

**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 IEC170031PCT	<b>FOR FURTHER ACTION</b>		See item 4 below
International application No. PCT/CN2017/087433	International filing date ( <i>day/month/year</i> ) 07 June 2017 (07.06.2017)	Priority date ( <i>day/month/year</i> ) 08 June 2016 (08.06.2016)	
International Patent Classification (8th edition unless older edition indicated) See relevant information in Form PCT/ISA/237			
Applicant XUANZHU PHARMA 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 6 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 type="checkbox"/></td> <td>Box No. II</td> <td>Priority</td> </tr> <tr> <td><input checked="" 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 type="checkbox"/>	Box No. II	Priority	<input checked="" 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 type="checkbox"/>	Box No. II	Priority																						
<input checked="" 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 11 December 2018 (11.12.2018)
The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland	Authorized officer  Xiaofan Tang
Facsimile No. +41 22 338 82 70	e-mail: pct.team2@wipo.int

# 专利合作条约

发信人：国际检索单位

收信人： 100037 中国北京市西城区阜成门外大街2号万通新世界广场8层  中国国际贸易促进委员会专利商标事务所
---

## PCT

国际检索单位书面意见

(PCT细则43之二 . 1)

国际申请号 PCT/CN2017/087433		国际申请日 (年/月/日)      2017年 6月 7日		优先权日 (年/月/日)      2016年 6月 8日	
国际专利分类 (IPC) 或国家分类及IPC C07D 471/04(2006.01) i; A61K 31/4545(2006.01) i; A61P 3/10(2006.01) i; A61P 3/06(2006.01) i; A61P 5/48(2006.01) i		申请人 山东轩竹医药科技有限公司			

发文日 (年/月/日)      2017年 8月 3日
关于后续行为 见下面第2段

<p>1. 本意见包括关于下列各项标明的内容：</p> <ul style="list-style-type: none"> <li><input checked="" type="checkbox"/> 第I栏      意见的基础</li> <li><input type="checkbox"/> 第II栏      优先权</li> <li><input checked="" type="checkbox"/> 第III栏      不做出关于新颖性、创造性和工业实用性的意见</li> <li><input type="checkbox"/> 第IV栏      缺乏发明的单一性</li> <li><input checked="" type="checkbox"/> 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</li> <li><input type="checkbox"/> 第VI栏      某些引用的文件</li> <li><input type="checkbox"/> 第VII栏      国际申请中的某些缺陷</li> <li><input checked="" type="checkbox"/> 第VIII栏      对国际申请的某些意见</li> </ul> <p>2. 后续行为</p> <p>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。</p> <p>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）。</p> <p>进一步的选择参见PCT/ISA/220表。</p>
---

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	完成本意见的日期 2017年 7月 30日	受权官员 张建宏
传真号 (86-10) 62019451	电话号码 (86-10) 010-82246675	

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. (提交提供)

纸件形式

电子形式

b. (提交时间)

含在申请提交时的国际申请中

以电子形式与国际申请一起提交

为检索之用随后提交本单位

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III栏 不做出关于新颖性、创造性和工业实用性的意见

对于

- 整个国际申请  
 权利要求 12

没有审查要求保护的发明看来是否具备新颖性、创造性(非显而易见性), 或者工业实用性的问题,

因为:

- 该国际申请, 或者该权利要求 12 涉及不要求国际检索的主题(具体说明):

[1] 权利要求12涉及疾病的治疗方法, 但本声明基于本申请所要求保护化合物的相应制药用途进行了审查。

- 说明书、权利要求书或者附图(下面特别指明的部分)或者所述权利要求 \_\_\_\_\_ 不清楚, 以致不能够形成任何有意义的意见(具体说明):

- 权利要求书或所述权利要求 \_\_\_\_\_ 没有得到说明书的充分支持, 以致不能形成任何有意义的意见(具体说明):

- 对所述权利要求 \_\_\_\_\_ 没有做出国际检索报告。

- 没有序列表, 无法做出有意义的意见; 申请人没有在规定的期限内:

没有提供符合行政规程附件C中所规定的标准的纸件形式的序列表, 并且国际检索单位也未获得式和方式可以被接受的序列表。

没有提供符合行政规程附件c中所规定的标准的电子形式的序列表, 并且国际检索单位也未获得式和方式可以被接受的序列表。

在答复根据细则13之三.1(a)或(b)的通知提交序列表时, 没有缴纳所要求的后提交费。

- 详情见补充栏

## 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	1-13	是
	权利要求	无	否
创造性 (IS)	权利要求	无	是
	权利要求	1-13	否
工业实用性 (IA)	权利要求	1-13	是
	权利要求	无	否

## 2. 引证和解释:

[1] 2.1 引证的文献

[2] D1: CN102127072A (山东轩竹医药科技有限公司) 20.7月2011 (20.07.2011)

[3] D2: CN102863440A (山东轩竹医药科技有限公司) 09.1月2013 (09.01.2013)

[4] D3: SHU, Chutian等, "Discovery of Imigliptin, a Novel Selective DPP-4 Inhibitor for the Treatment of Type 2 Diabetes", ACS Medicinal Chemistry Letters, 第8期, 第5卷, 16.6月2014 (16.06.2014), 第921-926页

[5] 2.2 新颖性

[6] D1公开了化合物17 (即权利要求1中式(I)) 的三氟乙酸盐及其制备方法 (说明书实施例17)。

[7] D2公开了式(1)化合物的二盐酸盐晶型I (权利要求1)。

[8] D3公开了化合物27 (第925页Scheme 1. )。

[9] D1-D3均未公开权利要求1中式(I)化合物的丁二酸盐晶体。因此, 权利要求1具备新颖性, 符合PCT条约33(2)的规定。

[10] D1-D3同样未公开权利要求2-13请求保护的主体。因此, 权利要求2-13同样具备新颖性, 符合PCT条约33(2)的规定。

[11] 2.3 创造性

[12] 对于权利要求1, 以D1作为最接近的现有技术。则权利要求1所请求保护的晶体盐与D1公开的盐相比较, 其区别在于: 与式(I)化合物成盐的酸的种类不同。权利要求1实际解决的技术问题是: 提供一种式(I)化合物丁二酸盐晶体。然而将药物化合物制备成各种常用盐进而纯化得到晶体为本领域常规技术手段, 其中丁二酸为本领域常规使用的与药物成盐的有机酸。因此, 在D1的基础上得到权利要求1所请求保护的技术方案对于本领域技术人员而言是显而易见的。因此, 权利要求1不具备创造性, 不符合PCT条约33(3)的规定。基于相同理由, 权利要求2-4, 13同样不具备创造性, 不符合PCT条约33(3)的规定。

[13] 对于权利要求5, D1实施例17公开了化合物17三氟乙酸盐的制备方法。则权利要求5与D1相比较, 区别在于: 盐的种类, 结晶的具体操作不同。权利要求5实际解决的技术问题是: 提供一种制备式(I)化合物丁二酸盐的方法。然而本领域技术人员在制备一种化合物具体的盐时有动机结合D1实施例17的操作加入酸反应, 并根据其掌握的普通技术知识和实验手段进行溶剂的选择和操作步骤的优化。因此, 权利要求5不具备创造性, 不符合PCT条约33(3)的规定。基于相同理由, 权利要求6-9同样不具备创造性, 不符合PCT条约33(3)的规定。

[14] 权利要求10请求保护药物组合物。权利要求11-12请求保护化合物的制药用途。D1公开了包含其化合物的组合物及其相应的制药用途 (权利要求10-11)。因此, 权利要求10-12同样不具备创造性, 不符合PCT条约33(3)的规定。

[15] 2.4 工业实用性

[16] 权利要求1-13可在制药工业中应用, 因此符合PCT条约33(4)有关工业实用性的规定。

## 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中涉及“优选”，导致权利要求限定出两个不同的保护范围，不符合PCT第6条的规定。