HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

专利申请文件及技术交底书撰写

用科技成就每一个创新中国梦

汇报人：倪健

天启黑马信息科技（北京）有限公司

目录/Contents

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

01 国际贸易形势与政策导向

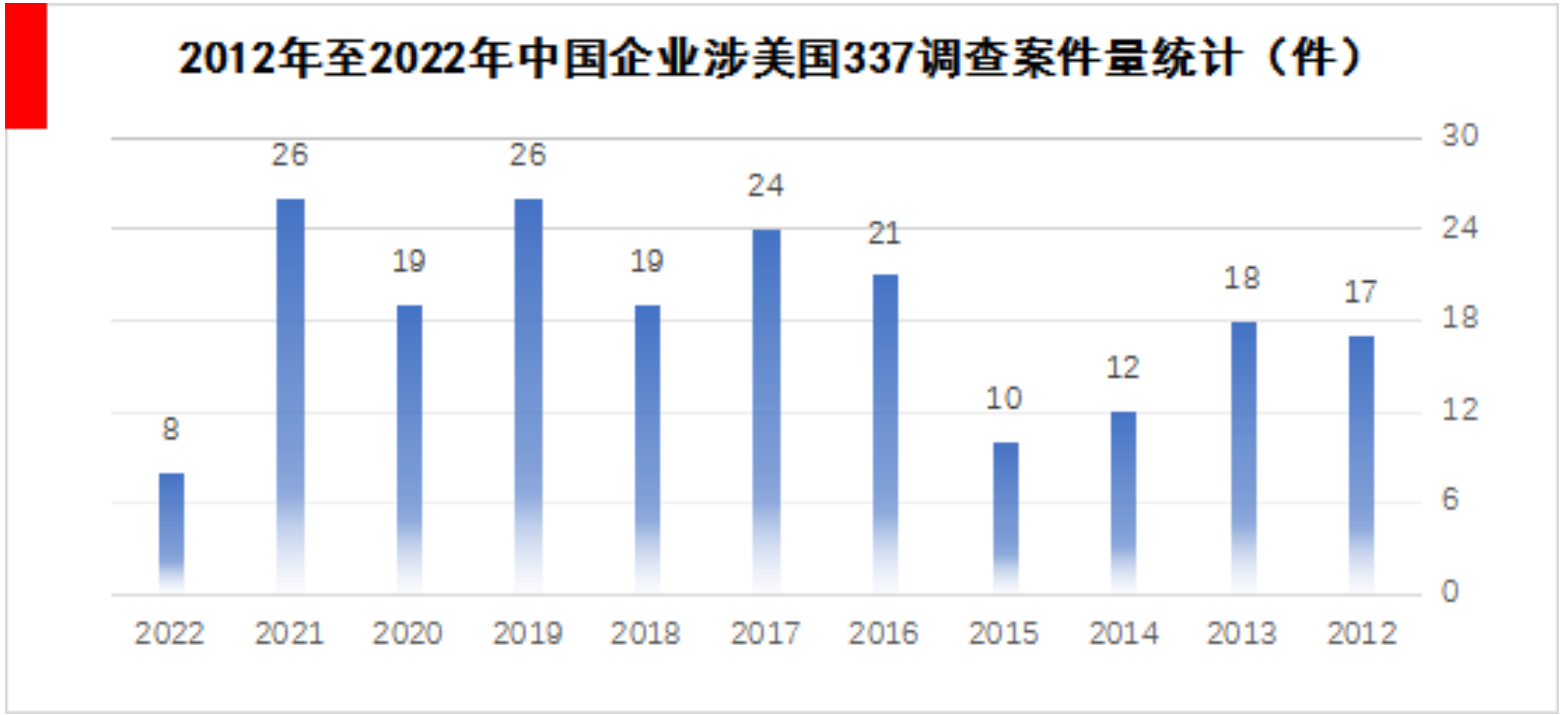
02 高价值专利申请文件撰写

03 专利技术交底书及其作用

知识产权是国际贸易的标配

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

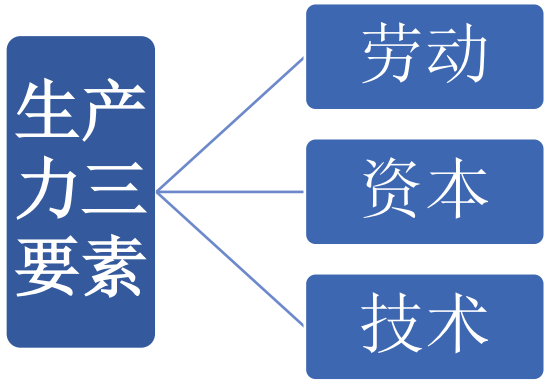
2019年至2022年中国企业涉美国337调查案件案由统计

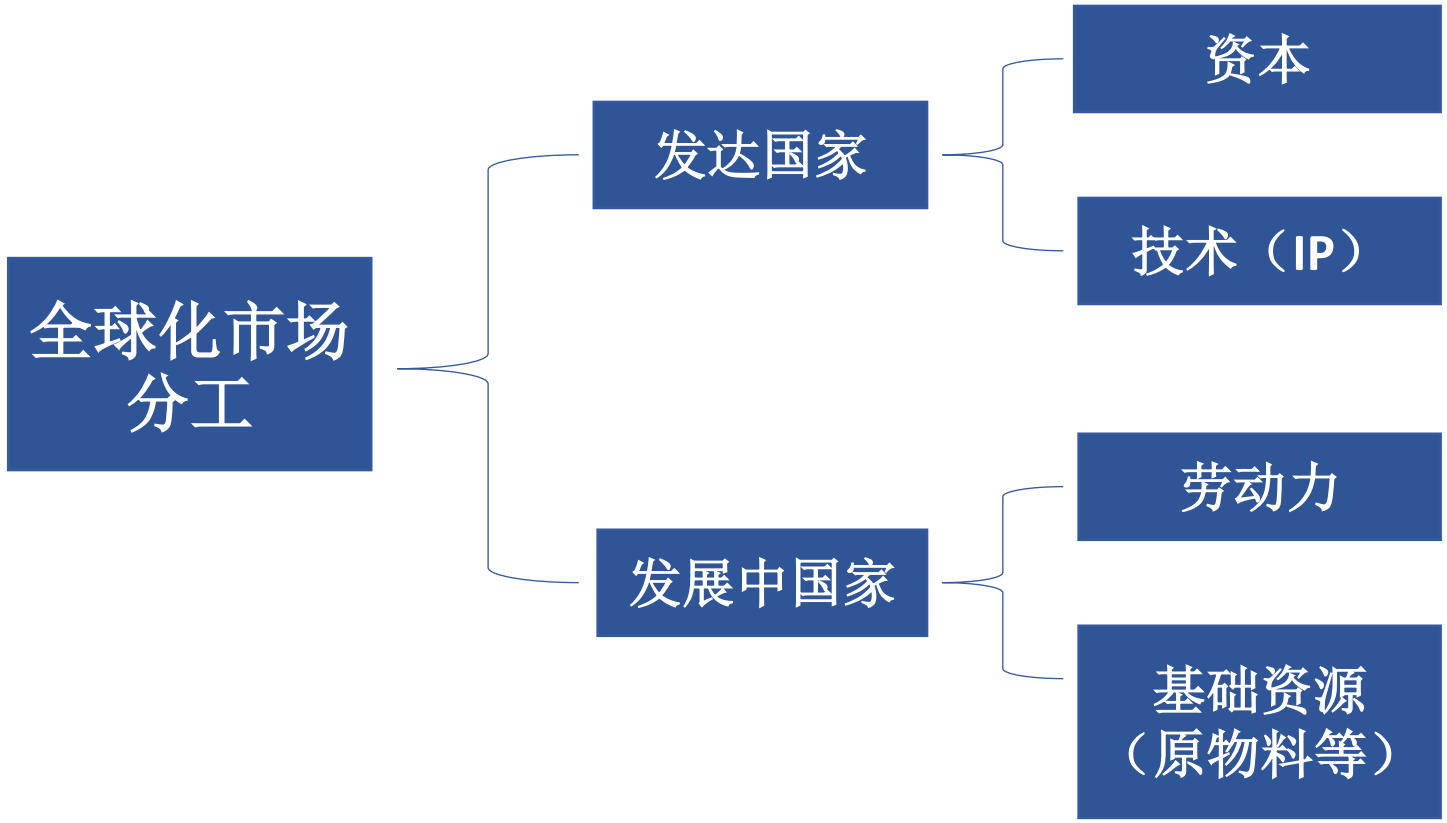


以上数据来源于美国国际贸易委员会的官方数据统计，统计来源于知产力

知识产权是国际贸易的标配

劳动力、资本和技术是现代经济中最为重要的生产要素。这三个要素相互作用，共同推动了经济的发展和社会的进步。然而全球化是片面的，国际政治经济秩序从来不是公平的，发达国家善于利用自身优势发展而来的高附加值、高科技产业，实现对发展中国家的控制、剥削





知识产权是国际贸易的标配

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

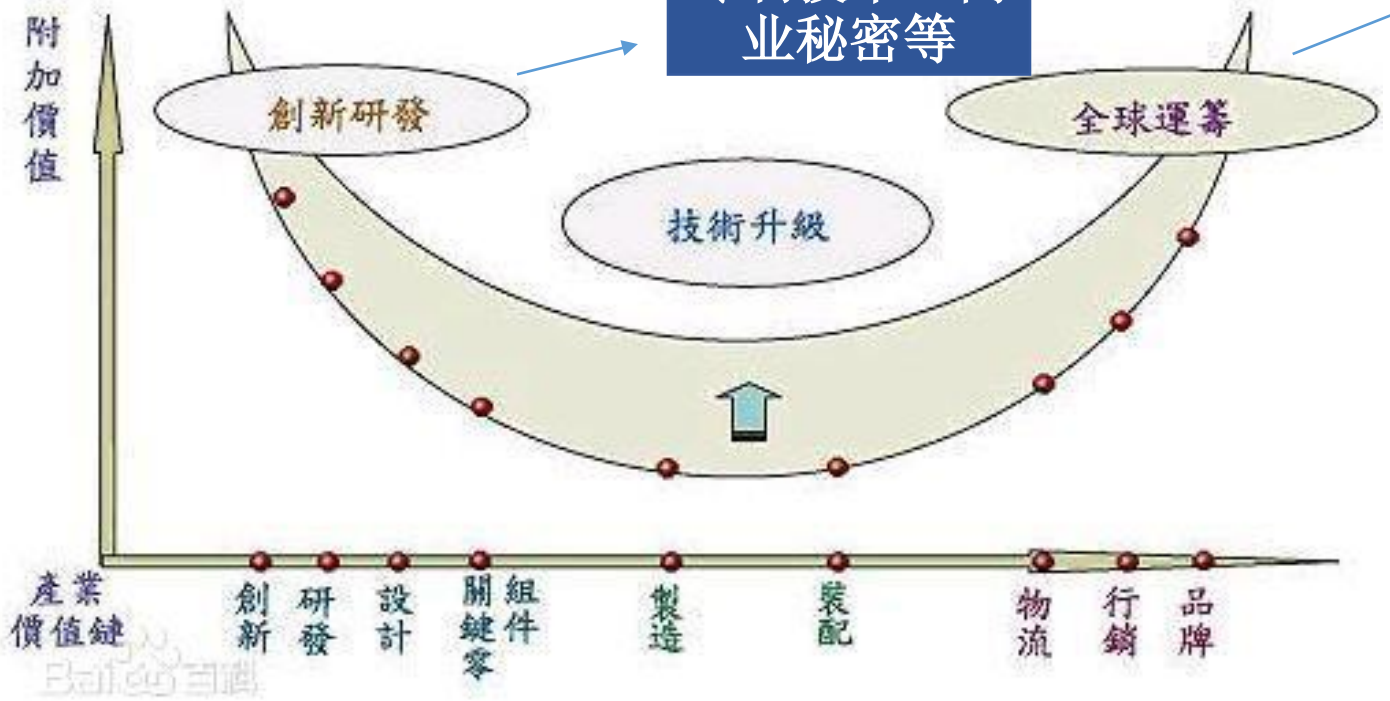
发达国家：通过知识产权保护维持其在研究开发以及品牌上的既有优势

- 提升技術層次
- 邁向創新研發
- 開展全球運籌

→ 提高附加價值

专利技术、商业秘密等

商标保护



图片来源于百度百科

知识产权是国际贸易的标配

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

2018年3月以来，针对美国政府单方面发起的中美经贸摩擦，中国采取有力应对措施，坚决捍卫国家和人民利益。

2020年1月16日，中美签署《关于发布中美第一阶 段经贸协议的公告》全文包括：序言、第一章知识产权、第二章技术转让、第三章食品和农产品贸易、第四章金 融服务、第五章宏观经济政策、汇率问题和透明度、第六章扩大贸易、第七章双边评估和争端解决、第八章最 终条款等9个部分章节。其中具体涉及商业秘密，证券、基金管理和期货服务，保险服务等方面。

第一章 知识产权

第一节 一般义务

美国认识到知识产权保护的重要性。中国正从重要知识产权消费国转变为重要知识产权生产国，中国认识到，建立和实施知识产权保护和执行的全面法律体系的重要性。中国认为，不断加强知识产权保护和执法，有利于建设创新型国家，发展创新型企业，推动经济高质量发展。

第二章 技术转让

双方确认确保按照自愿和基于市场的条件开展技术转让的重要性，并认识到强制技术转让是一项重要关切。由于技术和技术变化给世界经济带来深刻影响，双方进一步认识到采取措施解决这些问题的重要性。

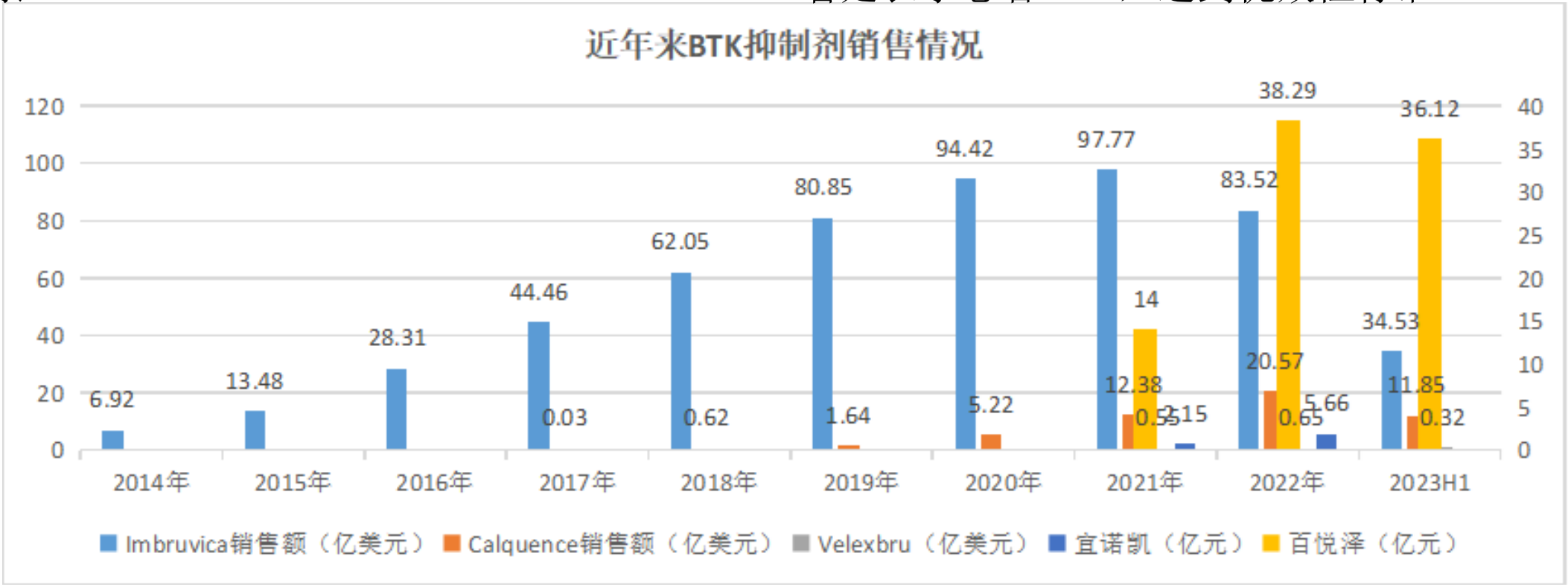
为增进双方关于技术事项的互信与合作，保护知识产权，促进贸易和投资，并为解决长期结构性问题打好基础，双方约定如下：

企业出海之专利侵权风险— 百济神州

HimmPat | 黑马学到 让一部分人先从科技情报中看到未来

Imbruvica（伊布替尼）凭借先发优势和获批适应症最多，销售额最高，于2021年达到销售额峰值（97.77亿美元），不过2022年Imbruvica销售额开始下滑，这种局面的出现与竞品的出现有很大关系

另一方面，泽布替尼直接选择与伊布替尼头对头PK，试图将伊布替尼挑落下马，并且还打赢了。在复发或难治性慢性淋巴细胞白血病/小淋巴细胞淋巴瘤（R/R CLL/SLL）成人患者中，泽布替尼相较于伊布替尼显著延长了患者PFS，达到优效性标准



数据来源于医药魔方

企业出海之专利侵权风险— 百济神州

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

AbbVie Files Patent Infringement Lawsu Against BeiGene's Brukinsa

Published: Jun 15, 2023 | By Alejandra Manjarrez

In terms of safety, Brukinsa was also superior. For instance, patients treated with it were less likely to experience cardiac adverse events.

Based on their compared toxicity, the National Comprehensive Cancer Network **placed** Brukinsa ahead of Imbruvica in their guidelines to treat these slow-growing blood cancer.

In the first quarter of 2023, Brukinsa's worldwide sales reached $211.4 million, up significantly from $104.3 million a year ago. Imbruvica's sales, on the other hand, dropped 25% in the first quarter of 2023 compared to the same period in 2022.

BeiGene's statement emphasized that the company "has developed original and novel intellectual properties" around Brukinsa to "demonstrate its differentiated profile," while insisting that they "will vigorously defend against all allegations of patent infringement."

首个"出海"成功的原研抗癌药被指专利侵权，百济神州的回应来了

播报文章

第一财经
2023-06-16 08:34 | 第一财经官方帐号,优质财经领域创作者

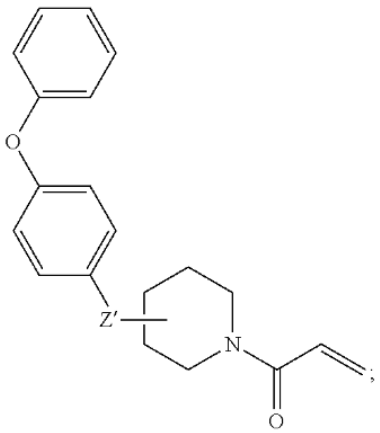
关注

6月15日下午，百济神州（BGNE.NS、06160.HK、688235.SH）A股以及港股股价均暴跌12%以上，而股价大跌导火线是，公司的泽布替尼（商品名：百悦泽）专利被指控侵权。

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

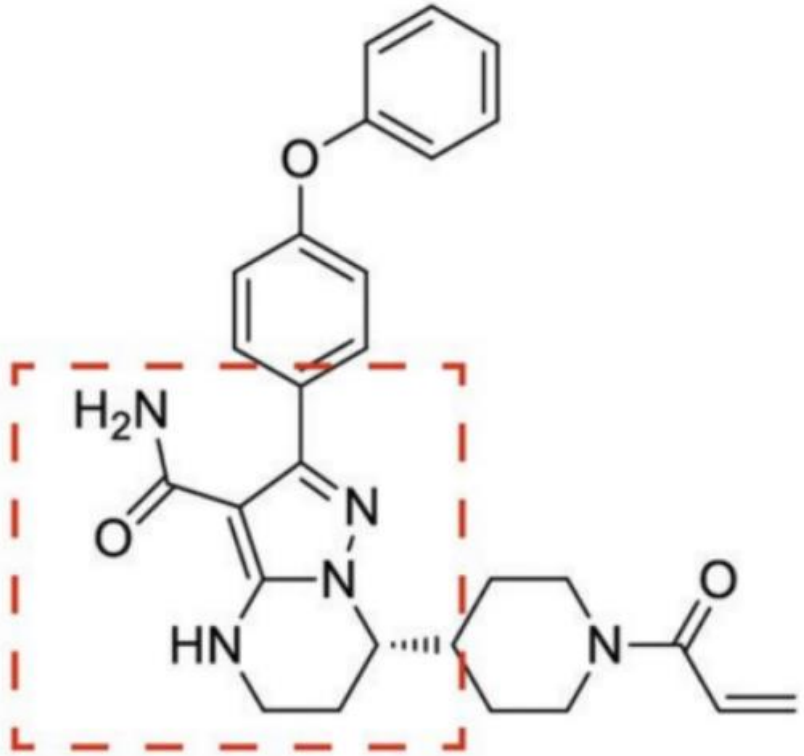
US11672803B2—涉案专利

1. 一种治疗个体慢性淋巴细胞白血病 (CLL) 或小淋巴细胞淋巴瘤 (SLL) 的方法，包括：以连续的每日方案向个体口服治疗有效量的布鲁顿氏酪氨酸激酶(Btk)的不可逆抑制剂，直至CLL或SLL进展或不可接受的毒性；其中淋巴细胞增多不被认为是CLL或SLL的进展，并且其中Btk的不可逆抑制剂是具有以下结构的有机小分子：



其中Z'是包含2-4个氮杂原子的任选取代的稠合杂环系统；其中任选取代的稠合杂环系统由包含至少一个氮杂原子的5元环稠合至包含至少一个氮杂原子的6元环组成；和其中Btk的不可逆抑制剂与布鲁顿氏酪氨酸激酶的Cys^{481}形成共价键。

Zanubrutinib



HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

Pharmacyclics 公司用于起诉百济神州侵权的专利授权公告号是 US11672803B2（以下称 803 号专利），2023 年 6 月 13 日收到授权通知书，当天就提起了诉讼

2011-06-03	申请日	US13/153317 接续案(前案)
2013-04-24	申请日	US13/869700 接续案(前案)
2013-11-26	申请日	US14/091196 接续案(前案)
2017-09-26	申请日	US15/715995 接续案(前案)
2018-04-27	申请日	US15/965114 接续案(前案)
2019-08-08	申请日	US16/536058 接续案(前案)
2020-01-21	申请日	US16/748142 接续案(前案)
2020-07-10	申请日	US16/926280 当前专利 申请号
2021-06-10	首次公开日	US20210169885A1 公开(公告)号
2023-06-13	公开(公告)日, 授权日	US11672803B2 当前专利 公开(公告)号

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

研发立项

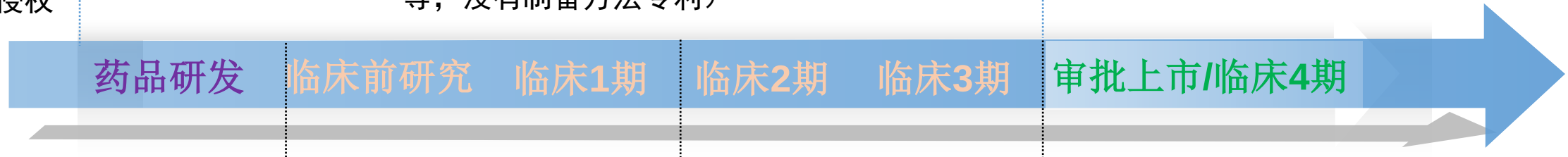
技术热点

技术空白点

规避专利侵权

药品上市

药品专利登记（化学药品、生物制药、中药化合物成分、组合物、序列结构、用途专利等，没有制备方法专利）



产品确定

专利布局：化合物、剂型、联合用药、基因、工程菌、用途等

地域布局：国内和国外哪些国家和地区

专利申请事宜

提交专利申请

专利授权后，是否需要分案，如何延长保护期

药品上市

1 进行FTO检索

2 进行竞争对手监视，对仿制药声明提出异议

3 发起侵权诉讼

4 实施专利许可、专利转让

5 布局外围专利，变相延长专利保护期

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

02 高价值专利申请文件撰写

高价值专利培育是明确的政策导向

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

《国民经济社会发展第十四个五年规划与2035年目标》

专栏 1 “十四五”时期经济社会发展主要指标

类别	指标	2020 年	2025 年	年均/累计	属性
经济发展	1.国内生产总值（GDP）增长（%）	2.3	—	保持在合理区间、各年度视情提出	预期性
	2.全员劳动生产率增长（%）	2.5	—	高于 GDP 增长	预期性
	3.常住人口城镇化率（%）	60.6*	65	—	预期性
创新驱动	4.全社会研发经费投入增长（%）	—	—	>7、力争投入强度高于“十三五”时期实际	预期性
	5.每万人口高价值发明专利拥有量（件）	6.3	12	—	预期性
	6.数字经济核心产业增加值占 GDP 比重（%）	7.8	10	—	预期性
民生福祉	7.居民人均可支配收入增长（%）	2.1	—	与 GDP 增长基本同步	预期性
	8.城镇调查失业率（%）	5.2	—	<5.5	预期性
	9.劳动年龄人口平均受教育年限（年）	10.8	11.3	—	约束性
	10.每千人口拥有执业（助理）医师数（人）	2.9	3.2	—	预期性
	11.基本养老保险参保率（%）	91	95	—	预期性
	12.每千人口拥有 3 岁以下婴幼儿托位数（个）	1.8	4.5	—	预期性
	13.人均预期寿命（岁）	77.3*	—	〔1〕	预期性
绿色生态	14.单位 GDP 能源消耗降低（%）	—	—	〔13.5〕	约束性
	15.单位 GDP 二氧化碳排放降低（%）	—	—	〔18〕	约束性
	16.地级及以上城市空气质量优良天数比率(%)	87	87.5	—	约束性
	17.地表水达到或好于Ⅲ类水体比例（%）	83.4	85	—	约束性
	18.森林覆盖率（%）	23.2*	24.1	—	约束性
安全保障	19.粮食综合生产能力（亿吨）	—	>6.5	—	约束性
	20.能源综合生产能力（亿吨标准煤）	—	>46	—	约束性

高价值专利培育是明确的政策导向

HimmPat | 黑马学到 让一部分人先从科技情报中看到未来

国家知识产权局关于印发《推动知识产权高质量发展年度工作指引（2022）》

三、提升知识产权创造质量		
5. 促进知识产权高质量创造	**国家知识产权局：**强化中国专利奖对关键核心技术领域重大发明创造的评价和激励。持续严格规范专利商标申请行为，严厉打击非正常专利申请和恶意商标注册申请，严防非正常申请外溢造成国际影响。修订《关于规范专利申请行为的若干规定》，进一步完善工作机制，创新排查方式，提高发现和打击非正常专利申请的力度和精准度。加大对商标囤积行为的治理。 **各地区：**进一步统一思想、强化治理，完善工作机制、健全工作措施，严厉打击非正常专利申请和商标恶意抢注行为，对于有关申请人、代理人、代理机构进行严肃处理，必要的追究法律责任，共同营造知识产权高质量发展的良好氛围。 **涉及城市：**坚持高质量发展导向不动摇，市本级及区县的知识产权资助政策要完全符合《关于持续严格规范专利申请行为的通知》等政策文件要求，继续严厉打击非正常专利申请行为、恶意商标注册行为。力争在2023年底前全面取消对专利授权的各类财政资助，重点加大对后续转化运用、行政保护和公共服务的支持。	**局内：**运用促进司、保护司、条法司、专利局审业部，商标局 **省份：**各省份必做 **城市：**国家知识产权强市建设示范城市必做

高价值专利培育是明确的政策导向

高价值专利的衡量

申请趋势—专利质量存在诸多问题

HimmPat | 黑马学到 让一部分人先从科技情报中看到未来

2018年，中科院某所“石墨烯”项目成果获国家自然科学奖二等奖。

■项目发表在Nature Materials等学术期刊上的8篇论文在国内外产生重要影响，得到同行业高度评价和广泛引用。

■该所就项目成果共申请专利5件：

其中3件因发表论文在先未获授权——“氢电弧加热膨胀石墨烯解理”；“快速加热膨胀石墨烯解理”；“石墨烯负载或包裹金属氧化物的电极材料”

1件专利“在三维多孔金属模板表面催化裂解碳源气体生长出三维连通的石墨烯” 撰写问题产品权利要求未获授权，仅制备方法获授权。

1件“电解鼓泡分离及转移石墨烯膜”，授权后权利要求中的限定技术特征较多，实际的专利保护范围较小。

申请趋势—专利质量存在诸多问题

HimmPat | 黑马学到 让一部分人先从科技情报中看到未来

1.技术创新水平 → **2.专利提案水平** → 3.专利布局能力

材料案例

■专利保护主题过于单一，对应技术链条存在专利保护盲区

	曼彻斯特大学 CN201180006211	苏州高通新材料 CN201510259055
保护主题	权利要求1：保护材料 权利要求12：保护制备方法 权利要求13：保护材料的性能检测方法 权利要求16：保护材料力学性能的改善方法 权利要求17：保护材料在电子器件或结构材料领域的用途	权利要求1：保护材料 权利要求2：保护制备方法

申请趋势—专利质量存在诸多问题

HimmPat | 黑马学到 让一部分人先从科技情报中看到未来

1.技术创新水平 → **2.专利提案水平** → 3.专利布局能力

材料案例

■专利权利要求限定过多，专利保护范围狭窄

	曼彻斯特大学 CN201180006211	苏州高通新材料 CN201510259055
保护范围	一种纳米复合材料，包括： (1)基材；石墨烯或官能化石墨烯； 任选的粘合剂组分，用于将所述石墨烯或官能化石墨烯粘附至所 述基材； 和任选的保护层，用于覆盖所述石墨烯或官能化石墨 烯；或 (2)分散在液体载体中的石墨烯或官能化石墨烯，其中所述液体载 体在一旦施加至表面后能够形成涂覆所述表面的膜。 ◆采用“基材”的表述，不限定成分的比例，保护范围覆盖所有分散有石墨烯的复合材料	一种基于磺化石墨烯的导热尼龙材料，其特征在于包含：尼龙基体材料95wt%～99.9wt%，磺化石墨烯0.1wt%～5wt%，其中所述磺化石墨烯的径向尺寸为500nm～50μm，厚度为1～20nm，并且所述磺化石墨烯中所含C与S的摩尔比为12:1～6:1。 ◆采用“尼龙基体材料”的表述，限定尼龙基体材料和磺化石墨烯的比例范围，限定磺化石墨烯的径向尺寸、厚度和C/S摩尔比，保护范围较小。

申请趋势—专利质量存在诸多问题

HimmPat | 黑马学到 让一部分人先从科技情报中看到未来

1.技术创新水平 → **2.专利提案水平** → 3.专利布局能力

材料案例

■专利权利要求缺少梯次设计，专利保护纵深不足

	曼彻斯特大学 CN201180006211	苏州高通新材料 CN201510259055
保护层次	对材料主题的保护层次： **第一层次**：保护石墨烯、粘合剂、保护层组成的复合材料 **第二层次**：保护粘合剂、保护层的用途 **第三层次**：3个权利要求分别单独保护石墨烯、粘合剂、保护层 **第四层次**：保护复合材料组合与另一材料的结合形式 **第五层次**：2个权利要求分别保护石墨烯成分厚度、复合材料层数 **第六层次**：3个权利要求分别保护基材选取范围、基材厚度、保护基材形式	对材料主题的保护层次： **第一层次**：保护尼龙基体材料和磺化石墨烯复合材料 **第二层次**：限定复合材料垂直导热系数

申请趋势—专利质量存在诸多问题

HimmPat | 黑马学到 让一部分人先从科技情报中看到未来

1.技术创新水平 → **2.专利提案水平** → 3.专利布局能力

医药案例

■说明书内容受忽视，对权利要求的支撑不够充分全面

法国施维雅药厂专利CN200380104606	
权利要求	化合物及衍生物结构；药物组合物；制备的药物用途；制备方法；
说明书实施例	共28个的实施例： **实施例1-23**为化合物的制备及结构确证，包括近20余个化合物的合成工艺、4项效果确证试验、1项制剂工艺； **实施例A-E**为化合物毒性及有效性验证试验； **实施例F**为药物组合物制剂制备试验，内容全面、数据详实

申请趋势—专利质量存在诸多问题

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

1.技术创新水平 → 2.专利提案设计水平 → **3.专利布局能力**

- 随机性
- 分散性
- 盲目性
- 数量导向
- 任务导向

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

阿斯利康看中了第一三共什么?

2020-08-02 00:00

7月27日，阿斯利康与第一三共宣布在抗体偶联药物（ADC）领域达成重磅合作。这一合作协议及金额高达60亿美元，可谓ADC药物领域的一次大手笔交易。

根据协议，阿斯利康与第一三共将在全球除日本外共同开发和商业化靶向Trop-2的抗体偶联药物DS-1062，第一三共将保留在日本独家开发的权利。与此同时，阿斯利康将向第一三共支付10亿美元分期付款（协议完成时3.5亿美元，协议生效之日起12个月后3.25亿美元，协议生效之日起24个月后3.25亿美元）、药物上市后额外支付10亿美元款项，以及高达40亿美元的销售相关里程碑款项。

据悉，DS-1062是一款潜在的重磅新药，目前正在开发用于治疗表达Trop-2的多种肿瘤。而阿斯利康也可谓对DS-1062寄予了厚望，认为该疗法将“重新定义肺癌、乳腺癌和其他多种癌症的治疗标准”。

实际上，这已经不是阿斯利康首次“出手”第一三共了。去年3月份，阿斯利康就已斥69亿美元巨资与第一三共达成合作，在全球范围内共同开发和商业推广肿瘤靶向药Enhertu。

也就是说，在短短一年半不到的时间内，阿斯利康已向第一三共豪掷近130亿美元。那么阿斯利康如此“认定”第一三共的原因是什么?

放手一博，攻下ADC

近年来，阿斯利康在产品和公司收购方面可以说是十分谨慎，所以其在一年半不到的时间里两度面向第一三共大手笔收购之举，的确难免令人遐想。

具体案例-SeaGen Linker专利

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

第一三共ヘルスケア
Daiichi-Sankyo

Seagen

2004

Seagen 提交美国专利申请US10/983340

2008

Seagen 与第一三共daiichi合作开发抗体偶联药物（ADC）2008至2015

2013

2013年 提交专利申请WO2014057687保护ADC，连接子，linker的效应分子等

2015

2015年第一三共提交专利申请WO2015115091靶向HER2的ADC

2019

第一三共的Enhertu(DS-8201)在临床上取得了预料不到的技术效果

Seagen 提交专利申请US10/808039，该专利请求保护了与DS-8201相似的连接子

作为对第一三共诉讼的回应，Seagen则表示，根据两家公司于2008 年达成的协议条款，候选药物中使用的连接子和ADC技术是基于Seagen的ADC技术进行的改良

Seagen 提交专利申请US10/808039，该专利请求保护了与DS-8201相似的连接子

2020

第一三共起诉Seagen“篡夺”连接子技术

1 2020年，FDA批准Enhertu上市
2 第一三共请求US10/808039

1 US10/808039获得授权
2 Seagen 称第一三共专利侵权

具体案例-SeaGen Linker专利

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

UNITED STATES DISTRICT COURT
EASTERN DISTRICT OF TEXAS
MARSHALL DIVISION

SEAGEN INC., Plaintiff, v. DAIICHI SANKYO CO., LTD., Defendant.	CIVIL ACTION NO. **COMPLAINT FOR PATENT INFRINGEMENT** **JURY TRIAL DEMANDED**

COMPLAINT

Plaintiff Seagen Inc. ("Seagen") complains and alleges as follows against Defendant Daiichi Sankyo Co., Ltd. ("DSC").

THE NATURE OF THE ACTION

1. Seagen brings this action to protect its proprietary technology enabling the delivery of chemotherapeutic drugs directly to cancer cells. When Seagen began developing this technology, most chemotherapeutic drugs for cancer were not targeted, resulting in the delivery of treatments throughout the patient's body and causing significant adverse side effects. Since then, Seagen's pioneering innovations in the field of antibody-drug conjugates (ADCs), a type of therapy that directly targets chemotherapeutic drugs to cancer cells, have helped establish ADCs as an important pillar of cancer therapy. Seagen's ADC technology is the result of decades of research and development effort by Seagen's scientists and hundreds of millions of dollars of investment. Seagen's transformative innovations have maintained Seagen's leadership status even as other companies have entered the field, and Seagen's innovations are embodied in more approved ADC therapies than those of any other company. DSC is a new entrant in the ADC field, and it infringes Seagen's United States Patent No. 10,808,039 (the "'039 patent"). DSC has already booked

具体案例-SeaGen Linker专利

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

US 10983340 80 Members in Patent Family (22 currently shown)

IP Office Type

- [ ] All IP5 Offices
  - [ ] EPO
  - [ ] SIPO
  - [ ] KIPO
  - [ ] JPO
  - [x] USPTO
- [ ] Non-IP5 Offices

Office	Application	Applicant	Title	App. Date	Priority #	Pub. #	Pub. Date
US	PCT/US04/38392 View Dossier	1) SEATTLE GENETICS, INC., 2) DORONINA, Svetlana, O., 3) SENTER, Peter, D., 4) TOKI, Brian, E., 5) EBENS, Allen, J., 6) KLINE, Toni, Beth, 7) POLAKIS, Paul, 8) SLIWKOWSKI, Mark, X., 9) SPENCER, Susan, D.,	MONOMETHYLVALINE COMPOUNDS CAPABLE OF CONJUGATION TO LIGANDS	11/05/2004	US 60557116 US 60622455 US 60598899 US 60518534	WO 2005081711 A2 WO 2005081711 A3	09/09/2005 11/23/2006
US	10983340 View Dossier	1) Doronina, Svetlana O. 2) Senter, Peter D. 3) Toki, Brian E.	MONOMETHYLVALINE COMPOUNDS CAPABLE OF CONJUGATION TO LIGANDS	11/05/2004	US 60557116 US 10983340 US 60622455 US 60598899 US 60518534	US 20050238649 A1 US 7498298 B2	10/27/2005 03/03/2009
US	11833959 View Dossier	1) Doronina, Svetlana O. 2) Senter, Peter D. 3) Toki, Brian E. 4) Ebens, Allen J. 5) Kline, Toni Beth 6) Polakis, Paul 7) Sliwkowski, Mark X. 8) Spencer, Susan D.	MONOMETHYLVALINE COMPOUNDS CAPABLE OF CONJUGATION TO LIGANDS	08/03/2007	US 60557116 US 11833959 US 10983340 US 60622455 US 60598899 US 60518534	US 20080248053 A1 US 7964566 B2	10/09/2008 06/21/2011

具体案例-SeaGen Linker专利

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

1

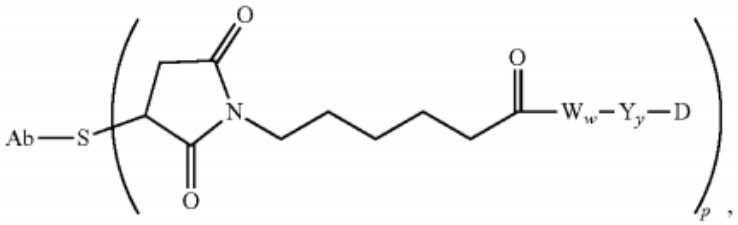
MONOMETHYLVALINE COMPOUNDS CAPABLE OF CONJUGATION TO LIGANDS

1. CROSS-REFERENCES TO RELATED APPLICATIONS

This application is a continuation of U.S. patent application Ser. No. 15/811,190 filed Nov. 13, 2017, which is a continuation of U.S. patent application Ser. No. 15/188,843 filed Jun. 21, 2016, which is a continuation of U.S. patent application Ser. No. 14/194,106 filed Feb. 28, 2014, which is a continuation of U.S. patent application Ser. No. 13/098,391 filed Apr. 29, 2011 (now U.S. Pat. No. 8,703,714), which is a continuation of U.S. patent application Ser. No. 11/833,954 filed Aug. 3, 2007 (now U.S. Pat. No. 7,994,135), which is a divisional of U.S. patent application Ser. No. 10/983,340 filed Nov. 5, 2004 (now U.S. Pat. No. 7,498,298), which is an application claiming the benefit under 35 U.S.C. § 119(e) of U.S. Provisional Patent Application No. 60/518,534, filed Nov. 6, 2003, and U.S. Provisional Patent Application No. 60/557,116, filed Mar. 26, 2004, and U.S. Provisional Patent Application No. 60/598,899, filed Aug. 4, 2004, and U.S. Provisional Patent Application No. 60/622,455, filed Oct. 27, 2004, each of which is incorporated herein by reference in its entirety.

What is claimed is:

1. An antibody-drug conjugate having the formula:

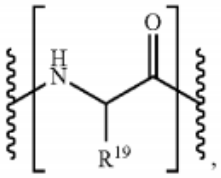


or a pharmaceutically acceptable salt thereof, wherein:

Ab is an antibody,

S is sulfur,

each —W_w— unit is a tetrapeptide; wherein each —W— unit is independently an Amino Acid unit having the formula denoted below in the square bracket:



wherein R^{19} is hydrogen or benzyl,

Y is a Spacer unit,

y is 0, 1 or 2,

D is a drug moiety, and

p ranges from 1 to about 20,

wherein the S is a sulfur atom on a cysteine residue of the antibody, and

wherein the drug moiety is intracellularly cleaved in a patient from the antibody of the antibody-drug conjugate or an intracellular metabolite of the antibody-drug conjugate.

2. The antibody-drug conjugate of claim **1**, wherein Y is a self-immolative spacer.

3. The antibody-drug conjugate of claim **2**, wherein y is 1.

4. The antibody-drug conjugate of claim **3**, wherein p is about 3 to about 8.

5. The antibody-drug conjugate of claim **4**, wherein p is about 8.

6. The antibody-drug conjugate of claim **1**, **2**, **3**, **4**, or **5**, wherein the bioavailability of the antibody-drug conjugate or an intracellular metabolite of the antibody-drug conjugate in a patient is improved when compared to a drug compound comprising the drug moiety of the antibody-drug conjugate.

7. The antibody-drug conjugate compound of claim **1**, **2**, **3**, **4**, or **5**, wherein the bioavailability of the antibody-drug conjugate or an intracellular metabolite of the antibody-drug conjugate in a patient is improved when compared to an analog of the antibody-drug conjugate not having the drug moiety.

8. The antibody-drug conjugate compound of claim **1**, **2**, **3**, **4**, or **5**, wherein the drug moiety is intracellularly cleaved in a patient from an intracellular metabolite of the antibody-drug conjugate.

9. The antibody-drug conjugate of claim **1**, **2**, **3**, **4**, or **5**, wherein the antibody is a monoclonal antibody.

10. The antibody-drug conjugate of claim **9**, wherein the antibody is a humanized monoclonal antibody.

* * * * *

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

03 专利技术交底书及其作用

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

如何写出高质量、高价值专利

在专利申请文件的撰写过程中，就要考虑是否会被竞争对手规避，并且考虑到竞争对手日后会以何种形式进行专利申请，提前进行专利申请和布局，从商业竞争的维度来围绕专利布局

01

申请人提供逻辑顺畅的技术交底书

02

代理人具有阅读技术交底书的能力

03

具有案件预判能力

04

扩充技术方案和专利挖掘能力

05

代理人和发明人之间保持密切的沟通

技术交底书

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

01

概念

技术交底书，即“Invention Disclosure”，就是关于发明创造的核心技术材料，是记载发明人的发明创造内容的原始载体

02

作用

1、公开发明内容
2、传递发明思想
3、形成内容充实的高质量申请文件
4、……

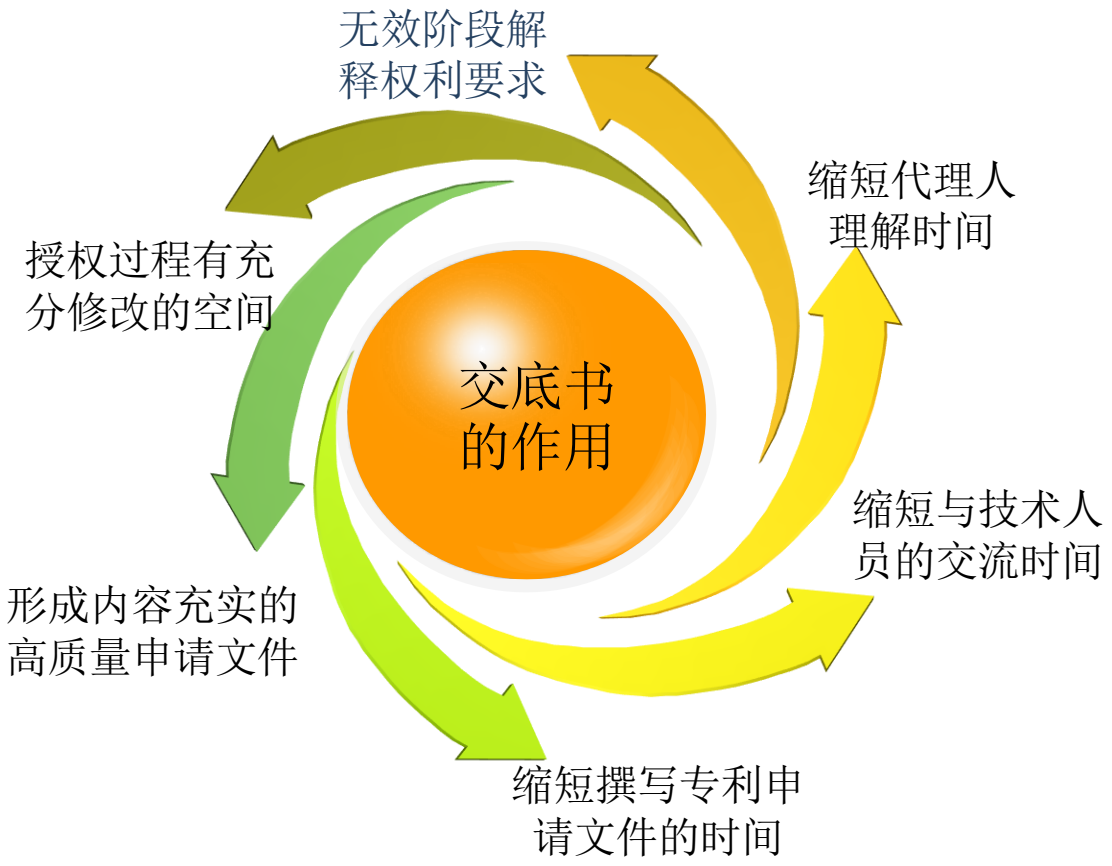
03

主要内容

1、背景技术
2、技术内容
3、技术效果
4、附图

技术交底书的作用

清亦华知识产权



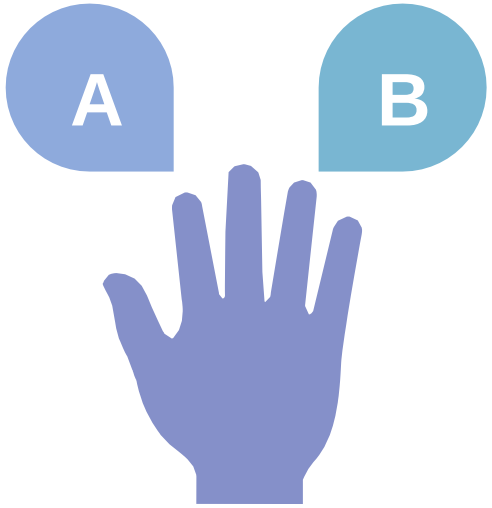
高质量的交底书对专利撰写、授权和确权的影响

- 撰写期间：时效性高，撰写质量高；
- 审查期间：提升通过审查的概率，易授权；
- 确权期间：提升专利稳定性，难无效；

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来
清亦华知识产权

一个产品多个专利

一个产品一件专利？



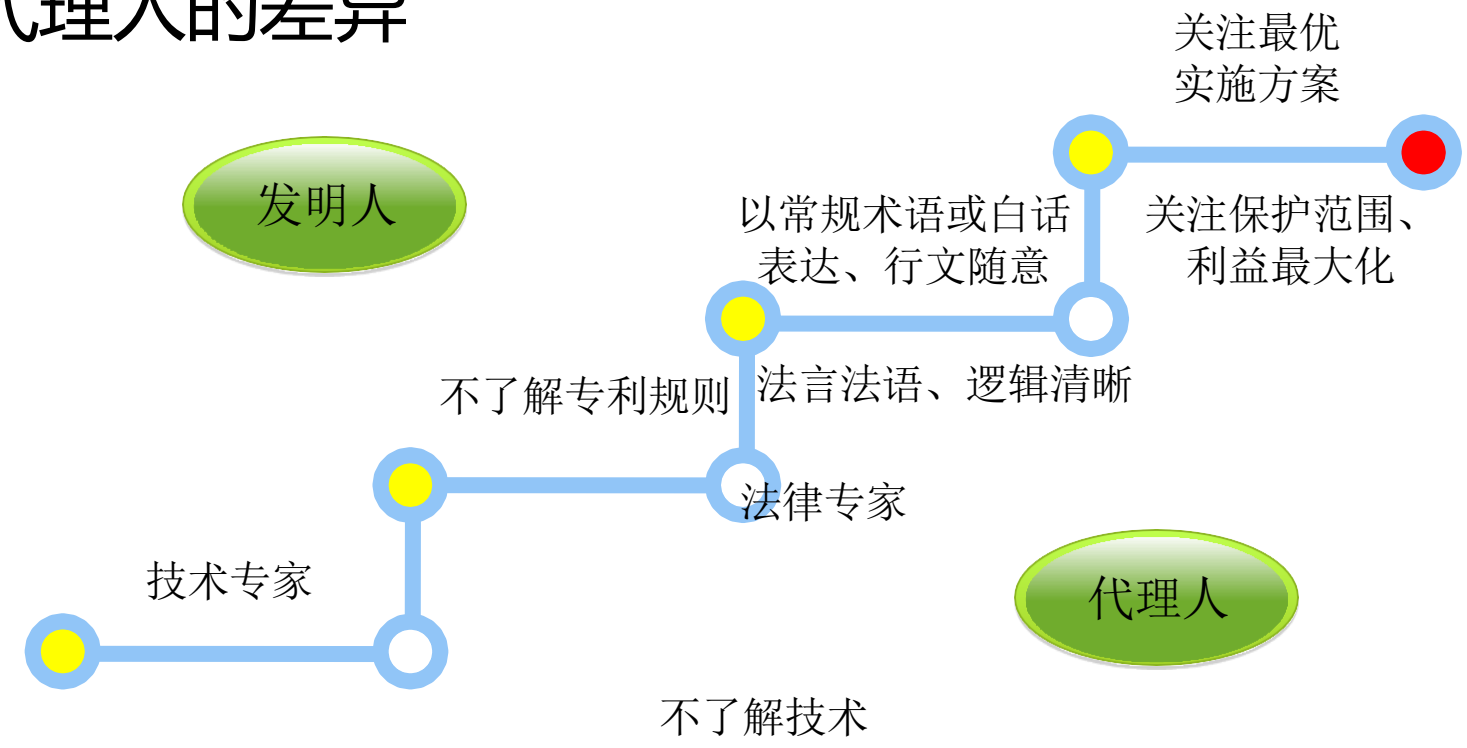
N个产品N件专利？

一个产品中可能蕴含多个可申请专利的技术方案

丰富翔实的技术交底书是前提

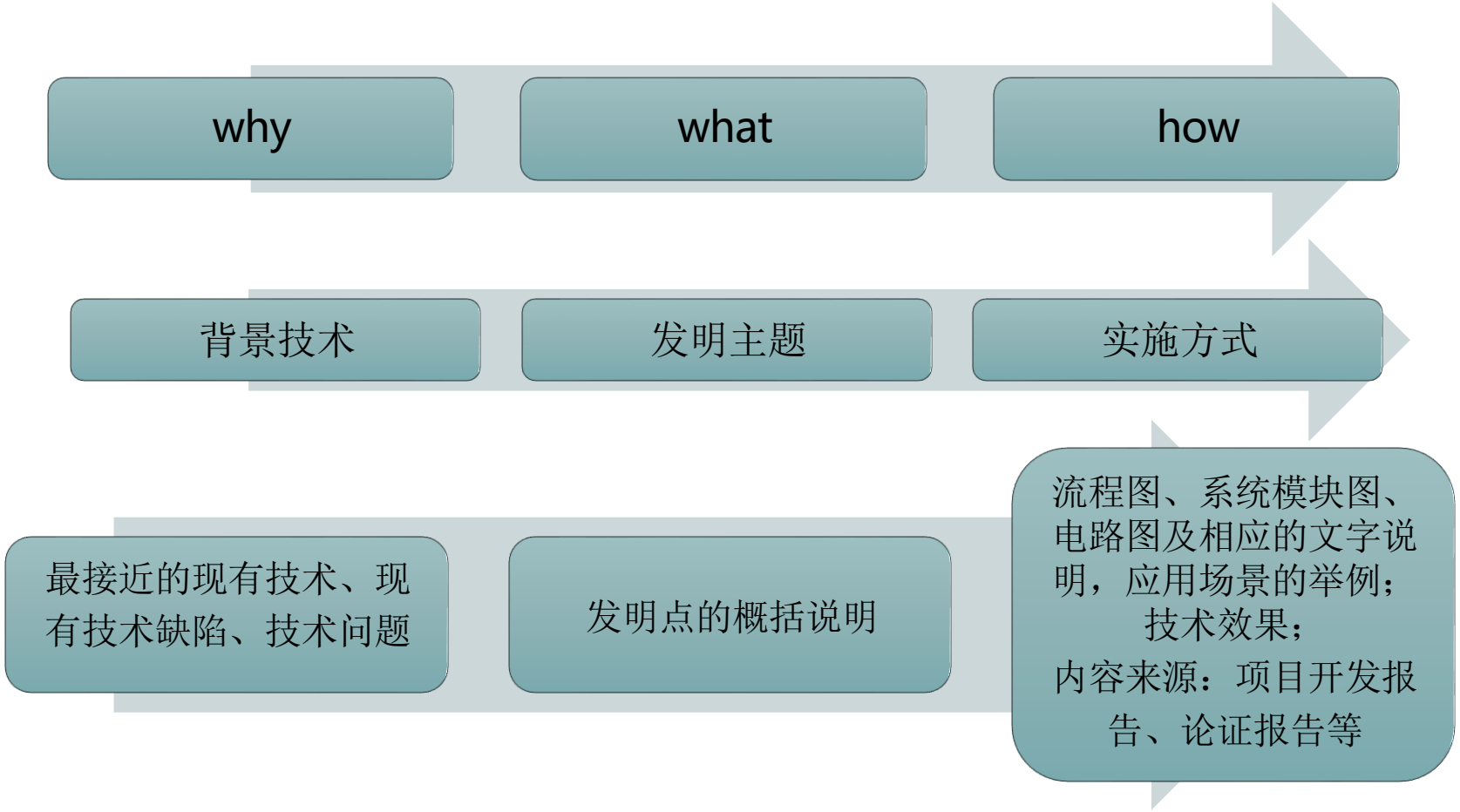
HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来
清亦华知识产权

发明人与代理人的差异



交底书是代理人与发明人沟通的基础，沟通的第一步，重中之重

技术交底书的撰写思路


why
what
how
背景技术
发明主题
实施方式
最接近的现有技术、现有技术缺陷、技术问题
发明点的概括说明
流程图、系统模块图、电路图及相应的文字说明，应用场景的举例；技术效果；
内容来源：项目开发报告、论证报告等

技术交底书的撰写思路

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

背景技术

概述

- 背景技术是对现有技术的描述和客观评价
- 现有技术的描述
- 现有技术的客观评价

注意事项

- 一般介绍一个与技术方案最接近的产品或方法
- 客观指出现有技术存在的不足
- 结合附图说明
- 最好引证最接近的现有技术文献

技术内容

概述

- 所要解决的技术问题
- 具体实施方式
- 详细描述
- 实施例数量合理确定
- 附图标记使用一致

注意事项

- 描述工作原理
- 列出发明点（关键点）
- 结合附图介绍技术方案的构成、工作或动作过程
- 提供一个以上具体实例

技术交底书的撰写思路

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

技术效果

概述

- 技术效果是指由构成发明的技术特征总和（技术方案）带来的
- 技术效果是技术方案直接带来的，或者是由所述的技术特征必然产生的技术效果

注意事项

- 逐条列出技术效果
- 多描述技术效果
- 描述客观

说明书附图

概述

- 附图的作用在于用图形补充说明书文字部分的描述
- 附图可以使人直观地、形象化地理解发明的每个技术特征和整体技术方案

注意事项

- 提供流程图、产品构成框图、产品结构示意图
- 对主要部件，标注出序号

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

技术交底书的撰写思路总结

别人是怎么做的？（背景技术）

↓

你为什么还要做？（存在的技术问题）

↓

你是怎么做的？（详细的技术方案）

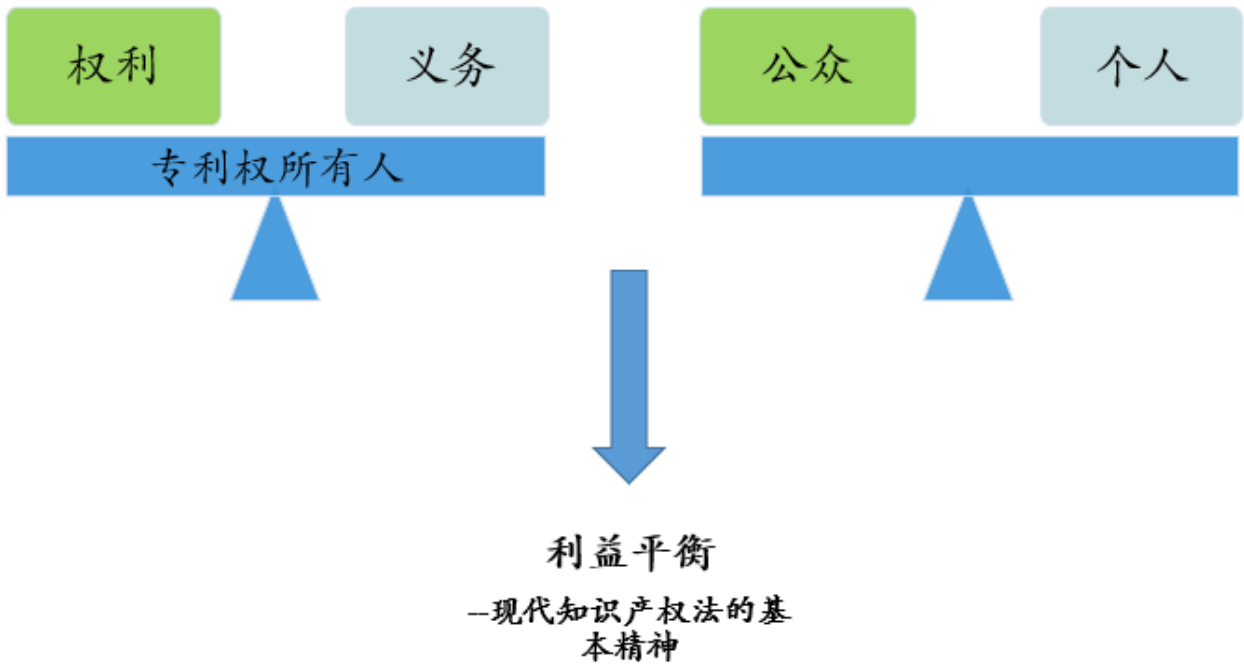
↓

你做的有什么好处/优点？（技术效果）

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

按照技术交底书撰写的常见形式问题来看：

1、现有技术的描述不客观或者不准确
2、未写明要解决的技术问题
3、写入过多的要解决的技术问题
4、未充分公开
缺少解决技术问题的手段
缺少理解或再现发明所需的技术内容
无产生有益效果的推导或证据
5、实施例仅有一个或者过少



疾病的诊断和治疗方法

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

1.一种对于已经明确的癌症患者，判断其愈后的方法，其特征在于，包括以下几个步骤：
(1) 检测标本中单个细胞的细胞周期蛋白 E 型蛋白；
(2) 检测标本中单个细胞的后 G1 期物质；
(3) 确定胞核中含有细胞周期蛋白 E型蛋白的细胞；
(4) 根据后 G1 期物质的含量来确定处于S期和 G2 期的细胞；
当胞核中含有过量的细胞周期蛋白 E 型蛋白的细胞数目增加，而同时同一细胞处于S期或 G2 期，则表明标本中存在有细胞周期调节紊乱的细胞。

第五条　对违反法律、社会公德或者**妨害公共利益**的发明创造，不授予专利权。

第二十五条　对下列各项，不授予专利权：
（一）科学发现；
（二）智力活动的规则和方法；
（三）疾病的诊断和治疗方法；
（四）动物和植物品种；
（五）原子核变换方法以及用原子核变换方法获得的物质；
（六）对平面印刷品的图案、色彩或者二者的结合作出的主要起标识作用的设计。
对前款第（四）项所列产品的生产方法，可以依照本法规定授予专利权。

疾病的诊断和治疗方法

1.一种监测患者的卒中治疗过程的方法，其特征在于使用未结合游离脂肪酸的体液水平进行监测，包括下列步骤:
(1) 在整个卒中治疗过程中的不同时间，测量来自所述患者体液样品中未结合游离脂肪酸的水平;
(2) 将所得到的未结合游离脂肪酸水平与未结合游离脂肪酸水平阈值相比较，其中所述阈值水平由无卒中存在的正常群体体液中的未结合游离脂肪酸浓度来确定;
(3) 在卒中治疗过程中的特定时间，确定来自患者体液样品中的未结合游离脂肪酸水平是否趋向于指示卒中治疗成功的来自正常群体的未结合游离脂肪酸的阈值水平。

一种人体心肌灌注显像的方法，包括同时或者先后将放射性核素和所述化合物 A给予人体，其中，在给予所述放射性核素和所述化合物 A 以后对心肌血力量不足的区域进行检查。

分析:上述主题由于本质是通过心肌灌注显像，从而得以对心肌血力量不足的区域检查，因而属于疾病的诊断方法。如果是下述主题:“一种加强核磁共振检测显像的方法，包括将处理器采集的图像数据经两级预处理程序后合并，从而使图像质量得以加强。”由于其本质是提高图像质量，因而不属于疾病的诊断方法。

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

1994.05.13 辉瑞公司开始申请“万艾可”在华专利权，申请号为CN94192386.X

2001.09.19 国家知识产权局授予辉瑞“万艾可”专利权；同日，中国自然人潘华平即提出伟哥专利无效请求

2001.10.29 国内12家药企联名向国家知识产权局专利复审委员会提出申请，请求宣告“万艾可”专利无效

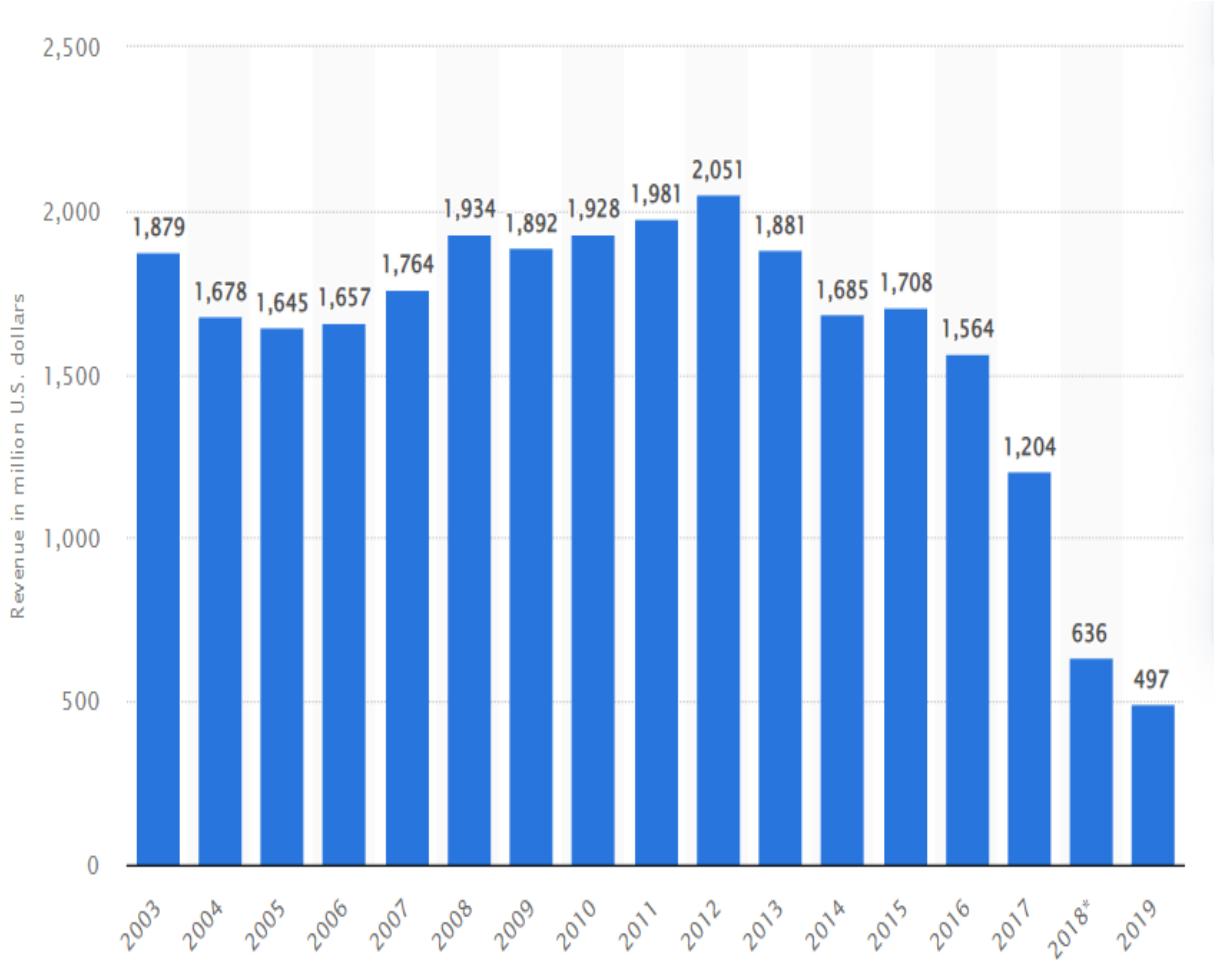
2004.07.05 专利复审委以“专利说明书公开不充分”为由，宣告辉瑞万艾可专利无效

2004.09.28 辉瑞公司将国家知识产权局专利复审委告上法庭，北京市第一中级人民法院正式受理这桩行政诉讼

2006.06.02 一审法院裁定原告辉瑞胜诉

2004.06 北京一中院宣判后，作为第三人的国内12家企业不服，上诉至北京市高院

2007.09.07 北京市高级法院终审做出撤销专利复审委员会的辉瑞万艾可专利无效的判决



辉瑞伟哥从2003-2019年的全球销售额（数据来源于Statista）

未充分公开案例—“伟哥”专利案

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

Pfizer Lobbies China to Keep Viagra Patent

By Phelim KyneDow Jones Newswires

Sept. 20, 2004 12:01 am ET

BEIJING -- U.S. Pharmaceutical giant Pfizer Inc. PFE -1.07% ▼ is lobbying China's State Intellectual Property Office to restore the company's domestic-use patent for the erectile-dysfunction drug Viagra, a Pfizer executive said.

Pfizer is "hopeful and cautiously optimistic" that the agency will reconsider its July decision to overturn the Viagra patent before an Oct. 5 deadline for filing a formal court appeal, the company's senior vice president for corporate affairs, Robert Mallet, said late Thursday.

China's handling of Pfizer's efforts to reclaim its patent will be scrutinized by foreign investors and legal experts, who view the case as a litmus test of China's commitment to international standards of intellectual-property rights protection.

由于牵涉巨大的经济利益，必然决定了辉瑞上述“伟哥”专利无效纠纷的曲折，这也让“伟哥”专利无效案吸引了众多人的眼光。《华尔街日报》便报道，“许多在华的外国投资者将这起事件看作是中国维护知识产权国际标准的承诺的试金石。最终的结果让国内企业提前生产伟哥的想法最终破灭，行政诉讼中，一审和二审法院都作出了撤销专利局复审委的辉瑞万艾可专利无效的判决。至此，长达6年的专利无效案最终得以落幕。

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

方法

由IIAM(Pennsylvania)得到新鲜的冷冻人类阴茎。将组织在室 温下解冻，从阴茎上分割下阴茎海绵体，得到约2-4g组织，按下 述进行分离步骤。将组织在含250mM蔗糖，1mM EDTA、0.5mM PMSF (苯甲基磺酰氟化物)和20mM HEPES(N-羟乙基哌嗪-N′-2 一乙烷磺酸酯)的冰冷的等渗缓冲液(pH 7.2,35ml)中粗略地切碎， 混合物用一台Silversen混合器/乳化剂进行短暂的(1分钟)处理。用带有聚四氟乙烯捣锤的均化器管制备均化物，在4°C和100,000xg 下离心60分钟以得到可溶的级分。将10ml高速离心后的清液加在 Pharmacia Mono Q阴离子交换柱(床体积1ml)上，该柱子用含1mM EDTA、0.5mM PMSF和20mM HEPES、pH为7.2的缓冲液(色谱缓冲液) 平衡。然后用5倍床体积的色谱缓冲液洗柱子，接着用连续梯度的0-500mM NaCl(总体积35ml)洗脱PDEs，收集1ml各级分。

结果

本发明化合物已在体外作为试验并发现它们是对cGMP有专一性的 PDEv的很强的选择性抑制剂。例如，**本发明的一种特别优选的化合物对PDEv酶的IC50=6.8nMV，但对于PDEII和PDEIII酶只显示很弱的抑制活性，IC50分别为≥100μm和34μm**。于是，阴茎海绵体组织的舒张和随之发生的阴茎勃起会由于该组织内的cGMP含量的 增高而得到调节，而这又是本发明化合物对于几种PDE的抑制特点造成的。

另外，在鼠和狗内试验的本发明化合物，在最高达3 mg/kg的静脉内(i.v.)和口服(p.o.)这两种情形，均未显示出任何不利的急 性毒性的明显迹象。在小鼠的情形，在高达100mg/kg的剂量(i.v.) 下未发生死亡。某些特另优选的化合物在以最高达10mg/kg的剂量 对鼠和以高达20mg/kg的剂量对狗长期口服时，无毒性作用。

对于人，按一次剂量和多次剂量对志愿者口服试验了某些特别优选的化合物。另外，至今为止对患者进行的研究已证实，一种特别优选的化合物诱发了阳萎男性的阴茎勃起。

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

关于特别优选的化合物的理解

根据本专利说明书的记载可以看出，本专利所述式（I）化合物依其优选程度分为：

(1)“式（I）化合物或其药学上可接受的盐或含有它们中存在的药物组合物……”，下称第一级化合物；

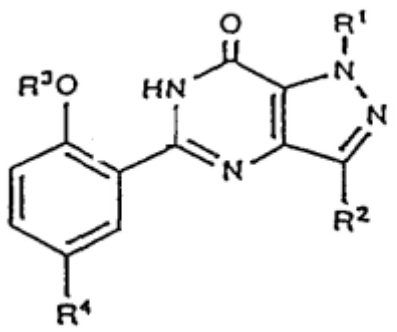
(2)“优选的一组式（I）化合物”，下称第二级化合物；

(3)“一组更优选的式（I）化合物”，下称第三级化合物；

(4)“特别优选的式（I）化合物”，下称第四级化合物；

(5)“特别优选的个别的本发明化合物”，共包括9种化合物，下称第五级化合物。

本发明涉及用式(I)化合物或其药学上可接受的盐或含有它们中存在的药物组合物制造用于治疗或预防雄性动物。



(I)

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

复审委观点

对已知医药产品的用途发明而言，如果所属领域技术人员根据说明书记载的技术内容并结合现有技术知识，依然需要花费创造性劳动方可确信所述已知化合物具有所述医药用途，则不能认为该说明书对于权利要求中要求保护的技术方案的公开是充分的。**在说明书中没有记载，仅由申请人或者专利权人掌握的、不属于现有技术的技术资料，不能用于证明要求保护的技术方案已充分公开**。

(1)由于本专利说明书所记载的试验数据有限，而且说明书对于这些有限的数据也没有作出足以认定其具体归属的说明。在此情况下，即使将本专利说明书与本专利所属技术领域的现有技术所公开的内容结合考虑，也不能使所属技术领域的技术人员确信本发明的cGMP PDEv抑制剂具有本专利说明书所述的“诱发阳痿男性的阴茎勃起”的效果。

(2)由于本专利说明书在给出了所述第四级化合物之一对cGMP PDEv的体外选择抑制活性数据后，没有给出关于该化合物对于阳痿的治疗或预防的进一步的效果，因此，即使结合考虑现有技术的教导，所属领域技术人员也同样不能确信该cGMP PDEv的选择性抑制剂具有“诱发阳痿男性的阴茎勃起”的效果。

(3)以马库什通式形式表述的第一级化合物的数目巨大，即使是第四级化合物的数目亦超过了100种。

在此情况下，对于所属领域技术人员而言，根据本专利说明书的教导，从这逾百种化合物中筛选和确认本专利化合物确实具有“诱发阳痿男性的阴茎勃起”的效果，不能被认为是无需付出创造性劳动。

未充分公开案例—CN200410001150.0

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

授权权利要求1：

用于治疗骨质增生疾病的药物的制造方法，其特征在于将以下3位天然产物云母石、黄连、枯矾，采用水煎煮方法提取有效成份，并使用气相指痕光谱定量，其重量百分比为由云母石97.1％、黄连0.97％、枯矾1.93％。将云母石每100kg加水1000kg、800kg在100℃条件下，提取3小时、2小时，合并提取液，滤过，得滤液(1)；将黄连每1kg加水20kg、20kg在100℃条件下提取45分钟、45分钟，合并提取液，滤过，得滤液(2)；合并滤液(1)、(2)，减压浓缩至100升体积，加入枯矾2kg溶解后，再加入碳酸钠4kg调节药液PH在9.5-11范围内，静置24小时，取上清液，滤过。用薄层扫描仪测定指痕图谱成分含量后，将滤液灌装于铝罐中，然后充入抛射剂氟里昂F12，密封。

复审委观点

（1）关于“气相指痕光谱定量”，该术语不是本领域的常规技术术语，在该专利说明书中未提及和解释该术语。

（2）说明书中未对权利要求1中“使用气相指痕光谱定量，使其重量百分比为由云母石97.1％、黄连0.97％、枯矾1.93％”的步骤给予清楚、完整的说明，致使本领域技术人员无法实施该步骤，从而无法实现权1的技术方案。

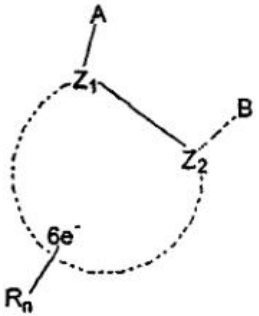
给申请人撰写申请文件的启示

该案给专利申请人的启示在于，在撰写交底书时，如果权利要求中使用的术语为本领域通用术语时，可以不在说明书中对该术语进行解释；但如果该术语为申请人自造的词汇，则必须将对该术语的解释写入说明书中，以利于本领域技术人员理解该发明并能实现本发明。

权利要求以说明书为依据—CN01822705.8

CN01822705.8—公开文本

2. 权利要求 1 的方法，其中所述杀真菌剂包括具有下式结构的化合物或其农艺学盐：



其中 Z_1 和 Z_2 为 C 或 N 并且为选自以下的芳族环的组成部分：苯、吡啶、噻吩、呋喃、吡咯、吡唑、噻唑和异噻唑；

A 选自-C(X)-胺、-C(O)-SR_3、-NH-C(X)R_4 和-C(=NR_3)-XR_7；

B 为-W_m-Q$(R_2)_3$ 或者选自邻甲苯基、1-萘基、2-萘基和 9-菲基，各个基团任选被卤素或 R_4 取代；

CN01822705.8—授权文本

1.一种提高豆类植物活力和/或产量的方法，该方法包括用0.1g/100kg种子至500g/100kg种子的杀真菌剂4，5-二甲基-N-2-丙烯基-2-(三甲基甲硅烷基)-3-噻吩甲酰胺或其农艺学盐处理所述植物的种子和任选处理所述植物的叶；

其中所述种子用1g/kg种子至50g/kg种子的包括根瘤属菌(Rhizobium spp.)、慢生根瘤属菌(Bradyrhizobium spp.)或根瘤属菌和慢生根瘤属菌的混合物的种菌处理。

权利要求以说明书为依据—CN01822705.8

HimmPat | 黑马学到 让一部分人先从科技情报中看到未来

实施例 1

本实施例说明仅用 Silthiofam 以及用 Silthiofam 和慢生根瘤菌(*Bradyrhizobium spp.*)种菌处理大豆种子的方法。

将大豆种子(CSR2121 品种，Monsanto Company, St. Louis, MO)放置在旋转静态种子处理机中(Hege Equipment, Inc., Colwich, KS)。将铺展剂/粘着剂化合物(Mollyflo®，Soygro (Pty) Ltd., Mooibank, Botchefstroom, South Africa)以 4 ml/kg 种子速度加入到搅拌下的种子中，使其分布在种子上。以 2ml/kg 种子速度将包含 4,5-二甲基-N-2-丙烯基-2-三甲硅烷基)-3-噻吩甲酰胺(silthiopham)活性成分加入包被种子中。所述制剂按照以上所示组合物 I 配方制备，包含约 125 g/L silthiopham。加入铺展剂/粘着剂后，搅拌种子下将活性制剂加入包

复审委观点

根据说明书的描述，权利要求1的通式化合物的共有特性是对危害谷类植物的小麦禾顶囊壳菌具有抑制作用，对危害豆类植物的病原菌没有活性，同时，根据实施例的内容，使用通式化合物中最优选的化合物硅噻菌胺之所以能够提高豆类植物的活力和/或产量，并不是基于其对病菌的控制，而是“意想不到”的其他原因。可见本申请要达到提高豆类植物活力和/或产量的效果，利用的并不是所述通式化合物的共性。因此，在说明书中仅提供一个具体化合物，即硅噻菌胺与种菌联合使用对大豆菌株的活力和产量有改善作用的情形下，本领域技术人员难以预测权利要求1中概括的其它化合物同样可以解决本申请的技术问题，并且达到上述技术效果。因此，最终申请人将权利要求1中的化合物限定为硅噻菌胺。

HimmPat | 黑马学到
让一部分人先从科技情报中看到未来

谢　谢！

倪健
18710376582