

附件 4

第二届全国知识产权公共服务机构专利检索分析大赛

初赛赛题（化工医药组）

一、技术交底书

“解除全体人民的疾病医疗后顾之忧”是医药行业的一项重大使命。随着人们对健康水平的要求不断提高，对药物的有效性、可及性等的要求也越来越高。在原研药或现有药物的基础上，如何更有效地发挥药物价值，成为行业内一个重要的研究方向。某企业专注于药物新型递送系统和新型制剂的研究，现针对该领域现有技术的状况和问题提出改进。

技术背景

过敏性鼻炎（又称变应性鼻炎，Allergic Rhinitis）、过敏性结膜炎（Anaphylactic Conjunctivitis）均是受外界刺激，应激敏感的疾病；干眼症（Xerophthalmia）又称角结膜干燥症，常见症状包括眼睛干涩、有异物感，同样为对外界刺激敏感的病症。目前针对过敏性鼻炎、过敏性结膜炎多采用抗生素、激素及手术治疗；对于干眼症多采用人工泪液、免疫抑制剂或局部施用激素。上述手段缺陷在于，难以在短时间内缓解患者的症状，或疗效欠佳，或操作复杂，且不易精准给药。若剂量不足，则无法起效，而超剂量给予抗生素、激素等药物则会造成药物的滥用和浪费，且伴随着较强的毒副作用。因而，亟需快速起效且副作用较小的定量给药制剂。

改进设计

某企业发明了一种喷雾制剂、滴剂及相应的给药器具，它可快速有效缓解患者的鼻塞、鼻干、眼干、眼痛等不适症状，且毒副作用较小。作为喷雾制剂使用时，该制剂可采用喷雾器精确定量施药，喷出的雾滴较细，在鼻腔内分布均匀、不易流失、粘附速度快、药剂迅速起效。当作为滴剂施用于眼睛时，该制剂可延长泪膜破

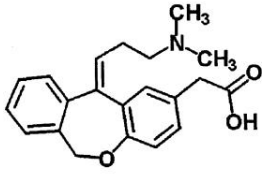
裂时间，保持泪膜稳定，减少泪液蒸发，精确定量施药，从而保持眼表泪液含量，减缓眼干的痛感。

所述制剂主要包含药物成分、溶剂和表面活性剂，其中药物成分包括治疗鼻炎、鼻窦炎、干眼症、过敏性结膜炎药物中的一种或多种，所述制剂的溶剂可以为水、医用硅油、食用植物油等。

所述喷雾制剂或滴眼剂为稳定的乳浊液形式。优选磷脂作为表面活性剂，表面活性剂以 0.1-25.0wt% 存在于乳浊液内。被表面活性剂携裹的药物形成液滴均匀分散于溶剂中，从而使制剂组合物的表面张力小于 40mN/m（优选小于 30mN/m，更优选小于 27mN/m）。当施用于鼻腔时，所述表面活性剂可以通过喷雾器或滴鼻液形式有效达到鼻腔，降低鼻腔和黏液的表面张力，快速补充缺失的液体，既可湿润鼻腔，又可修复破损黏膜；当施用于眼睛时，表面活性剂可降低表面张力，增加泪液脂质层的厚度，从而保持眼表泪液含量。并且，若采用卵磷脂作为天然表面活性剂，还可补充泪液脂质层中卵磷脂的缺失。

实验表明，制剂表面张力越小越不稳定，容易聚集甚至分层和沉降。为保证制剂稳定性，需控制所述液滴的体积平均粒径为 100 μm 以下（介于 50-500nm 之间更佳，100-500nm、甚至 200-400nm 尤佳），此时液滴在溶剂内稳定分布，避免了固态粉末状表面活性剂易出现的沉降现象。当粒径满足上述条件时，液滴可更稳定地在溶剂中分散。乳剂中分散相液滴集中在一起成疏松团块的现象称絮凝。分散相液滴电荷减少， ζ 电位降低，液滴产生聚集而絮凝；絮凝的出现表明乳剂稳定性降低，通常是乳剂破坏的前奏。因此，制剂体系的分散稳定性可通过 ζ 电位来表示。多次实验结果显示，当乳浊液制剂的粒径控制在 100 μm 以下、 ζ 电位的绝对值控制在 15mV 以上，且表面张力小于 40mN/m 时，可以保持较长时间的稳定状态，不易出现凝结、凝聚现象。

当针对鼻炎、鼻窦炎患者时，其中的药物成分可以是可的松、氢化可的松、醋酸可的松、曲安奈德、甘油、透明质酸等，药物还可优选现有专利文献中报道的 (Z)-11-(3-二甲基氨基亚丙基)-6,11-二氢二苯并[b,e]氧杂萘



；当针对过敏性结膜炎、干眼症患者时，其中的药物成分可以是可的松、氢化可的松、醋酸可的松，甘油、透明质酸中的一种或多种；药物成分以 0.001-4.0wt%存在于制剂中。

所述制剂组合物中除包含 70.0-99.899%含量的溶剂外，还可以含有常规抑菌剂、常规芳香剂、常规稳定剂、常规抗氧化剂等。抑菌剂的含量推荐为 0.01-2.0wt%，芳香剂的含量推荐为 0.01-5.0wt%，稳定剂的含量推荐为 0.01-5.0wt%，抗氧化剂的含量推荐为 0.001-5.0wt%。

可通过超声的方式将表面活性剂、药物及其抑菌剂等成分在溶剂中分散，然后加大转速至 3000rpm 以上搅拌，将液态的组合物形成分散的包含表面活性剂和药物的乳浊液状的制剂组合物，使所述制剂组合物表面张力小于 40mN/m、 ζ 电位的绝对值为 15mV 以上。还可以采用高压匀浆方式，在溶剂中形成体积平均粒径为 50-500nm 的液滴，将抑菌剂、芳香剂、稳定剂、抗氧化剂中的一种或多种分散于溶剂中。

为了减小对使用者的刺激，同时提高该制剂组合物的稳定性，优选上述制剂组合物的 pH 值为 5.0-7.4，更优选为 6.0-7.4。

企业还设计了一种用于喷施前述制剂组合物的给药器具（参见图 1）。所述器具包含贮药容器和容器上方用于分配药物的分配头和容器盖。为了确保给药剂量，分配头可包括定量泵、滴管、计量阀门和喷雾出口/滴液出口。容器主体的贮药部分由柔性材料制成。当对容器主体施加压力时，药液从滴管口下方进入滴管内，并随压力被传送到上方的分配头部分，进而被传送至分配头内的定量泵。在定量泵的作用下，药液通过滴管上部压送到计量阀门中，进而定量地进入喷雾出口/滴液出口，喷出一个喷雾单位的药量或形成一个液滴单位被挤出，从而施于患者。

为了使药液充分利用，容器底部可设置成朝下延伸的圆锥形，滴管设置成纵贯容器上方和容器底座的轴向长滴管。当药液量较少时，仍能保证药液从容器底部进入滴管内，避免浪费。容器圆锥形底部配套有底座，从而使容器容纳在底座中，保证容器的稳定。容器底部外表面优选设置多个与底座内表面配合的螺纹；容器圆锥

形底座中心优选为凸出的圆球状，便于剩余药液的收集，也可以在施用后配套嵌入底座上，方便使用和固定。



图 1

二、任务及要求

2020年3月1日，企业技术人员带着上述项目资料找到你机构，希望分析判断上述技术方案的可专利性，并围绕提升专利申请质量获取相关指导和建议。假如您是机构中负责服务该项目的公共服务人员，请根据以下要求为企业提供服务。

1 本次比赛只针对专利文献进行检索分析，可引用公知常识。检索系统为国家知识产权局专利检索及分析系统 <https://pss-system.cponline.cnipa.gov.cn/conventionalSearch>。系统账号由选手自行申请。

2 选手需提交以“省份+知识产权公共服务机构名称+考生姓名”命名的答案文件夹（以 ZIP 格式压缩）。文件夹需包括以下文档及现有技术文件。

（1） 文档。

参见后面的答卷模版。答卷模版中除省略号部分选手根据需要选择做答之外，其它部分均应按照要求进行做答。

（2） 现有技术文件。

考虑到任务完成时间，所使用的现有技术公开日应在 2020 年 4 月 1 日之前。选手应根据前面文档中答卷所设置题目的要求，选择不超过五篇现有技术文件。每份

文件以文件 N-公开号/公告号的格式命名，比如文件 1-CN11111111. A。如果文件超出 5 篇，评委仅针对前 5 篇进行评分。选手须以红色下划线标明所使用的文字部分，以红色标记标出附图中所引用的部分，并在空白处注明使用目的，例如：某特征被公开，给出了结合启示，给出了技术发展方向等。

(3) 检索过程导出文件。

需从国家知识产权局专利检索及分析系统直接导出。

附件：答卷模版

答卷

一. 请根据技术交底书，构建检索所要针对的技术方案，并给出每个技术方案的发明点（技术方案的撰写可参考权利要求书）。

二. 检索

1. 给出检索涉及的分类号。

2. 给出检索要素和关键词。（可采用如下表格）

	检索要素 1	检索要素 2	检索要素 3	……
	例如，动力源			
关键词	电机			
扩展 1	气缸			
……	motor			

3. 给出最终检到文件所涉及的检索构思、检索式,并简要说明。

例如：检索构思 1: A01B001/01 加 A（关键词） 加 B（关键词）命中 D1

具体检索式或检索过程：

检索构思 2: 申请人 X 命中 D2

具体检索式或检索过程：

三. 分析建议部分

1. 根据所检索的现有技术，对前面所构建技术方案的可专利性给出分析。现有技术只能使用专利文献和公知常识。如果存在多种方式评价技术方案的新颖性和创造性，请列出不超过三种方式，并针对最佳方式详细论述。如果选手详细论述了多种评述方式，评委只针对第一种方式进行打分。

2. 依据所检索的现有技术，就是否申请专利给出建议。如不申请，请给出理由。如申请，请重新构建技术方案，并就拟写入说明书的内容是否需要完善、如何完善给出建议。

3. 依据企业技术交底书和所检到的现有技术，请就企业的研发方向、研发管理等给出建议。

4. 如将该技术应用市场，请就该技术是否会侵犯他人专利权及应对给出建议。

5. 其它建议。