ウイルス薬）などの治療薬や、幼児疾患やA型およびB型肝炎予防のワクチン等を製造している。

メルク アンド コー名義の出願には、合併前の「メルクシャープエンドーム」、「メルクフロストカナダ」、「メルクフロストカナダアンド」名義の出願を併せて解析を行った。

主力製品として「CLINORIL」（消炎鎮痛剤）、「CRIXIVAN」（抗ウイルス HIV プロテアーゼ阻害剤）、「INDOCIN」（解熱消炎鎮痛剤）、「MAXALT」（片頭痛治療剤）、「FOSAMAX」（骨吸収抑制剤）、「ZOCOR」（高脂血症薬）などがある。

（出典：<http://www.merck.com/product/>）

2.10.2 製品例

抗アレルギー剤関連製品

医療用医薬品

「SINGULAIR」（気管支喘息薬）

（出典：<http://www.merck.com/product/>）

（出典：<http://phx.corporate-ir.net/phoenix.zhtml?c=73184&p=IR0L-irhome>）

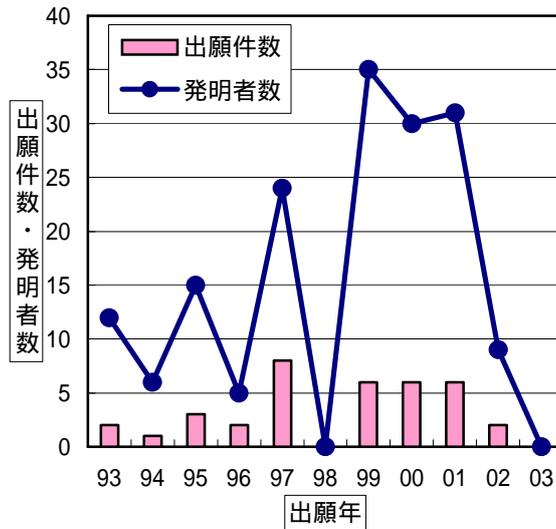
2.10.3 技術開発拠点と研究者

開発拠点：米国

研究者数：7,800 名以上

図 2.10.3 にメルク アンド コーの抗アレルギー剤の出願件数と発明者数の年次推移を示す。出願件数は 99 年以降、毎年 5 件を上回っている。

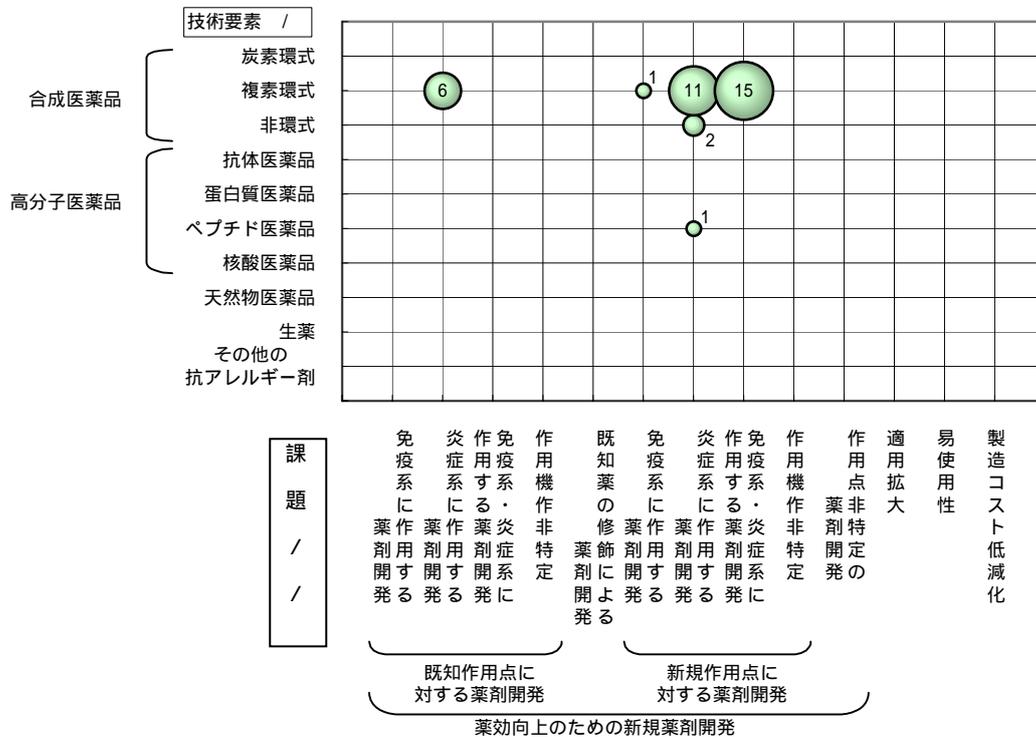
図 2.10.3 メルク アンド コーの抗アレルギー剤に関する出願件数と発明者数



2.10.4 技術開発課題対応保有特許の概要

図 2.10.4-1 に抗アレルギー剤に対する技術要素と課題の分布を示す。メルク アンド コーでは合成医薬品が主流であり、化合物としては大部分が複素環式化合物である。

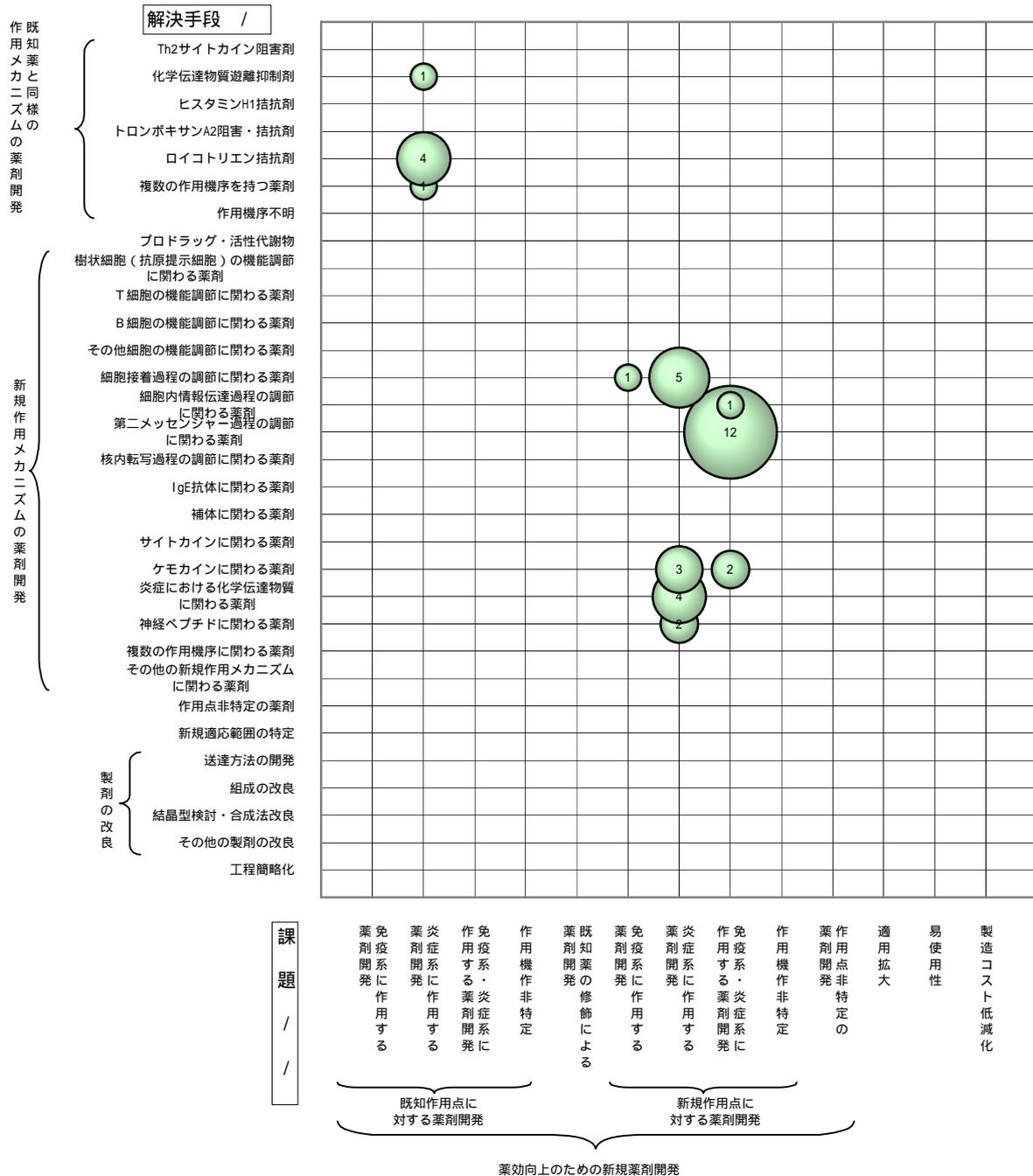
図 2.10.4-1 メルク アンド コーの抗アレルギー剤に関する技術要素と課題



(1993年1月～2003年12月の出願)

図 2.10.4-2 に抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布を示す。「新規作用点に対する薬剤開発」については、「第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤」（PDE4 阻害剤）で対応する特許が 12 件ある。「新規作用点に対する薬剤開発」についてはほかに「ケモカインに関わる薬剤」5 件、「細胞接着過程の調節に関わる薬剤」6 件、「炎症における化学伝達物質に関わる薬剤」4 件（PGD2 拮抗剤およびブラジキニン拮抗剤）などで対応している。

図 2.10.4-2 メルク アンド コーの抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布



(1993年1月～2003年12月の出願)

表 2.10.4 にメルク アンド コーの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許を示す。
出願件数は 36 件であり、そのうち登録になっている特許は 2 件である。

なお、表 2.10.4 では図 2.10.4-2 の解決手段 を細展開した解決手段 まで分析している。

表 2.10.4 メルク アンド コーの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(1/3)

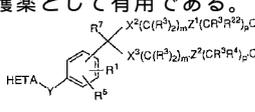
技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 複素環式	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	化学伝達物質遊離抑制剤	特表平 10-507767 94.10.27 C07D311/16,101	ロイコトリエン生合成阻害剤としてのビスアリアルカルピノール誘導体
	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	ロイコトリエン拮抗剤	特表平 9-504777 (みなし取下げ) 93.05.21 C07D215/22 [被引用 1 回]	ロイコトリエンアンタゴニストとしてのキノリン誘導体
			特許 3594603 93.12.28 C07D491/048 [被引用 1 回]	ロイコトリエン拮抗薬としてのジアリール 5,6-縮合複素環酸 下記(I)で示される、ロイコトリエン拮抗薬。この化合物は抗喘息薬、抗アレルギー薬、抗炎症薬及び細胞保護薬として有用である。 
			特表平 11-509179 (みなし取下げ) 95.06.07 C07D215/14 [被引用 1 回]	ロイコトリエン拮抗薬としてのヘテロアリアルジオール酸
			特表 2001-514660 97.03.13 C07D215/18	キノリンロイコトリエン拮抗薬
	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	複数の作用機序を持つ薬剤	特表平 11-504044 (拒絶査定確定) 96.02.08 A61K31/445,ABF	治療方法及び医薬製剤
	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	細胞接着過程の調節に関わる薬剤	特表 2002-512625 97.05.29 A61K38/00 [被引用 3 回]	細胞接着阻害薬としての複素環アミド化合物
	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発		特表 2001-524465 97.11.24 C07D207/16 [被引用 1 回]	細胞接着阻害剤としての置換 -アラニン誘導体
			特表 2004-526733 01.03.20 C07K5/078	強力な細胞接着阻害剤としての置換 N-アリアルスルホニルプロリン誘導体
		ケモカインに関わる薬剤 / CC ケモカインに関わる薬剤	特表 2002-541103 99.04.06 C07D207/09 [被引用 2 回]	ピロリジン系ケモカイン受容体活性調節剤

表 2.10.4 メルク アンド コーの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(2/3)

技術要素 /	(課題)課題 /課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発 (つづき)	ケモカインに関わる薬剤 / CC ケモカインに関わる薬剤 (つづき)	特表 2002-541104 99.04.06 C07D401/06 [被引用 2 回]	ピロリジン系ケモカイン受容体活性調節剤
			特表 2004-506013 00.08.17 C07D211/14	シクロペンチル系ケモカイン受容体活性調節剤
		炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 脂質メディエーターに関わる薬剤	特表 2003-530426 00.04.12 A61K45/00	PGD2 受容体拮抗薬を用いるアレルギー状態の治療のための方法および組成物
			特表 2004-534774 01.05.23 C07D471/04, 104	プロスタグランジン D2 受容体拮抗薬としてのジヒドロピロロ[1,2-a]インドールおよびテトラヒドロピロロ[1,2-a]ーインドール誘導体
		炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 起炎性プロテアーゼに関わる薬剤	特表 2005-522430 02.02.04 C12N5/06, ZNA	グランザイム B 阻害剤
		炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / その他の化学伝達物質に関わる薬剤	特表 2005-517006 02.02.08 C07C237/24	ブラジキニン拮抗薬として有用なメチル上に置換基を有する N-ピフェニルメチルアミノシクロアルカンカルボキサミド誘導体
	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	神経ペプチドに関わる薬剤 / タキキニンに関わる薬剤	特表平 11-508553 (みなし取下げ) 95.06.28 C07D401/14, 249	ビペリジン及びモルホリン誘導体並びに治療剤としてのそれらの使用
			特表 2001-501203 96.09.25 C07D491/107	スピロアザシクロ誘導体、該誘導体の製造およびタキキニン拮抗薬としての該誘導体の使用
		細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特表 2005-504752 01.08.01 C07D471/04, 105	ベンズイミダゾ[4,5-f]イソキノリノン誘導体
		第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / PDE4 に関わる薬剤	特許 3468777 95.12.15 C07D213/50 [被引用 5 回]	<p>PDEIV 阻害剤としてのジフェニルピリジリエン誘導体</p> <p>ホスホジエステラーゼ IV(PDEIV)を阻害してサイクリックアデノシン-3',5'-リン酸(cAMP)のレベルを増大させることによる、喘息を含む疾患の治療に有用な下記(I)の新規な化合物。</p>  <p style="text-align: center;">I</p>
			特表 2002-537383 (取下) 99.02.25 C07D213/89	PDEIV 阻害化合物、組成物および治療方法
			特表 2002-543064 99.04.23 C07D213/64	PDE4 インヒビターとなるヘテロ置換ピリジン誘導体
	特表 2002-544193 99.05.05 C07D213/74	PDE4 阻害薬としてのヘテロ置換ピリジン誘導体		

表 2.10.4 メルク アンド コーの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(3/3)

技術要素 /	(課題)課題 /課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発 (つづき)	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / PDE4 に関わる薬剤 (つづき)	特表 2002-544259 99.05.13 C07D213/70	PDE4 阻害薬としてのヘテロ置換ピリジン誘導体
			特表 2003-525273 00.03.02 C07D209/42	PDEIV を阻害するアミド、組成物および治療方法
			特表 2003-528099 00.03.23 C07D417/04	トリーアリアルール置換-エタン PDE4 阻害物質
			特表 2003-534328 00.05.25 C07D213/89	フルオロアルコキシ置換ベンズアミドジクロロピリジニル N-オキシド PDE4 阻害剤
			特表 2004-521921 00.12.20 C07D215/12	置換 8-アリアルールキノリン系ホスホジエステラーゼ-4 阻害薬
			特表 2004-534773 01.05.24 C07D471/04, 114	1-ピアリアルール-1,8-ナフチリジン-4-オン系ホスホジエステラーゼ-4 阻害薬
			特表 2005-501822 01.06.27 C07D215/12	置換 8-アリアルールキノリン系 PDE4 阻害薬
			特表 2005-508313 01.08.29 C07D471/04, 114	アルキン-アリアルールホスホジエステラーゼ-4 阻害薬
		ケモカインに関わる薬剤 / その他のケモカインに関わる薬剤	特表 2001-508798 (みなし取下げ) 97.01.21 C07D211/16	ケモカインレセプター活性のモジュレーターとしての 3,3-二置換ピペリジン類
			特表 2002-510327 (みなし取下) 97.07.25 C07D211/58 [被引用 6 回]	環状アミンケモカイン受容体活性調節剤
非環式 合成医薬品 /	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	細胞接着過程の調節に関わる薬剤	特表 2001-517245 97.05.29 C07D217/26 [被引用 5 回]	細胞接着阻害薬としてのピアリアルールアルカン酸類
			特表 2002-501537 (みなし取下) 97.05.29 A61K31/18 [被引用 2 回]	細胞接着阻害薬としてのスルホンアミド類
ペプチド医薬品 / 高分子医薬品 /			特表 2001-523711 97.11.24 C07C311/19 [被引用 1 回]	細胞接着阻害薬としての環状アミノ酸誘導体

2.11 アステラス製薬

2.11.1 企業の概要

商号	アステラス製薬 株式会社
本社所在地	〒103-0023 東京都中央区日本橋本町 2 - 3 - 11
設立年	1923年
資本金	1,029 億 85 百万円
従業員数	約6,600名(個別) (連結: 15,300名)
事業内容	医薬品、医薬部外品、食品、医療関連製品の製造・販売および輸出入、並びに在宅医療事業など

アステラス製薬は、2005 年 4 月 1 日に藤沢薬品工業と山之内製薬が合併により誕生した企業である。同社は、創薬研究において、泌尿器と移植を含む炎症・免疫をフランチャイズ領域とし、感染症、糖尿病、消化器、中枢の 4 領域を重点研究領域としている。アステラス製薬名義の出願には、合併前の「藤沢薬品工業」、「山之内製薬」名義の出願を併せて解析を行った。

主力製品として「リピトール」（高コレステロール血症治療剤）、「ミカルディス」（高血圧症治療薬）、「マイスリ」（入眠剤）、「ルボックス」（選択的セロトニン再取り込み阻害剤）などがある。

（出典：<http://www.astellas.com/jp/index.html>）

2.11.2 製品例

抗アレルギー剤関連製品

医療用医薬品

- 「インターール」（気管支喘息、アレルギー性鼻炎、アレルギー性結膜炎、食物アレルギー治療剤）
- 「プロトピック」（アトピー性皮膚炎治療剤）

2.11.3 技術開発拠点と研究者

開発拠点：茨城県つくば市東光台 5-2-3、茨城県つくば市御幸が丘 21

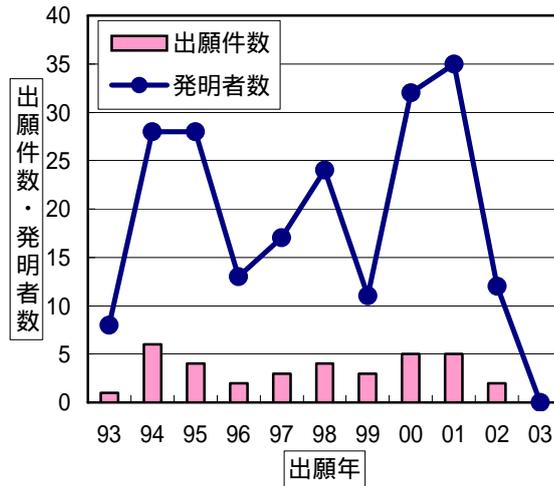
アステラス製薬 探索研究所、発酵研究所、分子医学研究所

大阪府大阪市中央区道修町 3-4-7

アステラス製薬 創薬推進研究所、薬理研究所、化学研究所

図 2.11.3 にアステラス製薬の抗アレルギー剤の出願件数と発明者数の年次推移を示す。出願件数は毎年数件である。

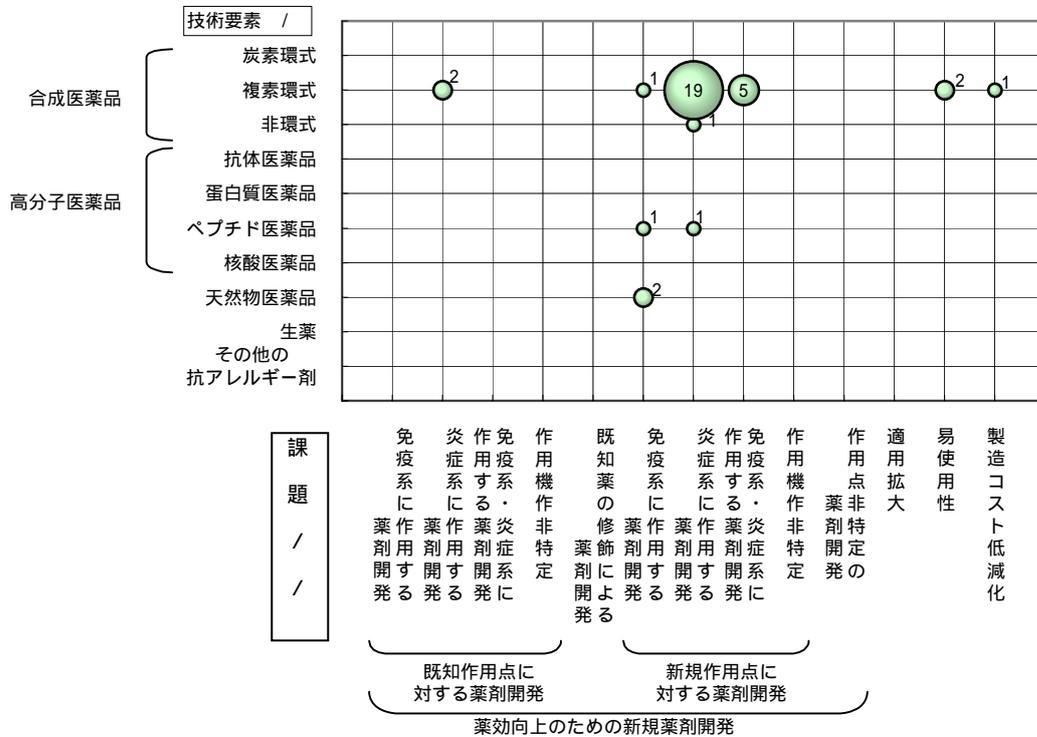
図 2.11.3 アステラス製薬の抗アレルギー剤に関する出願件数と発明者数



2.11.4 技術開発課題対応保有特許の概要

図 2.11.4-1 に抗アレルギー剤に対する技術要素と課題の分布を示す。アステラス製薬では合成医薬品が主流であり、化合物としては大部分が複素環式化合物である。ペプチド医薬、天然物医薬も出願されている。

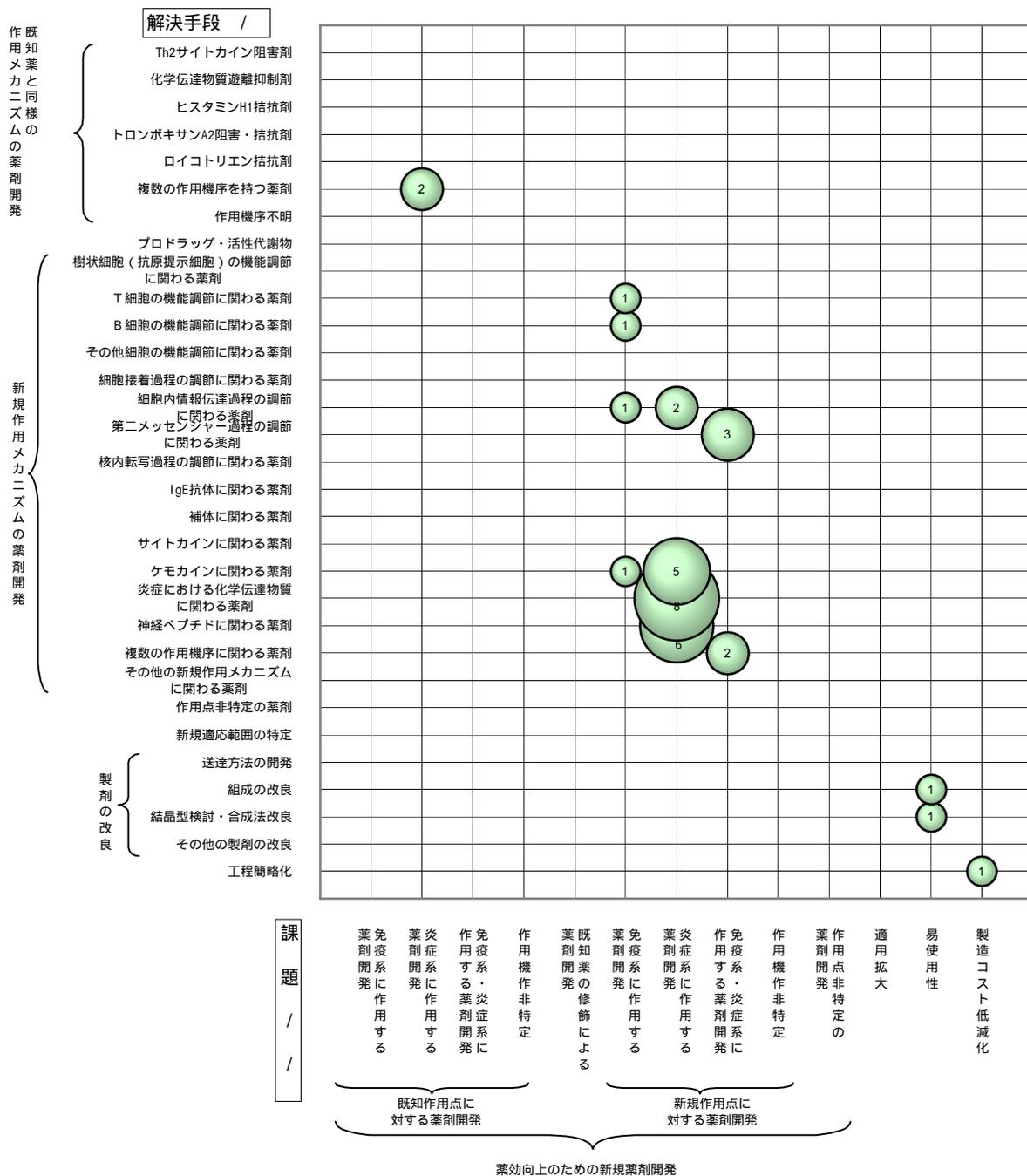
図 2.11.4-1 アステラス製薬の抗アレルギー剤に関する技術要素と課題



(1993年1月～2003年12月の出願)

図 2.11.4-2 に抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布を示す。「新規作用点に対する薬剤開発」については、「炎症における化学伝達物質に関わる薬剤」8件、「ケモカインに関わる薬剤」5件（CCR3 阻害剤）、「その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤」5件（ブラジキニン拮抗剤）、「神経ペプチドに関わる薬剤」5件（タキキニン拮抗剤）、「第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤」3件（PDE4 阻害剤）などが出願されている。

図 2.11.4-2 アステラス製薬の抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布



(1993年1月～2003年12月の出願)

表 2.11.4 にアステラス製薬の抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許を示す。
出願件数は 35 件であり、そのうち登録になっている特許は 4 件である。

なお、表 2.11.4 では図 2.11.4-2 の解決手段 を細展開した解決手段 まで分析している。

表 2.11.4 アステラス製薬の抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(1/3)

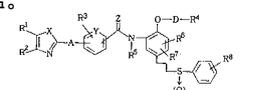
技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 複素環式	(易使用性)保存安定性	組成の改良	特表 2001-501980 (拒絶査定確定) 98.06.29 A61K31/404	医薬組成物
		結晶型検討・合成法改良	特開平 10-316677 (みなし取下げ) 97.05.19 C07D401/12,213	結晶
	(製造コスト低減化)原体コストの低減化	工程簡略化	特開平 10-316678 (みなし取下げ) 97.05.16 C07D417/04,209	チアゾリルベンゾフラン誘導体の製造方法
	既知作用点に対する薬剤開発/炎症系に作用する薬剤開発	複数の作用機序を持つ薬剤	特許 3061862 94.10.14 C07D263/32 [被引用 2 回]	アゾール誘導体 ロイコトリエン拮抗作用及びトロンボキササン A2 拮抗作用を併有し、アレルギー性疾患 虚血性心疾患又は虚血性脳疾患の予防又は治療に有用である下記(1)で示されるアゾール誘導体またはその塩。  (1)
			特表 2000-503984 96.01.22 C07D417/14	チアゾリルベンゾフラン誘導体およびその医薬組成物
	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系に作用する薬剤開発	B 細胞の機能調節に関わる薬剤	WO00/75113 (却下) 00.06.09 C07D213/82	新規なヘテロ環カルボキサミド誘導体
	新規作用点に対する薬剤開発/炎症系に作用する薬剤開発	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特表 2003-503489 99.07.05 C07D233/64,105	一酸化窒素産生阻害剤としての N-イミダゾリルメチルカルボキサミド
			ケモカインに関わる薬剤/CC ケモカインに関わる薬剤	特開 2002-187880 00.09.27 C07D211/14 東レ、山之内製薬
			特開 2003-155285 (みなし取下げ) 01.11.19 C07D401/12 東レ、山之内製薬	環状含窒素誘導体
			特開 2004-83511 02.08.28 C07D207/14 山之内製薬、東レ	アクリルアミド誘導体
		WO02/18335 00.08.28 C07D207/14 山之内製薬、東レ [被引用 2 回]	環状アミン誘導体	

表 2.11.4 アステラス製薬の抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許 (2/3)

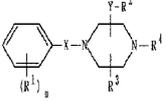
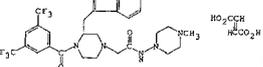
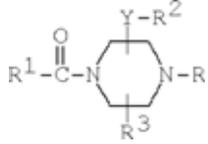
技術要素 /	(課題)課題 /課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発 (つづき)	ケモカインに関わる薬剤 / CC ケモカインに関わる薬剤 (つづき)	W003/72545 02.02.27 A61K45/00 東レ、山之内製薬	環状アミン化合物及びそれを有効成分とする CCR3 阻害薬
		炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 脂質メデイーターに関わる薬剤	特表 2002-503247 (みなし取下) 97.06.02 C07D263/32	PGE2 アゴニストおよびアンタゴニストとして有用なオキサゾール化合物
			特表 2002-525361 98.09.25 C07D263/32	オキサゾール化合物
		炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 起炎性プロテアーゼに関わる薬剤	特表 2005-502706 01.09.07 C07D409/04	MMP 又は TNF-アルファ阻害物質としてのチオフエニルチオピランジオキソイド
		炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / その他の化学伝達物質に関わる薬剤	特開平 7-242666 (みなし取下) 94.03.08 C07D471/04, 108 [被引用 1 回]	複素環化合物
			特開平 7-300477 (みなし取下) 94.04.29 C07D471/04, 108 [被引用 1 回]	複素環化合物
			特表平 10-507764 (特許 3697486) 94.10.27 C07D215/26 [被引用 4 回]	ブラジキニン拮抗剤としての、ピリドピリミドン類、キノリン類および縮合 N-複素環類
			特表 2000-515848 95.09.18 C07D215/26	ブラジキニン拮抗薬としての複素環式化合物
		神経ペプチドに関わる薬剤 / タキキニンに関わる薬剤	特許 3129123 93.11.29 C07D241/04 [被引用 2 回]	<p>ビペラジン誘導体</p> <p>下記(1)で示される新規なビペラジン誘導体またはその塩、それらの製造方法およびそれらを含む医薬組成物。タキキニン拮抗剤として、喘息、気管支炎等の治療に有効である。</p>  <p style="text-align: right;">(1)</p>
			W095/28389 (みなし取下) 94.04.15 C07D221/20 [被引用 4 回]	スピロ化合物及びその医薬組成物
	特許 3071829 (権利消滅) 95.05.25 C07D403/06	<p>ニューロキニン受容体拮抗剤としての 1-ベンゾイル-2-(インドリル-3-アルキル)-ビペラジン誘導体</p> <p>下記(1)の化合物、それらの塩、それらの製造法、それらを含む医薬組成物、ならびにそれらの医薬としての用途に関する。</p>  <p style="text-align: right;">(1)</p>		

表 2.11.4 アステラス製薬の抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許 (3/3)

技術要素 /	(課題)課題 /課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発 (つづき)	神経ペプチドに関わる薬剤 / タキキニンに関わる薬剤 (つづき)	特許 3454427 98.12.14 C07D413/06	ピペラジン誘導体 下記で表されるピペラジン誘導体およびその塩、その製造方法、それを含む医薬組成物、並びにそのタキキニン媒介疾患の治療または予防への利用 
			特表 2004-501903 00.06.29 C07D241/04	ベンズヒドリル誘導体
			特表 2004-517873 01.01.02 C07D241/04	タキキニン拮抗薬としての 1-(2-メトキシベンジル)-3-ベンズヒドリルピペラジン誘導体
	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / PDE4に関わる薬剤	特表平 11-503445 95.04.10 C07D209/12	cGMP-PDE 阻害剤としてのインドール誘導体
			特表 2003-505376 99.07.21 C07D235/26	ベンズイミダゾロン誘導体およびそのホスホジエステラーゼ阻害剤としての用途
			特開 2003-12671 01.04.23 C07D471/04, 114	医薬組成物
特開 2001-220390 00.02.09 C07D401/12 W000/18768 (拒絶査定確定) 98.09.29 C07D471/04, 120			縮合ピラゾール誘導体 ピリドピラジン化合物の新規な塩およびその結晶	
合成医薬品 / 非環式	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 脂質メディエーターに関わる薬剤	特表平 9-508363 (みなし取下げ) 94.01.24 C07C229/22 [被引用 1 回]	アミノ酸誘導体およびそのホスホリパーゼ A 下 2 阻害剤としての用途
高分子医薬品 / ペプチド医薬品	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特表 2003-513104 99.11.04 C07K5/078	NOS 阻害活性を有する置換ジペプチド
			特表 2004-517877 01.01.02 C07K5/078	一酸化窒素産生阻害活性を有するペプチド
天然物医薬品 / 微生物由来	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	ケモカインに関わる薬剤 / CC ケモカインに関わる薬剤	特開平 9-241242 (みなし取下げ) 96.03.06 C07D213/69	新規ピエリサイジン誘導体
動物由来 / 医薬品 / 天然物		T細胞の機能調節に関わる薬剤	特開平 9-143072 (みなし取下げ) 95.11.22 A61K31/44, ABC	サイトカイン産生抑制剤

2.12 協和醗酵工業

2.12.1 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（2005年3月末）
従業員数	5,960名（2005年3月末、連結ベース）
事業内容	医家向け医薬品、原料用アルコール、食品の製造・販売 製剤原料および農畜水産薬の製造、化学品（溶剤、可塑剤等）の販売

協和醗酵工業は医薬事業に注力しており、この中核をなしているのはバイオ医薬、ゲノム創薬である。癌、中枢およびアレルギー領域に焦点をあて、抗体技術や最先端技術により治療薬の創薬研究ならびに臨床開発を進めている。

研究開発品目としては、抗アレルギー剤 KW-4679（アレロック）が中国においてPhaseIIIである。

研究開発におけるアレルギー関連の薬としては、抗T細胞受容体抗体が前臨床中である。

主力製品には「デュロテップパッチ」（持続性がん疼痛治療剤）、「コニール」（高血圧症・狭心症治療剤）などがある。

（出典：<http://www.kyowa.co.jp/pharma/index.html>）

2.12.2 製品例

抗アレルギー剤関連製品

医療用医薬品

- 「アレロック」（アレルギー性鼻炎、じんましん、皮膚疾患に伴うそう痒症治療剤）
- 「セルテクト」（アレルギー性鼻炎、じんましん、皮膚そう痒症、湿疹、皮膚炎治療剤）

（出典：<http://www.kyowa.co.jp/pharma/index.html>）

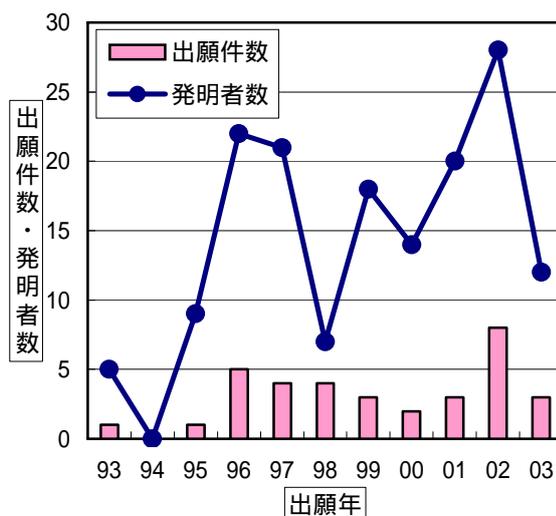
2.12.3 技術開発拠点と研究者

開発拠点：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

研究者数：1,400名

図 2.12.3 に協和醗酵工業の抗アレルギー剤の出願件数と発明者数の年次推移を示す。出願件数は数件、継続的に出願されている。

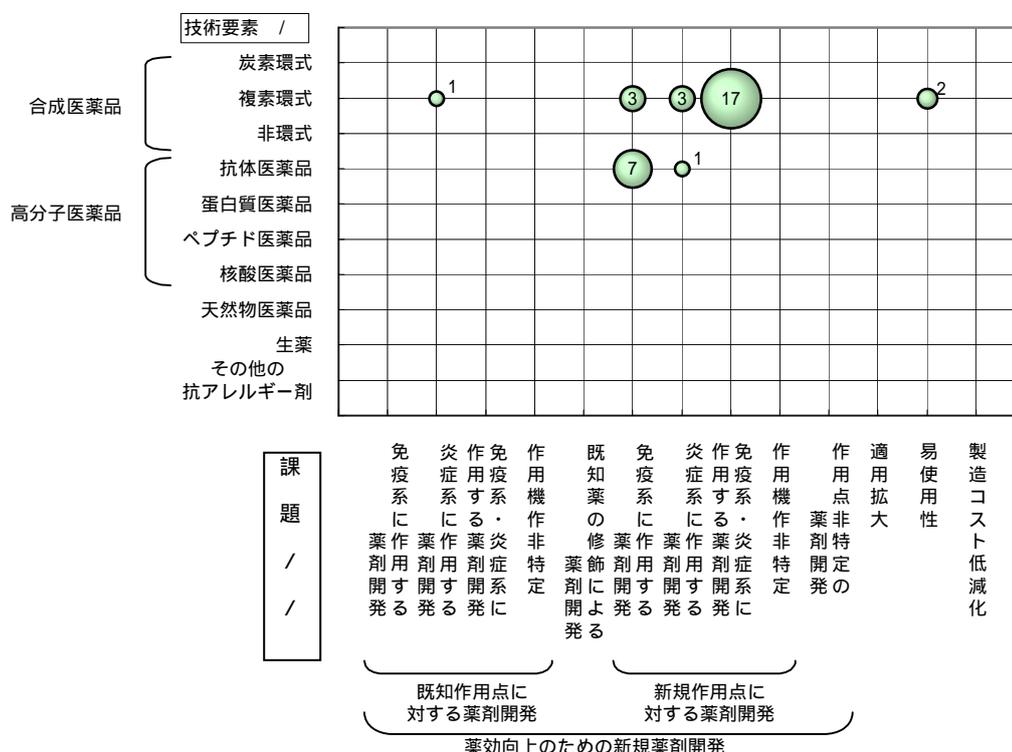
図 2.12.3 協和醗酵工業の抗アレルギー剤に関する出願件数と発明者数



2.12.4 技術開発課題対応特許の概要

図 2.12.4-1 に抗アレルギー剤に対する技術要素と課題の分布を示す。協和醗酵工業では合成医薬品の他に抗体医薬品の出願がある。抗体医薬としては「ケモカインに関わる薬剤」、「その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤」である。

図 2.12.4-1 協和醗酵工業の抗アレルギー剤の技術要素と課題の分布

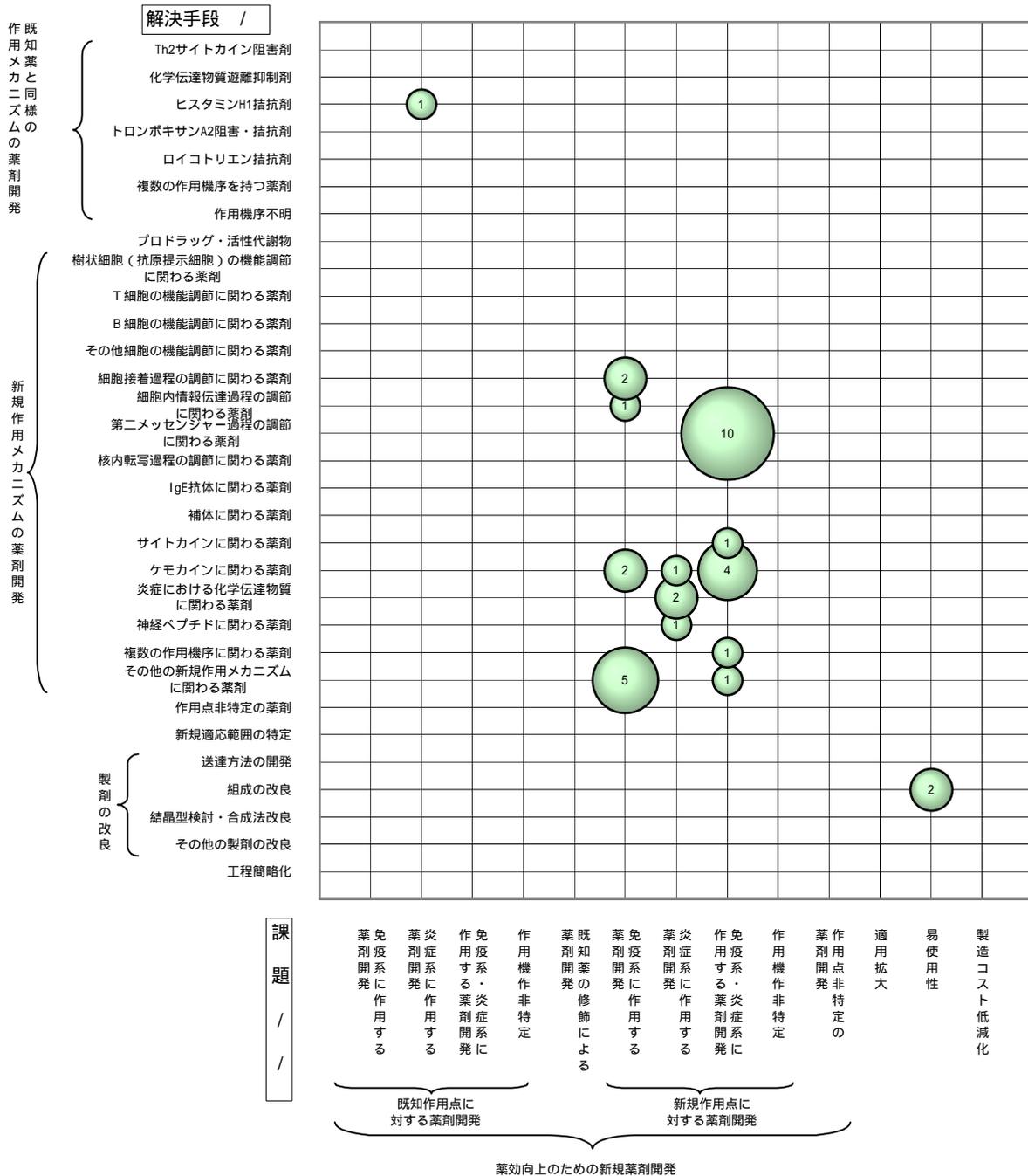


(1993年1月～2003年12月の出願)

図 2.12.4-2 に抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布を示す。「新規作用点に対する薬剤開発」の中で「免疫系・炎症系に作用する薬剤開発」の課題が多く、解

決手段としては「第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤」(PDE4 阻害剤) 10 件、「ケモカインに関わる薬剤」4 件などで対応している。

図 2.12.4-2 協和醗酵工業の抗アレルギー剤の課題と解決手段の分布



(1993年1月～2003年12月の出願)

表 2.12.4 に協和醗酵工業の抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許を示す。出願件数は 34 件であり、そのうち登録になっている特許は 2 件である。

なお、表 2.12.4 では図 2.12.4-2 の解決手段 を細展開した解決手段 まで分析している。

表 2.12.4 協和醗酵工業の抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(1/3)

技術要素 /	(課題)課題 /課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品 / 複素環式	(易使用性)投与法の改善	組成の改良	特許 3662944 93.08.24 A61K31/335	点鼻剤 (Z) - 11 - (3 - ジメチルアミノプロピリデン) - 611 - ジヒドロジベンゾ [be] オキセピン - 2 - 酢酸またはその塩を有効成分として含有する点鼻剤。アレルギー性鼻疾患の治療に有用 (図なし)
			特開平 11-35460 97.07.24 A61K31/335, ABE	ジベンゾ [b.e] オキセピン誘導体を含有する医薬品製剤
	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	ヒスタミン H1 拮抗剤	特開平 10-25241 96.07.10 A61K31/335, ABF	抗アレルギー剤
	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	細胞接着過程の調節に関わる薬剤	特開平 9-278780 (みなし取下げ) 96.04.09 C07D513/04, 345 [被引用 1 回]	キノロン誘導体
			特開平 10-330377 (みなし取下げ) 97.06.02 C07D401/14, 239	ピペリジン誘導体
		細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	W003/06060 01.07.09 A61K45/00	SH3 ドメイン結合阻害剤
	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / その他の化学伝達物質に関わる薬剤	W098/42672 (みなし取下) 97.03.24 C07D215/26	ベンゼン誘導体
			特開 2004-131497 02.09.18 C07D233/64, 105 周東智	シスシクロプロパン誘導体
		神経ペプチドに関わる薬剤 / タキキニンに関わる薬剤	特開平 9-40662 (みなし取下げ) 95.05.24 C07D313/12	三環式化合物
	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / PDE4 に関する薬剤	特開平 10-147585 96.11.19 C07D405/12, 213	含酸素複素環化合物
			W098/22455 96.11.19 C07D319/18 [被引用 3 回]	含酸素複素環化合物
			W098/22452 96.11.19 C07D307/84	ベンゾフラン誘導体
			特開 2000-239277 99.02.19 C07D487/04, 144	イミダゾキナゾリン誘導体

表 2.12.4 協和醗酵工業の抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(2/3)

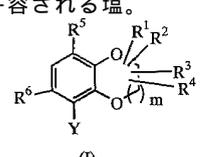
技術要素 /	(課題)課題 /課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系・炎症系に作用する薬剤開発(つづき)	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤/PDE4に関する薬剤(つづき)	W099/16768 97.10.01 C07D405/14	ベンゾフラン誘導体
			特許 3589985 98.09.03 C07D317/64 [被引用 1 回]	含酸素複素環化合物 下記(I)で表される含酸素複素環化合物またはその薬理的に許容される塩。  (I)
			W001/64666 00.03.02 C07D319/18 [被引用 1 回]	含酸素複素環化合物
			特開 2004-196785 02.12.02 C07D491/048	フロピリジン誘導体
			特開 2005-60375 02.02.20 A61K31/196	含酸素複素環化合物
			特開 2005-60376 02.02.20 A61K31/196	ピペリジン誘導体
			特表 2003-506377 99.07.28 A61K31/451 ミレニアム PHARM	ケモカイン受容体アンタゴニストおよびその使用方法
			特表 2002-501052 98.01.21 C07D211/52 ミレニアム PHARM	ケモカイン受容体アンタゴニストおよびその使用方法
			特表 2002-501072 98.01.21 C07D211/52 ミレニアム PHARM	ケモカイン受容体アンタゴニストおよびその使用方法
			特表 2002-524458 98.09.04 C07D213/36 ミレニアム PHARM	ケモカイン受容体アンタゴニストおよびその使用方法
			特表 2005-510565 01.11.21 C07D211/52, CSP ミレニアム PHARM	ケモカイン受容体アンタゴニストおよびその使用方法
			特開 2005-162673 03.12.03 C07D471/04	二環性ピリミジン誘導体
			W003/82855 02.02.20 C07D207/26	抗炎症剤

表 2.12.4 協和醗酵工業の抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(3/3)

技術要素 / /	(課題)課題 / /課題	(解決手段) 解決手段/ 解決手段	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
高分子医薬品/ 抗体医薬品	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系に作用する薬剤開発	ケモカインに関わる薬剤/CCケモカインに関わる薬剤	特開 2001-161369 99.12.07 C12N15/09,ZNA	ケモカイン HVC002 の有する活性を阻害する抗体
			W001/64754 00.03.03 C12N15/09,ZNA	遺伝子組換え抗体およびその抗体断片
		その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤	W003/84569 02.02.20 C07D207/26	抗体組成物含有医薬
			W003/84570 02.02.20 C07D207/26	Fc R111a 多型患者に適応する抗体組成物含有医薬
			W003/85102 02.02.20 C07D207/26	GDP-フコースの輸送に関与する蛋白質の活性が低下または欠失した細胞
			W003/85107 02.02.20 C07D207/26	ゲノムが改変された細胞
			W003/85118 02.02.20 C07D207/26	抗体組成物の製造方法
	新規作用点に対する薬剤開発/炎症系に作用する薬剤開発	ケモカインに関わる薬剤/CCケモカインに関わる薬剤	W003/18635 01.08.31 C12N15/09,ZNA	ヒト型 CDR 移植抗体およびその抗体断片

2.13 小野薬品工業

2.13.1 企業の概要

商号	小野薬品工業 株式会社
本社所在地	〒541-8564 大阪市中央区久太郎町1丁目8番2号
設立年	1947年
資本金	17,358百万円
従業員数	2,396名（小野薬品単独ベース） 2,604名（連結ベース）（2005年3月末現在）
事業内容	医療用医薬品を主体とする各種医薬品および診断用試薬・機器の製造、仕入れおよび販売

小野薬品工業は、創薬研究として、プロスタグランジン、酵素阻害剤、神経科学、細胞内情報伝達の4領域を重点研究領域としている。

国内で販売していた、気管支喘息・アレルギー性鼻炎治療剤「オノンカプセル」、気管支喘息治療剤「オノンドライシロップ」は2000年11月に米国シェリング・プラウ社に導出され、現在、同社により中南米諸国で販売されている。

主力製品として「オパルモン錠」（抹消循環障害治療剤）、「注射用エラスポール」（急性肺障害治療剤）などがある。

（出典：<http://www.ono.co.jp/>、第57期事業報告書）

2.13.2 製品例

抗アレルギー剤関連製品

医療用医薬品

- 「オノンドライシロップ、ベガ錠」（気管支喘息治療剤）
- 「オノンカプセル」（気管支喘息・アレルギー性鼻炎治療剤）

（出典：<http://www.ono.co.jp/>、第57期事業報告書）

2.13.3 技術開発拠点と研究者

開発拠点：福井県坂井郡三国町山岸テクノポート1-5-2 小野薬品工業

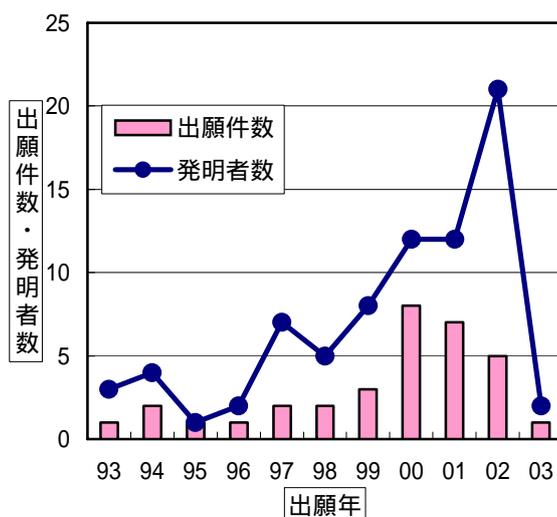
福井研究所

大阪府三島郡島本町桜井3丁目1-1 小野薬品工業 水無瀬研究所

茨城県つくば市和台17番の2 小野薬品工業 筑波研究所

図 2.13.3 に小野薬品工業の抗アレルギー剤の出願件数と発明者数の年次推移を示す。継続的に出願されているが00～02年にかけて増加している。

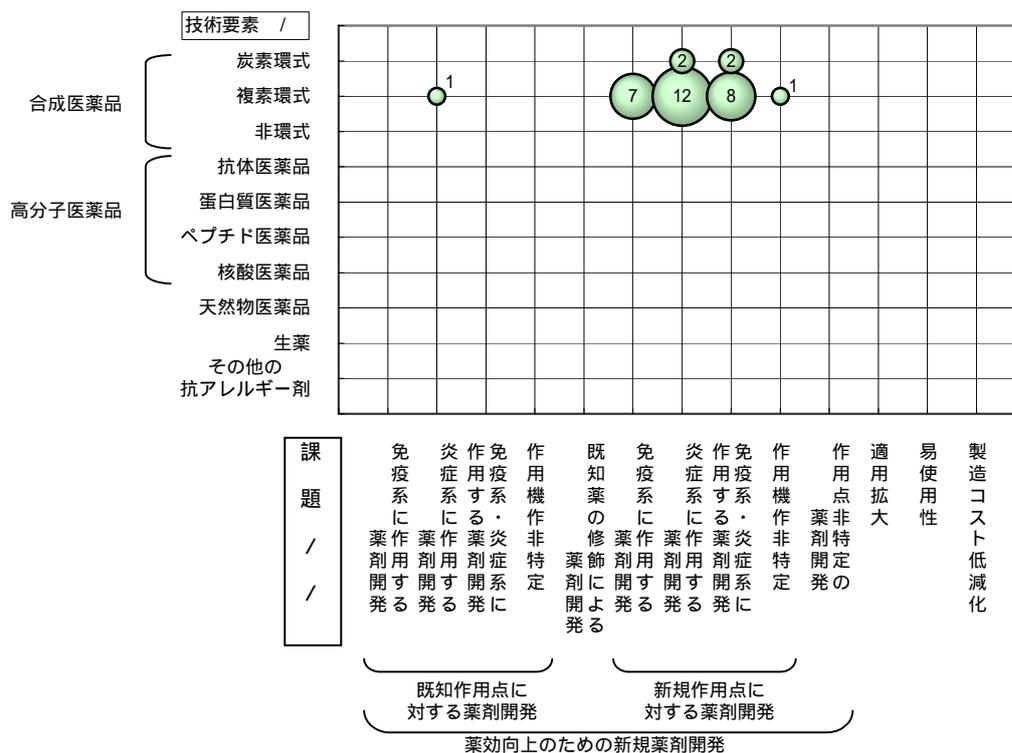
図 2.13.3 小野薬品工業の抗アレルギー剤に関する出願件数と発明者数



2.13.4 技術開発課題対応保有特許の概要

図 2.13.4-1 に抗アレルギー剤に対する技術要素と課題の分布を示す。小野薬品工業では合成医薬品が主流であり、化合物としては複素環式化合物が大部分である。

図 2.13.4-1 小野薬品工業の抗アレルギー剤に関する技術要素と課題

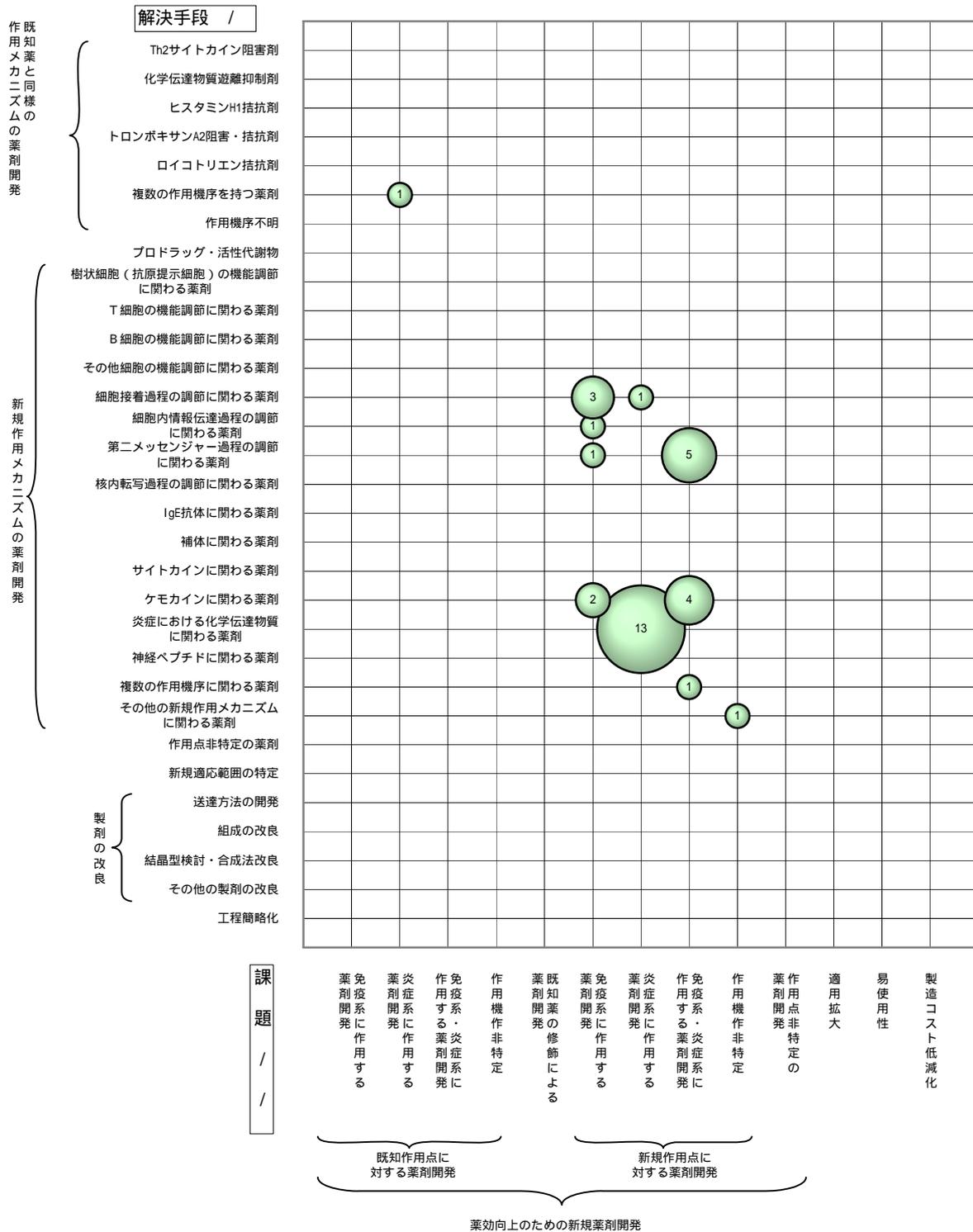


(1993年1月～2003年12月の出願)

図 2.13.4-2 に抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布を示す。「新規作用点に対する薬剤開発」のうち「炎症系に作用する薬剤開発」の課題の中では主に「炎症における化学伝達物質に関わる薬剤」13件、(脂質メディエーターに関わる薬剤)で対応して

いる。「薬効向上のための新規薬剤開発」の全体でみると「第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤」6件、(PDE4 阻害剤)、「ケモカインに関わる薬剤」(6件)などが出願されている。

図 2.13.4-2 小野薬品工業の抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布



(1993年1月~2003年12月の出願)

表 2.13.4 に小野薬品工業の抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許を示す。出願件数は 33 件であり、そのうち登録になっている特許は 2 件である。

なお、表 2.13.4 では図 2.13.4-2 の解決手段 を細展開した解決手段 まで分析している。

表 2.13.4 小野薬品工業の技術要素別課題対応特許 (1/3)

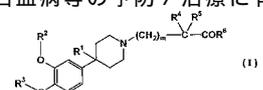
技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 炭素環式	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 起炎性プロテアーゼに関わる薬剤	特開平 9-40631 95.08.02 C07C257/18	アミジノフェノール誘導体、その製造方法およびダニアレルギー治療剤
			特開平 10-306025 (みなし取下げ) 97.05.07 A61K31/24, AED 桐蔭横浜大学	花粉プロテアーゼ阻害剤
	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / PDE4 に関する薬剤	特開 2002-193880 00.12.27 C07C62/34 特許 3433752 00.08.11 C07D211/22 [被引用 2 回]	ピシクロオクタン誘導体 ピペリジン誘導体およびその誘導体を有効成分とする薬剤 下記(1)で示されるピペリジン誘導体。PDE4 阻害活性を有し、炎症性疾患、糖尿病性疾患、アレルギー性疾患、自己免疫疾患、骨粗しょう症、骨折、肥満症、抗うつ、パーキンソン病、虚血再かん流障害、白血病等の予防 / 治療に有用である。  (1)
	合成医薬品 / 複素環式	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	複数の作用機序を持つ薬剤	特開平 8-109179 (みなし取下げ) 94.10.07 C07D405/06, 233
新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	細胞接着過程の調節に関わる薬剤	特開平 11-302280 (みなし取下) 98.04.17 C07D417/06, 307 特開 2000-319277 99.05.11 C07D471/14, 102 [被引用 5 回] 特開 2000-319278 99.05.11 C07D471/14, 102	チアゾリジン誘導体、およびその誘導体を有効成分とする医薬 縮合ピラジン化合物およびその化合物を有効成分とする薬剤 縮合ピラジン化合物およびその化合物を有効成分とする薬剤	
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	W003/22309 01.09.10 A61K45/00	アレルギー疾患治療剤	
	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤	W003/64389 02.01.31 C07D209/44	含窒素二環性化合物およびその化合物を有効成分として含有する薬剤	
	ケモカインに関わる薬剤 / CC ケモカインに関わる薬剤	特開 2004-196822 02.02.20 A61K31/436	トリアザスピロ [5.5] ウンデカン誘導体およびそれらを有効成分とする薬剤	

表 2.13.4 小野薬品工業の技術要素別課題対応特許 (2/3)

技術要素 /	(課題)課題 /課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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		
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発(つづき)	ケモカインに関わる薬剤 / CXC ケモカインに関わる薬剤	特開 2005-132761 03.10.29 C07D403/04	含窒素複素環化合物およびその用途		
			W099/24434 97.11.11 C07D487/04,145	縮合ピラジン化合物		
			特開平 7-316150 (みなし取下げ) 94.05.24 C07D405/06,233	縮合フェノール誘導体		
			特開平 7-112980 (みなし取下げ) 93.08.24 C07D405/06,207	縮合フェノール誘導体およびその誘導体を有効成分として含有する薬剤		
			W001/62708 00.02.22 C07C233/55	安息香酸誘導体、それらの製造方法およびそれらを有効成分として含有する薬剤		
			W001/66520 00.03.09 C07D209/08	インドール誘導体、その製造方法および用途		
			W002/16311 00.08.22 C07C233/44	カルボン酸誘導体、それらの製造方法およびそれらを有効成分として含有する薬剤		
			W002/20462 00.09.01 C07C233/55	安息香酸誘導体およびそれらを有効成分として含有する薬剤		
			W003/22813 01.09.07 C07D209/12	インドール誘導体化合物、それらの製造方法およびそれらを有効成分として含有する薬剤		
			W003/22814 01.09.07 C07D209/26	インドール誘導体化合物		
			W003/74483 02.02.20 A61K31/4375	8-アザプロスタグランジン誘導体化合物およびその化合物を有効成分として含有する薬剤		
			W003/78409 02.02.20 C07D265/36	カルボン酸化合物およびその化合物を有効成分として含有する薬剤		
			W097/37969 (みなし取下げ) 96.04.10 C07C257/18 [被引用1回]	トリプターゼ阻害剤および新規なグアニジノ誘導体		
			新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / PDE4に関する薬剤	特開 2002-20386 00.07.07 C07D471/04,106	ピラゾロピリジン誘導体
					特開 2003-300960 02.02.08 C07D211/64	ピペリジン誘導体化合物およびその化合物を有効成分として含有する薬剤
W003/66591 02.02.08 C07D211/64	ピペリジン誘導体化合物およびその化合物を有効成分として含有する薬剤					

表 2.13.4 小野薬品工業の技術要素別課題対応特許 (3/3)

技術要素 / /	(課題)課題 / /課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品/ 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系・炎症系に作用する薬剤開発(つづき)	ケモカインに関わる薬剤/CC ケモカインに関わる薬剤	特許 3558079 01.03.19 C07D471/10,102	トリアザスピロ[5.5]ウンデカン誘導体およびそれらを有効成分とする薬剤 トリアザスピロ[5.5]ウンデカン誘導体。ケモカイン/ケモカイン受容体の作用を制御し、各種炎症性疾患、喘息、アトピー性皮膚炎、蕁麻疹、アレルギー疾患、腎炎、腎症、肝炎、関節炎、慢性関節リウマチ等の予防/治療に有用。(図なし)
			W003/35074 01.10.23 A61K31/499	トリアザスピロ[5.5]ウンデカン誘導体とチトクロム P450 アイソザイム 3A4 阻害剤および/または P 糖タンパク質阻害剤との組み合わせからなる医薬
		ケモカインに関わる薬剤/その他のケモカインに関わる薬剤	特開 2002-348288 01.05.28 C07D471/10,102	スピロ複素環誘導体およびそれらを有効成分とする薬剤
			W001/40227 99.12.03 C07D471/10,102 [被引用 1 回]	トリアザスピロ[5.5]ウンデカン誘導体およびそれらを有効成分とする薬剤
		複数の作用機序に関わる薬剤	W099/56744 98.05.06 A61K31/351	グルコピラノース誘導体を有効成分とする免疫抑制剤
新規作用点に対する薬剤開発/作用機作非特定	その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤	W002/10135 00.08.01 C07D217/16 [被引用 3 回]	3.4-ジヒドロイソキノリン誘導体化合物及びその化合物を有効成分とする薬剤	

2.14 三菱ウェルファーマ

2.14.1 企業の概要

商号	三菱ウェルファーマ 株式会社
本社所在地	〒541-0046 大阪市中央区平野町 2 - 6 - 9
設立年	2001年（平成13年）
資本金	305億60百万円（2005年9月）
従業員数	3,652名（2005年9月末）（連結：5,995名）
事業内容	石油化学製品（基礎石化製品、化成品、合成繊維原料等）、機能化学品（無機化学品、有機中間体、電子関連製品等）、樹脂加工品の製造・販売、他

三菱ウェルファーマは、2001年10月ウェルファイドと三菱東京製薬の合併により誕生した企業である。2005年10月には三菱化学とともに、共同持株会社「三菱ケミカルホールディングス」を設立した。

同社は、創薬研究として、循環・代謝、精神・神経、呼吸器・免疫、癌・肝疾患の4領域を重点研究領域としている。

国内における研究開発品目としては、気管支喘息薬「MCC-847」が Phase III、アレルギー性鼻炎薬として Phase II である。

三菱ウェルファーマ名義の出願には、「三菱化学」名義の出願も併せて解析を行った。

主力製品には「ラジカット注」（脳保護薬）、「アンプラーグ」（抗血小板剤）「消化性潰瘍治療剤」（オメプラゾン錠）などがある。

（出典：<http://www.m-pharma.co.jp/>、第4期事業報告書）

2.14.2 製品例

現在、抗アレルギー剤関連製品はない。

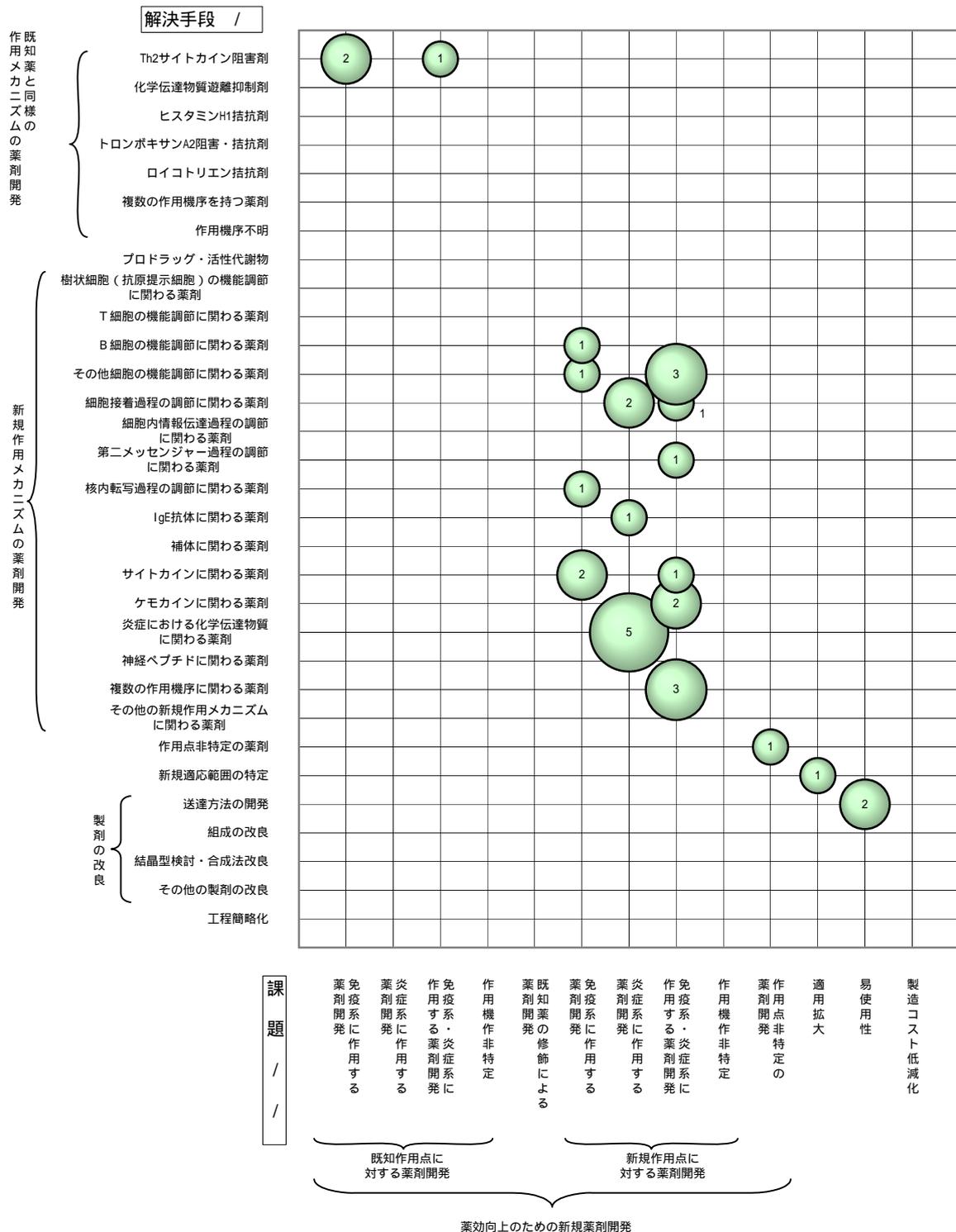
2.14.3 技術開発拠点と研究者

開発拠点：神奈川県横浜市青葉区鴨志田町 1000 三菱ウェルファーマ 総合研究所

図 2.14.3 に三菱ウェルファーマの抗アレルギー剤の出願件数と発明者数の年次推移を示す。出願件数は数件、継続的に出願されている。

(PLA2 阻害剤、トリプターゼ阻害剤) で対応している。「免疫系・炎症系に作用する薬剤開発」については、「ケモカインに関わる薬剤」2件などで対応している。その他「既知作用点に対する薬剤開発」については、「Th2 サイトカイン阻害剤」2件で対応している。

図 2.14.4-2 三菱ウェルファーマの抗アレルギー剤の課題と解決手段の分布



(1993年1月～2003年12月の出願)

表 2.14.4 に三菱ウェルファーマの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許を示す。出願件数は 31 件で、そのうち登録になっているものは 3 件である。

なお、表 2.14.4 では図 2.14.4-2 の解決手段 を細展開した解決手段 まで分析している。

表 2.14.4 三菱ウェルファーマの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許 (1/3)

技術要素 /	(課題)課題 /課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品 / 炭素環式	(易使用性)投与法の改善	送達方法の開発	W097/24112 95.12.28 A61K31/135,ABC	外用剤
	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	その他細胞の機能調節に関わる薬剤	特開平 10-330258 (みなし取下げ) 97.05.30 A61K31/275,ABY	好酸球活性化抑制剤
	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発		特開平 7-33735 (みなし取下げ) 93.07.26 C07C317/32	新規ジフェニルスルホン誘導体
			特開平 7-48251 (みなし取下げ) 93.08.04 A61K31/135,ABF	好酸球関連疾患予防治療剤
	作用点非特定の薬剤開発		(作用点非特定の薬剤)	W096/06068 94.08.22 C07C215/28 [被引用4回]
合成医薬品 / 複素環式	副作用低減化	送達方法の開発	特開 2000-63274 (みなし取下) 98.08.20 A61K31/44,ACD	喘息抑制用吸入剤
	既知作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	Th2 サイトカイン阻害剤	特開 2004-67510 (みなし取下げ) 97.12.26 C07D417/12,233	新規イミダゾール誘導体
			W000/78758 99.06.21 C07D417/12	新規イミダゾール誘導体
	既知作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発		W099/33827 (却下) 97.12.26 C07D417/12	新規イミダゾール誘導体
	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	サイトカインに関わる薬剤 / 抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤	特開 2002-338537 01.05.16 C07C255/60	アミド化合物およびその医薬用途
			特開平 10-45603 (みなし取下げ) 96.07.30 A61K31/70,AED	スルファチドを有効成分とする TNF- 産生抑制剤

表 2.14.4 三菱ウェルファーマの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許(2/3)

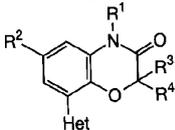
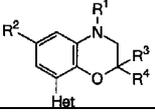
技術要素 /	(課題)課題 /課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 脂質メディエーターに関わる薬剤	特開平 6-312978 (みなし取下げ) 93.04.30 C07D209/48 日本たばこ産業 [被引用 2 回]	ホスホリパーゼ A2 阻害活性を有する新規フルイミド誘導体
		炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 起炎性プロテアーゼに関わる薬剤	W099/12918 97.09.05 C07D307/85 [被引用 3 回] W099/26925 97.11.26 C07D213/64	トリプターゼ阻害剤 複素環式アミド化合物からなるトリプターゼ阻害剤
		炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / その他の化学伝達物質に関わる薬剤	W098/53828 (みなし取下) 97.05.27 A61K31/551 千寿製薬	イスラパフアント含有水性液剤
	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	その他細胞の機能調節に関わる薬剤	特開平 7-101942 (みなし取下げ) 93.07.23 C07D249/14,507	新規トリアゾール誘導体
		細胞接着過程の調節に関わる薬剤	W094/22872 (みなし取下げ) 93.03.30 C07D495/14	細胞接着阻害剤およびチエノトリアゾロジアゼピン化合物
		第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / PDE4に関する薬剤	特開平 7-300455 (みなし取下げ) 94.03.08 C07D207/08	3-フェニルピロリジン誘導体
		サイトカインに関わる薬剤 / その他のサイトカインに関わる薬剤	特開 2004-107220 02.09.13 A61K31/506	TNF- α 産生抑制剤
		ケモカインに関わる薬剤 / その他のケモカインに関わる薬剤	特開 2003-81973 01.09.12 C07D417/12	新規ベンゾチアゾール化合物
			W002/88111 01.04.27 C07D401/12	新規ベンジルピペリジン化合物
		複数の作用機序に関わる薬剤	特許 3348505 94.03.01 C07D413/04	<p>ベンゾオキサジン-3-オン化合物 下記(1)で表されるベンゾオキサジン-3-オン化合物。 PLA2 阻害、IL-1 産生抑制およびカラゲニン足浮腫抑制作用を有し、アトピー性疾患などのアレルギー性疾患、気管支喘息、関節炎、膵炎などの各種炎症性疾患、虚血性血管障害、敗血症の治療 / 予防薬として有用</p>  <p>(1)</p>

表 2.14.4 三菱ウェルファーマの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許 (3/3)

技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数回]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発 (つづき)	複数の作用機序に関わる薬剤 (つづき)	特許 3362494 94.03.01 C07D413/04	ベンゾオキサジン化合物 下記【化1】で表されるベンゾオキサジン化合物またはその塩。PLA2 阻害、IL-1 産生抑制およびカラゲニン足浮腫抑制作用を有し、アトピー性疾患などのアレルギー性疾患、気管支喘息、関節炎、膵炎などの各種炎症性疾患、虚血性血管障害、敗血症の治療薬および予防薬として有用。  (I)
		複数の作用機序に関わる薬剤	特許 3329337 97.10.14 C07D213/74	ピペラジン化合物およびその医薬としての用途 ピペラジン化合物で、優れた TNF- α 産生抑制作用および / または IL-10 産生促進作用を有し、慢性・急性炎症性疾患、感染による炎症性疾患、自己免疫性疾患、アレルギー性疾患、その他の TNF- α 介在性疾患の予防または治療剤として有用である。(図なし)
	(適用拡大)	(新規適応範囲の特定)	特開平 10-101564 (みなし取下げ) 96.09.27 A61K31/505, ABF	鼻炎予防及び / 又は治療剤
非環式 合成医薬品 /	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 起炎性プロテアーゼに関わる薬剤	W001/23349 99.09.30 C07C311/51	アシルスルホンアミド誘導体
高分子医薬品 / 蛋白質医薬品 /	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	B 細胞の機能調節に関わる薬剤	特開 2004-201547 02.12.25 C12N15/09, ZNA	マスト細胞の細胞死誘発剤
		核内転写過程の調節に関わる薬剤	特開 2003-9883 01.07.05 C12N15/09, ZNA	マスト細胞の細胞死誘発剤
高分子医薬品 / ペプチド医薬品 /	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	IgE 抗体に関わる薬剤	特開平 7-118168 93.10.19 A61K39/395 智 靖 [被引用 2 回]	IgE 産生抑制剤
微生物由来 天然物医薬品 /		細胞接着過程の調節に関わる薬剤	特開平 9-143118 (みなし取下げ) 95.11.20 C07C49/713	ポリケチド類およびその製造方法並びにそれを有効成分とする ICAM-1 発現抑制剤
			特開平 9-143119 (みなし取下げ) 95.11.20 C07C59/13	セスキテルペン誘導体およびその製造方法並びにそれを有効成分とする ICAM-1 発現抑制剤

2.15 ジョンソン・エンド・ジョンソン（米国）

2.15.1 企業の概要

商号	Johnson & Johnson
本社所在地	One Johnson & Johnson Plaza, New Brunswick, NJ 08933
設立年	1887年
資本金	N/A
従業員数	115,600名
事業内容	医薬品の製造、販売。注力分野は、特に避妊薬、感染症薬である

ジョンソン・エンド・ジョンソンは米国に拠点を置き、製品はグローバルに展開している総合ヘルスケアメーカーである。ジョンソン・エンド・ジョンソン名義の出願には、合併前の「オーソマクニール PHARM」、「ジャンセン PHARM」名義の出願を併せて解析を行った。

主力製品には「MODICON Tablets」（避妊薬）、「ORTHO-CEPT Tablets」（避妊薬）、「ORTHO EVRA」（避妊薬）、「DITROPAN」（泌尿器科）、「TERAZOL 3 Vaginal Cream」（膣治療剤）、「FLOXIN」（抗菌剤）、「LEVAQUIN」（抗菌剤）、「NIZORAL」（抗真菌剤）、「SPORANOX」（抗真菌剤）などがある。

（出典：<http://www.jnj.com/product/categories/index.htm>）

2.15.2 製品例

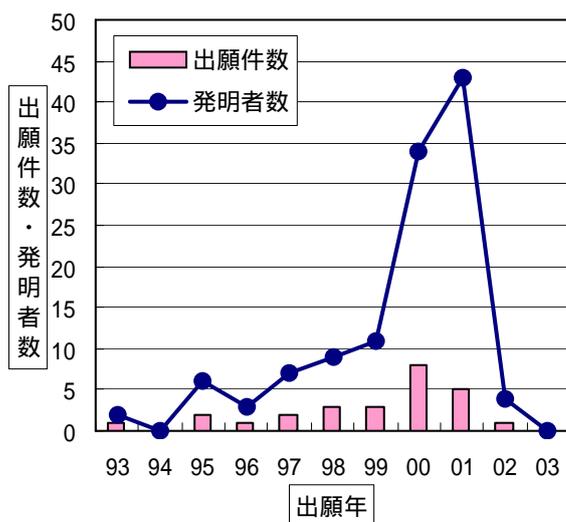
現在、抗アレルギー剤関連製品はない。

2.15.3 技術開発拠点と研究者

開発拠点：Raritan, N.J., USA

図 2.15.3 にジョンソン・エンド・ジョンソンの抗アレルギー剤の出願件数と発明者数の年次推移を示す。出願件数は数件、継続的に出願されている。

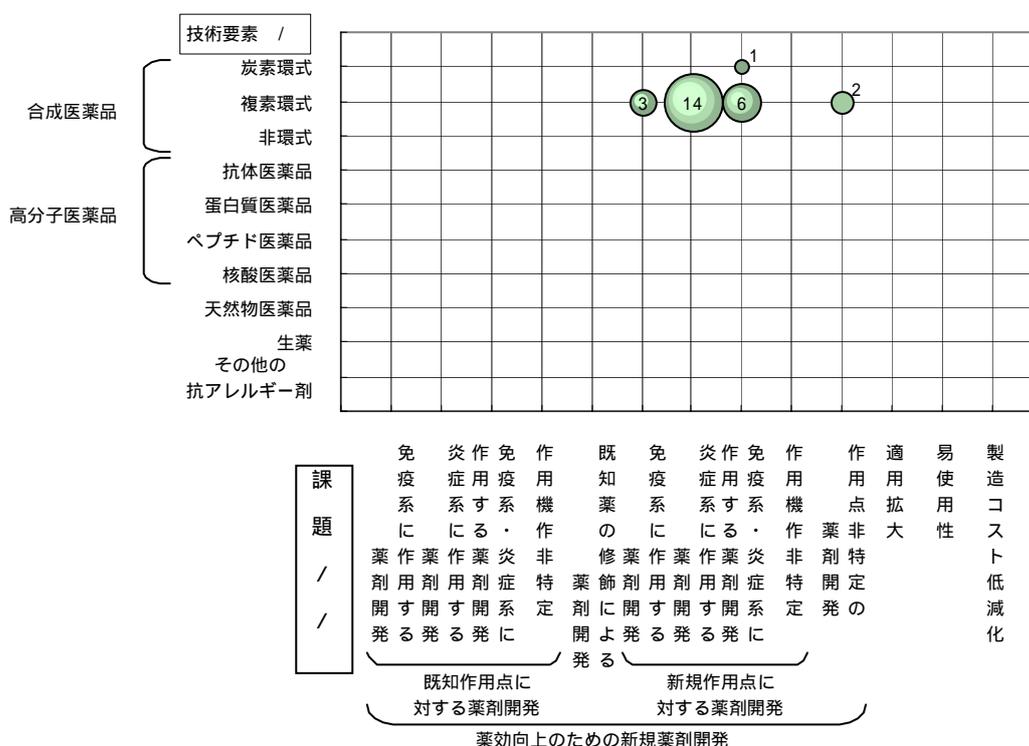
図 2.15.3 ジョンソン・エンド・ジョンソンの抗アレルギー剤に関する出願件数と発明者数



2.15.4 技術開発課題対応保有特許の概要

図 2.15.4-1 に抗アレルギー剤に対する技術要素と課題の分布を示す。ジョンソン・エンド・ジョンソンでは合成医薬品が主流であり、化合物としてはほとんど複素環式化合物である。

図 2.15.4-1 ジョンソン・エンド・ジョンソンの抗アレルギー剤に関する技術要素と課題

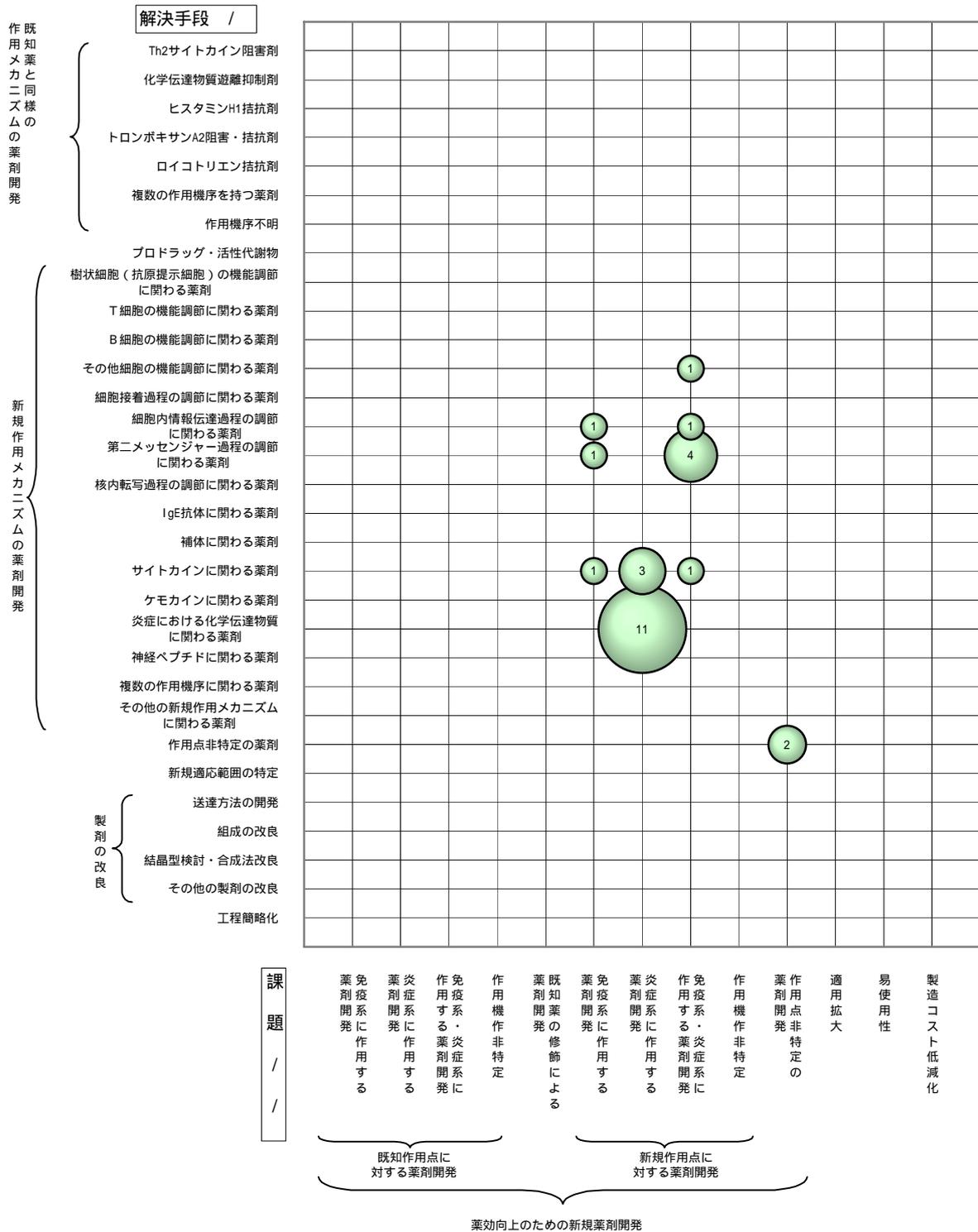


(1993年1月～2003年12月の出願)

図 2.15.4-2 に抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布を示す。「新規作用点に対する薬剤開発」については「炎症における化学伝達物質に関わる薬剤」(トリプターゼ

阻害剤、ブラジキニン拮抗剤、ヒスタミン H3 拮抗剤) が 11 件、「免疫系・炎症系に作用する薬剤開発」については「第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤」4 件 (IL-5 阻害剤、PDE4 阻害剤) が出願されている。

図 2.15.4-2 ジョンソン・エンド・ジョンソンの抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布



(1993年1月～2003年12月の出願)

表 2.15.4 にジョンソン・エンド・ジョンソンの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許を示す。出願件数は 26 件であり、そのうち登録になっている特許は 2 件である。

なお、表 2.15.4 では図 2.15.4-2 の解決手段 を細展開した解決手段 まで分析している。

表 2.15.4 ジョンソン・エンド・ジョンソンの技術要素別課題対応特許 (1/3)

技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
/ 合成医薬品 / 炭素環式	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤/PDE4に関する薬剤	特表平 11-504003 95.04.06 C07D233/32 [被引用 1 回]	PDEIV およびサイトカイン阻害活性を有する 1.3-ジヒドロ-2H-イミダゾール-2-オン誘導体
合成医薬品 / 複素環式	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系に作用する薬剤開発	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特表 2003-528104 00.03.23 C07D495/04,116	チエピノ[3.2-b]ジヒドロピリジンおよび関連組成物ならびに方法
		第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤/その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤	特表 2004-532228 01.04.18 C07D221/16	PDE 阻害作用をもつアリアルインデノピリジン
		サイトカインに関わる薬剤/その他のサイトカインに関わる薬剤	特表 2002-504555 98.02.26 C07D487/04,138	炎症性疾患を処置するための置換されたピロロペンゾイミダゾール
新規作用点に対する薬剤開発/炎症系に作用する薬剤開発	サイトカインに関わる薬剤/炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤	サイトカインに関わる薬剤/炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤	特表 2002-511882 97.07.10 C07D253/06 [被引用 1 回]	IL-5 を阻害する 6-アザウラシル誘導体
		サイトカインに関わる薬剤	特表 2002-508001 97.07.10 C07D253/06	IL-5 インヒビターとしての 6-アザウラシル誘導体
		サイトカインに関わる薬剤	特表 2003-506451 99.08.06 C07D413/10	インターロイキン-5 を抑制する 6-アザウラシル誘導体
	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤/起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤/起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤	特表 2002-535394 99.01.27 C07K5/062	トリプターゼインヒビターとして有用なペプチジル複素環式ケトン
		炎症における化学伝達物質に関わる薬剤/起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤	特表 2004-523469 00.09.06 A61K45/00	アレルギーの治療方法
		炎症における化学伝達物質に関わる薬剤/起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤	特表 2004-531456 00.09.06 A61K31/4545	置換ピラゾールを用いてアレルギーを治療する方法
		炎症における化学伝達物質に関わる薬剤/起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤	特表 2004-508329 00.09.06 A61K31/496 [被引用 1 回]	置換ピラゾールを使用するアレルギーの処置法
炎症における化学伝達物質に関わる薬剤/起炎症性プロテアーゼに関わる薬剤	特表 2004-508330 00.09.06 A61K31/4545	置換ピラゾールを用いてアレルギーを治療する方法		

表 2.15.4 ジョンソン・エンド・ジョンソンの技術要素別課題対応特許 (2/3)

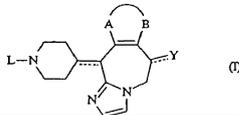
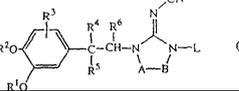
技術要素 / /	(課題)課題 / /課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要	
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発(つづき)	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / その他の化学伝達物質に関わる薬剤	特表 2004-511438 00.08.08 C07D295/08	イミダゾールを含有しないアリアルオキシピペリジン	
			特表 2004-510712 00.09.22 C07D471/04,104	オクタヒドロインドリジンおよびキノリジンおよびヘキサヒドロピロリジン	
			特表 2004-520434 01.03.09 C07D209/42	複素環化合物	
			特表 2004-524363 01.03.29 C07D233/84	ヒスタミン H3 受容体のリガンドとして用いるに有用なイミダゾール誘導体	
			特表 2005-509680 01.11.23 C07D471/04,105	頭蓋内圧亢進の急性減少のための抗ヒスタミン剤の使用	
			特表 2005-525398 02.02.20 C07D401/12	ブラジキニン受容体モジュレーターとして有用な新規なヘテロアリアルアルキルアミド誘導体	
新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	その他細胞の機能調節に関わる薬剤	特許 3681388 93.07.13 C07D487/04,150	抗アレルギー性イミダゾアゼピン 下記(1)の新規のイミダゾアゼピン、その塩および立体化学的異性体形態、本化合物を含む組成物、同化合物の調製方法、およびアレルギー性疾患を治療するためのこれらの化合物の使用に関する。	
					
			細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特表 2003-513977 99.11.10 C07D487/04,144	置換 2-アリアル-3-(ヘテロアリアル)-イミダゾ[1,2-]ピリジン類および関連薬剤組成物および方法
			第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / PDE4 に関する薬剤	特表平 11-503136 95.04.06 C07D233/32 [被引用 1 回]	PDEIV 及びサイトカイン活性を有する 1,3-ジヒドロ-1-(フェニルアルキル)-2H-イミダゾール-2-オン誘導体
				特許 3068208 96.10.02 C07D233/44 [被引用 6 回]	PDEIV 阻害性の 2-シアノイミノイミダゾール誘導体 PDEIV およびサイトカイン阻害活性を有する下記(1)に示される 2-シアノイミノイミダゾール誘導体、その N-オキド形態、製薬学的に許容可能な付加塩および立体化学的異性体形態、及びそれら製薬学的組成物の製造方法。
					
サイトカインに関わる薬剤 / その他のサイトカインに関わる薬剤	特表 2002-509927 98.04.01 C07D401/06 [被引用 1 回]	PDEIV 阻害ピリジン誘導体			
		特表 2005-504767 01.08.13 C07D417/04	2.4.5-三置換チアゾリル誘導体およびそれらの抗炎症活性		

表 2.15.4 ジョンソン・エンド・ジョンソンの技術要素別課題対応特許 (3/3)

技術要素 / /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品 / 複素環式	作用点非特定の薬 剤開発	(作用点非特定の 薬剤)	特表 2002-533344 98.12.19 C07D471/20	抗ヒスタミン性スピロ化合物
			特表 2003-535096 00.05.30 C07D405/12	ジヒドロピリジンソフトドラッグならびに関連する組成物及び方法

2.16 バイエル（ドイツ）

2.16.1 企業の概要

商号	Bayer AG
本社所在地	Building W1, Leverkusen 51368, Germany
設立年	1863年
資本金	N/A
従業員数	113,000名（連結：2004年12年末）
事業内容	医薬品、動物薬、農薬、高分子材料、化学品等の製造・販売

バイエルはドイツを拠点とする世界屈指の化学品・医薬品メーカーである。抗アレルギー剤自体の製品は保有していないが、アレルギー性鼻炎治療薬であるバイナスを販売している。

バイエル名義の出願には、合併前の「バイエル PHARM」、「バイエルヘルスケア」、「バイエル薬品」名義の出願を併せて解析を行った。

主力製品には、「アダラート」（高血圧・狭心症治療薬）、「バイミカード」（高血圧・狭心症治療薬）、「シプロキサニ錠、シプロキサニ注」（広範囲抗菌剤）、「バイナス錠」（アレルギー性鼻炎治療薬）、「グルコバイ」（糖尿病用薬）、「マイコスポール」（抗真菌剤）、「エンベシド」（抗真菌剤）、「バイアスピリン」（抗血小板剤）、「コージネイト FS」（遺伝子組換え型血液凝固第 VIII 因子製剤）、「レビトラ錠」（勃起不全治療剤）、「アルプミン・カッター」（血漿分画製剤）、「プラスマネート・カッター」（血漿分画製剤）、「ポリグロビン N」（血漿分画製剤）などがある。

（出典：<http://www.bayer.co.jp/bgj/group.html>）

（出典：<http://www.bayer.co.jp/byl/aboutus/index.html>）

2.16.2 製品例

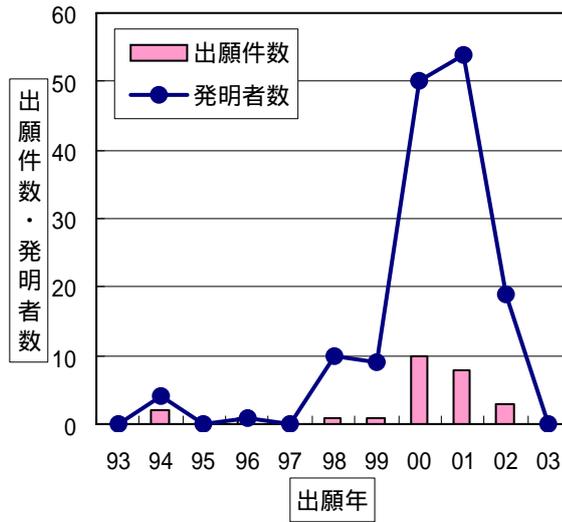
現在、抗アレルギー剤関連製品はない。

2.16.3 技術開発拠点と研究者

開発拠点：ドイツ

図 2.16.3 にバイエルの抗アレルギー剤の出願件数と発明者数の年次推移を示す。出願件数は数件、2000年に急増が見られる。

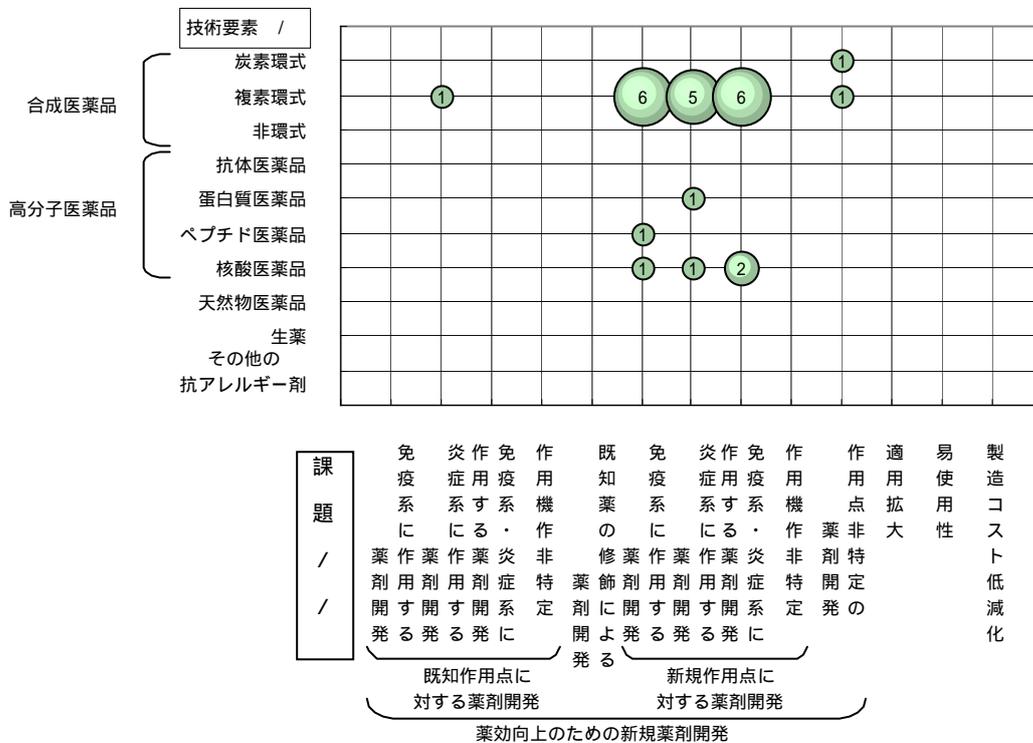
図 2.16.3 バイエルの抗アレルギー剤に関する出願件数と発明者数



2.16.4 技術開発課題対応保有特許の概要

図 2.16.4-1 に抗アレルギー剤に対する技術要素と課題の分布を示す。バイエルでは合成医薬品が主流であり、化合物としては複素環式化合物が主であるが、蛋白質医薬、ペプチド医薬、核酸医薬も出願されている。

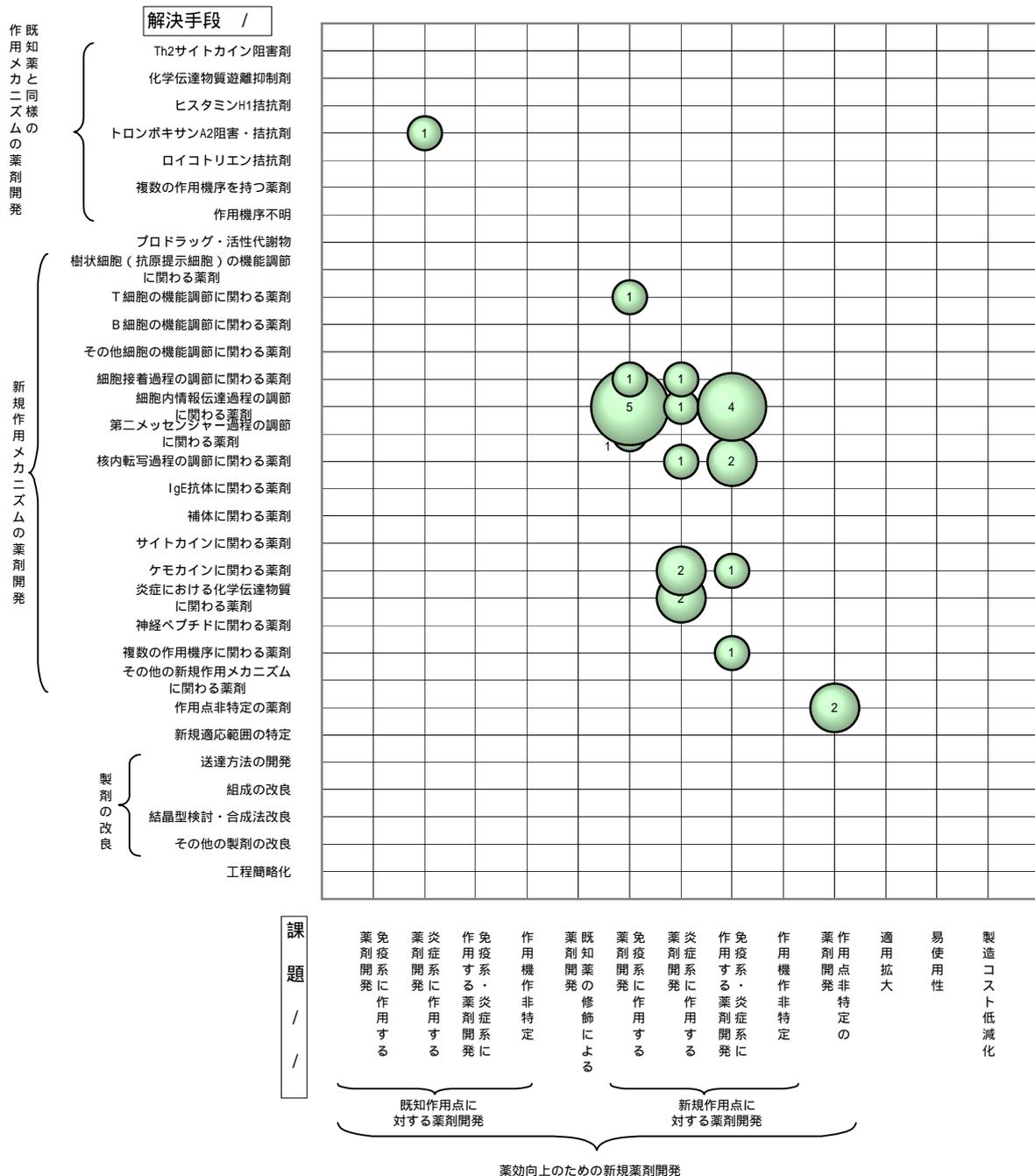
図 2.16.4-1 バイエルの抗アレルギー剤に関する技術要素と課題



(1993年1月～2003年12月の出願)

図 2.16.4-2 に抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布を示す。「新規作用点に対する薬剤開発」については、「細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤」が 10 件（p38 阻害剤、ヒト CYSLT2 様 GPCR 蛋白の調節剤、IV 型ヒトアデニル酸シクラーゼ調節剤、ヒト二重特異性タンパク質ホスファターゼ 7 様タンパク質の調節剤）、「ケモカインに関わる薬剤」が 3 件出願されている。

図 2.16.4-2 バイエルの抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布



(1993年1月～2003年12月の出願)

表 2.16.4 にバイエルの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許を示す。出願件数は 26 件であり、そのうち登録になっている特許は 1 件である。

なお、表 2.16.4 では図 2.16.4-2 の解決手段 を細展開した解決手段 まで分析している。

表 2.16.4 バイエルの技術要素別課題対応特許 (1/3)

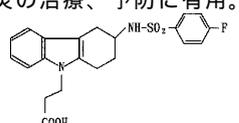
技術要素 / 炭素環式 / 合成医薬品 / 複素環式	(課題)課題 / 課題	(解決手段) / 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) / 出願日 / 主IPC / 共同出願人 / [被引用回数]	発明の名称 / 概要
炭素環式 / 合成医薬品 /	作用点非特定の薬剤開発	(作用点非特定の薬剤)	特表 2004-520328 00.12.29 A61K31/785	活性物質としてポリアミンを含む医薬
合成医薬品 / 複素環式	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤	特許 2901226 94.12.26 A61K31/40, ABF	アレルギー性皮膚炎の処置剤 下記【1】の 3 - (4 - フルオロフェニルスルホンアミド) - 1234 - テトラヒドロ - 9 - カルバゾールプロピオン酸又はその塩。アトピー性皮膚炎、湿疹、蕁麻疹、皮膚そう痒症等の、アレルギー性皮膚炎の治療、予防に有用。  (1)
		新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	細胞接着過程の調節に関わる薬剤	特表 2003-519126 99.12.24 C07D211/60
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特開 2003-137886 01.10.31 C07D487/04, 140	ピリミド[4.5-b]インドール
			特開 2003-277383 02.03.14 C07D498/04	光学活性ピリジン誘導体およびそれを含む医薬
			特表 2004-537511 01.04.20 A61K31/4409	p38 阻害剤としての窒素ヘテロ原子含有ヘテロアリアル尿素
	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	細胞接着過程の調節に関わる薬剤	特表 2005-515173 01.10.31 C07D487/04, 140	ピリミド[4.5-b]インドール誘導体
			第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / その他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤	特表 2005-503345 01.04.30 C07D495/04, 105
新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	細胞接着過程の調節に関わる薬剤	特表 2004-511460 00.10.09 C07C275/40	インテグリン受容体アンタゴニストとしての ーアミノ酸誘導体	
		核内転写過程の調節に関わる薬剤	特開 2002-193938 (みなし取下げ) 00.12.01 C07D213/73	4-アリアルピリジン誘導体

表 2.16.4 バイエルの技術要素別課題対応特許 (2/3)

技術要素 /	(課題)課題 /課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発(つづき)	ケモカインに関わる薬剤 / CC ケモカインに関わる薬剤	特開 2003-81937 01.09.07 C07C311/29	ベンゼンスルホンアミド誘導体
			特表 2005-519024 01.09.07 C07D207/14	スルホンアミド誘導体
		炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 起炎性プロテアーゼに関わる薬剤	特表 2002-534404 98.12.30 A61K31/192	呼吸器疾患の治療のためのマトリックスメタロプロテアーゼ阻害剤としての置換 4-ピアリール酪酸および 5-ピアリールペンタン酸誘導体の使用
	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特開 2001-302667 00.04.28 C07D487/04,144	イミダゾピリミジン誘導体およびトリアゾロピリミジン誘導体
			特表 2003-535067 00.04.28 C07D487/04,144 [被引用 2 回]	イミダゾピリミジン誘導体およびトリアゾロピリミジン誘導体
		核内転写過程の調節に関わる薬剤	特開 2002-114777 00.09.22 C07D401/04 特表 2004-514712 00.12.01 C07D213/73 [被引用 1 回]	ピリジン誘導体 抗炎症剤としての 4,6-ジフェニルピリジン誘導体
作用点非特定の薬剤開発	(作用点非特定の薬剤)	特表 2005-526074 02.02.20 C07D498/04	光学的に活性なピリジン誘導体およびそれを含有する薬剤	
特開 2002-241282 (みなし取下げ) 96.05.21 A61K31/40, ABE	アレルギー性皮膚炎の処置剤			
高分子医薬品 / 蛋白質医薬品	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 起炎性プロテアーゼに関わる薬剤	特表平 10-505833 94.09.12 A61K38/55, ACD [被引用 1 回]	トリプターゼ阻害剤としての分泌性白血球プロテアーゼインヒビター
高分子医薬品 / ペプチド医薬品	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	T細胞の機能調節に関わる薬剤	特表 2004-527228 01.01.04 C12N15/09, ZNA	ヒト B7-H2 タンパク質の調節

表 2.16.4 バイエルの技術要素別課題対応特許 (3/3)

技術要素 / /	(課題)課題 / /課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
高分子医薬品/ 核酸医薬品	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系に作用する薬剤開発(つづき)	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特表 2004-529639 01.03.23 C12N15/09,ZNA	ヒト二重特異性タンパク質ホスファターゼ 7 様タンパク質の調節
	新規作用点に対する薬剤開発/炎症系に作用する薬剤開発		特表 2003-530121 00.04.07 C12N15/09,ZNA	ヒト CYSLT2 様 GPCR 蛋白の調節
	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系・炎症系に作用する薬剤開発		特表 2004-511245 (みなし取下げ) 00.10.18 C12N15/09,ZNA	IV 型ヒトアデニル酸シクラーゼの調節
			ケモカインに関わる薬剤/その他のケモカインに関わる薬剤	特表 2004-522429 00.12.14 C12N15/09,ZNA

2.17 メルク（ドイツ）

2.17.1 企業の概要

商号	Merck KGaA
本社所在地	Frankfurter Str. 250, 64293 Darmstadt, Germany
設立年	1827年
資本金	N/A
従業員数	28,900名
事業内容	医薬品（医療用医薬品、大衆薬）、化学品の製造、販売

ドイツとスイスに拠点を置く化学企業グループ。売り上げのうち医薬品部門が過半を占め、次いで研究用試薬・機器部門、特殊化学品部門と続く。

医薬品開発では、癌、循環器系領域を中心に複数の製薬企業と提携して進めている。抗アレルギー剤についてはジェネリック薬の開発・販売をしている。

主力製品には、医療用医薬品として「Cetuximab（大腸癌）、Matuzumab」（制癌剤）、「Concor」（心臓循環系用薬）、「Glucophage」（糖尿病薬）、「Niaspen」（高脂血症薬）があるほか一般用医薬品等には「Nasivin, Sedalmerck」（感冒薬）、「Femibion, Cebion, Bion」（ビタミン剤、ミネラル、サプリメント）などがある。

（出典：http://www.merck.de/servlet/PB/menu/1014700_ePRJ-MERCK-EN_pcontent_12/content.html）

2.17.2 製品例

抗アレルギー剤関連製品

医療用医薬品

- 「EpiPen, DuoNeb」（呼吸器疾患およびアレルギー用のジェネリック薬）

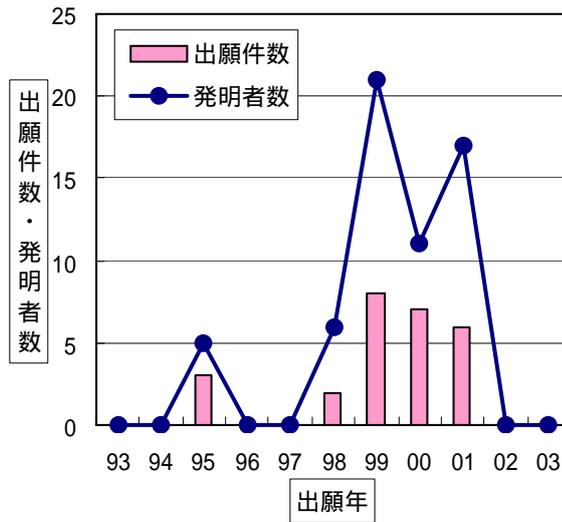
（出典：http://www.merck.de/servlet/PB/menu/1014700_ePRJ-MERCK-EN_pcontent_12/content.html）

2.17.3 技術開発拠点と研究者

開発拠点：Darmstadt, Germany

図 2.17.3 にメルクの抗アレルギー剤の出願件数と発明者数の年次推移を示す。出願件数は 99 年以降増加している。

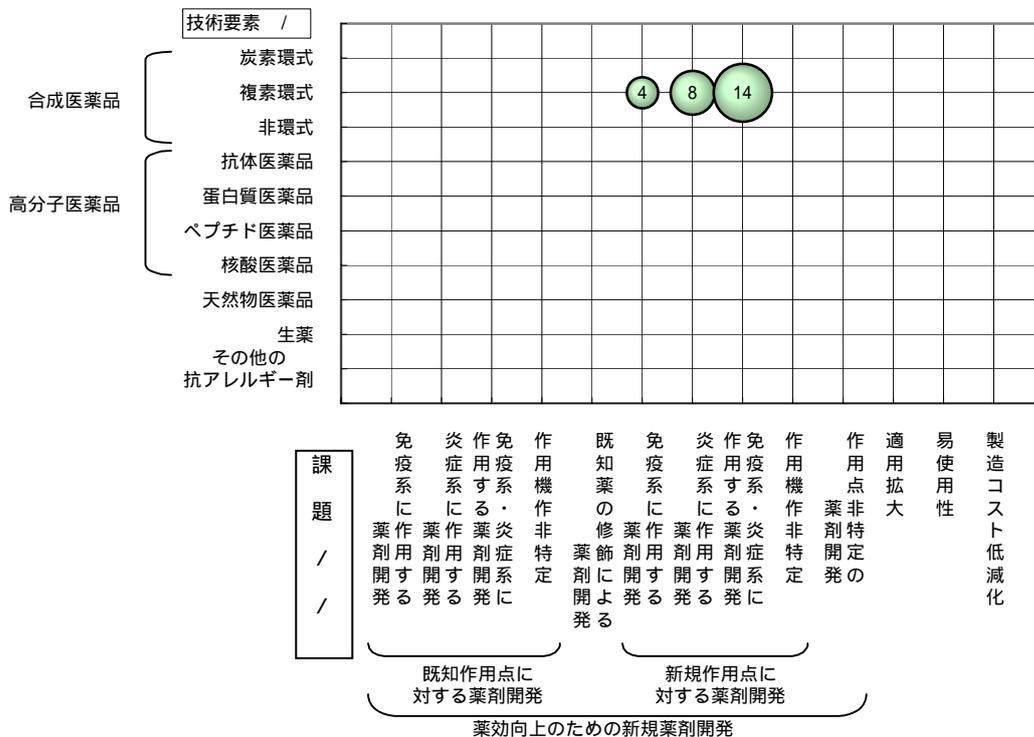
図 2.17.3 メルクの抗アレルギー剤に関する出願件数と発明者数



2.17.4 技術開発課題対応保有特許の概要

図 2.17.4-1 に抗アレルギー剤に対する技術要素と課題の分布を示す。メルクでは合成医薬品が主流であり、化合物は複素環式化合物である。

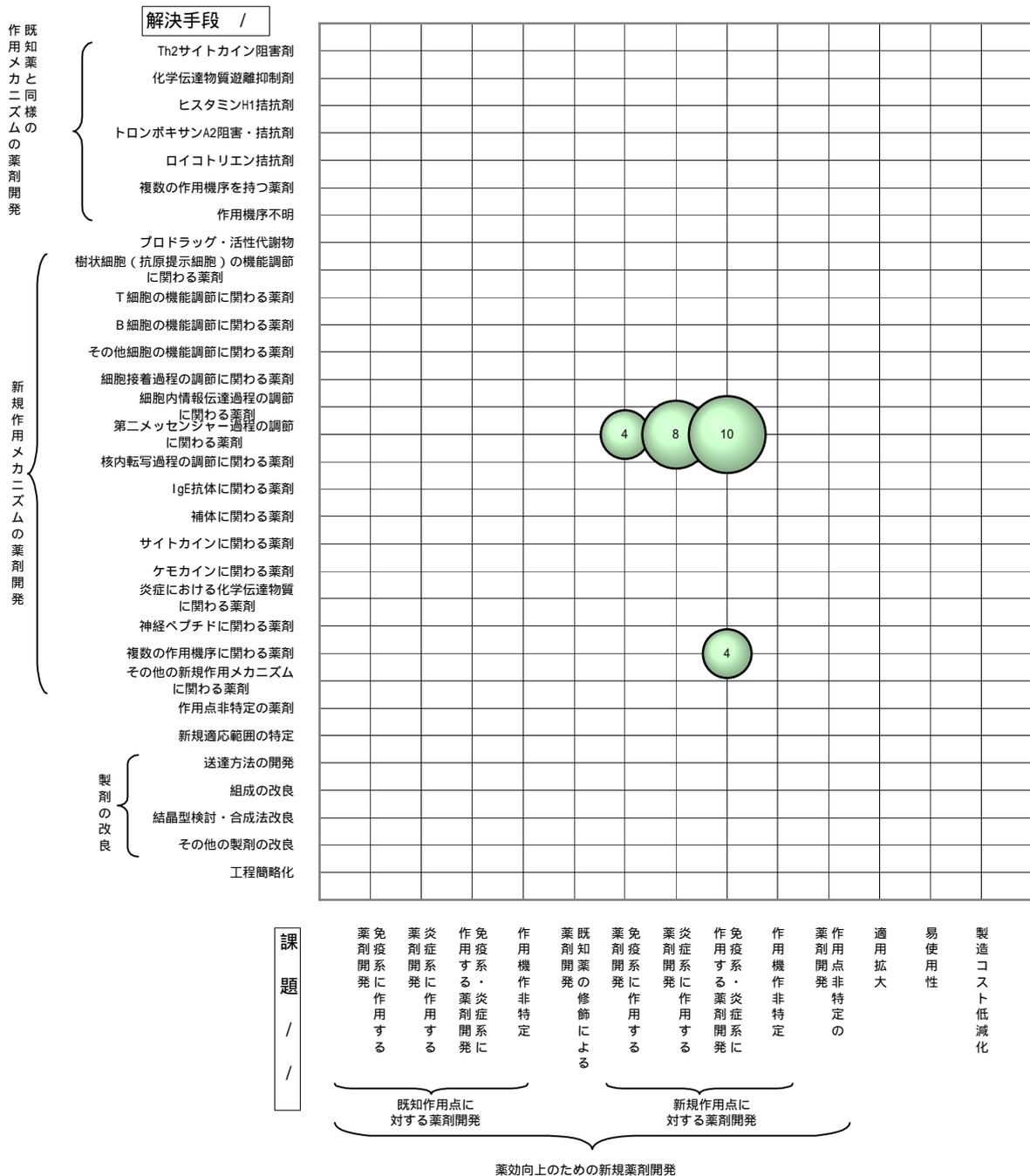
図 2.17.4-1 メルクの抗アレルギー剤に関する技術要素と課題



(1993年1月～2003年12月の出願)

図 2.17.4-2 に抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布を示す。「新規作用点に対する薬剤開発」については特に「第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤」（PDE4 阻害剤、PDE7 阻害剤）が解決手段として 22 件出願されている。

図 2.17.4-2 メルクの抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布



(1993年1月～2003年12月の出願)

表 2.17.4 にメルクの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許を示す。出願件数は 26 件である。

なお、表 2.17.4 では図 2.17.4-2 の解決手段 を細展開した解決手段 まで分析している。

表 2.17.4 メルクの技術要素別課題対応特許 (1/2)

技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品 / 複素環式	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / PDE4 に関する薬剤	特表 2004-535468 01.07.18 C07D253/06	心臓疾患及びアレルギーの治療のための PDEIV 阻害作用及び TNF 拮抗作用を有する 4-(ベンジリデンアミノ)-3-(メチルスルファニル)-4H-1,2,4-トリア
		第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / その他メッセンジャー調節因子に関わる薬剤	特表 2003-512381 99.10.21 C07D491/052	ホスホジエステラーゼ VII 阻害剤としてのイミダゾール誘導体
			特表 2003-513042 99.11.04 C07D261/18	ホスホジエステラーゼ VII 阻害剤としてのイソオキサゾール誘導体
			特表 2003-513070 99.11.04 C07D207/34 [被引用 1 回]	ホスホジエステラーゼ VII 阻害剤としてのピロール誘導体
	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発		特表 2003-514821 99.11.13 C07D513/06	ホスホジエステラーゼ VII 阻害剤として用いられるイミダゾール化合物
			特表 2004-513966 (みなし取下げ) 00.11.25 A61K31/519	チエノピリミジン類の使用
			特表 2004-516268 (みなし取下げ) 00.12.19 A61K45/06	チエノピリミジンおよび抗血栓剤、カルシウム拮抗剤、プロスタグランジンまたはプロスタグランジン誘導体を含有する医薬製剤
			特表 2004-516269 (みなし取下げ) 00.12.19 A61K45/06	チエノピリミジンおよび抗血栓剤、カルシウム拮抗剤、プロスタグランジンまたはプロスタグランジン誘導体を含有する医薬製剤
			特表 2004-516270 (みなし取下げ) 00.12.19 A61K45/06	ピラゾロ [4.3-d] ピリミジンおよび抗血栓剤、カルシウム拮抗剤、プロスタグランジンまたはプロスタグランジン誘導体を含む医薬製剤
			特表 2004-516329 00.12.23 C07D495/04, 105	スルファミドチエノピリミジン
			特表 2004-517940 (みなし取下げ) 01.01.31 A61K31/519	ピラゾロ [4.3-d] ピリミジンおよびニトレートまたはチエノピリミジンおよびニトレートを含む医薬製剤
		特表 2004-525890 (みなし取下げ) 01.02.02 A61K31/519	ピラゾロ [4.3-d] ピリミジンおよびエンドセリンレセプターアンタゴニストまたはチエノピリミジンおよびエンドセリンレセプターアンタゴニストを含む医薬製剤	
	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / PDE4 に関する薬剤	特開平 9-124611 95.09.14 C07D237/04	アリールアルキルジアジノン化合物

表 2.17.4 メルクの技術要素別課題対応特許 (2/2)

技術要素 / /	(課題)課題 / /課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品/ 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系・炎症系に作用する薬剤開発(つづき)	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤/PDE	特表 2002-528536 98.11.04 C07D237/04	ベンゾイルピリダジン
		4 に関する薬剤(つづき)	特表 2003-504358 99.07.10 C07D237/04	ベンゾイルピリダジン
			特表 2004-519450 00.12.23 C07D237/04	ベンゾイルピリダジン
			特表 2005-515975 (みなし取下) 01.10.31 C07D237/04	4 型ホスホジエステラーゼ阻害剤およびこれらの使用
			特表 2005-511595 01.11.05 C07D237/04, CSP	ヒドラゾノーマロニトリル類
		第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤/その	特表 2003-509370 99.09.14 A61K31/519	チエノピリミジン類の使用
		他のメッセンジャー調節因子に関わる薬剤	特表 2003-509511 99.09.17 C07D495/04, 105	アミン誘導体
			特表 2003-513973 99.11.06 C07D471/04, 105 [被引用 1 回]	ホスホジエステラーゼ VII 阻害剤としてのイミダゾピリジン誘導体
			特表 2004-513963 (みなし取下げ) 00.11.25 A61K31/519	ピラゾロ〔4.3-d〕ピリミジンの使用
		複数の作用機序に関わる薬剤	特開平 8-231522 95.01.28 C07D285/16	アリアルアルキルチアジアジノン誘導体
			特開平 8-291145 95.04.20 C07D237/04	アリアルアルキルピリダジノン化合物
			特表 2002-518377 98.06.16 C07D237/04 [被引用 1 回]	アリアルアルカノイルピリダジン
			特表 2005-520801 01.12.24 C07D235/14	ピロロピリミジン類

2.18 大日本住友製薬

2.18.1 企業の概要

商号	大日本住友製薬 株式会社
本社所在地	〒541-0045 大阪市中央区道修町 2 - 6 - 8
設立年	1897年
資本金	224億円
従業員数	5,158名(単体)
事業内容	医薬品、臨床検査薬、医薬機器、動物用医薬品、食品添加物、工業薬品、その他化学製品の製造、売買及び輸出入

大日本住友製薬は、2005年10月大日本製薬および住友製薬の合併により誕生した企業である。

同社の主力製品は、高血圧症・狭心症治療薬、消化管運動機能改善剤、末梢循環改善剤、カルバペネム系抗生物質製剤である。これら主力4製品をはじめ、CNS(中枢神経)領域、糖尿病領域、骨・炎症・アレルギー領域、がん・感染症領域など製品ラインナップを有する。具体的には、「アムロジン」(高血圧症・狭心症治療薬)、「メロペン」(カルバペネム系抗生物質製剤)、「ガスモチン」(消化管運動機能改善剤)、「クラリシッド」(マクロライド系抗生物質製剤)などがある。

重点研究領域では、特に糖尿病領域、CNS(中枢神経系)領域へ研究資源を重点的に投入し、新薬開発を行っている。

抗アレルギー剤として「エバステル(鼻炎・皮膚炎)」を販売している。

(出典：<http://www.ds-pharma.co.jp/>)

2.18.2 製品例

抗アレルギー剤関連製品

医療用医薬品

- 「エバステル(鼻炎・皮膚炎)」(抗アレルギー剤)
- 「ジルテック」(アレルギー性疾患治療剤)

(出典：<http://www.ds-pharma.co.jp/>)

2.18.3 技術開発拠点と研究者

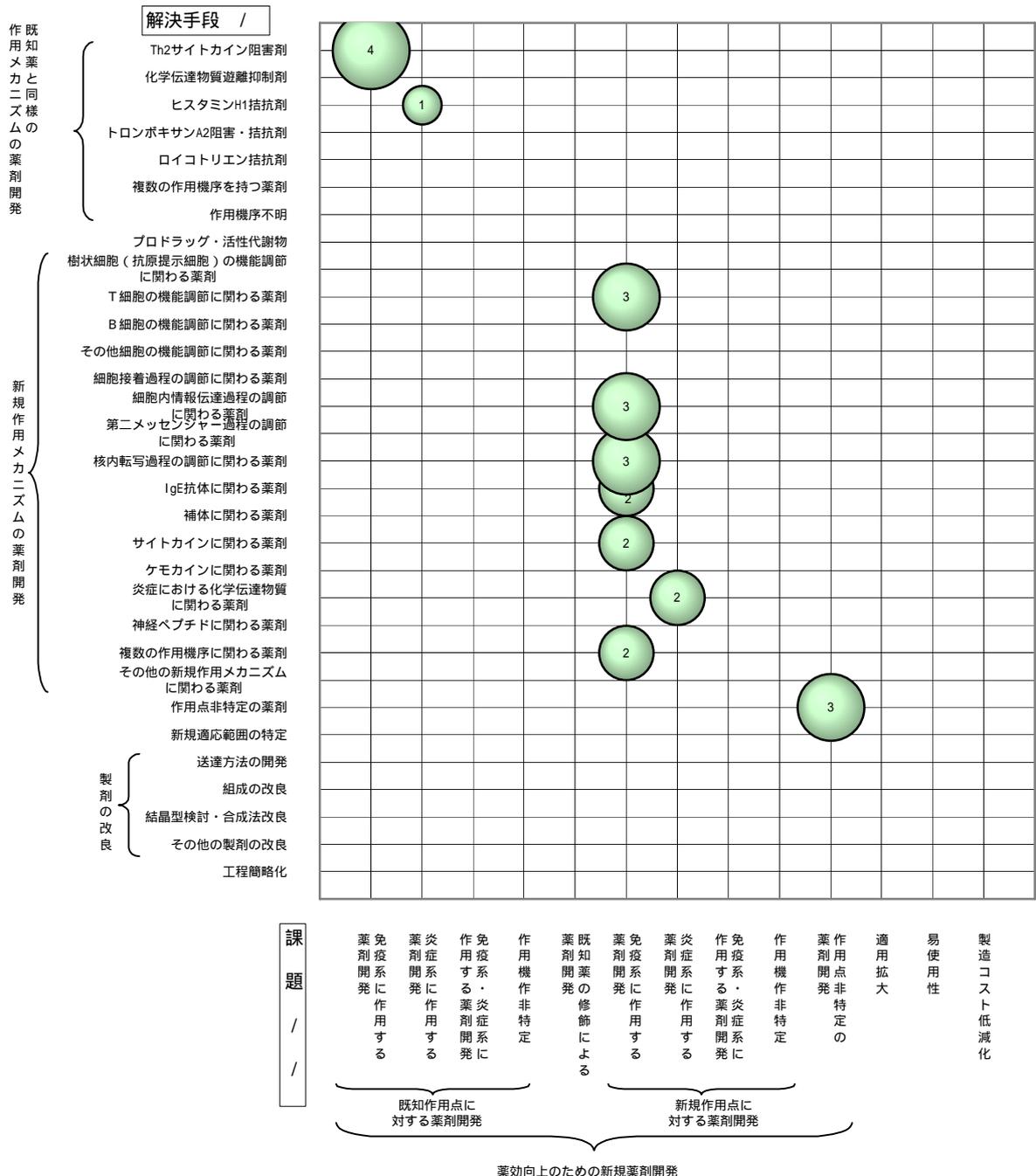
開発拠点：大阪府吹田市江の木町 33-94 大日本住友製薬 総合研究所

大阪府大阪市中央区道修町 2 - 6 - 8 大日本住友製薬 大阪研究所

図 2.18.3 に大日本住友製薬の抗アレルギー剤の出願件数と発明者数の年次推移を示す。出願件数は数件、継続的に出願されている。

図 2.18.4-2 に抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布を示す。「新規作用点に対する薬剤開発」では「免疫系に作用する薬剤開発」が多く、「T細胞の機能調節に関わる薬剤」3件、「細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤」3件、「核内転写過程の調節に関わる薬剤」3件などが対応している。「既知作用点に対する薬剤開発」の内の「免疫系に作用する薬剤開発」に関しては、「Th2 サイトカイン阻害剤」4件が対応している。

図 2.18.4-2 大日本住友製薬の抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布



(1993年1月～2003年12月の出願)

表 2.18.4 に大日本住友製薬の抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許を示す。
出願件数は 25 件である。

なお、表 2.18.4 では図 2.18.4-2 の解決手段 を細展開した解決手段 まで分析している。

表 2.18.4 大日本住友製薬の技術要素別課題対応特許 (1/2)

技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品 / 複素環式	既知作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	Th2 サイトカイン阻害剤	特開平 10-218776 97.02.13 A61K31/70, ABA	タイプ 2 ヘルパー T 細胞型サイトカイン産生選択的抑制剤
			特開平 10-298181 (みなし取下げ) 97.04.25 C07D471/04, 105 ジャパンエナジー電子材料 [被引用 1 回]	タイプ 2 ヘルパー T 細胞選択的免疫応答抑制剤
			特開平 10-330369 (みなし取下げ) 97.04.04 C07D263/58 [被引用 1 回]	複素環化合物
			特開平 11-335360 98.05.21 C07D239/95	キナゾリン誘導体
新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	T 細胞の機能調節に関わる薬剤	W099/32122 97.12.22 A61K31/52	タイプ 2 ヘルパー T 細胞選択的免疫応答抑制剤	
		特開 2004-137157 02.10.16 A61K31/52	新規アデニン誘導体を有効成分として含有する医薬	
		W002/85905 01.04.17 C07D473/16	新規アデニン誘導体	
	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特開 2003-12516 01.04.25 A61K31/437	新規な CaMKK 阻害剤	
	核内転写過程の調節に関わる薬剤	特開平 10-175965 (みなし取下げ) 96.12.17 C07D261/20	テトラヒドロベンズイソキサゾール誘導体	
		特開平 10-175964 (みなし取下げ) 96.12.18 C07D261/14	アミノイソキサゾール誘導体	
		特開平 11-116481 (みなし取下げ) 97.10.06 A61K31/435, AED	スタット 6 活性化阻害剤	
	IgE 抗体に関わる薬剤	特開 2000-281660 99.03.29 C07D239/95	キナゾリン誘導体	
		特開 2004-250329 02.12.26 C07D209/38	イサチン誘導体	

表 2.18.4 大日本住友製薬の技術要素別課題対応特許 (2/2)

技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発 (つづき)	サイトカインに関わる薬剤 / 抗原特異的免疫応答に関わるサイトカインに関わる薬剤	特開 2000-53653 98.08.10 C07D239/95	キナゾリン誘導体
		サイトカインに関わる薬剤 / 炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤	特開平 11-180982 97.12.24 C07D473/34,321	新規アデニン誘導体及びその医薬用途
		複数の作用機序に関わる薬剤	特開 2000-53654 98.08.10 C07D239/95	新規なキナゾリン誘導体
新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 起炎性プロテアーゼに関わる薬剤	特開 2003-231645 (みなし取下げ) 02.02.06 A61K38/43	ピロリジン誘導体からなる医薬
			特表 2004-507539 00.08.30 C07K5/062	ピロリジン誘導体及びそのキマーゼ阻害剤としての使用
作用点非特定の薬剤開発	作用点非特定の薬剤開発	(作用点非特定の薬剤)	特開 2003-104975 01.09.28 C07D277/68	新規なベンゾチアゾール化合物
			特開 2003-192591 01.12.27 A61K31/426	5員環化合物からなる医薬
			特開 2005-89334 03.09.12 C07F9/6561	8-ヒドロキシアデニン化合物
天然物医薬品 / 微生物由来	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特開 2004-67583 (みなし取下) 02.08.06 C07K5/083,ZNA	新規ペプチド誘導体
			特開 2004-67584 (みなし取下) 02.08.06 C07D213/80	新規ピリドン誘導体
生薬	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	ヒスタミン H1 拮抗剤	特開平 10-245395 (取下) 97.03.03 C07J63/00	皮膚子由来抗掻痒剤

2.19 日研化学

2.19.1 企業の概要

商号	日研化学 株式会社
本社所在地	〒104-0045 東京都中央区築地一丁目12番6号
設立年	1947年
資本金	67億7千5百万円
従業員数	955名
事業内容	医薬品の製造、販売

日研化学は興和を親会社とする興和グループに所属しており、新剤型・新効能医薬品の開発を目指す。中枢神経系薬剤、アレルギー・免疫領域を含む呼吸器系薬剤、その他（腎臓領域、肝臓領域他）に研究テーマの選択と集中を行っている。

主力製品には「イソバイド」（経口浸透圧利尿・メニエール病改善剤）、「セレニカR」（抗てんかん剤・躁状態治療剤）、「ヴィーン」（輸液剤）などがある。

（出典：第62期有価証券報告書、<http://www.nikken-chemicals.co.jp/ir/pdf/nikkenchemicals62ys.pdf>）

2.19.2 製品例

抗アレルギー剤関連製品

医療用医薬品

- 「テオドール」（喘息治療剤）

（出典：第62期有価証券報告書、<http://www.nikken-chemicals.co.jp/ir/pdf/nikkenchemicals62ys.pdf>）

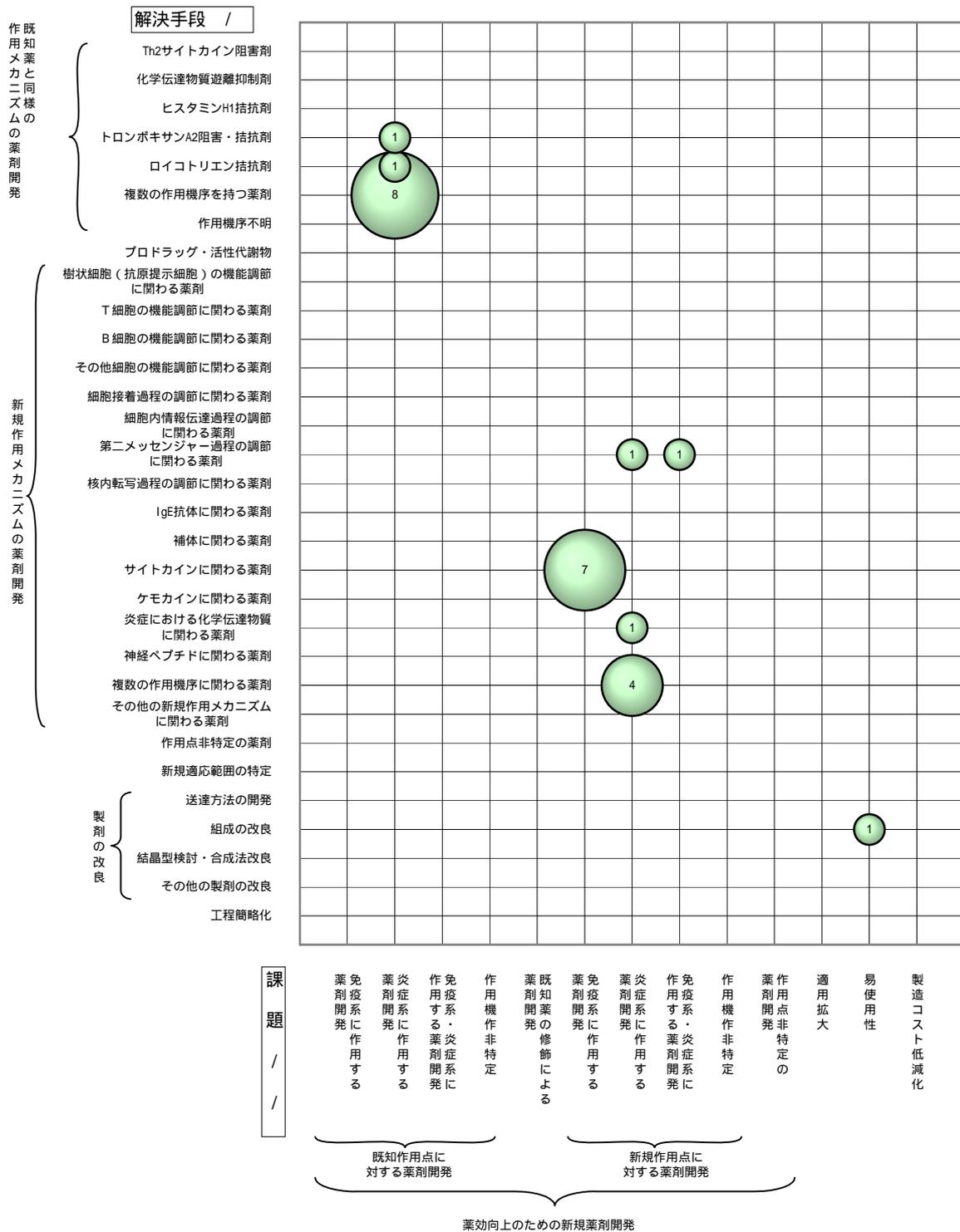
2.19.3 技術開発拠点と研究者

開発拠点：埼玉県さいたま市大宮区北袋町一丁目346番地 日研化学
医薬品研究所

図 2.19.3 に日研化学の抗アレルギー剤の出願件数と発明者数の年次推移を示す。出願件数は01年以降減少している。

図 2.19.4-2 に抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布を示す。「既知作用点に対する薬剤開発」の「炎症系に作用する薬剤開発」については、「複数の作用機序を持つ薬剤」が 8 件で、具体的にはリポキシゲナーゼ阻害作用とトロンボキサン合成酵素阻害作用など複数の作用機序をもつ薬剤である。「新規作用点に対する薬剤開発」の「免疫系に作用する薬剤開発」については、「サイトカインに関わる薬剤」が 7 件出願されている。

図 2.19.4-2 日研化学の抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布



(1993年1月～2003年12月の出願)

表 2.19.4 に日研化学の抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許を示す。出願件数は 25 件であり、そのうち登録になっている特許は 11 件である。

なお、表 2.19.4 では図 2.19.4-2 の解決手段 を細展開した解決手段 まで分析している。

表 2.19.4 日研化学の技術要素別課題対応特許 (1/3)

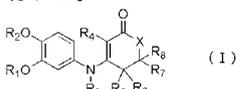
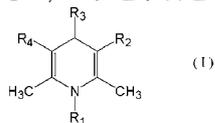
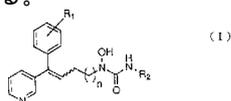
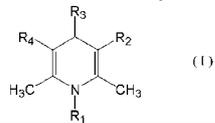
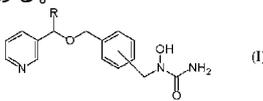
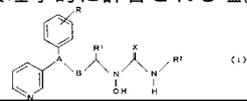
技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 炭素環式	(易使用性)投与方法の改善	組成の改良	特開 2001-151673 99.09.06 A61K9/72	吸入用粉末製剤の製造方法
	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / PDE4 に関する薬剤	特許 3542482 97.12.25 C07C225/20 [被引用 2 回]	3-アニリノ-2-シクロアルケノン誘導体 下記(1)で表される新規な 3-アニリノ-2-シクロアルケノン誘導体。ホスホジエステラーゼ IV 阻害作用を有する。 
合成医薬品 / 複素環式	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤	特許 3249346 94.07.29 C07D401/12	1,4-ジヒドロピリジン類 新規な抗アレルギー剤または抗炎症剤である、下記(1)で表される 1,4-ジヒドロピリジン類。 
		ロイコトリエン拮抗剤	特許 3281492 94.10.06 C07D213/42 [被引用 1 回]	N-ヒドロキシウレア類 下記(1)で表される N-ヒドロキシウレア類又はその薬理的に許容される塩は、アレルギー性疾患または炎症性疾患の治療用薬剤として有用な新規化合物である。 
		複数の作用機序を持つ薬剤	特許 3337829 94.07.29 C07D401/14 [被引用 1 回]	1,4-ジヒドロピリジン化合物 下記(1)で表される 1,4-ジヒドロピリジン化合物、ならびに当該化合物を有効成分とする新規な抗アレルギー剤又は抗炎症剤。 
		特許 3281503 95.02.02 C07D213/30	N-ヒドロキシウレア化合物 下記(1)【化 1】で表される N-ヒドロキシウレア化合物。この化合物はリポキシゲナーゼ阻害作用とトロンボキサン合成酵素阻害作用を有する新規化合物である。 	
		特許 3322885 95.02.02 C07D213/42 [被引用 7 回]	N-ヒドロキシウレア誘導体 下記(1)で表される N-ヒドロキシウレア誘導体又はその薬理的に許容される塩。 	

表 2.19.4 日研化学の技術要素別課題対応特許 (2/3)

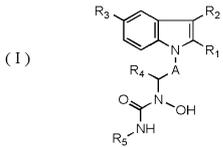
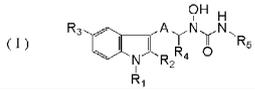
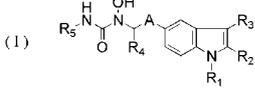
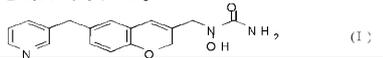
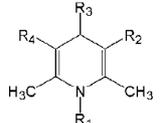
技術要素 /	(課題)課題 /課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発(つづき)	複数の作用機序を持つ薬剤(つづき)	特許 3558152 96.12.26 C07D401/04	N-ヒドロキシ尿素誘導体 下記(1)で表される、抗アレルギー作用または抗炎症作用を有する新規なN-ヒドロキシ尿素誘導体、または、その塩またはその水和物または溶媒和物。 
			特許 3558153 96.12.26 C07D401/04	N-ヒドロキシ尿素誘導体 下記(1)で表される抗アレルギー作用又は抗炎症作用を有する新規なN-ヒドロキシ尿素誘導体、又はその薬理学的許容しうる塩又はその水和物又は溶媒和物。 
			特許 3558154 96.12.26 C07D401/04	N-ヒドロキシ尿素誘導体 抗アレルギー作用又は抗炎症作用を有する新規なN-ヒドロキシ尿素誘導体、又はその薬理学的許容しうる塩又はその水和物又は溶媒和物。 
			特許 3222428 97.11.11 C07D405/06 [被引用1回]	N-ヒドロキシ尿素誘導体及びそれを含む医薬 新規なN-ヒドロキシ尿素誘導体。下記(1)で表されるN-ヒドロキシ-N-[6-(3-ピリジルメチル)-2H-1-ベンゾピラン-3-イルメチル]尿素またはその塩、及びそれらを有効成分とする抗アレルギー薬または抗炎症薬、特に抗喘息薬に関する。 
			特開 2000-256355 99.03.11 C07D409/06	N-ヒドロキシ尿素誘導体
			新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	サイトカインに関わる薬剤 / 免疫系に作用する薬剤
特開 2001-151780 99.11.30 C07D495/04, 105	4.5.6.7-テトラヒドロチエノ〔2.3-c〕ピリジン化合物			
特開 2001-158789 99.12.03 C07D495/04, 105	4.5.6.7-テトラヒドロチエノ〔2.3-c〕ピリジン誘導体			
特開 2002-37784 00.05.17 C07D409/04	新規チオフェンアミド化合物			
特開 2002-105081 00.07.28 C07D495/04, 105	新規チオフェン二環化合物			
特開 2002-167389 00.09.20 C07D513/04, 321	新規チアゾール二環化合物			

表 2.19.4 日研化学の技術要素別課題対応特許 (3/3)

技術要素 / /	(課題)課題 / /課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品/ 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系に作用する薬剤開発	サイトカインに関わる薬剤/その他のサイトカインに関わる薬剤	特開 2003-300884 02.04.08 A61K31/535	TNF- 産生阻害剤
	新規作用点に対する薬剤開発/炎症系に作用する薬剤開発	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤/脂質メディエーターに関わる薬剤	特開 2002-20289 00.07.07 A61K31/4433	プロスタグランジン E2 産生促進薬
		複数の作用機序に関わる薬剤	特許 3251434 94.07.29 C07D401/14	1,4-ジヒドロピリジン誘導体 下記(1)で表される新規な 1,4-ジヒドロピリジン誘導体、ならびに当該化合物を有効成分とする抗アレルギー剤又は抗炎症剤。  (1)
			特開平 11-60570 (みなし取下げ) 97.08.15 C07D401/12,209	置換アミノオキシアルカン酸誘導体
			特開平 11-71378 (特許 3753541) 97.06.25 C07D495/22 [被引用 1 回]	トリアゾロー-1,4-ジアゼピン系化合物
			特開 2000-256356 99.03.11 C07D409/06,213	N-ヒドロキシ尿素誘導体
新規作用点に対する薬剤開発/免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤/PDE4に関する薬剤	特開 2003-81926 01.06.29 C07C225/20	シクロアルケノン誘導体	

2.20 イーライリリーアンドカンパニー（米国）

2.20.1 企業の概要

商号	Eli Lilly and Company
本社所在地	Indianapolis, Indiana 46285 USA
設立年	1876年
資本金	N/A
従業員数	44,455名
事業内容	うつ病、精神分裂病、骨粗しょう症、制癌剤、その他の分野の医薬品の開発と販売

イーライリリーアンドカンパニーは米国に拠点を置く医薬品メーカーである。

主力製品には「Symbyax」（抗うつ薬）、「Cialis」（勃起不全薬）

「Forteo」（骨粗しょう症薬）、「Zyprexa」（精神分裂症薬）、「Humulin」（ヒトインシュリン）、「Gemzar」（膵臓癌および非小細胞肺癌治療薬）、「Ceclor」（経口抗生物質）などがある。（出典：<http://lilly.com/about/highlights.html>）

2.20.2 製品例

現在、抗アレルギー剤関連製品はない。

2.20.3 技術開発拠点と研究者

開発拠点：Indianapolis, USA

研究者数：8,800名

（<http://lilly.com/about/highlights.html>）

図 2.20.3 にイーライリリーアンドカンパニーの抗アレルギー剤の出願件数と発明者数の年次推移を示す。出願件数は継続的に毎年数件である。

図 2.20.4-2 に抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布を示す。「新規作用点に対する薬剤開発」については、「炎症系に作用する薬剤開発」が 22 件あり、そのうち「炎症における化学伝達物質に関わる薬剤」（sPLA2 阻害剤）が 17 件出願されている。

図 2.20.4-2 イーライリリーアンドカンパニーの抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布

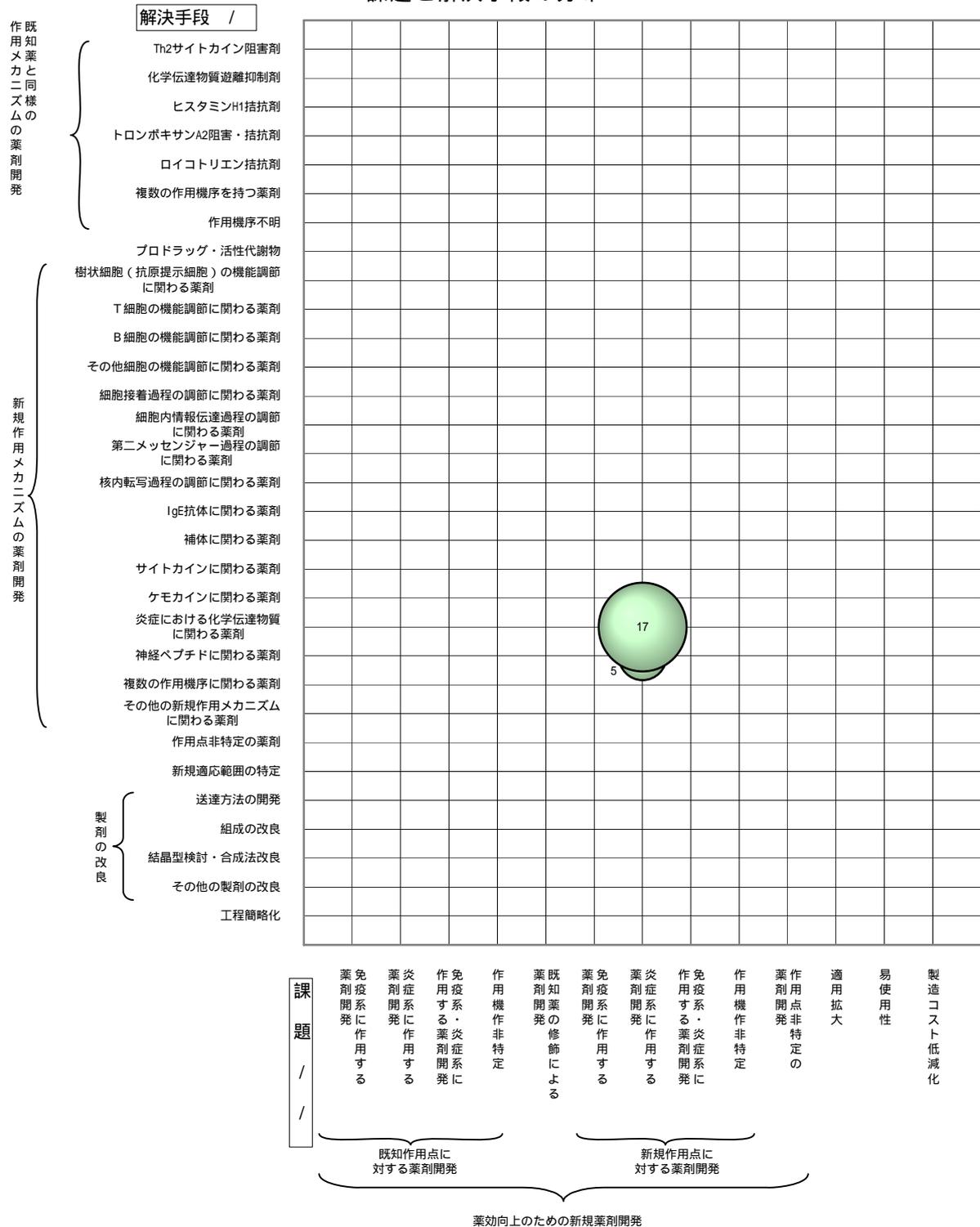


表 2.20.4 にイーライリリーアンドカンパニーの抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許を示す。出願件数は 22 件であり、そのうち登録になっている特許は 2 件である。

なお、表 2.20.4 では図 2.20.4-2 の解決手段 を細展開した解決手段 まで分析している。

表 2.20.4 イーライリリーアンドカンパニーの技術要素別課題対応特許 (1/2)

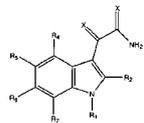
技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 炭素環式	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 脂質メディエーターに関わる薬剤	特表 2000-502083 95.12.13 C07C235/78 [被引用 3 回]	sPLA 下 2 インヒビターとしてのナフチルグリオキサミド類
			特表 2000-501739 95.12.13 C07C233/11 [被引用 3 回]	sPLA2 阻害物質としてのナフチルアセトアミド
			特表 2001-505882 96.12.03 C07C235/78 [被引用 2 回]	sPLA 下 2 阻害剤としてのフェニルグリオキサミド化合物
合成医薬品 / 複素環式			特表 2003-519198 00.01.06 A61K45/06	炎症性疾患および呼吸器疾患の処置のための併用療法
			特許 3621128 93.04.16 C07D209/22 [被引用 3 回]	sPLA2 阻害剤 1H-インドール-3-酢酸ヒドラジド sPLA2 阻害剤である、1H-インドール-3-酢酸ヒドラジド誘導体。本発明の化合物は、敗血症ショック、成人呼吸困難症候群、気管支喘息、慢性関節・リュウマチ等の処置に有用。(図なし)
			特許 3109974 94.04.01 C07D209/18 [被引用 3 回]	1H-インドール-3-グリオキシルアミド sPLA2 阻害剤 下記で示される新規 1H-インドール-3-グリオキシルアミド類。sPLA2 媒介性脂肪酸の遊離を阻害し、敗血症性ショック、成人の呼吸困難症候群、膵臓炎、外傷、気管支喘息、アレルギー性鼻炎、慢性関節リュウマチなどの治療に有用である。 
			特表 2002-515053 96.12.04 C07D231/44 [被引用 2 回]	ヒト非膵分泌性ホスホリパーゼ A 下 2 阻害剤としてのピラゾール化合物
			特表 2001-505915 96.12.10 A61P43/00, 111 [被引用 2 回]	sPLA2 阻害剤としてのピロール
特開平 11-322713 98.04.17 C07D209/88	置換三環式化合物			
特表 2001-520991 97.10.27 A61K31/404	インドール sPLA2 阻害剤の N,N-ジエチルグリコールアミドエステルプロドラッグ			

表 2.20.4 イーライリリーアンドカンパニーの技術要素別課題対応特許 (2/2)

技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発 (つづき)	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 脂質メディエーターに関わる薬剤(つづき)	特表 2001-520998 97.10.27 C07D209/14	インドール sPLA2 阻害剤のモルホリノールエステルプロドラッグ
		特表 2002-513761 98.05.01 C07D209/22	sPLA2 阻害剤エステル	
		特表 2002-522385 98.08.03 C07D209/40	インドール sPLA2 インヒビター	
		特表 2002-522386 98.08.03 C07D209/22	インドール sPLA2 インヒビター	
		特表 2002-544256 99.05.12 C07D209/18	インドール sPLA2 インヒビターのモルホリノールエステル誘導体	
		特表 2004-525154 01.03.28 C07D209/88	sPLA2 インヒビターとしての置換カルバゾール	
		炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / その他の化学伝達物質に関わる薬剤	特表 2000-507269 (みなし取下げ) 96.03.25 A61K45/00	一般かぜまたはアレルギー性鼻炎の処置方法
		神経ペプチドに関わる薬剤 / タキキニンに関わる薬剤	特開平 7-215863 (拒絶査定確定) 93.12.21 A61K31/40, AED	非ペプチドタキキニン受容体拮抗物質
		特開平 7-330736 94.06.10 C07D233/06	イミダゾリニルタキキニン受容体拮抗薬	
		特開平 8-59457 (みなし取下げ) 94.07.22 A61K31/13, AED	1-アリール-2-アセトアミドベンタノン誘導体のタキキニン受容体アンタゴニストとしての使用	
		特表平 10-502640 94.07.12 C07D401/14, 209	異項環タキキニン受容体拮抗物質	
		特表 2001-512717 (みなし取下) 97.08.06 C07D209/16	タキキニン受容体アンタゴニストとしての 2-アシルアミノプロパンアミン	

2.21 塩野義製薬

2.21.1 企業の概要

商号	塩野義製薬 株式会社
本社所在地	〒541-0045 大阪市中央区道修町3丁目1番8号
設立年	1919年
資本金	212億7974万2717円
従業員数	連結 合計 5,614名、単体 合計 4,343名
事業内容	医薬品、診断薬などの製造・販売

塩野義製薬は医療用医薬品が売上高全体の90%以上を占め、製品領域として「循環/代謝」「感染/免疫」「癌/疼痛」の3領域がある。

研究開発部門では重点領域をさらに絞り込み、感染症に加え、疼痛、メタボリックシンドロームを第二、第三の柱としている。

主力製品には「フロモックス」（経口用抗生物質）、「フルマリン」（注射用抗生物質）、「塩酸バンコマイシン」（MRSA感染症治療薬）、「イムネース」（抗癌剤：遺伝子組換え型インターロイキン-2製剤）などがある。

（出典：<http://www.shionogi.co.jp/contents/kaisha/jigyo/seihin.htm>）

2.21.2 製品例

抗アレルギー剤関連製品

医療用医薬品

- 「クラリチン錠」（抗アレルギー剤）
- 「クラリチンレディタブ錠」（抗アレルギー剤）

（出典：<http://www.shionogi.co.jp/contents/kaisha/jigyo/seihin.htm>）

2.21.3 技術開発拠点と研究者

開発拠点：大阪市福島区鷺州5丁目12番4号 塩野義製薬 中央研究所

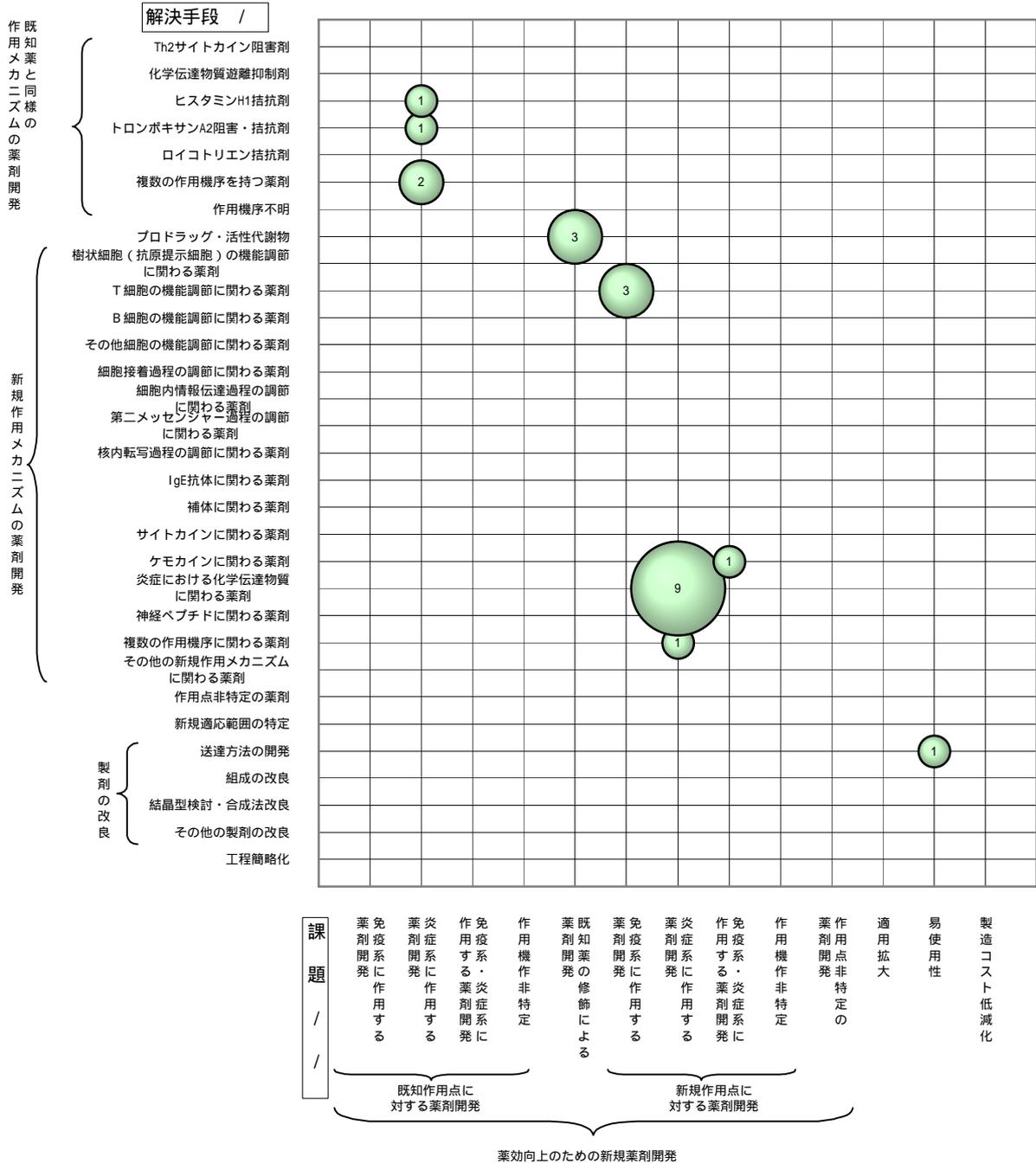
新薬研究所： 豊中市二葉町3丁目1番1号（新薬研究所）

（<http://www.shionogi.co.jp/contents/kaisha/jigyosho.htm>）

図 2.21.3 に塩野義製薬の抗アレルギー剤の出願件数と発明者数の年次推移を示す。出願件数は毎年数件であるが99年は7件と多い。

図 2.21.4-2 に抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布を示す。「新規作用点に対する薬剤開発」において、課題として多い「炎症系に作用する薬剤開発」に対して、「炎症における化学伝達物質に関わる薬剤」（PGD2拮抗剤、sPLA2阻害剤）を解決手段としている特許が9件ある。

図 2.21.4-2 塩野義製薬の抗アレルギー剤に関する課題と解決手段の分布



(1993年1月～2003年12月の出願)

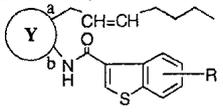
表 2.21.4 に塩野義製薬の抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許を示す。出願件数は 22 件であり、そのうち登録になっている特許は 2 件である。

なお、表 2.21.4 では図 2.21.4-2 の解決手段 を細展開した解決手段 まで分析している。

表 2.21.4 塩野義製薬の技術要素別課題対応特許 (1/2)

技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品 / 炭素環式	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	トロンボキサン A2 阻害・拮抗剤	特開 2000-351729 99.06.08 A61K31/19, 602	トロンボキサン A2 受容体拮抗剤の経皮吸収製剤
		複数の作用機序を持つ薬剤	WO01/94309 00.06.02 C07C233/81	PGD2/TXA2 両受容体拮抗性医薬組成物
	既知薬の修飾による薬剤開発	(プロドラッグ・活性代謝物)	WO01/05750 99.07.19 C07C271/28	アシロキシメトキシカルボニル側鎖を有するパラテルフェニル化合物
			WO01/05768 99.07.19 C07D213/64	アシロキシメトキシカルボニル側鎖を有する三環式化合物
	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	T細胞の機能調節に関わる薬剤	WO02/57216 01.01.18 C07C211/50	置換アミノ基を有するテルフェニル化合物
	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 脂質メディエーターに関わる薬剤	特許 3195361 95.06.21 A61K31/201 [被引用 8 回]	ピシクロ環系アミノ誘導体およびそれを含有する PGD2 拮抗剤 下記(1)の化合物は、PGD2 拮抗剤であり、全身性肥満細胞症や全身性肥満細胞活性化障害の治療剤、抗気管収縮剤、抗喘息剤、抗アレルギー性鼻炎剤、抗アレルギー性結膜炎剤、抗蕁麻疹剤、虚血再灌流傷害治療薬、抗炎症剤として用いることができ、特に鼻閉症の治療に有用である。
			特開 2001-288160 (特許 3701878) 95.06.21 C07C311/20	ピシクロ環系アミノ誘導体およびそれを含有する PGD2 拮抗剤
WO02/36583 00.11.01 C07D207/34			PGD2 受容体拮抗性医薬組成物	
合成医薬品 / 複素環式	(易使用性)投与方法の改善	送達方法の開発	特開 2005-60265 03.08.08 A61K31/4545、シエリングブラウ	ロラタジンを含むドライシロップ剤
	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	ヒスタミン H1 拮抗剤	特開平 7-61968 (特許 3719612) 93.06.14 C07D207/27	ヘテロ環を含有する尿素誘導体
		複数の作用機序を持つ薬剤	WO99/15502 97.09.19 C07D209/42	[2.2.1]ピシクロ骨格を有する化合物
	既知薬の修飾による薬剤開発	(プロドラッグ・活性代謝物)	WO01/07401 99.07.23 C07C243/22	三環式化合物およびそれを含有する医薬組成物

表 2.21.4 塩野義製薬の技術要素別課題対応特許 (2/2)

技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	T細胞の機能調節に関わる薬剤	W002/57237 01.01.22 C07D213/74	置換アミノ基を有するヘテロ3環化合物
	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 脂質メデイエーターに関わる薬剤	特許 3215441 96.12.13 C07D333/68 [被引用2回]	ベンゾチオフェンカルボン酸アミド誘導体およびそれを含有する PGD2 拮抗剤 式(1)の化合物は、PGD2 拮抗作用、好酸球浸潤抑制作用を有し、肥満細胞機能不全や、全身性肥満細胞症及び全身性肥満細胞活性化障害の治療剤、抗気管収縮剤、抗喘息剤、抗アレルギー性鼻炎剤、抗アレルギー性結膜炎剤、抗蕁麻疹剤、虚血再灌流傷害治療薬、抗炎症剤、アトピー性皮膚炎治療薬として有用。 
			W001/14378 99.08.23 C07D487/04, 140	sPLA2 阻害作用を有するピロロトリアジン誘導体
			W001/26653 99.10.15 A61K31/403	V型および/またはX型 sPLA2 阻害剤
			W001/36420 99.11.15 C07D487/04, 140	sPLA2 阻害作用を有する三環性アザインドリジン誘導体
			特開平 10-87493 (みなし取下げ) 96.09.18 A61K31/535, ABN [被引用4回]	セフエム系化合物を含有するキマーゼ阻害剤
高分子医薬品 / 蛋白質医薬品	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	T細胞の機能調節に関わる薬剤	W099/53947 98.04.20 A61K39/00	W/O エマルジョンを含有する Th2 移行促進剤
	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	ケモカインに関わる薬剤 / CC ケモカインに関わる薬剤	特開平 11-243960 (取下) 98.03.06 C12N15/09, ZNA	ヒト CC 型ケモカインエオタキシン 3
天然物医薬品 / 微生物由来	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 起炎性プロテアーゼに関わる薬剤	特開平 10-101666 (みなし取下げ) 96.10.02 C07D313/00 [被引用3回]	新規ベンゾオキサシクロトリデシン化合物およびそれを含有する医薬組成物

2.22 大学・公的研究機関等

表 2.22 に大学および公的研究機関の抗アレルギー剤の技術要素別課題対応特許を示す。出願件数は 30 件であり、そのうち登録になっている特許は 6 件である。

表 2.22 大学・公的研究機関の抗アレルギー剤に関する技術要素別課題対応特許(1/6)

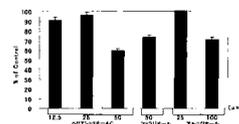
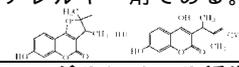
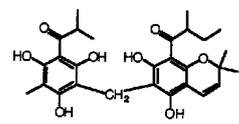
公的研究機関	技術要素 / 技術要素	(課題)課題 / 課題	(解決手段)解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
日本大学	合成医薬品 / 複素環式	作用点非特定の薬剤開発	(作用点非特定の薬剤)	W003/73870 02.02.20 C07D277/20, CSP	抗アレルギー作用を有する健康食品 Aniba gardneri、それらの抽出物もしくは分画物、またはこれらに含有される化合物もしくはその誘導体を含むアレルギー症状を緩和するための健康食品および抗アレルギー剤である薬品組成物。(図なし)
	天然物医薬品 / 植物由来	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	化学伝達物質遊離抑制剤	特開 2003-277267 (みなし取下) 02.03.20 A61K31/56	トリテルペン系化合物含有抗アレルギー剤 ヘリアントリオールC及びファラジオールからなる群から選ばれた少なくとも1種のトリテルペン系化合物を含有することを特徴とする抗アレルギー剤。あるいは、ヒスタミン遊離抑制効果を有することを特徴とする抗アレルギー剤。ロイコトリエン分泌抑制効果を有することを特徴とする抗アレルギー剤。特に、菊科植物花弁を処理して得られることを特徴とする上記抗アレルギー剤。 
		新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	細胞内情報伝達過程の調節に関わる薬剤	特開 2005-53829 03.08.04 C07D307/33	新規なブレニル基を含む誘導体及びそれを含む抗炎症剤 下記式で表されるブレニル誘導体化合物:および医薬として受容可能な担体及び/又は希釈剤を含む、医薬組成物。用途としては、医薬組成物が抗炎症剤あるいは抗アレルギー剤である。 
		新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	複数の作用機序に関わる薬剤	特開 2003-55369 01.08.06 C07D311/58	新規なフロログルシノール誘導体、及びこれを用いた組成物、抗アレルギー剤 下記式で示される新規なフロログルシノール誘導体および請求項1記載のフロログルシノール誘導体含有する組成物。  (1)

表 2.22 大学・公的研究機関の抗アレルギー剤に関する技術要素別課題対応特許(2/6)

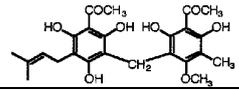
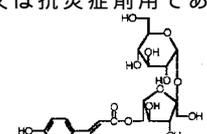
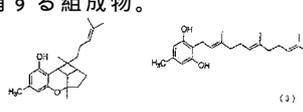
公的研究機関	技術要素 / 技術要素	(課題) 課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
日本大学(つづき)	天然物医薬品 / 植物由来 (つづき)	作用点非特定の薬剤開発	(作用点非特定の薬剤)	特開 2003-73265 01.09.04 A61K31/12	<p>フロログルシノール誘導体を用いた抗アレルギー剤及び抗炎症剤</p> <p>フロログルシノール誘導体を含む抗アレルギー剤。特に、フロログルシノール誘導体が、下記で示される化合物(Mallotojaponin)及び/又は下記化学式(2)で示される化合物(Butyrylmallotojaponin)である抗アレルギー剤</p> 
				特開 2003-73392 01.09.04 C07H13/06	<p>新規なケイヒ酸誘導体並びにこれを用いた組成物、抗アレルギー剤及び抗炎症剤</p> <p>下記で示される新規なケイヒ酸誘導体および新規なケイヒ酸誘導体を有する組成物。用途としては、抗アレルギー剤用又は抗炎症剤用である</p> 
				特開 2002-265463 00.10.06 C07D311/58	<p>新規なオルシノール誘導体及びこれを用いた組成物、抗アレルギー剤</p> <p>下記で代表される新規なオルシノール誘導体および新規なオルシノール誘導体を有する組成物。</p> 
				特開 2003-277276 02.01.16 A61K35/64	<p>ペニカミキリフラスを有効成分とする皮膚外用薬</p> <p>ペニカミキリフラスを成分として含有することを特徴とする抗アレルギー剤、皮膚外用薬、皮膚炎抑制剤、浴用剤、花粉症軽減剤。(図なし)</p>
	生薬			特開 2003-212786 (みなし取下げ) 02.01.16 A61K35/78 日本大学	<p>竹の抽出成分を有効成分とする皮膚外用薬</p> <p>ヘリアントリオールC及びファラジオールからなる群から選ばれた少なくとも1種のトリテルペン系化合物を含有することを特徴とする抗アレルギー剤。あるいは、ヒスタミン遊離抑制効果を有することを特徴とする抗アレルギー剤。ロイコトリエン分泌抑制効果を有することを特徴とする抗アレルギー剤。特に、菊科植物花弁を処理して得られることを特徴とする上記抗アレルギー剤。(図なし)</p>

表 2.22 大学・公的研究機関の抗アレルギー剤に関する技術要素別課題対応特許(3/6)

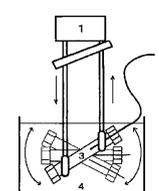
機関 大学・ 公的研究	技術要素 / 技術要素	(課題)課題 /課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
農業 生物系特定産業 技術研究機構	合成医薬品 / 複素環式	既知作用点に 対する薬剤開 発 / 炎症系に 作用する薬剤 開発	化学伝達物質 遊離抑制剤	特開 2004-107295 02.09.20 A61K31/7016 江東微生物研究所、 佐藤宏一	ヒスタミン遊離抑制剤 ペクチン若しくはその塩、又はペクチ ンの加水分解物を有効成分とするヒス タミン遊離抑制剤。また、該抑制剤を 含んでなる医薬組成物、化粧品及び飲 食品。
		作用点非特定 の薬剤開発	(作用点非特 定の薬剤)	特開 2002-12545 (特許 3694733) 00.06.29 A61K31/7024	抗アレルギー剤 ストリクチニン及びそのメチル化誘導 体の中から選ばれた少なくとも1種の ポリフェノールを有効成分として含有 する抗アレルギー剤、炎症剤 経口及び外用抗アレルギー剤または経 口または外用炎症剤を含む飲食物。
	天然物医薬品 /植物由来	既知作用点に 対する薬剤開 発 / 炎症系に 作用する薬剤 開発	化学伝達物質 遊離抑制剤	特許 3637355 98.11.20 A61K31/352 静岡県	抗アレルギー剤 3-O-メチルガロイルエピガロカテ キンおよび/または4-O-メチルガ ロイルエピガロカテキンを有効成分と して含有することを特徴とする抗アレ ルギー剤、炎症剤、飲食物並びに化 粧料。
	生薬	新規作用点に 対する薬剤開 発 / 炎症系に 作用する薬剤 開発	炎症における 化学伝達物質 に関わる薬剤 /脂質メディ エーターに関 わる薬剤	特開 2001-233778 00.02.22 A61K35/78 富士産業 [被引用1回]	5-リボキシゲナーゼ活性阻害剤及び 5-リボキシゲナーゼ活性阻害成分含有 抗アレルギー食品 各種の薬用植物からの低極性有機溶媒 に易溶な成分を有効成分とする5-リ ボキシゲナーゼ活性阻害剤、及びそれ を含有する抗アレルギー食品。アラキ ドン酸代謝異常に伴う疾患の予防、治 療に有用。
産業 技術総合研究所	天然物医薬品 /微生物由来	新規作用点に 対する薬剤開 発 / 免疫系に 作用する薬剤 開発	その他細胞の 機能調節に関 わる薬剤	特許 3066488 95.07.04 A61K31/39	抗アレルギー剤 チオトロポシンの新規用途として、チオ トロポシンを有効成分として含む抗アレ ルギー剤。 
	生薬	新規作用点に 対する薬剤開 発 / 炎症系に 作用する薬剤 開発	炎症における 化学伝達物質 に関わる薬剤 /起炎性プロ テアーゼに関 わる薬剤	特許 3066484 97.03.27 A61K35/80	抗アレルギー剤および炎症剤 藻類の水抽出物を活性成分として含有す る抗アレルギー剤、炎症剤、ヒアルロ ニダーゼ活性阻害剤および肥満細胞脱顆 粒阻害剤。 

表 2.22 大学・公的研究機関の抗アレルギー剤に関する技術要素別課題対応特許(4/6)

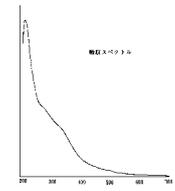
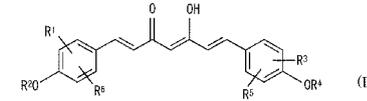
公的研究機関	技術要素 / 技術要素	(課題) 課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
産業技術総合研究所(つづき)	生薬 (つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	複数の作用機序に関わる薬剤	特許 3071669 95.07.04 A61K35/78 ホクレン農業協同組合連合会 [被引用1回]	抗アレルギー物質、その製造方法、抗アレルギー剤及び機能性食品 シソ植物中から得られる抗アレルギー剤及び機能性食品、及びその製法。本抗アレルギー物質には、アミノ酸を含む分子量13500の多糖類(抗アレルギー物質I)、並びにポリフェノール類(抗アレルギー物質II及びIII)がある。 
科学技術振興機構	合成医薬品 / 複素環式	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 脂質メディエーターに関わる薬剤	特開 2004-2248 02.03.25 A61K31/502	ヒト由来プロスタグランジン合成酵素阻害剤 1 - アミノ - 4 - (4 - スルファモイルアニリノ) - アントラキノン - 2 - スルホン酸、2 - (2 - ベンゾチアゾリル) - 5 - スチリル - 3 - (4 - フタルヒドロジイル) テトラゾリウム塩化物を有効成分とするヒト由来プロスタグランジンD2合成酵素阻害剤。睡眠、体温、性周期、鎮痛または臭覚等を調節できる。
	天然物医薬品 / 植物由来	(製造コスト低減化) 原体コストの低減化	工程簡略化	特開 2005-41817 03.07.23 C07H15/203	クルクミノイド配糖体、及びその製造方法 下記(1)の新規なクルクミノイド配糖体、該配糖体を含む色素組成物、該クルクミノイド配糖体などを含むアレルギー治療用医薬組成物、及び効率的で、多様なクルクミノイド配糖体の製造方法を提供する。 
近畿大学		既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	化学伝達物質遊離抑制剤	特開 2005-170804 03.12.08 A61K31/7034	抗アレルギー剤 本発明の抗アレルギー剤および食品はネオヘスペリジン、ナリンギン、ネオヘスペリジンおよびナリンギンを有効成分とする柑橘類果実を含有する。これらは副作用がなく長期間に渡り服用できる抗アレルギー剤および食品である。
		作用点非特定の薬剤開発	(作用点非特定の薬剤)	特開 2005-132791 03.10.31 A61K31/7048	抗アレルギー剤 本発明の抗アレルギー剤は、ヘスペリジン含有する未熟な柑橘類果実の40%以上のエタノール抽出エキスを含有し、気管支ぜん息、アレルギー性鼻炎、花粉症、アトピー性皮膚炎などのアレルギー性疾患の予防・改善・治療に有効である。

表 2.22 大学・公的研究機関の抗アレルギー剤に関する技術要素別課題対応特許(5/6)

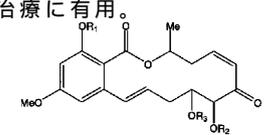
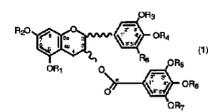
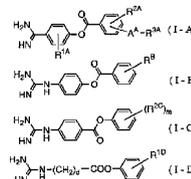
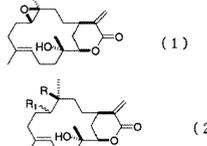
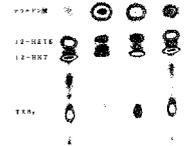
機関	大学・ 公的研究 機関	技術要素 / 技術要素	(課題)課題 /課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主IPC 共同出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
慶応義塾	合成医薬品 / 複素環式	新規作用点に 対する薬剤開発 / 免疫系に 作用する薬剤 開発	サイトカイン に関わる薬剤 / 抗原特異的 免疫応答に関 わるサイトカ インに関わる 薬剤	特開 2001-294527 00.04.14 A61K31/365 味の素		Th2反応に特異的な免疫寛容誘導剤 下記(1)で示される化合物またはその塩を含む、Th2反応に特異的な免疫寛容誘導剤。本剤は特にTh2リンパ球の活性化およびそれに伴う液性免疫反応の異常が病態に関与するアレルギー性疾患もしくは免疫異常疾患の予防、改善または治療に有用。 
						その他の抗 アレルギー 剤
静岡県	天然物医薬品 / 植物由来	(製造コスト 低減化)原体 コストの低減 化	工程簡略化	特開 2001-253879 00.03.09 C07D311/62		カテキン類のアルキル誘導体 カテキンおよび炭素数1-10のアルキルハライドを炭酸リチウムの存在下で反応させて、下記(1)に示す強い抗アレルギー活性を持つカテキン誘導体類を高純度で安価に合成する。 
			既知作用点に 対する薬剤開 発 / 炎症系に 作用する薬剤 開発	化学伝達物質 遊離抑制剤	特許 3637355 98.11.20 A61K31/352 農業生物系特定産 業技術研究機構	抗アレルギー剤 3-O-メチルガロイルエピガロカテキンおよび/または4-O-メチルガロイルエピガロカテキンを有効成分として含有することを特徴とする抗アレルギー剤、抗炎症剤、飲食物並びに化粧料。 
分子工 学研 究組 合生 物 研 究 所	高分子医薬品 / ペプチド 医薬品	新規作用点に 対する薬剤開 発 / 免疫系に 作用する薬剤 開発	サイトカイン に関わる薬剤 / 抗原特異的 免疫応答に関 わるサイトカ インに関わる 薬剤	特開 2005-154382 03.11.28 C07K14/00		ヒトインターロイキン4およびヒトインターロイキン13のアンタゴニストであるペプチド hIL-4のアンタゴニストであると同時にhIL-13のアンタゴニストでもある新規なアミノ酸配列を有する合成ペプチドの製造、並びに、該合成ペプチドを含有する、アレルギー疾患を処置するのに有用な医薬組成物を提供する。

表 2.22 大学・公的研究機関の抗アレルギー剤に関する技術要素別課題対応特許(6/6)

公的研究機関	技術要素 / 技術要素	(課題) 課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	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
桐蔭横浜大学	合成医薬品 / 炭素環式	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 起炎性プロテアーゼに関わる薬剤	特開平 10-306025 (みなし取下げ) 97.05.07 A61K31/24, AED 小野薬品工業	花粉プロテアーゼ阻害剤 式(1-A)、(1-B)、(1-C)、(1-D)で示されるフェノール又は安息香酸誘導体、およびそれらの塩または酸付加塩または水和物を有効成分とする花粉プロテアーゼ阻害剤。花粉に起因する種々のアレルギー性疾患の予防 / は治療に有用。 
産学連携機構九州	天然物医薬品 / 動物由来	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	サイトカインに関わる薬剤 / その他のサイトカインに関わる薬剤	特開 2004-262849 03.03.03 A61K31/366	腫瘍壊死因子機能阻害剤 下記の式(1)で表わされる、人体に対して安全なフレキシピリドもしくは式(2)で表されるフレキシピリド誘導体またはそれらの薬理学上許容される塩を含有する腫瘍壊死因子機能阻害剤。 
京都大学	合成医薬品 / 複素環式	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 起炎性プロテアーゼに関わる薬剤	特開 2005-75805 03.09.03 A61K31/765	酵素阻害剤 エピガロカテキンガレートを酸化重合して得られる、マトリックスメタロプロテアーゼ、ウロキナーゼ、ヒアルロニダーゼ及びエラスターゼに対する高い阻害活性を有するフラボノイド誘導体。腫瘍性湿潤、慢性関節リウマチ、動脈硬化、歯周疾患、肝硬変、潰瘍形成、皮膚アレルギー等の治療薬 / 予防剤として有用。
研究機構 東京都医学	天然物医薬品 / 動物由来	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	ヒスタミン H1 拮抗剤	特開 2000-169379 98.09.28 A61K35/12	抗アレルギー剤及びその製造方法 動物組織から抽出され、アトピー性疾患などのアレルギー性疾患の予防や治療に有効な新規な抗アレルギー剤及びその製造方法を提供する。
農林水産省中国農業試験場長	生薬	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 脂質メディエーターに関わる薬剤	特許 2732504 95.03.08 A61K35/78, AED	アラキドン酸代謝活性阻害剤とその製造法 特定のカンキツ類の果皮からの抽出物を有効成分とするアラキドン酸代謝酵素阻害活性を示す組成物並びにその製造法。このものを各種食品に添加することにより、動脈硬化、血栓などの循環器系疾患、アレルギー性疾患や炎症などを効果的に予防、治療することができる。 

2.23 主要企業等以外の特許番号一覧

表 2.23 に、上位 21 社および大学・公的研究機関等以外の特許番号一覧を示す。主要企業等以外の登録特許は 83 件であった。

表 2.23 主要企業等以外の特許番号一覧(1/15)

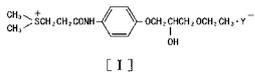
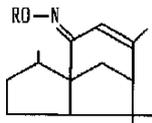
技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) / 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 炭素環式	(易使用性)投与法の改善	送達方法の開発	特許 3428465 97.11.06 A61K31/63 パナセアバイオテック	新規な抗アレルギー-抗炎症組成物 ニメスリドのような非ステロイド性抗炎症スルホンアニリドと、セチリジンのような第2世代抗ヒスタミン剤(H1ブロッカー)とを、適切な薬学的塩基および賦形剤中に有する、新規な抗ロイコトリエン、抗ヒスタミン、抗アレルギー、および抗炎症組成物。(図なし)
		組成の改良	特許 3202861 94.01.19 A61K31/167 大鵬薬品工業 [被引用1回]	スルホニウム化合物含有外用剤 下記(1)で表される抗アレルギー作用性スルホニウム化合物と親油性基剤とからなり、水を添加していないことを特徴とする皮膚外用剤。水を添加しないことにより抗アレルギー作用性スルホニウム化合物の安定性及び経皮吸収性を高めることができる。  (1)
	(製造コスト低減化)原体コストの低減化	工程簡略化	特許 3563480 94.03.10 C07C381/12 大鵬薬品工業 [被引用1回]	光学活性体の製造方法、並びに光学活性なスルホニウム化合物 下記[1](式中、Yは無機酸残基または有機酸残基)で表され、アレルギー疾患の治療に用いられる光学活性なスルホニウム化合物。  [1]
既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	ヒスタミン H1 拮抗剤	特許 3113759 93.05.17 C07C251/44 花王	セスキテルベン誘導体 下記(1)のセスキテルベン誘導体。優れた抗ヒスタミン作用、抗ロイコトリエン作用及び血中コレステロール低下作用を有し、湿疹、蕁麻疹、アトピー性皮膚炎、アレルギー性鼻炎、花粉症等のアレルギー性疾患及び高脂質血症の予防又は治療に有用である。  (1)	

表 2.23 主要企業等以外の特許番号一覧(2/15)

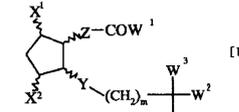
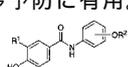
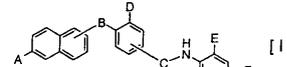
技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) / 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 炭素環式(つづき)	既知作用点に対する薬剤開発 / 作用機作非特定	作用機序不明	特許 2733053 95.12.01 C07C43/23 セイエールデガル デルマ	アダマンチル基を有するバイアロマテイツク化合物および該化合物を含有する薬用および化粧用組成物並びにその使用 細胞分化および増殖に関する疾患に顕著な有効性を示すバイアロマテイツク化合物(biaromatic compounds)、並びにこの化合物を含んだ薬用組成物もしくは化粧用組成物。 
			特許 2733054 95.12.01 C07C43/23 セイエールデガル デルマ	バイアロマテイツク化合物および該化合物を含有する薬用および化粧用組成物並びにその使用 細胞分化および増殖に関する疾患に顕著な有効性を示すバイアロマテイツク化合物(biaromatic compounds)、並びにこの化合物を含んだ薬用組成物もしくは化粧用組成物。 
			特許 3678366 02.08.09 A61K31/5575 大正製薬、佐藤史衛	止痒剤 下記[1]で表されるプロスタグランジン誘導体、その製薬学的に許容される塩またはその水和物を有効成分とする掻痒性症状の予防または治療用薬剤。 
	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	細胞接着過程の調節に関わる薬剤	特許 3650144 94.06.08 A61K31/165 花王	細胞接着抑制剤 下記(1)で表わされる安息香酸アニリド類又はその塩を有効成分とする細胞接着抑制剤。各種炎症性疾患、気管支喘息、リウマチ、アトピー性皮膚炎、花粉症、乾癬、腎炎、自己免疫疾患等の治療及び癌転移予防に有用。 
		IgE 抗体に関わる薬剤	特許 3668494 94.05.31 C07C233/55 帝人	ナフタレン誘導体 下記[1]で示されるナフタレン誘導体、その塩。その化合物は、例えば IgE 抗体の産生を抑制する等の作用を有し、アレルギー疾患の予防剤および/または治療剤等として有用。 

表 2.23 主要企業等以外の特許番号一覧(3/15)

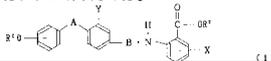
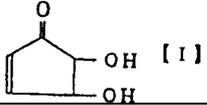
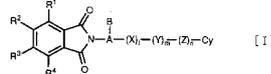
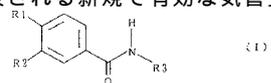
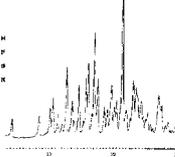
技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) / 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 炭素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発(つづき)	IgE 抗体に関わる薬剤(つづき)	特許 3117466 95.11.27 C07C235/38 帝人	ベンゼン誘導体 高い IgE 抗体産生抑制作用を有し、アレルギー疾患の予防剤または治療剤として有用な、下記(1)の新規なベンゼン誘導体、その塩、それを有効成分として含む医薬組成物、特にアレルギー疾患に対する予防剤又は治療剤。  (1)
		複数の作用機序に関わる薬剤	特許 3664738 97.07.02 A61K31/122 タカラバイオ	抗アレルギー剤 下記[1]で表される 4,5 - ジヒドロキシ - 2 - シクロペンテン - 1 - オン若しくはその光学活性体又はその塩から選択される化合物を有効成分として含有する抗アレルギー剤。  [1]
			特許 2921760 (権利消滅) 97.05.21 C07D209/48 日本たばこ産業	フタルイミド誘導体及びそれら誘導体を含んでなる医薬 選択的に IgE 及び IL - 5 の産生を抑制することにより、有効性と安全性を兼ね備えた抗アレルギー剤となる下記[1]で示される新規化合物。  [1]
	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / PDE4 に関する薬剤	特許 3093271 93.07.02 C07C235/56 ビクグルデンロンベルグヒエーミッシュェファブリーク [被引用 5 回]	フルオルアルコキシ置換のベンズアミド及び環状ヌクレオチドホスホジエステラーゼ阻害剤としての使用 下記(1)で表される新規で有効な気管支治療剤。  (1)
合成医薬品 / 複素環式	(易使用性)投与法の改善	組成の改良	特許 3193028 (権利消滅) 99.07.21 A61K31/4164 昭栄	ニトロイミダゾール系化合物を含むアトピー性皮膚炎治療用の外用剤 メトロニダゾールまたはその塩を有効成分とする、アトピー性皮膚炎の外用剤。ステロイド系外用剤に見られるような副作用(リバウンド等)の懸念もなく、治療効果も高い。(図なし)
	(易使用性)保存安定性	結晶型検討・合成法改良	特許 3182685 95.09.01 C07D491/044 北陸製薬	水和物結晶及びその製造方法 抗ヒスタミン作用及び抗アレルギー作用を有し、気管支喘息、アレルギー性鼻炎、皮膚疾患蕁麻疹等の治療剤として有用な 3 - [4 - (8 - フルオロ - 511 - ジヒドロベンズ [b] オキセピノ [43 - b] ピリジン - 11 - イリデン) ピペリジノ] プロピオン酸の安定な結晶及びその製造方法。 

表 2.23 主要企業等以外の特許番号一覧(4/15)

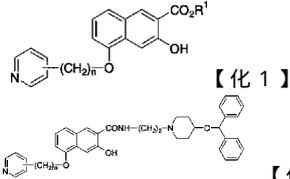
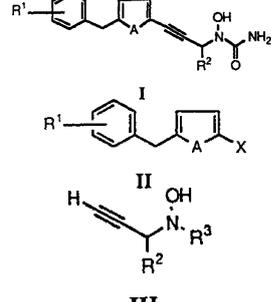
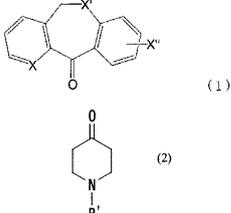
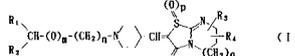
技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) / 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	(製造コスト低減化) 原体コストの低減化	工程簡略化	特許 3257348 95.06.05 C07D401/12 富士レビオ	2-ナフタミド誘導体の製造方法 下記【化1】で表されるナフトエ酸エステル誘導体と1-(2-アミノエチル)-4-ベンズヒドリルピペリジンとを反応させることによる下記【化2】で表される2-ナフタミド誘導体の製造方法。この方法は、工業的な製造法として有用である。 
			特許 3487858 93.11.05 C07D333/20 アポット LAB [被引用 1 回]	N-[4-[(置換フェニル)アルキルチエニル回]ー及びN-4-[(置換フェニル)アルキルフリル回]ープロト-3-イン-2-イル回]ーN-ヒドロキシ尿素化合物の製造方法 下記(II)の化合物を、下記(III)の化合物と Pd 触媒の存在下に結合することによる構造(I)の化合物の製法。構造(I)の化合物は、5-リボキシゲナーゼ阻害作用を有し、アレルギー性及び炎症性病状の治療に有用。 
			特許 3548133 01.05.18 C07D491/044 富士薬品	生理活性を有するピペリジリデン誘導体の製造方法 下記(1)のベンゾオキセピノ化合物と(2)のピペリジン-4-オン化合物から合成される抗アレルギー剤として有用なベンゾオキセピノ-11-ピペリジリデン化合物の新規な改良された製造方法。 
	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	化学伝達物質遊離抑制剤	特許 3647936 95.06.16 C07D513/04, 331 久光製薬	新規な縮合複素環化合物 下記(1)で表される新規な縮合複素環化合物およびその塩、並びにそれらの化合物を有効成分とする抗アレルギー剤および抗ヒスタミン剤。特にI型アレルギー反応およびIV型アレルギー反応を抑制する。 

表 2.23 主要企業等以外の特許番号一覧(5/15)

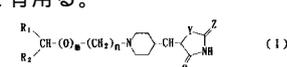
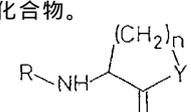
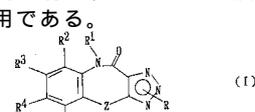
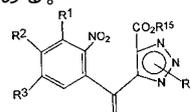
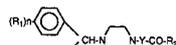
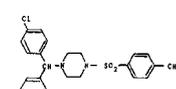
技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) / 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発(つづき)	化学伝達物質遊離抑制剤(つづき)	特許 3668291 95.06.16 C07D417/06 久光製薬	<p>新規なピペリジン誘導体 下記(1)で表わされるピペリジン誘導体およびその塩、並びにこれらを有効成分とする抗アレルギー剤および抗ヒスタミン剤。I型およびIV型アレルギー反応を抑制し広義の抗アレルギー剤として極めて有用。</p>  <p>(1)</p>
			特許 3434824 93.07.02 C07D307/33 ユニバーシティオブノッティンガム	<p>例えば N-(3-オキシヘキサノイル)ホモセリンラクトンのような免疫抑制剤及び抗アレルギー性化合物 マスト細胞及び / 又は好塩基球からのヒスタミン放出剤又は免疫抑制剤として用いるための下記(1)で示される化合物。</p> 
			特許 3290664 93.12.28 C07D487/04, 150 明治製菓 [被引用 1 回]	<p>3環性ベンゾアゼピンおよびベンゾチアゼピン誘導体 下記(1)で表わされる3環性ベンゾアゼピンならびにベンゾチアゼピン誘導体。この化合物は抗アレルギー作用を有し、アレルギー疾患の治療および予防に有用である。</p>  <p>(1)</p>
			特許 3537446 95.06.15 C07D487/04, 150 明治製菓 [被引用 1 回]	<p>三環性ベンゾアゼピン化合物 下記()で表わされる三環性ベンゾアゼピン化合物およびその塩。気管支喘息、湿疹、蕁麻疹、アレルギー性胃腸障害やアレルギー性鼻炎、アレルギー性結膜炎などの治療および予防に有用な抗アレルギー剤である。</p>  <p>(III)</p>
		ヒスタミン H1 拮抗剤	特許 3352184 93.11.12 C07D213/38 アズエル [被引用 1 回]	<p>ピペラジン不飽和脂肪酸誘導体 下記[1]で示される新規なピペラジン不飽和脂肪酸誘導体またはその薬理的に許容しうる塩およびその製造法ならびに当該化合物を有効成分として含有するアレルギー疾患治療剤。</p>  <p>[1]</p>
			特許 3267434 93.03.15 C07D295/22 ユーセーペー	<p>1-[(4-クロロフェニル)フェニルメチル]-4-[(4-メチルフェニル)スルホニル]ピペラジンの鏡像体およびその製造法 貴重な薬理活性、とりわけ抗ヒスタミン活性を有する光学純度の高い1,4-二置換ピペラジン誘導体下記[化1]およびその製造中間体を提供する。</p>  <p>[化1]</p>

表 2.23 主要企業等以外の特許番号一覧(6/15)

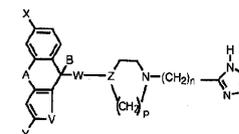
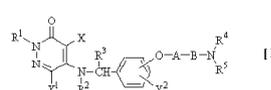
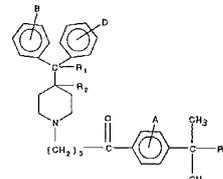
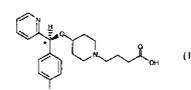
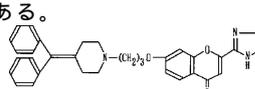
技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) / 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発(つづき)	ヒスタミン H1 拮抗剤(つづき)	特許 3338913 93.06.29 C07D257/04 大鵬薬品工業	<p>テトラゾール誘導体 下記で表される新規テトラゾール誘導体またはその薬理的に許容される塩、および当該化合物またはその薬理的に許容される塩を有効成分とする抗ヒスタミン剤、抗アレルギー剤および喘息治療剤。</p> 
			特許 3080131 93.06.29 C07D237/22 日産化学工業	<p>ピリダジノン誘導体 下記〔1〕で表される 3(2H) - ピリダジノン誘導体、及びその製法。呼吸器疾患、即時型アレルギー疾患、血栓性疾患等の予防又は治療剤として有用であり、とりわけ経口的にも優れた活性を示す。</p> 
			特許 3034047 93.06.24 C07D211/32 オールパニーモレキユラーリサーチ	<p>ピペリジン誘導体及びそれらの製造法 下記式で示される実質的に純粋なピペリジン誘導体化合物及びそのようなピペリジン誘導体の製造法。</p> 
			特許 3107784 96.12.26 C07D401/12 宇部興産、田辺製薬 [被引用 1 回]	<p>光学活性ピペリジン誘導体の酸付加塩及びその製法 下記(1)で示される、吸湿性が少なく、安定性に優れた、抗ヒスタミン活性及び抗アレルギー活性が優れている、(S) - 4 - [4 - [(4 - クロロフェニル) (2 - ピリジル) メトキシ] ピペリジン) ブタン酸のベンゼンスルホン酸塩及び安息香酸塩。</p> 
		ロイコトリエン拮抗剤	特許 3193508 93.03.05 C07D405/14 興和	<p>ピペリジン誘導体 下記(1)で表わされるピペリジン誘導体又はその塩、及びこれを有効成分とする医薬。本化合物は、優れた抗ヒスタミン作用及び抗ロイコトリエン作用を有し、喘息、アレルギー性鼻炎、アレルギー性皮膚炎、じん麻疹などの予防及び治療剤として有用である。</p> 

表 2.23 主要企業等以外の特許番号一覧(7/15)

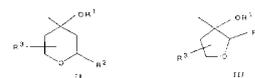
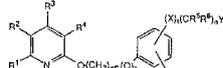
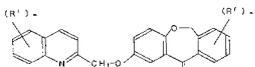
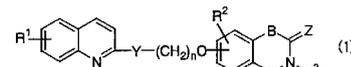
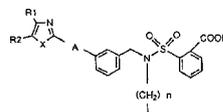
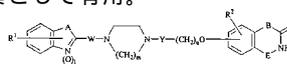
技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) / 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発(つづき)	ロイコトリエン拮抗剤(つづき)	特許 3553127 93.04.29 C07D405/12 シンジエンタ、アストラ PHARM	<p>エーテル誘導体、その製造方法およびロイコトリエンが介在する疾患または症状に使用するためのそれを含有する調剤学的組成物</p> <p>下記 I のエーテル誘導体またはその塩、その製造方法ならびにその調剤学的組成物。アラキドン酸の 5 - LO による接触酸化が関係する多様な炎症及び / 又はアレルギー性疾患の治療薬。</p> 
			特許 2866202 (権利消滅) 94.04.13 C07D213/64 エフホフマンラロシュント	<p>置換ピリジンロイコトリエン B 下 4 拮抗物質</p> <p>下記 (I) で示される化合物、及び光学異性体。強力なロイコトリエン B4 拮抗物質であり、乾癬、鼻炎、慢性閉塞性肺疾患、炎症性腸疾患、喘息、急性呼吸窮迫症候群、嚢胞性線維症、アレルギー、関節炎、皮膚炎、NSAID 誘発性胃炎、痛風、虚血 / 再灌流障害、及び外傷誘発性炎症等の治療に有用。</p> 
	複数の作用機序を持つ薬剤		特許 2936719 93.02.16 C07D405/12, 215 宇部興産 [被引用 2 回]	<p>キノリン誘導体</p> <p>下記 (I) で表わされるキノリン誘導体およびその塩。</p> 
			特許 3413109 97.09.25 C07D401/14 興和	<p>ピペリジン誘導体</p> <p>下記 (I) で表わされるピペリジン誘導体又はその塩、及びこれを含有する医薬。抗ヒスタミン作用と抗ロイコトリエン作用に優れ、かつ眠気等の副作用が少ない。</p> 
			特許 3527514 97.06.17 C07D215/14 科研製薬	<p>2-スルファモイル安息香酸誘導体</p> <p>ロイコトリエン D4 受容体拮抗作用とトロンボキサン A2 受容体拮抗作用を併せ持つ下記 (I) で表わされる 2 - スルファモイル安息香酸誘導体、その塩並びにそれを有効成分とする医薬、抗アレルギー剤。</p> 
			特許 3588126 97.07.07 C07D401/12 興和	<p>ジアミン誘導体及びこれを含有する医薬</p> <p>下記 (I) で表されるジアミン誘導体又はその塩。抗ロイコトリエン作用と抗ヒスタミン作用を併有するとともに脳内移行性が低く、喘息予防治療剤などの医薬として有用。</p> 

表 2.23 主要企業等以外の特許番号一覧(8/15)

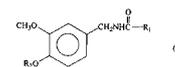
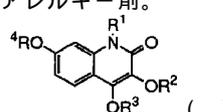
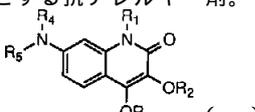
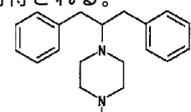
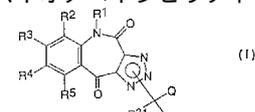
技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 複素環式(つつき)	既知作用点に対する薬剤開発 / 作用機作非特定	作用機序不明	特許 3568216 93.05.11 A61K31/165 小川香料	鼻炎治療薬 下記(1)で表されるカプサイシン誘導体を有効成分とする鼻炎治療薬。アレルギー性鼻炎および血管運動性鼻炎の予防 / 治療に有効で、薬効の持続時間が長く、鼻や喉の痛みや咽喉乾燥感などの副作用がない。  (1)
			特許 3677878 95.07.31 C07D215/22 大日本インキ化学工業 [被引用 1 回]	キノリノン誘導体及びそれを有効成分とする抗アレルギー剤 下記(1)で表されるキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩、並びに、それらを有効成分とする抗アレルギー剤。  ()
			特許 2943725 96.01.17 C07D215/38 大日本インキ化学工業 [被引用 4 回]	キノリノン誘導体及びそれを有効成分とする抗アレルギー剤 式(1)で表わされるキノリノン誘導体およびその塩を有効成分とする抗アレルギー剤。  ()
			特許 3284268 (権利消滅) 98.03.09 A61K31/495 参天製薬	抗アレルギー剤または鎮痛剤 下記[1]で表わされる化合物からなる抗アレルギー剤または鎮痛剤。特に 14 - ジフェニルプロピルピペラジン誘導体は、気管支喘息、アレルギー性鼻炎、アトピー性皮膚炎、蕁麻疹、アレルギー性眼性炎症等、また、疼痛等の治療剤として有用であることが期待される。  [1]
既知薬の修飾による薬剤開発	(プロドラッグ・活性代謝物)		特許 3188482 97.09.29 C07D487/04,150 明治製菓 [被引用 2 回]	三環性トリアゾロベンゾアゼピン誘導体およびその製造法並びに抗アレルギー剤 下記(1)で示される、プロドラッグ化された三環性トリアゾロベンゾアゼピン誘導体を提供する。本発明の化合物は抗アレルギー剤として有用であり、優れたバイオアベイラビリティーを示す。  (1)
新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発		その他細胞の機能調節に関わる薬剤	特許 3014367 97.08.18 C07D211/18 エフホフマンロシュونت [被引用 2 回]	CCR-3 受容体アンタゴニスト 好酸球が仲介する炎症性疾患の治療に有用である CCR - 3 アンタゴニストであって、望ましくない副作用を起こさずに好酸球関連疾患を治療する環式アミン誘導体である、下記(1)で示される化合物。

表 2.23 主要企業等以外の特許番号一覧(9/15)

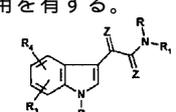
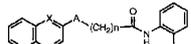
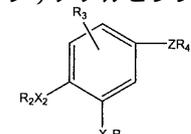
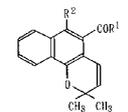
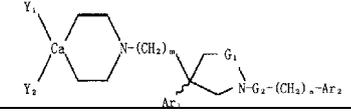
技術要素 技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) / 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発(つづき)	その他細胞の機能調節に関わる薬剤(つづき)	特許 3296437 96.09.06 C07D209/18 アスタメディカ	抗喘息、抗アレルギー及び免疫抑制/免疫調節作用を有する N-置換インドール-3-グリオキシルアミド 新規 N-置換インドール-3-グリオキシルアミド、その製法及びその薬剤学的使用。この下記の化合物は、抗喘息、抗アレルギー及び免疫抑制/免疫調節作用を有する。 
		IgE 抗体に関わる薬剤	特許 3265134 94.09.20 C07D215/12 帝人 [被引用 3 回]	含窒素二環性複素環誘導体およびこれを含有する医薬製剤 下記 [1] で示される含窒素二環性複素環誘導体またはその塩。新規な IgE 産生抑制作用を持つアレルギーおよび抗体産生抑制作用を特徴とする免疫疾患用剤である。 
	新規作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / PDE 4 に関する薬剤	特許 3056788 (権利消滅) 94.06.24 C07D231/38 ユーロセルティク [被引用 3 回]	ホスホジエステラーゼ IV の阻害化合物および阻害方法 ロリプラム(rolipram)と比べて同程度のまたは向上した PDE IV、PDE III 阻害作用を示す新規化合物。好ましい化合物は、3-(3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシベンジルアミノ)-4-ヒドロキシ(またはメトキシ)メチルピラゾールである。 
		炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 脂質メディエーターに関わる薬剤	特許 3586481 94.10.14 A61K31/352 花王	アラキドン酸代謝阻害剤 下記 (1) で表わされるモルギン又はその誘導体を有効成分とするアラキドン酸代謝阻害剤、抗アレルギー剤、及び抗炎症剤。優れたリポキシゲナーゼ及びシクロオキシゲナーゼ阻害作用を有する。 
		神経ペプチドに関わる薬剤 / タキキニンに関わる薬剤	特許 3424174 93.05.06 C07D401/06 メルレダウ PHARM [被引用 1 回]	タキキニン拮抗剤として有用な置換ピロリジン-3-イル-アルキル-ピペリジン類 下記で表される、置換ピロリジン-3-イルアルキルピペリジン類、それらの立体異性体類及びそれらの製造方法。本化合物は、タキキニン拮抗、特にサブスタンス P 及びニューロキニン A 拮抗剤等の薬理的な活性に於て有用である。 

表 2.23 主要企業等以外の特許番号一覧(10/15)

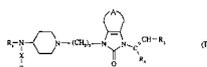
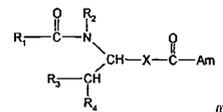
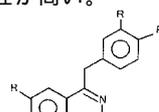
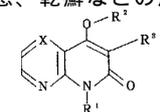
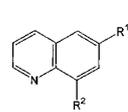
技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発/炎症系に作用(つづき)	神経ペプチドに関わる薬剤/その他の神経ペプチドに関わる薬剤	特許 3004574 94.10.21 C07D401/06 アディール	新規ピペリジン化合物、それらの製造法、およびそれらを含む製剤組成物 NK1 受容体に対して強力な拮抗薬特性を有する特異的リガンドの提供。下記(1)で示される化合物、その異性体、対応する第四級アンモニウム塩等、およびその製造方法ならびに当該化合物を含む、NK、受容体の拮抗薬として有用な製剤組成物。  (1)
			特許 3506714 95.02.22 C07C237/22 ノバルティス	1-アリール-2-アシルアミノ-エタン化合物およびニューロキニン特にニューロキニン 1 アンタゴニストとしてのそれらの用途 下記で示される 1-アリール-2-アシルアミノ-エタン化合物。NK1 アンタゴニストとして特に有効である。  (2)
		その他の新規作用メカニズムに関わる薬剤/	特許 3124041 (権利消滅) 96.08.30 A61K31/352 京都薬品工業	アレルギー性皮膚炎治療剤 L-リシルクロモグリク酸ジエチルエステル又はその非毒性塩を有効成分とする IV 型アレルギー反応が関与するアレルギー性皮膚炎治療剤。(図なし)
新規作用点に対する薬剤開発/免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤/PDE4 に関する薬剤		特許 3276762 93.12.28 A61K31/472 日本臓器製薬	イソキノリン誘導体を含む医薬組成物 下記で示されるイソキノリン誘導体は PDEIV に対して特異性の高い優れた阻害活性を有し、抗鬱剤、抗不安剤、抗痙攣剤、抗炎症剤、抗アレルギー剤、抗喘息剤、肝保護剤、利尿剤等の医薬として非常に有用性が高い。 
			特許 3406689 94.03.15 C07D471/04, 114 大塚製薬工場 [被引用 5 回]	ナフチリジン及びピリドピラジン誘導体 抗炎症作用、免疫調節作用、鎮痛作用、解熱作用、抗アレルギー作用、抗うつ作用等を有する、下記【化 1】で表されるナフチリジン及びピリドピラジン誘導体。慢性関節リウマチ、腎炎、中枢性疾患、喘息、乾癬などの治療及び予防に有用。  【化 1】
			特許 3564133 93.03.31 C07D215/06 シンテックスユーエスエイ [被引用 1 回]	IV 型ホスホジエステラーゼ阻害因子としてのキノリン類 PDE 阻害作用のある下記(1)で示されるキノリン類。抗炎症剤、免疫抑制剤、抗アレルギー剤(例えば、喘息、鼻炎およびアトピー性皮膚炎)、気管支拡張剤、抗自己免疫疾患剤、または鎮痛剤等として有用。  (1)

表 2.23 主要企業等以外の特許番号一覧(11/15)

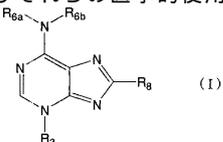
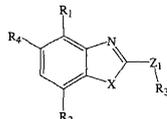
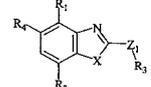
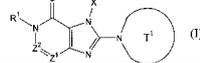
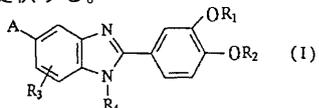
技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) / 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要	
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系・炎症系に作用する薬剤開発(つづき)	第二メッセンジャー過程の調節に関わる薬剤 / PDE4に関する薬剤(つづき)	特許 3350550 93.06.22 C07D473/34, 361 ユーロセルティク [被引用 3 回]	<p>PDE - IV 阻害活性を有する新規化合物 気管支又は気管の弛緩活性及び / 又は抗炎症活性を有する、下記()で表される新規なプリン誘導体及びそれらのイソグアニン及びジチオキサントニン前駆体化合物の製造方法、それらを含む医薬組成物、及びそれらの医学的使用に関する。</p> 	
			特許 3219412 94.10.12 C07D263/56 ユーロセルティク [被引用 1 回]	<p>新規ベンゾオキサゾール類 効果的な PDEIV 阻害剤である新規化合物。この化合物はテオフィリンまたはロリプラムと比較して、改善された PDEIV 阻害性を有し、例えば PDEIII 阻害に関して改善された選択性を有する。</p> 	
			特許 3520226 94.10.12 C07D263/56 ユーロセルティク [被引用 1 回]	<p>新規ベンゾオキサゾール類 下記[化1]で表される新規なベンゾオキサゾールまたはベンゾチアゾール誘導体。選択的に改善された PDEIV 阻害活性を有し、喘息、アレルギー、痴呆、およびサイトカイン類のレベルが異常に高い疾病の治療に有用。</p> 	
			特許 3504234 97.12.12 C07D473/34, 321 ユーロセルティク [被引用 1 回]	<p>ホスホジエステラーゼ IV 阻害活性を有するプリン誘導体 3-(3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシ-ベンジル)-6-エチルアミノ-8-(1-ヒドロキシ-1-メチル-エチル)3H-プリン等の PDE(IV) 阻害活性を有するプリン誘導体。(図なし)</p>	
			炎症における化学伝達物質に関わる薬剤 / 起炎症プロテアーゼに関わる薬剤	特許 3675813 02.06.06 C07D487/04, 144 エーザイ	<p>新規縮合イミダゾール誘導体 下記(1)で表される化合物またはその塩もしくは水和物。これらは優れた DPPIV 阻害作用を示す新規化合物である。</p> 
			複数の作用機序に関わる薬剤	特許 3271991 97.11.07 C07D403/04 大鵬薬品工業	<p>ベンズイミダゾール誘導体及びその薬学的に許容される塩 下記(1)で表わされる、IL-4 産生抑制作用及び PDE(IV)阻害作用の両作用を持つ化合物、その有効量と薬学的担体とを含む医薬組成物、急性及び慢性炎症疾患の治療又は予防剤並びに抗アレルギー剤又は抗炎症剤、並びに治療及び / 又は予防方法を提供する。</p> 

表 2.23 主要企業等以外の特許番号一覧(12/15)

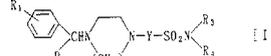
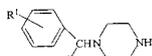
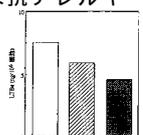
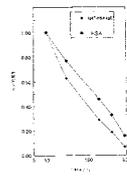
技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主 IPC 出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
合成医薬品 / 複素環式(つづき)	作用点非特定の薬剤開発	(作用点非特定の薬剤)	特許 3426242 94.01.14 C07D295/08 アズエル [被引用 1 回]	ジアザシクロアルカンアルキルスルホンアミド誘導体 下記 [I] で表されるジアザシクロアルカンアルキルスルホンアミド誘導体。抗アレルギー作用を有し、低毒性であり、気管支喘息、アレルギー性鼻炎、アトピー性皮膚炎、じん麻疹等の予防および治療剤として有用である。  [I]
			特許 3476475 97.06.04 C07D213/76 アズエル	ピペラジンスルホンアミド誘導体およびその塩の製造方法 下記 (I) で表される化合物と、式 (II) で表されるスルホンアミドとの反応により、ピペラジンスルホンアミド誘導体およびその塩を有利に製造する方法。  (I)  (II)
合成医薬品 / 非環式	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	IgE 抗体に関わる薬剤	特許 3051375 97.11.13 A61K31/20 リノール油脂	共役リノール酸を有効成分とする抗アレルギー剤 共役リノール酸を有効成分とする、副作用がなく、人体に無害な抗アレルギー剤。 
高分子医薬品 / 蛋白質医薬品			特許 3681402 96.07.26 C12N15/09, ZNA ノバルティス	IgE 結合ドメインおよび HSA 成分から成る融合ポリペプチドおよびその診断薬ならびに治療薬としての用途 ヒト血清アルブミン成分に融合した、IgE 結合ドメインを含む二量体融合ポリペプチドまたはその塩、その製造法。IgE 介在アレルギー性疾患、例えば、アトピー性皮膚炎、アトピー性喘息及び慢性蕁麻疹などの予防/治療用途を示唆する。 
ペプチド医薬品 /	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	化学伝達物質遊離抑制剤	特許 3651921 94.02.23 A61K31/70 三香堂	肥満細胞ヒスタミン遊離抑制剤 アミノ酸、ペプチドおよび蛋白質のうちのいずれかと還元糖との反応によって得られる、メラノイジンを有効成分とする肥満細胞ヒスタミン遊離抑制剤。(図なし)

表 2.23 主要企業等以外の特許番号一覧(13/15)

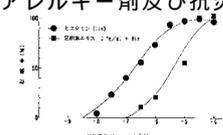
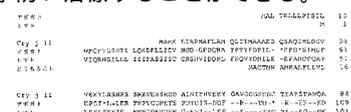
技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主IPC 出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
天然物医薬品 / 植物由来	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発(つづき)	化学伝達物質遊離抑制剤(つづき)	特許 3295165 93.03.10 A61K35/78 第一製薬 [被引用 3 回]	抗アレルギー剤 延胡索の極性溶媒抽出物を有効成分とする、副作用の少ない抗アレルギー剤及び抗炎症剤。 
			特許 3621483 95.12.01 A61K35/78 花王	ヒスタミン遊離抑制剤 カラスムギ抽出物を有効成分とするヒスタミン遊離抑制剤。ヒスタミン遊離抑制作用が強く、安全性も高い。(図なし)
	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	IgE 抗体に関わる薬剤	特許 3647895 94.06.10 A61K31/785 明治乳業	アレルギー性疾患予防及び治療剤 ポリガラクトツロン酸、その塩又はそのエステルを有効成分とするアレルギー性疾患予防及び治療剤。特に花粉症に対し抗原特異的で、安全に各種症状を予防 / 治療することができる。 
天然物医薬品 / 微生物由来	(製造コスト低減化) 原体コストの低減化	工程簡略化	特許 3602567 94.04.05 C12P1/06 積水化学工業	アレルギー性炎症抑制物質の製造方法 放線菌ストレプトマイセス・ノビリス (Streptomyces nobilis) の菌体を抽出処理することを特徴とするアレルギー性炎症抑制物質含有抽出物の製造方法。(図なし)
	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	ヒスタミン H1 拮抗剤	特許 3040744 (権利消滅) 97.08.20 A61K35/74 二子二子製薬 [被引用 1 回]	抗アレルギー剤およびその製造法 エンテロコッカス属の菌体を溶菌酵素処理および熱処理したものを有効成分とする副作用のない抗アレルギー剤で、アナフィラキシー反応を示すアレルギー症状、花粉症を抑制する。また、市販の抗アレルギー剤との併用も有効。(図なし)
		複数の作用機序を持つ薬剤	特許 3273948 96.03.12 C12P21/02 宝酒造	生理活性物質 TKR1785 類、製造方法及び微生物 下記(A)で表される新規な生理活性物質 TKR1785 類で、真菌感染症等の治療剤として有用な新規生理活性物質である。 $\text{H}_3\text{C}-(\text{CH}_2)_{12}-\underset{\text{OH}}{\text{CH}}-\text{CH}_2-\underset{\text{OH}}{\text{CH}}-\underset{\text{NH}_2}{\text{CH}}-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{NH}-\underset{\text{R}}{\text{CH}}-\text{CO}-\text{NH}-\underset{\text{CH}_2\text{OH}}{\text{CH}}-\text{CH}_2\text{OH}$ (A)
	既知作用点に対する薬剤開発 / 作用機序非特定	作用機序不明	特許 3665852 98.03.10 A61K31/702 日本甜菜製糖 [被引用 1 回]	抗アトピー性皮膚炎組成物 ラフィノースを有効成分とする抗アトピー性皮膚炎組成物。安全性においてもすぐれているため、本組成物は、乳幼児や長期間の投与にも十分に耐え得る。 

表 2.23 主要企業等以外の特許番号一覧(14/15)

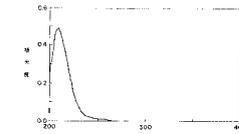
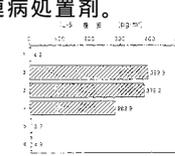
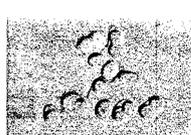
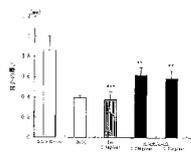
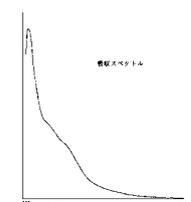
技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) / 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主IPC 出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
天然物医薬品 / 微生物由来(つづき)	新規作用点に対する薬剤開発 / 免疫系に作用する薬剤開発	細胞接着過程の調節に関わる薬剤	特許 3641013 95.05.30 C07G17/00 北里研究所	新規な細胞接着阻害剤マクロスフェライド A 及び B 並びにそれらの製造法 ミクロスフェロプシス属に属する微生物を培養することにより、細胞接着阻害作用を有するマクロスフェライド A 及び B を採取する。癌転移、あるいは関節炎などの慢性炎症や喘息、アレルギー疾患に対しての効果が期待される。 
		サイトカインに関わる薬剤 / 炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤	特許 2834583 95.03.08 A61K45/00 環境科学総合研究所	免疫関連病処置剤及びその探索方法 ヒト T 細胞においてサイトカインの少なくとも 1 種の産生を選択的に遺伝子転写レベルで抑制することが出来るマクロライド系抗生物質を有効成分とする免疫関連病処置剤。 
生薬	(易使用性)投与法の改善	組成の改良	特許 3471789 00.06.14 A61K35/78 福田光次	アレルギー疾患治療剤およびその製造方法 松科植物の新芽と、水と、糖質とを混合し、自然発酵させて得られるアレルギー疾患治療剤。短期間の服用で、副作用もなく、完治させることができ、特に喘息およびアトピー性皮膚炎の治療剤として有用。 
	既知作用点に対する薬剤開発 / 炎症系に作用する薬剤開発	化学伝達物質遊離抑制剤	特許 3192617 97.09.11 A61K35/78 北中進、漢方閣薬品	抗アレルギー剤 ちねんの抽出物を有効成分とし、有機溶媒または水抽出によって得られる抗アレルギー剤。 
		ロイコトリエン拮抗剤	特許 3623247 93.06.16 C07G3/00 伊藤園	茶葉サポニン類を含む薬剤 茶葉から、抽出、分離して取得される茶葉サポニン類を含む薬剤。抗炎症作用、ロイコトリエン拮抗作用を示し、溶血性を示さない等安全性が高く、炎症性疾患、アレルギー性疾患の治療と予防に有用。(図なし)
	既知作用点に対する薬剤開発 / 作用機序非特定	作用機序不明	特許 3561764 97.05.21 A61K35/78 田中雅也、日置正人 [被引用 1 回]	呼吸器系疾患治療薬 サルトリイバラあるいはその類縁植物を有効成分とする、各種の呼吸器系疾患、アレルギー性疾患、角化症及び癌性疼痛の予防又は治療薬を提供する。(図なし)

表 2.23 主要企業等以外の特許番号一覧(15/15)

技術要素 /	(課題)課題 / 課題	(解決手段) / 解決手段 / 解決手段	特許番号 (経過情報) 出願日 主IPC 出願人 [被引用回数]	発明の名称 概要
生薬(こつき)	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系に作用する薬剤開発	細胞接着過程の調節に関わる薬剤	特許 3323765 96.03.22 A61K35/78 花王	細胞接着抑制剤 アスナロ又はその抽出物を有効成分とする細胞接着抑制剤。細胞毒性が低く、優れた細胞接着抑制作用を有し、抗アレルギー剤、抗炎症剤、癌転移抑制剤、免疫抑制剤、慢性関節リウマチ及び/又は慢性関節炎、動脈硬化症予防治療剤として有用である。(図なし)
	新規作用点に対する薬剤開発/炎症系に作用する薬剤開発	神経ペプチドに関わる薬剤/その他の神経ペプチドに関わる薬剤	特許 3377997 93.12.27 A61K35/78 アサヒビール、中北薬品	サブスタンスP拮抗剤 紅景天またはその抽出エキスを有効成分として含有することを特徴とするサブスタンスP拮抗剤。喘息、アレルギー、炎症、疼痛等の改善に有効。(図なし)
	新規作用点に対する薬剤開発/免疫系・炎症系に作用する薬剤開発	サイトカインに関わる薬剤/炎症性細胞の活性化をもたらすサイトカインに関わる薬剤	特許 3494845 97.04.23 A61K35/78 ヤクルト本社 [被引用2回]	アレルギー性疾患予防・治療剤 インチンコウ (Artemisia capillaris Thunberg.) 又はその抽出物。IL-5及びIL-4の産生を抑制し、IFN- γ の産生を増強し、アレルギー性疾患を有効に予防・治療し、かつ副作用が少ない。 
		複数の作用機序に関わる薬剤	特許 3071669 95.07.04 A61K35/78 産業技術総合研究所、ホクレン農業協同組合連合会 [被引用1回]	抗アレルギー物質、その製造方法、抗アレルギー剤及び機能性食品 シソ植物中に含まれる抗アレルギー作用を有する物質を精製し、その成分を特定化し、その特定化された抗アレルギー物質及びその製造方法、並びに抗アレルギー剤及び機能性食品。抗アレルギー物質としてI多糖類、II、IIIポリフェノール類がある。 
その他の抗アレルギー剤	既知作用点に対する薬剤開発/炎症系に作用する薬剤開発	化学伝達物質遊離抑制剤	特許 2727441 93.03.19 A61K31/80, ABF 日本臓器製薬 [被引用1回]	抗アレルギー剤 生体機能調整作用を有するケイ酸ポリマーを有効成分として含有する物質。神経、免疫、内分泌系に作用して生体の機能を正常状態に修復する作用を有するため、抗アレルギー剤、抗炎症剤、末梢血流改善剤、異常知覚改善剤、鎮痛剤等の医薬又は基剤として有用である。(図なし)
	(適用拡大)	(新規適応範囲の特定)	特許 3247620 96.10.24 A61K33/00 小椋武	海洋ミネラル成分からなる治療及び/または予防剤 海水濃縮物から塩化ナトリウムおよび有毒成分を除去した残留物を有効成分とする、肝炎、高血圧、腫瘍(ガン)、アトピー性皮膚炎あるいは鼻炎などのアレルギーの治療剤及び/または予防剤。(図なし)

3. 主要企業の技術開発拠点

3.1 抗アレルギー剤の技術開発拠点

3. 主要企業の技術開発拠点

海外に開発拠点が集中している。

3.1 抗アレルギー剤の技術開発拠点

図 3.1 に、抗アレルギー剤の技術開発拠点の主要企業の技術開発拠点を示す。また、表 3.1 には、抗アレルギー剤の技術開発拠点を示す。

図 3.1 抗アレルギー剤の開発拠点

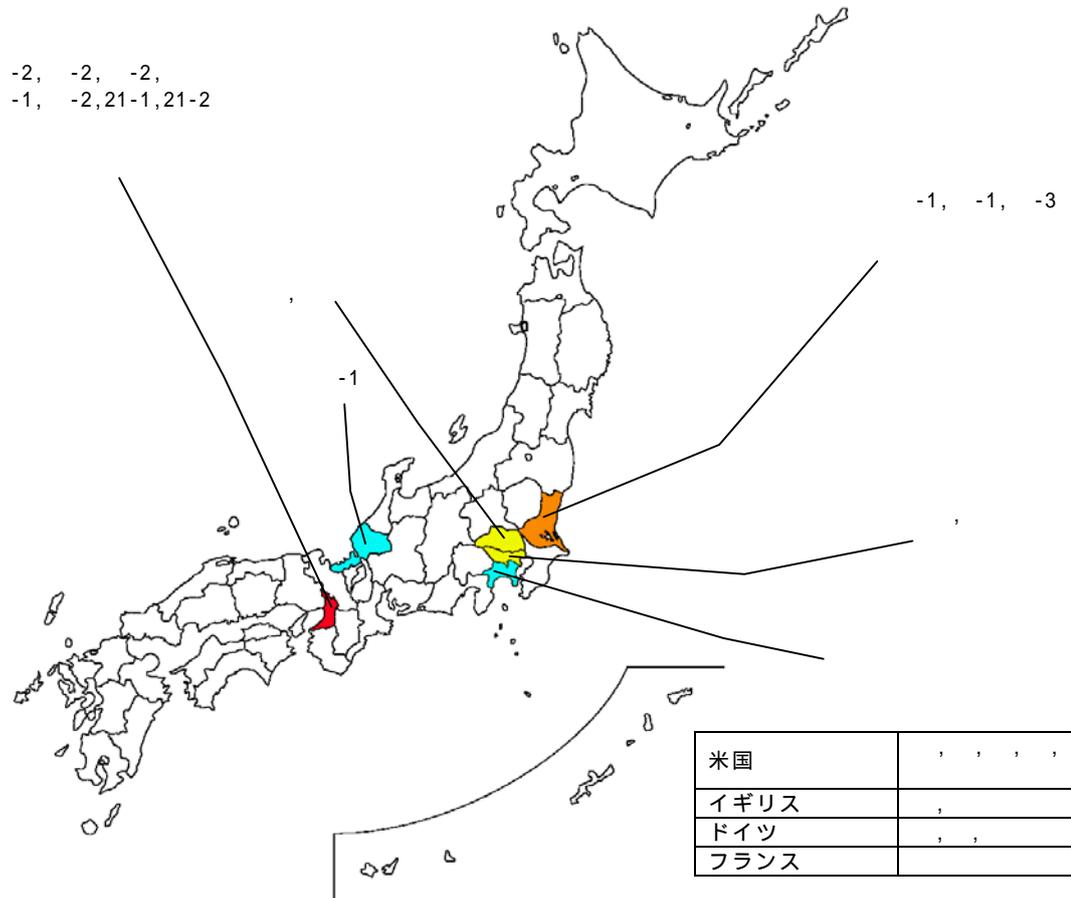


表 3.1 抗アレルギー剤の技術開発拠点

No.	企業名	住所
	ファイザー	米国
	グラクソ・スミスクライン	イギリス
	シェリング・プラウ	米国
-1 -2	武田薬品工業	茨城県つくば市和台 10 武田薬品工業株式会社 筑波地区研究部門 大阪府大阪市淀川区十三本町 2 - 17 - 85 武田薬品工業株式会社大阪工場地区研究部門
	アストラゼネカ	イギリス
	三共	東京都品川区広町 1-2-58 三共 研究開発センター
	大正製薬	埼玉県さいたま市北区吉野町 1 - 403 大正製薬 総合研究所
	サノフィ・ベンティス	フランス
	ベーリンガーインゲルハイム	ドイツ
	メルクアンドコー	米国
-1 -2	アステラス製薬	茨城県つくば市東光台 5 - 2 - 3、茨城県つくば市御幸が丘 21 アステラス製薬 探索研究所、発酵研究所、分子医学研究所 大阪府大阪市中央区道修町 3 - 4 - 7 アステラス製薬 創薬推進研究所、薬理研究所、化学研究所
	協和醗酵工業	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
-1 -2 -3	小野薬品工業	福井県坂井郡三国町山岸テクノポート 1 - 5 - 2 小野薬品工業 福井研究所 大阪府三島郡島本町桜井 3 丁目 1 - 1 小野薬品工業 水無瀬研究所 茨城県つくば市和台 17 番の 2 小野薬品工業 筑波研究所
-1	三菱ウェルファーマ	神奈川県横浜市青葉区鴨志田町 1000 三菱ウェルファーマ 総合研究所
	ジョンソン・エンド・ジョンソン	米国
	バイエル	ドイツ
	メルク	ドイツ
-1 -2	大日本住友製薬	大阪府吹田市江の木町 33-94 大日本住友製薬 総合研究所、 大阪府大阪市中央区道修町 2 - 6 - 8 大日本住友製薬 大阪研究所
	日研化学	埼玉県さいたま市大宮区北袋町一丁目 346 番地 日研化学 医薬品研究所
	イーライリリーアンドカンパニー	米国
21 -1 -2	塩野義製薬	大阪市福島区鷺州 5 丁目 12 番 4 号 塩野義製薬 中央研究所 新薬研究所：豊中市二葉町 3 丁目 1 番 1 号（新薬研究所）

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

抗アレルギー剤のライセンス提供の用意のある特許について、特許流通データベース¹により検索した結果を以下に示す。

検索キーワードは「抗アレルギー OR 抗ヒスタミン」²で行い、その中から抗アレルギー剤に関連する特許を選択した。

¹ (独立行政法人工業所有権情報・研修館のホームページにて無料で提供、
URL : <http://www.ryutu.ncipi.go.jp/PDDB/Service/PDDBService>)

² 同義語・異表記展開を指定する：カタカナ、アルファベット、全角・半角、同義語

ライセンス提供の用意のある特許

(2005年12月20日現在)

	表示特許番号	出願人・権利者名	発明・考案の名称	技術要素
1	特許 2920151	伊藤園	抗アレルギー剤	生薬
2	特許 3023962	伊藤園	抗アレルギー剤	
3	特許 2829368	工業技術院長	ジヒドロ葉酸還元酵素 抗アレルギー性ペントペプチド融合タンパク質	高分子医薬品
4	特許 3007919	工業技術院長	ジヒドロ葉酸還元酵素 抗アレルギー性ペントペプチド多量体の融合タンパク質	
5	特許 3012908	工業技術院長	ジヒドロ葉酸還元酵素 抗アレルギー性ペントペプチド多量体の融合タンパク質)	
6	特許 3193998	工業技術院長	ジヒドロ葉酸還元酵素 抗アレルギー性ペントペプチド多量体の融合タンパク質	
7	特許 2769996	工業技術院長	チオトロポシンの製造方法および用途	天然物医薬品
8	特許 2890039	工業技術院長	抗微生物剤	
9	特許 3066488	工業技術院長	抗アレルギー剤	
10	特許 3066484	工業技術院長	抗アレルギー剤および抗炎症剤	生薬
11	特許 3355367	産業技術総合研究所	魚病抗菌剤	天然物医薬品
12	特許 3281919	産業技術総合研究所	肥満細胞脱顆粒阻害剤	生薬
13	特許 3092827	資生堂	アルケンアミド誘導体及びそのアルケンアミド誘導体を用いた抗アレルギー剤、アルケン酸、そのアルケン酸の製造方法	合成医薬品
14	特許 3694733	農業生物系特定産業技術研究機構	抗アレルギー剤	合成医薬品
15	特開 2004-123679	科学技術振興機構	好酸球カチオン性タンパク質を含有する組成物	高分子薬品
16	特開 2002-265463	日本大学	新規なオルシノール誘導体及びこれを用いた組成物、抗アレルギー剤	天然物医薬品
17	特開 2003-277276	日本大学	ベニカミキリフラスを有効成分とする皮膚外用薬	
18	特開 2003-55369	日本大学	新規なフロログルシノール誘導体、及びこれを用いた組成物、抗アレルギー剤	
19	特開 2003-73265	日本大学	フロログルシノール誘導体を用いた抗アレルギー剤及び抗炎症剤	
20	特開 2003-73392	日本大学	新規なケイヒ酸誘導体並びにこれを用いた組成物、抗アレルギー剤及び抗炎症剤	
21	特開 2003-61617	日本大学	抗アレルギー作用を有する健康食品	生薬

特許流通支援チャート 化学 30

抗アレルギー剤

2006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 c
〒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。