

01 智慧財產及商業法院行政判決

02 110年度行專訴字第68號

03 民國111年8月17日辯論終結

04 原 告 美時化學製藥股份有限公司

05 代 表 人 Vilhelm Robert Wessman

06 訴訟代理人 呂紹凡律師

07 馬鈺婷律師

08 黃雅君專利師

09 被 告 經濟部智慧財產局

10 代 表 人 洪淑敏

11 訴訟代理人 施雅儀

12 簡正芳

13 參 加 人 NOVARTIS AG. 瑞士商諾華公司

14 代 表 人 Robert Carroll Stanley

15 Hiram Robert Andrews

16 訴訟代理人 牛豫燕律師

17 莊郁沁律師

18 林蘭君專利師

19 上列當事人間因發明專利舉發事件，原告不服經濟部中華民國11
20 0年10月27日經訴字第11006306870號訴願決定，提起行政訴訟，
21 並經本院命參加人獨立參加訴訟，本院判決如下：

22 主 文

23 訴願決定及原處分關於「請求項2至3舉發不成立」部分均撤銷。
24 被告就第I406661號發明專利應為「請求項2至3舉發成立」之處
25 分。

26 訴訟費用由被告負擔。

27 事實及理由

28 一、參加人前於民國95年7月19日以「4-甲基-N-[3-(4-甲基-
29 咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓啶-2
30 -基胺基)-苯甲醯胺之結晶型」(下稱系爭結晶型)向被告
31 申請發明專利，並聲明以西元2005年7月20日、同年9月12美

01 國60/701, 405、60/716, 214號專利案主張優先權，經被告實
02 體審查後，於102年5月6日審定准予專利，發給第I406661號
03 發明專利證書（下稱系爭專利）。嗣經原告於109年4月7日
04 以系爭專利請求項第1至4、7、10至13、16、19、22、25、2
05 8、31、33及36至38項，違反核准時（即100年12月21日修正
06 公布、102年1月1日施行）專利法第26條第1、2項及第22條
07 第2項規定提起舉發，參加人於同年8月3日申請更正系爭專
08 利範圍，經被告於110年3月26日以（110）智專三（四）011
09 45字第11020279040號專利舉發審定書作成「109年8月3日之
10 更正事項，准予更正」、「請求項1、4、7、10、13、16、1
11 9、22、25、28、31、33、36舉發駁回」（上開二部分業已
12 確定，以下逕以系爭專利各請求項稱之，不再贅述為系爭專
13 利更正後各請求項）及「請求項2至3、11至12、37至38舉發
14 不成立」之處分（下稱原處分），原告不服，乃就原處分關
15 於上開舉發不成立部分提起訴願，經經濟部於110年10月27
16 日作成經訴字第11006306870號「原處分關於『請求項2至3
17 舉發不成立』部分訴願駁回；原處分關於『請求項11至12、
18 37至38舉發不成立』部分撤銷，由原處分機關於6個月內另
19 為適法之處分」之訴願決定（下稱訴願決定），原告就原處
20 分及訴願決定關於「請求項2至3舉發不成立」部分不服，提
21 起本件行政訴訟。本院認本件判決之結果，倘認原處分及訴
22 願決定，應予撤銷，將影響參加人之權利或法律上之利益，
23 爰依職權命參加人獨立參加訴訟。

24 二、原告起訴主張略以：

25 (一)、系爭專利請求項2、3對應之說明書內容違反核准時專利法第
26 26條第1項（可據以實現要件）之規定：

27 系爭專利雖經准予更正，惟根據系爭專利各請求項可知，系
28 爭專利的系爭結晶型判斷，是藉由圖式所呈現所有被偵測到
29 的粉末X射線衍射法（即XRPD）定性結晶類型表徵，以得知
30 其結晶型種類。有關XRPD定性結晶類型，通常須包含10個
31 （ 2θ 度數）最大值來作為X-射線粉末繞射圖案表徵，方足

01 以使該領域具有通常知識者判定其結晶型。不管是結晶型或
02 非結晶型物質，其XRPD均具有峰值，而結晶型應至少具有數
03 10個峰值，方可有別於仍具有少量峰值之非結晶型。換言
04 之，僅藉由小於或甚至遠小於10個（ 2θ 度數）最大值，不
05 足以明確判斷其結晶型種類。系爭專利對於結晶型A、A'、
06 A''、B、B'、SB、SB'、C、C'、SC及SE等類型的判定，係藉
07 由如其說明書所載至少包含10個左右（ 2θ 度數）最大值作
08 為X-射線粉末繞射圖案表徵加以區分之。若僅就系爭專利請
09 求項2至3以結晶型係二水合物、及具有「至少1個」或「至
10 少4個」之X-射線粉末繞射圖案表徵界定所請，則如何能僅
11 以如此少量峰值（至少1個或至少4個），及藉由單水合物或
12 二水合物，來明確區分包含類似或完全相同峰值表徵之混合
13 結晶型物質中的各個晶型之技術手段，並未揭露於系爭專利
14 說明書，該領域具有通常知識者並無法僅藉由系爭專利說明
15 書之揭露內容，而可據以實現系爭專利請求項2至3所請範
16 圍。又系爭專利說明書是否符合核准時專利法第26條第1項
17 之規定，應係以系爭專利說明書內容整體觀之，而非僅以系
18 爭專利部分請求項所載內容為判定依據，然訴願決定僅以系
19 爭專利說明書已部分記載結晶型A及B之結晶型種類、性質、
20 製備方法及步驟，而認定系爭專利說明書未違反核准時專利
21 法第26條第1項規定，顯有重大違誤，系爭專利違反核准時
22 專利法第26條第1項規定甚明。

23 (二)、系爭專利請求項2、3違反核准時專利法第26條第2項（明確
24 要件）：

25 系爭專利所申請者係為「物」的請求項，而非「方法」請求
26 項。根據系爭專利先前技術所載，可清楚得知，系爭專利相
27 較於先前技術，主要技術特徵應在於藉由選擇何種製程條件
28 來製備得不同的結晶型，即系爭專利之特別技術應在於多晶
29 型的製備方法，而非不具任何無法預期功效之多晶型本身。
30 且根據系爭專利各請求項可知，其所請範圍並非是僅針對製
31 備後的結晶型種類，而是針對任何可落入申請專利範圍所載

01 均屬之。再者，系爭專利之晶體判斷，是藉由圖式所呈現所
02 所有被偵測到的XRPD表徵，來得知其結晶型種類，而系爭專利
03 請求項2至3，以結晶型係二水化合物、及具有「至少1個」
04 或「至少4個」之不足量，甚至可能與其他結晶型發生範圍
05 重疊的x-射線粉末繞射圖案表徵，來界定所請之晶體結構特
06 徵，實際上根本無法判定所請係何種結晶型之技術特徵，致
07 所請範圍不明確，無法為系爭專利說明書所支持，不符核准
08 時專利法第26條第2項之明確要件。再者，根據系爭專利說
09 明書第12至23頁所揭露的內容，可知系爭專利所申請之鹽酸
10 鹽至少包含結晶型A、A'、A''、B、B'、SB、SB'、C、C'、S
11 C、D及SE等多種晶型種類，其中系爭專利請求項2至3所申請
12 之結晶型A之XRPD最大值，在「±0.2」、「±0.3」之誤差值
13 範圍內，與上開多種結晶型A'產生至少1個、甚至6個數值相
14 同或重疊。訴願決定所認定系爭專利請求項11至12所界定
15 (2θ度數)之XRPD最大值時，會與系爭專利請求項23至24
16 所界定之(2θ度數)之XRPD最大值，在「±0.2」、「±0.
17 3」之誤差值範圍內，產生部分數值相同或重疊，導致無法
18 判讀該結晶究竟為結晶型B或結晶型C，故系爭專利請求項1
19 1、12記載不明確而違反核准時專利法第26條第2項之規定；
20 同理，系爭專利請求項2、3所界定之8.5°、11.0°、11.5°、
21 17.2°、18.8°、19.2°、20.8°、22.1°及26.0°(2θ度數)
22 之XRPD最大值時，會與上開多種結晶型A'等之XRPD最大值，
23 在「±0.2」、「±0.3」之誤差值範圍內，產生至少1個、甚
24 至6個數值相同或重疊，導致無法判讀該結晶是否為結晶型A
25 或其他晶型，故系爭專利請求項2、3自亦有記載不明確之情
26 形，而違反核准時專利法第26條第2項之規定。

27 (三)、系爭專利請求項2、3違反核准時專利法第26條第2項(支持
28 要件)：

29 系爭專利所請之結晶型A、B及C於不同溶劑或溫度下，會互
30 相轉換其結晶型，甚至處於混合二種或三種結晶型狀態，而
31 系爭專利請求項2之結晶型，亦界定只要大於50%結晶之大體

01 上純淨即屬之。系爭專利所請各結晶型主要均處於混合結晶
02 型狀態（包含非結晶、結晶型A、結晶型B及/或結晶型C
03 等）。此時，若該領域有通常知識者欲具有相同或重疊之
04 「至少1個或至少4個之峰值表徵」時，在此有限的條件下，
05 不僅難以區分出該混合結晶型物質是否有大於50%所請結晶
06 型，並且亦難判定該大於50%所請結晶型係為單水合物（例
07 如結晶型B）或二水合物（例如結晶型A）。根據系爭專利所
08 申請之各請求項，可知其所申請之範圍並非僅限定為製備後
09 之結晶型種類，而是針對任何可落入申請專利範圍所載均屬
10 之。更何況該領域具有通常知識者在系爭專利所界定有限的
11 條件中，是否可以明確區分出該混合結晶型物質是否為「大
12 體上純淨」（即大於50%）之所請結晶型，並且由「至少1個
13 或至少4個之峰值表徵」的X-射線粉末繞射圖案，即可判斷
14 為單水合物或二水合物鹽酸鹽，實屬困難，實際上亦無法為
15 說明書所支持。

16 (四)、甲證11至13之組合足以證明系爭專利請求項2、3不具進步
17 性：

18 1、甲證11揭露一種式I之化合物（即舉發證據1第6頁第1段，下
19 稱式I化合物），並揭露式I化合物可為醫藥上可接受之鹽，
20 而該鹽可為式I化合物與有機酸或無機酸所形成之酸加成
21 鹽，並例示該無機酸包括鹽酸。系爭專利請求項2及3與甲證
22 11之差異在於甲證11未具體揭露式I化合物之鹽酸鹽，且未
23 揭露該鹽之結晶型式。然甲證12揭露一種化合物AMN107，即
24 為甲證11之式I化合物（即舉發證據2第130頁之圖1A），並
25 揭露AMN107-AA（即AMN107之鹽酸鹽AMN107-HCl）的藥物動
26 力學數據。由此可見，甲證12已具體揭示甲證11之式I化
27 合物可呈鹽酸鹽形式，亦揭露投與該鹽酸鹽化合物至動物體後
28 之血漿濃度等藥物動力學參數。甲證13則揭露AMN107可用於
29 治療慢性骨髓性白血病（即舉發證據3），且進一步揭露所
30 使用之AMN107為AMN107單鹽酸鹽（甲證13第4942頁右欄第3
31 段），更已揭露可購得該鹽之公開管道。由此可知，於系爭

01 專利申請日前（亦於優先權日前），系爭結晶型已是習知化
02 合物，其鹽酸鹽形式業已用於醫藥用途。系爭專利於其說明
03 書對於多晶型穩定性研究中所載：「而該鹽酸鹽之非結晶型
04 自發結晶為結晶型A」等內容，足見系爭專利所申請之結晶
05 型A，事實上於已知系爭結晶型鹽酸鹽存在時，即同時與非
06 結晶型同時共存。故系爭專利所請之結晶型A即系爭專利請
07 求項2至3，實屬已知化合物，其發明人對該結晶型應僅屬單
08 純的發現，而非發明，相較於甲證11至13應不具進步性。

09 2、再者，倘若申請專利之發明為已知化合物的多晶型，且未具
10 有無法預期的功效，則該化合物的多晶型亦不具進步性。系
11 爭專利於其說明書【先前技術】一節亦自承多晶型相較於非
12 晶型具有更好的穩定性係為習知技術，系爭專利並未揭露其
13 所請鹽酸鹽化合物之結晶型A、B、C等晶型，就該等性質之
14 實驗比較，具有任何無法預期的效果，而僅於系爭專利說明
15 書探討結晶型A、B、C相較於非結晶型之穩定性（系爭專利
16 說明書第49頁），且參酌核准時專利審查基準第二篇第十三
17 章第5.3.1.3節，系爭專利請求項2至3不具進步性甚明。

18 (五)、甲證11至14、17之組合足以證明系爭專利請求項2、3不具進
19 步性：

20 已知化合物的多晶型是否具有進步性，應證明該多晶型較該
21 已知化合物具有無法預期的功效，就系爭專利而言，其應進
22 一步提供其所請各類結晶型之AMN107鹽酸鹽相較於非結晶型
23 之AMN107鹽酸鹽具有無法預期的功效，否則應認定該些結晶
24 型之AMN107鹽酸鹽不具進步性。而甲證11至13（即舉發證據
25 1至3）已揭示了AMN107鹽酸鹽及其投藥後之藥物動力學和應
26 用，已如前述。甲證14揭露包含AMN107鹽酸鹽等鹽類之化學
27 式1可為水合物、結晶型等形式（本院卷二第476頁，甲證1
28 4、14-1第31頁倒數第3段、第63頁實施例92及第51頁實施例
29 68），且甲證17圖1A明確揭示AMN107鹽酸鹽單水合物（NVP-
30 AMN107-AA，甲證17第4501頁圖1A及同頁左下欄），「NVP-A
31 MN107-AA」係為AMN107鹽酸鹽單水合物的應用。甲證11至13

01 既已投藥應用，為已知化合物，因此系爭專利所請結晶型之
02 AMN107鹽酸鹽是否具有無法預期之功效的比較對象理應為非
03 結晶型之AMN107鹽酸鹽，而非為AMN107游離鹼。從而，多晶
04 型相較於非晶型具較佳穩定性本為習知技術，而系爭專利請
05 求項2及3並未證明其所請之AMN107鹽酸鹽之結晶型A，相較
06 於非結晶型之AMN107鹽酸鹽具有無法預期之功效。縱AMN107
07 鹽酸鹽單水合物係為結晶型，AMN107鹽酸鹽單水合物之結晶
08 型至多僅可能為結晶型A、結晶型B及結晶型C，但並不可能
09 係指為二水合物之結晶型A，參酌核准時專利審查基準第二
10 篇第十三章第5.3.1.3節所載，系爭專利請求項2及3不具進
11 步性甚明。

12 (六)、甲證11至14、17、19之組合；甲證11至14、17、20之組合；
13 甲證11至14、17、21之組合；甲證11至14、17與甲證19至21
14 之組合，均足以證明系爭專利請求項2、3不具進步性：

15 1、系爭專利請求項2及3所請實為已知化合物的多晶型，且該些
16 晶型相較於該已知化合物並不具無法預期的功效。甲證19亦
17 教示AMN107鹽酸鹽可為水合物，甲證19、20及21更揭示可藉
18 由溶劑與水的調配而取得鹽酸鹽等鹽類之結晶型水合物。據
19 此，AMN107之鹽酸鹽及其水合物係在系爭專利申請前，即為
20 已知存在的化合物，系爭專利至多僅進一步界定區分該已知
21 化合物AMN107鹽酸鹽之結晶型的種類。是以，就系爭專利而
22 言，其應進一步提供其所請各類結晶型之AMN107鹽酸鹽相較
23 於非結晶型之AMN107鹽酸鹽具有無法預期的功效，否則應認
24 定該些結晶型之AMN107鹽酸鹽不具進步性。依核准時專利審
25 查基準第二篇第十三章第5.3.1.3節規定，系爭專利請求項2
26 及3相較於甲證11、12、13、14、17或其任意組合；或甲證1
27 1、12、13、14及/或17與甲證19、20及/或21之組合之任意
28 組合，實不具進步性，而違反核准時專利法第22條第2項之
29 規定。

30 2、承上，甲證19、20及21揭示可藉由溶劑與水的調配而取得鹽
31 酸鹽等鹽類之結晶型水合物。據此，AMN107之鹽酸鹽及其水

01 合物係在系爭專利申請前，即為已知存在的化合物，系爭專
02 利至多僅進一步界定區分該已知化合物AMN107鹽酸鹽之結晶
03 型的種類。專利權人應進一步提供其所請各類結晶型之AMN1
04 07鹽酸鹽相較於非結晶型之AMN107鹽酸鹽具有無法預期的功
05 效，否則應認定該些結晶型之AMN107鹽酸鹽不具進步性。多
06 晶型相較於非晶型具較佳穩定性本為習知技術，系爭專利未
07 揭露其相較於非晶型之AMN107鹽酸鹽，具有無法預期的功
08 效。系爭專利並未揭露其所請之鹽酸鹽化合物之結晶型A、
09 B、C等晶型，就該等性質（藥物的貯存期限、溶解度、調配
10 物性質及加工性質）之實驗比較，具有任何無法預期的效
11 果，而僅於系爭專利說明書第49頁探討結晶型A、B、C相較
12 於非結晶型之穩定性，故依核准時專利審查基準第二篇第十
13 三章第5.3.1.3節所載，系爭專利請求項2及3不具進步性甚
14 明。

15 (七)、並更正訴之聲明為：訴願決定及原處分關於「請求項2至3舉
16 發不成立」部分應撤銷；被告就發明第I406661號專利舉發
17 事件，應作成「請求項2至3舉發成立」之處分；訴訟費用由
18 被告負擔（本院卷二第468頁）。

19 三、被告答辯略以：

20 (一)、系爭專利請求項2、3對應之說明書內容未違反核准時專利法
21 第26條第1項（可據以實現要件）之規定：

22 1、化合物發明之可據以實現要件之審查係根據系爭專利核准當
23 時（102年5月6日）所採102年版發明專利審查基準，其於第
24 二篇第13章第1.1.1.1節記載「關於化合物發明，說明書中
25 應指明所請求之化合物，即應載明該化合物的化學名稱、結
26 構式（包括各種官能基團、分子立體構型等）或分子式，並
27 應記載該化合物之物理、化學性質（例如各種定性、定量數
28 據或光譜圖等），說明書之記載應明確且充分揭露至該發明
29 所屬技術領域中具有通常知識者能確認該化合物的程
30 度……」，而系爭專利說明書已明確且充分揭露各種結晶型
31 化合物的製備方法及其性質，是系爭專利說明書之記載確實

01 已明確且充分揭露至該發明所屬技術領域中具有通常知識者
02 能確認該二水合物結晶型A的程度，且該發明所屬技術領域
03 中具有通常知識者皆知，當結晶型化合物進行X-射線粉末繞
04 射後，所獲得之X-射線粉末繞射圖案會呈現所有被偵測到的
05 XRPD表徵，實無須如所指稱者揭露如何製備僅具有少數峰值
06 表徵的晶體，雖然原告稱「……根據系爭專利各請求項可
07 知，其所請範圍並非是僅針對製備後的結晶型種類，而是針
08 對任何可落入申請專利範圍所載均屬之……」等語，惟並非
09 僅具有「至少1個或至少4個之峰值表徵」之化合物即會落入
10 系爭專利請求項2至3之範圍內，系爭專利請求項2至3實質上
11 為一種特定化合物之二水合物結晶型A，既然系爭專利說明
12 書業已明確且充分揭露該二水合物結晶型A的製備方法及其
13 性質，系爭專利請求項2至3所對應之說明書內容自當符合可
14 據以實現要件，原告所持之理由並不可採。

15 2、且先前技術即甲證14所揭露之結晶型化合物即屬於一種游離
16 鹼形式，系爭專利已於說明書明確揭露該先前技術及如何製
17 備出系爭結晶型鹽酸鹽如實例23等，非如原告所指稱僅有特
18 定人士才能取得。又系爭專利說明書已明確充分揭露二水合
19 物結晶型A之製備方法及其所具有之X-射線粉末繞射圖案表
20 徵等性質，該發明所屬技術領域中具有通常知識者在系爭專
21 利說明書、申請專利範圍及圖式三者整體之基礎上，參酌申
22 請時之通常知識，無須過度試驗即可據以實現申請專利之發
23 明，因此系爭專利請求項2至3所對應之說明書內容符合核准
24 時專利法第26條第1項之規定。

25 (二)、系爭專利請求項2、3未違反核准時專利法第26條第2項（明
26 確要件）：

27 1、根據系爭專利核准當時所採102年版發明專利審查基準，其
28 於第二篇第十三章第4.2.1.1節記載「申請專利之發明為化
29 合物之結晶物時，原則上，請求項應以具有其技術特徵之物
30 理、化學特性，例如X射線粉末繞射、X射線單晶繞射、IR、
31 Raman、NMR等光譜分析法、或DTA、TGA、DSC等熱分析方法

01 之數值界定其晶體結構，使該發明所屬技術領域中具有通常
02 知識者足以認定申請專利之發明與先前技術之區別」，由於
03 系爭專利請求項2至3中所述之二水合物結晶型A已由具有至
04 少1個或4個選自特定數值(2θ 度數)之最大值之X-射線粉末
05 繞射圖案所表徵，且亦能與先前技術有所區別，自當符合明
06 確要件。

07 2、系爭專利說明書實施例25主要係藉由10種不同溶劑分別對於
08 各結晶型(A、B及/或C)會如何互相轉變進行平衡研究，第
09 49頁係觀察在極端貯存條件下各結晶型之穩定性，並非表示
10 結晶型A、B或C於製備出後會處於混合結晶型狀態，事實上
11 系爭專利之說明書已詳盡說明如何製備出大體上純淨之各特
12 定結晶型及其性質，且並非僅具有「至少1個或至少4個之峰
13 值表徵」之化合物即會落入系爭專利請求項2至3的範圍內，
14 系爭專利請求項2至3實質上為一種特定化合物之二水合物結
15 晶型A，故其本質上亦具有該化合物之二水合物結晶型A的固
16 有性質如固有溶解速率等(系爭專利說明書之表23)，而此
17 等二水合物結晶型A的固有性質亦已被系爭專利之說明書所
18 詳盡記載，如同常見的化合物專利雖僅在其申請專利範圍記
19 載化合物之化學名稱、結構式、分子式等結構特徵，但該發
20 明所屬技術領域中具有通常知識者自可根據其專利說明書所
21 記載該化合物之性質而區分出一化合物是否落入所請之範圍
22 內，化合物之結晶物之所以進一步要求以具有其技術特徵之
23 物理、化學特性予以界定，係為了使所請化合物之結晶物能
24 與先前技術有所區別，而系爭專利請求項2至3已然以具有至
25 少1個或4個選自特定數值(2θ 度數)之最大值之X-射線粉
26 末繞射之數值界定，且亦能與先前技術有所區別，自當符合
27 明確要件；綜上所述，該發明所屬技術領域中具有通常知識
28 者在獲得一種鹽酸鹽之結晶體時，自可根據所記載之「至少
29 1個或至少4個之峰值表徵」以及說明書所記載之關於該化合
30 物之二水合物結晶型A的固有性質，明確區分出該結晶體是
31 否落入系爭專利請求項2至3的範圍內。

01 (三)、系爭專利請求項2、3未違反核准時專利法第26條第2項（支
02 持要件）：

03 系爭專利請求項2至3所請的二水合物結晶型A為系爭專利所
04 製備出之唯一的二水合物，其餘結晶型皆非二水合物，故從
05 系爭專利請求項2至3所記載之化學名稱即足以與系爭專利之
06 其他結晶型有所區別，並不可謂系爭專利請求項2至3之二水
07 合物結晶型A無法與其他結晶型區別，況且系爭專利請求項2
08 至3所記載之二水合物結晶型A的 2θ 度數與其他結晶型並不
09 相同，亦未以「約」、「 ± 0.2 」、「 ± 0.3 」等用語界定請求
10 項的範圍，故亦不存在原告所言之數值相同或重疊的情事。
11 系爭專利請求項2至3以特定化合物之二水合物以及具有至少
12 1個或至少4個之x-射線粉末繞射圖案表徵來界定所請的結晶
13 型A，各請求項彼此間已無範圍重疊致不明確者，亦能與先
14 前技術有明確區別，且可為說明書所支持，因此系爭專利請
15 求項2至3符合核准時專利法第26條第2項之規定。

16 (四)、甲證11至13之組合不足以證明系爭專利請求項2、3不具進步
17 性：

18 1、甲證11至13皆未揭露系爭結晶型鹽酸鹽的二水合物之結晶型
19 A，僅憑系爭專利說明書第49頁所記載之「而該鹽酸鹽之非
20 結晶型自發結晶為結晶型A」實不足以認定結晶型A屬已知化
21 合物。又系爭專利請求項2至3所請結晶型為系爭結晶型鹽酸
22 鹽的二水合物結晶型A，然而甲證11至13皆未揭露其化合物
23 鹽酸鹽有水合物，遑論二水合物，因此該等結晶型的分子結
24 構已與該化合物非完全相同，亦即所請化合物之特定水合物
25 之特定結晶型非屬於已知化合物的多晶型，仍應綜合考量
26 「否定進步性之因素」及「肯定進步性之因素」後，確認是
27 否能建立不具進步性之論理，始能判斷所請發明是否具有進
28 步性，而非僅根據無法預期功效之有無即遽以認定該發明是
29 否具有進步性。

30 2、由於甲證11並未揭露AMN107鹽酸鹽的二水合物之結晶型A，
31 雖甲證12揭露AMN107/AA鹽投予老鼠後之藥物動力學及甲證1

01 3揭露以AMN107單鹽酸為 Bcr-Abl抑制劑來治療慢性骨髓性
02 白血病，然甲證11至13均未有教示或建議將其化合物鹽酸鹽
03 作成二水合物結晶型A，是以，該發明所屬技術領域中具有
04 通常知識者基於甲證11至13，參酌申請時通常知識，並不會
05 產生合理動機將其化合物鹽酸鹽作成二水合物之結晶型A而
06 輕易完成系爭專利發明，因此甲證11至13之組合並不足以證
07 明系爭專利請求項2至3不具進步性。

08 (五)、甲證11至14、17之組合不足以證明系爭專利請求項2、3不具
09 進步性：

10 甲證11至13雖可證明系爭專利優先權日前，AMN107鹽酸鹽已
11 是習知化合物，且業已用於醫藥用途，惟甲證14僅概括性揭
12 露式I化合物，包括其鹽，亦可以水合物之形式獲得其結晶
13 可包括例如使用於結晶之溶劑，並未揭露個別化合物以鹽酸
14 鹽水合物的形式存在，亦即甲證14僅揭露AMN107化合物，而
15 仍未揭露AMN107鹽酸鹽水合物，故原告主張甲證14揭示包括
16 AMN107鹽酸鹽等鹽類之化學式I可為水合物、結晶型等形式
17 等語與事實不符，並不可採。又甲證17記載AMN107，並以括
18 號加註NVP-AMN107-AA，所註明之文獻(12)即為甲證13，
19 亦即甲證17係將代號AMN107與NVP-AMN107-AA混用。雖然甲
20 證18在NVP-AMN107-AA之後加註鹽酸鹽單水合物，惟並不足
21 以證明該NVP-AMN107-AA代號在系爭專利之優先權日前即被
22 用以表示AMN107鹽酸鹽單水合物。在系爭專利之國際優先權
23 日前，當該發明所屬技術領域中具有通常知識者在獲知甲證
24 17之內容時，僅會認知甲證17揭露AMN107鹽酸鹽之使用，斷
25 無可能認為甲證17揭露AMN107鹽酸鹽單水合物，故原告主張
26 甲證17揭露AMN107鹽酸鹽單水合物，與事實不符。

27 (六)、甲證11至14、17、19之組合；甲證11至14、17、20之組合；
28 甲證11至14、17、21之組合；甲證11至14、17與甲證19至21
29 之組合，均不足以證明系爭專利請求項2、3不具進步性：

30 1、甲證19僅概括性揭露鹵化物相較於羧酸鹽更容易形成水合
31 物，並未揭露與AMN107相關之化合物所形成之鹽酸鹽可為水

01 合物。甲證20揭露藥物鹽酸鹽之結晶型水合物的備製，甲證
02 21則揭露藥物結晶型水合物的備製，亦皆未提及其藥物為AM
03 N107，故原告主張甲證20、21教示可將甲證11至14、17所揭
04 示之AMN107鹽酸鹽形成水合結晶物的方式，亦不可採。

05 2、由於甲證14、17、19至21仍未揭露或教示AMN107鹽酸鹽的水
06 合物，故並未補足甲證11至13所未揭露之關於將AMN107鹽酸
07 鹽作成二水合物結晶型A的部分，所請化合物之特定水合物
08 之特定結晶型非屬於已知化合物的多晶型，不能僅根據無法
09 預期功效之有無即遽以認定該發明是否具有進步性。

10 (七)、被告答辯聲明：原告之訴駁回；訴訟費用由原告負擔。

11 四、參加人陳述意見略以：

12 (一)、系爭專利請求項2、3對應之說明書內容未違反核准時專利法
13 第26條第1項（可據以實現要件）之規定；系爭專利請求項
14 2、3未違反核准時專利法第26條第2項（明確要件、支持要
15 件）之規定，均與被告答辯相同，茲不贅述。

16 (二)、甲證11至14、17及19至21之組合不足以證明系爭專利請求項
17 2、3不具進步性：

18 1、我國專利制度對於「已知化合物」之新穎結晶形式具有可專
19 利性採肯定之態度，因多晶型的分子結構係與該化合物完全
20 相同，僅結晶型態有所不同，且多晶型通常以例行之實驗方
21 法即可獲得，故原則上已知化合物的多晶型不具進步性，除
22 非該多晶型較該已知化合物具有無法預期的功效，例如TWI7
23 38269、TWI695004、TWI652012、TWI508962等。系爭專利案
24 所請結晶型所涉之化合物並非「已知化合物」，系爭專利請
25 求項2、3所請結晶型A係AMN107鹽酸鹽之「二水合物」，就
26 分子結構而論，系爭專利所請結晶型包括AMN107鹽酸鹽的二
27 水合物(結晶型A)以及單水合物(結晶型B)及其他水合物/溶
28 劑合物，因此該等結晶型之分子結構已與該化合物非完全相
29 同。再者，系爭專利所請結晶型並非以例行之實驗方法所獲
30 得。即結晶型A必須先將AMN107鹽酸鹽在特定溫度下溶解於
31 特定溶劑中，再經過加熱、冷卻等步驟方能獲得者，而系爭

01 專利結晶型B又係在甲醇蒸汽存在下，得以從結晶型A轉化為
02 結晶型B（系爭專利說明書第13頁第2行參照），其等並非審
03 查基準所述之「例行之實驗方法」。

04 2、甲證14、17、19至21為新證據，其中甲證14僅概括性揭露式
05 I之化合物，並未揭露其鹽酸鹽，更未揭露鹽酸鹽之水合
06 物，遑論其鹽酸鹽之二水合物及單水合物之特定結晶型。系
07 爭專利係將特定結晶固體-AMN107游離鹼之結晶型A加入於乙
08 酸乙酯後再添加鹽酸，然而甲證14之實施例92及實施例68係
09 在施加乙酸乙酯後才得到未知的結晶固體，二者的起始物及
10 步驟皆不相同，顯然不得以此遽認甲證14之實施例92及實
11 施例68所製得之AMN107游離鹼即為結晶型A及B，亦即甲證14僅
12 揭露AMN107化合物，而仍未揭露結晶型A及B，遑論結晶型A
13 及B之AMN107鹽酸鹽，故原告主張系爭專利所請之結晶型A
14 （即系爭專利請求項2及3）基於甲證14及通常知識之揭示可輕
15 易完成云云與事實不符，並不可採。又查甲證17記載AMN10
16 7，即甲證17係將代號AMN107與NVP-AMN107-AA混用，且從甲
17 證17僅可得知其所使用者為AMN107鹽酸鹽。甲證19僅概括性
18 揭露鹵化物相較於羧酸鹽更容易形成水合物，惟並未揭露或
19 教示任何與AMN107相關之化合物所形成之鹽酸鹽可為水合
20 物。另外，甲證20揭露藥物鹽酸鹽之結晶型水合物的製備，
21 甲證21則揭露了藥物結晶型水合物的製備，皆未具體提及其
22 藥物為AMN107，因此，甲證19至21所揭露者仍無關於系爭專
23 利所請AMN107之鹽酸鹽、水合物及其結晶型等。因此甲證1
24 1、12、13、14、17或其任意組合，或甲證11、12、13、14
25 及/或17與甲證19、20及/或21之組合並不足以證明系爭專利
26 請求項2至3不具進步性。

27 3、綜上，由原告所援引之甲證11至14、17及19至21觀之，並無
28 任一證據揭示AMN107鹽酸鹽之結晶型，遑論揭露其製備方
29 法，因此在沒有任何證據揭露AMN107鹽酸鹽之結晶型的情
30 況下，若稱系爭專利所請結晶型可由「例行之實驗方法」所獲

01 得而欲適用核准時專利審查基準第二篇第十三章第5.3.1.3
02 節中多晶型進步性的判斷標準，顯失公允。

03 (三)、參加人答辯聲明：原告之訴駁回；訴訟費用由原告負擔。

04 五、本件爭點（本院卷二第319頁）：

05 (一)、系爭專利請求項2、3對應之說明書內容是否違反核准時專利
06 法第26條第1項（可據以實現要件）之規定？

07 (二)、系爭專利請求項2、3是否違反核准時專利法第26條第2項
08 （明確要件）？

09 (三)、系爭專利請求項2、3是否違反核准時專利法第26條第2項
10 （支持要件）？

11 (四)、甲證11至13之組合是否足以證明系爭專利請求項2、3不具進
12 步性？

13 (五)、甲證11至14、17之組合是否足以證明系爭專利請求項2、3不
14 具進步性？

15 (六)、甲證11至14、17、19之組合是否足以證明系爭專利請求項
16 2、3不具進步性？

17 (七)、甲證11至14、17、20之組合是否足以證明系爭專利請求項
18 2、3不具進步性？

19 (八)、甲證11至14、17、21之組合是否足以證明系爭專利請求項
20 2、3不具進步性？

21 (九)、甲證11至14、17與甲證19、20、21之組合是否足以證明系爭
22 專利請求項2、3不具進步性？

23 六、本院之判斷：

24 (一)、本件應適用之專利法：

25 系爭專利申請日為95年7月19日，核准審定日為102年5月6日
26 ，其是否有應撤銷專利權之情事，應以核准審定時所適用之
27 100年12月21日修正公布、102年1月1日施行之專利法為斷。
28 按利用自然法則之技術思想之創作，而可供產業上利用者，
29 得依法申請取得發明專利，核准時專利法第21條及第22條第
30 1項前段定有明文，又說明書應明確且充分揭露，使該發明
31 所屬技術領域中具有通常知識者，能瞭解其內容，並可據以

01 實現。各請求項應以明確、簡潔之方式記載，且必須為說明
02 書所支持。發明為其所屬技術領域中具有通常知識者依申請
03 前之先前技術所能輕易完成時，不得取得發明專利，核准時
04 專利法第26條第1項、第2項後段、第22條第2項後段亦有明
05 文。

06 (二)、本院得審酌新證據：

07 按「關於撤銷、廢止商標註冊或撤銷專利權之行政訴訟中，
08 當事人於言詞辯論終結前，就同一撤銷或廢止理由提出之新
09 證據，智慧財產及商業法院仍應審酌之」，智慧財產案件審
10 理法（下稱審理法）第33條第1項定有明文，其立法目的是
11 為了避免舉發人就之前行政訴訟中未能提出之新證據，就同
12 一專利權或商標權「再為舉發」，或「再為異議、評定、廢
13 止」，而衍生另一行政爭訟程序（審理法第33條第1項立法
14 理由參照）。由此可知，依審理法第33條提出「新證據」之
15 人，於專利行政訴訟中必為得提起舉發之人，於商標行政訴
16 訟中必為得提起異議、評定、廢止之人，專利權人或商標權
17 人不會提出撤銷自己專利權或商標權之「新證據」，本件原
18 告（即舉發人）於舉發階段以「甲證11至13之組合」證明系
19 爭專利不具進步性，復於行政訴訟中提出甲證14、17、19、
20 20至21（為獨立證據非輔助證據或補強證據），再主張以
21 「甲證11至14、17之組合」、「甲證11至14、17、19之組
22 合」、「甲證11至14、17、20之組合」、「甲證11至14、1
23 7、21之組合」、「甲證11至14、17與甲證19、20、21之組
24 合」，證明系爭專利請求項2、3不具進步性，則本件「新證
25 據」即為上述之組合，本院應予審酌。

26 (三)、系爭專利技術分析：

27 1、系爭專利技術內容：

28 本發明係關於4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-
29 5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘧啶-2-基
30 胺基)-苯甲醯胺游離鹼之大體上純淨之結晶型。本發明亦
31 係關於4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5-三

01 氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓啶-2-基胺基)
02 -苯甲醯胺之鹽酸鹽及硫酸鹽之大體上純淨之結晶型。本發
03 明進一步關於一種醫藥組合物，其包含：(a) 治療有效量之
04 本發明4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5-三
05 氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓啶-2-基胺基)
06 -苯甲醯胺游離鹼或其鹽之大體上純淨之結晶型；及(b) 至
07 少一醫藥上可接受之載劑、稀釋劑、媒劑或賦形劑。本發明
08 亦係關於一種治療對蛋白激酶活性之抑制起反應之疾病的方法，該方法包括向有此治療需要之受試者投與治療有效量之
09 本發明4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5-三
10 氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓啶-2-基胺基)
11 -苯甲醯胺游離鹼或其鹽之大體上純淨之結晶型的步驟（系
12 爭專利說明書第8頁第15行至第9頁第8行，本院卷一第86至8
13 7頁）。

15 2、系爭專利申請專利範圍分析：

16 系爭專利申請專利範圍係為參加人於109年8月3日提出更
17 正，經被告審定准予更正，業如前述，系爭專利申請專利範
18 圍共有11項，原告所爭執之請求項2、3，及請求項2涉及之
19 請求項1（業經刪除），分別列載如下：

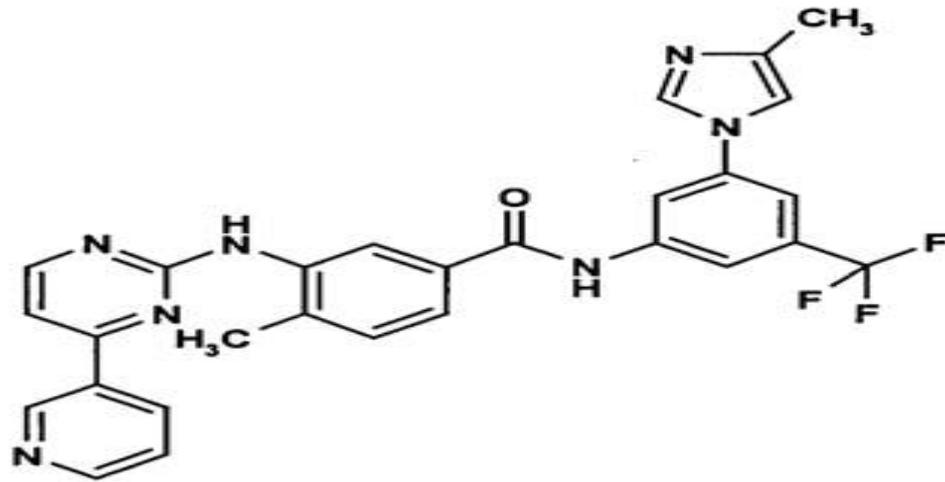
- 20 (1)、請求項1（刪除）：一種4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-
21 基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓啶-2-基胺
22 基)-苯甲醯胺鹽酸鹽之大體上純淨之結晶型A，由具有至少
23 1個選自8.5°、11.0°、11.5°、17.2°、18.8°、19.2°、20.
24 8°、22.1°及26.0°（2θ度數）之最大值之X-射線粉末繞射
25 圖案表徵；其中「大體上純淨」係指大於50%結晶4-甲基-N-
26 [3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-
27 3-基-嘓啶-2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽呈現於所述之結晶
28 型中。
- 29 (2)、請求項2：如請求項1之大體上純淨之結晶型，其中結晶型A
30 係二水合物。
- 31 (3)、請求項3：如請求項2之大體上純淨之結晶型，其中該大體上

01 純淨之結晶型由具有至少4個選自8.5°、11.0°、11.5°、17.
02 2°、18.8°、19.2°、20.8°、22.1°及26.0° (2θ度數) 之最
03 大值之X-射線粉末繞射圖案表徵。

04 3、系爭專利主要圖式：

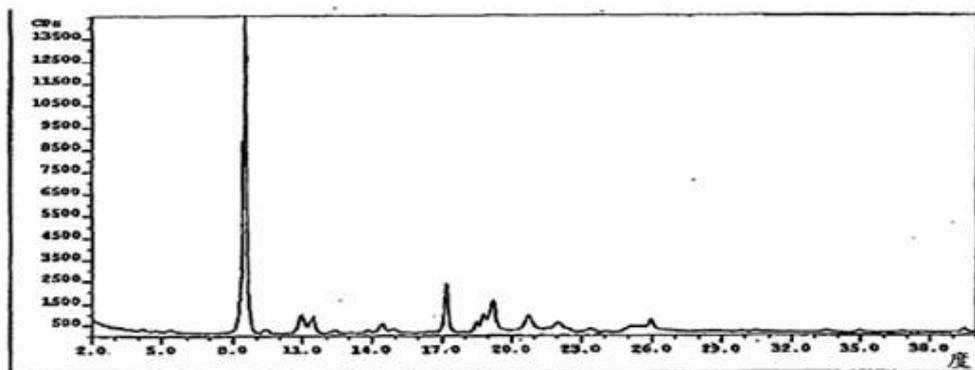
05 (1)、主要化學式：

06



07 (2)、圖2：顯示本發明4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-
08 基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓啶-2-
09 基氨基)-苯甲醯胺鹽酸鹽之結晶型A的X-射線粉末繞射
10 圖案(XRPD)。

11



12

13

圖2

14 (四)、舉發證據技術分析：

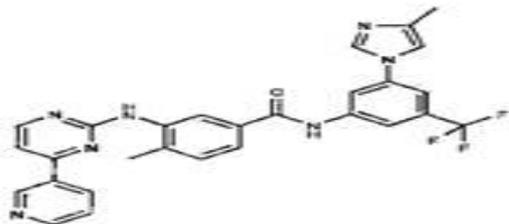
15 1、甲證11：

16 (1)、西元2005年5月6日公開第W02005/039586A1號專利案，其公
17 告日期早於系爭專利優先權日西元2005年7月20日及西元200

01 5年9月12日，可為系爭專利之先前技術。

02 (2)、甲證11說明書第6頁第1段揭露一種式I 之化合物，其為4-甲
03 基-N-[3- (4-甲基-咪唑-1-基) -5-三氟甲基-苯基]-3- (4-
04 吡啶-3-基-嘓啶-2-基胺基) -苯甲醯胺。

05

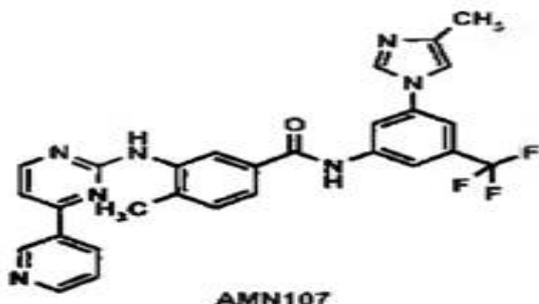


06 2、甲證12：

07 (1)、Weisberg等作者發表於Cancer Cell期刊, 2005 Feb;7, 129-1
08 41題目為Characterization of AMN107, a selective inhib
09 itor of native and mutant Bcr-Abl文獻，其公開日期早
10 於系爭專利優先權日西元2005年7月20日及西元2005年9月12
11 日，可為系爭專利之先前技術。

12 (2)、甲證12第130頁圖1A揭露一種化合物AMN107，即為甲證11之
13 式I化合物，第134頁之圖4B及第135頁表2進一步揭露AMN107
14 -AA(即AMN107之鹽酸鹽AMN107-HCl) 的藥物動力學數據。

15



16 3、甲證13：

17 (1)、Golemovic等作者發表於Clin Cancer Res. 5 2005 Jul 1, 1
18 1 (13):4941-7 題目為「AMN107, a novel aminopyrimidin
19 e inhibitor of Bcr-Abl, has in vitro activity agains
20 t imatinib-resistant chronic Myeloid leukemia」之文
21 獻，早於系爭專利優先權日西元2005年7月20日及西元2005
22 年9月12日，可為系爭專利之先前技術。

01 (2)、甲證13標題揭露AMN107可用於治療對imatinib有阻抗性之慢
02 性骨髓性白血病，其第4942頁右欄第3段進一步揭露所使用
03 之AMN107為AMN107單鹽酸鹽。

04 4、甲證14：

05 (1)、西元2004年1月15日公開第W02004/005281A1號專利案，其公
06 開日期早於系爭專利優先權日西元2005年7月20日及西元200
07 5年9月12日，可為系爭專利之先前技術。

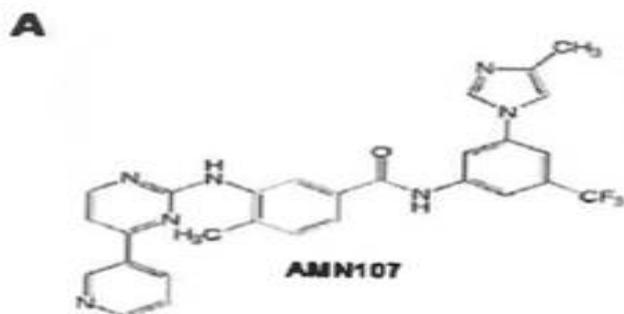
08 (2)、甲證14第63頁實施例92揭露實施例69（為實施例68之誤繕）
09 之『4-Methyl-3-[[4-(3-Pyridinyl)-2-pyrimidinyl]amin
10 o]-N-[[3-[(1-hydroxy-1-methyl-ethyl)]-5-(1,1,1-trifl
11 uoromethyl)phenyl]methyl]benzamide』化合物藉以製備為
12 『4-Methyl-3-[[4-(3-Pyridinyl)-2-pyrimidinyl]amino]-
13 N-[5-[(4-methyl-1H-imidazol-1-yl)-3-(trifluoromethyl
14)phenyl] benzamide』，此即為AMN107化合物。

15 5、甲證17：

16 (1)、O' Hare等作者發表於Cryst Eng Comm, 11 May 2005;7(55):
17 342-45之題目為「In vitro Activity of Bcr-Abl Inhibit
18 ors AMN107 and BMS-354825 against Clinically Relevan
19 t Imatinib-Resistant Abl Kinase Domain Mutants」文
20 獻，其公開日期早於系爭專利優先權日西元2005年7月20日
21 及西元2005年9月12日，可為系爭專利之先前技術。

22 (2)、甲證17第4501頁圖1A揭露AMN107化合物結構，詳如下圖。

23



24 6、甲證19：

25 (1)、Hynes等作者發表於Cancer, 1 June 2005;65(11):4500-5之
26 題目為「Hydrate formation in NH⁺containing salts of

- 01 pharmaceutically acceptable anions: A CSD survey」文
02 獻，其公開日期早於系爭專利優先權日西元2005年7月20日
03 及西元2005年9月12日，可為系爭專利之先前技術。
- 04 (2)、甲證19第1頁揭露特定機團鹽類形成水合物之分析，且第129
05 頁右欄第1至2行揭露「基於陰離子之研究，鹵化物 (halide
06 s) 相較於羧酸鹽 (carboxylate) 更容易形成水合物」。
- 07 7、甲證20：
- 08 (1)、Wermuth及Stahl兩作者發表於Handbook of Pharmaceutical
09 Salts: Properties, Selection, and Use 2002, Chapter 1
10 1, 131-145之題目為「Selected Procedures for the Prepa
11 ration of Pharmaceutically Acceptable Salts」文獻，
12 其公開日期早於系爭專利優先權日西元2005年7月20日及西
13 元2005年9月12日，可為系爭專利之先前技術。
- 14 (2)、甲證20第132頁揭露「鹽酸於其他時間當化學計量之水存在
15 下會與之形成水合物結晶」。
- 16 8、甲證21：
- 17 1、Byrn等作者發表於Pharmaceutical Research, 1995：12
18 (7)：945-54之題目為「Pharmaceutical Solids:A Strat
19 egic Approach to Regulatory Considerations」文獻，其
20 公開日期早於系爭專利優先權日西元2005年7月20日及西元2
21 005年9月12日，可為系爭專利之先前技術。
- 22 2、甲證21第147頁第22至24行揭露「當水分子合併於藥物原料
23 之晶格時即會形成水合物」，倒數第1至4行揭露「因為藥物
24 製造過程或藥物原料之儲存或藥物劑型之關係，故研究藥物
25 原料是否有多晶型或水合物之存在是明智的」。
- 26 (五)、爭點分析：
- 27 1、系爭專利請求項2、3對應之說明書內容違反核准時專利法第
28 26條第1項（可據以實現要件）之規定：
- 29 (1)、查核准時之專利審查基準第二篇發明專利實體審查第一章說
30 明書、申請專利範圍、摘要及圖式1.3.1可據以實現記載
31 「專利法第26條第1項規定『使該發明所屬技術領域中具有

01 通常知識者，能瞭解其內容，並可據以實現』，指說明書應
02 明確且充分記載申請專利之發明，記載之用語亦應明確，使
03 該發明所屬技術領域中具有通常知識者，在說明書、申請專
04 利範圍及圖式三者整體之基礎上，參酌申請時之通常知識，
05 無須過度實驗，即能瞭解其內容，據以製造及使用申請專利
06 之發明，解決問題，並且產生預期的功效」等內容。

07 (2)、系爭專利請求項2依附於請求項1，雖系爭專利請求項1業已
08 刪除，惟系爭專利請求項2於解釋上仍包含系爭專利請求項1
09 之全部技術特徵，系爭專利請求項3係依附於系爭專利請求
10 項2，系爭專利請求項3於解釋上仍包含系爭專利請求項2之
11 全部技術特徵，系爭專利請求項2之範圍應為：一種4-甲基-
12 N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡
13 啶-3-基-嘓啶-2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽「二水合物」之
14 大體上純淨之結晶型A，由具有「至少1個」選自8.5°、11.
15 0°、11.5°、17.2°、18.8°、19.2°、20.8°、22.1°及26.
16 0°(2θ度數)之最大之x-射線粉末繞射圖案表徵；其中
17 「大體上純淨」係指大於50%結晶4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪
18 唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓啶-2-基
19 胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽「二水合物」呈現於所述之結晶型
20 中；而系爭專利請求項3之範圍應為：一種4-甲基-N-[3-(4
21 -甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-
22 嘓啶-2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽「二水合物」之大體上純
23 淨之結晶型A，由具有「至少4個」選自8.5°、11.0°、11.
24 5°、17.2°、18.8°、19.2°、20.8°、22.1°及26.0°(2θ度
25 數)之最大之x-射線粉末繞射圖案表徵；其中「大體上純
26 淨」係指大於50%結晶4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-
27 5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓啶-2-基胺基)-苯
28 甲醯胺鹽酸鹽「二水合物」呈現於所述之結晶型中。

29 (3)、又系爭專利說明書第12頁倒數第4行至第13頁第14行記載
30 「本發明其他實施例係關於4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪
31 唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-

01 嘧啶-2-基胺基)- 苯甲醯胺之所述鹽之該等大體上純淨之
02 結晶型中的每一個。該鹽酸鹽之結晶型A係具有相對較差結
03 晶度之二水合物。……該鹽酸鹽之結晶型A之X-射線粉末繞
04 射圖案顯示有至少1個、更佳至少2個、進一步更佳至少4
05 個、且最佳全部選自約8.5°、11.0°、11.5°、17.2°、18.
06 8°、19.2°、20.8°、22.1°及26.0°(2θ度數)之最大值。本
07 發明一尤佳實施例係關於藉由圖2之XRPD表徵之4-甲基-N
08 -[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3
09 -(4-吡啶-3-基-嘧啶-2-基胺基)- 苯甲醯胺鹽酸鹽
10 之大體上純淨之結晶型A」，第14頁第16至18行揭露「與該
11 鹽酸鹽之結晶型A相關之其他結晶型包括結晶型A'及結晶型
12 A''，其分別表示結晶型A之單水合物及結晶型A之無水形
13 式」。

14 (4)、次查，系爭專利說明書第49頁第3至11行揭露「亦進一步對4
15 -甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-
16 苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘧啶-2-基胺基)- 苯甲醯
17 胺鹽酸鹽之結晶型A、結晶型B、結晶型C及非結晶型之全部
18 實施穩定性研究。對於結晶型A、B及C，在不同相對濕度下
19 貯存後未觀察到形式轉變；而該鹽酸鹽之非結晶型自發結晶
20 為結晶型A。此外，每一結晶型皆具有良好的化學穩定性，5
21 0°C時保持1個月，80°C時保持1個月且在80°C及75%相對濕度
22 下保持1個月，但結晶型C及非結晶型二者在上述最後一種條
23 件下顯示為與結晶型A之混合物」，就該發明所屬技術領域
24 中具有通常知識者可理解「4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪
25 唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-
26 嘧啶-2-基胺基)- 苯甲醯胺鹽酸鹽二水合物之結晶型A」
27 可於高相對濕度及不同高溫下(如：50°C)下具有儲存安定
28 性，不會轉變為其他結晶型；又查系爭專利說明書實例10，
29 其中表10所列溶劑乙醇、乙酸乙酯及乙腈，均可產生結晶型
30 A及B之混合晶型狀態，實施例27揭露將約100毫克4-甲基-
31 N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3

01 —(4-吡啶-3-基-嘧啶-2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽
02 之結晶型B在60°C下溶於約2毫升甲醇/水(99.0/1.0)中
03 (參見表16), 24小時後可測得具有結晶型SB及SC(混合晶
04 型狀態), 該發明所屬技術領域中具有通常知識者可理解
05 「混合晶型狀態」, 特別是結晶型A可與其他晶型呈混合晶
06 型狀態, 端視不同結晶步驟而定。

07 (5)、就系爭專利請求項2而言, 所申請者即為「一種4-甲基-N-[3
08 -(4-甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-
09 基-嘧啶-2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽二水合物之大體上純
10 淨之結晶型A」, 係以具有至少1個選自8.5°、11.0°、11.
11 5°、17.2°、18.8°、19.2°、20.8°、22.1°及26.0°(2θ度
12 數)之最大之x-射線粉末繞射圖案表徵加以界定, 查系爭
13 專利說明書第15頁第3至7行揭露「結晶型A」之XRPD最大
14 值為「至少1個、更佳至少2個、進一步更佳至少4個、且最佳
15 全部選自約4.5°、8.8°、11.5°、11.9°、13.0°、14.4°、1
16 4.8°、15.3°、16.9°、17.6°、19.2°、19.5°、19.9°、21.
17 3°、24.6°、25.4°、26.4°、27.9°及31.5°(2θ度數)之最
18 大值」, 而第15頁倒數第1至5行揭露「結晶型B」之XRPD最
19 大值為「至少1個、更佳至少2個、進一步更佳至少4個、且
20 最佳全部選自約7.2°、9.2°、11.4°、12.0°、12.3°、14.
21 6°、14.8°、15.7°、17.6°、19.2°、19.5°、20.5°、22.
22 0°、23.4°、23.9°、25.0°、25.5°、25.9°、27.0°(2θ度
23 數)之最大值」, 另第17頁第5至9行揭露「結晶型B'」之XRP
24 D最大值為「至少1個、更佳至少2個、進一步更佳至少4個、
25 且最佳全部選自約7.2°、9.2°、11.5°、12.0°、13.9°、14.
26 3°、15.4°、17.6°、18.6°、20.3°、21.7°、22.5°、23.
27 2°、24.7°、24.9°、25.2°、26.0°、26.6°、27.5°、28.
28 2°、29.2°及30.0°(2θ度數)之最大值」, 第18頁第4至6行
29 揭露「結晶型SB」之XRPD最大值為「至少1個、更佳至少2
30 個、進一步更佳至少4個、且最佳全部選自約7.5°、9.3°、1
31 1.5°、14.8°、19.4°、21.9°、23.0°、23.8°、24.9°、25.

01 6°、25.9°、26.3°及26.7°(2θ度數)之最大值」，第18頁
02 第11至15行揭露「結晶型SB'」之XRPD最大值為「至少1個、
03 更佳至少2個、進一步更佳至少4個、且最佳全部選自約7.
04 5°、9.3°、11.6°、12.4°、13.4°、13.8°、14.9°、19.7°、
05 20.2°、22.0°、23.0°、23.9°、24.2°、25.1°、26.0°、26.
06 8°、29.3°及30.7°(2θ度數)之最大值」，第19頁第2至5行
07 揭露「結晶型C」之XRPD最大值為「至少1個、更佳至少2
08 個、進一步更佳至少4個、且最佳全部選自約6.6°、7.0°、
09 8.9°、11.2°、11.8°、13.3°、14.0°、17.3°、18.4°、20.
10 0°、22.1°及23.0°(2θ度數)之最大值」，第21頁倒數第1
11 至4行揭露「結晶型SE」之XRPD最大值為「至少1個、更佳至
12 少2個、進一步更佳至少4個、且最佳全部選自約3.4°、4.
13 5°、5.1°、5.8°、7.2°、9.3°、10.1°、12.9°、13.3°、13.
14 8°、14.8°、15.7°、17.4°、19.6°、20.8°、21.3°、22.
15 5°、24.4°、25.5°、26.0°、27.4°及27.9°(2θ度數)之最
16 大值」，是以，該發明所屬技術領域中具有通常知識者可理
17 解結晶型A''、結晶型B、結晶型B'、結晶型SB、結晶型SB'、
18 結晶型C及結晶型SE均有1或2個XRPD最大值與結晶型A相同
19 (如：11.5°、19.2°、20.8°、22.1°及26.0°)，若結晶型A
20 僅以11.5°、19.2°、20.8°、22.1°及26.0°之「任1個」，甚
21 至「任2個」XRPD最大值加以界定，則可能顯示該結晶型中
22 可能混有與結晶型A之1或2個XRPD最大值相同之其他結晶
23 型，如請求項2係以1個19.2°XRPD最大值界定結晶型A，則結
24 晶型B之XRPD最大值亦同有19.2°，即會產生該結晶型A是否
25 混合有結晶型B之可能態樣(因系爭專利請求項2有界定大體
26 上純淨之結晶型A，係為該結晶型中大於50%結晶型A，其他
27 成分除包含雜質外，解釋上應不排除混有其他晶型可能
28 性)，查系爭專利說明書並未揭露在僅有1個或2個相同XRPD
29 最大值之界定下，需以何種技術手段判斷結晶型A含量百分
30 比大於50%(相對於結晶型A''、結晶型B、結晶型B'、結晶
31 型SB、結晶型SB'、結晶型C及結晶型SE)，是以，系爭專利

01 請求項2對應之說明書內容，未明確且充分揭露，無法使該
02 發明所屬技術領域中具有通常知識者能瞭解其內容並據以實
03 施而違反核准時專利法第26條第1項之規定。

04 (6)、另就系爭專利請求項3而言，所申請者即為「一種4-甲基-N-
05 [3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-
06 3-基-嘧啶-2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽二水合物之大體上
07 純淨之結晶型A」，係以具有「至少4個」選自 8.5° 、 $11.$
08 0° 、 11.5° 、 17.2° 、 18.8° 、 19.2° 、 20.8° 、 22.1° 及 $26.$
09 0° (2θ 度數)之最大之x-射線粉末繞射圖案表徵加以界
10 定，且該結晶型A可穩定存在，亦無與系爭專利說明書所揭
11 露之各種結晶型(A、A'、A''、B'、B、SB、SB'、C、C'、SC
12 及SE)之XRPD最大值中有「4個以上」數值之相同重複，惟
13 查系爭專利說明書第14頁第19至23行揭露「該鹽酸鹽之結晶
14 型A'(單水合物)之x-射線粉末繞射圖案顯示有至少1個、更
15 佳至少2個、進一步更佳至少4個、且更佳全部選自『約』 $4.$
16 3° 、 8.6° 、 11.6° 、 12.1° 、 17.1° 、 20.6° 、 24.5° 、 25.3° 、
17 25.8° 、 27.3° 及 31.6° (2θ 度數)之最大值」，第15頁第2至
18 7行揭露「該鹽酸鹽之結晶型A''(無水)之x-射線粉末繞射圖
19 案顯示至少1個、更佳至少2個、進一步更佳至少4個、且更
20 佳全部選自『約』 4.5° 、 8.8° 、 11.5° 、 11.9° 、 13.0° 、 $14.$
21 4° 、 14.8° 、 15.3° 、 16.9° 、 17.6° 、 19.2° 、 19.5° 、 $19.$
22 9° 、 21.3° 、 24.6° 、 25.4° 、 26.4° 、 27.9° 及 31.5° (2θ 度
23 數)之最大值」，第15頁倒數第1至5行揭露「該鹽酸鹽之結
24 晶型B之x-射線粉末繞射圖案顯示至少1個、更佳至少2個、
25 進一步更佳至少4個、且更佳全部選自『約』 7.2° 、 9.2° 、 1
26 1.4° 、 12.0° 、 12.3° 、 14.6° 、 14.8° 、 15.7° 、 17.6° 、 $19.$
27 2° 、 19.5° 、 20.5° 、 22.0° 、 23.4° 、 23.9° 、 25.0° 、 $25.$
28 5° 、 25.9° 、 27.0° (2θ 度數)之最大值」，第18頁第4至6行
29 揭露「該鹽酸鹽之結晶型SB之x-射線粉末繞射圖案顯示至少
30 1個、更佳至少2個、進一步更佳至少4個、且更佳全部選自
31 『約』 7.5° 、 9.3° 、 11.5° 、 14.8° 、 19.4° 、 21.9° 、 $23.$

01 0°、23.8°、24.9°、25.6°、25.9°、26.3°及26.7°(2θ度
02 數)之最大值」，第19頁第2至5行揭露「該鹽酸鹽之結晶型
03 C之x-射線粉末繞射圖案顯示至少1個、更佳至少2個、進一
04 步更佳至少4個、且更佳全部選自『約』6.6°、7.0°、8.
05 9°、11.2°、11.8°、13.3°、14.0°、17.3°、18.4°、20.
06 0°、22.1°及23.0°(2θ度數)之最大值」，第20頁倒數第3
07 行至第21頁第2行揭露「該鹽酸鹽之結晶型SC之x-射線粉末
08 繞射圖案顯示至少1個、更佳至少2個、進一步更佳至少4
09 個、且更佳全部選自『約』6.5°、7.3°、9.1°、10.8°、12.
10 1°、13.0°、14.5°、14.9°、18.9°、19.4°、24.2°、25.
11 0°、25.4°、26.2°、27.4°及28.4°(2θ度數)之最大值」，
12 再查，系爭專利說明書第10頁第2至4行揭露「關於XRPD最大
13 值(以°表示)之詞語『約』通常係指在給定值之0.3°以內，
14 更佳0.2°以內，且最佳0.1°以內。或者，當為熟習此項技術
15 之通常知識者所考慮時，詞語『約』(在此處及全文中)係指
16 在可接受之平均值標準誤差內」，故考量「±0.2」、「±0.
17 3」之誤差值範圍，上開結晶型A'、結晶型A"、結晶型B、結
18 晶型SB、結晶型C、結晶型SC之XRPD最大值「至少有4個數
19 值」會涵蓋結晶型A之至少有4個XRPD最大值(參下表)，故
20 若僅以至少4個「落入」上開結晶型A'、結晶型A"、結晶型
21 B、結晶型SB、結晶型C、結晶型SC之XRPD最大值誤差範圍之
22 數值界定結晶型A(如：8.5°、11.0°、11.5°、17.2°、19.
23 2°、20.8°、22.1°等)，即有可能為結晶型A混合有其他與
24 結晶型A至少4個XRPD最大值落入誤差範圍之晶型(如：結晶
25 型A')之態樣，同前所述，系爭專利說明書未揭露結晶型A之
26 XRPD最大值與結晶型A'、結晶型A"、結晶型B、結晶型SB、
27 結晶型C、結晶型SC之XRPD最大值誤差範圍至少有4個數值範
28 圍重複下，需以何種技術手段判斷結晶型A含量百分比大於5
29 0%(相對於結晶型A'、結晶型A"、結晶型B、結晶型SB、結
30 晶型C、結晶型SC)，是以，系爭專利請求項3對應系爭專利
31 說明書內容，未明確且充分揭露，無法使該發明所屬技術領

01
02
03

域中具有通常知識者能瞭解其內容並據以實施，而違反核准時專利法第26條第1項之規定。

結晶型A之XRPD最大值
8.5°、11.0°、11.5°、17.2°、18.8°、19.2°、20.8°、22.1°及26.0°
結晶型A'之XRPD最大值
4.3°、8.6°、11.6°、12.1°、17.1°、20.6°、24.5°、25.3°、25.8°、27.3°及31.6° 在「±0.2」、「±0.3」之誤差值範圍與結晶型A之XRPD最大值重疊之值
8.6°、11.6°、17.1°、20.6°、25.8°
結晶型A"之XRPD最大值
4.5°、8.8°、11.5°、11.9°、13.0°、14.4°、14.8°、15.3°、16.9°、17.6°、19.2°、19.5°、19.9°、21.3°、24.6°、25.4°、26.4°、27.9°及31.5° 在「±0.2」、「±0.3」之誤差值範圍與結晶型A之XRPD最大值重疊之值
8.8°、11.5°、16.9°、19.2°
結晶型B之XRPD最大值
7.2°、9.2°、11.4°、12.0°、12.3°、14.6°、14.8°、15.7°、17.6°、19.2°、19.5°、20.5°、22.0°、23.4°、23.9°、25.0°、25.5°、25.9°、27.0° 在「±0.2」、「±0.3」之誤差值範圍與結晶型A之XRPD最大值重疊之值
11.4°、19.2°、19.5°、20.5°、22.0°、25.9°
結晶型SB之XRPD最大值
7.5°、9.3°、11.5°、14.8°、19.4°、21.9°、23.0°、23.8°、24.9°、25.6°、25.9°、26.3°及26.7°

<p>在「±0.2」、「±0.3」之誤差值範圍與結晶型A之XRPD最大值重疊之值</p> <p>11.5°、19.4°、21.9°、25.9°</p>
<p>結晶型C之XRPD最大值</p> <p>6.6°、7.0°、8.9°、11.2°、11.8°、13.3°、14.0°、17.3°、18.4°、20.0°、22.1°及23.0°</p> <p>在「±0.2」、「±0.3」之誤差值範圍與結晶型A之XRPD最大值重疊之值</p> <p>11.2°、11.8°、17.3°、22.1°</p>
<p>結晶型SC之XRPD最大值</p> <p>6.5°、7.3°、9.1°、10.8°、12.1°、13.0°、14.5°、14.9°、18.9°、19.4°、24.2°、25.0°、25.4°、26.2°、27.4°及28.4°</p> <p>在「±0.2」、「±0.3」之誤差值範圍與結晶型A之XRPD最大值重疊之值</p> <p>10.8°、18.9°、19.4°、26.2°</p>

02 (7)、參加人雖謂系爭專利之請求項所載「大體上純淨」之結晶型
03 ，主要形成結晶體時，可能會有些雜質存在於結晶體內，因
04 此有各種有關結晶體內雜質的研究，而本領域通常知識可以
05 高效能液相層析法（High Performance Liquid Chromatogr
06 aphy, HPLC）測量純度，如系爭專利說明書表21等云云，惟
07 查該發明所屬技術領域中具有通常知識者可理解系爭專利說
08 明書表21所揭露之HPLC純度（面積%）係以高效能液相層析
09 法測量其結晶型之純度（若有雜質或不純物可於HPLC圖譜中
10 以其與待測主成分不同滯留時間之波峰顯示，可與待測主成
11 分區隔），且待分析物係以溶解於溶液之形式進行分析，其
12 結晶型態於溶液形式中已不復存在，故對於前開混合晶型之
13 態樣，是否可為高效能液相層析法所鑑別已然超出申請時通
14 常知識之範圍，更未記載高效能液相層析法於混合晶型態樣
15 下可鑑別結晶型A大於50%之步驟，亦未揭露其實施例佐證

01 是以該發明所屬技術領域中具有通常知識者參酌系爭專利
02 說明書表21僅能理解該高效能液相層析法可應用於結晶型純
03 度分析，尚無法理解對於前開混合晶型之態樣下，如何鑑別
04 結晶型A且該結晶型A大於50%，系爭專利說明書當有前開未
05 明確且充分揭露，無法使該發明所屬技術領域中具有通常知
06 識者能瞭解其內容並據以實施之問題。

07 (8)、原告雖於舉發理由稱「系爭專利並未說明如何取得製備各晶
08 型所需之起始物，即4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5
09 -三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓啶-2-基胺基)-苯甲
10 醯胺之鹽酸鹽或游離鹼或提供該鹽酸鹽或游離鹼之製備方
11 法」云云。惟查，系爭專利說明書第7頁第5至8行記載「下
12 式之化合物4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5
13 -三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓啶-2-基胺
14 基)-苯甲醯胺係闡述於WO 2004/005281 A1之實例92中」，
15 是以，該發明所屬技術領域中具有通常知識者可獲致4-甲
16 基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯
17 基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓啶-2-基胺基)-苯甲醯胺
18 可以被製備，由於一個醫藥化合物鹽類之形成，本即屬於酸
19 鹼中和反應，故當4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-
20 基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓啶-2
21 -基胺基)-苯甲醯胺溶於進行反應之溶劑時，即成為鹼性
22 離子化合物，此即為游離鹼形式，尚難謂系爭專利說明書未
23 揭露4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5-三氟
24 甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓啶-2-基胺基)-
25 苯甲醯胺之游離鹼及製備方法；又系爭專利說明書實例23記
26 載「將4.0克4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5
27 -三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓啶-2-基胺
28 基)-苯甲醯胺游離鹼在50°C下溶於60毫升甲醇中。以存於2
29 毫升甲醇之溶液形式添加1.05當量(688.7微升)氫氯酸。使
30 該溶液在50°C下靜置60分鐘。使該溶液冷卻至42°C且在此溫
31 度下保持15分鐘。添加存於甲醇(40毫克)/水(0.4毫克)中且

01 在超聲波浴中均質化10秒之4毫克4-甲基-N-[3-(4-甲
02 基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3
03 -基-嘧啶-2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽懸浮液」，即已
04 揭露以4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5-三
05 氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘧啶-2-基胺基)
06 -苯甲醯胺游離鹼形式經酸鹼中和反應形成鹽酸鹽，亦難謂
07 系爭專利說明書未揭露4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-
08 1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘧啶
09 -2-基胺基)-苯甲醯胺之鹽酸鹽及製備方法。

10 (9)、是以，系爭專利請求項2、3所對應系爭專利說明書部分，並
11 未明確且充分揭露，無法使該發明所屬技術領域中具有通常
12 知識者能瞭解其內容，並據以實施，固有違反核准時專利法
13 第26條第1項之規定。

14 2、系爭專利請求項2、3違反核准時專利法第26條第2項（明確
15 要件）：

16 (1)、查核准時之專利審查基準第二篇發明專利實體審查第一章說
17 明書、申請專利範圍、摘要及圖式2.4.1明確記載「請求項
18 應明確，指每一請求項之記載應明確，且所有請求項整體之
19 記載亦應明確，使該發明所屬技術領域中具有通常知識者，
20 單獨由請求項之記載內容，即可明確瞭解其意義，而對其範
21 圍不會產生疑義。具體而言，即每一請求項中記載之範疇及
22 必要技術特徵應明確，且每一請求項之間的依附關係亦應明
23 確。解釋請求項時得參酌說明書、圖式及申請時之通常知
24 識」，2.4.1.2說明書與請求項不一致記載「說明書與請求
25 項之記載不一致，而可能使請求項不明確。例如依『說明書
26 之記載』，並參酌申請時之通常知識，認定獨立項未敘明必
27 要技術特徵，而導致請求項不明確。此外，審查時若認為獨
28 立項未敘明必要技術特徵，亦可能導致請求項無法為說明書
29 所支持，或導致申請專利之發明違反可據以實現要件」。又
30 核准時專利審查基準第二篇發明專利實體審查第十三章醫藥
31 相關發明4.2.1.1化合物請求項記載「……申請專利之發明

01 為化合物之結晶物時，原則上，請求項應以具有其技術特徵
02 之物理、化學特性，例如X射線粉末繞射、X射線單晶繞射、
03 IR、Raman、NMR 等光譜分析法、或DTA、TGA、DSC 等熱分
04 析方法之數值界定其『晶體結構』，使該發明所屬技術領域
05 中具有通常知識者足以認定申請專利之發明與先前技術之區
06 別。請求項撰寫為『一種化合物 X之多晶型』，因所述之多
07 晶型A型是任意的名稱，並無技術特徵之描述，是不明確
08 的」，故就本案而言，結晶型A僅是一任意名稱，該發明所
09 屬技術領域中具有通常知識者可理解當請求項之發明為化合
10 物結晶型，則必須特別以「X 射線粉末繞射」分析法所得之
11 數值加以界定，即晶體結構之特性係由前開分析數值所賦
12 予，故系爭專利請求項2或3所請一種4-甲基-N-[3-（4-甲
13 基-咪唑-1-基）-5-三氟甲基-苯基]-3-（4-吡啶-3-基-噻
14 啶-2-基胺基）-苯甲醯胺鹽酸鹽二水合物之大體上純淨之結
15 晶型A，所請該晶體結構特徵係由所記載之x-射線粉末繞射
16 圖案（ 2θ 度數）之最大值加以界定。

17 (2)、原告主張中國藥典有關粉末X射線衍射法（即XRPD）章節記
18 載：「晶態物質的粉末X射線衍射峰是由數十乃至上百個銳
19 峰（窄峰）組成；而非晶態物質的粉末X射線衍射峰的數量較
20 少且呈瀰散狀（為寬峰或饅頭峰）」（參甲證7第56頁右欄
21 之「第二法」一節）之說明可知，不管是結晶型或非結晶型
22 物質，其XRPD均具有峰值，而結晶型應至少具有數十個峰
23 值，方可有別於仍具有少量峰值之非結晶型，歐洲藥典中，
24 於有關XRPD之晶體特性章節（甲證6之第383頁左欄倒數第二
25 段）亦明確記載：「It is generally sufficient to scan
26 past the 10 strongest reflections identified in single
27 phase XRPD database files」，美國藥典亦出現同樣內
28 容於甲證5第431頁左欄第一段，可證藉由XRPD定性結晶類型
29 ，通常須包含十個（ 2θ 度數）最大值來作為x-射線粉末繞
30 射圖案表徵，方足以使該領域具有通常知識者判定其結晶型
31 云云，惟查關於上開中國藥典、歐洲藥典及美國藥典均是針

01 對藥物成分之研究分析為出發點，當一藥物成分結晶型態是
02 以X射線粉末繞射（XRPD）之方式分析時，所呈現之數
03 十個峰值，均是代表此化合物結晶型晶體結構之特性，就藥
04 物成分開發之立場，自當將該特性盡量揭露並瞭解，是以，
05 若測出有多少個窄峰峰值，自應將其盡量全部揭露，然核准
06 時專利法第26條第2項之明確要件，卻與藥物成分開發之精
07 神不同，上開醫藥相關發明審查基準相關規定內容，X射線
08 粉末繞射（XRPD）之峰值之界定係為與先前技術有所區分，
09 或上開專利審查基準明確要件規定內容，依據說明書之記載
10 ，參酌申請時之通常知識，考量請求項之結晶型發明是否記
11 載必要技術特徵，可以X射線粉末繞射（XRPD）之峰值加以
12 界定其化合物結晶型，惟均未明確規定須以多少個X射線粉
13 末繞射之測定峰值藉以界定化合物結晶型特徵方屬明確，故
14 只要該X射線粉末繞射之測定峰值之界定足以與先前技術有
15 所區隔，或已記載足夠之必要技術特徵，單就系爭專利請求
16 項2中界定最少1個，系爭專利請求項3中界定最少4個（ 2θ
17 度數）最大值來作為X-射線粉末繞射圖案表徵，尚難謂不明
18 確，惟本案系爭專利請求項2及3，該發明所屬技術領域中具
19 有通常知識者參考系爭專利說明書確有未記載必要技術特徵
20 之問題（詳後述），而有記載不明確之態樣。

21 (3)、承上，然就系爭專利請求項2而言，若以「1個」選自 8.5° 、
22 11.0° 、 11.5° 、 17.2° 、 18.8° 、 19.2° 、 20.8° 、 22.1° 及 $26.$
23 0° （ 2θ 度數）之最大之X-射線粉末繞射圖案表徵，如：
24 「 11.5° 」，加以界定「4-甲基-N-[3-（4-甲基-咪唑-1-
25 基）-5-三氟甲基-苯基]-3-（4-吡啶-3-基-嘓啶-2-基胺
26 基）-苯甲醯胺鹽酸鹽二水合物之大體上純淨之結晶型A」之
27 「晶體結構」，即可能會與結晶型A''、結晶型B'及結晶型SB
28 之XRPD最大值之一（ 11.5° ）所界定者相同，然所請之結晶
29 型A的晶體結構係由XRPD最大值所界定賦予，結晶型A僅為一
30 「任意名稱」，進而造成該發明所屬技術領域中具有通常知
31 識者無法判讀系爭專利請求項2之發明究係「大體上純淨之

01 結晶型A」，還是「大體上純淨之結晶型A''」、「大體上純
02 淨之結晶型B'」、「大體上純淨之結晶型SB」（承上述，系
03 爭專利說明書均明確記載有可以至少1個XRPD最大值界定結
04 晶型A''、B'、SB），有未記載必要技術特徵，而記載不明確
05 之情形，故系爭專利請求項2違反核准時專利法第26條第2項
06 之規定。另就系爭專利請求項3而言，若以「4個以上」選自
07 8.5°、11.0°、11.5°、17.2°、18.8°、19.2°、20.8°、22.
08 1°及26.0°（2θ度數）之最大之x-射線粉末繞射圖案表
09 徵，雖與系爭專利說明書所揭露之各種結晶型（A、A'、
10 A''、B、B'、SB、SB'、C、C'、SC及SE）之（2θ度數）最大
11 值之x-射線粉末繞射圖案表徵不具有4個以上數值相同，惟
12 查系爭專利說明書第14頁第19至22行揭露「該鹽酸鹽之結晶
13 型A'（單水合物）之x-射線粉末繞射圖案顯示有至少1個、更
14 佳至少2個、進一步更佳至少4個、且更佳全部選自『約』4.
15 3°、8.6°、11.6°、12.1°、17.1°、20.6°、24.5°、25.3°、
16 25.8°、27.3°及31.6°」，第15頁第2至6行揭露「該鹽酸鹽
17 之結晶型A''（無水）之x-射線粉末繞射圖案顯示至少1個、更
18 佳至少2個、進一步更佳至少4個、且更佳全部選自『約』4.
19 5°、8.8°、11.5°、11.9°、13.0°、14.4°、14.8°、15.3°、
20 16.9°、17.6°、19.2°、19.5°、19.9°、21.3°、24.6°、25.
21 4°、26.4°、27.9°及31.5°」，第15頁倒數第1至5行揭露
22 「該鹽酸鹽之結晶型B之x-射線粉末繞射圖案顯示至少1個、
23 更佳至少2個、進一步更佳至少4個、且更佳全部選自『約』
24 7.2°、9.2°、11.4°、12.0°、12.3°、14.6°、14.8°、15.
25 7°、17.6°、19.2°、19.5°、20.5°、22.0°、23.4°、23.
26 9°、25.0°、25.5°、25.9°、27.0°」，第18頁第2至6行揭露
27 「該鹽酸鹽之結晶型SB之x-射線粉末繞射圖案顯示至少1
28 個、更佳至少2個、進一步更佳至少4個、且更佳全部選自
29 『約』7.5°、9.3°、11.5°、14.8°、19.4°、21.9°、23.
30 0°、23.8°、24.9°、25.6°、25.9°、26.3°及26.7°」，第19
31 頁第2至5行揭露「該鹽酸鹽之結晶型C之x-射線粉末繞射圖

01 案顯示至少1個、更佳至少2個、進一步更佳至少4個、且更
02 佳全部選自『約』 6.6° 、 7.0° 、 8.9° 、 11.2° 、 11.8° 、 $13.$
03 3° 、 14.0° 、 17.3° 、 18.4° 、 20.0° 、 22.1° 及 23.0° 」，第20
04 頁倒數第3行至第21頁第2行揭露「該鹽酸鹽之結晶型SC之X-
05 射線粉末繞射圖案顯示至少1個、更佳至少2個、進一步更佳
06 至少4個、且更佳全部選自『約』 6.5° 、 7.3° 、 9.1° 、 $10.$
07 8° 、 12.1° 、 13.0° 、 14.5° 、 14.9° 、 18.9° 、 19.4° 、 $24.$
08 2° 、 25.0° 、 25.4° 、 26.2° 、 27.4° 及 28.4° 」，再查，系爭
09 專利說明書第10頁第2至6行揭露「關於XRPD最大值(以 $^{\circ}$ 表
10 示)之詞語『約』通常係指在給定值之 0.3° 以內，更佳 0.2°
11 以內，且最佳 0.1° 以內。或者，當為熟習此項技術之普通人
12 員所考慮時，詞語『約』(在此處及全文中)係指在可接受之
13 平均值標準誤差內」，故考量「 ± 0.2 」、「 ± 0.3 」之誤差值
14 範圍，上開結晶型A'、結晶型A''、結晶型B、結晶型SB、結
15 晶型C、結晶型SC之XRPD最大值至少有4個數值誤差範圍涵蓋
16 結晶型A之XRPD最大值，然所請之結晶型A的晶體結構係由XR
17 PD最大值所界定賦予，結晶型A僅為一「任意名稱」，進而
18 造成該發明所屬技術領域中具有通常知識者無法判讀系爭專
19 利請求項3之發明究係「大體上純淨之結晶型A」，還是「大
20 體上純淨之結晶型A'」、「大體上純淨之結晶型A''」、「大
21 體上純淨之結晶型B」、「大體上純淨之結晶型SB」、「大
22 體上純淨之結晶型C」、「大體上純淨之結晶型SC」(承上
23 述，系爭專利說明書均載有可以至少4個XRPD最大值界定結
24 晶型A'、A''、B、SB、C、SC)，有未記載必要技術特徵，而
25 有記載不明確之情形，故系爭專利請求項3有違反核准時專
26 利法第26條第2項之規定。

27 (4)、被告雖主張「並非僅具有『至少1個或至少4個之峰值表徵』
28 之化合物即會落入系爭專利請求項2至3的範圍內，系爭專利
29 請求項2至3實質上為一種特定化合物之二水合物結晶型A，
30 故其本質上亦具有該化合物之二水合物結晶型A的固有性質
31 如固有速率等(系爭專利說明書之表23)」，故該發明所屬技

01 術領域中具有通常知識者在獲得一種鹽酸鹽之結晶體時，自
02 可根據所記載之『至少1個或至少4個之峰值表徵』以及『說
03 明書所載之性質』，明確區分出該結晶體是否落入系爭專利
04 請求項2至3之範圍」云云，惟按發明專利權範圍，以申請專
05 利範圍為準，於解釋申請專利範圍時，並得審酌說明書及圖
06 式，核准時專利法第58條第4項定有明文。是解釋申請專利
07 範圍時，得審酌說明書及圖式，俾以瞭解該發明之目的、作
08 用及效果，惟申請專利範圍係就說明書中所載實施方式或實
09 施例作總括性之界定，除非說明書中已明確表示申請專利範
10 圍之內容應限於實施例及圖式，否則不得將說明書及圖式之
11 限制條件讀入申請專利範圍，而變更申請專利範圍對外公告
12 而客觀表現之專利權範圍（最高行政法院109年判字第130號
13 判決意旨參照），而關於核准時之醫藥相關發明審查基準已
14 明確規定當請求項所請化合物為結晶物時，其對於結晶型之
15 命名，如「一種化合物X之多晶型A型」，其多晶型A型僅為
16 一任意名稱，其晶型結構係由X射線粉末繞射法分析方法數
17 值界定，而系爭專利請求項2至3所請均為一種4-甲基-N-[3-
18 (4-甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-
19 基-嘓啶-2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽二水合物之結晶型A，
20 分別以至少1個或至少4個之x-射線粉末繞射之（ 2θ 度數）
21 最大值界定，故系爭專利請求項2至3所界定之範圍自有不
22 同，若依據被告主張直接將系爭專利說明書對於結晶型A之
23 固有性質讀入系爭專利請求項2至3一種4-甲基-N-[3-(4-甲
24 基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓
25 啶-2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽二水合物之結晶型A而賦予
26 該結晶型A特定性質，從而主張以至少1個或至少4個之x-射
27 線粉末繞射之（ 2θ 度數）最大值「界定」系爭專利請求項2
28 至3所請一種4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲
29 基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓啶-2-基胺基)-苯甲醯胺鹽
30 酸鹽二水合物之結晶型A可明確區分，未有上開記載不明確
31 之問題，當已違反請求項禁止讀入原則，應不足採。

01 (5)、另參加人主張原告所論及系爭專利請求項2至3所請「結晶型
02 A」，該等請求項已界定4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-
03 基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓啶-2-基胺
04 基)-苯甲醯胺鹽酸鹽之「結晶型A」為「二水合物」，而其
05 為系爭專利說明書中僅有的「二水合物」，故可輕易與其他
06 結晶型區分，被告主張系爭專利請求項2至3所請之二水合物
07 結晶型A為系爭專利所製備出之唯一的二水合物，其餘結晶
08 型皆非二水合物，系爭專利請求項2至3所記載之化學名稱即
09 足以與系爭專利之其他晶型有所區隔等云云。惟查系爭專利
10 請求項2、3所請係為4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5-
11 -三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓啶-2-基胺基)-苯甲
12 醯胺鹽酸鹽二水合物之結晶型A，其所請範圍係為一特定晶
13 體結構，其晶體結構特徵須由X-射線粉末繞射之(2θ 度
14 數)最大值界定，不同之X-射線粉末繞射之(2θ 度數)最
15 大值方有與其他結晶型之晶體結構鑑別之效果，「二水合
16 物」之有無，屬化合物結構上之差異，與如何區分其他結晶
17 型無涉，退步言，如4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5-
18 -三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓啶-2-基胺基)-苯甲
19 醯胺「鹽酸鹽二水合物」之結晶型A與4-甲基-N-[3-(4-甲
20 基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓
21 啶-2-基胺基)-苯甲醯胺「鹽酸鹽」之結晶型B'之晶體結構
22 若皆以1個X-射線粉末繞射之(2θ 度數)最大值「 11.5° 」
23 界定，則會導致不同分子化合物結構，但是其晶體結構特徵
24 相同，有違藥學相關科學原理，更證實系爭專利請求項2及3
25 有未記載必要技術特徵，而有記載不明確之情形，故化學結
26 構之不同與晶體結構之鑑別，分屬二事，參加人及被告之主
27 張均不可採。

28 (6)、至於原告雖主張根據系爭專利說明書第12至23頁所揭露的內
29 容，可知系爭專利所請的鹽酸鹽至少包含結晶型A、A'、
30 A''、B、B'、SB、SB'、C、C'、SC及SE等多種晶型種類，其
31 中系爭專利請求項2至3所請的結晶型A之XRPD最大值，在

01 「±0.2」、±0.3」之誤差值範圍內，與結晶型A'、A''、
02 B、B'、SB、SB'、C、C'、SC、D及SE產生至少1個、甚至6個
03 數值相同或重疊而導致無法判讀是否為結晶型A或其他晶型
04 云云，惟查系爭專利說明書第10頁第2至6行揭露「關於XRPD
05 最大值(以°表示)之詞語『約』通常係指在給定值之0.3°以
06 內，更佳0.2°以內，且最佳0.1°以內。或者，當為熟習此項
07 技術之普通知識者所考慮時，詞語『約』(在此處及全文中)
08 係指在可接受之平均值標準誤差內」，而系爭專利請求項2
09 至3，均無以「約」界定其XRPD最大值，於解釋系爭專利請
10 求項2至3時，自當不能將XRPD最大值，以「±0.2」、「±0.
11 3」之誤差值範圍作文義解釋，故原告所主張因考量誤差範
12 圍後解釋系爭專利請求項2及3之結晶型A可能與其他晶型之X
13 RPD最大值重疊，而導致無法判讀其結晶型是否為結晶型A，
14 其解釋方式有誤，尚不足採。

15 3、系爭專利請求項2、3違反核准時專利法第26條第2項（支持
16 要件）：

17 (1)、查核准時專利審查基準第二篇發明專利實體審查第13章醫藥
18 相關發明4.2.3為說明書所支持有「有關化合物請求項，必
19 須考慮該申請專利範圍是否得到說明書之支持，亦即基於說
20 明書所揭露之內容，利用例行之實驗或分析方法是否足以將
21 說明書所載之內容延伸到請求項之範圍，或對於說明書所揭
22 露之內容是否僅做明顯之修飾即能獲致者」之記載，而系爭
23 專利請求項2係為一種4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-
24 5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓啶-2-基胺基)-苯
25 甲醯胺鹽酸鹽「二水合物」之大體上純淨之結晶型A，由具
26 有「至少1個」選自8.5°、11.0°、11.5°、17.2°、18.8°、1
27 9.2°、20.8°、22.1°及26.0°(2θ度數)之最大値之x-射線
28 粉末繞射圖案表徵；其中「大體上純淨」係指大於50%結晶4
29 -甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-
30 (4-吡啶-3-基-嘓啶-2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽「二水合
31 物」呈現於所述之結晶型中，若依據「1個」最大値之x-射

01 線粉末繞射圖案表徵以界定該結晶型A之晶體結構，如選擇
02 以 11.5° x-射線粉末繞射圖案表徵最大值界定結晶型A，則可
03 能無法與其他結晶型區隔，且所請之結晶型A的晶體結構係
04 由XRPD最大值所界定賦予，結晶型A僅為一「任意名稱」，
05 則實際上無法鑑別「大體上純淨結晶型A」抑或是「大體上
06 純淨結晶型A''、結晶型B'、結晶型SB（均有 11.5° x-射線粉
07 末繞射圖案表徵最大值）」（承上述，系爭專利說明書均明
08 確記載有可以至少1個XRPD最大值界定結晶型A''、B'、S
09 B），進者，亦可能呈現混合晶型狀態，即「大體上純淨結
10 晶型A」混有結晶型A''、結晶型B'、結晶型SB，已如前述，
11 而系爭專利說明書並未揭露「單一結晶型」態樣下，如何判
12 別所界定之結晶型，定為結晶型A，而非其他結晶型，如：
13 結晶型A''，或「混合晶型」態樣下，確認結晶型A大於5
14 0%，故系爭專利請求項2「無法」為系爭專利說明書所支
15 持，違反核准時專利法第26條第2項之規定。

16 (2)、另關於系爭專利請求項3部分，若以「4個或以上」選自 $8.$
17 5° 、 11.0° 、 11.5° 、 17.2° 、 18.8° 、 19.2° 、 20.8° 、 22.1°
18 及 26.0° （ 2θ 度數）之最大值之x-射線粉末繞射圖案表徵界
19 定結晶型A之晶體結構，雖與系爭專利說明書所揭露之各種
20 結晶型（A、A'、A''、B、B'、SB、SB'、C、C'、SC、D及S
21 E）之（ 2θ 度數）最大值之x-射線粉末繞射圖案表徵不具有
22 4個以上相同數值，惟查系爭專利說明書第14頁第19至22行
23 揭露「該鹽酸鹽之結晶型A'（單水合物）之x-射線粉末繞射圖
24 案顯示有至少1個、更佳至少2個、進一步更佳至少4個、且
25 更佳全部選自『約』 4.3° 、 8.6° 、 11.6° 、 12.1° 、 17.1° 、 2
26 0.6° 、 24.5° 、 25.3° 、 25.8° 、 27.3° 及 31.6° 」，第15頁第2
27 至6行揭露「該鹽酸鹽之結晶型A''（無水）之x-射線粉末繞射
28 圖案顯示至少1個、更佳至少2個、進一步更佳至少4個、且
29 更佳全部選自『約』 4.5° 、 8.8° 、 11.5° 、 11.9° 、 13.0° 、 1
30 4.4° 、 14.8° 、 15.3° 、 16.9° 、 17.6° 、 19.2° 、 19.5° 、 $19.$
31 9° 、 21.3° 、 24.6° 、 25.4° 、 26.4° 、 27.9° 及 31.5° 」，第15

01 頁倒數第1至5行揭露「該鹽酸鹽之結晶型B之x-射線粉末繞
02 射圖案顯示至少1個、更佳至少2個、進一步更佳至少4個、
03 且更佳全部選自『約』 7.2° 、 9.2° 、 11.4° 、 12.0° 、 $12.$
04 3° 、 14.6° 、 14.8° 、 15.7° 、 17.6° 、 19.2° 、 19.5° 、 $20.$
05 5° 、 22.0° 、 23.4° 、 23.9° 、 25.0° 、 25.5° 、 25.9° 、 $27.$
06 0° 」，第18頁第2至6行揭露「該鹽酸鹽之結晶型SB之x-射線
07 粉末繞射圖案顯示至少1個、更佳至少2個、進一步更佳至少
08 4個、且更佳全部選自『約』 7.5° 、 9.3° 、 11.5° 、 14.8° 、 1
09 9.4° 、 21.9° 、 23.0° 、 23.8° 、 24.9° 、 25.6° 、 25.9° 、 $26.$
10 3° 及 26.7° 」，第19頁第2至5行揭露「該鹽酸鹽之結晶型C之
11 x-射線粉末繞射圖案顯示至少1個、更佳至少2個、進一步更
12 佳至少4個、且更佳全部選自『約』 6.6° 、 7.0° 、 8.9° 、 $11.$
13 2° 、 11.8° 、 13.3° 、 14.0° 、 17.3° 、 18.4° 、 20.0° 、 22.1°
14 及 23.0° 」，第20頁倒數第3行至第21頁第2行揭露「該鹽酸
15 鹽之結晶型SC之x-射線粉末繞射圖案顯示至少1個、更佳至
16 少2個、進一步更佳至少4個、且更佳全部選自『約』 6.5° 、
17 7.3° 、 9.1° 、 10.8° 、 12.1° 、 13.0° 、 14.5° 、 14.9° 、 $18.$
18 9° 、 19.4° 、 24.2° 、 25.0° 、 25.4° 、 26.2° 、 27.4° 及 $28.$
19 4° 」，再查，系爭專利說明書第10頁第2至4行揭露「關於XR
20 PD最大值(以 $^\circ$ 表示)之詞語『約』通常係指在給定值之 0.3°
21 以內，更佳 0.2° 以內，且最佳 0.1° 以內。或者，當為熟習此
22 項技術之通常知識者所考慮時，詞語『約』(在此處及全文
23 中)係指在可接受之平均值標準誤差內」，故考量「 $\pm 0.$
24 2 」、「 ± 0.3 」之誤差值範圍，上開結晶型A'、結晶型A''、
25 結晶型B、結晶型SB、結晶型C、結晶型SC之XRPD最大值至少
26 有4個數值誤差範圍涵蓋結晶型A之XRPD最大值，若依據該
27 「4個」最大值之x-射線粉末繞射圖案表徵以界定該結晶型
28 A，基於所請之結晶型A的晶體結構係由XRPD最大值所界定賦
29 予，結晶型A僅為一「任意名稱」，故實際上無法鑑別「大
30 體上純淨之結晶型A」，還是「大體上純淨之結晶型A'」、「
31 「大體上純淨之結晶型A''」、「大體上純淨之結晶型B」、

01 「大體上純淨之結晶型SB」、「大體上純淨之結晶型C」、
02 「大體上純淨之結晶型SC」（承上述，系爭專利說明書均載
03 有可以至少4個XRPD最大值界定結晶型A'、A"、B、SB、C、S
04 C），進者，亦可能呈現混合晶型狀態，即「大體上純淨結
05 晶型A」混有結晶型A'、結晶型A"、結晶型B、結晶型SB、結
06 晶型C、結晶型SC，已如前述，而系爭專利說明書並未揭露
07 「單一結晶型」態樣下，如何判別所界定之結晶型，定為結
08 晶型A，而非其他結晶型，如：結晶型A"，或「混合晶型」
09 態樣下，確認結晶型A大於50%，故系爭專利請求項3無法為
10 系爭專利說明書所支持，而有違反核准時專利法第26條第2
11 項之規定。

12 4、甲證11至13之組合不足以證明系爭專利請求項2、3不具進步
13 性：

14 (1)、甲證11第6頁第1段揭露一種式I化合物，其4-甲基-N-[3
15 -(4-甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4
16 -吡啶-3-基-嘓啶-2-基胺基)-苯甲醯胺，甲證11第1
17 1頁第4至8行另揭露該式I化合物可為醫藥上可接受之鹽，而
18 該鹽可為式I化合物與有機酸或無機酸所形成之酸加成鹽，
19 並例示該無機酸包括鹽酸，可用以治療神經方面之疾病（甲
20 證11摘要），甲證12第130頁之圖1A揭露一種化合物AMN10
21 7，即甲證11之式I化合物，甲證12第134頁之圖4B及第135頁
22 表2進一步揭露AMN107之鹽酸鹽，可用以治療慢性骨髓性白
23 血病（甲證12摘要），甲證13摘要則揭露AMN107可用於治療
24 慢性骨髓性白血病，是以，甲證11至13均揭露AMN107化合物
25 及可用於醫藥用途，具有技術領域之關連性，故該發明所屬
26 技術領域中具有通常知識具有合理動機組合甲證11至13。

27 (2)、系爭專利請求項2至3範圍業如前述，按西元2020年專利審查
28 基準第二篇發明專利實體審查第13章醫藥相關發明5.3.1.4
29 水合物記載「申請專利之發明為一種已知化合物之特定含水
30 數的水合物。對於醫藥產物而言，不同含水數對藥物之溶解
31 度、溶解速度及生體可用率、製劑之化學安定性及物理安定

01 性等均有影響，若該發明所屬技術領域中具有通常知識者於
02 確認或預期該化合物有水合物存在之情況下，有動機尋找較
03 佳含水數，並以例行之實驗方法即可獲得該較佳含水數之水
04 合物，則原則上該已知化合物之水合物發明不具進步性，除
05 非申請人能提供請求之水合物具有無法預期功效的證據或其
06 他理由足以證明請求之水合物具有進步性」。另按，專利專
07 責機關（即被告）對專利有效性案件，為求審查迅速，公平
08 正確，依職權訂定專利審查基準供其指定之審查人員有明確
09 之遵循標準。依我國現行行政程序法對行政命令僅分為法規
10 命令及行政規則的二分法，專利審查基準既為主管機關為規
11 範內部審查作業而依職權所頒訂之非直接對外發生效力之一
12 般、抽象規定，屬於行政規則（行政程序法第159條第1項參
13 照）。雖然審查基準之內容並非只有單一內容，有解釋性之
14 行政規則，也有作為判斷基準之行政規則，甚至有裁量性的
15 基準。不過既為行政規則，依憲法第80條規定，行政法院法
16 官關於法律的適用，應有正確闡釋之必要，自應本於其確
17 信，對於法律規定表示合法適當之法律見解，當然不受行政
18 機關所訂定之行政規則之拘束；易言之，客觀法律解釋權
19 限，應歸屬法院而非行政機關。法院對於法律解釋應有最終
20 具有拘束性的解釋權，法院作成的裁判也應基於其自身對法
21 律的確信，不應受行政機關訂定行政規則之拘束，行政規則
22 也不應成為審判時法律基準（但若係裁量基準，則因基於平
23 等原則所衍生之行政自我拘束原則應予除外）。縱使法院引
24 用審查基準內容文字，亦係基於法院自身對法律的確信，所
25 表示合法適當之法律見解而為法院作成之法律解釋內容，並
26 非受行政機關訂定行政規則之拘束，審查基準內容有所變更
27 或修訂，法院仍應依其確信，為妥當之法律解釋，不受前後
28 變更之影響。所以專利審查基準修訂或變更，並不發生適用
29 法規基準時問題。法院如認為修正後之專利審查基準僅係明
30 確法條適用、補充闡明，與核准時專利法之規範並不相違，

01 而參酌修正後審查基準據以判斷系爭專利進步性，亦無不可
02 （最高行政法院109年上字第914號判決意旨參照）。

03 (3)、系爭專利核准時之醫藥相關發明基準，並未有針對醫藥化合物
04 的水合物型態之進步性判斷有所闡明，直至西元2020年版
05 之醫藥相關發明基準方有對其水合物型態之進步性判斷揭露
06 相關原則，基於核准時之醫藥相關發明基準未有醫藥化合物
07 水合物之進步性判斷原則，只要與核准時之專利法規範不違
08 背之情形下，自當可進一步參考2020年版醫藥相關發明基準
09 對於醫藥化合物水合物之進步性的補充闡明。甲證11第6頁
10 第1段揭露一種式I化合物，其4-甲基-N-[3-(4-甲基-
11 咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-
12 嘓啶-2-基胺基)-苯甲醯胺，甲證11第11頁第4至8行另
13 揭露該式I化合物可為醫藥上可接受之鹽，而該鹽可為式I
14 化合物與有機酸或無機酸所形成之酸加成鹽，並例示該無機
15 酸包括鹽酸。甲證12第130頁之圖1A揭露一種化合物AMN10
16 7，即為甲證11之式I化合物（兩造並無爭執），甲證12第13
17 4頁之圖4B及第135頁表2進一步揭露AMN107之鹽酸鹽（AMN10
18 7-HCl）的藥物動力學數據。甲證13摘要則揭露AMN107可用
19 於治療慢性骨髓性白血病，甲證13第4942頁右欄第11行進一
20 步揭露所使用之AMN107為AMN107單鹽酸鹽。是以，該發明所
21 屬技術領域中具有通常知識者參酌甲證11至13可理解「4-
22 甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡
23 啶-3-基-嘓啶-2-基胺基)-苯甲醯胺」之鹽酸鹽已屬先前技術（即為AMN107鹽酸鹽），與系爭
24 專利請求項2至3之差異在於未揭露「4-甲基-N-[3-(4-
25 甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-
26 3-基-嘓啶-2-基胺基)-苯甲醯胺」之鹽酸鹽『二水
27 合物之結晶型A』，惟該發明所屬技術領域中具有通常知識
28 者可理解先前技術僅揭露「4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪
29 唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-
30 嘓啶-2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽』與『4-甲基-N-[3-

01 (4-甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-
02 基-嘧啶-2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽二水合物結晶型A」結
03 構上具有二水合物之差異，故二者係為結構不同之化合物，
04 又醫藥化合物水合物之生成，在於溶解於水中受到水分子吸
05 引作用向水中擴散，並與水分子水合，當外界條件改變時，
06 會從溶液中析出晶體，有些水合分子相對結合比較牢固，結
07 晶時會克服溶液中大量水分子吸引力作用，而將其結合之水
08 分子隨著結晶析出而帶有結晶水，而該等水合物形成關鍵亦
09 在於水分子是否與該醫藥化合物以氫鍵方式產生相互作用，
10 惟查甲證11至13均未揭露4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑
11 -1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘧
12 啶-2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽是否可確認或合理預期具
13 有「水合物」之形式，亦未揭露醫藥開發過程，探討水合物
14 形成之可能性，及製備水合物，對於藥物之溶解度、溶解速
15 度及生體可利用率、製劑之化學及物理的安定性之影響，故
16 該發明所屬技術領域中具有通常知識者參酌甲證11至13之內
17 容尚難謂有合理動機且可經一般例行性試驗而完成4-甲基
18 -N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]
19 -3-(4-吡啶-3-基-嘧啶-2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸
20 鹽之二水合物形式，遑論評估該二水合物之各種結晶型對於
21 藥物開發及製造過程之影響進而完成其結晶型A，故甲證11
22 至13之組合不足以證明系爭專利請求項2至3不具進步性。

23 5、甲證11至14、17之組合不足以證明系爭專利請求項2、3不具
24 進步性：

25 (1)、甲證14第31頁倒數第5至6行揭露式(I)通式化合物(包括
26 鹽類)可為水合物，亦可呈結晶型式，其中實施例92化合物
27 則為該式(I)通式化合物之下位概念，且與「4-甲基-N
28 -[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3
29 -(4-吡啶-3-基-嘧啶-2-基胺基)-苯甲醯胺」(即
30 為AMN107)，可用治療白血病(甲證14摘要)，甲證17第45
31 01頁左下欄揭露NVP-AMN107-AA(即為AMN107鹽酸鹽)，可

01 用以治療imatinib反應不佳之慢性骨髓性白血病（甲證17摘
02 要最後1行），承上述，甲證11至14、17均揭露AMN107化合
03 物及可用於醫藥用途，具有技術領域之關連性，故該發明所
04 屬技術領域中具有通常知識具有合理動機組合甲證11至14、
05 17。

06 (2)、如前所述，甲證11至13已揭露「4-甲基-N-[3-(4-甲基
07 -咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-
08 基-嘧啶-2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽」，但未揭露該化
09 合物是否有水合物存在之預期，查甲證14（編碼為14-1）第
10 31頁倒數第5至6行揭露式（I）通式化合物（包括鹽類）可
11 為水合物，亦可呈結晶型式，其中實施例92化合物則為該式
12 （I）通式化合物之下位概念，且與「4-甲基-N-[3-(4-
13 -甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡
14 啶-3-基-嘧啶-2-基胺基)-苯甲醯胺」（兩造無爭執
15 ）相同，但查甲證14內容並未有任何關於式（I）通式化合
16 物可製備水合物之實例，故前開式（I）通式化合物之鹽類
17 可為水合物僅為籠統敘述並無法認定為甲證14有針對式
18 （I）通式化合物是否可產生水合物形式進行研究探討，自
19 當無法確認或預期該實施例92化合物之鹽酸鹽具有水合物存
20 在，又，甲證17第4501頁左下欄揭露NVP-AMN107-AA（即為A
21 MN107鹽酸鹽），雖查甲證18第163頁補強證據（Pharmacolo
22 gical Review of Nilotinib downloaded from USFDA publ
23 ished on 29 Oct. 2007）揭露該NVP-AMN107-AA係指AMN107
24 鹽酸鹽單水合物，二者定義有所不同，惟就其甲證17所揭露
25 之NVP-AMN107-AA解釋，當以甲證17所定義為主，不應參考
26 甲證18所記載者，是以，該發明所屬技術領域中具有通常知
27 識者參酌甲證11至14、17無法確認或預期4-甲基-N-[3-
28 (4-甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-
29 吡啶-3-基-嘧啶-2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽」具有
30 水合物存在，亦無動機於醫藥開發過程，探討水合物形成之
31 可能性，及評估水合物，對於藥物之溶解度、溶解速度及生

01 體可利用率、製劑之化學及物理的安定性之影響，故「4-
02 甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯
03 基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓啶-2-基胺基)-苯甲醯胺
04 鹽酸鹽之二水合物」非屬該發明所屬技術領域中具有通常知
05 識者具有合理動機且經一般例行性試驗而可輕易完成，遑論
06 評估該二水合物之各種結晶型對於藥物開發及製造過程之影
07 響進而完成其結晶型A，故甲證11至14、17之組合不足以證
08 明系爭專利請求項2至3不具進步性。

09 6、甲證11至14、17、19之組合不足以證明系爭專利請求項2、3
10 不具進步性：

11 甲證19係含有關藥學上可接受陰離子之NH⁺鹽類的水合物形
12 成的劍橋晶體資料庫調查文獻，與甲證11至14、17所揭露內
13 容，均為醫藥領域之相關技術，具有技術領域之關連性，故
14 該發明所屬技術領域中具有通常知識具有合理動機組合甲證
15 11至14、17、19。承上所述（即5、(2)部分），甲證19第34
16 2頁右欄第3.1節揭露「所有陽離子亞組中，鹵化物鹽出現率
17 很高，在消耗其他陰離子基團上，三級胺和環胺中鹵化鹽出
18 現增加」，第344頁右欄第1至2行揭露鹵素離子相較於羧酸
19 離子（鹵素離子與羧酸離子均為陰離子）有高度可能被水合
20 化，即當陰離子為鹵化物時，鹵素離子與陽離子形成鹵化物
21 鹽比羧酸鹽更容易水合，查「4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-
22 1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓啶-2-基胺
23 基)-苯甲醯胺」雖具有2級胺及環胺結構，然甲證19圖4揭
24 露鹵素離子與2級胺與環胺結構之陽離子結構形成鹵化物鹽
25 之水合比例僅約為13至29%左右（參圖4紫色柱狀圖形於2° a
26 mine及cyclic amine所對應縱軸之水合物百分比），惟該發
27 明所屬技術領域中具有通常知識者參酌甲證17、19內容仍無
28 法確認或預期「4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-
29 -5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓啶-2-
30 基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽」具有水合物存在，綜上，該發
31 明所屬技術領域中具有通常知識者參酌甲證11至14、17、19

01 無法確認或預期4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)
02 -5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓啶-2-
03 基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽」具有水合物存在，亦無動機於
04 醫藥開發過程，探討水合物形成之可能性，及評估水合物，
05 對於藥物之溶解度、溶解速度及生體可利用率、製劑之化學
06 及物理的安定性之影響，故「4-甲基-N-[3-(4-甲基-
07 咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-
08 嘓啶-2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽之二水合物」非屬該
09 發明所屬技術領域中具有通常知識者具有合理動機且經一般
10 例行性試驗而可輕易完成，遑論評估該二水合物之各種結晶
11 型對於藥物開發及製造過程之影響進而完成其結晶型A，故
12 甲證11至14、17、19之組合不足以證明系爭專利請求項2至3
13 不具進步性。

14 7、甲證11至14、17、20之組合不足以證明系爭專利請求項2、3
15 不具進步性：

16 (1)、甲證20第132頁2.1Hydrochlorides係探討對於鹼性醫藥化
17 合物可與鹽酸反應製備該醫藥化合物鹽酸鹽，與甲證11至1
18 4、17所揭露內容，均為醫藥領域之相關技術，具有技術領
19 域之關連性，故該發明所屬技術領域中具有通常知識者有合
20 理動機組合甲證11至14、17、20。

21 (2)、甲證11至14、17所揭露者，如前所述，該發明所屬技術領域
22 中具通常知識者可理解，系爭專利請求項2及3之「4-甲基
23 -N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]
24 -3-(4-吡啶-3-基-嘓啶-2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸
25 鹽」屬系爭專利優先權日前之先前技術，查甲證20第132頁
26 2.1Hydrochlorides係探討對於鹼性醫藥化合物可與鹽酸反
27 應製備該醫藥化合物鹽酸鹽，並未特定揭露前開系爭專利請
28 求項2及3之化合物具有水合物之存在，亦無揭露於醫藥開發
29 過程，探討水合物形成之可能性，及評估水合物，對於藥物
30 之溶解度、溶解速度及生體可利用率、製劑之化學及物理的
31 安定性之影響，準此，該發明所屬技術領域中具有通常知識

01 者參酌甲證11至14、17、20無法確認或預期4-甲基-N-[3-
02 -(4-甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-
03 -吡啶-3-基-嘓啶-2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽」有
04 水合物存在，亦無合理動機且可經一般例行性試驗而完成4-
05 甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-
06 苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓啶-2-基胺基)-苯甲醯
07 胺鹽酸鹽之二水合物形式，遑論評估該二水合物之各種結晶
08 型對於藥物開發及製造過程之影響進而完成其結晶型A，從
09 而甲證11至14、17、20之組合不足以證明系爭專利請求項2
10 及3不具進步性。

11 8、甲證11至14、17、21之組合足以證明系爭專利請求項2、3不
12 具進步性：

13 (1)、甲證21圖6揭露藥物開發過程（因應藥物查驗登記審查為目
14 的），研究人員應評估所研究之醫藥化合物是否具有水合物
15 或溶劑合物存在，與甲證11至14、17所揭露內容，均為醫藥
16 領域之相關技術，具有技術領域之關連性，故該發明所屬技
17 術領域中具有通常知識者有合理動機組合甲證11至14、17、
18 21。

19 (2)、甲證11至14、17所揭露者，如前所述，特別是該發明所屬技
20 術領域中具通常知識者參酌甲證11可理解，系爭專利請求項
21 2及3之「4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5-
22 三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓啶-2-基胺
23 基)-苯甲醯胺鹽酸鹽」屬系爭專利優先權日前之先前技
24 術，且甲證11請求項8揭露前開化合物可用以治療神經血管
25 相關疾病，查甲證21揭露藥物物質固體之查驗登記法規考量
26 之策略性方法（參標題），食品藥物管理局之藥物物質指導
27 方針，要求使用適當分析方法測量藥物物質多晶型、水合或
28 非晶型態，因為控制藥物物質晶型具有重要性，且申請人有
29 責任控制藥物物質晶型，假如生體可用率受到影響，並須證
30 明控制方法的適當性（參甲證21第945頁左欄第1段），考量
31 甲證21第946頁左欄第3段（參甲證21-1中文翻譯）揭露「4

01 種決策樹係描述在以下部分：『多晶型物』、『水合物（溶
02 劑合物）』、去溶劑化之溶劑合物及非結晶型式。當藥物物
03 質以不同的晶體堆積排列結晶且所有的排列都具有相同的元
04 素成分時，會存在多晶型物（注意：水合物也可以存在於多
05 晶型物中）……如前所述，建議調查藥物物質是否存在多
06 晶型或水合物，因為在製藥過程的任何階段或儲存藥物物質
07 或劑型都可能遇到此些問題」，甲證21圖6揭露藥物開發過
08 程（因應藥物查驗登記審查為目的），研究人員應評估所研
09 究之醫藥化合物是否具有水合物或溶劑合物存在（使用不同
10 再結晶溶劑，測試不同參數，如：溫度、濃度及pH值，並利
11 用X粉末繞射法測試鑑別）並研究水合物之物化特性，如穩
12 定性及溶解度，此為藥物開發之標準流程，是以，該發明所
13 屬技術領域中具有通常知識者若以「4-甲基-N-[3-(4-
14 甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶
15 -3-基-嘓啶-2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽」為醫藥化
16 合物研究開發之起點，當會評估是否存在水合物，若存在水
17 合物，亦會評估該各種水合物之溶解度與穩定性等物化特
18 性，藉以評估該水合物於藥物製劑開發是否具有優勢，準
19 此，該發明所屬技術領域中具有通常知識者參酌甲證21可理
20 解以例行性試驗測試「4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-
21 1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓啶
22 -2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽」是否有水合物存在，並接
23 續執行一系列例行性試驗瞭解其各種水合物之物化特性
24 （如：穩定性），並為優化其物化特性進而尋找出最適合
25 者，故「4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5-
26 三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓啶-2-基胺
27 基)-苯甲醯胺鹽酸鹽二水合物」為該發明所屬技術領域中
28 具有通常知識者參酌甲證11、21內容後，有合理動機經一般
29 例行性試驗而輕易完成。

30 (3)、又核准時之專利審查基準第二篇發明專利實體審查第13章醫
31 藥相關發明5.3.1.3化合物多晶型之進步性記載「申請專利

01 之發明為一種已知化合物的多晶型，因多晶型的分子結構係
02 與該化合物完全相同，僅結晶型態有所不同，且多晶型通常
03 以『例行之實驗方法』即可獲得，故原則上已知化合物的多
04 晶型不具進步性，除非該多晶型較該已知化合物具有無法預
05 期的功效。……」，查系爭專利說明書第6頁第9至11行【先
06 前技術】揭露「多晶型現象表示物質存在一種以上晶體結
07 構。化學物質以一種以上晶體變型結晶之能力對藥物的貯存
08 期限、溶解度、調配物性質及加工性質具有深遠影響」，第
09 7頁倒數第1至2行【先前技術】揭露「一旦選擇，重要之處
10 在於在所研究劑型中多晶型可再現性製備且長時間保持不
11 變」，故該發明所屬技術領域中具有通常知識者可理解化
12 合物結晶型之物化性質對於藥物開發過程期間相當重要，必須
13 具有優良的溶解度、調配物性質、加工性質、製備再現性及
14 穩定性，甲證21圖1揭露藥物開發過程（因應藥物查驗登記
15 審查為目的），研究人員應評估所研究之醫藥化合物是否具
16 有多晶型物存在（使用不同再結晶溶劑，測試不同參數，
17 如：溫度、濃度及pH值，並利用X粉末繞射法測試鑑別）並
18 研究多晶型物之物化特性，故自會有合理動機於藥物開發過
19 程中尋找適當結晶型，而系爭專利說明書第49頁第3至11行
20 揭露「亦進一步對4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-
21 基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘧啶-2-
22 基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽之結晶型A、結晶型B、結晶型C
23 及非結晶型之全部實施穩定性研究。對於結晶型A、B及C，
24 在不同相對濕度下貯存後未觀察到形式轉變；而該鹽酸鹽之
25 非結晶型自發結晶為結晶型A。此外，每一結晶型皆具有良
26 好的化學穩定性，50°C時保持1個月，80°C時保持1個月且在
27 80°C及75%相對濕度下保持1個月，但結晶型C及非結晶型二
28 者在上述最後一種條件下顯示為與結晶型A之混合物」，該
29 發明所屬技術領域中具有通常知識者可理解結晶型A具有儲
30 存之安定性，承上述，雖然「4-甲基-N-[3-(4-甲基-
31 咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基

01 一嘧啶-2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽二水合物」並未明確
02 揭露於先前技術中，非屬醫藥相關發明基準5.3.1.3化合物
03 多晶型之進步性規定中「已知化合物」，惟「4-甲基-N-
04 [3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-
05 (4-吡啶-3-基-嘧啶-2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽二
06 水合物」可經由一般例行性試驗完成，已如前述，故該化
07 合物並未有進步性可言，基於醫藥相關發明基準5.3.1.3化
08 合物多晶型之進步性規定中相同結構之二種以上之多晶型，可
09 經由一般例行性試驗而完成，當以「4-甲基-N-[3-(4-
10 甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶
11 -3-基-嘧啶-2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽二水合物」
12 為研究起點，當具有合理動機經一般例行性試驗而完成純淨
13 之前開化合物具有穩定性之結晶型A，並以X粉末繞射法數值
14 界定該結晶型A，又考量製備「4-甲基-N-[3-(4-甲基
15 -咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-
16 基-嘧啶-2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽二水合物結晶型
17 A」作為藥物原料，自然對於該原料純度之要求極高，盡量
18 不得有不純物，當可完成「大體上純淨」之「4-甲基-N-
19 [3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-
20 (4-吡啶-3-基-嘧啶-2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽二
21 水合物結晶型A」。

- 22 (4)、再者，核准時之專利審查基準第二篇發明專利實體審查第3
23 章專利要件3.4.2.1發明具有無法預期之功效記載「無法預
24 期之功效包含產生新的特性或在數量上的顯著變化。若申請
25 專利之發明對照先前技術具有無法預期之功效，而其係該發
26 明之技術特徵所導致時，該無法預期之功效得佐證該發明並
27 非能輕易完成。因此，即使申請時之通常知識或先前技術會
28 促使該發明所屬技術領域中具有通常知識者組合、修飾、置
29 換或轉用先前技術所揭露之內容而完成申請專利之發明，但
30 若該先前技術並未揭露組合、修飾、置換或轉用後會產生無
31 法預期之功效時，則申請專利之發明仍非能輕易完成」等內

01 容，查甲證8（系爭專利權人於專利申請階段提交之申復理
02 由書）記載於活體動物（狗）生體利用率試驗，「鹽酸鹽單
03 水合物」所呈現的生體利用率較「游離鹼」高出13倍以上，
04 惟本件之證據組合所揭露之先前技術為「4-甲基-N-[3-
05 (4-甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-
06 吡啶-3-基-嘓啶-2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽」，系
07 爭專利請求項2及3之發明為「4-甲基-N-[3-(4-甲基-
08 咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-
09 嘓啶-2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽二水合物結晶型
10 A」，就系爭專利之發明與先前技術之對照而論，甲證8所提
11 供之數據並無法證明「4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-
12 1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓啶-
13 2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽二水合物結晶型A」相較於
14 「4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲
15 基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓啶-2-基胺基)-苯
16 甲醯胺鹽酸鹽」具有無法預期之功效。

17 (5)、參加人雖主張「將12克4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-
18 5-三氟甲基-苯基]-3-(4-吡啶-3-基-嘓啶-2-基胺基)-苯甲
19 醯胺鹽酸鹽在52°C下溶於192毫升甲醇及21毫升水中。使該
20 溶液在10分鐘內加熱至64至66°C且使其靜置45分鐘。然後使
21 該溶液於3小時內冷卻至0°C。由於0°C之前該溶液自發結
22 晶，因而在20°C時停止斜坡冷卻並在攪拌下將其放置2天。
23 使該懸浮液於2小時內冷卻至0°C，然後在真空下過濾以得到
24 4-甲基-N-[3-(4-甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-
25 (4-吡啶-3-基-嘓啶-2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽之結晶型
26 A」，其等並非審查基準所述之「例行之實驗方法」云云，
27 查甲證21圖1揭露藥物開發過程（因應藥物查驗登記審查為
28 目的），研究人員應評估所研究之醫藥化合物是否具有多晶
29 型物存在（使用不同再結晶溶劑，測試不同參數，如：溫
30 度、濃度及pH值，並利用X粉末繞射法測試鑑別）並研究多
31 晶型物之物化特性，故實施例19中關於將「4-甲基-N-[3

01 —(4-甲基-咪唑-1-基)-5-三氟甲基-苯基]-3-(4
02 -吡啶-3-基-嘧啶-2-基胺基)-苯甲醯胺鹽酸鹽」於
03 特定溶劑中，在經過加熱、冷卻等步驟方能獲得該結晶型
04 A，均屬甲證21圖1所教示範圍，且僅為重覆測試試驗之過
05 程，當屬基準所規定之「例行之實驗方法」。

06 (6)、是以甲證11、21之組合既足以證明系爭專利請求項2及3不具
07 進步性，從而，甲證11至14、17、21之組合亦足以證明系爭
08 專利請求項2及3不具進步性。

09 9、甲證11至14、17、19、20、21之組合足以證明系爭專利請求
10 項2、3不具進步性：

11 (1)、承上述，甲證11至14、17分別與甲證19、20、21具有技術領
12 域之關連性，是以，該發明所屬技術領域中具有通常知識
13 者，當具有合理動機組合甲證11至14、17、19、20、21。

14 (2)、再者，基於甲證11至14、17、21之組合足以證明系爭專利請
15 求項2及3不具進步性，該發明所屬技術領域中具有通常知識
16 者亦可理解甲證11至14、17、19、20、21之組合足以證明系
17 爭專利請求項2及3不具進步性。

18 七、綜上所述，系爭專利請求項2、3對應之說明書內容違反核准
19 時專利法第26條第1項（可據以實現要件）之規定；系爭專
20 利請求項2、3違反核准時專利法第26條第2項（明確要
21 件）；系爭專利請求項2、3違反核准時專利法第26條第2項
22 （支持要件）；甲證11至14、17、21之組合足以證明系爭專
23 利請求項2、3不具進步性；甲證11至14、17、19、20、21之
24 組合足以證明系爭專利請求項2、3不具進步性。從而，原處
25 分關於「請求項2至3舉發不成立」部分之審定，有所違誤，
26 訴願決定予以維持，亦有未合，原告起訴請求撤銷訴願決定
27 及原處分關於「請求項2至3舉發不成立」部分，並命被告就
28 上開請求項應作成舉發成立之處分，為有理由，應予准許。

29 八、本件事證已明，兩造及參加人其餘主張或答辯，均核與本院
30 判決結果不生影響，爰毋庸一一論列，併此敘明。

01 據上論結，原告之訴為有理由，爰依智慧財產案件審理法第1
02 條，行政訴訟法第98條第1項前段，判決如主文。

03 中 華 民 國 111 年 9 月 30 日

04 智慧財產第三庭

05 審判長法官 彭洪英

06 法官 林怡伸

07 法官 林惠君

08 以上正本係照原本作成。

09 如不服本判決，應於送達後20日內，向本院提出上訴狀並表明上
10 訴理由，其未表明上訴理由者，應於提起上訴後20日內向本院補
11 提上訴理由書；如於本判決宣示後送達前提起上訴者，應於判決
12 送達後20日內補提上訴理由書（均須按他造人數附繕本）。

13 上訴時應委任律師為訴訟代理人，並提出委任書（行政訴訟法第
14 241條之1第1項前段），但符合下列情形者，得例外不委任律師
15 為訴訟代理人（同條第1項但書、第2項）。

得不委任律師為訴訟 代理人之情形	所 需 要 件
一符合右列情形之一 者，得不委任律師 為訴訟代理人	1. 上訴人或其法定代理人具備律師資 格或為教育部審定合格之大學或獨 立學院公法學教授、副教授者。 2. 稅務行政事件，上訴人或其法定代 理人具備會計師資格者。 3. 專利行政事件，上訴人或其法定代 理人具備專利師資格或依法得為專 利代理人者。
二非律師具有右列情 形之一，經最高行 政法院認為適當者	1. 上訴人之配偶、三親等內之血親、 二親等內之姻親具備律師資格者。 2. 稅務行政事件，具備會計師資格者

01 | ，亦得為上訴審訴 | 。 |
02 | 訟代理人 | 3. 專利行政事件，具備專利師資格或 |
03 | | 依法得為專利代理人者。 |
04 | | 4. 上訴人為公法人、中央或地方機關 |
05 | | 、公法上之非法人團體時，其所屬 |
06 | | 專任人員辦理法制、法務、訴願業 |
07 | | 務或與訴訟事件相關業務者。 |

08 |
09 | 是否符合一、二之情形，而得為強制律師代理之例外，上訴 |
10 | 人應於提起上訴或委任時釋明之，並提出二所示關係之釋明 |
11 | 文書影本及委任書。 |
12 |

13 | 中 華 民 國 111 年 9 月 30 日 |
14 | 書記官 張玫玲 |