

附件一：爭點（卷二第 10 至 11 頁）

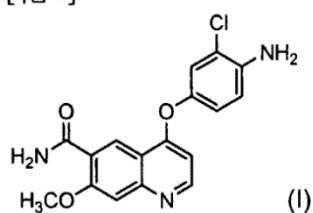
編號	爭點內容
一、	系爭專利請求項 1 至 3 對應之說明書內容是否違反核准審定時專利法第 26 條第 1 項規定？
二、	系爭專利請求項 1 至 3 是否違反核准審定時專利法第 26 條第 2 項規定？
三、	證據 4 是否足以證明系爭專利請求項 1 不具新穎性？
四、	證據 4 是否足以證明系爭專利請求項 1 不具進步性？
五、	證據 4、10 之組合是否足以證明系爭專利請求項 1 不具進步性？
六、	證據 11 是否足以證明系爭專利請求項 1 不具進步性？
七、	證據 13、14 或 15 是否足以證明系爭專利請求項 1 不具進步性？
八、	證據 4 是否足以證明系爭專利請求項 2 不具新穎性？
九、	證據 4 是否足以證明系爭專利請求項 2 不具進步性？
十、	證據 4、10 或證據 4、18 之組合是否足以證明系爭專利請求項 2 不具進步性？
十一、	證據 11 是否足以證明系爭專利請求項 2 不具進步性？
十二、	證據 4 是否足以證明系爭專利請求項 3 不具新穎性？
十三、	證據 4 是否足以證明系爭專利請求項 3 不具進步性？
十四、	證據 4、10 或證據 4、18 之組合是否足以證明系爭專利請求項 3 不具進步性？
十五、	證據 11、13、14 或 15 是否足以證明系爭專利請求項 3 不具進步性？
十六、	證據 10、13、19 之組合是否足以證明系爭專利請求項 4 不具進步性？
十七、	證據 10、13、19 之組合是否足以證明系爭專利請求項 5 不具進步性？
十八、	證據 10、13、19 之組合是否足以證明系爭專利請求項 6 至 9 不具進步性？

附件二：系爭專利技術分析

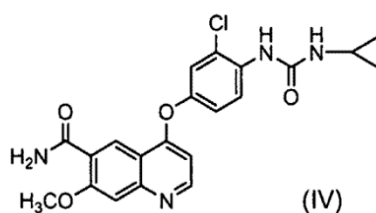
（一）系爭專利技術內容

提供了由化學式(IV)所表示之化合物或其鹽，其中由化學式(I)所表示之化合物的含量按質量計為 350ppm 或更少(系爭專利摘要，卷二第 69 頁)。

[化1]



(I)



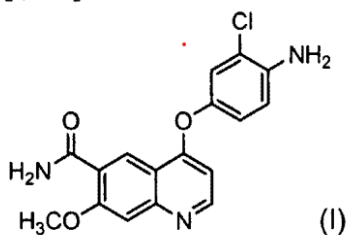
(IV)

(二)系爭專利申請專利範圍

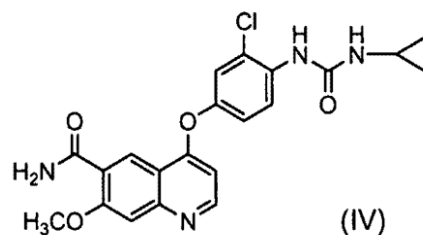
系爭專利核准公告之申請專利範圍共計 9 項，其中請求項 1 至 5 為獨立項，其餘均為附屬項。內容如下：

1. 請求項 1：一種組合物，其中由化學式(IV)所表示之化合物之甲磺酸鹽的含量按質量計為 98.0%或更多，並且由化學式(I)所表示之化合物的含量按質量計為 183 ppm 或更少。

[化1]

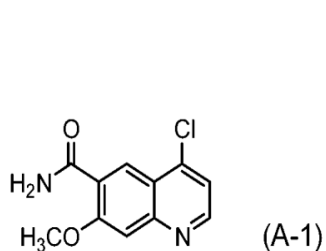


(I)

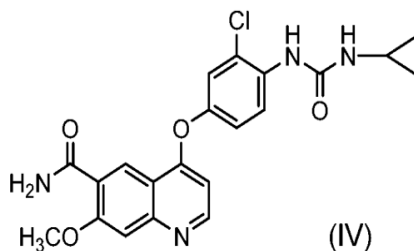


(IV)

2. 請求項 2：一種組合物，其中由化學式(IV)所表示之化合物之甲磺酸鹽的含量按質量計為 98.0%或更多，並且由化學式(A-1)所表示之化合物的含量按質量計為 60 ppm 或更少。

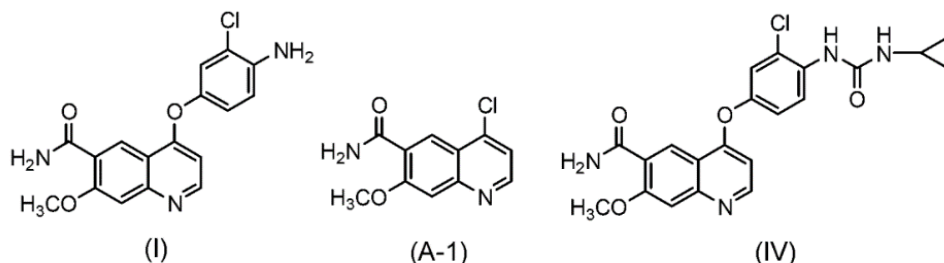


(A-1)

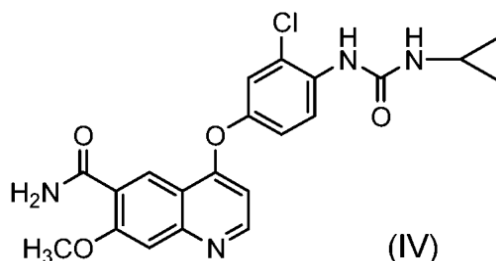


(IV)

3. 請求項 3：一種組合物，其中由化學式(IV)所表示之化合物之甲磺酸鹽的含量按質量計為 98.0%或更多，由化學式(I)所表示之化合物的含量按質量計為 183 ppm 或更少，並且由化學式(A-1)所表示之化合物的含量按質量計為 60 ppm 或更少。

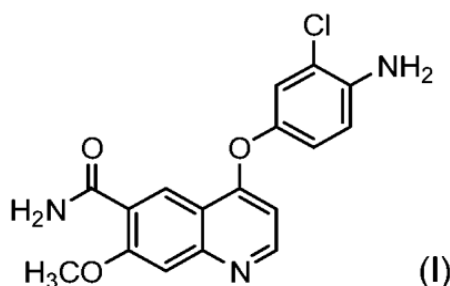


4. 請求項 4：一種用於生產由化學式(IV)所表示之化合物

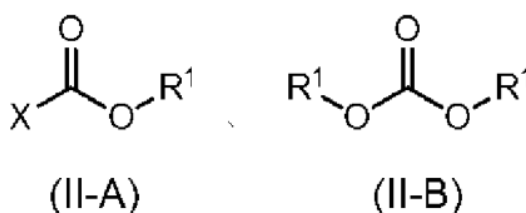


或其鹽之方法，該方法包括：

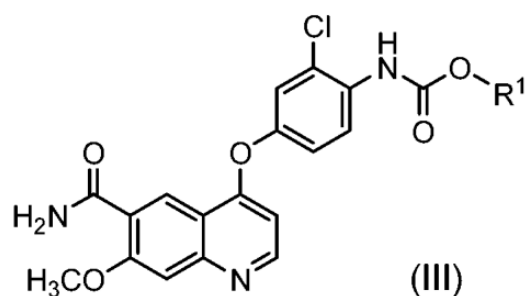
步驟 B，允許由化學式(I)所表示之化合物



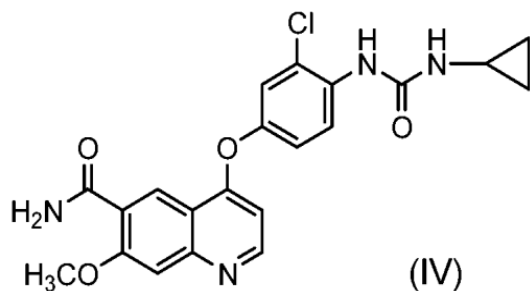
或其鹽與由化學式(II-A)或化學式(II-B)所表示之化合物在鹼與水存在下進行反應



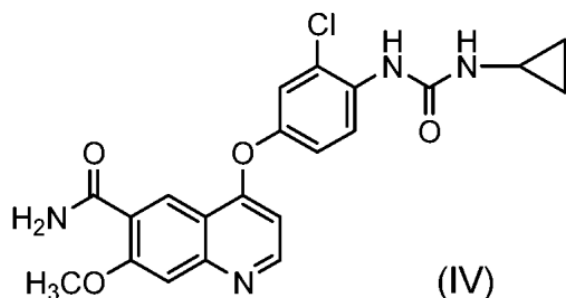
其中 R^1 係 C_{1-6} 烷基基團、 C_{2-6} 烯基基團、 C_{6-10} 芳基基團、或 C_{7-11} 芳烷基基團，其中該 C_{1-6} 烷基基團或該 C_{2-6} 烯基基團可以含有一至三個可以是相同的或不同的並選自下組之取代基，該組由鹵素原子和甲氧基基團組成，並且其中該 C_{6-10} 芳基基團或該 C_{7-11} 芳烷基基團可以含有一至三個可以是相同的或不同的並選自下組之取代基，該組由以下各項組成：鹵素原子、甲基基團、甲氧基基團、和硝基基團；並且 X 係鹵素原子，從而獲得由化學式(III)所表示之化合物



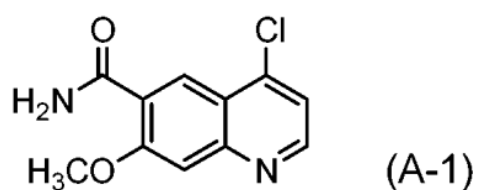
其中 R^1 係與如上所述的相同的基團，以及步驟 C，在允許步驟 B 中所獲得的由化學式(III)所表示之化合物無需分離地與環丙胺進行反應之後，藉由向反應溶液中引入一含水的有機溶劑沈澱並分離由化學式(IV)所表示之化合物或其鹽。



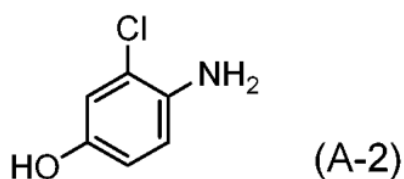
5. 請求項 5：一種用於生產由化學式(IV)所表示之化合物



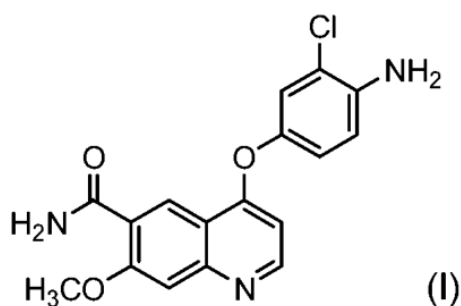
或其鹽的方法，該方法包括：步驟 A，在鹼的存在下允許由化學式(A-1)所表示之化合物



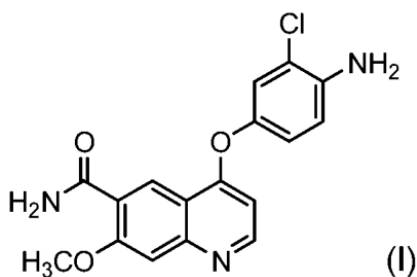
與由化學式(A-2)所表示之化合物



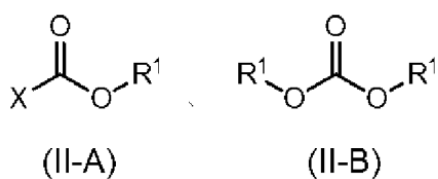
或其鹽進行反應後，藉由向該反應溶液中引入一含水的有機溶劑從該反應溶液中沈澱並分離由化學式(I)所表示之化合物



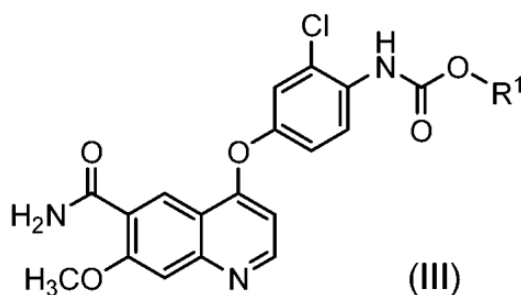
或其鹽，步驟 B，在鹼與水的存在下允許在步驟 A 中獲得的由化學式(I)所表示之化合物



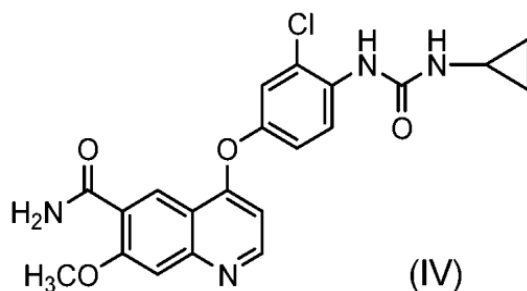
或其鹽與由化學式(II-A)或化學式(II-B)所表示之化合物進行反應



其中 R^1 係 C_{1-6} 烷基基團、 C_{2-6} 烯基基團、 C_{6-10} 芳基基團、或 C_{7-11} 芳烷基基團，其中該 C_{1-6} 烷基基團或該 C_{2-6} 烯基基團可以含有一至三個可以是相同的或不同的並選自下組之取代基，該組由鹵素原子和甲氧基基團組成，並且其中該 C_{6-10} 芳基基團或該 C_{7-11} 芳烷基基團可以含有一至三個可以是相同的或不同的並選自下組之取代基，該組由以下各項組成：鹵素原子、甲基基團、甲氧基基團、和硝基基團；並且 X 係鹵素原子，從而獲得由化學式(III)所表示之化合物

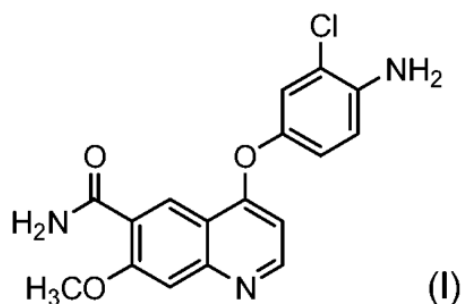


其中 R^1 係與如上所述的相同的基團，以及步驟 C，在允許步驟 B 中所獲得的由化學式(III)所表示之化合物無需分離地與環丙胺進行反應之後，藉由向反應溶液中引入一含水的有機溶劑沈澱並分離由化學式(IV)所表示之化合物或其鹽。

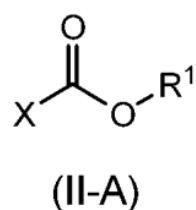


6. 請求項 6：如請求項 4 或 5 之方法，進一步包括步驟 D，從而將在步驟 C 中所獲得的由化學式(IV)所表示之化合物轉化為由化學式(IV)所表示之化合物的鹽。
7. 請求項 7：如請求項 6 之方法，其中在步驟 D 中所獲得的鹽係甲磺酸鹽。

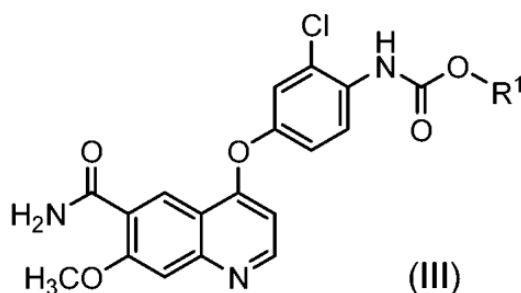
8. 請求項 8：如請求項 4 或 5 之方法，其中步驟 B 係這樣一個步驟：允許由化學式(I)所表示之化合物



或其鹽與由化學式(II-A)所表示之化合物在鹼與水的存在下進行反應



其中 R¹ 係 C₆₋₁₀ 芳基基團，該 C₆₋₁₀ 芳基基團可以含有一至三個可以相同或不同的並選自下組之取代基，該組由以下各項組成：鹵素原子、甲基基團、甲氧基基團、和硝基基團；並且 X 係鹵素原子，從而獲得由化學式(III)所表示之化合物



其中 R¹ 係與如上所述的相同的基團。

9. 請求項 9：如請求項 4 或 5 之方法，其中由化學式(II-A)所表示之化合物係氯甲酸苯酯。