

**Interner Verteilerschlüssel:**

- (A) [ ] Veröffentlichung im ABl.  
(B) [ ] An Vorsitzende und Mitglieder  
(C) [X] An Vorsitzende  
(D) [ ] Keine Verteilung

**Datenblatt zur Entscheidung  
vom 27. Juni 2007**

**Beschwerde-Aktenzeichen:** T 0372/02 - 3.3.02

**Anmeldenummer:** 93914598.3

**Veröffentlichungsnummer:** 0650354

**IPC:** A61K 9/16

**Verfahrenssprache:** DE

**Bezeichnung der Erfindung:**

Feste und flüssige Lösungen von schwer wasserlöslichen  
Arzneistoffen

**Patentinhaberin:**

ALFATEC-PHARMA GmbH

**Einsprechende:**

BASF Aktiengesellschaft  
Abbott GmbH & Co. KG

**Stichwort:**

Schwer wasserlösliche Arzneistoffe/ALFATEC

**Relevante Rechtsnormen:**

EPÜ Art. 54, 105, 114 (2)

**Schlagwort:**

"Neuheit (nein): Beanspruchte Zusammensetzung in allen  
Merkmalen vorweggenommen"

**Zitierte Entscheidungen:**

-

**Orientierungssatz:**

-



Aktenzeichen: T 0372/02 - 3.3.02

**ENTSCHEIDUNG**  
der Technischen Beschwerdekammer 3.3.02  
vom 27. Juni 2007

**Beschwerdeführerin:**  
(Patentinhaberin)

ALFATEC-PHARMA GmbH  
Im Neuenheimer Feld 519  
D-69120 Heidelberg (DE)

**Vertreter:**

Goddar, Heinz J.  
FORRESTER & BOEHMERT  
Pettenkoflerstraße 20-22  
D-80336 München (DE)

**Beschwerdegegnerin:**  
(Einsprechende 01)

BASF Aktiengesellschaft  
Patente, Marken und Lizenzen  
D-67056 Ludwigshafen (DE)

**Vertreter:**

Riedl, Peter  
Patentanwälte  
Reitstötter, Kinzebach & Partner  
Postfach 86 06 49  
D-81633 München (DE)

**Beschwerdegegnerin:**  
(Einsprechende 02)

Abbott GmbH & Co. KG  
Patent & Trademark Department  
Knollstraße 50  
D-67061 Ludwigshafen (DE)

**Vertreter:**

Riedl, Peter  
Patentanwälte  
Reitstötter, Kinzebach & Partner  
Postfach 86 06 49  
D-81633 München (DE)

**Angefochtene Entscheidung:** Entscheidung der Einspruchsabteilung des Europäischen Patentamts, die am 28. Januar 2002 zur Post gegeben wurde und mit der das europäische Patent Nr. 0650354 aufgrund des Artikels 102 (1) EPÜ widerrufen worden ist.

**Zusammensetzung der Kammer:**

**Vorsitzender:** U. Oswald  
**Mitglieder:** H. Kellner  
J.-P. Seitz

## Sachverhalt und Anträge

- I. Auf die Patentanmeldung Nr. 93 914 598.3 wurde das europäische Patent Nr. 0 650 354 mit 29 Ansprüchen erteilt.
- II. Patentanspruch 1 des erteilten Patents hat folgenden Wortlaut:
- "Schwer wasserlösliche Wirkstoffe enthaltende Zubereitung, gekennzeichnet durch eine molekulardisperse bis kolloiddisperse Verteilung des schwer wasserlöslichen Wirkstoffes in einem unvernetzten hydrophilen Peptid mit einem Molekulargewicht über 100 D."
- III. Die Einsprechenden (Beschwerdegegnerinnen) haben mit der Begründung Einspruch eingelegt, der Gegenstand des Streitpatents sei nicht neu und er ergäbe sich in naheliegender Weise aus dem Stand der Technik (Artikel 100 a) EPÜ).
- IV. Die folgende Entgegenhaltung wurde unter anderen im Einspruchsverfahren und im anschließenden Beschwerdeverfahren genannt:
- (1) T. Imai et al., International Journal of Pharmaceutics 53, 1989, 7-12
- V. Die Einspruchsabteilung hat das Streitpatent mit der am 28. Januar 2002 zur Post gegebenen Entscheidung nach Artikel 102 (1), (3) EPÜ widerrufen.

Die Einspruchsabteilung führte unter anderem aus, der Gegenstand des erteilten Patents (Hauptantrag) und der Gegenstand gemäß Hilfsantrag 4 seien gegenüber Entgegenhaltung (1) nicht neu.

Die Gegenstände der jeweils ersten Ansprüche der Hilfsanträge 1 bis 3 erfüllten zwar die Erfordernisse nach Artikel 84 sowie Regel 57a EPÜ; die enthaltenen Änderungen seien jedoch im Hinblick auf Artikel 123(3) EPÜ nicht zulässig.

- VI. Die Beschwerdeführerin (Patentinhaberin) hat gegen die Entscheidung der Einspruchsabteilung Beschwerde erhoben und mit der Beschwerdebegründung vom 7. Juni 2002 eine Anspruchsfassung als Hauptantrag vorgelegt, bei der Patentanspruch 1 identisch zur erteilten Fassung war. Die Hilfsanträge 1 bis 3 aus dem Einspruchsverfahren sollten aufrechterhalten bleiben.

Mit Schreiben vom 11. Juni 2007 hat die Beschwerdeführerin mit der Bemerkung, die bisherigen Anträge würden nicht weiterverfolgt, neue Anspruchsfassungen entsprechend einem Hauptantrag und fünf Hilfsanträgen eingereicht.

Patentanspruch 1 des Hauptantrags hat wiederum den gleichen Wortlaut, wie der erteilte Patentanspruch 1, die restlichen Ansprüche des Hauptantrags sind identisch zum Hauptantrag gemäß Beschwerdebegründung.

- VII. Am 27. Juni 2007 hat eine mündliche Verhandlung stattgefunden.

Die zuletzt eingereichten Hilfsanträge 1 bis 5 wurden als verspätet nicht zum Verfahren zugelassen. Seit der Beschwerdeerwiderung der Beschwerdegegnerin (Einsprechende 01) vom 28. April 2005 waren keine sachlichen Eingaben seitens der Beschwerdegegnerinnen und keine sachlichen Bescheide seitens der Kammer zu verzeichnen gewesen.

VIII. Die Argumente der Beschwerdeführerin (Patentinhaberin) können wie folgt zusammengefasst werden:

Die späte Vorlage der neuen Anträge sei die Folge eines Vertreterwechsels kurz vor dem Termin der mündlichen Verhandlung. Im übrigen seien die Gegenstände dieser Anträge sachlich nicht komplex und als Reaktion auf die Argumente der Beschwerdegegnerinnen für die Parteien und die Kammer vorhersehbar gewesen.

Der Gegenstand des Hauptantrags sei im Lichte der Beschreibung eindeutig so zu verstehen, dass der Arzneistoff durch die Auswahl geeigneter hydrophiler Peptide immer in den Zustand versetzt werde, in dem er gleichzeitig teils molekulardispers und teils in kolloiddisperser Form vorliege. Das Wort "kann" in der entsprechenden Formulierung der Patentschrift sei nicht dahingehend zu verstehen, dass der Arzneistoff bei der Erfindung auch in anderer Form vorliegen könne. Das Vorliegen in der genannten Form sei im übrigen zwingend notwendig, um die erfindungsgemäßen Eigenschaften überhaupt zu erzielen.

Dementsprechend sei das Wort "kann" lediglich als Erläuterung des Umstands zu lesen, dass dem Arzneistoff durch die vorgenannte Auswahl die Möglichkeit gegeben

werde, beziehungsweise er in die Lage versetzt werde, gleichzeitig teils molekulardispers teils in kolloiddisperser Form vorzuliegen.

Tatsächlich werde dieses Merkmal durch den molekulardispers in einer Matrix vorliegenden Arzneistoff erreicht. Dabei ergäbe sich der kolloiddisperse Anteil aus der Tatsache, dass die molekulardispersen Arzneistoffpartikel von einer Sol-Schicht umgeben beziehungsweise als Konjugat geschützt seien.

Mit Hilfe der Lehre der Entgegenhaltung (1) sei dagegen eine solche Verteilung des Arzneistoffs überhaupt nicht erreichbar, weil die Tatsache der Salzbildung zwischen dem sauren Arzneistoff und dem Peptid, insbesondere durch das dort verwendete Herstellverfahren "Verkneten", jedenfalls zu Auskristallisierungen und nicht zu einer molekulardispersen Verteilung des Arzneistoffs führen würde. Auch sei in dieser Entgegenhaltung von einer Komplexierung des Arzneistoffs die Rede, was nach den Ausführungen im Streitpatent aber gerade zu vermeiden sei.

Die Beschwerdeführerin trägt weiterhin vor, die Einspruchsabteilung sei demgegenüber von einer unzutreffenden Bewertung des Merkmals der molekulardispersen bis kolloiddispersen Verteilung des schwer wasserlöslichen Wirkstoffes ausgegangen. Eine Deutung, dass der Arzneistoff auch jeweils molekulardispers oder kolloiddispers alleine vorliegen könne, wie sie wahrscheinlich aus der unzutreffenden englischsprachigen Übersetzung der Ansprüche entnommen worden sei, sei eben jedenfalls im Licht des

Beschreibungsteils des Patents nicht möglich. Die Aussagen in der Einspruchsentscheidung zur mangelnden Neuheit der beanspruchten Gegenstände seien daher nicht haltbar.

- IX. Die Beschwerdegegnerinnen (Einsprechenden) haben den Argumenten der Beschwerdeführerin widersprochen.

Die mit Schreiben vom 11. Juni 2007 von der Beschwerdeführerin sehr spät vorgelegten Hilfsanträge und insbesondere die gesamte mit diesem Schreiben verbundene Argumentation würden so stark vom bisherigen Vorbringen der Beschwerdeführerin abweichen, dass sie insgesamt nicht zum Verfahren zuzulassen seien. Der späte Vertreterwechsel dürfe sich nicht auf das Verfahren auswirken, da sich die Patentinhaberin solche Umstände jedenfalls selbst zuzuschreiben habe.

Im Übrigen ginge die Argumentation der Beschwerdeführerin im Wesentlichen an den zu beurteilenden Fakten vorbei, weil die vorgebrachten Argumente keinen Bezug zu den tatsächlich in der vorliegenden Anspruchsfassung enthaltenen Merkmalen hätten.

- X. Die Beschwerdeführerin (Patentinhaberin) beantragte die Aufhebung der angefochtenen Entscheidung und die Aufrechterhaltung des Patents auf Grundlage des mit Schreiben vom 11. Juni 2007 eingereichten Hauptantrags oder auf der Grundlage eines der mit dem gleichen Schreiben eingereichten Hilfsanträge 1 bis 5.

Die Beschwerdegegnerinnen (Einsprechenden) beantragten die Zurückweisung der Beschwerde der Patentinhaberin.



## **Entscheidungsgründe**

1. Die Beschwerde ist zulässig.
  
2. Die Beschwerdegegnerin (Einsprechende 02) ist durch ihre mit einem Beitritt zum Einspruchsverfahren vor der Abteilung nach Artikel 105 EPÜ erworbene Einsprechendenstellung auch Partei im Beschwerdeverfahren. Die Kammer hat sich davon überzeugt, dass die Bedingungen von Artikel 105 EPÜ erfüllt sind (siehe auch Punkt 1.1. der Entscheidung der Einspruchsabteilung).
  
3. Der mit dem Schreiben vom 11. Juni 2007 verbundene Hauptantrag und die Hilfsanträge 1 bis 5 sind über zwei Jahre nach der letzten sachlichen Eingabe der Beschwerdegegnerinnen und fast vier Monate nach Absendung der Ladung zur mündlichen Verhandlung (15. Februar 2007) eingereicht worden, das ist bereits insofern verspätet. Diese Anträge können allein auf Grund der zeitlichen Verhältnisse keine Antwort auf irgend ein in jüngerer Zeit neu vorgetragenes Argument oder einen neuen Sachverhalt sein. Sie bereinigen aber auch nicht offensichtlich die im Verfahren diskutierten Probleme, sondern werfen beginnend mit der Prüfung der ursprünglichen Offenbarung zahlreiche neue Fragen auf. Sie sind unter anderem deswegen nicht eindeutig und auf den ersten Blick gewährbar.

Der Hauptantrag aus dieser Serie von Anträgen ist aber wortgleich zum bereits mit der Beschwerdebegründung eingereichten Hauptantrag.

Die Kammer hat daher von ihrem Ermessen Gebrauch gemacht und die mit Schreiben vom 11. Juni 2007 eingereichten Hilfsanträge 1 bis 5 nicht zum Verfahren zugelassen. Gegenstand der Verhandlung ist daher der mit dem gleichen Schreiben eingereichte Hauptantrag.

4. Das erteilte Patent ist weder unter Artikel 100 b) noch unter Artikel 100 c) EPÜ angegriffen worden. Damit ist zunächst nur der Gegenstand von Anspruch 1 gemäß Hauptantrag auf Neuheit nach Artikel 54 EPÜ zu prüfen.
5. Dieser Anspruch 1 betrifft eine
  - schwer wasserlösliche Wirkstoffe enthaltende Zubereitung, bei der diese Wirkstoffe, zum Beispiel Diclofenac (siehe Seite 21, Zeile 9 der ursprünglichen Anmeldeunterlagen zum Streitpatent)
  - in einem unvernetzten, hydrophilen Peptid mit einem Molekulargewicht über 100 D, zum Beispiel einem Albumin (siehe Seite 5, Zeile 8 der ursprünglichen Anmeldeunterlagen zum Streitpatent)
  - eine molekulardispers bis kolloiddispers Verteilung aufweisen.

Das die Verteilung des Wirkstoffs kennzeichnende Merkmal ist bereits in sich klar, es beschreibt die Eigenschaften der Partikelverteilung in einem Übergang von molekulardispers bis kolloiddispers.

Das heißt, diese Partikel können zunächst eine nur molekulardispers Verteilung, dann auch gemischt eine sowohl molekulardispers als auch kolloiddispers und

schließlich auch eine alleine kolloiddisperse Verteilung aufweisen.

In Entgegenhaltung (1) ist aber eine Zusammensetzung offenbart, die

- Diclofenac (siehe Seite 7 von (1), rechte Spalte, vorletzte Zeile; zur Verdeutlichung des schwer wasserlöslichen Zustands ausdrücklich als Diclofenac Säure bezeichnet) in
- Eialbumin (siehe Seite 7, rechte Spalte, zweiter Absatz, Zeilen 1 bis 3) in
- molekulardisperser Verteilung enthält (siehe Seite 7, Zusammenfassung, Zeilen 4 bis 6 sowie Seite 11, rechte Spalte, Zeilen 13 bis 19 und Seite 12, linke Spalte, Zeilen 10 bis 13).

Der Nachweis dieser molekulardispersen Verteilung für Diclofenac wird durch experimentelle Daten mit Hilfe von Differentialthermoanalyse (DTA beziehungsweise im Englischen DSC) und Röntgenstreuungsexperimenten geführt (siehe Seite 11, rechte Spalte, Zeilen 3 bis 19 und Seite 11, rechte Spalte, Zeile 24 bis Seite 12, linke Spalte, Zeile 13).

In Entgegenhaltung (1) wird also eine Zusammensetzung beschrieben, die jedenfalls in der Ausprägung "schwer wasserlöslicher Wirkstoff in molekulardisperser Verteilung" alle Merkmale nach Patentanspruch 1 des Hauptantrags vorwegnimmt.

Dementsprechend ist sein Gegenstand nicht mehr neu.

6. Den demgegenüber vorgebrachten Argumenten der Beschwerdeführerin vermag die Kammer nicht zu folgen:

- 6.1 Der Einwand, in der Zusammensetzung Diclofenac Säure mit Eialbumin gemäß Entgegenhaltung (1) sei wegen des Verknetens der Bestandteile zwingend eine Salzbildung mit der Folge von Kristallisierungen zu erwarten, kann angesichts der fundierten Experimente mit gegenteiligem Ergebnis in (1) nicht greifen.
- 6.2 Auch das Argument, das Merkmal "molekulardisperse bis kolloiddisperse Verteilung des schwer wasserlöslichen Wirkstoffes" sei im Lichte der Beschreibung eindeutig so zu verstehen, dass der Arzneistoff (Wirkstoff) ausschließlich teils molekulardispers und teils in kolloiddisperser Form vorliege, kann nicht zum Ziel führen.

Wenn der Fachmann die Beschreibung heranzieht, so findet er, dass der Wirkstoff gerade nicht zwingend in teilweise molekulardisperser und teilweise kolloiddisperser Verteilung vorliegen muss, sondern eben in dieser kombinierten Verteilung vorliegen "kann" (siehe Spalte 3, Zeile 1 im Streitpatent und Seite 4, Zeile 15 der zugehörigen Anmeldung). Eine solche Formulierung lässt auch die anderen Alternativen zu, insbesondere die rein molekulardisperse Verteilung.

Im Absatz vor der Nennung dieses Wortes "kann" sind nämlich die streitpatentgemäßen Maßnahmen zur Herstellung der gewünschten Wirkstoffverteilung beschrieben:

Zur Einstellung des Ausmaßes in dem der molekulardisperse Teil des Wirkstoffs in ein disperses System übergeht soll die "Auswahl geeigneter hydrophiler

Peptide mit einem besonders hohen Anteil lipophiler Bereiche" dienen (siehe Spalte 2, Zeilen 51 bis 58 im Streitpatent und Seite 4, Zeilen 7 bis 13 der zugehörigen Anmeldung). Damit muss die rein molekulardisperse Verteilung sogar das vorrangige Ziel sein. Jedenfalls muss eine solche Bevorzugung der lipophilen Anteile eines Peptids in die Richtung weisen, schwer wasserlösliche Wirkstoffe vollständig in molekulardisperser Verteilung aufzunehmen und nicht dahin, zwingend einen gewissen Anteil dispers verteilten Wirkstoffs sicherzustellen.

Dass der Sachverhalt in dieser Form zutrifft, gibt die Beschwerdeführerin im Grunde auch selbst zu erkennen. Gerade in ihrer Argumentation zur Deutung des Wortes "kann" wird einerseits behauptet dass der Wirkstoff immer in den Zustand versetzt werde, in dem er gleichzeitig teils molekulardispers und teils in kolloiddisperser Form vorliege jedoch andererseits wird davon gesprochen, dass dem Arzneistoff die Möglichkeit gegeben werde, beziehungsweise er in die Lage versetzt werde, gleichzeitig teils molekulardispers teils in kolloiddisperser Form vorzuliegen (siehe auch Eingabe vom 11. Juni 2007, von Seite 2 auf Seite 3 übergreifender Absatz). Letzteres bedeutet aber nichts anderes, als dass in diesem Fall eben nur die Möglichkeit der gleichzeitig molekulardispersen und kolloiddispersen Verteilung gegeben ist, die tatsächliche Verteilung demgegenüber aber dahingestellt bleibt.

- 6.3 Damit sind auch alle weiteren Argumente der Beschwerdeführerin entkräftet, da sie allesamt auf der Behauptung beruhen, der vorliegende Anspruch 1 würde ein

zwingendes Nebeneinander des Wirkstoffs in teils molekulardisperser und teils kolloiddisperser Form vorsehen.

Die Frage, ob streitpatentgemäß nun konjugierte oder durch eine Sol-Schicht geschützte Arzneistoffe in kolloiddisperser Verteilung vorliegen, spielt angesichts der vorstehenden Ausführungen zum alleinigen Vorliegen einer molekulardispersen Verteilung keine Rolle mehr.

Auch die Überlegung, ob Entgegenhaltung (1) wegen angedeuteter Komplexierungen der Wirkstoffe durch das Albumin vom Streitpatentgegenstand abweichende Sachverhalte betreffen könnte, spielt sich nur in Relation zu den behaupteten kolloiddispersen Konjugaten ab und ist insofern für die Beurteilung der Neuheit des streitpatentgemäßen Gegenstands unerheblich.

7. Nachdem Patentanspruch 1 des einzig vorliegenden Antrags mangels Neuheit (Artikel 54 (1) EPÜ) nicht gewährbar ist, erübrigt sich auch das Eingehen auf die weiteren, abhängigen Ansprüche.

**Entscheidungsformel**

**Aus diesen Gründen wird entschieden:**

Die Beschwerde wird zurückgewiesen.

Der Geschäftsstellenbeamte:

Der Vorsitzende:

N. Maslin

U. Oswald