

Veröffentlichung im Amtsblatt	Ja/Nein
Publication in the Official Journal	Yes/No
Publication au Journal Officiel	Oui/Non



14

Aktenzeichen / Case Number / N° du recours :

T 163/84

Anmeldenummer / Filing No / N° de la demande :

80 100 882.2

Veröffentlichungs-Nr. / Publication No / N° de la publication :

15 456

Bezeichnung der Erfindung:

Title of invention:

Titre de l'invention :

Omega-Halogen-acetophenon Oximether,  
Verfahren zur Herstellung sowie ihre Ver-  
wendung als Zwischenprodukte zur Herstellung  
von Omega-Azolyl-acetophenon Oximether

Klassifikation / Classification / Classement :

### ENTSCHEIDUNG / DECISION

vom / of / du

21. August 1986

Anmelder / Applicant / Demandeur :

Patentinhaber / Proprietor of the patent /  
Titulaire du brevet :

BAYER AG (Beschwerdegegner)

Einsprechender / Opponent / Opposant :

BASF AG (Beschwerdeführer)

Stichwort / Headword / Référence :

"Acetophenonderivate/BAYER"

EPÜ / EPC / CBE

Art. 52(1) und 56 EPÜ

Kennwort / Keyword / Mot clé :

"Erfinderische Tätigkeit

Zwischenprodukte für bekannte Endprodukte  
Mehrstufenverfahren - Teilverfahren -  
Patentierbarkeit - Elementenschutz"

#### Leitsatz / Headnote / Sommaire

Ein neues chemisches Zwischenprodukt wird nicht allein deshalb erfinderisch, weil es im Laufe eines erfinderischen Mehrstufenverfahrens hergestellt und zu einem bekannten Endprodukt weiterverarbeitet wird. Ein solches Produkt ist aber jedenfalls dann patentierbar, wenn seine Weiterverarbeitung erfinderisch ist. (Im Anschluß an "Bis-epoxyäther"/BASF, T 22/82, ABl. 9/1982, p. 341).

Europäisches  
Patentamt  
Beschwerdekammern

European Patent  
Office  
Boards of Appeal

Office européen  
des brevets  
Chambres de recours



Aktenzeichen: T 163/84

**E N T S C H E I D U N G**  
der Technischen Beschwerdekammer 3.3.2  
vom 21. August 1986

**Beschwerdeführer:**  
(Einsprechender)

BASF Aktiengesellschaft  
Carl-Bosch-Strasse 38  
D-6700 Ludwigshafen

**Vertreter:**

**Beschwerdegegner:**  
(Patentinhaber)

BAYER AG  
Konzernverwaltung RP  
Patentabteilung  
D-5090 Leverkusen 1  
Bayerwerk

**Vertreter:**

**Angefochtene Entscheidung:**

Entscheidung der Einspruchsabteilung  
des Europäischen Patentamts vom  
8. Juni 1984, mit der der Einspruch  
gegen das europäische Patent Nr.  
15.456 aufgrund des Artikels 102(2)  
EPÜ zurückgewiesen worden ist.

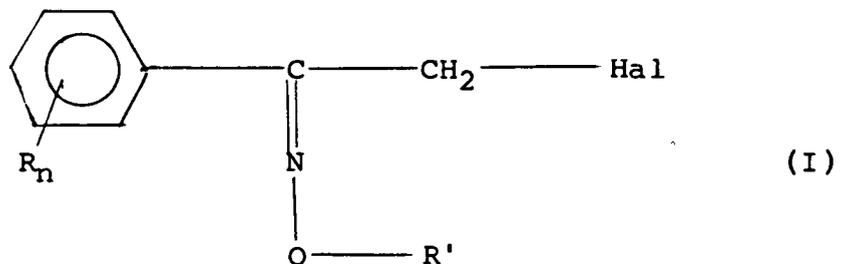
**Zusammensetzung der Kammer:**

Vorsitzender: P.A.M. Lançon  
Mitglied: G.S.A. Szabo  
Mitglied: O.P. Bossung

### Sachverhalt und Anträge

- I. Auf die europäische Patentanmeldung 80 100 882.2, die am 22. Februar 1980 unter Inanspruchnahme der Priorität aus der Voranmeldung vom 1. März 1979 (DE 2 907 972) angemeldet worden ist, ist am 2. Dezember 1981 das europäische Patent 15 456 mit drei Ansprüchen erteilt worden. Die Ansprüche haben den folgenden Wortlaut:

1.  $\omega$ -Halogen-acetophenon-oximether der allgemeinen Formel



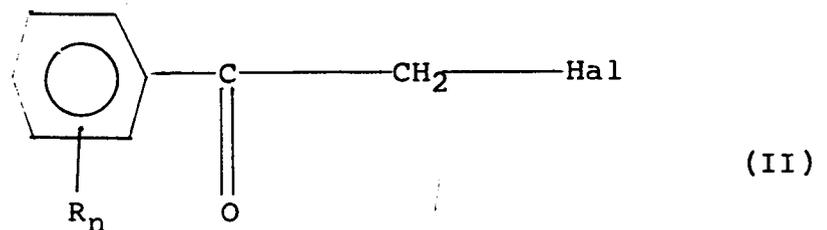
in welcher

R für Fluor, Chlor, Brom, Nitro und Cyano steht, ferner für Alkyl und Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, für Alkoxy und Alkylthio mit 1 bis 2 Kohlenstoffatomen sowie für Halogenalkyl mit bis zu 2 Kohlenstoff- und bis zu 3 Halogenatomen steht, außerdem für Phenyl oder Phenoxy steht, wobei diese beiden Reste substituiert sein können durch Halogen, Cyano, Nitro sowie Halogenalkyl mit bis zu 2 Kohlenstoff- und bis zu 3 Halogenatomen.

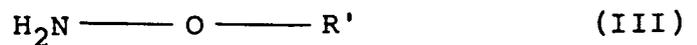
R' für Alkyl, Alkenyl und Alkinyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen und für Cycloalkylalkyl mit 5 bis 7 Kohlenstoffatomen im Cycloalkylteil und 1 bis 2 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht, wobei der Cycloalkylteil gegebenenfalls durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiert sein kann, sowie für Benzyl oder Styryl

steht, wobei die beiden genannten Reste substituiert sein können durch Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Phenyl, Phenoxy und Halogenalkyl mit bis zu 2 Kohlenstoff- und bis zu 3 Halogenatomen, n für die Zahlen 1 oder 2 steht und Hal für Chlor oder Brom steht.

2. Verfahren zur Herstellung von  $\omega$ -Halogen-acetophenon-oximethern der Formel I in Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man  $\omega$ -Halogen-acetophenone der Formel

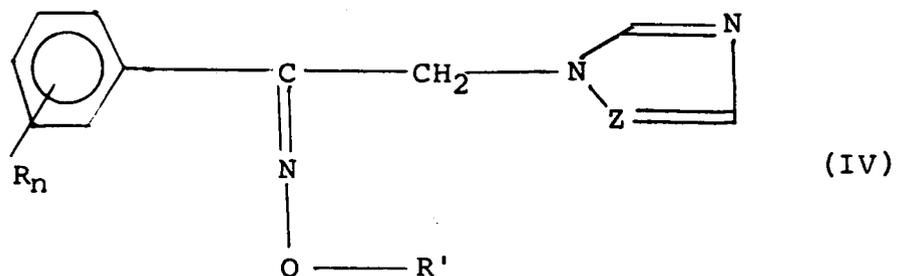


in welcher Hal, R und n die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben, mit substituierten Hydroxylaminen der Formel



in welcher R' die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung hat, in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

3. Verwendung von  $\omega$ -Halogen-acetophenon-oximethern der Formel I in Anspruch 1 als Zwischenprodukte zur Herstellung von weitgehend bekannten  $\omega$ -Azolyl-acetophenon-oximethern der allgemeinen Formel



in welcher R, R' und n die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung besitzen und Z für die CH-Gruppe oder ein Stickstoffatom steht, dadurch gekennzeichnet, daß man die  $\omega$ -Halogen-acetophenon-oximether der Formel I in Anspruch 1 mit Azolen der Formel



in welcher Z die obenangegebene Bedeutung hat, in Gegenwart eines Säurebindemittels und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

II. Gegen die Erteilung des Europäischen Patents hat die Einsprechende Einspruch eingelegt und den Widerruf des Patents wegen mangelnder erfinderischer Tätigkeit beantragt. Die Begründungen wurden auf neue Entgegnungen, unter anderem auf Dokumente

- (1) DE-A-2 657 578 (SIEGFRIED AG)
- (2) DE-A-2 723 942 (BAYER AG)
- (3) DE-A-2 613 167 (BAYER AG)
- (4) Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, 4. Auflage, Bd. 10/4, Seiten 73/74 (1968)
- (5) Troxler et al., Helv.Chim.Acta, Bd. 51, S. 1616 ff. (1968)
- (6) Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, 4. Auflage, Bd. 10/1, Seiten 1181 und 1183 (1971)
- (7) Mixich, Thiele, Arzneim.-Forschung, Bd. 29 (II), S. 1510 ff. (1979)

- (8) Beilstein, 4. Aufl., Hauptwerk, Bd. 7, S. 282 (1925)  
(9) DE-A-2 431 407 (BAYER AG)  
(10) Godefroi et. al. J. Med. Chem., Bd. 12, S. 784 - 791  
(1969)  
gestützt.

- III. Durch Entscheidung vom 29. Februar 1984 (Mündliche Verhandlung) hat die Einspruchsabteilung den Einspruch zurückgewiesen. Die Zurückweisung wurde im wesentlichen damit begründet, daß es nicht notwendig sei, daß die Weiterverarbeitung der Zwischenprodukte (I) zu den bekannten Endprodukten (IV) auf erfinderischer Tätigkeit beruhe. Es komme lediglich darauf an, ob das neue Gesamtverfahren, bei dem die Zwischenprodukte (I) verwendet werden, auf erfinderischer Tätigkeit beruhe.

Das bekannte Verfahren nach der Literatur könnte das Endprodukt durch eine Azolierung und dann eine Reaktion mit Hydroxylamin nur in einer Gesamtausbeute von 60% herstellen. Sollte die Reaktion mit Hydroxylaminether statt Hydroxylamin durchgeführt werden, seien die Erwartungen noch schlechter (40%). Dagegen betrage die Ausbeute des patentgemäßen Verfahrens rund 84%. Eine solche Ausbeutesteigerung sei für den Fachmann nicht vorhersehbar gewesen, weil die Einsprechende keinen Stand der Technik genannt hat, der entweder für die Einzelschritte oder für das Gesamtverfahren bessere Ausbeuten ermitteln lasse.

- IV. Gegen diese Entscheidung hat die Einsprechende am 29. Juni 1984 formgerecht Beschwerde erhoben und diese am 9. Oktober 1984 begründet. Nach einem Zwischenbescheid der Kammer fand eine mündliche Verhandlung am 21. August 1986 statt.

V. Zur Begründung führte die Beschwerdeführerin (Einsprechende) letztlich folgendes aus:

- (a) Die Einspruchsabteilung sei von der Entscheidung "Bis-epoxyäther/BASF" (T 22/82, AB1 9/1982, 341) ausgegangen und habe festgestellt, daß die als erfinderrisch angesehene Leistung in der Auffindung des Gesamtverfahrens zu sehen sei. Im gegebenen Fall sei dies jedoch nicht beansprucht worden. Die genannte Entscheidung sei im vorliegenden Fall auch nicht anwendbar, weil dort das Zwischenprodukt selbst unerwartete vorteilhafte Eigenschaften zeige.
- (b) Die angeblich niedrige Ausbeute im Vergleich der verschiedenen Entgegenhaltungen mit den entsprechenden Verfahrensstufen nach dem Patent, sei hier nicht maßgeblich. Beispiele in Patenten seien im allgemeinen nur Illustrationen von Möglichkeiten, aber keine entwickelten "technischen" Maßnahmen. Letztlich hänge die "Ausbeute" eines chemischen Verfahrens von dem handwerklichen Geschick des Fachmanns ab. Es sei naheliegend gewesen, diese Methoden für den hier verfolgten Zweck anzuwenden.

VI. Die Beschwerdegegnerin (Patentinhaberin) tritt diesem Vorbringen entgegen. Sie vertritt die Auffassung, daß es nicht notwendig sei, das Gesamtverfahren in Anspruch zu nehmen. Es ergebe sich zwanglos aus den Ansprüchen. Die Vorteile, die der Verfahrensweg über die Zwischenprodukte aufweise, seien unbestritten und wesentlich. Auch Stufe 2 des Gesamtverfahrens weise eine völlig unerwartete Verbesserung der Ausbeuten im Vergleich mit den zitierten Kondensationsreaktionen der verschiedenen Azole mit Acetophenonderivaten auf.

- VII. Die Beschwerdeführerin beantragt die Aufhebung der angefochtenen Entscheidung und den Widerruf des europäischen Patents. Die Beschwerdegegnerin beantragt nach Hauptantrag die Beschwerde zurückzuweisen. Nach erstem Hilfsantrag beantragt sie, den Anspruch 3 unter Einbeziehung der Herstellungsstufe zu beschränken, und nach zweitem Hilfsantrag, den Patentanspruch 3 entfallen zu lassen.

#### Entscheidungsgründe

1. Die Beschwerde entspricht den Erfordernissen von Artikeln 106 bis 108 und Regel 64 EPÜ; sie ist daher zulässig.
2. Die geltenden Patentansprüche sind in formeller Hinsicht nicht zu beanstanden, weil sie ihre Stütze in den ursprünglichen Unterlagen finden.
3. Anspruch 1 ist auf bestimmte substituierte  $\omega$ -Halogenacetophenon-oximether gerichtet. Diese sind für die Herstellung bekannter substituiertes  $\omega$ -Azolyl-acetophenon-oximether durch Azolierung geeignet (vgl. Verwendungsanspruch 3). Im Hinblick auf diese Reaktivität ist eigentlich die Entgegenhaltung (9) der nächstkommende Stand der Technik, weil dort ein 2,4-chlor-substituiertes  $\omega$ -Brom-acetophenon mit 1,2,4-Triazol in einer Ausbeute von 60% der Theorie kondensiert wird. Die technische Aufgabe war es daher im Hinblick auf diese Technik die Kondensation mit einem Azol wesentlich zu verbessern. Die Lösung der Aufgabe besteht in der Bereitstellung der beanspruchten Zwischenprodukte und in deren Verwendung für die Herstellung bekannter Azol-Derivate.
4. Die erfindungsgemäße Reaktion von 2,4-Chloro-acetophenon-oxim-O-methylether mit 1,2,4-Triazol bringt eine Ausbeute

von 84% (Berechnung nach S. 11, Z. 9-11 und S. 10, Z. 29-31), was wesentlich besser ist als die entsprechende Azolierung des identisch substituierten Ketons gemäß (9), Beispiel 3, S. 29 (60%). Obwohl andere Beispiele gemäß (10) auch nur Ausbeuten von 58 bis 77% aufweisen, verwenden diese Kondensationen Imidazol, d.h. ein Diazol statt einem Triazol. Der Ansicht der Beschwerdeführerin, daß Vergleiche dieser Art unzulässig seien, weil Beispiele im Stand der Technik nur erste Versuche und keine entwickelten Verfahren darstellen, kann nicht zugestimmt werden. Ohne besonderen Anlaß die veröffentlichten Beispiele zu bezweifeln, würde der Fachmann diese als seinen tatsächlichen Ausgangspunkt betrachten. Es ist daher glaubhaft, daß die technische Aufgabe tatsächlich gelöst wird. Die Auslegung einer Lehre einer Entgeghaltung ist auf deren tatsächlichen Offenbarungsgehalt im Sinne einer fertigen konkreten technischen Regel abzustellen (vgl. "Spiroverbindungen/CIBA-GEIGY", T 181/82, ABl 9/1984, 401 auf Seite 411, Punkt 8, oder T 68/83, 21.03.1986, Seite 11).

Da die beanspruchten Zwischenprodukte unbestritten neu sind, gilt dasselbe für ihre Herstellung und Verwendung gemäß Ansprüchen 2 und 3.

5. Es ist zu untersuchen, ob die Bereitstellung der Zwischenprodukte auf erfinderischer Tätigkeit beruht. Die Frage ist, ob es für den Fachmann naheliegend war, eine bessere Kondensation von ~~4~~-Halogen-substituierten Acetophenon-Derivaten zu erwarten, wenn der Keton erst in einem O-substituierten Oxim umgewandelt wird. Die Beschwerdeführerin hat selber eingeräumt, daß der Fachmann eine Reaktionsbegünstigung aufgrund des Austausches der Oxogruppe durch eine Oximgruppe nicht mit Sicherheit

erwarten konnte. Obwohl die erstgenannte Gruppe die Reaktionsfähigkeit der  $\beta$ -Methylengruppe möglicherweise erhöhen konnte, läßt sich aus dem allgemeinen Fachwissen keine Vermutung über den Einfluß der Oximgruppe unter den Umständen der Reaktion gewinnen. Es war dem Fachmann auch bekannt, daß der Ersatz von Diazol durch Triazole ein Ausbeuteverringern verursacht (vgl. (9) mit Verbindung 3, in Tabelle 1, S. 785 (10)), so daß er irgendeine Verbesserung mit Triazolen nicht erwarten konnte. Im Gegensatz zu dieser Erwartung sind die Ergebnisse mit diesem Reagenten überraschend besser geworden.

6. Die Verwendung der Zwischenprodukte selbst gemäß Anspruch 3 weist einen günstigen, unerwarteten "Verfahrenseffekt" auf (vgl. "Bis-epoxyäther/BASF" Entscheidung, S. 346, Punkt 7). Die Struktur des Zwischenprodukts spielt eine unmittelbare Rolle in dieser Reaktion und die strukturelle Andersartigkeit der Verbindung manifestiert sich in einer wertvollen Wirkung (a.a.o. S. 345, Punkt 6). Das Verfahren und auch das neue Mittel dafür beruhen daher auf erfinderischer Tätigkeit, die nicht von der etwaigen Gewährbarkeit des Gesamtverfahrens hergeleitet wird. Ein solches Gesamtverfahren braucht daher nicht in Anspruch genommen werden. Obwohl das Herstellungsverfahren auch selbst aufgrund eigener Effekte und Vorteile erfinderisch sein könnte, ist Anspruch 2 schon wegen der Patentfähigkeit der Produkte selbst gewährbar, selbst wenn es um ein sog. Analogieverfahren ginge.
7. Ein Gesamtverfahren kann aufgrund der Kombination allein erfinderisch sein, ohne daß es irgendwelche patentierbare Teilstufen erhalten würde. Andererseits kann der erfinderische Charakter des Ganzen auf mindestens einem erfinderischen Teil beruhen. Im gegebenen Fall hat die

Einspruchsabteilung die erfinderische Tätigkeit für das Gesamtverfahren anerkannt und dann daraus die Patentierbarkeit der Teile als zwangsläufig abgeleitet. Die Kammer vertritt jedoch die Ansicht, daß alle formell und im Wesen unabhängigen Anspruchskategorien unter Berücksichtigung der eigenen Aufgabe und erzielten Effekte (Wirkungen) zu beurteilen sind.

8. Es gibt keinen Zweifel daran, daß auch das Gesamtverfahren als eine Kombination gegenüber dem eigenen nächstliegenden Stand der Technik (d.h. das bekannte Gesamtverfahren nach Azolierung und Oximbildung gemäß DE-A- 2 723 942 und DE-A-2 723 942) erfinderisch ist. Das gilt unbeschadet der oben geäußerten Auffassung der Kammer, daß die 2. Stufe schon allein patentfähig ist. Der Vergleich der Gesamtverfahren weist eine wesentliche, unerwartete Ausbeuteerhöhung auf (vgl. Patentschrift S. 11, Z. 15 bis S. 12, Z. 11 einerseits, und S. 10, Z. 13 bis S. 11 Z. 12 andererseits). Trotz des einfachen Austausches der Azolierung durch die Oximbildung ist das Gesamtverfahren erfinderisch, weil es nicht darum geht, ob der Fachmann die Möglichkeit der Reaktionsstufen hätte vorsehen können, sondern darum, ob er dies in Erwartung einer Verbesserung oder eines Vorteils auch getan hätte (vgl. Simethicon-Tablette/RIDER, T 2/83, ABl. 6/1984, 265, Leitsatz II).
9. Jedoch kann die Patentierbarkeit der Zwischenprodukte im vorliegenden Fall nicht automatisch auf Grund der a.a.O. erwähnten "Bis-epoxyäther/BASF" Entscheidung anerkannt werden. In dieser Sache bestand keine unmittelbare Vergleichsmöglichkeit mit einem bekannten Mehrstufenverfahren. Statt quantitativem Vergleich mit analogen Reaktionsstufen, mußte die qualitative Besonderheit der Zwischenprodukte in Betracht gezogen werden. Jedoch wurde

die Verwendung der neuen eigenartigen Zwischenprodukte als erfinderisch anerkannt (a.a.O., S. 350, Punkt 15). In jenem Fall haben die Zwischenprodukte gerade wegen ihrer "strukturellen Andersartigkeit" und die dadurch manifestierte "Wirkung" für die zweite Stufe des Gesamtverfahrens einen erfinderischen Beitrag gegeben (S. 345, Punkt 6). Ohne diesen wäre das vorteilhafte Gesamtverfahren nicht denkbar gewesen (S. 341, Leitsatz 1, zweiter Absatz).

10. In dem hier zu entscheidenden Fall sind die Gesamtverfahren sowohl im Ganzen wie in ihren Teilabschnitten quantitativ vergleichbar. Ob hier die Zwischenprodukte auch selbst patentfähig sind, hängt ab von ihrem Beitrag zu dem quantitativen Effekt, den sie selbst in der Azolierungsstufe verursachen. Die Kammer hat keinen Zweifel daran, daß der quantitative Erfolg auf die Zwischenprodukte zurückgeht, so daß ihre Patentierung gerechtfertigt erscheint.

Teile eines patentfähigen Gesamtverfahrens sind nicht automatisch für sich patentierbar. Andernfalls könnten auch nicht erfinderische neue Produkte eines erfinderischen Verfahrens als Zwischenprodukte durch eine einfache Ergänzung des Verfahrens mit einer trivialen Weiterverarbeitungsstufe zu einem "Gesamtverfahren" patentfähig gemacht werden. Es ist daher die Auffassung der Kammer, daß ein neues chemisches Zwischenprodukt nicht allein deshalb erfinderisch wird, weil es im Laufe eines erfinderischen Mehrstufenverfahrens hergestellt und zu einem bekannten Endprodukt weiterverarbeitet wird. Dazu bedarf es zusätzlicher Überlegungen, wie z.B., daß das Verfahren zur Herstellung des neuen Zwischenproduktes erstmals in erfinderischer Weise dessen Herstellung ermöglichte und andere Wege zu seiner Herstellung aus-

geschlossen schienen (vgl. etwa die Sachlage im Falle "Zeolithe/BASF, T 219/83, ABl. 7/1986, 211, 220 insbesondere Abs. 11 und 12). Jedenfalls ist ein solches Produkt aber dann patentierbar, wenn seine Weiterverarbeitung, wie hier, erfinderisch ist (im Anschluß an "Bis-epoxyäther/BASF", T 22/82).

### Entscheidungsformel

Aus diesen Gründen wird entschieden:

Die Beschwerde wird zurückgewiesen.

Der Geschäftsstellenbeamte:



Der Vorsitzende:



g/g 2/11