

Prüfungsarbeit eines Bewerbers

In Erwiderung auf den Bescheid vom 23. August 2010 werden hiermit neue Patentansprüche 1-8 eingereicht, die die ursprünglich eingereichten Ansprüche 1-10 ersetzen; vgl. Anlage zu diesem Schreiben.

1.) Änderungen; Art. 123(2) EPÜ

Anspruch 1 wurde durch die nähere Definition der Substituenten R und Y geändert. Dabei ist R nun eine Alkylgruppe mit 3-6 Kohlenstoffatomen und Y eine Arylgruppe.

Die Grundlage für den geänderten Anspruch 1 bilden die ursprünglichen Ansprüche 1 und 2 in Verbindung mit dem Absatz (Abs.) [0009] vorletzter und letzter Satz.

Die Kombination dieser Merkmale stellt auch keinen neuen Gegenstand dar, den der Fachmann nicht unmittelbar und eindeutig aus Anlage 1 (A1) entnehmen könnte, da R = Alkylgruppe mit 3-6 Kohlenstoffatomen bzw. Y = Arylgruppe unabhängig voneinander als bevorzugte Ausführungsformen dieser Substituenten offenbart sind, die auch unabhängig voneinander gewählt werden können, womit auch die Kombination offenbart ist.

Die eingefügten Merkmale definieren nun gem. der ursprünglich eingereichten Anmeldung eine bevorzugte Ausführungsform der ursprünglich in Anspruch 1 offenbarten Verbindung.

Der ursprüngliche Anspruch 2 wurde gestrichen.

Geänderter Anspruch 2 basiert auf dem ursprünglichen Anspruch 3 und ist ferner durch Abs. [0007], drittletzter Satz gestützt. Auch dieser Absatz macht deutlich, dass die Arylgruppen unabhängig von den anderen Substituenten gewählt werden können. Damit ist auch die Kombination R = Alkyl (C₃₋₆) und Y = Phenyl, TolyI oder Xylyl für den Fachmann eindeutig und unmissverständlich offenbart.

Der ursprüngliche Anspruch 4 wurde gestrichen, da dieser nicht mehr unter geänderten Anspruch 1 fällt.

Die geänderten Ansprüche 3 bis 6 basieren auf den ursprüngl. Ansprüchen 5-8 und sind ferner durch die Abs. [001] und [0012] der A1 gestützt.

Der geänderte Anspruch 7 basiert auf dem ursprünglichen Anspruch 9. Der Anspruch wurde geändert, in dem dieselben Definitionen für R und Y eingeführt wurden wie in Anspruch 1. Die Definitionen für R und Y finden sich in Abs. [0009], letzter und vorletzter Satz. Diese Definitionen gelten auch für das Produkt (C) (wie auch für Produkte (A) und (B)), was zum einen daraus ersichtlich ist, dass dieselben Variablen für die Substituenten in Formel (1) und den Verbindungen (A), (B) und (C) verwendet werden. Außerdem geht aus Abs. [008] [009] unmittelbar und eindeutig hervor, dass die Verbindungen der vorliegenden Erfindung aus (A) und (B) und dem Zwischenprodukt (C) hergestellt werden. Daraus ist dem Fachmann klar, dass auch das Zwischenprodukt (C) dieselben Substituenten aufweisen muss wie das gewünschte Endprodukt, insbesondere weil (C) nur durch einen Oxidationsschritt in das Endprodukt umgewandelt wird.

Dass die Substituentenvariablen X, R und Y für sowohl A, B und C als auch für das Endprodukt dieselben Definitionen haben, geht auch aus dem ursprünglichen Anspruch 10 hervor, in dem die Verbindungen A, B und C in Kombination mit den Substituentendefinitionen für Verbindung (1) genannt sind.

Damit ist auch der Gegenstand von Anspruch 7 in der ursprünglichen Anmeldung offenbart.

Anspruch 8 basiert auf dem ursprünglichen Anspruch 10 und ist ferner in den Abs. [008] und [009] gestützt.

2.) Einheitlichkeit; Art. 82 EPÜ

Die in geänderten Anspruch 7 beanspruchte Verbindung ist ein Zwischenprodukt im Verfahren zur Herstellung der in Anspruch 1 beanspruchten Verbindung. Laut ständiger Rechtsprechung der Beschwerdekammern des EPA sind Zwischenprodukte mit ihren Endprodukten einheitlich, sofern sie durch ihren Beitrag einen ausreichend engen technischen Zusammenhang mit einem wesentlichen Strukturelement der Endprodukte aufweisen; vgl. T 57/82, W 35/91, W 7/85 und Richtlinien für die Prüfung im EPA (RiLi) C-III, 7.3.

Vorliegend ist die komplette Struktur des Zwischenprodukts gem. Anspruch 7 in der Verbindung gem. Anspruch 1 enthalten, so dass Anspruch 1 und Anspruch 7 einheitlich sind.

3.) Neuheit; Art. 54 EPÜ

Der Gegenstand der geänderten Ansprüche 1-8 ist aus folgenden Gründen neu:

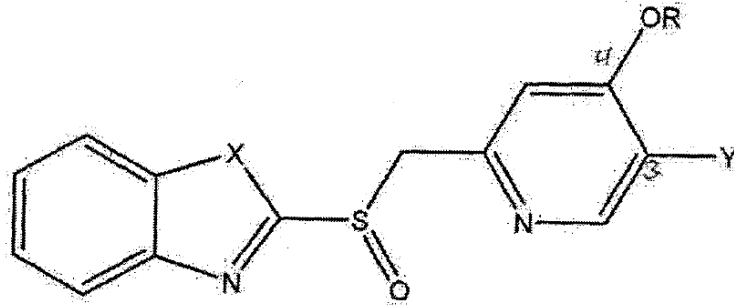
3.1) D1 offenbart Stickstoff-3-phenyl-4-dodecyl-belliace (NPDB) als Protonenpumpeninhibitor, der in Kombination mit einem oder mehreren Antibiotika z.B. in Form von Tabletten eine Arznei darstellt, die auf alle Symptome, insbesondere Entstehung von Säure und Vorhandensein von Helicobacter pylori-Bakterien (vgl. Abs. [001] letzter Satz), von Ulcus pepticum abzielt; vgl. Abs. [0002] und [0003], D1. Laut D1 hat NPDB eine viel höhere Aktivität als Protonenpumpeninhibitor als jede andere Verbindung dieser Familie; vgl. Abs. [0002], letzter Satz, D1.

Damit offenbart (Dokument 1) D1 eine Belliace-Verbindung gem. dem früheren (ursprünglichen) Anspruch 1 von A1, wobei X = NH, R = dodecyl, also eine Alkylgruppe mit 12 Kohlenstoffatomen, und Y = phenyl ist.

Der geänderte Anspruch 1 definiert aber, dass R eine Alkylgruppe mit 3-6 Kohlenstoffatomen ist, so dass die spezifische in D1 offenbarte Erfindung den Gegenstand von dem geänderten Anspruch 1 nicht neuheitsschädlich vorwegnimmt.

Damit ist der Gegenstand von Anspruch 1 neu gegenüber D1.

3.2) D2 offenbart eine Klasse von Verbindungen, die sog. Belliacke-Verbindungen (vgl. Abs. [004]) folgender allg. Formel:



Die
diesen

Variablen in
Verbindungen

sind X und die Gruppen R und Y. X kann NH, S oder O sein. Die Gruppen R und Y können gleich oder verschieden sein und können aus einer Vielzahl von Substituenten ausgewählt werden: Alkyl, Hydroxyalkyl, Nitro, Amin, Aryl oder Halogen. Die Alkyl- und Hydroxyalkylgruppen sollten eine Länge von 3 bis 30 Kohlenstoffatomen haben, vorzugsweise 6 bis 10 Kohlenstoffatome. Sie können verzweigt oder linear sein. Die Arylgruppen sind vorzugsweise Phenyl, Xylyl und Toly.

D2 offenbart ferner ein Verfahren zu deren Herstellung (vgl. Abs. [005]) sowie einige spezifische Ausführungsformen in Tabelle 1, wobei X = NH und sowohl Y als auch R eine Alkylgruppe ist.

D2 offenbart allerdings nicht die spezifische Kombination der Substituenten, wobei Y = Arylgruppe und R = Alkylgruppe mit 3-6 Kohlenstoffatomen ist. D2 offenbart lediglich, dass R und Y aus einer Vielzahl von Substituenten ausgewählt werden kann und ganz allgemein (nicht spezifisch für R bzw. Y offenbart), dass Alkyl- und Hydroxyalkylgruppen 3 bis 30, vorzugsweise 6-10 Kohlenstoffatome haben.

Somit stellt die in geändertem Anspruch 1 definierte Verbindung eine spezifische Auswahl dar, die in dieser Form nicht in der D2 offenbart ist. Damit ist der Gegenstand von Anspruch 1 neu gegenüber D2.

3.3) Die Ansprüche 2 bis 4 sind von Anspruch 1 abhängig und sind damit auch neu gegenüber D1 und D2; vgl. RiLi C-IV, 11.13.

Die Ansprüche 5 und 6 umfassen durch ihren Verweis auf Anspruch 1 alle Merkmale des Anspruchs 1 und sind deshalb neu gegenüber D1 und D2.

Die Verbindung gem. dem geänderten Anspruch 7 umfasst dieselben Definitionen für X, R und Y wie die Verbindung aus Anspruch 1. Damit ist der Gegenstand von Anspruch 7 aus denselben Gründen neu gegenüber D2 wie Anspruch 1.

Die D1 offenbart keine Verbindung, der die S=O Verbindung fehlt, so dass der Gegenstand von Anspruch 7 deshalb neu ist gegenüber D1.

Anspruch 8 betrifft ein Verfahren, das zwangsläufig zur Herstellung des Produkts aus Anspruch 1 führt, so dass der Gegenstand von Anspruch 8 deshalb neu gegenüber D1 und D2 ist; vgl. RiLi C-IV, 11.13.

4.) Erfinderische Tätigkeit; Art. 56 EPÜ

Die geänderten Ansprüche 1-8 sind aus folgenden Gründen erfinderisch:

Der nächstliegende Stand der Technik ist D1, weil dieser Artikel auch auf eine verbesserte Behandlung von *Ulcus pepticum* abzielt, wie auch die vorliegende Anmeldung; vgl. Abs. [006] A1.

Der Unterschied zwischen der beanspruchten Verbindung und der in D1 offenbarten Verbindung sind die Substituenten, vor allem R, denn R ist in D1 eine Dodecylgruppe und in Anspruch 1 eine Alkylgruppe mit 3-6 Kohlenstoffatomen.

Dieser Unterschied bewirkt, dass die Verbindung nicht nur einen guten Protonenpumpen-inhibierenden Effekt hat, sondern auch selbst einen Pylori-Dezimierungs-Effekt aufweist; vgl. Beispiel 6 (entspricht Verbindung aus D1) mit den Beispielen 5, 8, 10 und 11 aus A1.

Damit besteht die dem Gegenstand von Anspruch 1 zugrunde liegende technische Aufgabe darin, eine Belliake-Verbindung bereitzustellen, die selbst Pylori-Dezimierungseffekt hat ohne die Protonenpumpen-inhibitorische Wirkung zu beeinflussen.

Die D1 schlägt vor, Antibiotika mit NPDB zu mischen und dann zu verabreichen, um ein Medikament zu erhalten, das alle Symptome von *Ulcer*, also Säurebildung und Vorhandensein von *Helicobacter pylori*, behandeln kann.

Es wird in D1 nicht vorgeschlagen, die Substituenten zu verändern, um einen Pylori-Dezimierungseffekt zu bekommen, schon gar nicht, dass eine Kombination von R = Alkyl C₃₋₆ und Y = Aryl eine solche Wirkung erzeugt.

Die objektive technische Aufgabe wird durch die Verbindung gem. Anspruch 1 gelöst. Dies kann durch einen Vergleich des Beispiels 6, das der Verbindung aus D1 entspricht, mit den Beispielen 5, 8, 10 und 11, die jeweils eine Arylgruppe (Y) mit einer Alkylgruppe C_{3-C₆} (R) kombinieren, [belegt werden]. Während Beispiel 6 kaum Pylori-Dezimierungsfaktor (18) aufweist, haben die Beispiele 5 (79), 8 (82), 10 (70) und 11 (75) einen sehr hohen Pylori-Dezimierungsfaktor bei vergleichbarem Protoneninhibitionsfaktor.

Die D2 geht auf eine Pylori-dezimierende Wirkung gar nicht ein, so dass D2 die Information, die nötig wäre, um zum Gegenstand von Anspruch 1 zu gelangen, nicht liefern kann.

Damit basiert der Gegenstand von Anspruch 1 gegenüber D1 in Kombination mit D2 auf einer erfinderischen Tätigkeit.

Die Ansprüche 2 bis 6 und 8 sind von Anspruch 1 abhängig bzw. beinhalten durch Verweis auf Anspruch 1 alle Merkmale von Anspruch 1. Damit basiert auch der Gegenstand der Ansprüche 1-6 und 8 auf einer erfinderischen Tätigkeit; vgl. RiLi C-IV, 11.13.

Anspruch 7 ist ein Zwischenprodukt zur Herstellung der Verbindung gem. Anspruch 1, das alle wesentlichen strukturellen Elemente der Verbindung aus Anspruch 1 enthält. Damit basiert auch der Gegenstand von Anspruch 7 auf einer erfinderischen Tätigkeit.

Selbst wenn D2 als nächstliegender Stand der Technik gewählt würde, so basierte der Gegenstand von Anspruch 1 auch auf einer erfinderischen Tätigkeit.

Der Unterschied von Anspruch 1 zu D2 ist die spezifische Auswahl der Substituenten, die die technische Wirkung haben, dass die Verbindung neben der Protonenpumpeninhib. Wirkung auch Pylori-dezimierende Wirkung hat.

Damit ist auch das technische Problem, wie die Verbindungen aus D2 so verändert werden können, um einen Pylori-dezimierenden Effekt zu erzielen.

Weder D1 noch D2 liefern dazu Anhaltspunkte. Die D1 schlägt vor, Antibiotika zu kombinieren, um diesen Effekt zu erhalten.

Demnach ist Anspruch 1 auch erfinderisch, wenn D2 als nächstliegender StdT gewählt würde.

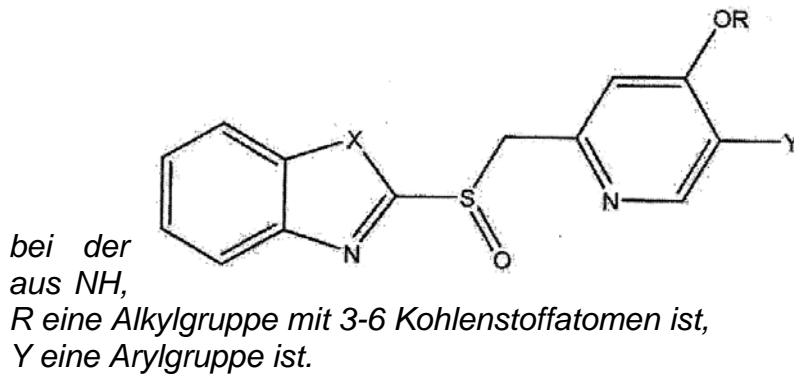
Damit erfüllen die Ansprüche 1-8 alle Erfordernisse des EPÜ.

(Unterschrift)

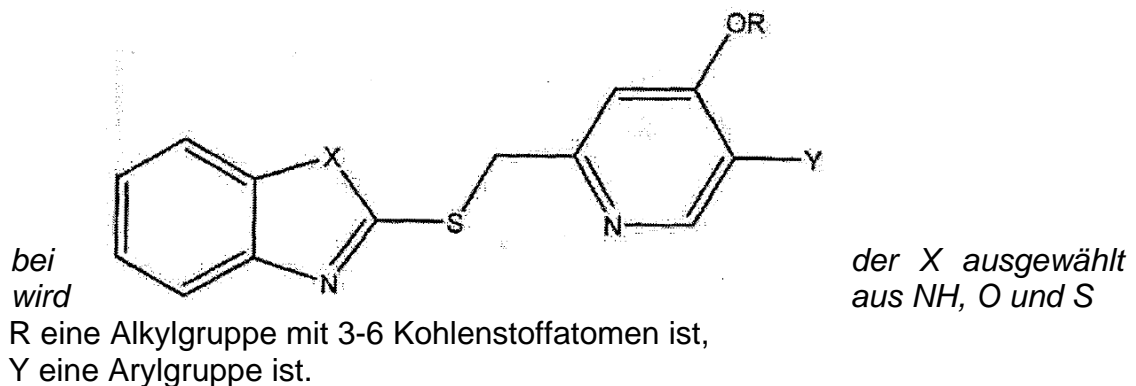
Anlage:
Ansprüche 1-8

Geänderte Ansprüche

1. Verbindung der Formel (1)

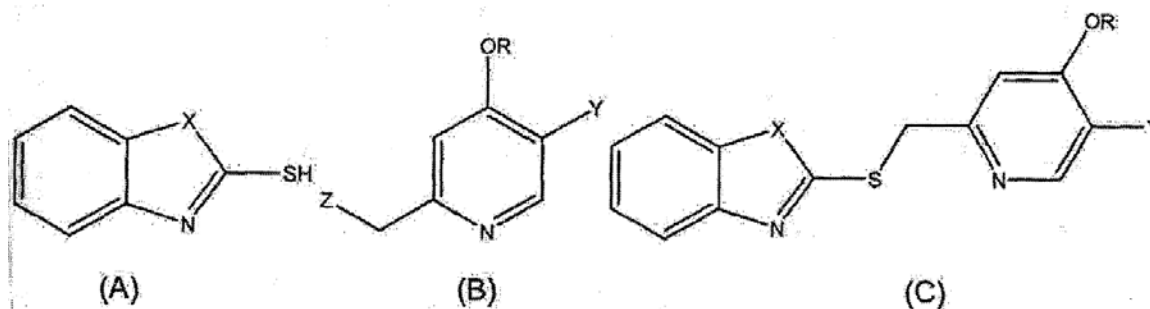


- ~~2. Verbindung nach Anspruch 1, bei der die Alkyl und Hydroxyalkylgruppen 3 bis 20 Kohlenstoffatome haben, vorzugsweise 3 bis 6 Kohlenstoffatome.~~
3. 2. Verbindung nach Anspruch 1, bei der die Arylgruppe aus Phenyl, Xylyl und Tolylyl ausgewählt wird.
- ~~4. Verbindung nach Anspruch 2, bei der die beiden Gruppen R und Y Alkyl sind.~~
- ~~5. 3. Verbindung nach Anspruch 1 zur Verwendung in der Medizin.~~
- ~~6. 4. Verbindung nach Anspruch 1 zur Verwendung bei der Behandlung von *Ulcus pepticum*.~~
- ~~7. 5. Zusammensetzung umfassend die Verbindung der Ansprüche 1 bis 4-3 und einen pharmazeutisch annehmbaren Trägerstoff.~~
- ~~8. 6. Tablette umfassend die Zusammensetzung nach Anspruch 7 5.~~
9. 7. Verbindung der Formel (C):



- ~~10. 8. Verfahren zur Herstellung der Verbindung nach Anspruch 1 umfassend folgende Schritte: (1) Umsetzung der Verbindung A mit der Verbindung B bei einer Temperatur von -78°C bis 0°C in Anwesenheit einer Base mit einem pKa-Wert größer 13, wie n-Butyllithium, Kalium-t-butoxid, Lithiumdiisopropylamid,~~

Lithiumdiethylamid und Natriumhydrid in einem Lösungsmittel, ausgewählt aus Ethoxyethan, Tetrahydrofuran und Dimethylformamid, zur Bildung der Verbindung C; und (2) Oxidation der Verbindung C mit einem aus *t*-Butylhydroperoxid, Peressigsäure, *m*-Chlorperbenzoesäure und Pyridiniumchlorchromat ausgewählten Oxidationsmittel unter Verwendung von Dichlormethan, Chloroform oder Toluol als Lösungsmittel, und wobei die Verbindungen A, B und C wie nachstehend definiert sind:



und Z eine Abgangsgruppe ist, die aus Br, I, Tosylat und Mesylat ausgewählt wird.

EXAMINATION COMMITTEE I

Candidate No.

Paper B (Chemistry) 2011 - Marking Sheet

Category		Maximum possible	Marks awarded	
			Marker	Marker
Claims	Compound / medical uses	25	25	25
	Intermediate compound	10	10	10
Arguments	Amendments	12	12	10
	Novelty	18	11	12
	Inventive Step	30	25	25
	Unity	5	5	5
Total		100	88	87

Examination Committee I agrees on 88 marks and recommends the following grade to the Examination Board:

PASS
(50-100)

COMPENSABLE FAIL
(45-49)

FAIL
(0-44)

30 June 2011

Chairman of Examination Committee I