

EUROPÄISCHE EIGNUNGSPRÜFUNG 2016

Aufgabe B(Ch)

Chemie

Diese Prüfungsaufgabe enthält:

- | | |
|--|---------------------|
| * Patentanmeldung | 2016/B(Ch)/DE/1-6 |
| * Dokument D1 | 2016/B(Ch)/DE/7-8 |
| * Dokument D2 | 2016/B(Ch)/DE/9-10 |
| * Bescheid | 2016/B(Ch)/DE/11-12 |
| * Schreiben des Anmelders
(einschließlich neuer Anspruchsatz) | 2016/B(Ch)/DE/13-16 |



Patentanmeldung

Abwehrmittel gegen Hunde und Katzen

[001] Die vorliegende Erfindung betrifft Maßnahmen, um Hunde und Katzen von Objekten fernzuhalten.

[002] Die Verschmutzung von Gebäuden, Mauern und Zäunen durch Hunde- und Katzenurin ist gerade in größeren Städten ein zunehmendes Problem. Neben der hygienischen Belastung können die verschmutzten Objekte auch erhebliche Schäden erleiden. Hunde- und Katzenurin greift nicht nur die Wand- oder Zaunfarbe an, sondern kann auch zu erheblichen Schäden an der Bausubstanz führen.

[003] Es werden im Handel zahlreiche Mittel in Form von Sprays, Granulaten oder Pulvern angeboten, die sowohl Hunde als auch Katzen von den betroffenen Objekten fernhalten. Durch Regen, Wind oder chemische Zersetzung hält die Wirkung dieser Mittel in der Regel allerdings nur wenige Tage an. Zudem sind manche der verwendeten Substanzen giftig für Menschen und Haustiere.

[004] Aufgabe der vorliegenden Anmeldung ist es, Zusammensetzungen bereitzustellen, die eine Abwehrwirkung über einen längeren Zeitraum gewährleisten und eine geringe Toxizität gegenüber Mensch und Haustier aufweisen. Es wurden Cyclohexylharnstoff-Derivate gefunden, die eine lang anhaltende Abwehrwirkung gegen Katzen und Hunde entfalten und in den verwendeten Konzentrationen keine Gefahr für Menschen und Haustiere darstellen. Üblicherweise hält das erfindungsgemäße Cyclohexylharnstoff-Derivat mindestens 50% der Tiere über einen Zeitraum von 1 Jahr ab, an ein Objekt zu urinieren.



[005] Bevorzugt hat das Cyclohexylharnstoff-Derivat die allgemeine Formel (I),



wobei A entweder Sauerstoff oder Schwefel ist,

R Alkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 4 bis 8 Kohlenstoffatomen, Wasserstoff oder ein Halogen ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Chlor, Fluor, Jod oder Brom ist,

R¹ und R² gleich oder verschieden sind und ausgewählt sind aus der Gruppe bestehend aus Alkyl mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 4 bis 8 Kohlenstoffatomen oder Wasserstoff.

Bevorzugt sind R¹ und R² gleich. In einer besonders bevorzugten Ausführungsform sind A Sauerstoff, R Wasserstoff, R¹ = R² = Alkyl mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen.

[006] Das Cyclohexylharnstoff-Derivat kann in verschiedenen Zusammensetzungen angeboten werden, wie beispielsweise in Anstrichmitteln, sprühfertigen Dispersionen, Pulvern und Granulaten. So können Hauswände und Zäune mit dem Anstrichmittel behandelt oder mit der Dispersion besprüht werden, oder es können Granulate und Pulver in Hauseinfahrten verteilt werden, um Hunde und Katzen fernzuhalten.



[007] In einer Ausführungsform wird das Cyclohexylharnstoff-Derivat in eine polymere Matrix eingebettet, was eine kontrollierte Freisetzung des Abwehrstoffes ermöglicht. Als polymere Matrix werden beispielsweise Polymere verwendet, die 60 bis 85 Gewichts-% mindestens eines Acryl- oder Methacrylsäureesters eines Alkanols mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen und 15 bis 40 Gewichts-% eines Monomers mit einer funktionellen Gruppe enthalten. Die funktionelle Gruppe erlaubt dabei eine hohe Wechselwirkung mit dem Cyclohexylharnstoff-Derivat. Die Monomere mit einer funktionellen Gruppe sind zum Beispiel Acrylsäure, Methacrylsäure, Styrole oder Vinyltoluole. Der Gehalt an Cyclohexylharnstoff-Derivat in der polymeren Matrix beträgt wegen seiner Toxizität höchstens 25 Gewichts-%. In einer besonderen Ausführungsform wird das Cyclohexylharnstoff-Derivat in einer polymeren Matrix in Form von Mikropartikeln zu einem Anstrichmittel gegeben oder als sprühfertige Dispersion bereitgestellt, wobei die Mikropartikel 5 bis 25 Gewichts-% des Anstrichmittels oder 10 bis 25 Gewichts-% der sprühfertigen Dispersion ausmachen.

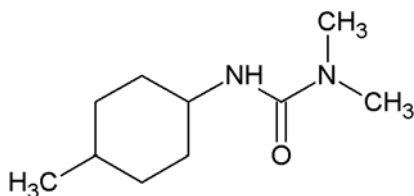
[008] Unter einem Anstrichmittel versteht der Fachmann einen flüssigen oder pastenförmigen Beschichtungsstoff, der durch Streichen oder Rollen aufgetragen wird. Damit unterscheidet sich ein Anstrichmittel von sprühfertigen Dispersionen, die durch Sprühen aufgetragen werden. Beispiele für Anstrichmittel sind Wandfarben, Holzfarben, Lacke und Korrosionsschutzanstriche. Ein typisches erfindungsgemäßes Anstrichmittel enthält 1 bis 25 Gewichts-% Polymere wie Polyvinylacrylate, 20 bis 70 Gewichts-% eines anorganischen Füllstoffes wie Calciumcarbonat, Talkum oder Aluminiumsilikate, 0,1 bis 5,0 Gewichts-% Tenside, bis zu 10 Gewichts-% Hilfsmittel, bis zu 10 Gewichts-% organisches Lösungsmittel und 20 bis 60 Gewichts-% Wasser.



[009] Um eine gute Haftung des Anstrichmittels an das Substrat, wie beispielsweise eine Mauer oder ein Zaun, zu erreichen, ist es vorteilhaft, mindestens 10 Gewichts-% einer polymeren Matrix, in die das Cyclohexylharnstoff-Derivat eingebettet ist, im Anstrichmittel zu verwenden. Damit wird verhindert, dass der Wirkstoff durch Regen aus dem Anstrichmittel gewaschen wird. Für ein Anstrichmittel mit lang anhaltender Wirkung hat sich ein Gehalt an Cyclohexylharnstoff-Derivat in der polymeren Matrix von 15 bis 25 Gewichts-% als vorteilhaft in Freisetzungsversuchen erwiesen.

[010] Die sprühfertige Dispersion enthält vorzugsweise 15 bis 25 Gewichts-% einer polymeren Matrix, in die das erfindungsgemäße Cyclohexylharnstoff-Derivat eingebettet ist, und 75 bis 85 Gewichts-% Wasser. Zusätzlich können weitere übliche Hilfsstoffe zugegeben werden. Die sprühfertige Dispersion kann in Zerstäubern oder Sprühdosen eingesetzt werden. Bei der Anwendung als sprühfertige Dispersion ist darauf zu achten, dass sie an einer regengeschützten Stelle aufgebracht wird, da sonst häufig nachgesprüht werden muss, um die gewünschte Wirkung über einen längeren Zeitraum zu erzielen.

[011] **Beispiel 1:** Herstellung einer polymeren Matrix mit 1-(4-Cyclohexylmethyl)-3-Dimethylharnstoff



Eine polymere Matrix in Form von Mikropartikeln mit einem Durchmesser von 1 bis 1000 Mikrometer und einem Gehalt von 15 Gewichts-% 1-(4-Cyclohexylmethyl)-3-Dimethylharnstoff wurde unter Verwendung der Monomere Isobutylmethacrylat und Styrol mit einem Gewichtsverhältnis von 70:30 nach dem Verfahren von Kunzu (*Handbuch der Polymerherstellung*, Denda-Verlag, 1985) hergestellt.



[012] Beispiel 2: Herstellung einer hundeeabwehrenden Wandfarbe

Zur Herstellung von 10 kg der hundeeabwehrenden Wandfarbe wurden zu 3 kg Wasser und 2 kg polymerer Matrix aus Beispiel 1 folgende Bestandteile gegeben: 2 kg kristallines Calciumcarbonat und 1 kg Titandioxid als anorganische Füllstoffe, 300 g Tensid, 700 g Waschbenzin und 1 kg Hilfsstoffgemisch aus Konservierungsmittel ANTIFOULPLUS, Entschäumer DEFOAM und Verdickungsmittel BIGTHICK.

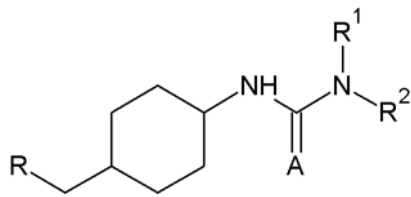
[013] Beispiel 3: Mauerversuch

In einem Hundeauslaufgebiet (Schafka-Park, Doghenge) wurden zwei Mauern mit den folgenden Wandfarben in üblicher Weise gestrichen. Mauer 1 wurde mit der Wandfarbe aus Beispiel 2 gestrichen. Mauer 2 wurde mit einer Wandfarbe ohne Cyclohexylharnstoff-Derivat-haltiger polymerer Matrix gestrichen. Die Mauern wurden mit einer Webcam über einen Zeitraum von 1 Jahr beobachtet und waren Regen und Wind ausgesetzt. Es wurde die Anzahl der Hunde bestimmt, die an jede der Mauern urinieren. Die Auswertung zeigte, dass an Mauer 1 60 % weniger Hunde urinieren als an Mauer 2. Damit konnte nachgewiesen werden, dass die untersuchten Abwehrmittel mindestens 50% der Hunde über einen Zeitraum von einem Jahr von einer Mauer fernhielten.



Patentansprüche

1. Zusammensetzung enthaltend mindestens ein Cyclohexylharnstoff-Derivat, durch welche mindestens 50% der Hunde und Katzen über einen Zeitraum von 1 Jahr von einem Objekt abgehalten werden.
2. Zusammensetzung nach Anspruch 1, wobei das Cyclohexylharnstoff-Derivat die folgende Formel (I) aufweist:



(I)

wobei A entweder Sauerstoff oder Schwefel ist,

R Alkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 4 bis 8 Kohlenstoffatomen, Wasserstoff oder ein Halogen ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Chlor, Fluor, Jod oder Brom ist,

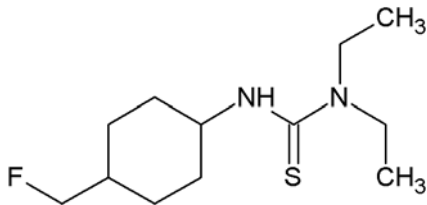
R¹ und R² gleich oder verschieden sind und ausgewählt sind aus der Gruppe bestehend aus Alkyl mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 4 bis 8 Kohlenstoffatomen oder Wasserstoff.

3. Zusammensetzung nach Anspruch 1 oder 2, wobei das Cyclohexylharnstoff-Derivat in eine polymere Matrix eingebettet ist.
4. Verwendung einer polymeren Matrix enthaltend einen Hunde- oder Katzenabwehrstoff zur Herstellung eines Anstrichmittel oder einer sprühfertigen Dispersion.

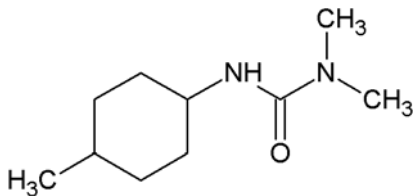


Dokument D1: Catcher B et al., *Der Schädlingsbekämpfer*, Band 23 (2012), Seiten 111-112

[001] Die Verschmutzung von Hauswänden, Eingängen und Einfahrten durch Hunde stellt ein ernstes hygienisches Problem dar. Neuerdings werden Cyclohexylharnstoff-Derivate wie



oder



verwendet, die wirksam Hunde abwehren und in Form von Pulvern oder Granulaten angeboten werden.

[002] Es hat sich in der Praxis jedoch gezeigt, dass diese Mittel nur für wenige Tage Hunde fernhalten, da die Wirkung aufgrund von Wind oder Regen sehr schnell nachlässt.

[003] Es wurde nun gefunden, dass die oben beschriebenen Substanzen die Mehrzahl der Hunde bis zu einem Jahr und in Einzelfällen auch länger fernhalten können, wenn sie in eine polymere Matrix eingebettet sind und im Hauseingang oder in einer regensicheren Vorrichtung deponiert werden.



[004] Eine solche regensichere Vorrichtung besteht aus einem Aufnahmebehälter, der mit der polymeren Matrix mit dem eingebetteten Hundeabwehrstoff gefüllt ist und der an einer Schiene an der Hauswand in einer Höhe von 20 bis 50 cm befestigt ist. Die polymere Matrix ist so ausgewählt und schließt den Hundeabwehrstoff so ein, dass er kontrolliert freigesetzt wird. Dabei ist eine möglichst hohe Konzentration an Hundeabwehrstoff in der polymeren Matrix anzustreben, nämlich 20 Gewichts-% oder mehr.

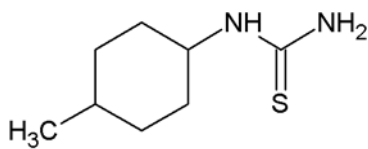
[005] Die Herstellung von Polymeren mit einem Methacrylsäureester wie Butylmethacrylat und einem weiteren Monomer wie beispielsweise Styrol oder Methacrylsäure ist in der Patentschrift EP8975654 für das kontrollierte Freisetzen von Düngemitteln beschrieben.



Dokument D2: Hahn et al., *AgroReports*, veröffentlicht am 17. Mai 2014

[001] Die vorliegende Untersuchung betrifft Zusammensetzungen mit kontrollierter Freisetzung zum Einsatz in der Landwirtschaft. Ziel der Untersuchung ist es, die Freisetzung eines aktiven Bestandteils in einer polymeren Matrix in ausreichender Konzentration über einen möglichst langen Zeitraum steuern zu können.

[002] Als Wirkstoffe kommen dabei die in der Landwirtschaft eingesetzten Abwehrstoffe gegen Insekten, Kleinnager oder Vögel in Frage. Für unsere Untersuchungen haben wir ein Cyclohexylharnstoff-Derivat mit der Formel (A) verwendet:



(A)

[003] Als polymere Matrix werden Polymere eingesetzt, die 60 bis 95 % mindestens eines Acryl- oder Methacrylsäureesters eines Alkanols mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 5 bis 40% eines Monomers mit einer funktionellen Gruppe wie beispielsweise ein Styrol enthalten. Diese polymere Matrix hat eine optimale Wechselwirkung mit dem aktiven Wirkstoff und erlaubt somit eine kontrollierte Freisetzung. Die polymere Matrix in Form von Mikropartikeln, in die das Cyclohexylharnstoff-Derivat der Formel (A) eingebettet ist, wurde nach dem Verfahren hergestellt wie von Kikker und Rana beschrieben (*Journal of Polymers and Agriculture*, 18: 230-236, 1997). Es wurden anschließend 10 Teile polymerer Matrix in 90 Teilen Wasser dispergiert.



[004] In einem ersten vereinfachten Versuch wurde die Wirksamkeit der sprühfertigen Dispersion gegenüber Insekten auf einer weißen Wand überprüft. Die Mischung wurde mittels eines Handsprühers auf fünf Quadratmeter einer wind- und regengeschützten weißen Wand eines Bauernhofs gesprüht und mit einer Webcam mit einer hohen Auflösung über einen Zeitraum von 144 Stunden beobachtet. Die Anzahl der durch die behandelte Wand angezogenen Fliegen im Vergleich zur unbehandelten Wand nahm nach 144 Stunden zwischen 62% und 83% ab, abhängig von der Konzentration an Cyclohexylharnstoff-Derivat der Formel (A) in der polymeren Matrix.

[005] Überraschend und unerwartet wurde gefunden, dass das Cyclohexylharnstoff-Derivat der Formel (A) mit einer Konzentration von 5 Gewichts-% in der polymeren Matrix eine länger anhaltende Wirkung hat als bei einer höheren Konzentration von 20 Gewichts-%. Da geringere Gehalte an Cyclohexylharnstoff-Derivat der Formel (A) auch weniger schädlich für Mensch und Haustiere sind, empfehlen wir für eine Langzeitwirkung eine Konzentration von 5 Gewichts-% an Cyclohexylharnstoff-Derivat der Formel (A) in der polymeren Matrix.

[006] Es konnte nicht festgestellt werden, inwieweit Haustiere durch die verwendete Zusammensetzung in Mitleidenschaft gezogen worden waren. Es wurde in diesem Zusammenhang beobachtet, dass die auf dem Bauernhof frei herumlaufenden Hühner, Hunde und Katzen einen Abstand von mindestens einem Meter von der behandelten Mauer einhielten und somit nicht in direkten Kontakt mit dem Abwehrmittel kamen. Es sind weitere Untersuchungen notwendig, um die Anwendung der Zusammensetzungen auf dem freien Feld zu testen, da die Wirkung der Abwehrstoffe unter Sonneneinstrahlung und unter dem Einfluss von Feuchtigkeit in kurzer Zeit vermutlich stark nachlässt.



Bescheid

1. Diesem Bescheid liegt die ursprünglich eingereichte Anmeldung zugrunde. Die beigefügten Dokumente D1 und D2 sind Stand der Technik nach Artikel 54(2) EPÜ.
2. Der Gegenstand der Ansprüche 1 bis 3 ist nicht neu, da die beiden Dokumente Cyclohexylharnstoff-Derivate offenbaren, die von Formel (I) umfasst werden. Weiterhin werden in D1 Zusammensetzungen genannt, die zur Abwehr von Hunden verwendet werden. Der Gegenstand des Anspruchs 4 ist nicht neu.
3. Anspruch 1 ist nicht klar im Sinne des Artikels 84 EPÜ, da die Verbindungen über das zu erzielende Ergebnis definiert werden und der Fachmann nicht weiß, welche strukturellen Merkmale maßgeblich für das Ergebnis sind und welche Verbindungen unter den Begriff „Derivate“ fallen.

Anspruch 4 ist nicht klar, weil die Merkmale „Hunde- oder Katzenabwehrstoff“, „polymere Matrix“, „Anstrichmittel“ und „sprühfertige Dispersion“ mehrdeutigen Begriffe sind.

4. Die Anmeldung ist nicht einheitlich (Artikel 82 EPÜ), weil Cyclohexylharnstoff-Derivate mit einer Hundeabwehrate von mehr als 50% über einen Zeitraum von 1 Jahr aus dem Dokument D1 bekannt sind. Damit sind die folgenden Erfindungen nicht untereinander verbunden:
Erfindungsgruppe 1 (Ansprüche 1 bis 3): jede Einzelverbindung, die in der allgemeinen Formel (I) als Alternative möglich ist, stellt eine eigene Erfindung dar;
Erfindung 2 (Anspruch 4): Verwendung nach Anspruch 4
Der Recherchebericht wurde für alle Erfindungen erstellt. Der Anmelder wird gebeten, eine Erfindung auszuwählen und die anderen zu streichen.
Gegebenenfalls können für die anderen Erfindungen ein oder mehrere Teilanmeldungen eingereicht werden.



5. Falls der Anmelder die Anmeldung weiter verfolgen will, sollten geänderte Patentansprüche eingereicht werden, die den vorstehenden Einwänden Rechnung tragen. Dabei sollte darauf geachtet werden, dass die geänderten Ansprüche den Erfordernissen des EPÜ in Bezug auf Neuheit, erfinderische Tätigkeit, Klarheit und Einheitlichkeit genügen. Auch dürfen keine Änderungen vorgenommen werden, die dazu führen, dass der Gegenstand über den Inhalt der Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgeht.

Im Antwortschreiben sollte der Unterschied zwischen den neu eingereichten Ansprüchen und dem in den Dokumenten D1 und D2 offenbarten Stand der Technik erläutert werden. Die der Erfindung zugrunde liegende technische Aufgabe gegenüber dem nächstliegenden Stand der Technik und deren Lösung sollten aus der Argumentation der Anmelderin deutlich hervorgehen.

6. Zur Erleichterung der Prüfung, ob die geänderten Ansprüche Gegenstände enthalten, die über den Inhalt der Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen, wird der Anmelder aufgefordert, genau anzugeben, auf welche Stellen in den ursprünglich eingereichten Anmeldungsunterlagen sich die vorgeschlagenen Änderungen beziehen.



Schreiben des Anmelders

Sehr geehrte Frau Dock,

Sie haben uns mitgeteilt, dass das Europäische Patentamt im Zuge des Erteilungsverfahrens für unsere Patentanmeldung neuheitsschädliche Dokumente zitiert hat.

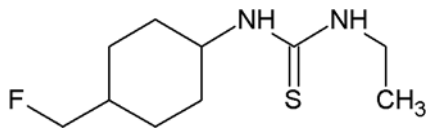
Wir haben die vom EPA erhobenen Einwände eingehend analysiert und haben die Ansprüche daraufhin geändert. Wir möchten uns nun auf Anstrichmittel und sprühfertige Dispersionen beschränken, die bestimmte Cyclohexylharnstoff-Derivate enthalten, da wir in solchen Produkten unsere Marktchancen sehen.

Wir sind uns sicher, dass wir damit die Einwände des EPA überwunden haben und die bevorzugten Verbindungen beanspruchen; sollten weitere Änderungen notwendig sein, möchten wir Sie bitten, diese vorzunehmen.

Wir nehmen an, dass mit den Änderungen auch die erfinderische Tätigkeit gegeben ist und die Erfindung nun einheitlich ist. Falls nötig bitten wir Sie, Erfindungen zu streichen.



Ergänzend zu den schon in der Anmeldung beschriebenen Versuchen haben wir zu einem Anstrichmittel ein Cyclohexylharnstoff-Derivat der Formel



gegeben und sehr gute Ergebnisse erzielt. Mit diesem Anstrichmittel konnten über einen Zeitraum von 14 Monaten 70% aller Hunde von der Mauer im Schafka-Park abgehalten werden.

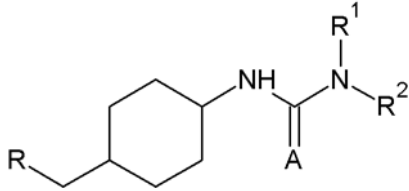
Wir haben noch keine abschließenden Ergebnisse für die sprühfertigen Dispersionen, die die Cyclohexylharnstoff-Derivate der geänderten Ansprüche enthalten, um ihre Wirksamkeit zur Abwehr von Hunden zu belegen. Erste Versuche zeigen, dass sprühfertige Dispersionen dieser Cyclohexylharnstoff-Derivate, weniger wirksam zur Abwehr von Hunden sind als die entsprechenden Anstrichmittel. Möglicherweise können wir Ihnen in einem Jahr abschließende Ergebnisse für sprühfertige Dispersionen vorlegen.

Mit freundlichen Grüßen
Peter Chienville
Sorak Ltd., Cattenborough



Patentansprüche

1. Anstrichmittel oder sprühfertige Dispersion enthaltend eine polymere Matrix, in die ein Cyclohexylharnstoff-Derivat der Formel (I)



(I)

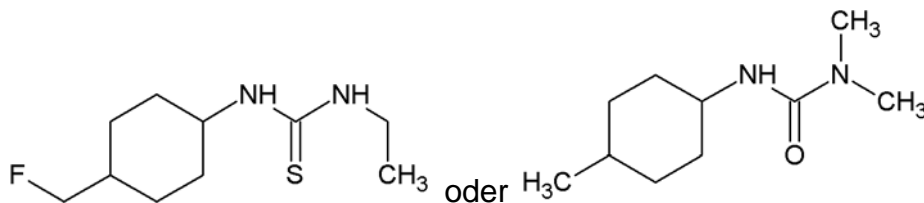
eingebettet ist, wobei

A entweder Sauerstoff oder Schwefel ist,

R Alkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 4 bis 8 Kohlenstoffatomen, Wasserstoff oder ein Halogen ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Chlor, Fluor, Jod oder Brom ist,

R¹ und R² gleich oder verschieden sind und ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Alkyl mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 4 bis 8 Kohlenstoffatomen oder Wasserstoff und wobei höchstens einer der beiden Reste R¹ oder R² ein Wasserstoff ist.

2. Anstrichmittel oder sprühfertige Dispersion nach Anspruch 1, wobei das Cyclohexylharnstoff-Derivat die Formel



hat.



3. Anstrichmittel oder sprühfertige Dispersion nach Anspruch 1 oder 2, wobei der Gehalt an Cyclohexylharnstoff-Derivat in der Polymermatrix zwischen 10 und 25 Gewichts-% beträgt.

4. Verwendung eines Anstrichmittels oder einer sprühfertigen Dispersion nach einem der Ansprüche 1 bis 3 zur Abwehr von Hunden oder Katzen.

