



CHANYE ZHUANLI
FENXI BAOGAO

产业专利分析报告

(第41册) —— 糖尿病药物

杨铁军◎主编



知识产权出版社

全国百佳图书出版单位

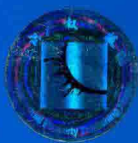


责任编辑◇卢海鹰 胡文彬 封面设计◇张 冀

CHANYE ZHUANLI
FENXI BAOGAO

产业专利分析报告

(第41册)



上架建议：知识产权
新浪微博：@知识产权编辑室

ISBN 978-7-5130-4238-3



定价：70.00元

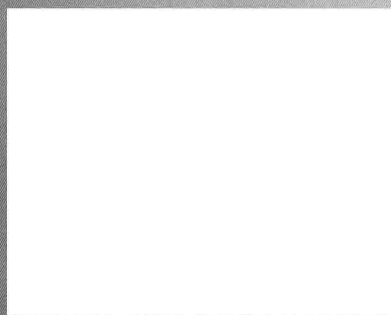


CHANYE ZHUANLI
FENXI BAOGAO

产业专利分析报告

(第41册) —— 糖尿病药物

杨铁军◎主编



知识产权出版社

全国百佳图书出版单位

图书在版编目 (CIP) 数据

产业专利分析报告. 第 41 册, 糖尿病药物/杨铁军主编. —北京: 知识产权出版社, 2016. 6
ISBN 978-7-5130-4238-3

I. ①产… II. ①杨… III. ①糖尿病—药物—专利—研究报告—世界 IV. ①G306.71②R977.1
中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2016) 第 137421 号

内容提要

本书是糖尿病药物行业的专利分析报告。报告从该行业的专利 (国内、国外) 申请、授权、申请人的已有专利状态、其他先进国家的专利状况、同领域领先企业的专利壁垒等方面入手, 充分结合相关数据, 展开分析, 并得出分析结果。本书是了解该行业技术发展现状并预测未来走向, 帮助企业做好专利预警的必备工具书。

责任编辑: 卢海鹰 胡文彬

责任校对: 韩秀天

内文设计: 王祝兰 胡文彬

责任出版: 刘译文

产业专利分析报告 (第 41 册)

——糖尿病药物

杨铁军 主编

出版发行: 知识产权出版社有限责任公司

网 址: <http://www.ipph.cn>

社 址: 北京市海淀区西外太平庄 55 号

邮 编: 100081

责编电话: 010-82000860 转 8031

责编邮箱: huwenbin@cnipr.com

发行电话: 010-82000860 转 8101/8102

发行传真: 010-82000893/82005070/82000270

印 刷: 北京嘉恒彩色印刷有限责任公司

经 销: 各大网上书店、新华书店及相关专业书店

开 本: 787mm×1092mm 1/16

印 张: 18.25

版 次: 2016 年 6 月第 1 版

印 次: 2016 年 6 月第 1 次印刷

字 数: 390 千字

定 价: 70.00 元

ISBN 978-7-5130-4238-3

出版权专有 侵权必究

如有印装质量问题, 本社负责调换。

编委会

主任：杨铁军

副主任：郑慧芬 冯小兵

编委：孟俊娥 曾武宗 张伟波 闫娜

曲淑君 唐跃强 张小凤 褚战星

序

知识产权制度作为激励创新的基本保障，将在供给侧结构性改革中发挥越来越重要的作用，加强知识产权保护和运用是“十三五”的重中之重。专利分析作为专利运用的基础，是实现专利价值、发挥创新引领作用的有效方式。

国家知识产权局“专利分析普及推广项目”在“十二五”期间完成了48项产业专利分析研究，在专利与技术、专利与市场、专利与企业发展等方面不断对分析方法作出有益的尝试，形成了一套科学、规范的专利分析方法。《产业专利分析报告》丛书的出版受到了社会各界的欢迎，对相关产业的发展起到了推动作用。

在“十三五”开局之年，《产业专利分析报告》（第39~48册），着眼于成果的实际应用效果，致力于解决迫切的产业需求，适度预测技术发展，精心为广大读者奉献了项目的最新研究成果。衷心希望《产业专利分析报告》丛书的相继出版，可以促进广大企业专利运用水平的提升，为“大众创业、万众创新”和加快实施创新驱动发展战略提供有益的支撑。

杨铁军

前 言

“十二五”期间，“专利分析普及推广项目”每年选择若干行业开展专利分析研究，推广专利分析成果，普及专利分析方法。《产业专利分析报告》（第1~38册）自出版以来，受到各行业广大读者的广泛欢迎，有力推动了各产业的技术创新和转型升级。

2015年度“专利分析普及推广项目”继续秉承“源于产业、依靠产业、推动产业”的工作原则，兼顾“大众创业、万众创新”背景下课题成果的普惠性，在综合考虑来自行业主管部门、行业协会、创新主体的众多需求后，最终选定了10个产业开展专利分析研究工作。这10个产业包括风力发电机组、高端通用芯片、糖尿病药物、高性能子午线轮胎、碳纤维复合材料、石墨烯电池、高性能汽车涂料、新型传感器、基因测序技术以及高速动车组和高铁安全监控技术，均属于我国科技创新和经济转型的核心产业。近一年来，约150名专利审查员参与课题研究，历时6个月，对10个产业进行深入分析，几经易稿，形成了10份内容实、质量高、特色多、紧扣行业需求的专利分析报告，共计400多万字、两千余幅图表。

2015年度的《产业专利分析报告》在加强方法创新的基础上，进一步深化了申请人合作、专利运营、外观设计、产品专利、技术路线、技术差异等多个方面的研究，并在课题研究中得到了充分的应用和验证。例如，高性能子午线轮胎课题组通过研究发现了美国和日本申请人互相要求专利优先权达成联盟的新方式；新型传感器课题组在初创企业利用专利成长的路径方面作出了尝试；碳纤维复合材料课题组对宝马i3进行了产品专利剖析，找出了国内企业可借鉴专利和风险专利；

高速动车组和高铁安全监控技术课题组找出了我国与其他高铁强国的专利技术差异。

2015年度“专利分析普及推广项目”的研究得到了社会各界的广泛关注和大力支持。例如，中国工程院院士杜善义先生、中国铁道科学研究院首席研究员黄强先生、中国电子企业协会会长董云庭先生等专家多次参与课题评审和指导工作，对课题成果给予较高评价。来自社会各界的近百名行业和技术专家多次指导课题工作，为课题顺利开展作出了贡献。课题研究也得到了工业和信息化部相关领导的重视，特别是工业和信息化部原材料工业司副司长潘爱华先生和科技司基础技术处副处长阮汝祥先生多次亲临指导。《产业专利分析报告》（第39~48册）凝聚社会各界智慧，旨在服务产业发展。希望各地方政府、各相关行业、相关企业以及科研院所能够充分发掘专利分析报告的应用价值，为专利信息利用提供工作指引，为行业政策研究提供有益参考，为行业技术创新提供有效支撑。

由于报告中专利文献的数据采集范围和专利分析工具的限制，加之研究人员水平有限，报告的数据、结论和建议仅供社会各界借鉴研究。

《产业专利分析报告》丛书编委会

2016年5月

项目联系人

褚战星：62084456/18612188384/chuzhanxing@sipo.gov.cn

糖尿病药物行业专利分析课题研究团队

一、项目指导

国家知识产权局：杨铁军 张茂于 郑慧芬 毕 因 韩秀成

二、项目管理

国家知识产权局专利局：冯小兵 张小凤 褚战星 冯 璐 杨海洋

三、课题组

承担部门：国家知识产权局专利局医药生物发明审查部

课题负责人：曾武宗

课题组组长：陈 矛

课题组成员：王 茨 田晓明 韦 轶 黄 嘉 陶可鑫 张 弛
肖 晶 郭 洁 王 冬 尹俊亭 陈 蕾 李肖蕖

四、研究分工

数据检索：陶可鑫 肖 晶 陈 蕾 郭 洁 田晓明 张 弛

数据清理：陶可鑫 陈 蕾 郭 洁 李肖蕖 肖 晶

数据标引：陶可鑫 田晓明 陈 矛 陈 蕾 黄 嘉 王 茨
郭 洁 尹俊亭 李肖蕖 肖 晶

图表制作：陶可鑫 陈 蕾 田晓明 黄 嘉 尹俊亭 郭 洁
张 弛 肖 晶

报告执笔：田晓明 韦 轶 张 弛 李肖蕖 黄 嘉 郭 洁
尹俊亭 王 茨

报告统稿：陈 矛 王 茨

报告编辑：陈 矛 王 茨 田晓明 张 弛

报告审校：曾武宗

五、报告撰稿

韦 轶：主要执笔第1章第1.1~1.3.1节、第1.3.3~1.3.4节，第2章第2.1.1~2.1.2节、第2.2节，参与执笔第2章第2.1.3节、第5章第5.5.2节

陶可鑫：主要执笔第2章第2.1.3节、第2.3节

张 弛：主要执笔第3章第3.1节，参与执笔第3章第3.2节

李肖蕖：主要执笔第3章第3.2.1.1~3.2.1.4节，第3.2.2~3.2.4节

- 肖晶**: 主要执笔第3章第3.2.1.5节、第3.2.5节
- 郭洁**: 主要执笔第4章第4.2~4.3节、第4.4.1~4.4.3节
- 王荧**: 主要执笔第4章第4.1节、第4.5节、第4.6节, 参与执笔第1章第1.2节、第4章第4.4节、第7章
- 田晓明**: 主要执笔第5章第5.1~5.2节、第5.5.1节、第5.6节, 参与执笔第1章第1.2节, 第5章第5.3节、第5.4.2节
- 陈蕾**: 主要执笔第1章第1.3.2节, 第5章第5.3.1~5.3.2节、第5.3.4~5.3.5节
- 黄嘉**: 主要执笔第5章第5.3.3节和第5.4.1节, 参与执笔第3章和第6章
- 尹俊亭**: 主要执笔第4章第4.4.4~4.4.6节、第4.5.2节, 第5章第5.3.6节
- 王冬**: 主要执笔第6章
- 陈矛**: 主要执笔第7章, 第5章第5.4.2节、第5.5.2节

六、指导专家

技术专家 (按姓氏拼音排序)

靳广毅 深圳大学医学院肿瘤研究中心

吕忠显 厦门大学药学院

李良成 厦门大学药学院

专利分析专家

褚战星 国家知识产权局专利局审查业务管理部

杨轶 国家知识产权局专利局化学发明审查部

七、合作单位 (排名不分先后)

甘李药业股份有限公司、深圳翰宇药业股份有限公司、深圳信立泰药业股份有限公司、海南皇隆制药股份有限公司、深圳大学、厦门大学、中国科学院上海药物研究所、上海市第一人民医院

目 录

- 第1章 研究概况 / 1
 - 1.1 立题背景及研究目的 / 1
 - 1.1.1 立题背景 / 1
 - 1.1.2 研究目的 / 3
 - 1.2 糖尿病及糖尿病药物的行业发展状况 / 3
 - 1.2.1 糖尿病的研究现状 / 3
 - 1.2.2 治疗糖尿病药物的研究现状 / 4
 - 1.2.3 热点糖尿病药物研究现状 / 5
 - 1.2.4 其他种类的糖尿病药物 / 15
 - 1.2.5 治疗糖尿病药物新靶点 / 19
 - 1.3 研究对象和方法 / 20
 - 1.3.1 技术分解 / 20
 - 1.3.2 数据检索 / 22
 - 1.3.3 数据处理 / 23
 - 1.3.4 相关事项和约定 / 23
- 第2章 糖尿病药物专利概览 / 25
 - 2.1 全球专利分析 / 25
 - 2.1.1 发展趋势分析 / 25
 - 2.1.2 国家或地区分布分析 / 27
 - 2.1.3 主要申请人分析 / 29
 - 2.2 中国专利申请分析 / 34
 - 2.2.1 发展趋势分析 / 35
 - 2.2.2 区域分布分析 / 36
 - 2.2.3 法律状态分析 / 37
 - 2.2.4 国内主要申请人分析 / 39
 - 2.3 小 结 / 44
- 第3章 胰岛素类药物专利分析 / 46
 - 3.1 专利申请概览 / 46

	3.1.1	发展态势 / 46
	3.1.2	已上市类似物 / 49
	3.1.3	主要申请人 / 52
	3.1.4	地区分布 / 53
	3.1.5	中国专利申请 / 55
	3.2	甘精胰岛素 / 56
	3.2.1	总体发展趋势 / 57
	3.2.2	原研药企 / 64
	3.2.3	勃林格殷格翰 & 礼来联盟 / 79
	3.2.4	印度仿制商 / 80
	3.2.5	中国申请人 / 83
第4章		DPP-IV抑制剂专利分析 / 94
	4.1	DPP-IV抑制剂的重点药物情况 / 94
	4.1.1	西格列汀 / 95
	4.1.2	利格列汀 / 96
	4.1.3	阿格列汀 / 97
	4.2	DPP-IV抑制剂全球专利分析 / 98
	4.2.1	发展趋势分析 / 98
	4.2.2	专利产出与输入分布 / 99
	4.2.3	主要申请人分析 / 102
	4.3	DPP-IV抑制剂中国专利分析 / 102
	4.3.1	发展趋势分析 / 102
	4.3.2	申请区域分布 / 103
	4.3.3	主要申请人 / 103
	4.4	超长效DPP-IV抑制剂——曲格列汀 / 105
	4.4.1	曲格列汀概述 / 105
	4.4.2	全球专利分析 / 108
	4.4.3	中国专利总体分析 / 112
	4.4.4	武田制药策略研究 / 119
	4.4.5	曲格列汀技术发展 / 124
	4.4.6	SWOT分析 / 131
	4.5	DPP-IV抑制剂专利保护之路 / 132
	4.5.1	直面专利悬崖的机遇与挑战 / 132
	4.5.2	国内DPP-IV抑制剂创新药的发展 / 135
	4.6	小结 / 138
第5章		GLP-1受体激动剂专利分析 / 140
	5.1	GLP-1受体激动剂全球专利态势 / 140

- 5.1.1 发展趋势 / 140
 - 5.1.2 技术来源国家/区域分布 / 141
 - 5.1.3 主要申请人 / 143
 - 5.2 GLP-1 受体激动剂中国专利态势 / 143
 - 5.2.1 发展趋势 / 144
 - 5.2.2 申请人来源分布 / 144
 - 5.2.3 主要申请人 / 146
 - 5.2.4 法律状态 / 147
 - 5.3 毒蜥外泌肽-4 类药物 / 147
 - 5.3.1 艾塞那肽全球专利态势 / 154
 - 5.3.2 艾塞那肽中国专利态势 / 157
 - 5.3.3 艾塞那肽制剂技术分析 / 160
 - 5.3.4 艾塞那肽融合蛋白技术分析 / 166
 - 5.3.5 艾塞那肽 PEG 修饰技术分析 / 177
 - 5.3.6 艾塞那肽的模拟肽——利司那肽 / 181
 - 5.3.7 小 结 / 189
 - 5.4 脂肪链修饰的 GLP-1 类药物 / 190
 - 5.4.1 利拉鲁肽 / 190
 - 5.4.2 索马鲁肽 / 197
 - 5.5 GLP-1 融合蛋白类药物 / 208
 - 5.5.1 阿必鲁肽 / 208
 - 5.5.2 杜拉鲁肽 / 215
 - 5.6 GLP-1 受体激动剂领域的专利挑战之路 / 222
- 第 6 章 侵权纠纷 / 224
- 6.1 武田制药的无效诉讼战 / 224
 - 6.1.1 案件回顾 / 225
 - 6.1.2 案件焦点 / 227
 - 6.1.3 案件启示 / 229
 - 6.2 礼来的多方诉讼战 / 230
 - 6.2.1 礼来 vs 甘李药业侵权诉讼 / 230
 - 6.2.2 礼来 vs 甘李药业专利无效案 / 233
 - 6.2.3 案件启示 / 241
 - 6.3 赛诺菲的专利保卫战 / 242
 - 6.3.1 案件回顾 / 242
 - 6.3.2 案件焦点 / 242
 - 6.3.3 案件启示 / 247

6.4	小 结 / 248
第7章	建 议 / 249
7.1	仿创结合 / 249
7.2	广开智源 / 249
7.3	强强联盟 / 250
7.4	知识产权开路护航 / 250
附 录	/ 252
图索引	/ 260
表索引	/ 264

第1章 研究概况

1.1 立题背景及研究目的

1.1.1 立题背景

随着全球经济的快速发展,工业化、城市化进程的不断推进,人们的饮食呈现出高热量和高钠化的趋势,与之相对的是人们的体力活动越来越少,这种生活方式的改变导致糖尿病患者群日益增大,使得糖尿病成为严重危害人类健康的慢性非传染性疾病。

国际糖尿病联盟(IDF)于2013年11月14日发布的第6版“IDF糖尿病地图”中的最新统计显示,2013年全球糖尿病患病患者数已达3.82亿,其中在20~79岁人群中的患病率为8.3%;估计到2035年,全球将有5.92亿人患糖尿病。2013年,全球共有510万人死于与糖尿病相关的疾病,占有所有死亡人数的8.4%。而在对各个国家和地区的发病率的估计中,中国2013年糖尿病的患病人数为9840万,居全球首位。据IDF估计,到2035年,这一数字将增加到1.43亿^①。

除了总患者数已跃居全球首位外,中国糖尿病患病率的增长也非常迅猛。1980年,我国糖尿病患病率低于1%,1994年为2.5%,2000~2001年为5.5%,2007年则激增到9.7%。2010年,上海交通大学医学院附属瑞金医院、上海市内分泌代谢病研究所与中国疾病预防控制中心慢性非传染性疾病预防控制中心合作展开了采用HbA_{1c}(糖化血红蛋白)作为诊断糖尿病标准之一的新标准的专题调查,结果表明,中国成人糖尿病患病率为11.6%,男性和女性分别为12.1%和11.0%,既往已确诊糖尿病患病率为3.5%,新诊断糖尿病患病率为8.1%。此外,糖尿病前期患病率为50.1%,男性和女性分别为52.1%和48.1%。老年人、城市居民和生活在经济发达地区的居民糖尿病患病率较高。在所有糖尿病患者中,25.8%的患者已接受或正在接受降糖药物治疗;在接受药物治疗的糖尿病患者中,39.7%的患者血糖控制良好。由上述诊断标准所得患病率数据推测,中国目前可能有多达1.139亿成人糖尿病患者,4.934亿糖尿病前期人群(血糖代谢异常但尚未达到糖尿病诊断标准的高危人群),这是发展为显性糖尿病和心血管疾病的重要危险因素。^②

① Nam Han Cho, 等. 国际糖尿病联盟(IDF)糖尿病地图[M]. 6版. 纪立农, 周翔海, 张秀英, 译. 国际糖尿病联盟, 2013.

② Yu Xu, 等. Prevalence and Control of Diabetes in Chinese Adults [J]. JAMA, 2013, 310 (9): 948-959.

糖尿病的慢性高血糖状态与长期并发症显著相关,即众多器官,特别是肾脏、眼、神经、心脏和血管等的损害、功能障碍和功能衰竭。据世界卫生组织统计,糖尿病患者中合并神经病变,造成末梢神经麻木或疼痛的占 90%;合并高血压的占 80%;合并性功能障碍的占 66%;合并肾脏病变,造成尿毒症的占 50%;合并四肢病变造成坏疽的占 50%,有的甚至导致截肢等严重后果;合并视网膜病变,造成失明、白内障的占 36%;合并心血管病变,造成心肌梗死或死亡的占 36%;合并呼吸系统感染的占 15%;妊娠期间高血糖会增加新生儿畸形、巨大儿和新生儿低血糖发生的危险。

随着患者数的不断增多,一方面给糖尿病患者及其家庭带来了沉重的经济压力,另一方面也造就了一个包括食品、药品、医疗服务、并发症处理、健康管理和日常监测的巨大产业。据 IDF 的相关统计,2013 年全球与糖尿病相关的医疗花费达 5480 亿美元,占全球医疗支出的 11%;预计到 2035 年,与糖尿病相关的全球医疗花费将高达 6270 亿美元。^① 据 IMS Health 统计,仅 2012 年全球糖尿病的药品市场规模就达到 424 亿美元,而且每年平均增长率约为 8.2%,在全球药品市场份额中排第四位。我国糖尿病药品市场规模同样发展迅速。据统计,2010 年因糖尿病的医疗花费达到 1734 亿元人民币,超过全国医疗花费的 13%,病程超过 10 年的患者的医疗费用更是占到家庭收入的 22% 以上。^② 截至 2013 年,我国糖尿病药品市场规模达 173.77 亿元人民币;预计到 2018 年,我国糖尿病药品市场的规模将接近 300 亿元人民币,增速要大大高于全球平均水平(见图 1-1-1)^③。

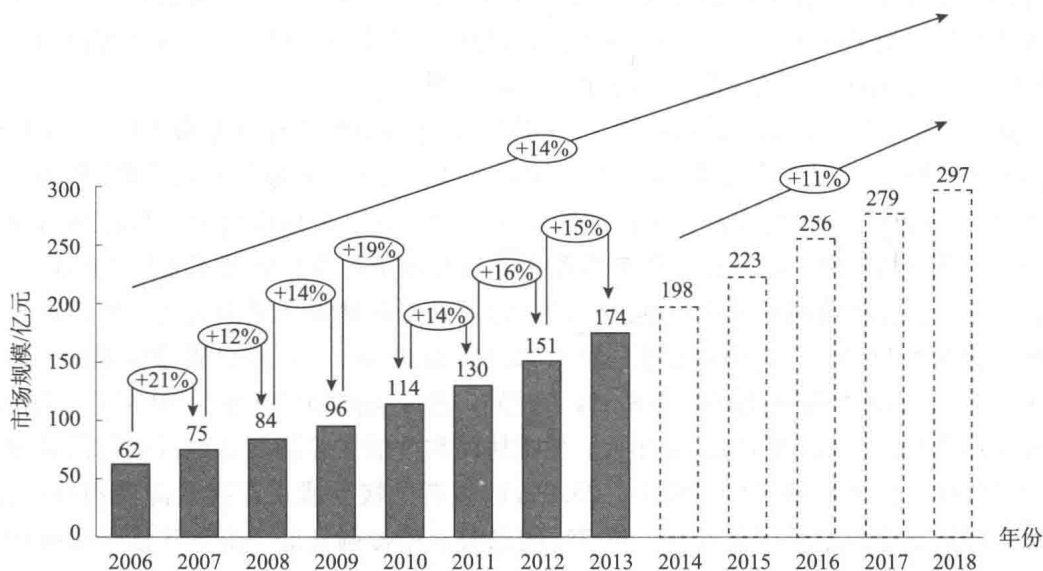


图 1-1-1 我国糖尿病用药市场规模预测

① 深圳市科技创新委员会. 深圳市糖尿病研究报告 [R]. 深圳市科技创新委员会, 2014.

② 徐瑜, 毕宇芳, 王卫庆, 等. 中国成人糖尿病流行与控制现状: 2010 年中国慢病监测暨糖尿病专题调查报告解读 [J]. 中华内分泌代谢杂志, 2014, 30 (3): 184-186.

③ 深圳市科技创新委员会. 深圳市糖尿病研究报告 [R]. 深圳市科技创新委员会, 2014.

我国政府对糖尿病非常重视,在原卫生部、发改委、教育部等联合颁布的《中国慢性病防治工作规划(2012~2015年)》中提出,拟投入300亿元人民币进行全国性慢性病防治工作,糖尿病是其中最重要的一项。在国务院2012年颁布的《“十二五”国家战略性新兴产业发展规划》中也指出“加快实施重大新药创制、艾滋病和病毒性肝炎等重大传染病防治科技重大专项,研发防治恶性肿瘤、心脑血管疾病、糖尿病等重大疾病的创新药物,开展新药安全评价和新药临床研究。”

1.1.2 研究目的

糖尿病患者和潜在患者人群的迅速增长,意味着巨大的市场。虽然糖尿病药物历史悠久、市场成熟,外资龙头企业在传统药物领域早已具有庞大的专利数量,但是新靶点、新机理的发现对于任何医药企业来说都具有足够的诱惑,糖尿病药物领域仍然具有足够的发展空间。面对如此庞大的糖尿病药物家族,对于我国企业来说,如何针对具体的药品进行研发和专利布局,是产业最为关心的问题,也是本书的研究重点。

本书针对糖尿病药物行业的相关专利数据进行系统深入的分析,展现了治疗糖尿病药物领域的专利申请发展态势,总结重要专利申请人的专利技术分布,选取了治疗糖尿病药物中的重点和热点品种进行了深入的研究和分析。希望这些数据和专利信息能够为国内相关企业和科研院所提供数据支持,帮助它们及时把握技术发展趋势,及时调整研发创新方向,获得更高的研究起点,并在专利保护策略的制定、知识产权的运用和管理等方面发挥积极作用。

同时,还希望能够通过该书对专利分析的开展和应用起到推广普及的作用,引导行业特别是行业内的企业开展专利分析和预警,避免重复研究、重复投入,减少专利风险,促进治疗糖尿病药物领域的技术创新。

1.2 糖尿病及糖尿病药物的行业发展状况

1.2.1 糖尿病的研究现状

糖尿病主要类型有:I型糖尿病、II型糖尿病、妊娠期糖尿病,以及其他特殊类型的糖尿病。其中,发病以II型糖尿病为主,所占比例约为95%。

I型糖尿病是因胰岛 β 细胞功能衰竭所致,易发生糖尿病急性并发症,如酮症酸中毒。

II型糖尿病是一组发病机制仅部分获知的复杂代谢紊乱。它包括不同程度的胰岛 β 细胞功能降低、周围组织胰岛素抵抗,以及肝糖原代谢异常。

对糖尿病发生机理的研究,目前主要集中在以下四个方面。

(1)核受体相关研究。最新研究发现,在糖脂代谢的稳态调节中,核受体发挥了重要的作用。一些核受体(称为“代谢性核受体”)与胰岛素抵抗、脂肪肝发生,以及与胰岛 β 细胞内胰岛素分泌有密切关系。核受体可能是连接糖脂代谢调节的桥梁。