

Interner Verteilerschlüssel:

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

**Datenblatt zur Entscheidung
vom 25. März 2021**

Beschwerde-Aktenzeichen: T 0247/18 - 3.3.02

Anmeldenummer: 09715350.6

Veröffentlichungsnummer: 2247577

IPC: C07D231/12, C07C251/80

Verfahrenssprache: DE

Bezeichnung der Erfindung:

VERFAHREN ZUR REGIOSELEKTIVEN SYNTHESE VON 1-ALKYL-3-HALOALKYL-PYRAZOL-4-CARBONSÄUR E-DERIVATEN

Patentinhaberin:

Bayer Intellectual Property GmbH

Einsprechender:

Stilkenböhrer, Uwe

Stichwort:

Relevante Rechtsnormen:

EPÜ Art. 123(2), 83, 54, 56

Schlagwort:

Änderungen
Ausreichende Offenbarung
Neuheit
Erfinderische Tätigkeit

Zitierte Entscheidungen:

G 0003/14

Orientierungssatz:



Beschwerdekammern

Boards of Appeal

Chambres de recours

Boards of Appeal of the
European Patent Office
Richard-Reitzner-Allee 8
85540 Haar
GERMANY
Tel. +49 (0)89 2399-0
Fax +49 (0)89 2399-4465

Beschwerde-Aktenzeichen: T 0247/18 - 3.3.02

E N T S C H E I D U N G
der Technischen Beschwerdekammer 3.3.02
vom 25. März 2021

Beschwerdeführerin: Bayer Intellectual Property GmbH
(Patentinhaberin) Alfred-Nobel-Strasse 10
40789 Monheim am Rhein (DE)

Vertreter: BIP Patents
c/o Bayer Intellectual Property GmbH
Alfred-Nobel-Straße 10
40789 Monheim am Rhein (DE)

Beschwerdegegner: Stilkenböhmer, Uwe
(Einsprechender) Thomas-Mann-Strasse 4a
28213 Bremen (DE)

Vertreter: Eisenführ Speiser
Patentanwälte Rechtsanwälte PartGmbB
Postfach 10 60 78
28060 Bremen (DE)

Angefochtene Entscheidung: **Entscheidung der Einspruchsabteilung des Europäischen Patentamts, die am 10. November 2017 zur Post gegeben wurde und mit der das europäische Patent Nr. 2247577 aufgrund des Artikels 101 (3) (b) EPÜ widerrufen worden ist**

Zusammensetzung der Kammer:

Vorsitzender M. O. Müller
Mitglieder: A. Lenzen
M. Blasi

Sachverhalt und Anträge

- I. Die vorliegende Entscheidung betrifft die Beschwerde der Patentinhaberin (Beschwerdeführerin) gegen die Entscheidung der Einspruchsabteilung (angefochtene Entscheidung) über den Widerruf des europäischen Patents Nr. 2 247 577 (Streitpatent).
- II. Im Einspruchsverfahren hatte der Einsprechende (Beschwerdegegner) den Widerruf des Streitpatents im gesamten Umfang basierend auf den Einspruchsgründen gemäß Artikel 100 a) EPÜ (mangelnde Neuheit und mangelnde erfinderische Tätigkeit), Artikel 100 b) EPÜ und Artikel 100 c) EPÜ beantragt.
- III. Die folgenden Dokumente aus dem Verfahren vor der Einspruchsabteilung sind für die vorliegende Entscheidung relevant:
- D3 EP 1 854 788 A1
- D4 Altenbach, R. J. et al. (2007): Synthesis, Potency, and In Vivo Profiles of Quinoline Containing Histamine H₃ Receptor Inverse Agonists, *J. Med. Chem.*, 50, pages 5439 to 5448
- D6 Hojo, M. et al. (1992): Facile Synthetic Methods for 3- and 5-Trifluoromethyl-4-Trifluoroacetyl-Pyrazoles and Their Conversion into Pyrazole-4-Carboxylic Acids, *Heterocycles*, 34, pages 791 to 798
- D8 WO 2005/042468 A1
- D9 Experimentelle Beschreibung (eingereicht vom Beschwerdegegner mit seinem Schriftsatz vom 23. August 2017)

IV. Die angefochtene Entscheidung basiert auf dem mit Schriftsatz vom 13. März 2017 eingereichten Anspruchssatz des Hauptantrags und den mit Schriftsatz vom 23. August 2017 eingereichten Anspruchssätzen der Hilfsanträge 1 und 2. Die Einspruchsabteilung entschied insbesondere, dass der beanspruchte Gegenstand des Hauptantrags nicht auf einer erfinderischen Tätigkeit gegenüber einer Kombination von D8 mit D4 und/oder D6 beruhe.

V. Im Hinblick auf einen von der Beschwerdeführerin im Beschwerdeverfahren vorgelegten Hilfsantrag reichten beide Parteien weitere Dokumente ein. Diese sind für die vorliegende Entscheidung jedoch nicht von Relevanz, da die Ansprüche des Hauptantrags gewährbar sind (siehe unten).

VI. Antragsgemäß wurden beide Parteien zu einer mündlichen Verhandlung geladen. Zu deren Vorbereitung erließ die Kammer eine Mitteilung gemäß Artikel 15 (1) VOBK 2020.

In der Folge nahmen beide Parteien ihren hilfsweise gestellten Antrag auf mündliche Verhandlung zurück und kündigten an, nicht an der mündlichen Verhandlung teilzunehmen. Die Kammer hob daraufhin den für die mündliche Verhandlung anberaumten Termin auf.

VII. Die für die vorliegende Entscheidung relevanten Anträge lauten wie folgt.

Die Beschwerdeführerin beantragt die Aufhebung der angefochtenen Entscheidung und die Aufrechterhaltung des Streitpatents in geänderter Fassung auf Basis des Anspruchssatzes des Hauptantrags, eingereicht mit Schriftsatz vom 13. März 2017.

Der Beschwerdegegner beantragt die Zurückweisung der Beschwerde.

- VIII. Die für die vorliegende Entscheidung relevanten Argumente der Beschwerdeführerin können wie folgt zusammengefasst werden.

Wie in der angefochtenen Entscheidung schon festgestellt, seien die Änderungen in den Ansprüchen des Hauptantrags gewährbar. Ferner sei der beanspruchte Gegenstand des Hauptantrags ausreichend offenbart und neu.

D3 sei der nächstliegende Stand der Technik. Der Gegenstand von Anspruch 1 unterscheide sich von D3 dadurch, dass das Acrylsäure-Derivat der Formel (II) eine andere Austrittsgruppe A aufweise und dass es nicht mit einem Hydrazin sondern mit dem N-Alkyl-Hydrazon der Formel (III) in Anspruch 1 umgesetzt werde. Die objektive technische Aufgabe müsse im Auffinden von alternativen Zugangswegen zu den gewünschten Verbindungen gesehen werden. Die in D4 und D6 mit Hydrazonen umgesetzten Verbindungen seien strukturell verschieden von denen, die in D3 mit Hydrazinen umgesetzt würden. Der Fachmann hätte somit nicht davon ausgehen können, dass die Hydrazine in der in D3 beschriebenen Umsetzung durch die in D4 oder D6 beschriebenen Hydrazone ausgetauscht werden könnten. Der Gegenstand der Ansprüche des Hauptantrags beruhe daher auf einer erfinderischen Tätigkeit.

IX. Die für die vorliegende Entscheidung relevanten Argumente des Beschwerdegegners können wie folgt zusammengefasst werden.

Die Definitionen der Reste R^8 und R^9 in den Ansprüchen des Hauptantrags würden im Gegensatz zu den ursprünglich eingereichten Unterlagen Wasserstoff umfassen. Ferner seien die Definitionen der Austrittsgruppe A und des Rests R^1 eingeschränkt worden. Insgesamt würden daher die Ansprüche des Hauptantrags in einer nicht zulässigen Weise auf einer Auswahl aus mindestens zwei Listen basieren. Zudem sei nun im Gegensatz zu den entsprechenden ursprünglichen Ansprüchen der Rest R^9 in den Ansprüchen 11 und 12 des Hauptantrags definiert. Auch seien die Reste R^9 , R^{10} und R^{11} in Anspruch 13 des Hauptantrags unbestimmt. Die Erfordernisse von Artikel 123 (2) EPÜ seien demnach nicht erfüllt.

Die Gruppe X sei in den Resten Y und Z in den Ansprüchen 1 bis 13 des Hauptantrags nicht definiert. Ferner sei eine in der Prioritätsanmeldung als essentiell beschriebene technische Lehre nicht im Streitpatent enthalten. Die Erfindung der Ansprüche 1 bis 13 sei daher nicht über den gesamten beanspruchten Bereich ausführbar. Dies werde auch durch die Versuche in D9 bestätigt.

Der Gegenstand der Ansprüche 1, 11 und 12 sei nicht neu gegenüber D8.

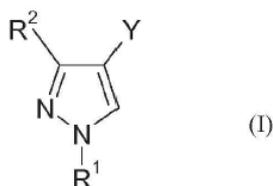
Der Gegenstand der Ansprüche 1 bis 13 beruhe nicht auf einer erfinderischen Tätigkeit ausgehend von D3 oder D8 als nächstliegendem Stand der Technik in Kombination mit D4 und/oder D6.

Entscheidungsgründe

Hauptantrag

1. Der Anspruchssatz des Hauptantrags in der Beschwerde ist der Anspruchssatz des Hauptantrags, auf dem die angefochtene Entscheidung basiert (vgl. Punkte IV und VII).
2. Die unabhängigen Ansprüche haben den folgenden Wortlaut.
 - 2.1 Anspruch 1

"Verfahren zum Herstellen von 1-Alkyl-3-haloalkyl-pyrazol-4-carbonsäure-Derivaten der Formel (I)



in welcher

R¹ ausgewählt ist aus Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl oder tert-Butyl;

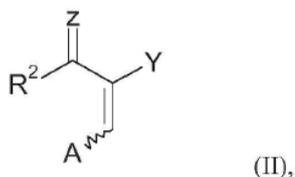
R² ausgewählt ist aus C₁-C₄-Alkylgruppen, die mit einem, zwei oder drei Halogenatomen, ausgewählt aus F, Cl und Br oder einer CF₃-Gruppe substituiert sein können;

Y ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus (C=O)OR³, CN und (C=O)NR⁴R⁵, wobei R³, R⁴ und R⁵ unabhängig voneinander ausgewählt sind aus C₁₋₁₂-Alkyl-, C₃₋₋₈-Cycloalkyl- [sic],

*C*₂₋₁₂-Alkenyl-, *C*₂₋₁₂-Alkynyl-, *C*₆₋₈-Aryl-, *C*₇₋₁₉-Arylalkyl- oder *C*₇₋₁₉-Alkylaryl-Gruppen, die jeweils mit einer oder mehreren Gruppen, die ausgewählt sind aus der Gruppe bestehend aus -R', -X, -OR', -SR', -NR'₂, -SiR'₃, -COOR', -(C=O)R', -CN and [sic] -CONR'₂', wobei R' Wasserstoff oder eine *C*₁₋₁₂-Alkyl-Gruppe ist, substituiert sein können und R⁴ und R⁵ zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5- bis 6-gliedrigen Ring bilden können, der gegebenenfalls ein oder zwei weitere Hetero-Atome, ausgewählt aus O, S und einer SO₂-Gruppe, enthalten kann und der mit einer oder mehreren Gruppen, die ausgewählt sind aus der Gruppe bestehend aus -R', -X, -OR', -SR', -NR'₂, -SiR'₃, -COOR', -(C=O)R', -CN and [sic] -CONR'₂', wobei R' Wasserstoff oder eine *C*₁₋₁₂-Alkyl-Gruppe ist, substituiert sein kann;

umfassend wenigstens eine der Reaktionssequenzen, die sich aus den folgenden Schritten (A) und (D), (B) und (D) oder (C) und (D) zusammensetzen:

- (A) Umsetzung eines 2-acylierten oder 2-iminoalkylierten Acrylsäure-Derivats der Formel (II),



in welcher

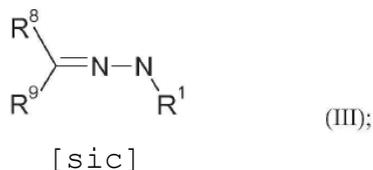
Z ausgewählt ist aus O, S und N^tR¹⁰R¹¹, wobei

R^{10} und R^{11} unabhängig voneinander ausgewählt sind aus C_{1-12} -Alkyl-, C_{3-8} -Cycloalkyl- [sic], C_{2-12} -Alkenyl-, C_{2-12} -Alkinyl-, C_{6-8} -Aryl-, C_{7-19} -Arylalkyl- oder C_{7-19} -Alkylaryl-Gruppen, die jeweils mit einer oder mehreren Gruppen, die ausgewählt sind aus der Gruppe bestehend aus $-R'$, $-X$, $-OR'$, $-SR'$, $-NR'_2$, $-SiR'_3$, $-COOR'$, $-(C=O)R'$, $-CN$ and [sic] $-CONR'_2$, wobei R' Wasserstoff oder eine C_{1-12} -Alkyl-Gruppe ist, substituiert sein können und R^{10} und R^{11} zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5- bis 6-gliedrigen Ring bilden können, der gegebenenfalls ein oder zwei weitere Hetero-Atome, ausgewählt aus O , S und einer SO_2 -Gruppe, enthalten kann und der mit einer oder mehreren Gruppen, die ausgewählt sind aus der Gruppe bestehend aus $-R'$, $-X$, $-OR'$, $-SR'$, $-NR'_2$, $-SiR'_3$, $-COOR'$, $-(C=O)R'$, $-CN$ and [sic] $-CONR'_2$, wobei R' Wasserstoff oder eine C_{1-12} -Alkyl-Gruppe ist, substituiert sein kann;

A eine Austrittsgruppe $NR^{12}R^{13}$ ist, wobei R^{12} und R^{13} unabhängig voneinander ausgewählt sind aus C_{1-12} -Alkyl-, C_{3-8} -Cycloalkyl- [sic], C_{2-12} -Alkenyl-, C_{2-12} -Alkinyl-, C_{6-8} -Aryl-, C_{7-19} -Arylalkyl- oder C_{7-19} -Alkylaryl-Gruppen, die jeweils mit einer oder mehreren Gruppen, die ausgewählt sind aus der Gruppe bestehend aus $-R'$, $-X$, $-OR'$, $-SR'$, $-NR'_2$, $-SiR'_3$, $-COOR'$, $-(C=O)R'$, $-CN$ and [sic] $-CONR'_2$, wobei R' Wasserstoff oder eine C_{1-12} -Alkyl-Gruppe ist,

substituiert sein können und R^{12} und R^{13} zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5- bis 6-gliedrigen Ring bilden können, der gegebenenfalls ein oder zwei weitere Hetero-Atome, ausgewählt aus O, S und einer SO_2 -Gruppe, enthalten kann und der mit einer oder mehreren Gruppen, die ausgewählt sind aus der Gruppe bestehend aus $-R'$, $-X$, $-OR'$, $-SR'$, $-NR'_2$, $-SiR'_3$, $-COOR'$, $-(C=O)R'$, $-CN$ and [sic] $-CONR'_2$, wobei R' Wasserstoff oder eine C_{1-12} -Alkyl-Gruppe ist, substituiert sein kann;

mit einem N-Alkyl-Hydrason der Formel (III)



in welcher

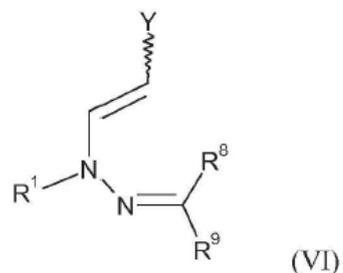
R^8 ausgewählt ist aus H, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Phenyl, Toly, Cyclohexyl;

R^9 ausgewählt ist aus H, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Phenyl, Toly, Cyclohexyl;

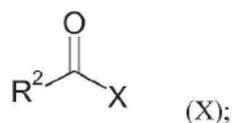
wobei R^8 und R^9 gemeinsam mit dem C-Atom, an das sie geknüpft sind, einen 5- oder 6-gliedrigen Ring bilden können;

(B) Acylierung eines Acrylsäurehydrazons der Formel

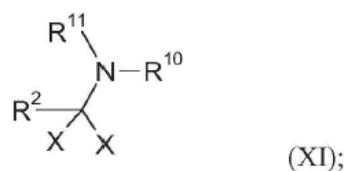
(VI);



mit einem Acylhalogenid der Formel (X), wobei X ausgewählt ist aus F, Cl, Br oder I;



(C) Iminoalkylierung eines Acrylsäurehydrazons der obigen Formel (VI) mit einem α,α -Dihalogenamin der Formel (XI), wobei X ausgewählt ist aus F, Cl, Br oder I,



(D) Cyclisierung der in Schritt (A), (B) oder (C) erhaltenen Zwischenprodukte zum 3-Haloalkyl-pyrazol-4-carbonsäure-Derivat der Formel (I)."

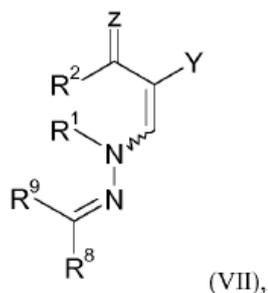
Anspruch 1 betrifft mithin drei Verfahrensalternativen für die Herstellung von Pyrazolen der Formel (I). Diese umfassen:

- die Schritte (A) und (D),
- die Schritte (B) und (D) bzw.
- die Schritte (C) und (D).

Die Pyrazole der Formel (I) zeichnen sich dadurch aus, dass sie an der Ringposition 1 einen Alkyl-Rest (R^1), an der Position 3 einen Haloalkyl-Rest (R^2) und an der Position 4 einen Rest (Y) tragen, der von einer Carbonsäuregruppe abgeleitet ist (nämlich $(C=O)OR^3$, CN oder $(C=O)NR^4R^5$).

2.2 Anspruch 11

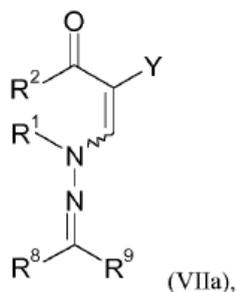
"2-Acyliertes oder 2-iminoalkyliertes Acrylsäurehydrazon der Formel (VII)



in der die Reste R^1 , R^2 , R^8 , [sic] R^9 , Y und Z die zuvor beschriebenen Bedeutungen haben."

2.3 Anspruch 12

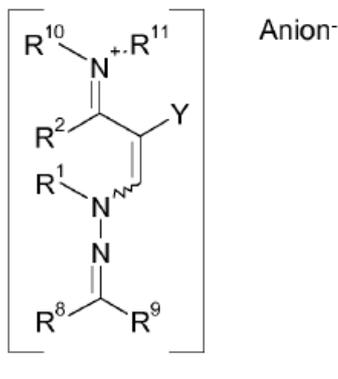
"2-Acrylacrylhydrazon der Formel (VIIa)



in der die Reste R^1 , R^2 , R^8 , R^9 und Y die zuvor beschriebenen Bedeutungen haben."

2.4 Anspruch 13

"Salze der Formel (VIIb)



in der die Reste R^1 bis R^8 und Y die zuvor beschriebenen Bedeutungen haben und das Anion ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus Cl^- , BF_4^- , PF_6^- , SbF_6^- und $AlCl_4^-$."

3. Änderungen (Artikel 123 (2) EPÜ)

3.1 Anspruch 1

Im Vergleich zur Anmeldung in ihrer ursprünglich eingereichten Fassung (nachfolgend "ursprüngliche Anmeldung"), und zwar deren Anspruch 1, wurden in Anspruch 1 des Hauptantrags die Definitionen der Austrittsgruppe A und die der Reste R^1 , R^8 und R^9 geändert.

Diese Änderungen betreffen die Schritte (A) bzw. (B) und (C) in unterschiedlicher Weise. Bei Schritt (A) sind beide Edukte betroffen, nämlich das die Austrittsgruppe A enthaltende Acrylsäure-Derivat der Formel (II) und das die Reste R^1 , R^8 und R^9 enthaltende N-Alkyl-Hydrason der Formel (III). Bei den Schritten (B) und (C) ist hingegen nur eines der jeweils zwei Edukte betroffen, nämlich das die Reste R^1 , R^8 und R^9 enthaltende Acrylsäurehydrason der Formel (VI). Die

Schritte (A) bzw. (B) und (C) werden daher in Folge getrennt voneinander betrachtet.

3.1.1 Schritt (A)

Die im ursprünglichen Anspruch 1 für die Austrittsgruppe A enthaltene breitere Definition

"A eine Austrittsgruppe, ausgewählt aus OR^{12} , SR^{12} , $NR^{12}R^{13}$ ist, wobei R^{12} und R^{13} unabhängig voneinander ausgewählt sind aus [...]"

wurde in Anspruch 1 des Hauptantrags beschränkt auf

"A eine Austrittsgruppe $NR^{12}R^{13}$ ist, wobei R^{12} und R^{13} unabhängig voneinander ausgewählt sind aus [...]".

Da die Definitionen der in der Austrittsgruppe $NR^{12}R^{13}$ enthaltenen Reste R^{12} und R^{13} jedoch nicht geändert wurden, ist die Austrittsgruppe A in Anspruch 1 des Hauptantrags nach wie vor generisch definiert.

In Bezug auf das N-Alkyl-Hydrazon der Formel (III) und die in ihm enthaltenen Reste R^1 , R^8 und R^9 offenbart die ursprüngliche Anmeldung zunächst eine allgemeine (Seite 16, Zeilen 11 bis 27) und direkt im Anschluss daran eine bevorzugte Ausführungsform (Seite 16, Zeile 28 bis Seite 17, Zeile 7). Auf die allgemeine Ausführungsform ist auch der ursprüngliche Anspruch 1 gerichtet. In Anspruch 1 des Hauptantrages ist diese durch die bevorzugte Ausführungsform ersetzt worden. Wenngleich die bevorzugte Ausführungsform insofern breiter ist als die Allgemeine, als sie die zusätzliche Möglichkeit umfasst, dass es sich bei R^8 und/oder R^9 um Wasserstoffatome handeln kann, stellt doch der in der

ursprünglichen Anmeldung hergestellte Zusammenhang zwischen beiden Ausführungsformen eine ausreichende Basis für den Ersatz der im ursprünglichen Anspruch 1 enthaltenen allgemeinen Ausführungsform durch die von ihr nicht vollständig umfasste bevorzugte Ausführungsform dar. Das Argument des Beschwerdegegners, wonach zwar Anspruch 1 des Hauptantrags, nicht aber der ursprüngliche Anspruch 1 die oben genannte Möglichkeit umfasse und dass daraus eine unzulässige Änderung resultiere, ist daher nicht überzeugend.

Zusammengefasst wird also bei Schritt (A) in Anspruch 1 des Hauptantrags die im ursprünglichen Anspruch 1 enthaltene generische Definition für die Austrittsgruppe A lediglich hinsichtlich ihres Umfangs beschränkt, bleibt aber nach wie vor generischer Natur. Des Weiteren ist der Ersatz der Definitionen für die Reste R^1 , R^8 und R^9 im ursprünglichen Anspruch 1 durch diejenigen in Anspruch 1 des Hauptantrags direkt und unmittelbar aus der ursprünglichen Anmeldung zu entnehmen. Insbesondere sind die in Anspruch 1 des Hauptantrags aufgenommenen Definitionen für R^1 , R^8 und R^9 nach wie vor generischer Natur und führen zusammen mit der bei der Austrittsgruppe A vorgenommenen Änderung nicht zu einem "singling-out" bestimmter (anderweitig nicht offenbarter) Kombinationen. Die vorgenommenen Änderungen bei Schritt (A) in Anspruch 1 des Hauptantrags sind daher im Hinblick auf Artikel 123 (2) EPÜ gewährbar.

3.1.2 Schritte (B) und (C)

Wie unter dem vorhergehenden Punkt ausgeführt ist für das N-Alkyl-Hydrazon der Formel (III) die in Anspruch 1 des Hauptantrags enthaltene Kombination von

Definitionen für R^1 , R^8 und R^9 in der ursprünglichen Anmeldung als bevorzugt offenbart. Zwar gibt die ursprüngliche Anmeldung in Bezug auf das Acrylsäurehydrazon der Formel (VI) an sich keine Definitionen für R^1 , R^8 und R^9 an, doch verweist sie darauf, dass dieses aus dem N-Alkyl-Hydrazon der Formel (III) erhalten werden kann (Seite 20 f., Schemata 7 und 8). Dem entnimmt der Fachmann, dass die für das N-Alkyl-Hydrazon der Formel (III) als bevorzugt offenbarte Kombination von Definitionen für R^1 , R^8 und R^9 auch für das Acrylsäurehydrazon der Formel (VI) bevorzugt ist. Daraus folgt also beispielsweise, dass auch für das Acrylsäurehydrazon der Formel (VI) die Möglichkeit besteht, dass es sich bei R^8 und/oder R^9 um Wasserstoffatome handeln kann. Entgegen dem vom Beschwerdegegner in diesem Zusammenhang vorgetragene Argument (siehe oben) ist dies im völligen Einklang mit der übrigen Offenbarung der ursprünglichen Anmeldung, denn diese nennt unter den auf Seite 18, Zeilen 8 ff. und Seite 22, Zeilen 1 ff. als bevorzugt bezeichneten Acrylsäurehydrazonen der Formel (VI) auch solche, die einen 1-Methyl-2-(phenylmethyliden)hydrazinyl-Rest im Molekül enthalten, bei welchen also $R^8/R^9 = \text{Ph}/\text{H}$ ist. Für die Schritte (B) und (C) sind die vorgenommenen Änderungen also direkt und unmittelbar aus der ursprünglichen Anmeldung zu entnehmen.

3.2 Weitere Ansprüche

Die Ansprüche 2 bis 10 basieren auf den Ansprüchen 2 bis 10 der ursprünglichen Anmeldung. Dabei ist die Liste der Acrylsäure-Derivate der Formel (II) im ursprünglichen Anspruch 8 in Anspruch 8 des Hauptantrags auf die Vertreter beschränkt worden, für die $A = \text{NR}^{12}\text{R}^{13}$ ist.

Die Ansprüche 11 und 12 basieren auf den ursprünglichen Ansprüchen 11 und 12. Dass R^9 in den ursprünglichen Ansprüchen 11 und 12 nicht definiert ist, nun aber zusammen mit unter anderem R^1 und R^8 "*die zuvor [beschriebene Bedeutung] haben*" soll, führt nicht über den Inhalt der ursprünglichen Anmeldung hinaus, da die Acrylsäurehydrazone der Formeln (VII) (Anspruch 11) bzw. (VIIa) (Anspruch 12) aus den N-Alkyl-Hydrazonen der Formel (III) bzw. den Acrylsäurehydrazonen der Formel (VI) gebildet werden, vgl. Schemata 3, 4, 6 der ursprünglichen Anmeldung sowie Seite 14, Zeilen 1 ff.

Anspruch 13 basiert auf dem ursprünglichen Anspruch 13. Die nun zusätzliche Angabe des "Anion⁻" und dessen Definition ist auf Seite 14, Zeilen 3 bis 8 der ursprünglichen Anmeldung offenbart. Dass in Anspruch 13 die Reste R^9 , R^{10} und R^{11} unbestimmt sind, führt nicht über den Gegenstand der ursprünglichen Anmeldung hinaus, da dies schon im ursprünglichen Anspruch 13 der Fall war. Der Vollständigkeit halber sei angemerkt, dass ein Einwand diesbezüglich unter Artikel 84 EPÜ unzulässig wäre, da Anspruch 13 identisch zum erteilten Anspruch 14 ist (vgl. G 3/14, ABl. EPA 2015, A102, Entscheidungsformel).

- 3.3 Zusammengefasst erfüllen also die Ansprüche des Hauptantrags die Erfordernisse von Artikel 123 (2) EPÜ.
- 4. Offenbarung der Erfindung (Artikel 83 EPÜ)
 - 4.1 Der Beschwerdegegner argumentierte, "*dass „X“ in den Variablengruppen Y und Z in den Ansprüchen 1-13 des Hauptantrags nicht definiert wird, weswegen der Gegenstand der Ansprüche 1-13 des Hauptantrags nicht im gesamten beanspruchten Bereich ausführbar ist*" (Beschwerdeerwiderung, Seite 6, Absatz 3).

In Anspruch 1 erfolgt eine Definition der Gruppe X lediglich in den Schritten (B) und (C). Das Fehlen einer solchen in Schritt (A) kann die Ausführbarkeit desselben jedoch nicht in Frage stellen, da das Streitpatent in Absatz [0020] diese Gruppe als "Halogen" definiert, d. h. als Fluor, Chlor, Brom oder Iod. Es ist dies im Übrigen die gleiche Definition wie bei den Schritten (B) und (C) in Anspruch 1.

- 4.2 Der Beschwerdegegner verwies auch auf D9. Die darin beschriebenen Versuche würden belegen, dass das Verfahren gemäß Anspruch 1, sofern es Schritt (A) betreffe, nicht über die gesamte Breite ausführbar sei.

In D9 wird die Umsetzung von 2-(Difluormethyl)-3-(pyrrolidine-1-yl)acrylsäureethylester mit dem aus Methylhydrazin und Aceton gebildeten Hydrazone untersucht. Diese Edukte sind gemäß den Formeln (II) und (III) in Anspruch 1 ($Y = (C=O)OEt$; $A = \text{Pyrrolidin-1-yl}$; $Z = O$; $R^2 = CHF_2$; $R^1 = Me$; $R^8 = R^9 = Me$). Die Bildung eines 1-Alkyl-3-haloalkyl-pyrazol-4-carbonsäure-Derivats der Formel (I) wird in nur geringer Menge und mit nur geringer Regioselektivität beobachtet. Ferner wird die Bildung eines Zwischenproduktes gemäß Formel (VII) nicht beobachtet.

Nun fordert Anspruch 1 weder, dass ein Produkt gemäß Formel (I) in einer bestimmten Menge/Ausbeute erhalten, noch dass es mit einer bestimmten Regioselektivität gebildet werden müsste. Auch fordert Anspruch 1 nicht, dass ein Zwischenprodukt gemäß Formel (VII) gebildet werden müsste. Absatz [0047] des Streitpatents weist vielmehr darauf hin, dass es sich dabei um mögliche Zwischenprodukte handeln kann. Mit der Bildung eines Produktes gemäß Formel (I) belegt somit D9 vielmehr,

dass das Verfahren gemäß Anspruch 1 ausreichend offenbart ist.

Zwar stellt Anspruch 2 des Hauptantrags auf die Bildung eines Zwischenproduktes der Formel (VII) ab (für die Struktur, vgl. Anspruch 11 oben unter Punkt 2.2), doch kann die Nichtbeobachtung eines solchen in D9 ebenfalls nicht die Ausführbarkeit des Verfahrens gemäß Anspruch 2 in Frage stellen. In Beispiel 1 des Streitpatents wird die Umsetzung von 2-(Difluoracetyl)-3-(dimethylamino)-acrylsäureethyl-ester mit 2-Methyl-1-phenylhydrazon beschrieben, d. h. zweier Verbindungen, welche ebenfalls gemäß der Formeln (II) und (III) in Anspruch 1 sind ($Y = (C=O)OEt$; $A = NMe_2$; $Z = O$; $R^2 = CHF_2$; $R^1 = Me$; $R^8/R^9 = H/Ph$). Erhalten wird aus dieser Reaktion das in Absatz [0103] des Streitpatents abgebildete Produkt, ein Zwischenprodukt gemäß Formel (VII) im Streitpatent (Schema 3). Vor diesem Hintergrund ist also die Lehre des Streitpatents für den Fachmann ausreichend, um ohne unzumutbaren Aufwand ein Zwischenprodukt gemäß Formel (VII) erhalten zu können. Wenn nun, wie in D9 beschrieben, andere Edukte anscheinend nicht unter Bildung eines entsprechenden Zwischenproduktes miteinander reagieren, so kann daraus nicht ohne Weiteres auf eine mangelnde Ausführbarkeit geschlossen werden. Dazu hätte es des Nachweises eines unzumutbaren Aufwands für den Fachmann bedurft und damit insbesondere auch des Nachweises, dass die Umsetzung der Edukte der D9 unter den im Streitpatent beschriebenen Reaktionsbedingungen nicht zu einem Zwischenprodukt gemäß Formel (VII) geführt hätte - denn die im Streitpatent genannten Reaktionsbedingungen sind grundlegend von denjenigen der D9 verschieden (vgl. beispielsweise Lösungsmittel: Toluol im Streitpatent vs. Aceton in D9; Katalysator: Kaliumhydrogensulfat im Streitpatent vs. keiner in D9; Reaktionstemperatur:

35-40 °C im Streitpatent vs. Raumtemperatur in D9). Es besteht daher keinerlei Anlass, daran zu zweifeln, dass mit diesen grundlegend andersartigen im Streitpatent offenbarten Reaktionsbedingungen der "Misserfolg" der D9 hätte vermieden werden können.

- 4.3 Zu guter Letzt verwies der Beschwerdegegner auch darauf, dass eine in der Prioritätsanmeldung als essentiell beschriebene technische Lehre nicht im Streitpatent enthalten sei, und dass das Verfahren gemäß Anspruch 1, sofern es Schritt (A) betreffe, nicht über die gesamte Breite ausführbar sei.

Auch dem kann sich die Kammer nicht anschließen. Aus der vermeintlichen Tatsache, dass eine in einer Prioritätsanmeldung als essentiell beschriebene technische Lehre nicht in der Nachanmeldung bzw. dem darauf basierenden Streitpatent enthalten ist, kann nicht notwendigerweise auf einen Offenbarungsmangel geschlossen werden. So könnte sich beispielsweise besagte technische Lehre zum Zeitpunkt der Einreichung der Nachanmeldung bzw. der Erteilung des Streitpatents als falsch oder unnötig herausgestellt haben. Hinzu kommt im vorliegenden Fall, dass die vom Beschwerdegegner angesprochene technische Lehre der Prioritätsanmeldung (Absatz [0042])

"Eine vollständige Transaminierung von 2-Acyl-3-amino-acrylsäure-Derivaten mit Hydrazonen erfolgt nur in Anwesenheit von Katalysatoren [...] Es ist darauf zu achten, dass die Reaktion möglichst unter Ausschluß von Wasser erfolgt um die Deacylierung zu verhindern."

nicht den Schluss zulässt, dass die Durchführung der betreffenden Reaktion ohne Katalysatoren oder in

Gegenwart von Wasser zu überhaupt keinem Produkt führen würde.

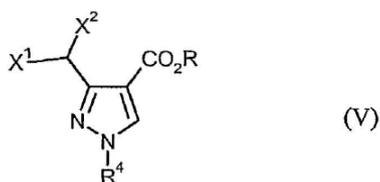
4.4 Zusammengefasst greifen die unter Artikel 83 EPÜ vom Beschwerdegegner erhobenen Einwände nicht durch und die Kammer sieht daher die beanspruchte Erfindung des Hauptantrags als ausreichend offenbart an.

5. Neuheit (Artikel 54 EPÜ)

Der einzige Neuheitseinwand des Beschwerdegegners basierte auf D8.

5.1 D8 offenbart (Seite 5, Zeile 24 bis Seite 6, Zeile 12):

Ebenfalls Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist ein Verfahren zum Herstellen von 3-Dihalogenmethyl-pyrazol-4-carbonsäureestern der Formel (V)



in welcher

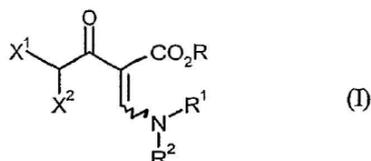
R für C₁-C₄-Alkyl steht,

X¹ und X² unabhängig voneinander für Fluor, Chlor oder Brom stehen,

R⁴ für C₁-C₄-Alkyl, Hydroxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy-C₁-C₄-alkyl mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, oder für Phenyl steht,

dadurch gekennzeichnet, dass man

b) 2-Dihalogenacetyl-3-amino-acrylsäureestern der Formel (I)

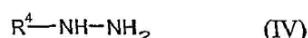


in welcher

R, R¹ und R² unabhängig voneinander für C₁-C₄-Alkyl stehen und

X¹ und X² unabhängig voneinander für Fluor, Chlor oder Brom stehen,

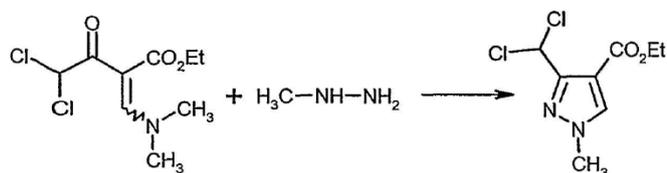
mit Hydrazin-Derivaten der Formel (IV)



in welcher R⁴ die oben angegebenen Bedeutungen hat,

bei Temperaturen von -50°C bis 0°C in Gegenwart eines aprotischen Lösungsmittels umgesetzt.

Gemäß D8 handelt es sich bei den Hydrazin-Derivaten der obigen Formel (IV) bevorzugt um Methylhydrazin (R⁴ = Me; Seite 6, Zeilen 23 bis 26). D8 offenbart ebenfalls eine Liste möglicher aprotischer Lösungsmittel, die in obiger Reaktion eingesetzt werden können. Unter diesen Lösungsmitteln ist Aceton genannt (Seite 7, Zeilen 15 bis 22). Beispielhaft wird in D8 die Umsetzung von 2-(Dichloracetyl)-3-(dimethylamino)acrylsäureethylester mit Methylhydrazin erwähnt (Seite 6, Zeile 28 bis Seite 7, Zeile 1):



5.2 Die als Formel (I) in der obigen Textstelle der D8 offenbarte Verbindung entspricht dem unter Schritt (A) von Anspruch 1 geforderten 2-acylierten Acrylsäurederivat (II).

Das beispielsweise durch die Umsetzung von 2-(Dichloracetyl)-3-(dimethylamino)acrylsäureethylester mit Methylhydrazin in D8 erhaltene Produkt entspricht dem in Anspruch 1 geforderten Pyrazol der Formel (I).

Dennoch unterscheidet sich das Verfahren des Anspruchs 1 dahingehend von D8, dass anspruchsgemäß in Schritt (A) ein N-Alkyl-Hydrazon $(R^9R^8)C=N-NH-R^1$ der Formel (III) eingesetzt wird, während in D8 das Hydrazinderivat $R^4-NH-NH_2$ (IV) verwendet wird.

- 5.3 Der Beschwerdegegner argumentierte in diesem Zusammenhang, dass bei Durchführung der obigen Reaktion bei einer Temperatur von -50 bis 0 °C und unter Einsatz des bevorzugten Methylhydrazins unweigerlich ein Hydrazon gemäß Formel (III) in Anspruch 1 gebildet werde, wenn Aceton als Lösungsmittel gewählt werde. Insbesondere bilde sich aus dem Hydrazin $CH_3-NH-NH_2$ und Aceton $(CH_3)_2(C=O)$ das Hydrazon $CH_3-NH-N=C(CH_3)_2$. Mithin müsse also bei Wahl von Aceton als Lösungsmittel unter Einsatz des bevorzugten Methylhydrazins eine Reaktion ablaufen wie sie in Anspruch 1 beschrieben ist. Neben dem Verfahren gemäß Anspruch 1 seien dadurch auch die Verbindungen der Ansprüche 11 und 12 neuheitsschädlich vorweggenommen.

Die Kammer kann sich dem nicht anschließen. Die Argumentation des Beschwerdegegners geht von der Auswahl von Aceton als Lösungsmittel aus und basiert im Wesentlichen auf der Behauptung, dass sich bei jeder Reaktionstemperatur, die ja darüber hinaus aus dem in D8 offenbarten Temperaturbereich von -50 bis 0 °C zu wählen ist,

- a) aus Methylhydrazin und Aceton das entsprechende Hydrazon bildet
- b) das in a) gebildete Hydrazon mit den Verbindungen der Formel (I) in D8 reagiert und
- c) das aus b) erhaltene Zwischenprodukt weiter unter Bildung von Verbindungen der Formel (V) in D8 zyklisiert.

Die Kammer erkennt an, dass Methylhydrazin und Aceton unter Bildung eines entsprechenden Hydrazons miteinander reagieren können. Dass sie dies aber bereitwillig bei so niedrigen Temperaturen wie beispielsweise $-50\text{ }^{\circ}\text{C}$ tun, kann durch einen bloßen Verweis auf das allgemeine Fachwissen nicht belegt werden. Schon bzgl. a) ergeben sich mithin berechtigte Zweifel. Selbst wenn man zu Gunsten des Beschwerdegegners davon ausgeht, dass die Bildung des Hydrazons selbst bei $-50\text{ }^{\circ}\text{C}$ bereitwillig vonstattengeht, bestünden immer noch erhebliche Zweifel bezüglich der Folgereaktionen b) und c).

Zu b): Wie wäre es etwa zu erklären, dass bei $-50\text{ }^{\circ}\text{C}$ das reaktive Methylhydrazin nicht mit Verbindungen der Formel (I) reagiert, wohl aber das aus Methylhydrazin und Aceton gebildete Hydrazon, welches weniger reaktiv ist als Methylhydrazin?

Zu c): Selbst wenn man nun weiter annimmt, dass Verbindungen der Formel (I) mit dem aus Methylhydrazin und Aceton gebildeten Hydrazon bei $-50\text{ }^{\circ}\text{C}$ reagieren, wie wäre dann der abschließende Ringschluss zum Pyrazol denkbar? Für diesen Ringschluss ist es erforderlich, dass die als Hydrazon ins Molekül eingeführte Hydrazin- NH_2 -Gruppe wieder frei gesetzt wird. Wenn sich aber unter den Bedingungen der D8 vermeintlich ein Hydrazon

spontan bildet (vgl. a) oben), wieso sollte dann spontan dessen Hydrolyse erfolgen?

Aus den oben genannten Gründen offenbart D8 unmittelbar und eindeutig weder ein Verfahren gemäß Anspruch 1 noch Verbindungen gemäß der Ansprüche 11 und 12. Der Gegenstand der Ansprüche 1, 11 und 12 ist daher gegenüber D8 neu.

6. Erfinderische Tätigkeit (Artikel 56 EPÜ)

6.1 Der Beschwerdegegner sah D3 oder D8 als den nächstliegenden Stand der Technik an und trug vor, dass der beanspruchte Gegenstand des Hauptantrags gegenüber einer Kombination jedes dieser Dokumente mit D4 und/oder D6 nicht auf einer erfinderischen Tätigkeit beruhe.

6.2 D8 als nächstliegender Stand der Technik

6.2.1 Ansprüche 1 bis 10

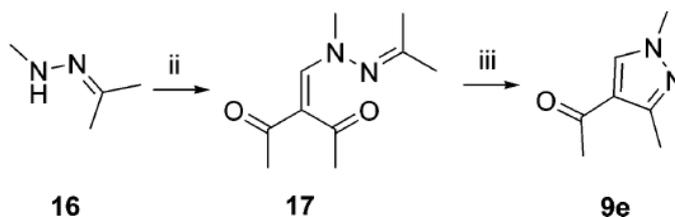
Wie oben schon festgestellt, unterscheidet sich das Verfahren gemäß Anspruch 1 von dem in D8 offenbarten Verfahren (vgl. beispielsweise die oben erwähnte Umsetzung von 2-(Dichloracetyl)-3-(dimethylamino)acrylsäureethylester mit Methylhydrazin) nur dadurch, dass in Schritt (A) das Acrylsäure-Derivat der Formel (II) mit einem N-Alkyl-Hydrazon der Formel (III) in Anspruch 1 umgesetzt wird und nicht mit einem Hydrazin gemäß Formel (IV) in D8.

Die angefochtene Entscheidung, auf die sich der Beschwerdegegner berief, führt aus, dass obiges Unterscheidungsmerkmal mit keinem technischen Effekt verbunden sei. Zugunsten des Beschwerdegegners wird in

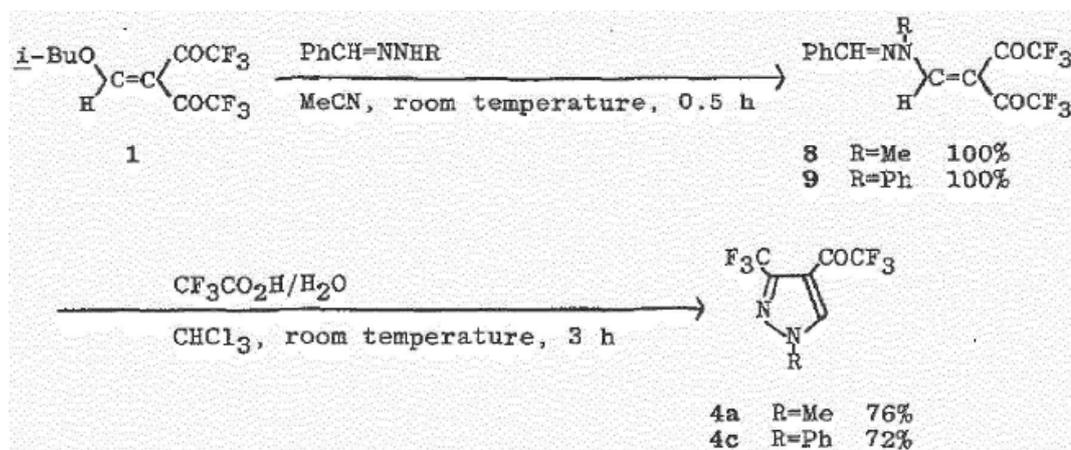
der Folge davon ausgegangen, dass dies korrekt ist. Die objektive technische Aufgabe kann daher darin gesehen werden, ein alternatives Syntheseverfahren für die Pyrazol-Derivate gemäß Formel (I) in Anspruch 1 bereitzustellen.

Hinsichtlich des Naheliegens verwies der Beschwerdegegner wiederum auf die angefochtene Entscheidung. Laut dieser habe der Fachmann D4 und/oder D6 entnehmen können, dass Hydrazone sich ähnlich Hydrazinen für Reaktionen mit Acrylsäurederivaten eignen, um zu Pyrazolverbindungen zu gelangen. Die Kammer kann sich dem aus den folgenden Gründen nicht anschließen.

D4 offenbart die Umsetzung des aus Methylhydrazin und Aceton gebildeten Hydrazons (Verbindung **16**) mit 3-Ethoxymethylenpentan-2,4-dion unter Bildung von Verbindung **17** (Schritt ii). Aus letzterer wird durch Umsetzung mit HCl in Ethanol das Pyrazol **9e** erhalten (Schritt iii):



In ähnlicher Weise offenbart D6 die Umsetzung des aus Methylhydrazin (R = Me) und Benzaldehyd gebildeten Hydrazons mit β,β -Bis(trifluoroacetyl)vinyl-*i*-butylether (Verbindung **1**) unter Bildung der Verbindung **8**. Aus dieser wird durch Umsetzung in wässriger Trifluoressigsäure das entsprechende Pyrazol **4a** erhalten:



Die oben beschriebenen Pyrazol-Synthesen der D4 und D6 sind die einzigen, welche von Hydrazonen ausgehen, die N-Alkyl-Hydrazone gemäß der Formel (III) in Anspruch 1 sind (D4: das aus Methylhydrazin und Aceton gebildete Hydrazon; D6: das aus Methylhydrazin und Benzaldehyd gebildete Hydrazon). Dabei fällt auf, dass sich deren jeweilige Reaktionspartner, nämlich 3-Ethoxymethylenpentan-2,4-dion (D4) bzw. β,β -Bis(trifluoroacetyl)vinyl-*i*-butylether (D6, Verbindung **1**), grundlegend von den Verbindungen unterscheiden, welche in D8 mit Hydrazinen umgesetzt werden. So besteht ein wesentlicher Unterschied darin, dass es sich bei den Verbindungen der D4 und D6 um Diketone handelt, bei denen der D8 hingegen um β -Ketocarbonsäureester. Des Weiteren weisen die Verbindungen der D4 und D6 mit Alkoxygruppen (D4: Ethoxy; D6: *i*-Butoxy) gänzlich andere Austrittsgruppen auf als die Verbindungen der D8, bei welchen es Aminogruppen sind. Vor diesem Hintergrund hätte der Fachmann nicht davon ausgehen können, dass sich die in D8 beschriebene Umsetzung mit Hydrazinen in gleicher Weise auch mit den in D4 und D6 beschriebenen Hydrazonen bewerkstelligen lassen würde. Der Gegenstand von Anspruch 1 und der von ihm abhängigen Ansprüche 2 bis 10 beruht demnach ausgehend von D8 auf einer erfinderischen Tätigkeit gemäß Artikel 56 EPÜ.

6.2.2 Ansprüche 11 bis 13

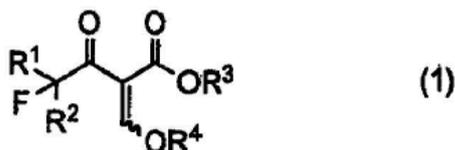
Der Gegenstand der Ansprüche 11 bis 13 ist auf die Acrylsäurehydrazone der Formeln (VII), (VIIa) bzw. (VIIb) gerichtet. Da diese Acrylsäurehydrazone Zwischenprodukte darstellen, die gemäß Schritt (A) in Anspruch 1 zugänglich sind, gilt die obige Argumentation entsprechend auch für den Gegenstand dieser Ansprüche. Ausgehend von D8 beruht mithin auch der Gegenstand der Ansprüche 11 bis 13 auf einer erfinderischen Tätigkeit.

6.3 D3 als nächstliegender Stand der Technik

D3 (Anspruch 1) betrifft im Wesentlichen ein Verfahren zur Herstellung von 1-substituierten 3-Fluoroalkylpyrazol-4-carboxylaten der folgenden Formel (3)



durch Umsetzung von 2-Alkoxy-methylenfluoroacrylaten der Formel (1)



mit Hydrazinen der Formel R⁵NHNH₂ (die genaue Bedeutung der Reste R¹ bis R⁵ ist dabei vorliegend nicht von Relevanz).

Das Verfahren gemäß Anspruch 1 des Hauptantrags unterscheidet sich somit von D3 mindestens dadurch, dass in Schritt (A)

- i) das Acrylsäure-Derivat der Formel (II) eine andere Austrittsgruppe aufweist (nämlich $NR^{12}R^{13}$ anstelle von OR^4 , vgl. Verbindung der Formel (1) in D3)
- ii) dass die Umsetzung in Schritt (A) mit einem N-Alkyl-Hydrazon der Formel (III) durchgeführt wird und nicht mit einem Hydrazin.

Zugunsten des Beschwerdegegners wird davon ausgegangen, dass mit obigen Unterscheidungsmerkmalen kein technischer Effekt verbunden ist und dass folglich die objektive technische Aufgabe lediglich darin zu sehen ist, ein alternatives Syntheseverfahren für die Pyrazol-Derivate gemäß Formel (I) in Anspruch 1 bereitzustellen.

Um ausgehend von D3 zum Gegenstand von Anspruch 1 zu gelangen, hätte der Fachmann zunächst die in den Verbindungen der Formel (1) in D3 enthaltene Austrittsgruppe OR^4 gegen eine solche austauschen müssen, welche gemäß der entsprechenden Definition in Anspruch 1 ist (d. h. $NR^{12}R^{13}$). Selbst wenn man nun, wiederum zugunsten des Beschwerdegegners, genau dies annimmt, so wäre der Fachmann dennoch mit der gleichen Situation konfrontiert gewesen wie ausgehend von D8, d. h. der Beurteilung einer möglichen Umsetzung von

- β -Ketocarbonsäureestern (vgl. die Struktur der Verbindungen der Formel (1) in D3) enthaltend eine Aminogruppe als Austrittsgruppe (vgl. den

gedanklich vorgenommen Austausch der Austrittsgruppe OR⁴ gegen eine Austrittsgruppe gemäß Anspruch 1)

mit

- den Hyrazonen der D4 und/oder D6, welche in diesen Dokumenten jedoch mit gänzlich anderen Verbindungen umgesetzt werden (vgl. oben).

Aus den oben schon angegebenen Gründen hätte der Fachmann nicht davon ausgehen können, dass sich eine solche Umsetzung bewerkstelligen lassen würde. Der Gegenstand von Anspruch 1 beruht demnach auf einer erfinderischen Tätigkeit. Für die übrigen Ansprüche 2 bis 13 gilt obige Argumentation ausgehend von D8 *mutatis mutandis*.

6.4 Zusammengefasst beruht also der beanspruchte Gegenstand des Hauptantrags auf einer erfinderischen Tätigkeit gemäß Artikel 56 EPÜ. Der Hauptantrag ist gewährbar.

Entscheidungsformel

Aus diesen Gründen wird entschieden:

1. Die angefochtene Entscheidung wird aufgehoben.
2. Die Angelegenheit wird an die Einspruchsabteilung mit der Anordnung zurückverwiesen, das Patent mit folgenden Ansprüchen und einer noch anzupassenden Beschreibung aufrechtzuerhalten: Ansprüche 1 bis 13 des Hauptantrags, eingereicht mit Schriftsatz vom 13. März 2017.

Der Geschäftsstellenbeamte:

Der Vorsitzende:



N. Maslin

M. O. Müller

Entscheidung elektronisch als authentisch bestätigt