

# 中华人民共和国最高人民法院 驳回再审申请通知书

(2009)知行字第3号

伊莱利利公司 (Eli Lilly and Company):

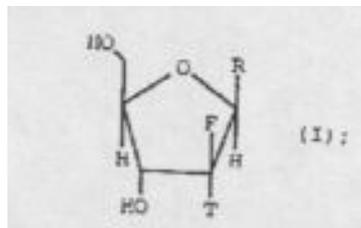
你公司因与被申请人国家知识产权局专利复审委员会 (简称专利复审委员会)、哈尔滨誉衡药业有限公司 (简称誉衡公司)、宁波市天衡制药有限公司 (简称天衡公司)、江苏豪森药业股份有限公司 (简称豪森公司) 发明专利权无效行政纠纷一案, 不服北京市高级人民法院 2008 年 11 月 6 日作出的 (2008) 高行终字第 451 号行政判决, 于 2009 年 7 月向本院申请再审。本院依法组成合议庭对本案进行了审查, 现已审查终结。

你公司申请再审称, 1、二审判决认定本案专利说明书不支持权利要求的结论没有从 58 个实施例出发正面考虑说明书的支持问题, 没有全面考虑附表中 46 组数据整体给出的启示, 而是以其中的 11 个未成功的数据片面判断得出的结论, 二审判决存在错误。2、二审判决混淆了专利法第二十六条第三款关于说明书充分公开的审查标准和专利法第二十六条第四款关于说明书应当支持权利要求的评判标准, 用充分公开的标准来审查本案专利, 得出说明书没有支持权利要求的结论, 属于适用法律错误。3、二审判决在否定独立权利要求 1 的专利性后, 没有对从属权利要求进行任何评判而作出维持无效决定的判决, 违反了《最高人民法院关于执行〈中华人民共和国民事诉讼法〉若干问题的解释》第六十七条的规定。请求本院撤销二审判决, 提审本案。

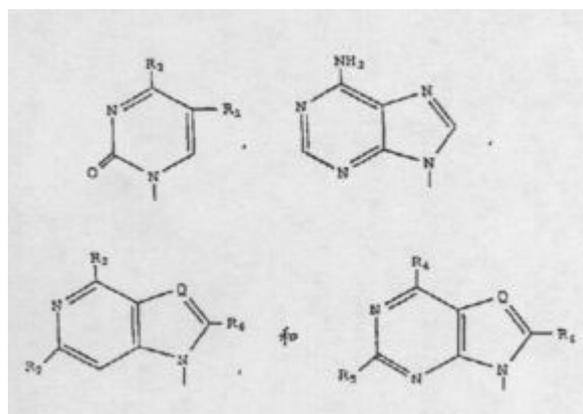
被申请人专利复审委员会称, 第 9525 号无效决定全面考虑了本专利说明书记载的要解决的技术问题、采用的技术方案、公开的具体实施例和表格例。本案专利权利要求记载的技术方案没有得到说明书支持。

誉衡公司、豪森公司称, 伊莱利利公司的申请再审理由不能成立。第 9525 号无效决定的认定并无不当。

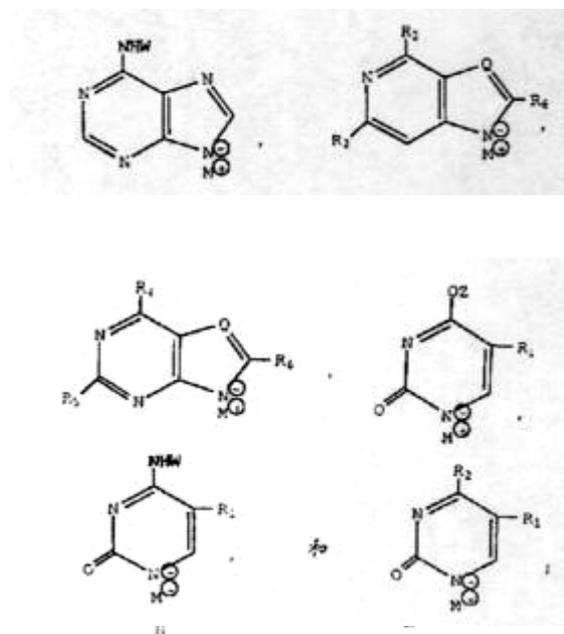
本院经审查查明, 本案诉争专利是于 1998 年 10 月 7 日授权公告的名称为“立体选择性糖基化方法”的发明专利 (简称本专利), 申请日是 1993 年 6 月 21 日, 最早优先权日为 1992 年 6 月 22 日, 专利权人为伊莱利利公司, 专利号为 93109045.8。其授权公告的权利要求如下: “1、制备下式  $\beta$  异头物富集的核苷的方法



其中 T 为氟而 R 为选自如下基团的核碱

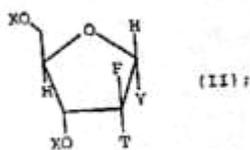


其中 R1 选自氢，烷基，取代的烷基和卤素；R2 选自羟基，卤素，叠氮基，伯胺基和仲胺基；R4, R5 和 R6 独立地选自氢，-OH, -NH2, N(烷基)W, 卤素，烷氧基和硫代烷基；Q 选自 CH, CR8 和 N；其中 R8 选自卤素，甲酰氨基，硫代甲酰氨基，烷氧羰基和氰基，该方法包括用至少一摩尔当量的选自如下的核碱(R'')：



其中 R1、R2、R4、R5、R6、Q 和 M+如前定义；Z 为羟基保护基；W 为氨基保护基；任选地在一种适宜溶剂中进行 SN2 亲核取代下式 α 异头物富集的糖的磺酰氧基(Y)；

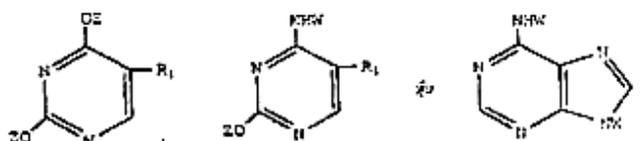
其中 X 独立地选自羟基保护基而 T 如前定义，其中，所述的 SN2 取代反应是



在约 170°C - 120°C 的温度下进行的；

和将所述的式(II)的化合物脱去保护以生成式(I)的化合物。

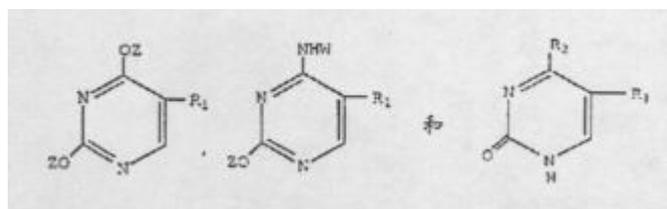
2、权利要求 1 的方法，其中 R'' 选自



其中 R1 选自氢，烷基，取代的烷基和卤素；Z 为羟基保护基；而 W 为氨基保护基；其中 Y 选自烷基磺酰氧基，芳基磺酰氧基、取代的烷基磺酰氧基和取代的芳基磺酰氧基；反应在糖浓度高于每单位体积溶剂为 20% (重量) 的溶液中进行

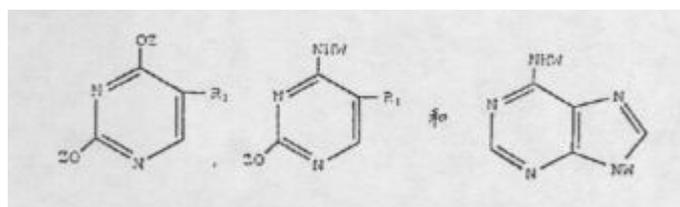
行；其中溶剂为沸点高于 70°C 的惰性溶剂。

3、权利要求 1 的方法，其中 R'' 选自



其中 R1 选自氢，烷基，取代的烷基和卤素；R2 选自羟基，卤素，叠氨基，伯胺基和仲胺基；Z 为羟基保护基而 W 为氨基保护基；其中 Y 选自三氟甲磺酰氧基，1, 1, 1-三氟乙磺酰氧基，八氟丁磺酰氧基和九氟丁磺酰氧基，其中 SN2 取代反应在 -120°C 至 25°C 的温度并在低冰点惰性溶剂中进行。

4、权利要求 1 的方法，其中 R'' 选自

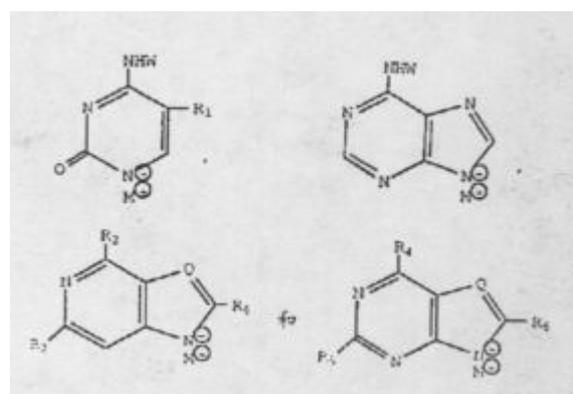


其中 R1 选自氢，烷基，取代的烷基和卤素；Z 为羟基保护基而 W 为氨基保护基；Y 选自烷基磺酰氧基，芳基磺酰氧基、取代的烷基磺酰氧基和取代的芳基磺酰氧基；所述的反应在催化剂存在下进行。

5、权利要求 4 的方法，其中催化剂选自基本上溶于溶剂，含有非亲核性阴离子的高度离子化盐。

6、权利要求 4 或 5 的方法，其中溶剂选自极性、非亲核性溶剂。

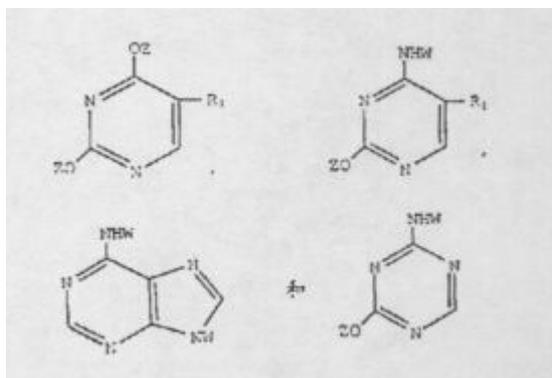
7、权利要求 1 的方法，其中 R'' 选自



其中 R2 选自羟基，卤素，叠氨基，伯胺基和仲胺基；R4, R5 和 R6 独立地选自氢，-OH，-NH2，N(烷基)W，卤素，烷氧基，和硫代烷基；Q 选自 CH，CR8 和 N；其中 R8 选自卤素，甲酰氨基，硫代甲酰氨基，烷氧羰基，和氰基，Z 为羟基保护基；W 为氨基保护基；而 M+ 为阳离子；其中 Y 选自三氟甲磺酰氧基，1,

1, 1-三氟乙磺酰氧基, 八氟丁磺酰氧基和九氟丁磺酰氧基; 其中溶剂为冰点低于 26°C 的惰性溶剂。

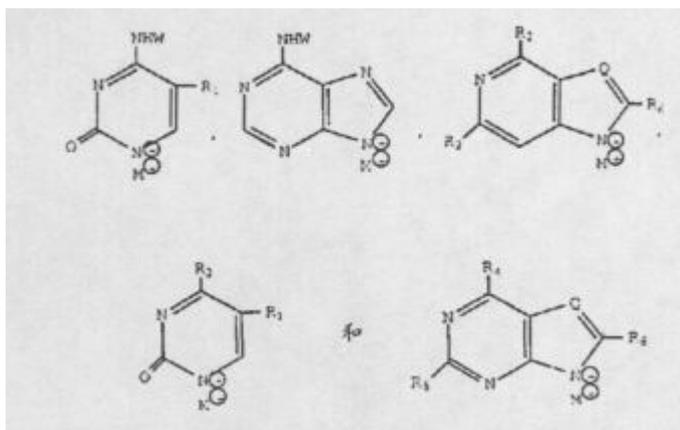
8、权利要求 1 的方法, 在无溶剂存在下进行, 其中 R'' 选自



其中 R1 选自氢, 烷基, 取代的烷基和卤素; Z 为羟基保护基而 W 为氨基保护基; 其中 Y 选自烷基磺酰氧基, 芳基磺酰氧基、取代的烷基磺酰氧基和取代的芳基磺酰氧基。

9、权利要求 8 的方法, 其中反应温度为 100°C 至 160°C。

10、权利要求 1 的方法, 其中 R'' 选自



其中 R1 选自氢, 烷基, 取代的烷基和卤素; R2 选自羟基, 卤素, 叠氨基, 伯氨基和仲氨基; R4, R5 和 R6 独立地选自氢, -OH, -NH2, N(烷基)W, 卤素, 烷氧基和硫代烷基; Q 选自 CH, CR8 和 N; 其中 R8 选自卤素, 甲酰氨基, 硫代甲酰氨基, 烷氧羰基, 和氰基, Z 为羟基保护基而 W 为氨基保护基; 其中 Y 选自烷基磺酰氧基, 芳基磺酰氧基, 取代的烷基磺酰氧基和取代的芳基磺酰氧基。

11、根据权利要求 1 的方法, 其中式 (II) 化合物的羟基保护 (X) 为苯甲酰基。

12、根据权利要求 1 的方法, 其中式 (II) 化合物的磺酰氧基 (Y) 为甲磺酰氧基。

13、根据权利要求 2 的方法, 其中式 (II) 化合物的磺酰氧基 (Y) 为甲磺酰氧基。

14、根据权利要求 4 的方法, 其中式 (II) 化合物的磺酰氧基 (Y) 为甲磺酰氧基。

15、根据权利要求 5 的方法, 其中式 (II) 化合物的磺酰氧基 (Y) 为甲磺酰氧基。

16、根据权利要求 6 的方法，其中式(II)化合物的磺酰氧基(Y)为甲磺酰氧基。

17、根据权利要求 8 的方法，其中式(II)化合物的磺酰氧基(Y)为甲磺酰氧基。

18、根据权利要求 9 的方法，其中式(II)化合物的磺酰氧基(Y)为甲磺酰氧基。

19、根据权利要求 10 的方法，其中式(II)化合物的磺酰氧基(Y)为甲磺酰氧基。

20、根据权利要求 1 的方法，其中式(II)化合物的磺酰氧基(Y)为三氟甲磺酰氧基。”

本专利说明书记载：短语“异头物富集”单独或结合地表示异头物混合物其中特定异头物的比例大于 1:1，并包括基本纯净的异头物。说明书给出 58 个实施例和 3 个表格例（包括 46 组数据），58 个实施例均能够得到  $\beta$  异头物与  $\alpha$  异头物之比大于 1:1 的核苷，表格例中有 7 组数据  $\beta$  异头物与  $\alpha$  异头物之比小于 1:1，4 组数据  $\beta$  异头物与  $\alpha$  异头物之比等于 1:1，其他数据均能得到  $\beta$  异头物与  $\alpha$  异头物之比大于 1:1 的核苷。

2007 年 2 月 28 日，专利复审委员会针对北京浦洋恒丰科技发展有限公司（简称浦洋恒丰公司）、誉衡公司、天衡公司、豪森公司就本专利提出的无效宣告请求，作出第 9525 号无效宣告请求审查决定（简称第 9525 号决定），宣告本专利权无效。该决定认定：1、根据说明书的描述，影响所述立体选择性方法的因素较多，按照权利要求 1 的条件，尤其是在核碱过量程度和原料糖  $\alpha$  异头物富集程度比较低的情况下，存在过多无法预见产物  $\beta$  异头物是否富集的情形，权利要求请求保护的是一个范围，所属领域技术人员要通过实验选择所有的非  $\beta$  异头物富集的实施方式、确定除实施例之外的技术方案能否实现，从各种反应条件的各种排列组合中筛选出能够实现权利要求 1 所要保护的技术方案需要进行大量的反复实验或者过度劳动，因此权利要求 1 不符合专利法第二十六条第四款的规定。2、反应条件优化的前提是在可以解决发明技术问题的技术方案中寻找优选方案。专利权人有权利要求保护优化的方案，但是相应的反应条件也应当按照说明书中制备得到该产物的反应条件进行适当概括。3、权利要求 2~20 是权利要求 1 的从属权利要求，均没有进一步限定核碱的当量和原料糖  $\alpha$  异头物富集程度以及在低核碱当量和原料糖  $\alpha$  异头物富集程度较低的情况下如何选择其他反应条件，所属领域技术人员在权利要求 2~20 限定的条件内仍旧需要进行大量的反复实验或者过度劳动才能确定能否制备得到  $\beta$  异头物富集的二氟核苷。因此，权利要求 2~20 同样不符合专利法第二十六条第四款的规定。

第 9525 号决定作出后，浦洋恒丰公司于 2007 年 8 月 30 日提交书面声明，放弃作为第三人参加诉讼的权利，放弃与该案有关的诉讼权利和实体权利。

伊莱利利公司不服该决定提起行政诉讼称，1、说明书清楚地记载了权利要求 1 的技术方案，说明书和实施例详细描述了要求保护的温度范围、溶剂、碱当量、离去基团，提供了 58 个实施例和 3 个表格总共 80 个具体实施方式来教导本领域技术人员如何优化反应条件，对说明书和实施例的教导应当被当作一个整体来理解。本专利权利要求的保护范围比说明书所公开的范围窄，因此权利要求的保护范围得到了说明书公开内容的充分支持。2、第 9525 号决定中采用的“大量的反复实验或者过度劳动”的认定理由没有在专利法和审查指南中规定，不是判

断权利要求是否得到说明书支持的正确依据，第 9525 号决定对专利法第二十六条第四款的理解存在重大错误。3、本专利所有结果  $\alpha / \beta$  核苷比对于现有技术中记载的 4: 1 的产率都有明显的改进，虽然说明书中表 1 和 2 中的七个实施例不能得到  $\beta$  异头物富集的产物，但是本领域技术人员会注意到说明书中大量实施例作为一个整体给出的暗示，不会仅仅注意实验中的一个或者某些数据。专利复审委员会对本专利说明书中的表格含义理解错误，其认为需要大量反复实验或者过度劳动才能选择出  $\beta$  异头物不富集的所有实施方式，并认为权利要求 1 的概括会损害公共利益均是错误的。请求撤销第 9525 号决定，并由专利复审委员会重新作出无效宣告请求审查决定。

北京市第一中级人民法院一审认为，专利法第二十六条第四款规定，权利要求书应当以说明书为依据。审查指南规定，权利要求书应当以说明书为依据，是指权利要求应当得到说明书的支持。权利要求书中的每一项权利要求所要求保护的技术方案应当是所属技术领域的技术人员能够从说明书充分公开的内容得到或概括得出的技术方案，并且不得超出说明书公开的范围。在判断权利要求是否得到说明书的支持时，应当考虑说明书的全部内容，而不是仅限于具体实施方式部分的内容。就本案而言，首先，本专利说明书给出了 3 个表格例包括 46 组数据，表格例应属于实施例的表现形式之一，其中记载的数据等同于实施例的数据，加上说明书中的 58 个实施例，说明书共给出 104 组数据。表格例中有 11 组数据  $\beta$  异头物与  $\alpha$  异头物之比小于或等于 1:1，而其他 93 组数据均能得到  $\beta$  异头物与  $\alpha$  异头物之比大于 1:1 的核苷。在评述本专利权利要求是否得到说明书支持时，专利复审委员会主要是从表格例中没有达到  $\beta$  异头物富集的几组数据出发进行判断，而没有全面考虑说明书中有关发明目的、技术方案的记载以及大量能够实现  $\beta$  异头物富集的实施例和表格例数据在评判本专利权利要求是否得到说明书支持时的作用，并将两者结合起来进行综合评判。其次，评价权利要求是否得到说明书支持应当以“权利要求书中的每一项权利要求所要求保护的技术方案应当是所属技术领域的技术人员能够从说明书充分公开的内容得到或概括得出的技术方案，并且不得超出说明书公开的范围”作为标准。而专利复审委员会在评述和决定要点中引入“如果所属技术领域的技术人员根据说明书的教导并考虑本领域普通技术知识，仍然需要进行大量的反复实验或者过度劳动才能确定权利要求概括的除实施例以外的技术方案能否实现”作为标准评判本专利权利要求是否得到说明书支持，其评判的出发点不符合专利法第二十六条第四款的规定，是不适当的。综上，专利复审委员会认为本专利权利要求 1 得不到说明书支持的理由不充分，伊莱利公司的起诉理由成立，予以支持。据此判决，撤销第 9525 号无效决定、专利复审委员会就本专利重新作出无效宣告请求审查决定。案件受理费 100 元，由专利复审委员会承担。

专利复审委员会、誉衡公司、天衡公司、豪森公司均不服一审判决，向北京市高级人民法院提起上诉，请求撤销一审判决，维持第 9525 号决定。

北京市高级人民法院二审认为，本案的核心问题在于说明书中存在该 11 个实施例是否说明本专利不符合专利法第二十六条第四款的规定。首先应当指出，权利要求书中的每一项权利要求所要求保护的技术方案应当是所属技术领域的技术人员能够从说明书充分公开的内容中得到或概括得出的技术方案，并且不得超出说明书公开的范围。如果说明书中公开的部分实施例或实施方式不能达到发明目的或发明效果却又被概括纳入权利要求的保护范围，并且删除该部分实施

例或实施方式时权利要求的保护范围相应缩小，则应当认为该权利要求得不到说明书的支持。本案中，在本专利说明书公开的全部 104 个实施例中，11 个实施例不能达到制得  $\beta$  异头物富集的核苷的发明目的或发明效果。而该 11 个实施例的反应原料、溶剂、温度、核碱的结构均落入权利要求 1 记载的技术特征的范围内，如果将该 11 个实施例去除，则本专利权利要求 1 的保护范围相应地缩小。因此，本专利权利要求 1 不符合专利法第二十六条第四款的规定。其次，权利要求的概括应当不超出说明书公开的范围，如果权利要求的概括包含申请人推测的内容，而其效果又难以预先确定和评价，则应当认为这种概括超出了说明书公开的范围。如果权利要求的概括使所属技术领域的技术人员有理由怀疑该上位概括或并列概括所包括的一种或多种下位概念或选择方式不能解决发明或实用新型所要解决的技术问题，并达到相同的技术效果，则应当认为该权利要求没有得到说明书的支持。在说明书中披露的部分实施例不能达到发明目的或发明效果的情况下，应当认为该权利要求没有得到说明书的支持。本专利说明书中披露的 11 个实施例不能达到本专利制得  $\beta$  异头物富集的核苷的发明目的或发明效果，本专利所属技术领域的技术人员通过阅读本专利权利要求所得到的技术方案，不能得到本专利说明书的支持，应当认为本专利权利要求 1 不符合专利法第二十六条第四款的规定。据此，有合理的依据认定本专利权利要求 1 没有得到说明书的支持，不符合专利法第二十六条第四款的规定，应当被宣告无效。专利复审委员会、誉衡公司、天衡公司、豪森公司的上诉主张成立，应予支持。

关于第 9525 号决定中将“所属领域技术人员从各种反应条件的各种排列组合中筛选出能够实现权利要求 1 所要保护的技术方案需要进行大量的反复实验或者过度劳动”作为对本专利权利要求是否得到说明书的支持的评判标准问题，权利要求允许概括的范围是本领域技术人员能够“合理预测”或者按照“常规试验容易确定”的范围。“合理预测”的范围应当理解为本领域技术人员根据说明书的记载，结合其所具有的普通技术知识，能够预见权利要求所保护的技术方案都能够实现。“常规试验容易确定”的范围应当理解为本领域技术人员根据说明书公开的实施方案，通过简单的常规试验即可实现权利要求的技术方案。而当超出此种“合理预测”或者“常规试验容易确定”的范围，即需要大量反复试验或者过度劳动才能实现的技术方案时，由于专利权人并未给出明确的、毫无疑义的指引，其效果难以预先合理判断，应当认为该权利要求没有得到说明书的支持。因此，专利复审委员会的认定标准不违反专利法第二十六条第四款的规定，并无不妥。据此判决，撤销一审判决、维持第 9525 号决定。二审案件受理费 100 元，由伊莱利利公司负担。

本院认为，1、权利要求所要求保护的技术方案应当是所属技术领域的技术人员能够从说明书充分公开的内容中得到或概括得出的技术方案，并且不得超出说明书公开的范围。如果权利要求的概括使所属技术领域的技术人员有理由怀疑该上位概括或并列概括所包含的一种或多种下位概念或选择方式不能解决发明所要解决的技术问题，并达到相同的技术效果，则应当认为该权利要求没有得到说明书的支持。本案权利要求 1 保护的是一种  $\beta$  异头物富集的二氟核苷的制备方法，其限定的技术特征是：产物为式 I 的  $\beta$  异头物富集的二氟核苷；原料及其用量是至少一摩尔当量被保护的核碱（R''）1 位是黄酰氧基、3 和 5 位被保护的式 II 的  $\alpha$  异头物富集的糖；反应步骤是核碱 R''SN<sub>2</sub> 亲核取代  $\alpha$  异头物富集的糖中的黄酰氧基，之后去保护；溶剂是任选的适宜溶剂、温度是约 170 度-负 120 度。

专利权人在说明书的表格例中，有 11 组数据不能制备得到  $\beta$  异头物富集的二氟核苷。根据说明书的描述，影响所属立体选择性方法的因素较多，除了原料糖的离去基团、原料糖构型和核碱用量外，还包括温度和溶剂的选择。权利要求 1 概括的制备方法的各因素，即离去基团、核碱种类、核碱当量、反应温度、反应溶剂等的范围是十分宽泛的。本领域技术人员有合理的理由认为，除了 11 个不能实施的情况外，该权利要求 1 的概括还包含众多其他不能解决发明所要解决的技术问题的技术方案，所属技术领域的技术人员不容易从各种反应条件的排列组合中通过常规实验或者合理推测得出能够解决技术问题的技术方案，而是需要大量反复实验或过度劳动才能确定权利要求 1 的范围。因此，无效决定和二审判决据此认为本专利权利要求 1 没有得到说明书的支持，不符合专利法第二十六条第四款的规定，宣告专利权无效，并无不当。2、伊莱利利公司对第 9525 号决定不服，提起行政诉讼主张本案专利权利要求的保护范围得到了说明书公开内容的支持时仅针对权利要求 1 的技术方案，二审判决就此进行了审理，并不存在漏审从属权利要求，违反行政诉讼二审案件全面审查原则的情形。

综上所述，二审判决认定事实清楚，适用法律正确。你公司的再审申请不符合《中华人民共和国行政诉讼法》第六十三条第二款、《最高人民法院关于执行〈中华人民共和国行政诉讼法〉若干问题的解释》第七十二条规定的再审条件，依据《最高人民法院关于执行〈中华人民共和国行政诉讼法〉若干问题的解释》第七十四条的规定，予以驳回。

特此通知。

二〇一〇年十一月十日