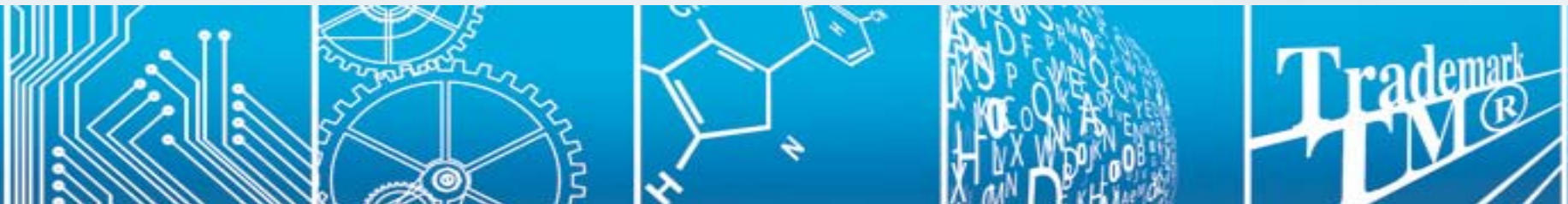


溴化替托品结晶性单水合物专利无效案案例评析



BEIJING EAST IP LTD.
BEIJING EAST IP LAW FIRM

撰写人：赵艳

- 结构上与已知化合物不接近、有新颖性的化合物并有一定用途或者效果，审查员可以认为它有创造性而不必要求其具有预料不到的用途或者效果；
- 结构上与已知化合物接近的化合物，必须要有预料不到的用途或者效果。

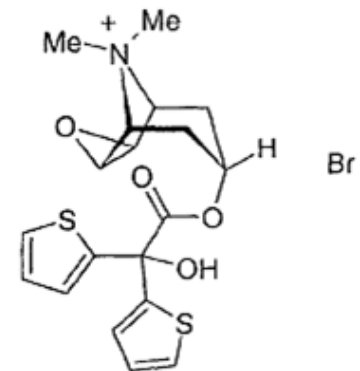
“预料不到的技术效果”是什么？(审查指南第二部分第4章5.3节)

发明同现有技术相比，其技术效果产生“质”的变化，具有新的性能；或者产生“量”的变化，超出人们预期的想象。这种“质”的或者“量”的变化，对所属技术领域的技术人员来说，事先无法预测或者推理出来。

专利号 ZL01817143.5

发明名称 结晶单水合物、其制备方法及其在制备药物组合物中的用途

权利要求 式 (I) 化合物溴化替托品的**结晶性单水合物**，其特征为单一的斜晶体，它具有的量度如下： $a=18.0774$ 埃、 $b=11.9711$ 埃、 $c=9.9321$ 埃、 $\theta=102.691$ 度、 $V=2096.96$ 埃³



说明书

出乎意外地发现，通过选择特定反应条件可以获得结晶形式的溴化替托品单水合物，它符合前述苛刻要求。

苛刻要求：例如起始物料在多种环境条件作用下的活性稳定性、药物制剂制造过程的稳定性以及最终药物组合物的稳定性。

活性物质在研磨过程（或者微粉化）中有足够的稳定性。

研磨过程造成的能量输入以及对晶体表面产生应力。这种情况可以导致多晶形变化，导致非晶形形成的改变、或导致结晶晶格的变化。（**活性物质的晶形、晶格稳定性**）

案情发展

请求人	证据1：溴化替托品晶体；证据5a：溴化替托品X水合物
专利权人	答复一通时提交的审查意见作为反证，证明“微粉化以后权利要求1要求保护的溴化替托品结晶性单水合物的细分颗粒级分在压力条件下基本上不变”
复审委	<p>溴化替托品的结构是权利要求1、证据5a以及证据1的化学产品的基本核心部分，本专利权利要求1的产品与证据5a和证据1的产品均属于结构上非常接近的产品。</p> <p>说明书仅笼统地提及了本专利说明书中所述的药物活性物质会满足诸多苛刻要求的效果，但没有任何证据表明上述技术效果的存在。</p>
一审、二审	支持复审委的观点

权利人

(1) 关于《审查指南》规定的“结构上接近”的认定，不仅要审查其化学结构是否相同，还应审查其微观晶体结构是否接近。本专利权利要求1要求保护的是溴化替托品结晶性单水合物，而证据5a公开了溴化替托品x水合物，证据1公开了溴化替托品晶体，显然不构成《审查指南》规定的“结构上接近”；(2) 反证1已经证明了，单水化合物在微粉化以后以及压力稳定性实验中只显示较小的粒径增长，即细分颗粒级分在压力条件下基本保持不变，可以得出上述预料不到的技术效果已被说明书记载的结论。

最高法

(1) 晶体化合物的微观晶体结构变化多样，某一化合物在固体状态下可能基于两种或者两种以上不同的分子排列而产生不同的固体结晶形态，但并非所有的微观晶体结构变化均必然导致突出的实质性特点和显著的进步，故不能单单依据微观晶体结构的不接近而认定其结构上不接近。在晶体的创造性判断中，微观晶体结构本身必须结合其是否带来预料不到的技术效果一并考虑。

(2) 反证1所述“粒径稳定”的技术效果未被说明书所记载。最高法驳回了专利权人的再审请求。

本案意义

明确了结晶化合物的创造性判断标准。

对技术效果的撰写指明了道路。

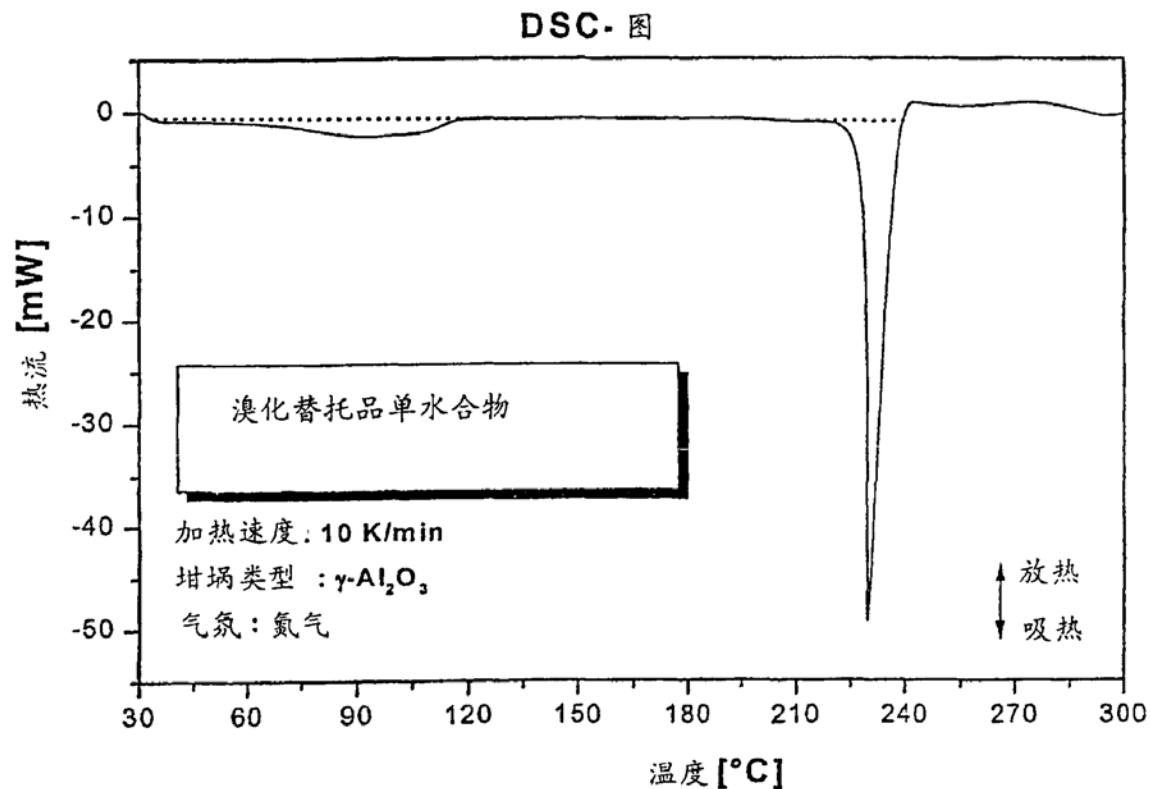
初步想法

- A. 对“预料不到的技术效果”的描述应当是明确的并且有依据的；
- B. 能够合理推导出的技术效果最好记载在说明书中；
- C. 对可能作为“预料不到技术效果”库的技术效果的描述最好是递进式的。

? 是预料不到的技术效果

活性物质的
晶形、晶格
稳定性

复审、一审、二审
认为证据1的溴化
替托品晶体更稳定



Thank you !

Suite 1601, Tower E2, The Towers, Oriental Plaza
No.1 East Chang An Ave., Dongcheng District
Beijing 100738, P.R.China

Tel : +86-10-85189318
Fax:+86-10-85189338
Info@beijingeastip.com