

A		B		C	X
---	--	---	--	---	---

Aktenzeichen: T 636/91 - 3.3.2

Anmeldenummer: 85 109 289.0

Veröffentlichungs-Nr.: 0 166 462

Bezeichnung der Erfindung: Fungizide Mittel

Klassifikation: A01N 43/653

E N T S C H E I D U N G

vom 31. März 1993

Anmelder: BAYER AG

Stichwort: Fungizide/BAYER

EPÜ Artikel 56

Schlagwort: "Erfinderische Tätigkeit - Hauptantrag (nein)-
Anregung im Stand der Technik" -
"Erfinderische Tätigkeit - Hilfsantrag (ja) - Auswahl"



Aktenzeichen: T 636/91 - 3.3.2

ENTSCHEIDUNG
der Technischen Beschwerdekammer 3.3.2
vom 31. März 1993

Beschwerdeführer: BAYER AG
Bayerwerk
W - 5090 Leverkusen 2 (DE)

Vertreter: H. Düvel
c/o BAYER AG
Konzernverwaltung
Patente Konzern
W - 5090 Leverkusen 1

Angefochtene Entscheidung: Entscheidung der Prüfungsabteilung des
Europäischen Patentamts vom 19. März 1991, mit
der die europäische Patentanmeldung
Nr. 85 109 289.0 aufgrund des Artikels 97 (1) EPÜ
zurückgewiesen worden ist.

Zusammensetzung der Kammer:

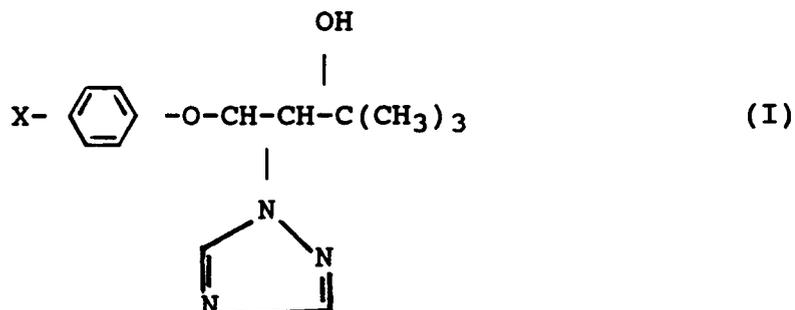
Vorsitzender: P.A.M. Lançon
Mitglieder: L. Galligani
E.M.C. Holtz

Sachverhalt und Anträge

- I. Die am 5. September 1983 eingereichte und unter der Nr. 0 166 462 veröffentlichte europäische Patentanmeldung Nr. 85 109 289.0 wurde mit Entscheidung der Prüfungsabteilung vom 19. März 1991 zurückgewiesen.

Der Entscheidung lag der am 29. November 1989 vorgelegte Anspruchsatz (Ansprüche 1 bis 4) zugrunde. Anspruch 1 lautet wie folgt:

" Fungizide Mittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an einer Wirkstoffkombination aus einem 1,2,4 -Triazolyl-alkanol der Formel

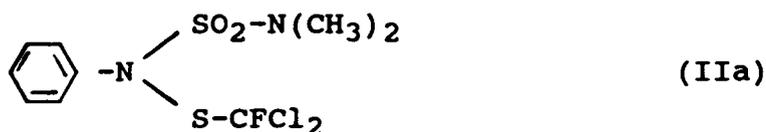


in welcher

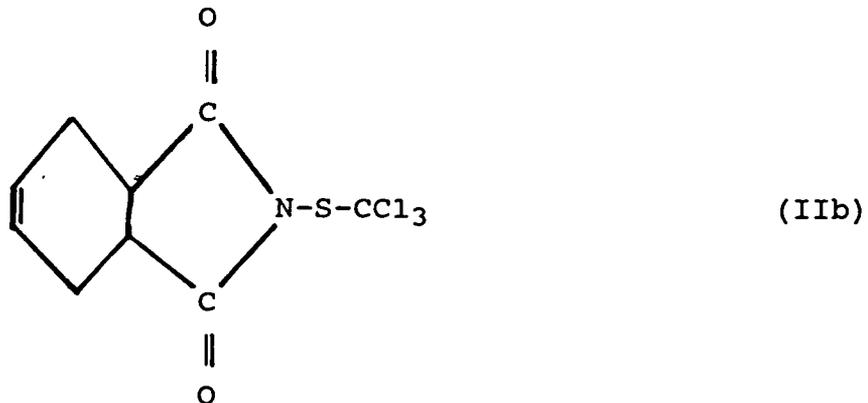
X für Chlor oder für Phenyl steht,

und

(A) einem Polyhalogenalkylthio-Derivat der Formel



oder



wobei in der Wirkstoffkombination das Gewichtsverhältnis von 1,2,4 -Triazolyl-alkanolen zu den Wirkstoffen aus der Wirkstoffklasse (A) zwischen 1:0.5 und 1:50 liegt".

Nachstehend werden die folgenden, üblichen Kurzbezeichnungen für die vom obengenannten Anspruch 1 gedeckten chemischen Verbindungen verwendet:

"Triadimenol" für die Verbindung der Formel I, in der X=Cl;

"Bitertanol" für die Verbindung der Formel I, in der X=Phenyl;

"Dichlofluanid" für die Verbindung der Formel IIa;

"Captan" "Captan" für die Verbindung der Formel IIb.

II. Die Anmeldung wurde mit der Begründung zurückgewiesen, daß der Gegenstand der Ansprüche, insofern er sich auf Wirkstoffkombinationen mit "Triadimenol" beziehe, im Hinblick auf die folgenden Entgegenhaltungen nicht auf

einer erfinderischen Tätigkeit im Sinne des Artikels 56 EPÜ beruhe:

- (1) FR-A-2 332 707;
- (2) US-A-3 912 752;
- (3) US-A-3 952 002.

In ihrer Entscheidung bezog sich die Prüfungsabteilung auf die Entgegenhaltung (1) als nächstliegenden Stand der Technik.

In (1) werden synergistische Fungizid-Mischungen eines 1,2,4 Triazolyl-Derivats, unter dessen allgemeinen Formel auch die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel I fallen, mit u. a. einem Polyhalogenalkylthio-Derivat (z. B. einer Verbindung der Formel IIa oder IIb) offenbart.

Die Prüfungsabteilung führte aus, daß in den Ausführungsbeispielen von (1) spezifische, synergistische Wirkstoffkombinationen mit fungiziden Eigenschaften von "Triadimefon" mit "Dichlofluanid" (IIa) oder "Captan" (IIb) beschrieben würden. "Triadimefon" unterscheide sich von dem erfindungsgemäßen "Triadimenol" nur durch den Ersatz der Ketogruppe durch eine Alkoholgruppe. Da in der genannten Entgegenhaltung (1) sowohl die 1,2,4 -Triazolylketon- als auch die 1,2,4 -Triazolylalkanol-Derivate bevorzugt würden, sei es für den Fachmann naheliegend, bei der Optimierung der in (1) beschriebenen Mischungen aus den dort genannten Wirkstoffen diejenigen auszuwählen, von denen er die höchste Wirkung erwarten könne.

Im Laufe des Prüfungsverfahrens reichte die Beschwerdeführerin Vergleichsversuche ein, die die bessere fungizide Wirksamkeit der erfindungsgemäßen Mischungen, insbesondere

der Mischungen von "Triadimenol" mit entweder "Dichlofluanid" (IIa) oder "Captan (IIb), gegenüber den ähnlichsten vorbekannten Wirkstoffkombinationen zeigen.

Jedoch entschied die Prüfungsabteilung, mit Bezug auf die Entscheidung T 191/86 vom 23. Juni 1988 (im Amtsblatt nicht veröffentlicht), der erhöhte synergistische Effekt könne die erfinderische Tätigkeit des Anmeldungsgegenstandes nicht stützen, da dieser für den Fachmann nicht überraschend sei. In der Tat sei aus den Vergleichsversuchen der Entgegenhaltungen (2) und (3) klar ersichtlich, daß "Triadimenol" dem "Triadimefon" bezüglich fungizider Wirksamkeit überlegen sei. Auf Grund dieser überlegenen Wirkung erwarte der Fachmann, der durch (1) schon angeregt werde, 1,2,4 -Triazolylketon- und 1,2,4 -Triazolylalkanol-Derivate in synergistischen Mischungen zu bevorzugen, daß die Wirkung der erfindungsgemäßen "Triadimenol"-enthaltenden Kombinationen gegenüber den nächstliegenden, "Triadimefon"-enthaltenden Kombinationen gemäß (1) höher sein würde.

In ihrer Entscheidung bejahte die Prüfungsabteilung die Patentierbarkeit der Mischungen von "Bitertanol" mit entweder "Dichlofluanid" (IIa) oder "Captan" (IIb) mit der Begründung, es seien für "Bitertanol" keine Vorteile gegenüber der entsprechenden in (1) genannten Keto-Verbindung vorbekannt gewesen.

- III. Die Beschwerdeführerin hat Beschwerde eingelegt und die Beschwerdegebühr entrichtet.
- IV. Eine mündliche Verhandlung fand am 31. März 1993 statt. Während der mündlichen Verhandlung reichte die Beschwerdeführerin hilfsweise einen auf die Kombination von

"Bitertanol" mit entweder "Dichlofluanid" (IIa) oder "Captan" (IIb) eingeschränkten Anspruch 1 sowie eine daran angepaßte Beschreibung ein. Weitere Vergleichsversuche und Vergleichstabellen wurden ebenfalls vorgelegt.

V. Die von der Beschwerdeführerin vorgebrachten Argumente lassen sich wie folgt zusammenfassen:

- a) Bei dem beanspruchten Gegenstand handle es sich um eine typische Auswählerfindung, da für den Fachmann bei der Suche nach neuen synergistischen Wirkstoffkombinationen mit fungiziden Eigenschaften in der großen Zahl der in (1) angegebenen möglichen Mischpartner eine Mehrzahl gedanklicher Schritte erforderlich sei (siehe auch T 296/87, ABl. 1990, 195).
- b) Einige Optimierungsversuche allein würden dafür nicht genügen.
- c) Auch wenn von allen in (1) offenbarten Mischungen eine synergistische Wirkung zu erwarten sei, so könne die durch die eingereichten Versuchsberichte belegte, peakartige Aktivitätserhöhung der erfindungsgemäßen Kombination und das Ausmaß der Überlegenheit gegenüber den konstitutionell ähnlichsten Kombinationen nicht vorausgesagt werden. Der Fachmann könne eine synergistische Wirkung, geschweige denn eine überadditive synergistische Wirkung der Fungizidmischungen nicht voraussehen.
- d) Obwohl die in (1) bis (3) enthaltenen Angaben keineswegs in Zweifel gezogen würden, würden sie nicht den von der Prüfungsabteilung gezogenen Schluß erlauben, "Triadimenol" sei dem Triadimefon bezüglich der fungiziden Eigenschaften überlegen. Erstens seien

"Triadimefon" und "Triadimenol" in keinem der in (2) und (3) angegebenen Beispiele direkt verglichen worden. Zweitens zeige - wie aus den während der mündlichen Verhandlung vorgelegten zusammenfassenden Tabellen ersichtlich sei - "Triadimenol" manchmal eine bessere, manchmal eine schlechtere, manchmal die gleiche Wirkung als "Triadimefon".

- e) Die Kriterien, die in der Entscheidung T 191/86 zur Zurückweisung führten, seien im vorliegenden Fall nicht relevant. Eher sei der beanspruchte Gegenstand auch im Hinblick auf die durch die Entscheidung T 296/87 gesetzten Maßstäbe als erfinderisch anzusehen.

VI. Die Beschwerdeführerin beantragte die Aufhebung der angefochtenen Entscheidung und die Erteilung eines Patents auf der Grundlage der von der Prüfungsabteilung zurückgewiesenen Patentansprüche 1 bis 4 oder, hilfsweise, auf der Grundlage des während der mündlichen Verhandlung vorgelegten Anspruchs 1 mit den von der Prüfungsabteilung zurückgewiesenen Ansprüchen 2 bis 4.

Entscheidungsgründe

1. Die Beschwerde ist zulässig.
2. Die Formulierung der Ansprüche gemäß dem Hauptantrag als auch gemäß dem Hilfsantrag ist in formeller Hinsicht nicht zu beanstanden (Art. 123 (2) EPÜ). In beiden Fällen handelt es sich um ursprünglich offenbarte, ausdrücklich bevorzugte Wirkstoffkombinationen (siehe ursprüngliche Beschreibung, Seiten 3 - 4).

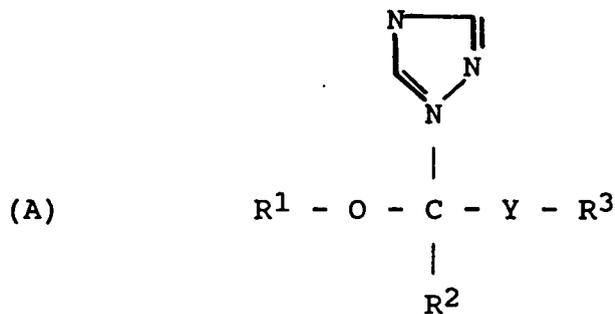
3. In der angefochtenen Entscheidung wurde der Gegenstand der Ansprüche 1 bis 4 als neu anerkannt. Die Kammer sieht keinen Grund bezüglich des Hauptantrags oder des Hilfsantrags hierzu vom Amts wegen (Art. 114 (1) EPÜ) Ermittlungen anzustellen.

4. Hauptantrag

Zu klären ist die Frage, ob der Gegenstand der Ansprüche die in Art. 56 EPÜ geforderte erfinderische Tätigkeit aufweist.

- 4.1 Wie bereits die Prüfungsabteilung angenommen und die Beschwerdeführerin zugestanden hat, ist die Entgeghaltung (1) der nächstliegende Stand der Technik.

In (1) werden synergistische Wirkstoffkombinationen mit fungiziden Eigenschaften offenbart, bestehend aus einem 1,2,4-Triazolyl-Derivat mit allgemeiner Formel (A)



worin als Substituenten in R^1 = Phenyl, das vorzugsweise durch Fluor, Chlor, Nitro, Trifluormethyl, Methyl, Methoxy oder Phenyl substituiert sein kann, in R^2 = H, in R^3 = geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Phenyl oder 4-Chlorphenyl, und in

Y = CO oder CH(OH) bevorzugt werden (siehe Seite 2, Zeilen 12 - 28 und Seite 5, Zeilen 4 - 12), und u. a. einem Polyhalogenalkylthio-Derivat (z. B. "Dichlofluanid", "Captan", vgl. Seite 3, Zeilen 7 - 19 und Seite 6, Zeilen 14 - 19).

Das Gewichtsverhältnis von 1,2,4-Triazolyl-Derivat zu dem Wirkstoff aus der anderen Klasse liegt zwischen 1 : 0,1 - 500, vorzugsweise zwischen 1 : 0,2 - 200 (Seite 10, Zeilen 4 - 9).

Die fungizide Wirkung der in (1) offenbarten Wirkstoffkombinationen ist wesentlich höher als die Wirkung der Einzelkomponenten und auch als die Summe der Einzelkomponenten (siehe Seite 4, Zeilen 21 - 24). In den Ausführungsbeispielen in (1) werden u. a. auch spezifische Wirkstoffkombinationen von "Triadimefon" [Verbindung der Formel (A), worin $R^1 = \text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-$; $R^2 = \text{H}$; $R^3 = -\text{C}(\text{CH}_3)_3$ und $Y = -\text{CO}$] mit entweder "Dichlofluanid" oder "Captan" offenbart. Deren tatsächliche synergistische Wirkung wird in den Tabellen A und B aufgezeigt.

- 4.2 Der vorliegenden Patentanmeldung liegt im Hinblick auf (1) die technische Aufgabe zugrunde, Wirkstoffkombinationen mit höherer fungizider Wirkung bereitzustellen.

Zur Lösung dieser Aufgabe werden in Anspruch 1 die Kombinationen aus einem Wirkstoff mit Formel I und einem Wirkstoff mit Formel IIa oder IIb vorgeschlagen.

Obwohl in der vorliegenden Beschreibung keine Testergebnisse angegeben werden, hat die Beschwerdeführerin im Laufe des Verfahrens durch Vergleichsversuche überzeugend nachgewiesen, daß die beanspruchten Wirkstoffkombinationen die zugrundeliegende Aufgabe tatsächlich lösen, da sie

eine deutliche Überlegenheit gegenüber den konstitutionell ähnlichsten Kombinationen gemäß (1) aufweisen.

- 4.3 Hier stellt sich die Frage, ob der Fachmann bei der Suche nach besseren Wirkstoffkombinationen im Hinblick auf (1) eine Auswahl bzw. eine erfinderische Auswahl aus einem sehr umfangreichen Bereich treffen mußte, um ein fungizides Mittel gemäß Anspruch 1 zu erzielen.

Dokument (1) stellt für den Fachmann einen Arbeitsrahmen dar. Aus der großen Zahl der darin angegebenen möglichen Wirkstoffkombinationen läßt sich kein Vorurteil gegen bestimmte Kombinationen von Mischpartnern, geschweige denn gegen bestimmte Kombinationen von bevorzugten Mischpartnern ableiten.

In seinem Bemühen, die zugrundeliegende Aufgabe zu lösen, würde der Fachmann, von (1) ausgehend, in erster Linie versuchen, die in den Beispielen beschriebenen Wirkstoffkombinationen zu verbessern. Das trifft vor allem für die in den Beispielen A und B angegebenen Kombinationen auf Basis von "Triadimefon", insbesondere die Kombinationen mit "Dichlofluanid" (IIa) oder "Captan" (IIb), zu.

Da nach (1) (siehe Seite 5, Zeilen 11 - 12) die bevorzugten Substitutionen CO und CH(OH) für Y in der Formel A als gleichwertig anzusehen sind, müßte der Fachmann, im Hinblick auf die genannten Beispiele, fungizide Mischungen auf Basis von Triazolyl-Carbinolen [Y = CH(OH)] oder von Triazolyl-Ketonen (Y = CO) *prima facie* als äquivalent und, auf alle Fälle, ebenfalls als bevorzugt betrachten.

Bei der Suche nach besseren Mischungen läßt der Fachmann selbstverständlich die Berichte über eine bessere oder schlechtere fungizide Wirkung der in (1) genannten Wirkstoffe nicht außer Acht.

Da in (2) und (3) Testergebnisse über die fungizide Wirkung von Triazolyl-Ketonen bzw. Triazolyl-Carbinolen offenbart werden, berücksichtigt der Fachmann sie ohne weiteres. Obwohl in keinem der in (2) und (3) angegebenen Beispiele "Triadimefon" und "Triadimenol" direkt verglichen werden, würde der Fachmann durch die jeweiligen Vergleichsversuche mit dem gleichen Referenzwirkstoff "1-Trityl-1,2,4 Triazol" deutlich erkennen, daß "Triadimenol" dem "Triadimefon" bezüglich fungizider Wirkung überlegen ist. In den meisten Versuchen weist "Triadimenol" bei vergleichbaren oder niedrigeren Konzentrationen eine bessere Wirkung auf [vgl. Tabellen 1 - 4 in (2) mit den Tabellen 2, 4, 7 in (3)]. In dem Fall, in dem "Triadimenol" genauso gut wie "Triadimefon" wirkt, ist "Triadimenol" bei einer erheblich niedrigeren Konzentration wirksam [vgl. Tabelle 5 in (2) mit der Tabelle 3 in (3)].

Deswegen ist die Kammer, in Übereinstimmung mit der Entscheidung der Prüfungsabteilung, der Auffassung, daß der Fachmann, von (1) ausgehend, in naheliegender Weise zu einem fungiziden Mittel auf Basis von "Triadimenol" mit entweder "Dichlofluanid" (IIa) oder "Captan" (IIb) gelangt wäre, weil er, im Hinblick auf die Testergebnisse in (2) und (3), für diese Kombinationen eine bessere fungizide Wirkung gegenüber der nächstliegenden, "Triadimefon"-enthaltenden Kombinationen erwarten konnte.

Dafür war keine Mehrzahl gedanklicher Schritte erforderlich (siehe Punkt V-a), da, wie oben ausgeführt, der Fachmann bei der Lösung der gestellten Aufgabe in erster Linie von den in (1) bevorzugten Mischpartnern und deren Kombinationen ausgeht. Dabei ist auch nicht die Anzahl der Optimierungsversuche maßgebend (siehe Punkt V-b), sondern die Qualität dieser Versuche. Einerseits war es für den Fachmann auf Grund der verfügbaren Informationen in (1) im vorliegenden Fall ohne weiteres möglich, eine Auswahl in einem engeren Bereich zu treffen; andererseits bekam der Fachmann von der Lehre der Dokumente (2) und (3) eine deutliche Anregung, "Triadimenol" zu versuchen (vgl. T 2/83, ABl., 1984, 265, Punkt 7).

- 4.4 Unter diesen Umständen erübrigt sich die Frage, ob der Fachmann die synergistische Wirkung oder sogar die überadditive synergistische Wirkung voraussehen konnte oder nicht (siehe Punkt V-c); denn er konnte beim Lesen von (1) in Hinblick auf (2) und (3) ohne weiteres eine erhöhte Aktivität für die Kombinationen vom "Triadimenol" mit entweder "Dichlofluanid" (IIa) oder "Captan" (IIb) gegenüber den konstitutionell ähnlichsten Kombinationen gemäß (1) erwarten.
- 4.5 Die Beschwerdeführerin hat während der mündlichen Verhandlung geltend gemacht, daß mindestens in einem Fall, und zwar beim Vergleich der in Tabelle B von (1) angegebenen Wirkung des "Triadimefons" mit der in Tabelle 7 von (3) angegebenen Wirkung des "Triadimenols", gezeigt werde, "Triadimenol" wirke schlechter als "Triadimefon". Nach ihrer Meinung bestätige dies, daß die in (1) bis (3) enthaltenen Angaben nicht den von der Prüfungsabteilung gezogenen Schluß erlauben würden,

"Triadimenol" sei dem Triadimefon bezüglich der fungiziden Eigenschaften überlegen (siehe Punkt V-d). Dazu ist zu bemerken, daß die Angabe in (1) (17 % Befall bei einer "Triadimefon"-Konzentration von 0,00062 % in dem Fusicladium Test) in Widerspruch mit einem Teil der Angaben in (2) steht (26 % Befall bei einer "Triadimefon"-Konzentration von 0,00156 % in dem gleichem Test - siehe Tabelle 3 -).

Jedenfalls kommt, wie schon oben ausgeführt, die Anregung für den Fachmann, "Triadimenol" anstelle von "Triadimefon" in fungiziden Mischungen zu verwenden, aus dem Vergleich der in (2) und (3) angegebenen Daten, nicht aus dem Vergleich der Angaben aus (1) und (3). In (2) und (3) wird die fungizide Wirksamkeit von "Triadimefon" bzw. "Triadimenol" mit der Wirksamkeit desselben Referenzwirkstoffs in verschiedenen Versuchen verglichen. Deswegen sind nur die darin enthaltenen Angaben für den Fachmann von Relevanz.

Daraus ist die Überlegenheit des "Triadimenols" gegenüber "Triadimefon" bezüglich fungizider Wirkung deutlich zu erkennen.

4.6 Folglich ist die Kammer der Auffassung, daß gerade in Hinblick auf die Angaben in (2) und (3) der Fachmann, von (1) ausgehend, in naheliegender Weise ein fungizides Mittel auf Basis von "Triadimenol" gemäß Anspruch 1 erzielt hätte.

4.7 Die Kriterien, die in der Entscheidung T 191/86 zur Zurückweisung führten, sind mutatis mutandis auch in dem vorliegenden Fall von Relevanz.

Die von der Beschwerdeführerin zitierte Entscheidung T 296/87 ist in vorliegendem Fall insofern relevant, als darin entschieden worden ist, eine überlegene Wirkung und das zahlenmäßige Ausmaß der Aktivitätserhöhung könne keine erfinderische Tätigkeit begründen, wenn es für den Fachmann naheliege, in Erwartung der Lösung der bestehenden Aufgabe, d. h. der Erzielung einer erhöhten Aktivität, übliche Versuche anzustellen (siehe Punkte 8.4.1 und 8.4.4).

4.8 Aus diesen Gründen ist für den Hauptantrag das Vorliegen einer erfinderischen Tätigkeit zu verneinen (Art. 56 EPÜ).

5. Hilfsantrag

Wie unter II. ausgeführt (siehe letzten Absatz), hat die Prüfungsabteilung in ihrer Entscheidung die Patentierbarkeit der Mischungen von "Bitertanol" mit entweder "Dichlofluamid" (IIa) oder "Captan" (IIb) anerkannt. Dieser Gegenstand entspricht dem jetzigen Hilfsantrag.

Die Kammer sieht keinen Anlaß den von der Prüfungsabteilung gezogenen Schluß in Frage zu stellen.

Entscheidungsformel

Aus diesen Gründen wird entschieden:

1. Die angefochtene Entscheidung wird aufgehoben.

2. Die Sache wird an die Vorinstanz zurückverwiesen mit der Auflage ein Patent auf Grundlage folgender Unterlagen zu erteilen:

- Anspruch 1: wie in der mündlichen Verhandlung überreicht,
- Ansprüche 2 - 4: wie von der Prüfungsabteilung zurückgewiesen,
- Beschreibung: Beschreibung, wie in der mündlichen Verhandlung überreicht.

Der Geschäftsstellenbeamte:

Der Vorsitzende:

P. Martorana

P.A.M. Lançon