

FIRSTLAW P.C.

韩国晶型发明的 专利性与权利范围判断

2026年9月17日

姜逸硕 办理士
韩国FIRSTLAW P.C.

01 晶型发明的创造性判断

- 1、乐卡地平案

2011年7月14日韩国大法院宣判

- 2、泰乐菌素案

2022年3月31日韩国大法院宣判

- 3、司来帕格案

2023年3月13日韩国大法院宣判
2024年6月27日韩国知识产权法院宣判

- 4、米拉贝隆案

2024年3月28日韩国大法院宣判

02 晶型发明的权利范围判断

- 5、替戈拉生案

2025年2月13日韩国知识产权法院宣判

- 6、诺欣妥案

2026年1月15日韩国大法院宣判

SECTION

01

晶型发明的创造性判断



定义

- 【韩国大法院判决】

晶型发明是指，在医药领域中，与现有技术中已公知的化合物相比，仅在结晶形态（晶型）上有所不同的特定晶型化合物发明

晶型发明的保护意义

- 晶型发明获得专利保护的正当性，在于其**相对于现有技术**所作出的「**技术贡献**」

韩国大法院判断标准

- 为进行医药化合物的制剂设计而**研究结晶多形（晶型多态）的存在**，属于**通常所进行的工作**
- 因此，除非存在特别情事，「晶型发明」仅在与现有技术所公开化合物的效果具有**质的差异**，或者虽无质的差异但在**量上存在显著差异**时，其**创造性才不被否定**

意义

- 实质上仅以「**效果的显著性**」这一标准判断**晶型发明的创造性**，对申请人、专利权人而言**极为不利**

系争专利的权利要求1

分离的**盐酸乐卡地平晶形（I）**，当根据 DSC 峰测定时其熔点为 197–201°C，并且在其于波长 $K\alpha$ 下的 X 射线衍射图案中显著峰的间距、 I/I_0 比和 2θ 角如下表中所示：

D(X)	相对强度 (I/I_0)	2θ 角
16.3	83	5.4
6.2	47	14.2
4.78	29	18.6
4.10	63	21.7
4.06	36	21.9
3.90	100	22.8

现有技术

- 公开了**盐酸乐卡地平的结晶形式**；但未公开该晶型的**粉末 X 射线衍射图谱**

专利审判院

新颖性否定

- 权利要求1的晶型（I）与现有技术晶型**熔点相同**

知识产权法院

新颖性肯定、创造性否定

- 已知存在**晶型不同但熔点相同**的多晶型化合物 → **新颖性肯定**
- 补充实验显示，晶型（I）溶解度约为现有技术的5倍，但「晶型变化可带来**5 ~ 10倍溶解度及生物利用度差异**」属**技术常识** → **创造性否定**

大法院

创造性否定

- **晶型变化**可带来**5 ~ 10倍溶解度差异**在申请日**已为本领域所知**；且**难以**获知溶解度提高5倍的**具体药理学效果** → 不认定晶型（I）具有显著效果

韩国大法院判断标准

- 为医药化合物制剂设计而考察其是否具有多种结晶形态的**多晶型筛选**，属于通常所进行的工作
- 但仅凭此**尚不能断定**结构的困难性即被否定——「**多晶型筛选是通常实验**」与「**能否容易获得特定晶型**」是**两个不同的问题**
- 综合考虑以下几点后，应关注本领域技术人员能否从现有技术中轻易导出**晶型发明的结构**：
 - 现有发明化合物的**多晶型**是否**已知或容易预料到**
 - 在现有技术或对比文件中，是否存在可以**达到特定晶型的教示、暗示、动机等**
 - 晶型发明的特定晶型是否在于通过对现有技术的化合物进行**通常多晶型筛选**就可获取的**多晶型范围内**
- 另一方面，如晶型发明这类属于医药化合物领域的发明，仅凭其结构难以预测效果，因此在判断结构的困难性时，**有必要参酌发明的效果**；若发明的效果相对于现有技术而言是显著的，则可成为推论结构困难性的有力资料

➡ **晶型发明同样适用「结构的困难性 + 效果的显著性」的一般创造性判断框架，获得专利变得较为容易**

系争专利申请

权利要求1

20,23-二哌啶基-5-0-碳霉糖基-泰乐内酯的晶型，具有包含在5.0、9.0和10.5度2θ的峰的粉末X-射线衍射光谱。

(即 I 型多晶型)

说明书

形 态	熔点 / 转变温度	熔融焓	相对湿度下重量变化
无定形	转变温度 96°C	-	-
II型多晶型	熔点 113°C	15.2 J/g	约 2%
III型多晶型	熔点 133°C	38.4 J/g	约 6%
IV型多晶型	熔点 155°C	48.6 J/g	-
I 型多晶型	熔点 195°C	57.2 J/g	约 1%

现有技术

- 仅公开泰乐菌素化合物本身，未提及结晶形式

驳回决定：不具备创造性

专利审判院

创造性否定

- 仅凭**3个2θ衍射峰****不能**认为晶型已被充分特定
- 无定形与晶型具有**不同熔点、稳定性、吸湿性**属公知常识，由此产生的熔点、熔融焓及吸湿性差异属一般性效果
- I · II · III型 1% · 2% · 6% 的吸湿性**均适于药用**

知识产权法院

创造性否定

- 依 X 射线衍射的技术常识，**3个2θ 衍射峰足以特定 I 型晶型**
- 但**选择热力学上最稳定的多晶型**属技术常识，不认定为显著效果
- 并且，各晶型间**吸湿性差异未达显著程度**

大法院

结构的困难性

- 现有技术**并未**提到泰乐星**作为晶型存在的可能性**
- 两者的起始物质及溶剂、温度、时间等**工艺参数均不相同**
- 仅凭现有证据，无法明确本领域技术人员能否经申请时常规的多晶型筛选容易得到 I 型晶型

效果的显著性

- **I 型晶型**较 II · III · IV 型热力学上**更稳定**，且**吸湿性低于** II · III 型
- 而**现有技术**中甚至**未公开**具有 II 型程度的热力学稳定性或 II · III 型程度吸湿性的泰乐菌素**晶型**
- 故**难以**断定 **I 型晶型**的效果属**可**从现有技术**预测**的程度

→ **判决：撤销原判、发回重审**

系争专利申请

权利要求1

2-{4-[N-(5,6-二苯基吡嗪-2-基)-N-异丙基氨基]丁氧基}-N-(甲基磺酰基)乙酰胺的 **I 型晶体**，该晶体的粉末X射线衍射图中，至少在下述衍射角 2θ ：**9.4度、9.8度、17.2度及19.4度**处显示出衍射峰，所述粉末X射线衍射图是用 Cu K α 射线得到的图谱。

说明书

晶 型	粒径 (D90, μm)	残留溶剂 (ppm)	重结晶杂质去除率 (%)
I 型晶体	25.8	453	75
II型晶体	22.0	2,415	66
III型晶体	14.4	2,874	47

现有技术

- 公开了司来帕格及其类似的 100 个化合物的**制备实施例**
- 其中许多**结构相似的化合物**记载为**结晶形式**，但对司来帕格本身**未提及结晶形式**

驳回决定：不具备创造性

大法院

结构的困难性

- 现有技术虽公开司来帕格化合物，但未阐明其为晶型还是无定形，亦无资料表明申请时已知其有多种结晶形态
- 两者起始物质及溶剂、温度、时间等结晶工艺参数不同，无法明确能否经常规多晶型筛选容易得到 I 型晶体

效果的显著性

- I 型晶体在粒径、残留溶剂、杂质去除及湿度 / 热稳定性上均优于 II · III 型晶体
- 而现有技术甚至未公开具有 III 型晶体程度效果的司来帕格晶型
- 故难以断定 I 型晶体的上述效果属可从现有技术预测的程度

→ 判决：具备创造性

分案申请

权利要求1

2-{4-[N-(5,6-二苯基吡嗪-2-基)-N-异丙基氨基]丁氧基}-N-(甲基磺酰基)乙酰胺的**II型晶体**，该晶体的粉末X射线衍射图中，至少在下述衍射角 2θ：**9.0度、12.9度、20.7度及22.6度**处显示出衍射峰，所述粉末X射线衍射图是用 Cu Kα 射线得到的图谱。

说明书

晶 型	粒径 (D90, μm)	残留溶剂 (ppm)	重结晶杂质去除率 (%)
I 型晶体	25.8	453	75
II型晶体	22.0	2,415	66
III型晶体	14.4	2,874	47

现有技术

- 公开了司来帕格及其类似的 100 个化合物的**制备实施例**
- 其中许多**结构相似的化合物**记载为**结晶形式**，但对司来帕格本身**未提及结晶形式**

驳回决定：不具备创造性

知识产权法院

创造性否定

- 现有技术已公开司来帕格的结构**类似化合物为结晶形式** → 本领域技术人员**容易预测司来帕格亦为结晶形式**
- 为获得II型晶体所用的**结晶方法**，不过是制药领域**优先且广泛选用的方法**
- II型晶体的粒径、残留溶剂量、纯度等**效果**，不过是确认多晶型后通过控制结晶工艺呈现的效果

大法院：简易驳回上诉

系争专利

权利要求3

(R)-2-(2-氨基噻唑-4-基)-4'-[2-[(2-羟基-2-苯基乙基)氨基]乙基]乙酰替苯胺的 α 型结晶，其特征在于，粉末X射线衍射中，在 $2\theta(^{\circ})$ 5.32、8.08、15.28、17.88、19.04、20.20、23.16 及 24.34 附近具有主峰。

说明书

记载由现有技术实施例41化合物（即米拉贝隆二盐酸盐）获得 α 型结晶的过程：二盐酸盐 $\rightarrow$ β 型结晶 $\rightarrow$ α 型结晶

二盐酸盐	β 型结晶	α 型结晶
相对湿度 80% 以上 吸湿性急剧上升， 90% 时保持约 14% 水分，吸湿性较强	自相对湿度约 20% 起重量增加， 保持约 3% 水分，吸 湿性较弱	相对湿度 5% ~ 95% 范围内水分保持量 0. 2% 以下，无吸湿性

现有技术

- 公开了米拉贝隆的化学式
- 实施例 41 公开了米拉贝隆二盐酸盐的合成
- 提及通式(I)化合物可能以晶型存在
- 但并未公开任何具体晶体

大法院

- 现有技术虽**无**米拉贝隆结晶多形性的**直接教导**，但已**作出暗示**
- **β 型**经现有技术二盐酸盐的**常规中和而得**，**α 型**又经 β 型**重结晶而得** → α 型属常规多晶型筛选可考察的范围
- **相对湿度 80% 以下**时，α 型重量变化为 -0.03%、二盐酸盐为 0.7%；
仅在超过 80% 的苛刻条件下才有相当差异 → **吸湿性差异不显著**
- α 型与 β 型约 2.8% 的**吸湿性差异**，**鉴于** β 型作为准稳定型亦可药用，亦**不能认为显著**

→ **判决：不具备创造性**



核心：考察晶型发明「相对于现有技术」所作出的「技术贡献」程度

【1】考察现有技术公开化合物晶型的程度

- 完全未提及晶型？ / 仅笼统暗示？ / 已公开具体晶型？（泰乐菌素·司来帕格 vs 米拉贝隆）

【2】考察由现有技术化合物导出对象晶型的困难性

- 起始物质、溶剂、温度、时间等工艺参数是否不同；能否经常规多晶型筛选容易到达该晶型（米拉贝隆）

【3】现有技术已公开具体晶型时

- 与该晶型进行对比实验，考察效果差异是否显著（乐卡地平）

【4】现有技术未公开具体晶型时

- 比较诸晶型特性，选择最优者申请专利（司来帕格 I 型 vs II 型的分野）

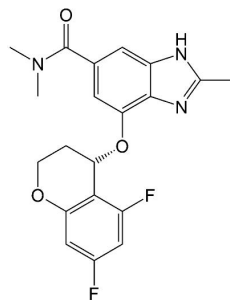
SECTION

02

晶型发明的权利范围判断

系争专利的权利要求1

由下述化学式1所示化合物的**晶型A**，其特征在于，在X射线粉末衍射图谱中，在衍射角($2\theta \pm 0.2^\circ$)为 8.1° 、 10.0° 、 12.6° 、 14.9° 、 15.6° 、 16.5° 、 17.2° 、 19.6° 、 23.1° 、 24.2° 、 28.1° 、 30.2° 和 31.6° 处具有峰：



系争专利申请的说明书

说明书公开了化学式1化合物（即**替戈拉生**）**晶型A**与**无定型替戈拉生**的比较实验数据：

- 保存4周后测定，**光学稳定性提高10倍**
- 保存4周后测定，**吸湿性降低20倍**
- **静电诱发能力降至60%水平**

审查意见通知书

- 相对于现有技术**不具备创造性**
- **现有技术**
 - 公开了包含替戈拉生化合物在内的**通式化合物**
 - 并**提及**该通式化合物**可能以晶型形式存在**
 - 但**并未具体公开**替戈拉生的**晶型**

申请人答复意见

- 主张说明书实施例中公开的替戈拉生晶型A具有**显著效果**

授权决定

请求人实施产品

- 请求人（竞争制药公司）的实施产品：**无定形替戈拉生**

专利审判院

- 无定形替戈拉生**不属于**系争专利替戈拉生晶型A的权利范围

知识产权法院

维持审判院决定

- 不属于文义范围**：无定形替戈拉生在X射线粉末衍射图谱中，衍射角($2\theta \pm 0.2^\circ$)处**不具有特征性峰**
- 不属于等同范围**：系争专利的替戈拉生晶型A相较于无定形替戈拉生具有**明显优异**的光稳定性、吸湿性等性能，与无定形替戈拉生**解决技术课题的原理不同** → 无定形替戈拉生亦不属于系争专利替戈拉生晶型A的“等同范围”
- 有意排除**：在审查过程中，专利权人**明确有意**将系争专利的权利范围中的“无定形替戈拉生”予以**排除的意图**

大法院：简易驳回上诉

母案专利

最初申请的权利要求1

- 双重作用的复合物，包括 (a) 血管紧张素受体拮抗剂； (b) 中性内肽酶抑制剂 (NEPi)；和任选的 (c) 药学上可接受的阳离子。

说明书记载的实施例

- (i) 缬沙坦、(ii) 沙库巴曲、(iii) 钠、(iv) 水以**1 : 1 : 3 : 2.5**比例缔合形成的超分子复合物（「**缬沙坦-沙库巴曲-三钠-半五水合物**」）的**3种制备方法**
- 以粉末X射线衍射结果记载该超分子复合物为**结晶态**

现有技术

- 现有技术已公开**缬沙坦与 NEPi 组合物**用于高血压等治疗

修改的权利要求1 → 授权

- **结晶形式**的**三钠**[3-((1S,3R)-1-联苯-4-基甲基-3-乙氧基羰基-1-丁基氨基甲酰基)丙酸-(S)-3'-甲基-2'-(戊酰基{2''-(四唑-5-基)联苯-4'-基甲基}氨基)丁酸]**半五水合物化合物**。（即「**缬沙坦-沙库巴曲-三钠-半五水合物晶体**」）

分案专利

分案申请的权利要求1 → 授权

- 总化学式为[(((S)-N-戊酰基-N-{[2'-(1H-四唑-5-基)-联苯-4-基]-甲基}-缬氨酸)((2R,4S)-5-联苯-4-基-4-(3-羧基-丙酰基氨基)-2-甲基-戊酸乙酯)]Na_y·xH₂O (其中, y为1至3, x为0至3) 的**固体形式**的复合物, 但**不包括结晶形式的三钠**[3-((1S,3R)-1-联苯-4-基甲基-3-乙氧基羰基-1-丁基氨基甲酰基)丙酸-(S)-3'-甲基-2'-(戊酰基{2''-(四唑-5-基)联苯-4'-基甲基}氨基)丁酸]**半五水合物化合物**。

意图

- 以**母案覆盖2.5水合物晶型**, 以**分案覆盖其余水合度·固体形式**的整个区间

分案专利—无效审判

主张的无效理由：说明书不充分公开

- 说明书仅以 **2.5 水合物晶型**为实施例，却请求**水分子数不同的所有固体形式**

母案专利—消极权利范围确认审判

确认对象产品

- 缬沙坦、沙库巴曲、钠、水以**1 : 1 : 3 : 3** 的比例缔合的结晶形式 (**3 水合物**)
- 依 X 射线衍射分析，**晶体结构**与母专利 **2.5 水合物**不同

大法院

说明书不充分公开

- 分案专利说明书仅在实施例记载沙库巴曲、缬沙坦、钠及水以**1 : 1 : 3 : 2.5**缔合的超分子复合物，**未记载其形成原理及构成要素间非共价相互作用**的技术内容
- 依说明书，**2.5水合物**超分子复合物是**结晶结构随水合度改变**的化学计量水合物
- 优先日当时，**确认**何种化学物质**能形成超分子复合物及其结构或形态**，是困难的
- 故**难以认为**本领域技术人员能认识到：即使**水分子数与 2.5 水合物不同或不含水分子**，各构成要素间的非共价相互作用**仍可平衡而形成**超分子复合物并据以制造

→ 诺欣妥案：以「技术贡献」为基准判断说明书公开充分

大法院

关于等同范围的判断标准

- 专利法保护的**专利发明的实质价值**，在于其**解决了**现有技术**未曾解决的技术课题**，对技术发展作出**贡献**
- 因此，判断确认对象发明中被变更的技术特征与专利发明对应技术特征**是否等同时**，**必须考虑**专利发明**特有的课题解决原理**
- 把握课题解决原理时，不仅要参酌**说明书的记载**，还要参酌**申请当时的技术常识等**
- 这是为了**依据**专利发明相对于全部现有技术**对技术发展的贡献程度**，**客观把握其实质价值**并给予**相当的保护**
- 故应参酌现有技术，依专利发明对技术发展的**贡献程度**，**决定**课题解决原理把握得**多宽或多窄**

→ **要旨：技术贡献的大小 → 决定课题解决原理的宽窄 → 决定等同范围的宽窄**

大法院

确认对象产品的3水合物超分子复合物晶体亦不属于母专利的等同范围

- 母专利保护的**2.5水合物**超分子复合物系在母专利中首次确认；但说明书**未记载其形成原理及构成要素间非共价相互作用**的技术内容
- **现有技术已公开**缬沙坦与沙库巴曲**合并给药**对高血压性血管疾病的**优异治疗效果**
- 优先日当时，**确认**何种化学物质**能形成超分子复合物及其结构或形态**，是困难的
- 系争专利对技术发展的**贡献部分**在于「提供**1 : 1 : 3 : 2.5**化学计量比的**2.5 水合物**超分子复合物」；**水分子个数不同的范围不能**评价为已作出贡献

→ **诺欣妥案：以「技术贡献」为基准判断权利范围**



贯穿始终的关键词「技术贡献」

创造性

- 现有技术**对晶型的公开程度**决定**结构的困难性**；**效果的显著性**以「现有技术中有**无可资比较的晶型**」为前提

说明书公开要件

- 说明书未揭示**形成原理**时，**超出实施例的上位化区间**不受支持

等同范围

- 对技术发展的**贡献程度**，决定**课题解决原理与等同范围的宽窄**

感谢聆听

FIRSTLAW P.C.

姜逸硕

合伙人、 辨理士

韩国FIRSTLAW P.C.

iskang@firstlaw.co.kr

<https://www.firstlaw.co.kr>

Tel: +82-2-589-0010

