

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

(Chapter I of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Rule 44bis)

Applicant's or agent's file reference OP111065	FOR FURTHER ACTION		See item 4 below
International application No. PCT/CN2011/082432	International filing date (<i>day/month/year</i>) 18 November 2011 (18.11.2011)	Priority date (<i>day/month/year</i>) 19 November 2010 (19.11.2010)	
International Patent Classification (8th edition unless older edition indicated) See relevant information in Form PCT/ISA/237			
Applicant ZHEJIANG JIUZHOU PHARMA SCIENCE & TECHNOLOGY CO., LTD.			

<p>1. This international preliminary report on patentability (Chapter I) is issued by the International Bureau on behalf of the International Searching Authority under Rule 44 bis.1(a).</p> <p>2. This REPORT consists of a total of 8 sheets, including this cover sheet.</p> <p>In the attached sheets, any reference to the written opinion of the International Searching Authority should be read as a reference to the international preliminary report on patentability (Chapter I) instead.</p>																								
<p>3. This report contains indications relating to the following items:</p> <table> <tr> <td><input checked="" type="checkbox"/></td> <td>Box No. I</td> <td>Basis of the report</td> </tr> <tr> <td><input checked="" type="checkbox"/></td> <td>Box No. II</td> <td>Priority</td> </tr> <tr> <td><input type="checkbox"/></td> <td>Box No. III</td> <td>Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability</td> </tr> <tr> <td><input type="checkbox"/></td> <td>Box No. IV</td> <td>Lack of unity of invention</td> </tr> <tr> <td><input checked="" type="checkbox"/></td> <td>Box No. V</td> <td>Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement</td> </tr> <tr> <td><input type="checkbox"/></td> <td>Box No. VI</td> <td>Certain documents cited</td> </tr> <tr> <td><input type="checkbox"/></td> <td>Box No. VII</td> <td>Certain defects in the international application</td> </tr> <tr> <td><input checked="" type="checkbox"/></td> <td>Box No. VIII</td> <td>Certain observations on the international application</td> </tr> </table> <p>4. The International Bureau will communicate this report to designated Offices in accordance with Rules 44bis.3(c) and 93bis.1 but not, except where the applicant makes an express request under Article 23(2), before the expiration of 30 months from the priority date (Rule 44bis .2).</p>	<input checked="" type="checkbox"/>	Box No. I	Basis of the report	<input checked="" type="checkbox"/>	Box No. II	Priority	<input type="checkbox"/>	Box No. III	Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability	<input type="checkbox"/>	Box No. IV	Lack of unity of invention	<input checked="" type="checkbox"/>	Box No. V	Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement	<input type="checkbox"/>	Box No. VI	Certain documents cited	<input type="checkbox"/>	Box No. VII	Certain defects in the international application	<input checked="" type="checkbox"/>	Box No. VIII	Certain observations on the international application
<input checked="" type="checkbox"/>	Box No. I	Basis of the report																						
<input checked="" type="checkbox"/>	Box No. II	Priority																						
<input type="checkbox"/>	Box No. III	Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability																						
<input type="checkbox"/>	Box No. IV	Lack of unity of invention																						
<input checked="" type="checkbox"/>	Box No. V	Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement																						
<input type="checkbox"/>	Box No. VI	Certain documents cited																						
<input type="checkbox"/>	Box No. VII	Certain defects in the international application																						
<input checked="" type="checkbox"/>	Box No. VIII	Certain observations on the international application																						

	Date of issuance of this report 21 May 2013 (21.05.2013)
The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland	Authorized officer Lingfei Bai
Facsimile No. +41 22 338 82 70	e-mail: pt02.pct@wipo.int

专利合作条约

发信人：国际检索单位

收信人：

100004

中国北京市朝阳区建外大街 22 号赛特广场 7 层

北京集佳知识产权代理有限公司

逯长明

PCT

国际检索单位书面意见

(PCT 细则 43 之二 .1)

发文日 (日/月/年)

01.3 月 2012 (01.03.2012)

申请人或代理人的档案号

OP111065

后续行为

见下面第 2 段

国际申请号

PCT/CN2011/082432

国际申请日 (日/月/年)

18.11 月 2011(18.11.2011)

优先权日 (日/月/年)

19. 11 月 2010 (19. 11. 2010)

国际专利分类(IPC)或国家分类和 IPC 两种分类

参见补充栏

申请人

浙江九洲药业股份有限公司 等

1. 本意见包括关于下列各项标明的内容：

- 第I栏 意见的基础
- 第II栏 优先权
- 第III栏 不做出关于新颖性、创造性和工业实用性的意见
- 第IV栏 缺乏发明的单一性
- 第V栏 按照细则 43 之二.1(a)(i)关于新颖性、创造性或工业实用性的推断性声明；支持这种声明的引证和解释
- 第VI栏 某些引用的文件
- 第VII栏 国际申请中的某些缺陷
- 第VIII栏 对国际申请的某些意见

2. 后续行为

如果提出初步审查要求书，本次意见将被视为国际初步审查单位 (IPEA) 的一次书面意见，除非申请人选择的国际初步审查单位非本机构，而且所选国际初步审查单位已按照细则 66.1 之二 (b) 通知国际局将不考虑国际检索单位的书面意见时例外。

如本书面意见被视为国际初步审查单位的书面意见，则请申请人在自 PCT/ISA/220 表发文日起 3 个月或自优先权日起 22 个月内（以后届满者为准）向国际初步审查单位提交书面答复并提交修改（如适用）。

进一步的选择参见 PCT/ISA/220 表。

3. 详细信息见 PCT/ISA/220 表格的说明

ISA/CN 的名称和邮寄地址：

中华人民共和国国家知识产权局

中国北京市海淀区蓟门桥西土城路 6 号 100088

传真号： (86-10)62019451

完成本意见的日期

**20.2 月 2012
(20.02.2012)**

受权官员

常晓屿

电话号码： (86-10)

62084403

第I栏 意见的基础

1. 关于语言，本意见的制定基于：

国际申请提交时使用的语言。

该国际申请的____语言译文，为了国际检索的目的提供该种语言的译文(细则 12.3(a)和 23.1(b))。

2. 本意见的制定考虑了本单位许可或被通知的根据细则 91 所做出的明显错误更正(细则 43 之二 1(a))。

3. 关于国际申请中所公开的任何对要求保护的发明必要的核苷酸和/或氨基酸序列，本意见是在下列基础上制定的：

a. 序列表的提交或提供

纸件形式

电子形式

b. 提交或提供时间

包括于已提交的国际申请。

以电子形式与国际申请一起提交。

为检索目的随后提交给本单位。

4. 另外，在提交/提供了多个版本或副本的序列表的情况下，提供了随后或附加副本中的信息与申请时提交的申请中的信息相同或未超出申请时提交的申请中的信息范围(如适用)的所需声明。

5. 补充意见

第II栏 优先权

- 没有考虑优先权的有效性，因为国际检索单位没有获得被要求优先权的在先申请的副本，或需要时该在先申请的译本。然而本意见是在假定所称优先权日是相关日的情况下作出的（细则 43 之二.1 和 64.1）。
- 由于发现所要求的优先权是无效的，因此本意见是按照如同没有要求优先权的情况下做出的（细则 43 之二.1 和 64.1），因而，为了本意见的目的，上面指明的国际申请日被认为是相关日。

3. 补充意见（如必要时）：

优先权中未提及权利要求 1 中 R^1 、 R^2-R^5 、 R^8-R^9 的某些基团，具体为权利要求 1 中的： $R^1=C_{1-8}$ 的链烃基或饱和环烃基或环烯烃基（优先权中为烃基），以及其中苯基上取代基为卤素， $R^2-R^5=C_{1-8}$ 的烷氧基， $R^8-R^9=$ 卤素，以及其中苯基上取代基为卤素，因此导致权利要求 1 的主题并没有被优先权公开。权利要求 2 的基团限定所表示的通式化合物没有被优先权公开。因此权利要求 1-2 的主题不享有 CN201010550836.0 的优先权，申请日 18.11.2011 被认为是相关日，且检索报告中所列的 PX 类文献构成影响权利要求 1-2 新颖性、创造性的现有技术。

当涉及权利要求 1-2 的化合物时，权利要求 4-8 的该手性化合物制备方法、权利要求 9-11 的手性催化剂、权利要求 12-20 的利用手性催化剂或手性化合物的还原方法都相应地也不享有 CN201010550836.0 的优先权，申请日 18.11.2011 被认为是相关日，且检索报告中所列的 PX 类文献构成影响权利要求 4-20 新颖性、创造性的现有技术。

优先权中（参见权利要求 2）公开了本申请权利要求 3 的主题。因此权利要求 3 享有 CN201010550836.0 的优先权。优先权日 19.11.2010 被认为是相关日，且检索报告中所列的 PX 类文献不构成影响权利要求 3 的新颖性、创造性的现有技术。

第V栏 按细则 43 之二.1 (a) (i) 关于新颖性、创造性或工业实用性的推测性声明；支持这种声明的引证和解释

1. 声明

新颖性(N)	权利要求	3	是
	权利要求	1-2, 4-20	否
创造性(IS)	权利要求	3	是
	权利要求	1-2, 4-20	否
工业实用性(IA)	权利要求	1-20	是
	权利要求		否

2. 引证和解释

2.1 引用如下对比文件：

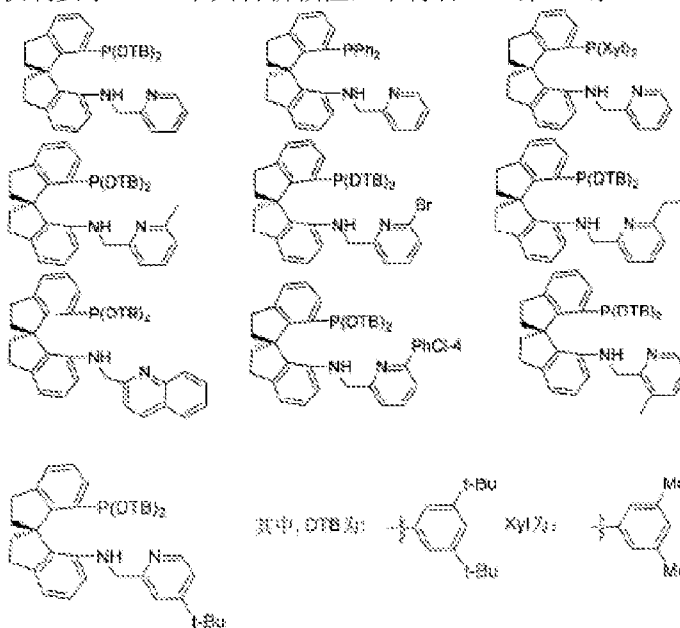
D1: CN 102040625 A (南开大学), 04.5月2011 (04.05.2011), 参见权利要求 1-10, 实施例 1、11;

D2: CN 101671365 A (南开大学), 17.3月2010 (17.03.2010), 参见全文, 尤其是权利要求 1-2.

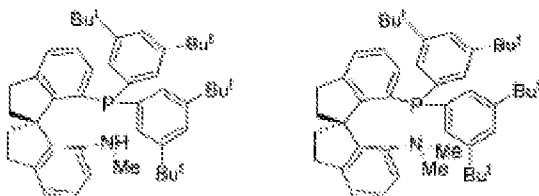
2.2 新颖性评价

权利要求 1-2 涉及通式 I 的手性螺环吡啶胺基磷化合物, 权利要求 3 涉及符合该通式的具体化合物, 权利要求 4-8 涉及该手性化合物的制备方法, 权利要求 9-11 涉及含有该化合物的手性催化剂, 权利要求 12-20 涉及利用该手性催化剂合成醇的方法。

D1 是权利要求 1-2, 4-20 最接近的现有技术, D1 公开了通式 I 的手性螺环吡啶胺基磷化合物 (参见权利要求 1), 其权利要求 3 公开的具体化合物 (参见下图) 落在了本申请权利要求 1 和 2 的范围内, 因此相对于 D1, 权利要求 1-2 不具备新颖性, 不符合 PCT 第 33 条 (2) 的标准。



D2 是权利要求 3 最接近的现有技术。其权利要求 2 公开的下面的化合物与本申请权利要求 3 的化合物最接近, 它们的区别在于胺基上的取代基不同, 本申请权利要求 3 是取代或未取代的吡啶甲基, 而 D2 中是甲基或氢。因此 D1 没有明确地或隐含地披露权利要求 3 的主题。因此根据 D1, 权利要求 3 具备新颖性, 符合 PCT 第 33 条 (2) 的标准。



参见补充栏

第VIII栏 对国际申请的某些意见

就权利要求、说明书和附图的清楚性或者就权利要求是否得到说明书的充分支持提出以下意见：

- 1、权利要求 1 在基团的限定中，多次出现杂芳基与呋喃基、噻吩基并列的情况，但是呋喃基和噻吩基都属于杂芳基的一种，因此这种限定导致权利要求 1 的保护范围不清楚，不符合 PCT 第 6 条的规定。

补充栏

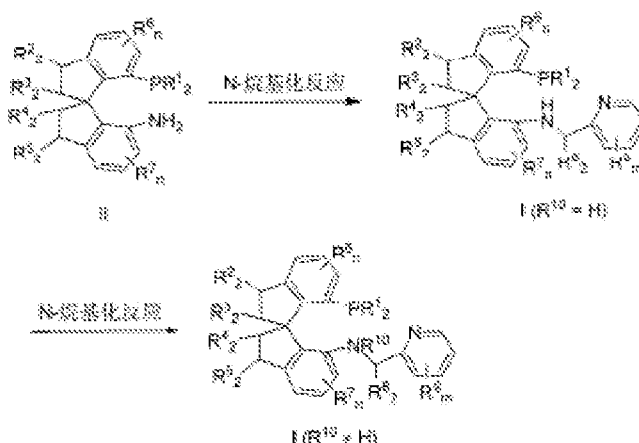
(当前面的任何一栏篇幅不够时使用本栏)

续：国际专利分类(IPC)或者国家分类和 IPC 两种分类

- C07F 9/58 (2006.01) i
- B01J 31/24 (2006.01) i
- C07B 53/00 (2006.01) i
- C07C 29/145 (2006.01) i
- C07C 33/22 (2006.01) i
- C07C 33/18 (2006.01) i
- C07C 33/46 (2006.01) i
- C07C 35/36 (2006.01) i
- C07C 35/32 (2006.01) i
- C07C 31/135 (2006.01) i
- C07C 33/28 (2006.01) i
- C07C 41/26 (2006.01) i
- C07C 43/23 (2006.01) i
- C07C 67/31 (2006.01) i
- C07C 69/732 (2006.01) i
- C07C 69/734 (2006.01) i
- C07C 69/68 (2006.01) i
- C07C 69/675 (2006.01) i
- C07D 307/83 (2006.01) i

续：第 V 栏：

D1 的权利要求 3 公开了下面的反应方法，当其引用权利要求 2 时落在了本申请权利要求 4 的保护范围之内，因此相对于 D1，权利要求 4 不具备新颖性，不符合 PCT 第 33 条 (2) 的标准。



D1 的权利要求 4 反应过程与本申请权利要求 5 的完全相同，当其限定为权利要求 2 的具体化合物的制备方法时，该技术方案的落在了本申请权利要求 5 的范围之内。因此相对于 D1，权利要求 5 不具备新颖性，不符合 PCT 第 33 条 (2) 的标准。D1 的权利要求 4 公开了本申请权利要求 6—8 的附加技术特征，因此在引用的权利要求不具备新颖性的情况下，权利要求 6—8 也不具备新颖性，不符合 PCT 第 33 条 (2) 的标准。当采用 D1 权利要求 2 的化合物为原料时，D1 的权利要求 8 所述的手性催化剂落在了本申请权利要求 9—11 的范围内，因此相对于 D1，权利要求 9—11 不具备新颖性，不符合 PCT 第 33 条 (2) 的标准。

参见补充栏

补充栏

(当前面的任何一栏篇幅不够时使用本栏)

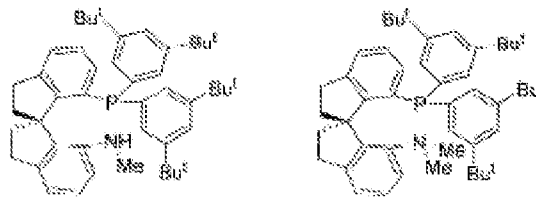
续：第 V 栏

D1 的实施例 11 公开了首先合成手性催化剂、而后还原底物的方法，其中还原部分公开了底物为羰基化合物，压力为 8—10atm，还原 10 分钟—24 小时，加入碱为叔丁醇钾，溶剂为乙醇。因此该实施例的方法落在了本申请权利要求 12—15 的范围内，权利要求 12—15 不具备新颖性，不符合 PCT 第 33 条 (2) 的标准。D1 的实施例 11 在手性催化剂合成部分公开了乙醇为溶剂，室温下搅拌 1 小时，而后氢气氛围为 1 大气压下 1 小时；以及公开的还原部分如上所述。因此该实施例的技术方案落在了本申请权利要求 16—20 的范围内，权利要求 16—20 不具备新颖性，不符合 PCT 第 33 条 (2) 的标准。

2.3 创造性评价

D1 是权利要求 1—2 和 4—20 最接近的现有技术。由于相对于 D1 来说，权利要求 1—2 和 4—20 不具备新颖性。因此对于本领域普通技术人员来说这些权利要求的主题是显而易见的。即相对于 D1，权利要求 1—2 和 4—20 不具备创造性，不符合 PCT 第 33 条 (3) 的标准。

D2 是权利要求 3 最接近的现有技术，其权利要求 2 公开的下面的化合物与本申请权利要求 3 的化合物最接近，它们的区别在于胺基上的取代基不同，本申请权利要求 3 是取代或未取代的吡啶甲基，而 D2 中是甲基或氢。因此本申请权利要求 3 要解决的技术问题是提供可用于催化还原剂的新的手性螺环吡啶胺基膦化合物。在本领域中，取代基的体积、性质都决定了所得到化合物的催化性能。当 D2 公开的下述化合物中，氨基上甲基中的氢被（取代的）吡啶基取代后，物质的结构发生了较大的变化。根据 D2 或 D2 结合公知常识，本领域技术人员无法预见到经过这样较大的变化后得到的化合物仍然具有类似的催化性能。即这种改变是需要创造性的劳动的。因此相对于 D2，权利要求 3 的化合物具备创造性，符合 PCT 第 33 条 (3) 的标准。



2.4 工业实用性评价：

权利要求 1—20 可以在催化剂化学领域使用，故而具备工业实用性，符合 PCT 条约 33(4) 的规定。