

Prüferbericht - Prüfungsaufgabe A 2012 (Chemie)

Übersetzung des englischen Originaltextes

Bei dieser Aufgabe geht es um Diarylbutadien-Derivate als Filter gegen UV-A-Strahlung. Dem Mandantenschreiben zufolge weisen diese Verbindungen eine verbesserte Fotostabilität auf, insbesondere wenn sie mit UV-B-Filtern kombiniert in Sonnenschutz-Zusammensetzungen eingesetzt werden. Der Mandant stellte außerdem fest, dass die Anwesenheit von mindestens einer $\text{Si}(\text{CH}_3)_3$ -Gruppe wesentlich für ein gutes Stabilitätsprofil ist. Es wird auch betont, dass die Verbindungen des Stands der Technik wasserlöslich sind und deshalb leicht durch Wasser von der Haut entfernt werden, sei es durch Meerwasser oder beim Schwitzen. Wie aus Tabelle 1 hervorgeht, sind Verbindungen, bei denen R_1 für Alkyl mit mindestens 6 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl oder Phenyl steht, öllöslich. Nach [006] haben solche Verbindungen zusätzliche Vorteile, wenn sie in Sonnenschutzmitteln eingesetzt werden.

Im ersten Dokument werden Diarylbutadien-Derivate als Monomere beschrieben, die mit Styrol zu neuen Gummis copolymerisiert werden können, die beständig gegenüber hohen Temperaturen sind. Die in diesem Dokument offenbarte Formel überschneidet sich mit derjenigen des Mandantenschreibens, wenn R_1 für Cycloalkyl oder Phenyl steht. Das Verfahren zur Erzeugung der Monomere ist im Wesentlichen identisch mit dem vom Mandanten beschriebenen. Das Polymerisierungsverfahren läuft in einem Medium ab, das mindestens eine Ölphase umfasst, in der die Monomere angabegemäß löslich sind. Im angegebenen Beispiel umfasst das Reaktionsmedium auch einen Stabilisator.

Das zweite Dokument betrifft Diarylbutadien-Derivate als UV-A-Filter. Es heißt darin, dass diese Verbindungen eine ausgezeichnete Fotostabilität aufweisen. Die Formel überschneidet sich mit derjenigen des Mandantenschreibens, wenn R_1 für unsubstituiertes Alkyl steht. Auch das in dem Dokument beschriebene Verfahren ist identisch mit dem im Mandantenschreiben angegebenen. Die bevorzugten Zusammensetzungen sind ebenfalls Emulsionen, die mindestens eine Ölphase umfassen. Diese Zusammensetzungen sind besonders nützlich in Feuchtigkeitscremes zur täglichen Anwendung.

1. Unabhängige Ansprüche

Für die unabhängigen Ansprüche konnten insgesamt 70 Punkte erzielt werden.

1.1. Anspruch auf eine Verbindung

Bis zu 30 Punkte konnten für den Verbindungsanspruch vergeben werden. Die Ansprüche sollten einen sinnvollen Patentschutz ermöglichen. Dem Mandantenschreiben zufolge wird Schutz für Verbindungen angestrebt, die sich als UV-Filter eignen. Aus dem Schreiben wird deutlich, dass solche Filter fotostabil sein müssen, um ihre Schutzfunktion zu erfüllen. Aus [021], letzter Satz, folgt, dass Verbindungen, die im Fotostabilitätstest mindestens 90 % erreichen, eine angemessene Fotostabilität aufweisen. Wie vom Mandanten hervorgehoben (siehe [025]), wird diese Wirkung nur erzielt, wenn mindestens eine Silylgruppe vorliegt. Die Anwesenheit von mindestens einer $\text{Si}(\text{CH}_3)_3$ -Gruppe ist also ein wesentliches

Merkmal, das in die Markush-Formel aufzunehmen ist. Das Weglassen dieses Merkmals hatte einen Abzug von 15 Punkten zur Folge.

Der Formel (I) im Mandantenschreiben fehlt es an Neuheit gegenüber beiden Dokumenten des Stands der Technik. Das erste Dokument ist neuheitsschädlich, wenn R_1 für Cycloalkyl oder Phenyl steht. Um dem Anspruch Neuheit zu verleihen, muss die Phenylgruppe aus der Definition von R_1 in Formel (I) ausgeklammert werden. Die Neuheit lässt sich nicht dadurch herstellen, dass die Anwesenheit mindestens einer $\text{Si}(\text{CH}_3)_3$ -Gruppe vorgeschrieben wird, denn das Dokument offenbart eine Verbindung, in der R_3 für $\text{Si}(\text{CH}_3)_3$ steht, siehe [006].

Auch ein Disclaimer wäre nicht ausreichend, um einen Anspruch zu formulieren, der neu ist. Das Dokument D1 offenbart nicht nur die einzelne Verbindung (worin R_1 für Phenyl steht, R_2 für Methyl und R_3 für $\text{Si}(\text{CH}_3)_3$), sondern auch 4,4-Diarylbutadien-Derivate der allgemeinen Formel (I), die andere Verbindungen mit einer Phenyl- und einer Silylgruppe umfasst. Die Aufnahme eines Disclaimers in die allgemeine Formel, bei der R_1 auch für ein Cycloalkyl oder Phenyl steht, führt lediglich dazu, dass dieselbe Gruppe von Stoffen beansprucht wird wie in Dokument D1 mit Ausnahme einer einzigen Verbindung. Ein solcher Anspruch ist nicht neu. Es war auch möglich, sowohl die Alkylgruppe mit mindestens 6 Kohlenstoffatomen als auch die Cycloalkylgruppe abzudecken. Innerhalb des mit D1 gemeinsamen Bereichs stellt die Kombination einer Cycloalkylgruppe und einer Silylgruppe eine individualisierte Offenbarung dar, die aus dem Dokument D1 nicht ohne weiteres ableitbar ist. Diese Kombination begründet also die Neuheit gegenüber dem Dokument D1. Für derartige Ansprüche wurde die volle Punktzahl vergeben.

Das zweite Dokument ist neuheitsschädlich, wenn R_1 für Alkyl steht, wie beispielsweise in Verbindung (1) von D2. Aus denselben Gründen wie bei D1 muss der gesamte Überschneidungsbereich aus Formel (I) ausgeklammert werden, um Neuheit herzustellen.

Im Mandantenschreiben heißt es, dass wasserlösliche Sonnenschutzmittel den Nachteil haben, dass sie beim Baden oder Schwitzen leicht abgewaschen werden. In Anbetracht von [006] und Tabelle 1 erscheinen Verbindungen mit "höheren" Alkylestern besonders geeignet, weil sie öllöslich sind, wie aus den Ergebnissen des Öllöslichkeitstests hervorgeht. Solche Verbindungen haben angabegemäß mindestens 6 Kohlenstoffatome in der R_1 -Alkylgruppe ([007]). Nach Tabelle 1 erwies sich eine Verbindung mit einer C_8 -Alkylgruppe als nicht in Öl löslich. Diese Alternative fällt aber nicht unter die Ansprüche, weil ihr die wesentliche $\text{Si}(\text{CH}_3)_3$ -Gruppe fehlt.

Der Begriff "höher" ohne Angabe der Zahl der Kohlenstoffatome wurde für unklar erachtet. Da sich ein unklarer Begriff nicht eignet, um eine Erfindung vom Stand der Technik abzugrenzen, sollte der Begriff "höher" nicht das einzige unterscheidende Merkmal sein. Die Verwendung des Begriffs "höher" als unterscheidendes Merkmal führte zum Abzug von 10 Punkten. 15 Punkte Abzug gab es, wenn R_1 auf die spezifischen Alkylgruppen Hexyl, Heptyl, Octyl oder Decyl beschränkt war.

Jede zusätzliche Beschränkung (z. B. R_1 beschränkt auf C_6 - C_{10} -Alkyl oder Alkyl mit mindestens 7 Kohlenstoffatomen; OH und NH_2 nicht Teil der Definition von R_2 und R_3) führte zu 5 Punkten Abzug.

Bis zu 2 Punkte wurden für unklare Anspruchsformulierungen abgezogen.
Für nicht neue Ansprüche wurden keine Punkte vergeben.

1.2. Anspruch auf eine Verbindung zur Anwendung

Für diesen Anspruch wurden bis zu 10 Punkte vergeben.

Für die Verbindung zur Anwendung in einem Verfahren zum Schutz der Haut vor UV-Strahlung konnte eine breitere Markush-Formel beansprucht werden. Aus Tabelle 1 im Mandantenschreiben und aus D1 ist klar, dass Verbindungen, bei denen R_1 für Cycloalkyl oder Phenyl steht, auch öllöslich und fotostabil sind. Diese Verbindungen lösen also die Aufgabe, Sonnenschutzmittel bereitzustellen, die nicht beim Baden oder Schwitzen von der Haut entfernt werden, und könnten für ihre Anwendung als UV-Filter beansprucht werden. Die Beschränkung auf den begrenzten Verbindungsanspruch führte zu 5 Punkten Abzug.

5 Punkte wurden für das Fehlen der wesentlichen $\text{Si}(\text{CH}_3)_3$ -Gruppe abgezogen.

3 Punkte Abzug gab es für zusätzliche Beschränkungen.

Die Anwendung von Sonnenschutzmitteln ist eine Behandlung des menschlichen Körpers und beinhaltet aufgrund der prophylaktischen Wirkung, die mit der kosmetischen Verwendung untrennbar verbunden ist, stets einen therapeutischen Aspekt. Die Formulierung als Verwendungsanspruch ist deshalb im Hinblick auf Artikel 53 c) problematisch und führte zum Abzug von 2 Punkten.

In diesem Zusammenhang wurde erwartet, dass die Formulierung aus Artikel 53 c) verwendet wird. Die Formulierung "Verbindung zur Verwendung als UV-Filter" wird so ausgelegt, dass der Anspruch auch auf Verbindungen gerichtet ist, die sich als UV-Filter eignen; der Anspruch ist dann nicht neu.

1.3. Anspruch auf eine Zusammensetzung

Bis zu 20 Punkte konnten für den Zusammensetzungsanspruch vergeben werden.

Im Schreiben wird die Anwesenheit von mindestens einer Ölphase als wesentliches Merkmal der Zusammensetzungen genannt, wenn öllösliche Verbindungen verwendet werden ([012], Zeile 4). Der Anspruch sollte entsprechend formuliert sein. 5 Punkte wurden abgezogen, wenn dem Anspruch dieses wesentliche Merkmal fehlte. Die Beschränkung auf Emulsionen war auch akzeptabel, weil dies implizit die Anwesenheit einer Ölphase bedingt. Es impliziert jedoch auch die Anwesenheit von Wasser, was eine zusätzliche Beschränkung darstellt; daher wurden 2 Punkte abgezogen.

Der Mandant teilt außerdem mit, dass die Zusammensetzung weitere Zusatzstoffe enthalten muss. Der bloße Hinweis auf die Anwesenheit weiterer Zusatzstoffe führte jedoch zu keiner neuen Beschränkung. Deshalb mussten spezifische Zusatzstoffe in den Anspruch aufgenommen werden.

D1 bezieht sich nicht ausdrücklich auf eine Zusammensetzung, doch das Verfahren beinhaltet ein Reaktionsmedium, das eine Ölphase und einen Stabilisator umfasst, siehe [005]. Die bloße Beschränkung der Zusammensetzung durch die Anwesenheit einer Ölphase und weiterer Zusatzstoffe wie Stabilisatoren reicht also nicht aus, um die Neuheit gegenüber D1 zu begründen. Eine breitere Markush-Formel, die die Verbindungen von D1 umfasst, kann beansprucht werden, wenn die Zusammensetzung ein Verdickungsmittel und ein Konservierungsmittel beinhaltet, die nicht in D1 offenbart sind. Die Beschränkung auf den begrenzten Verbindungsanspruch führte zu 10 Punkten Abzug. Das Fehlen des Verdickungsmittels oder des Konservierungsmittels führten zu 2 Punkten Abzug.

Der Inhalt der Verbindung der Formel (I) in der Copolymerisationsmischung von D1 wurde nicht ausdrücklich offenbart. Die Auswahl des Teilbereichs 0,02 bis 20 % als unterscheidendes Merkmal wurde nicht als angemessene Beschränkung gewertet und führte zum Abzug von 5 Punkten.

Wie oben erwähnt, richtet sich D2 auch auf kosmetische Zusammensetzungen, die mindestens eine Ölphase umfassen, insbesondere Emulsionen, siehe z. B. [008]. Die Markush-Formel für die Zusammensetzung sollte also dahingehend beschränkt werden, dass R_1 für Alkyl mit mindestens 6 Kohlenstoffatomen steht.

Die Beschränkung auf die spezifische Zusammensetzung von [014] führte zum Ausschluss mehrerer sinnvoller Alternativen. Für derartige Ansprüche wurden bis zu 10 Punkte vergeben.

Abhängig von der Formulierung der Ansprüche und des entsprechenden Teils der Beschreibung würde die Anwesenheit eines Stabilisators zur bevorzugten Zusammensetzung von [014] und zum Ausschluss der Beispiele führen. 5 Punkte wurden abgezogen, wenn die bevorzugten Ausführungsformen vom unabhängigen Zusammensetzungsanspruch nicht abgedeckt waren.

Die Angabe der Konzentration der einzelnen Komponenten der Zusammensetzung sowie jede sonstige Beschränkung führte zu 2 Punkten Abzug.

1.4. Anspruch auf ein Verfahren

Bis zu 10 Punkte konnten für den Verfahrensanspruch erzielt werden. Da D1 wie auch D2 dasselbe Verfahren offenbaren wie das vom Mandanten beschriebene, musste dieser Anspruch auf die Markush-Formel des Erzeugnisanspruchs beschränkt werden.

Zur Durchführung der Reaktion ist die Anwesenheit einer Base notwendig; dies sollte im Anspruch angegeben sein. Das Fehlen dieses wesentlichen Merkmals führte zum Abzug von 5 Punkten.

Alternativ konnte die breitere Markush-Formel der Ansprüche auf eine Zusammensetzung/Verbindung zur Anwendung verwendet werden; in diesem Fall verleiht eine Beschränkung in Bezug auf die Art der Base dem Anspruch Neuheit.

Ansprüche, die auf ein Verfahren zur Herstellung von Verbindungen gerichtet sind, die die gestellte Aufgabe nicht lösen (z. B. wenn Alkyl in R_1 nicht auf Alkyl mit mindestens 6 Kohlenstoffatomen beschränkt ist) wurden weder als einheitlich in

Bezug auf die übrigen unabhängigen Ansprüche noch als erfinderisch angesehen. Für solche Ansprüche wurden 5 Punkte abgezogen.

Für jede zusätzliche Beschränkung des Verfahrensanspruchs, wie etwa die Beschränkung auf einen der spezifischen Verfahrensschritte nach [011], wurden 2 Punkte abgezogen.

Die Punkte für einen unabhängigen Anspruch spiegeln wider, in welchem Umfang der Anspruch die Erfindung des Mandanten schützt. Die Beschränkung eines Anspruchs auf ein Verfahren, das bei 0 °C oder bei Raumtemperatur durchgeführt wird, ist ungeeignet, die Erfindung des Mandanten in ihrem größtmöglichen Umfang zu definieren, und benachteiligt den Mandanten, weil sie den Anspruchsgegenstand beschneidet.

Mängel bei der Klarheit wie etwa das Fehlen der Definition von R führten zu 2 Punkten Abzug.

Ein Verfahrensanspruch zur Herstellung der Zusammensetzung wurde nicht als sinnvoller Anspruch erachtet; für einen solchen Anspruch wurden keine Punkte vergeben.

Prüfungsarbeiten mit mehreren unabhängigen Ansprüchen in derselben Kategorie, die sich auf gleichartige Gegenstände bezogen, erhielten weniger Punkte, weil davon ausgegangen wurde, dass die Erfindung mit einem einzigen unabhängigen Anspruch in jeder Kategorie hinreichend beansprucht werden kann (Regel 43 (2) EPÜ).

2. Abhängige Ansprüche

Für die abhängigen Ansprüche gab es bis zu 15 Punkte. Die folgenden Merkmale boten gute Rückfallpositionen:

- Verbindungen mit $R_2, R_3 = \text{Si}(\text{CH}_3)_3$ (2 Punkte)
- Verbindungen, worin R_1 für $\text{C}_6\text{-C}_{10}$ -Alkyl steht (2 Punkte)
- Zusammensetzung, die außerdem mindestens ein UV-B-Sonnenschutzmittel umfasst (2 Punkte)
- Zusammensetzung in Form einer Emulsion, die außerdem einen Emulgator umfasst (5 Punkte).
Ohne Emulgator wurden nur 2 Punkte vergeben.
- Zusammensetzung in Form einer Wasser-in-Öl-Emulsion (sollte auch einen Emulgator umfassen) (2 Punkte)
- Zusammensetzung mit 2 - 7 Gew.-% UV-Filter der Formel (I), 2 - 7 Gew.-% UV-B-Filter, 0,05 - 1,0 Gew.-% Konservierungsmittel, 4 - 8 Gew.-% Emulgator, 0,1 - 2 Gew.-% Verdickungsmittel, 40 - 60 Gew.-% Ölphase, 15 - 51,85 Gew.-% Wasser (2 Punkte)
- Verfahren mit LiOH als Base (2 Punkte)
- Verfahren, das in Diethylether durchgeführt wird (2 Punkte)

Bei mehr als 15 Ansprüchen gab es ab dem 16. Anspruch keine Punkte mehr, da der Mandant nach eigener Aussage keine Anspruchsgebühren entrichten wollte.

3. Beschreibung

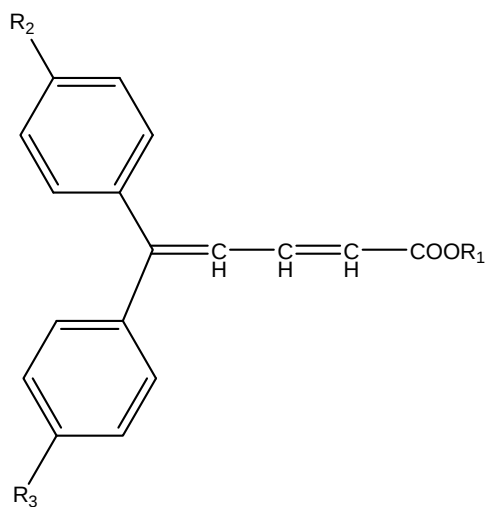
Für die Beschreibung wurden bis zu 15 Punkte vergeben. Die Einleitung der Beschreibung sollte wie bei einer echten Anmeldung verfasst sein und nicht als Schreiben an das EPA. Es galt den Stand der Technik zu erörtern und die Bedeutung der Erfindung für die Lösung der Aufgabe im Lichte des Stands der Technik klar darzulegen. Die Löslichkeit in Öl und ihre Vorteile für die Anwendung in Sonnenschutzmitteln sowie die Bewahrung der Stabilitätseigenschaften sollten aufgezeigt werden.

Der bisherige Stand der Technik sollte allgemein beschrieben werden, d. h. man könnte erwähnen, dass UV-Schutz zur Verhinderung von Sonnenbrand und dessen Folgen wesentlich ist. In diesem Zusammenhang ist es wichtig, dass die UV-Filter fotostabil sind, damit der Schutz nicht nachlässt. Außerdem kommen Sonnenschutzmittel oft mit Wasser in Kontakt, sei es beim Schwitzen oder beim Baden in Meer- oder Süßwasser. Für einen wirksamen Schutz ist es also auch wichtig, dass die Sonnenschutzmittel während und nach dem Kontakt mit Wasser auf der Haut bleiben. Die Nachteile des bekannten Stands der Technik sollten in der Beschreibung deutlich herausgehoben werden. Insbesondere sollte betont werden, dass in D2 wasserlösliche UV-Filter offenbart werden. Diese Filter würden leicht von der Haut entfernt, was zu unzureichendem Schutz führt. Die Lösung dieser Aufgabe sollte für alle abgedeckten Ausführungsformen erläutert werden. Es sollte angegeben werden, dass sowohl Alkyl mit mindestens 6 Kohlenwasserstoffatomen als auch Cycloalkyl- und Phenylgruppen öllöslich sind (wie aus dem Mandantenschreiben und D1 bekannt). Insbesondere könnte auf Tabelle 1 verwiesen werden, um diesen Effekt zu belegen.

Die Aufgabe und ihre Lösung sowie der Rest der Beschreibung musste mit dem Stand der Technik und mit den vorgeschlagenen unabhängigen Ansprüchen in Einklang stehen.

4. Ein möglicher Anspruchssatz könnte wie folgt lauten:

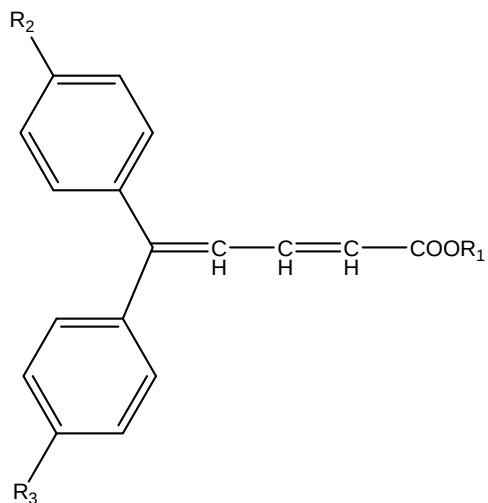
1. Verbindung der Formel (Ia)



worin

R₁ für Alkyl mit mindestens 6 Kohlenstoffatomen steht,
R₂ und R₃ unabhängig voneinander für H, Alkyl, Halogen, Si(CH₃)₃, OH oder NH₂
stehen
und von R₂ und R₃ mindestens eines Si(CH₃)₃ ist.

2. Verbindung der Formel (I)



worin

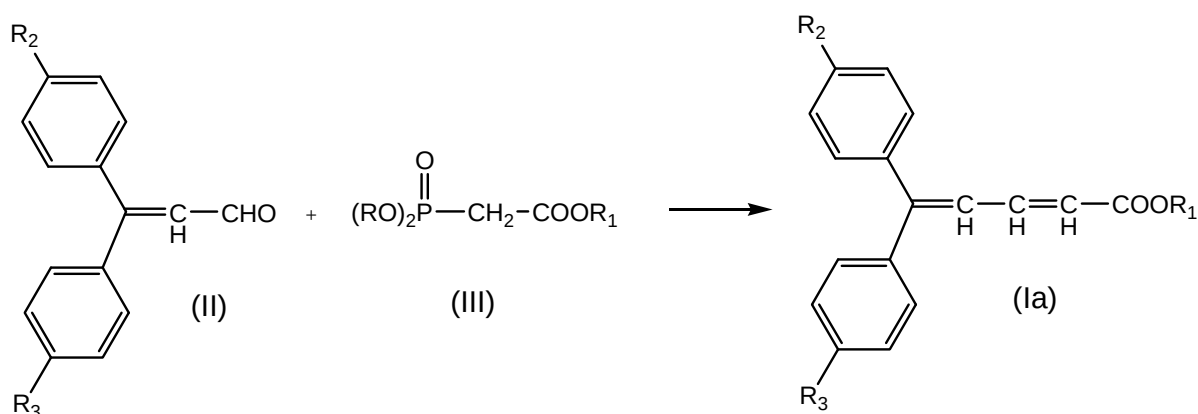
R₁ für Alkyl mit mindestens 6 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl oder Phenyl steht,
R₂ und R₃ unabhängig voneinander für H, Alkyl, Halogen, Si(CH₃)₃, OH oder NH₂
stehen
und von R₂ und R₃ mindestens eines Si(CH₃)₃ ist,
zur Anwendung in einem Verfahren zum Schutz der Haut vor UV-Strahlung.

**3. Verbindung der Formel (Ia) nach Anspruch 1 oder der Formel (I) nach
Anspruch 2, worin sowohl R₂ als auch R₃ für Si(CH₃)₃ stehen.**

4. Verbindung der Formel (Ia) nach Anspruch 1 oder der Formel (I) nach Anspruch 2, worin R_1 für C_6 - C_{10} -Alkyl steht.
5. Zusammensetzung, die mindestens eine Verbindung der Formel (I) nach Anspruch 2, ein Verdickungsmittel und ein Konservierungsmittel in mindestens einer Ölphase umfasst.
6. Zusammensetzung nach Anspruch 5, die außerdem mindestens ein UV-B-Sonnenschutzmittel umfasst.
7. Zusammensetzung nach Anspruch 5 bis 6 in Form einer Emulsion, die außerdem einen Emulgator umfasst.
8. Zusammensetzung nach Anspruch 7 in Form einer Wasser-in-Öl-Emulsion.
9. Zusammensetzung nach einem der Ansprüche 5 bis 8 mit
 - UV-Filter der Formel (I) 2 - 7 Gew.-%,
 - UV-B-Filter 2 - 7 Gew.-%,
 - Konservierungsmittel 0,05 - 1,0 Gew.-%,
 - Emulgator 4 - 8 Gew.-%,
 - Verdickungsmittel 0,1 - 2 Gew.-%,
 - Ölphase 40 - 60 Gew.-%,
 - Wasser 15 - 51,85 Gew.-%.
10. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel (Ia) nach Anspruch 1, das die Reaktion einer Verbindung der Formel (II) mit einer Verbindung der Formel (III) in Anwesenheit einer Base umfasst,

worin

R für C_1 - C_{10} -Alkyl oder Phenyl steht und R_1 , R_2 und R_3 wie in Anspruch 1 definiert sind.



11. Verfahren nach Anspruch 9, wobei die Base LiOH ist.
12. Verfahren nach Anspruch 10 oder 11, wobei die Reaktion in Diethylether abläuft.

EXAMINATION COMMITTEE I

Candidate No. _____

Paper A (Chemistry) 2012 - Marking Sheet

Category		Maximum possible	Marks awarded	
Independent claims	Compound	30		
	Compound for use	10		
	Composition	20		
	Process	10		
Dependent claims		15		
Description		15		
Total		100		

Examination Committee I agrees on marks and recommends the following grade to the Examination Board:

☐ PASS
(50-100)

☐ COMPENSABLE FAIL
(45-49)

☐ FAIL
(0-44)

28 June 2012

Chairman of Examination Committee I