

## ENTSCHEIDUNGEN DER BESCHWERDEKAMMERN

**Entscheidung der Technischen Beschwerdekammer 3.3.2 vom 25. Januar 1990**  
**T 18/88 - 3.3.2**  
 (Übersetzung)

Zusammensetzung der Kammer:

Vorsitzender: P. Lançon  
 Mitglieder: U. Kinkeldey  
 C. Holtz

**Anmelder/Beschwerdeführer: The Dow Chemical Company**

**Stichwort: Pyrimidine/DOW**

**Artikel: 56 EPÜ**

**Schlagwort: "erfinderische Tätigkeit (nein)" - "Zwischenprodukte"**

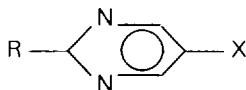
*Leitsatz*

*Zwischenprodukte werden nicht schon dadurch erfinderisch, daß die - weder neuen noch erfinderischen - Weiterverarbeitungsprodukte eine überlegene Wirkung aufweisen (vgl. Nr. 8 der Entscheidungsgründe).*

### Sachverhalt und Anträge

I. Die am 8. Juni 1983 eingereichte und unter der Nr 97 451 veröffentlichte europäische Patentanmeldung Nr. 83 303 322.8 wurde mit Entscheidung der Prüfungsabteilung vom 29. Juli 1987 zurückgewiesen. Der Entscheidung lag der eingeschränkte Satz aus den Ansprüchen 1 bis 5 in der ursprünglich eingereichten Fassung zugrunde. Anspruch 1 lautet wie folgt:

"1. Verbindung der Formel



wobei R eine Cyclopropyl-, Isopropyl- oder t-Butyl-Gruppe und X ein Chlor- oder Bromatom ist"

II. Die Anmeldung wurde mit der Begründung zurückgewiesen, daß der Gegenstand der Ansprüche im Hinblick auf die folgenden Entgegenhaltungen nicht auf einer erfinderischen Tätigkeit im Sinne des Artikels 56 EPÜ beruhe:

- (1) *Chemical Abstracts* 44: 1516g
- (2) "The Pyrimidines", *Supplement I*, D. J. Brown 1970, Wiley Interscience, Seiten 119 bis 122
- (3) "Antifungal Compounds", Segel & Sisler, Vol. I, Marcel Dekker, Inc., N. Y. & Basel, 1980, Seite 7
- (4) FR-A-2 365 577 (entspricht US-A-4 127 652)
- (5) EP-A-0 009 566

## DECISIONS OF THE BOARDS OF APPEAL

**Decision of Technical Board of Appeal 3.3.2 dated 25 January 1990**  
**T 18/88 - 3.3.2**  
 (Official Text)

Composition of the Board:

Chairman: P. Lançon  
 Members: U. Kinkeldey  
 C. Holtz

**Applicant/Appellant: The Dow Chemical Company**

**Headword: Pyrimidines/DOW**

**Article: 56 EPC**

**Keyword: "Inventive step (no)" - "Intermediates"**

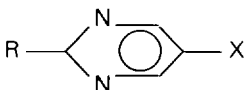
*Headnote*

*The superior effect of subsequent products which are neither novel nor inventive is not sufficient to make the intermediates inventive (cf point 8 of the reasons).*

### Summary of Facts and Submissions

I. European patent application No. 83 303 322.8, which was filed on 8 June 1983 and published under No. 97 451, was refused by a decision of the Examining Division of 29 July 1987. The decision was based on the limited set of Claims 1-5 as originally filed. Claim 1 reads as follows:

"1. A compound having the formula:



wherein R is a cyclopropyl, isopropyl or t-butyl group and X is a chlorine or bromine atom."

II. The ground for refusal was that the subject-matter of the claims did not involve an inventive step within the meaning of Article 56 EPC in view of the following documents:

- (1) *Chemical Abstracts* 44: 1516g
- (2) "The Pyrimidines", *Supplement I*, D. J. Brown 1970, Wiley Interscience, pages 119 to 122
- (3) "Antifungal Compounds", Segel & Sisler, Vol. I, Marcel Dekker, Inc., N. Y. & Basel, 1980, page 7
- (4) FR-A-2 365 577 (equivalent to US-A-4 127 652)
- (5) EP-A-0 009 566

## DECISIONS DES CHAMBRES DE RECOURS

**Décision de la Chambre de recours technique 3.3.2, en date du 25 janvier 1990**  
**T 18/88 - 3.3.2**  
 (Traduction)

Composition de la Chambre:

Président: P. Lançon  
 Membres: U. Kinkeldey  
 C. Holtz

**Demandeur/requérant: The Dow Chemical Company**

**Référence: Pyrimidines/DOW**

**Article: 56 CBE**

**Mot-clé: "Activité inventive (non)" - "Produits intermédiaires"**

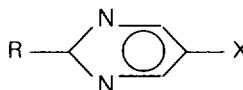
*Sommaire*

*L'effet supérieur de produits de transformation ultérieure qui ne sont ni nouveaux ni inventifs ne suffit pas pour rendre les produits intermédiaires inventifs (cf point 8 de l'exposé des motifs).*

### Exposé des faits et conclusions

I. La demande de brevet européen n° 83 303 322.8, déposée le 8 juin 1983 et publiée sous le n° 97 451, a été rejetée par décision de la division d'examen en date du 29 juillet 1987. Cette décision reposait sur un jeu limité de revendications 1 à 5 telles qu'initialement déposées. La revendication 1 est rédigée comme suit:

"1. Composé de formule



dans laquelle R représente un groupe de cyclopropyle, d'isopropyle ou de t-butyle, et X un atome de chlore ou de brome."

II. La demande a été rejetée au motif que l'objet des revendications n'impliquait aucune activité inventive au sens de l'article 56 CBE, par rapport aux documents suivants:

- 1) *Chemical Abstracts* 44: 1516g
- 2) "The Pyrimidines", *Supplement I*, D. J. Brown 1970, Wiley Interscience, pages 119 à 122
- 3) "Antifungal Compounds", Segel & Sisler, Vol. I, Marcel Dekker, Inc., N. Y. & Bâle, 1980, page 7
- 4) FR-A-2 365 577 (correspond à US-A-4 127 652)
- 5) EP-A-0 009 566

In ihrer Entscheidung erklärte die Prüfungsabteilung, Hauptzweck der beanspruchten Verbindungen sei ihre Verwendung als Zwischenprodukte für die Herstellung von O-Alkyl-O-(pyrimidin(5)yl)-(thiono)(thiol)-phosphor(phosphon)-säureestern bzw. -esteramiden. Diese Endprodukte wiesen eine außergewöhnliche insektizide Wirksamkeit auf und seien kommerziell äußerst erfolgreich.

Im Prüfungsverfahren reichte die Beschwerdeführerin Unterlagen ein, die zeigten, daß es unter den gewünschten Endprodukten drei gebe, in denen R für t-Butyl, Isopropyl bzw. Cyclopropyl stehe und deren insektizide Wirkung der Wirkung einer Verbindung derselben Formel, in der R für Methyl stehe, überlegen sei.

Die Prüfungsabteilung entschied, daß diese Unterlagen für den geprüften Gegenstand nicht relevant seien, weil die drei überlegenen Verbindungen nicht Gegenstand der Ansprüche seien. Außerdem stellte sie fest, daß die Verbindung, in der R für Isopropyl stehe, bereits in der Entgegenhaltung 4 und die Verbindung, in der R für Cyclopropyl stehe, in der Entgegenhaltung 5 offenbart worden sei; auch seien die insektiziden Eigenschaften der besagten Endprodukte im Hinblick auf die Entgegenhaltung 3 nicht überraschend.

Auch wenn die beanspruchten Verbindungen neu seien, weise ihre Struktur nichts Überraschendes auf. Sie hätten ohne weiteres durch eine Änderung der in den Entgegenhaltungen 1 oder 2 offenbarten Verfahren hergestellt werden können.

Des weiteren könnten die Zwischenprodukte leicht zu den jeweiligen Hydroxy-Verbindungen hydrolysiert werden, die gewöhnlich zur synthetischen Herstellung der vorstehend beschriebenen, höchst erwünschten Endprodukte verwendet würden.

III. Am 29. September 1987 wurde gegen diese Entscheidung Beschwerde eingelegt und die Beschwerdegebühr entrichtet. Die Beschwerdebegründung wurde am 25. November 1987 eingereicht.

IV. Die mündliche Verhandlung fand am 25. Januar 1990 statt.

V. Die von der Beschwerdeführerin im Beschwerdeverfahren vorgebrachten Argumente lassen sich wie folgt zusammenfassen (s. Absätze a - d); sie werden durch die folgenden Dokumente gestützt:

(6) "The Pyrimidines", Supplement I, D. J. Brown 1970, Wiley Interscience, Kapitel II und III und Seiten 148-149

In its decision, the Examining Division stated that the main purpose of the claimed compounds was their use as intermediates for preparing O-alkyl-O-(pyrimidine(5)yl)-(thiono)(thiol)-phosphoric(phosphonic) acid esters or ester-amides. These end products had an exceptional insecticidal activity and commercial success.

During the examination procedure, evidence was filed by the Appellants that among the desired end products there are three in which R was t-butyl, isopropyl or cyclopropyl, which were superior in their insecticidal activity over a compound of the same formula in which R was methyl.

The Examining Division concluded that, since the three superior compounds were not the subject-matter of the claims, this evidence would not be relevant for the examined subject-matter. Further, it was remarked that in any case the compound in which R is isopropyl was already described in document (4), the compound in which R is cyclopropyl was disclosed in document (5) and, in view of document (3), that the insecticidal properties of the said end products were not surprising.

Although the compounds as claimed were novel, their structure showed nothing surprising. They could have been obtained easily by a modification of the processes disclosed in documents (1) or (2).

Further, the intermediates were easily hydrolysable into the respective hydroxy compounds which were classically used for synthesizing the highly desirable end products as described above.

III. A notice of Appeal against this decision was filed on 29 September 1987, together with the appeal fee. A statement of grounds was filed on 25 November 1987.

IV. Oral proceedings took place on 25 January 1990.

V. The arguments put forward by the Appellants during the appeal procedure can be summarised as follows in subparagraphs (a) to (d) and are supported by the following documents:

(6) "The Pyrimidines", Supplement I, D.J. Brown 1970, Wiley Interscience, Chapters II and III and pages 148-149

Dans sa décision, la division d'examen a déclaré que les composés revendiqués avaient principalement pour objet de servir de produits intermédiaires en vue de la préparation d'esters ou d'ester-amides de l'acide O-alkyle-O-(pyrimidine(5)yle)-(thiono)(thiol)-phosphorique (phosphonique). Ces produits finals ont un effet insecticide exceptionnel et connaissent un énorme succès commercial.

Au cours de la procédure d'examen, le requérant a présenté des documents prouvant que dans trois des produits finals souhaités, R est du t-butyle, de l'isopropyle ou du cyclopropyle, dont l'activité insecticide est supérieure à celle d'un composé de même formule dans laquelle R est du méthyle.

La division d'examen a conclu que ces preuves n'étaient pas pertinentes quant à l'objet examiné, puisque les trois composés supérieurs ne sont pas l'objet des revendications. Elle a également relevé qu'en tout état de cause, le composé dans lequel R est de l'isopropyle était déjà décrit dans le document (4), que le composé dans lequel R est du cyclopropyle était divulgué dans le document (5) et que les propriétés insecticides desdits produits finals n'étaient pas surprenantes, compte tenu du document (3).

Bien que les composés revendiqués répondent à l'exigence de nouveauté, leur structure n'arien de surprenant. Ils auraient pu être obtenus facilement en modifiant les procédés divulgués dans les documents (1) ou (2).

En outre, il est facile d'obtenir, en hydrolysant les produits intermédiaires, les composés hydroxy correspondants, qui sont habituellement utilisés pour synthétiser les produits finals particulièrement souhaités décrits plus haut.

III. Un recours a été formé contre cette décision le 29 septembre 1987, et la taxe correspondante a été simultanément acquittée. Un mémoire exposant les motifs du recours a été déposé le 25 novembre 1987.

IV. La procédure orale s'est déroulée le 25 janvier 1990.

V. Les arguments invoqués par le requérant au cours de la procédure de recours sont résumés ci-après aux alinéas a) à d); ils sont fondés sur les documents suivants:

(6) "The Pyrimidines", Supplement I, D.J. Brown 1970, Wiley Interscience, chapitres II et III, et pages 148 et 149;

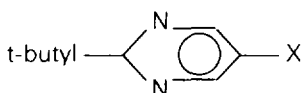
(7) die beim Europäischen Patentamt mit Schreiben vom 1. April 1986 eingereichten Versuchsergebnisse  
 (8) mehrere, zusammen mit der Beschwerdebegründung eingereichte Reaktionsschemata für die Herstellung der Verbindungen der Formel III  
 (9) in der mündlichen Verhandlung vorgelegte Versuchsdaten

a) Die Beschwerdeführerin räumte ein, daß Endprodukte, in denen R Isopropyl sei, in der Entgegenhaltung 4 offenbart worden seien. Auf die Verbindung, in der R für Cyclopropyl stehe, sei in der Entgegenhaltung 5 Bezug genommen worden. Eine entsprechende Verbindung, in der R t-Butyl sei, sei zu diesem Zeitpunkt noch nicht offenbart gewesen. Aus den Entgegenhaltungen 4 und 5 sei bekannt gewesen, daß die besagten Endprodukte anhand der in diesen Dokumenten angegebenen Literatur aus den entsprechenden Hydroxypyrimidinen hergestellt werden könnten.

Die Beschwerdeführerin wies für den Fall, daß die Kammer die Entgegenhaltungen 4 und 5 für den nächstliegenden Stand der Technik halten sollte, darauf hin, daß bei der Beurteilung der erfinderischen Tätigkeit zwischen den drei beanspruchten Verbindungen differenziert werden müsse, weil nur zwei der drei möglichen Varianten der Endprodukte, in denen R für Isopropyl, Cyclopropyl oder t-Butyl stehen könne, aus den genannten Entgegenhaltungen bekannt seien. Eine Verbindung, in der R t-Butyl sei, sei nicht bekannt, so daß zumindest die entsprechende beanspruchte Verbindung für patentfähig erachtet werde.

In Zusammenhang mit dieser Erklärung reichte die Beschwerdeführerin in der mündlichen Verhandlung einen Hilfsantrag ein, der auf einem einzigen Anspruch beruht und wie folgt lautet:

"1. Verbindung der Formel



wobei X ein Chlor- oder ein Bromatom ist"

b) Die Beschwerdeführerin bestritt aber, daß die Hydrolyse der beanspruchten Verbindungen so einfach sei, wie die Prüfungsabteilung behauptete. Bei Bezugnahmen auf das Dokument 6 müsse man bedenken, daß darin nicht die Hydrolyse von 5-Halopyrimidinen, den beanspruchten Verbindungen, sondern die Hydrolyse von 2-, 4- oder 6-Halopyrimidinen beschrieben sei und kein Hinweis darauf vorliege, daß die Hydrolyse von 5-Halopyrimidinen durchführbar sei. Daher würde der Fachmann durch die Lektüre dieses Dokuments sicher nicht zu der Annahme veranlaßt, daß die Hydrolyse

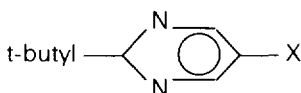
(7) the Test Results submitted to the European Patent Office with letter dated 1 April 1986  
 (8) several reaction schemes showing how to prepare compounds of formula (III) submitted with the Grounds for Appeal  
 (9) experimental data submitted during the oral proceedings.

(a) It was accepted by the Appellants that end products, in which R is isopropyl, had been disclosed in document (4). The compound, in which R is cyclopropyl, had been referred to in document (5). A corresponding compound, in which R is t-butyl, had not been disclosed at that date. From documents (4) and (5), it was known to prepare said end products from the corresponding hydroxy pyrimidines by reference to the literature in these documents.

The Appellants emphasised that, in the event that documents (4) and (5) were considered by the Board as closest prior art, one had to differentiate the three compounds as claimed when evaluating the inventive step, because only two variants out of the three possibilities of the end products wherein R may be isopropyl, cyclopropyl or t-butyl were known by the mentioned documents. A compound wherein R is t-butyl was not known and therefore at least the corresponding claimed compound was held to be patentable

In connection with this statement, the Appellants submitted during oral proceedings a subsidiary request based on one single claim, which reads:

"1. A compound having the formula:



wherein X is a chlorine or bromine atom."

(b) But the Appellants contested that hydrolysis of the claimed compounds is easy as assumed by the Examining Division. When referring to document (6), one had to bear in mind that it did not describe the hydrolysis of 5-halopyrimidines, which are the claimed compounds, but rather the hydrolysis of 2-, 4- or 6-halopyrimidines and there was no suggestion that the hydrolysis of 5-halopyrimidines was feasible. Thus, the skilled man on reading document (6) would certainly not be led to believe that hydrolysis of the claimed compounds to the above-mentioned hydroxy compounds was

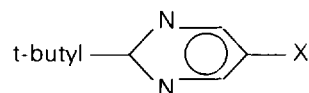
7) les résultats d'expériences communiqués à l'Office européen des brevets par lettre du 1<sup>er</sup> avril 1986;  
 8) plusieurs schémas de réaction permettant d'obtenir les composés de la formule (III), joints au mémoire exposant les motifs du recours;  
 9) des données expérimentales communiquées lors de la procédure orale

a) Le requérant a admis que les produits finals dans lesquels R représente de l'isopropyle, avaient été divulgués dans le document (4). Le composé dans lequel R est du cyclopropyle a été mentionné dans le document (5). Un composé correspondant, dans lequel R représente du t-butyle, n'avait pas encore été divulgué à ce jour. La littérature citée dans les documents (4) et (5) indique qu'il est possible de préparer lesdits produits finals à partir des hydroxy-pyrimidines correspondantes.

Le requérant a fait remarquer, au cas où la Chambre considérerait les documents (4) et (5) comme l'état de la technique le plus proche, qu'il y avait lieu, lors de l'appréciation de l'activité inventive, d'établir une distinction entre les trois composés revendiqués car, sur les trois possibilités de produits finals dans lesquels R peut être de l'isopropyle, du cyclopropyle ou du t-butyle, deux seulement sont mentionnées dans les documents cités. Etant donné qu'un composé dans lequel R est du t-butyle n'est pas connu, le composé correspondant revendiqué est donc, lui au moins, brevetable.

Relativement à cette déclaration, le requérant a déposé au cours de la procédure orale une requête subsidiaire reposant sur une seule revendication, formulée comme suit:

"1. Composé de formule:



dans laquelle X est un atome de chlore ou de brome."

b) Le requérant a cependant réfuté l'affirmation de la division d'examen selon laquelle il est facile d'hydrolyser les composés revendiqués. En citant le document (6), il faut garder à l'esprit qu'il ne décrit pas l'hydrolyse de 5-halopyrimidines, qui sont les composés revendiqués, mais celle de 2-, 4- ou 6-halopyrimidines, et ne suggère aucunement que l'hydrolyse de 5-halopyrimidines est réalisable. Ainsi, la lecture du document (6) ne porterait certainement pas l'homme du métier à croire qu'il est facile d'obtenir les composés hydroxy susmentionnés par hydrolyse des composés revendiqués. Ce docu-

der beanspruchten Verbindungen zu den oben genannten Hydroxy-Verbindungen einfach sei. Das Dokument würde ihn vielmehr davon abhalten, die beanspruchten Verbindungen als Ausgangsstoffe für die Herstellung der gewünschten Endprodukte zu verwenden. Außerdem bewiesen die in der mündlichen Verhandlung mit Dokument 9 vorgelegten Versuchsdaten, daß die Hydrolyse der beanspruchten Verbindungen, insbesondere des 5-Brom-2-t-butyl-pyrimidins unter besonderen Bedingungen durchgeführt werden müsse, damit eine annehmbare Ausbeute erzielt werde. Unter den in Dokument 6 beschriebenen Bedingungen, zu denen die Verwendung von Wasser gehöre, werde eine Ausbeute an 5-Hydroxyderivat von weniger als 6% erzielt. Der Wassergehalt sei daher für die Ausbeute an dem hydrolysierten Produkt entscheidend. Die Daten zeigten, daß selbst das Vorhandensein geringer Mengen Wasser die prozentuale Ausbeute an der 5-Hydroxyverbindung sehr beeinträchtigt.

c) Die vorliegende Erfindung liefere ferner ein neues, alternatives Verfahren für die Herstellung von Hydroxy-Zwischenprodukten zur Verwendung bei der Herstellung der gewünschten Endprodukte. Dies gelte besonders für die t-Butyl-Variante der beanspruchten Verbindungen, die nach dem in Dokument 8 beschriebenen Reaktionsschema F hergestellt werden könne. Damit die aus dem Stand der Technik bekannten, in den Reaktionsschemata als A-E definierten Methoden zur Herstellung der Verbindung der beanspruchten allgemeinen Formel, in der R für t-Butyl stehe, verwendet werden könnten, werde ein teures Amidin-Reagens, nämlich Pivalamidin, benutzt. Bei dem im Reaktionsschema F beschriebenen Verfahren, in dem die beanspruchten Verbindungen verwendet würden, könne auf das teure Amidin verzichtet werden.

d) Was nun die Entgegenhaltung 1 anbelange, so offenbare diese zwar eine Verbindung mit der allgemeinen Formel der beanspruchten Verbindungen, in der R für Methyl steht, jedoch - was entscheidend sei - keinerlei Verwendung dieser Verbindungen; dieses Dokument enthalte nichts, was die Herstellung der Isopropyl-, Cyclopropyl- oder t-Butyl-Entsprechungen dieser Verbindung für den patentgemäßen Zweck nahelege. Vor allem käme der Fachmann, dem ja bewußt sei, daß die Herstellung eines 5-Halopyrimidins nicht einfach sei. bei Durchsicht der Entgegenhaltung 1 nicht auf den Gedanken, die beanspruchten Verbindungen bereitzustellen.

VI. Die Beschwerdeführerin beantragte die Aufhebung der angefochtenen Entscheidung und die Erteilung eines Patents auf der Grundlage der von der Prüfungsabteilung zurückgewiesenen

straightforward. This document in fact taught away from the concept of employing the claimed compounds as a starting material for the production of the desired end products. Further, experimental data, submitted as document (9) during oral proceedings, provided evidence that hydrolysis of the claimed compounds, in particular of 5-bromo-2-t-butyl-pyrimidine, was to be carried out under special conditions so as to provide reasonable yield. Under conditions as described in document (6), in which use of water was implied, less than 6% yield of the 5-hydroxy derivative is obtained. The water content was, therefore, decisive in respect of the yield of the hydrolysed product. The data showed that the presence of even small amounts of water had a very deleterious effect on the percentage yield of the 5-hydroxy compound.

(c) The present invention also provided a novel and alternative process for the production of hydroxy intermediates for use in the manufacture of the desired end products. This was particularly the case for the t-butyl alternative of the claimed compounds which could be produced by reaction scheme F set out in document (8). To employ any of the prior art methods for providing the compound of the general formula of the claimed compounds, wherein R is t-butyl, defined in the reaction schemes as methods A-E, use is made of an expensive amidine reagent, namely pivalamidine. By employing the process described in reaction scheme F, which utilises the claimed compounds, the use of an expensive amidine was avoided.

(d) Having regard to the disclosure of document (1), it was decisive that, although in this document a compound having the general formula of the claimed compounds was described, in which R is methyl, there was no disclosure whatsoever in this document of any use of these compounds and nothing in that document would suggest making the isopropyl, cyclopropyl or t-butyl analogues of that compound for the purpose as described in the patent. In particular, when having in mind that it was not a simple matter to hydrolyse a 5-halopyrimidine, a skilled man faced with document (1) would not have thought about providing the claimed compounds.

VI. The Appellants requested that the decision under appeal be set aside and a patent be granted on the basis of Claims 1-5 as rejected by the Examining Division or, as a subsidiary

ment le dissuaderait plutôt d'utiliser les composés revendiqués comme substances de départ en vue de l'obtention des produits finals désirés. Par ailleurs, les données expérimentales communiquées sous la forme du document (9) au cours de la procédure orale prouvent que l'hydrolyse des composés revendiqués, en particulier de la 5-bromo-2-t-butyle-pyrimidine, doit, pour donner un rendement raisonnable, être effectuée dans des conditions spéciales. Dans les conditions décrites dans le document (6) où de l'eau est utilisée, un rendement de moins de 6% a été obtenu pour le dérivé 5-hydroxy. En conséquence, la teneur en eau influe de manière déterminante sur le rendement du produit hydrolysé. Les données fournies montrent que la présence d'eau, ne serait-ce qu'en petite quantité, nuit considérablement au rendement en pourcentage du composé 5-hydroxy.

c) La présente invention fournit également un procédé nouveau et différent de fabrication de produits intermédiaires hydroxy utilisables dans la fabrication des produits finals désirés. Cela est notamment le cas de la variante t-butyle des composés revendiqués, qui peut être obtenue selon le schéma de réaction F décrit dans le document (8). Pour pouvoir utiliser les méthodes figurant dans l'état de la technique et visant à fabriquer le composé de la formule générale revendiquée, où R est du t-butyle, qui sont dénommées méthodes A-E dans les procédés de réaction, on utilise un coûteux réactif d'amidine, à savoir la pivalamidine. Selon le procédé décrit dans le schéma de réaction F, où les composés revendiqués sont utilisés, le recours à une amidine coûteuse a été évité.

d) Quant au document (1), il divulgue certes un composé ayant la formule générale des composés revendiqués, dans laquelle R est du méthyle, mais, et cela est décisif, il ne mentionne aucunement l'utilisation de ces composés, et rien n'y donne à penser que l'isopropyle, le cyclopropyle ou le t-butyle sont des composés analogues à ce composé aux fins décrites dans le brevet. En particulier, sachant qu'il n'est pas facile d'hydrolyser une 5-halopyrimidine, l'homme du métier n'aurait pas songé, en lisant le document (1), à préparer les composés revendiqués.

VI. Le requérant a demandé l'annulation de la décision attaquée et la délivrance d'un brevet sur la base des revendications 1 à 5 telles que rejetées par la division d'examen ou, à titre

Patentansprüche 1 - 5 oder - hilfsweise - auf der Grundlage des in der mündlichen Verhandlung vor der Kammer eingereichten Anspruchs.

### Entscheidungsgründe

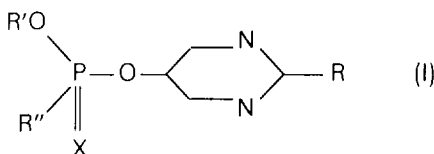
1. Die Beschwerde entspricht den Artikeln 106 bis 108 und Regel 64 EPÜ; sie ist somit zulässig

2. In der angefochtenen Entscheidung wurden die Verbindungen nach den eingereichten Ansprüchen 1 - 5 als neu anerkannt; die Kammer sieht keinen Grund, hierüber von Amts wegen (Art. 114 (1) EPÜ) Ermittlungen anzustellen.

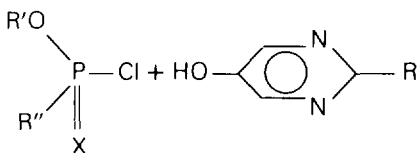
3. Zu klären ist die Frage, ob der Gegenstand des Anspruchs 1 die in Artikel 56 EPÜ geforderte erfinderische Tätigkeit aufweist.

Die Erfindung bezieht sich auf Verbindungen der Formel nach Anspruch 1. Diese Verbindungen dienen als Ausgangsstoffe für die Herstellung bestimmter Endprodukte, die eine ungewöhnlich hohe insektizide Wirksamkeit aufweisen.

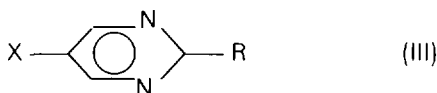
Die allgemeine Formel der Endprodukte lautet wie folgt:



Diese werden im allgemeinen auf folgende Weise hergestellt:



Gegenstand der angefochtenen Ansprüche sind Verbindungen der allgemeinen Formel



wobei R dieselbe Bedeutung hat wie das R der erfolgreichsten Verbindungen der Formel I und X für ein Chlor- oder Bromatom steht.

Die Verbindungen der Formel III treten in einem Verfahren zur Herstellung von Weiterverarbeitungsprodukten auf und liefern einen Strukturbeitrag zu diesen. Sie können daher als Zwischenprodukte bezeichnet werden. Die beanspruchten Zwischenprodukte müssen selbst auf erfinderischer Tätigkeit beru-

request, on the basis of the claim submitted during oral proceedings before the Board of Appeal.

### Reasons for the Decision

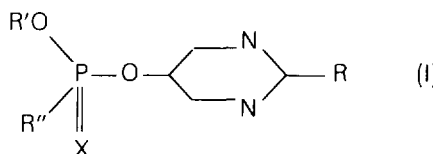
1. The appeal complies with Articles 106 to 108 and Rule 64 EPC and is, therefore, admissible.

2. In the contested decision, novelty of the compounds of Claims 1-5 on file has been acknowledged and the Board sees no reason to raise this issue of its own motion (Article 114(1) EPC)

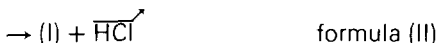
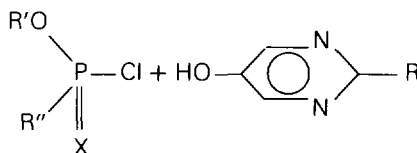
3. The issue to be dealt with is whether the subject-matter of Claim 1 involves an inventive step as required by Article 56 EPC

The invention relates to compounds having the formula of Claim 1. Such compounds are starting materials for the preparation of certain end products having exceptional insecticidal activity.

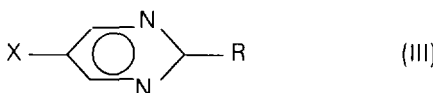
The general formula of the end products is as follows:



and they are generally synthesised by the following route:



The subject-matter of the disputed claims are compounds of the general formula:



wherein R has the same meaning as the R of the most successful compounds of formula (I) and wherein X is a chlorine or a bromine atom.

The compounds of formula (III) take part in a process for the production of subsequent products and provide a structural contribution to the subsequent products. They can therefore be qualified as intermediates. The claimed intermediates must themselves be based on an inventive step in

subsidaire, sur la base de la revendication communiquée lors de la procédure orale devant la Chambre de recours

### Motifs de la décision

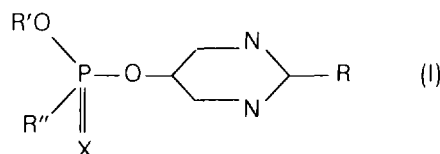
1. Le recours répond aux conditions énoncées aux articles 106, 107 et 108, ainsi qu'à la règle 64 CBE; il est donc recevable.

2. Dans la décision attaquée, la nouveauté des composés selon les revendications 1 à 5 déposées a été reconnue, de sorte que la Chambre ne voit aucune raison d'examiner ce point d'office (article 114(1) CBE).

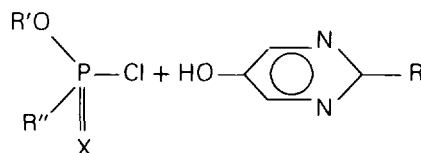
3. La question qui se pose est de savoir si l'objet de la revendication 1 implique une activité inventive comme prescrit à l'article 56 CBE

L'invention porte sur des composés ayant la formule selon la revendication 1. Ces composés sont des substances de départ en vue de l'obtention de certains produits finals présentant une activité insecticide exceptionnelle.

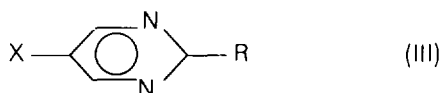
La formule générale des produits finals est la suivante:



Ceux-ci sont généralement synthétisés comme suit:



Les revendications incriminées ont pour objet les composés de formule générale



dans laquelle R a le même sens que le R des composés les plus satisfaisants de la formule (I), et où X est un atome de chlore ou de brome

Les composés de la formule (III) interviennent dans un procédé de fabrication de produits de transformation ultérieure et ils fournissent une contribution structurelle à ceux-ci. Ils peuvent donc être qualifiés de produits intermédiaires. Les produits intermédiaires revendiqués doivent eux-mêmes se

hen. um patentierbar zu sein. Ob diese Voraussetzung erfüllt ist, muß nun unter Berücksichtigung des Stands der Technik entschieden werden. Wie eine Beschwerdekammer bereits in einer früheren Entscheidung festgestellt hatte, sind als Stand der Technik in bezug auf die Zwischenprodukte zwei verschiedene Bereiche in Betracht zu ziehen, nämlich zum einen der "zwischenproduktnahe" und zum anderen der "produktnahe" Stand der Technik (siehe T 65/82, ABI EPA 1983, 327).

4. Wie von der Beschwerdeführerin selbst wiederholt erwähnt wurde, war dem Fachmann einerseits bekannt, daß die Verbindungen der Formel I konkret aus den entsprechenden Verbindungen der Formel II hergestellt werden. So war aus der Entgegnung 5 beispielsweise bekannt, daß die Verbindungen der Formel I durch Reaktion der entsprechenden Hydroxy-Verbindungen der allgemeinen Formel II mit anderen Verbindungen hergestellt werden können (siehe Seite 2, Zeile 11 bis Seite 4, Zeile 19). Auch in der Entgegnung 4 heißt es auf Seite 4, Zeilen 23 - 26, daß die Verbindungen der Formel I mit dem in der Literatur beschriebenen Verfahren hergestellt werden können, ohne daß diese Bezugnahmen jedoch näher bezeichnet werden.

Andererseits war allgemein bekannt, daß die Verbindungen der Formel II durch Hydrolyse der entsprechenden Halopyrimidine der Formel III hergestellt werden können, wie es die Literatur lehrt (siehe Beschreibung der Patentanmeldung, Seite 2, Zeilen 9 - 12 und der dort zitierte Stand der Technik).

5. Nach Prüfung aller Dokumente aus den beiden im Verfahren genannten Bereichen ist die Kammer zu der Auffassung gelangt, daß die Entgegnungen 4 und 5, die beide zum zweiten, nämlich dem "produktnahen" Bereich gehören, den nächstliegenden Stand der Technik bilden. In beiden Entgegnungen wird eine Verbindung beschrieben, deren Formel unter die Formel I fällt.

In der Entgegnung 4 werden die gewünschten überlegenen insektiziden O-Alkyl-O-(pyrimidin(5)yl)-(thiono)(thiol)-phosphor (phosphon)-säureester bzw. -esteramide beschrieben, in denen der Rest R für Isopropyl steht.

In der Entgegnung 5 wird eine Verbindung derselben Formel beschrieben, in der der Rest R aus Cyclopropyl besteht.

6. Der vorliegenden Patentanmeldung liegt im Hinblick auf die Entgegnungen 4 und 5 die technische Aufga-

order to be patentable. Whether or not this condition is fulfilled has to be decided by taking the state of the art into consideration. As already stated in an earlier decision by a Board of Appeal, the state of the art in relation to intermediates is to be found in two different areas. One of them is the "close-to-the-intermediate" state of the art. The other one is the "close-to-the-product" state of the art (see T 65/82, OJ EPO 1983, 327).

4. As repeatedly mentioned by the Appellants themselves, the skilled man was on the one hand aware that the compounds of formula (I) were specifically prepared from the corresponding compounds of formula (II). For instance, from document (5) it was known that the compounds of formula (I) could be made by the reaction of the corresponding hydroxy compounds of the general formula (II) with other compounds (see passage from page 2, line 11, to page 4, line 19). Also document (4) states on page 4, lines 23-26, that the compounds of formula (I) can be prepared by the process described in the literature without, however, specifying these references more closely.

On the other hand, the compounds of formula (II) were generally known to be obtained by hydrolysis of the corresponding halopyrimidines of formula (III) as taught in the literature (see description of the patent application, page 2, lines 9 to 12, and the state of the art quoted there).

5. After consideration of all the documents from both areas cited during the proceedings, it is the Board's opinion that documents (4) and (5) respectively, which belong to the second, namely the "close-to-the-product" area, represent the closest state of the art. In each of these documents, one compound is described whose formula is encompassed by formula (I).

According to document (4), the desired superior insecticidal O-alkyl-O-(pyrimidine(5)yl)-(thiono)(thiol)-phosphoric (phosphonic) acid esters or ester-amides are described in which the residual R is isopropyl.

According to document (5), a compound of the same formula is described, wherein the residual R is represented by cyclopropyl.

6. The technical problem underlying the present patent application can be seen, in view of documents (4) and (5)

fonder sur une activité inventive pour être brevetables. Pour savoir si cette condition est remplie, il faut tenir compte de l'état de la technique. Comme l'avait déjà déclaré une Chambre de recours dans une précédente décision, il faut prendre en considération deux domaines différents quand l'état de la technique est en rapport avec des produits intermédiaires: d'une part, l'état de la technique "proche du produit intermédiaire" et, d'autre part, l'état de la technique "proche du produit" (cf. T 65/82, JO OEB 1983, 327).

4. Comme le requérant lui-même l'a déclaré à plusieurs reprises, l'homme du métier sait que les composés de la formule I sont obtenus à partir des composés correspondants de la formule II. Le document (5), par exemple, révèle que les composés de la formule (I) peuvent être obtenus par réaction des composés hydroxy correspondants de la formule générale (II) avec d'autres composés (cf. page 2, ligne 11, à page 4, ligne 19). De même, il est dit dans le document (4), page 4, lignes 23 à 26, que les composés de la formule (I) peuvent être obtenus selon le procédé décrit dans la littérature, mais il n'est pas précisé de quelles publications il s'agit.

Par ailleurs, il est notoire que les composés de la formule (II) sont obtenus par hydrolyse des halopyrimidines correspondantes de la formule (III), comme cela est enseigné dans la littérature (cf. description de la demande de brevet, page 2, lignes 9 à 12, et l'état de la technique qui s'y trouve cité).

5. Après avoir examiné l'ensemble des documents concernant les deux domaines cités lors de la procédure, la Chambre estime que les documents (4) et (5), qui relèvent tous deux du second domaine, à savoir celui qui est "proche du produit", représentent l'état de la technique le plus proche. Ces documents décrivent chacun un composé dont la formule est comprise dans la formule (I).

Dans le document (4), une description est donnée des esters ou ester-amides de l'acide insecticide supérieur désiré O-alkyle-O-(pyrimidine(5)yle)-(thiono)-(thiol) phosphorique (phosphonique), dans lesquels le R résiduel est de l'isopropyle.

Dans le document (5), un composé de la même formule est décrit, où le R résiduel est du cyclopropyle.

6. Compte tenu des documents (4) et (5), le problème technique à résoudre dans la présente demande de brevet

be zugrunde, neue Zwischenprodukte zur Verwendung bei der Herstellung der bekannten oder nicht erfindersichen Weiterverarbeitungsprodukte der Formeln I und II bereitzustellen

Zur Lösung dieser Aufgabe werden im Hauptanspruch der Patentanmeldung Verbindungen der Formel III als Zwischenprodukte vorgeschlagen.

7. Gemäß der Beschreibung der vorliegenden Patentanmeldung werden bei der Herstellung der gewünschten Verbindungen der Formel I die beanspruchten Verbindungen zuerst hydrolysiert, wie beispielsweise aus "The Pyrimidines", Supplement I (Dokument 6) oder aus dem U.S. Patent 4 379 930 bekannt ist. Weiter heißt es auf Seite 3, Zeilen 11 bis 16 der veröffentlichten Patentanmeldung, daß die Hydrolyse der beanspruchten Verbindungen der Formel III am besten in Gegenwart eines Alkalimetallmethoxids und einer katalytischen Menge eines N-Oxids, eines Disulfids oder elementaren Schwefels durchgeführt wird. Zu den bevorzugten N-Oxiden gehört 2-Picolin-N-oxid. Bei den Disulfiden wird Di-N-butyl-disulfid bevorzugt. Auf Seite 3, Zeilen 17 bis 26 werden weitere bevorzugte Merkmale wie bestimmte Temperaturen und Drücke genannt. Den Zeilen 27 und 28 schließlich ist zu entnehmen, daß die Hydrolyse am besten und vorzugsweise in einem Lösungsmittel aus Methylalkohol durchgeführt wird. Der aus der Literatur bekannte nächste Schritt zur Verknüpfung der Verbindungen II und I wird dann auf Seite 4 und 5, erster Absatz der Beschreibung, erläutert.

Nach dieser Beschreibung ist es klar, daß die gewünschten Weiterverarbeitungsprodukte der Formel I sowie die Hydroxy-Verbindungen der Formel II mit den beanspruchten Verbindungen der Formel III als Ausgangsstoffen hergestellt werden können.

8. Zur Stützung der erfindersichen Tätigkeit der beanspruchten Produkte erklärte die Beschwerdeführerin im Prüfungsverfahren zunächst, daß sich die überlegene Wirkung der Endprodukte auf die erfindersiche Tätigkeit der beanspruchten Ausgangsstoffe auswirke. Die Kammer schließt sich der Prüfungsabteilung an, die dieses Argument mit einer überzeugenden Begründung zurückgewiesen hat. Wie bereits im Zusammenhang mit der Entscheidung T 65/82 (s. Nr. 3) festgestellt wurde, müssen beanspruchte Zwischenprodukte selbst auf einer erfindersichen Tätigkeit beruhen, um patentierbar zu sein. Die Frage, ob unter bestimmten Voraussetzungen neue und erfindersiche Weiterverarbeitungsprodukte eine erfindersiche Tätigkeit bei Zwischenprodukten stützen können, stellt sich hier nicht, weil die Wei-

respectively, as providing new intermediates to be used to prepare the known or not inventive subsequent products of formula (I) and (II).

In order to solve this problem, the main claim of the patent application suggests compounds of formula (III) as intermediates.

7. According to the description of the present patent application, in the preparation of the desired compounds of formula (I) the claimed compounds are first hydrolysed as taught, for example, in supplement I of "The Pyrimidines" (document (6)) or in US patent 4 379 930. As described further on page 3, lines 11 to 16, of the patent application as published, the hydrolysis of compounds of formula (III) as claimed is advantageously carried out in the presence of an alkali metal methoxide and a catalytic amount of an N-oxide, a disulfide or elemental sulfur. A preferred N-oxide is 2-picoline-N-oxide. A preferred disulfide is di-N-butyl-disulfide. According to lines 17 to 26 on page 3, further preferred features as specific temperatures and pressures are mentioned. Finally, as stated in lines 27 and 28, the hydrolysis is advantageously and preferably carried out in a methyl alcohol solvent. The next step linking compounds (II) and (I) as taught in the literature is further described on page 4 and page 5, first paragraph of the description.

According to this description, it is clear that the desired subsequent products of formula (I), as well as the hydroxy compounds of formula (II), can be obtained starting from the claimed compounds of formula (III).

8. In support of an inventive step of the claimed products, the Appellants first argued during the examination procedure that the superior effect of the end products influences the inventive step of the claimed starting material. The Board agrees to the convincing reasoning of the Examining Division, rejecting this argument. As already stated with regard to the decision T 65/82 (see point 3 above), claimed intermediates must themselves be based on an inventive step to be patentable. Whether, under certain circumstances, new and inventive subsequent products may support an inventive step of intermediates is not the question here because the subsequent products in this case are either not novel or not inventive (see point 6 and point 13). Thus, the Board considers the superior effect of subsequent pro-

consiste à obtenir de nouveaux produits intermédiaires devant servir à la préparation des produits de transformation ultérieure connus ou non inventifs des formules (I) et (II).

Pour résoudre ce problème, la revendication principale de la demande de brevet propose comme produits intermédiaires les composés de la formule (III).

7. Conformément à la description de la présente demande de brevet, la préparation des composés désirés de la formule (I) consiste, dans un premier temps, à hydrolyser les composés revendiqués, comme enseigné par exemple dans le supplément I de "The Pyrimidines" (document (6)) ou dans le brevet américain 4 379 930. Comme décrit ensuite à la page 3, lignes 11 à 16 de la demande de brevet publiée, l'hydrolyse des composés de la formule (III) revendiqués est effectuée de manière avantageuse en présence d'un méthylate de métal alcalin et d'une quantité catalytique d'un N-oxyde, d'un disulfure ou d'un sulfure élémentaire. Le 2-picoline-N-oxyde est l'un des N-oxydes préférés. Parmi les disulfures préférés se trouve le di-N-butyle-disulfure. Il ressort des lignes 17 à 26, page 3, que d'autres caractéristiques préférées sont mentionnées, telles que certaines températures et pressions. Enfin, il est indiqué aux lignes 27 et 28, que l'hydrolyse est de manière avantageuse et de préférence effectuée dans l'alcool méthylique en tant que solvant. L'étape suivante pour lier les composés (II) et (I), telle qu'enseignée dans la littérature, est décrite à la page 4, ainsi qu'à la page 5, premier paragraphe de la description.

Il ressort de cette description qu'il est possible d'obtenir les produits de transformation ultérieure désirés de la formule (I), ainsi que les composés hydroxyde la formule (II), à partir des composés revendiqués de la formule (III).

8. A l'appui de l'activité inventive des produits revendiqués, le requérant a tout d'abord déclaré au cours de la procédure d'examen que l'effet supérieur des produits finals influençait l'activité inventive des substances de départ revendiquées. La Chambre souscrit au raisonnement convaincant par lequel la division d'examen a rejeté cet argument. Comme cela a déjà été indiqué dans le contexte de la décision T 65/82 (cf. point 3 supra), il faut que les produits intermédiaires revendiqués soient eux-mêmes fondés sur une activité inventive pour être brevetables. Il ne s'agit pas en l'espèce de savoir si, dans certaines circonstances, des produits de transformation ultérieure nouveaux et impliquant une activité inventive peuvent justifier l'activité inventive de produits intermédiaires, parce que dans le cas présent, les pro-

terverarbeitungsprodukte im vorliegenden Fall weder neu noch erfinderisch sind (s. Nrn. 6 und 13). Die Kammer ist daher der Auffassung, daß Zwischenprodukte nicht schon dadurch erfinderisch werden, daß die Weiterverarbeitungsprodukte, die weder neu noch erfinderisch sind, eine überlegene Wirkung aufweisen. Das Argument der Beschwerdeführerin greift daher nicht.

9. Die Beschwerdeführerin wies ferner darauf hin, daß die Hydrolyse der beanspruchten Ausgangsstoffe zur Herstellung der Weiterverarbeitungsverbindungen der Formel II keineswegs einfach sei und der überraschende und damit erfinderische Charakter der beanspruchten Verbindungen durch den unerwarteten Erfolg bei der Hydrolyse der beanspruchten Verbindungen gestützt werde. In Gegenwart von nur 0,22 Gew.-% Wasser sei die Ausbeute auf 90 % der gewünschten 5-Hydroxy-Verbindung gesteigert worden. Erst mit der Entwicklung der Hydrolysereaktion, bei der Natriummethoxid/methanol verwendet werde, sei also die Hydrolyse der erfindungsgemäßen 2-Alkyl-5-halopyrimidine zu 2-Alkyl-5-hydroxypyrimidin der Formel II in der Praxis möglich geworden.

Die Kammer bemerkt dazu, daß die Beschwerdeführerin selbst bei Einreichung der Patentanmeldung die Hydrolyse an sich für trivial gehalten hat (s. S. 2, Zeilen 9 - 12 der veröffentlichten Patentanmeldung). Diese Auffassung wird durch das Dokument 6, also *Supplement 1* zu "*The Pyrimidines*", erhärtet, wo auf das Hauptwerk verwiesen wird, in welchem auf Seite 212, Absatz 3 die Hydrolyse eines 5-Bromopyrimidins zu einem 5-Hydroxypyrimidin bereits beschrieben ist. Für die Kammer ist daher nicht ersichtlich, welches Vorurteil einen Fachmann davon abgehalten haben könnte, Verbindungen der Formel III zu hydrolysieren, um so zu den Hydroxy-Verbindungen der Formel II zu gelangen. Sie ist im Gegenteil der Auffassung, daß der Fachmann die Lehre des Dokuments 6 befolgt hätte

Zu dem angeblich entscheidenden Merkmal des Wassergehalts stellt die Kammer fest, daß dies in der Patentanmeldung nicht offenbart worden ist. Die Kammer kann den Erklärungen der Beschwerdeführerin in der mündlichen Verhandlung nicht zustimmen, daß dieses Merkmal im letzten Absatz auf Seite 3 der veröffentlichten Patentanmeldung in der Erklärung offenbart werde, daß "die Hydrolyse am besten vorzugsweise in einem Lösungsmittel aus Methylalkohol durchgeführt wird". Nach Meinung der Kammer geht aus dieser Offenbarung nicht eindeutig und unmittelbar hervor, daß für die Hydrolyse entscheidend ist, daß sie mit einem Wassergehalt durchgeführt wird, der z. B. nur 0,22 Gew.-% beträgt.

ducts which are neither novel nor inventive not to be sufficient to render the intermediates inventive. The Appellants' argument must therefore fail.

9 The Appellants further emphasised that the hydrolysis of the claimed starting material for the provision of the subsequent compounds of formula (II), was not at all easy and that the surprising and thus inventive merit of the claimed compounds is carried by the unexpected success when hydrolysing the claimed compounds. In the presence of only 0.22 wt% of water the yield was raised to 90% of the desired 5-hydroxy compound. It was, therefore, not until the development of the hydrolysis reaction using sodium methoxide/methanol that the hydrolysis of the 2-alkyl-5-halopyrimidines of the present invention, to give the 2-alkyl-5-hydroxypyrimidines of formula (II), became a practical reality.

The Board notes that the Appellants themselves considered the hydrolysis as such to be trivial when filing the patent application (see page 2, lines 9-12, of the published patent application). The Appellants' opinion is supported by document (6), which is Supplement 1 of "*The Pyrimidines*", in which reference is made to the main book (*Hauptwerk*), where on page 212, third paragraph, the hydrolysis of a 5-bromo-pyrimidine into a 5-hydroxypyrimidine is already described. The Board, therefore, cannot see any prejudice which might have prevented a skilled person from hydrolysing compounds of formula (III) to get the subsequent hydroxy compounds of formula (II). On the contrary, the Board finds that the skilled man would have followed the teaching of document (6).

Concerning the allegedly decisive feature of the water content, the Board notes that this has not been disclosed in the patent application. The Board cannot agree to the Appellants' statements during the oral proceedings that the last paragraph on page 3 of the published patent application discloses this feature when stating that "the hydrolysis is advantageously and preferably carried out in a methyl alcohol solvent". In the Board's opinion, it is not unambiguously and directly derivable from this disclosure that the hydrolysis decisively has to be carried out with a water content as low as for example 0.22 wt%.

duits de transformation ultérieure sont soit non nouveaux, soit non inventifs (cf. points 6 et 13). En conséquence, l'effet supérieur de produits de transformation ultérieure qui ne sont ni nouveaux ni inventifs ne suffit pas, selon la Chambre, pour rendre inventifs les produits intermédiaires. L'argument du requérant ne peut donc aboutir.

9. Le requérant a également souligné que l'hydrolyse des substances de départ revendiquées en vue de l'obtention des composés de transformation ultérieure de la formule (II) était loin d'être facile, et que le caractère surprenant, donc inventif, des composés revendiqués était étayé par la réussite inattendue de l'hydrolyse des composés revendiqués. En présence de 0,22 % en poids d'eau seulement, le rendement est passé à 90 % du composé 5-hydroxy désiré. Ainsi, il a fallu attendre l'évolution de la réaction d'hydrolyse, où du méthylate de sodium/méthanol a été utilisé, pour que l'hydrolyse des 2-alkyle-5-halopyrimidines de la présente invention en 2-alkyle-5-hydroxypyrimidines de la formule (II) devienne réellement possible.

La Chambre relève que lors du dépôt de la demande de brevet le requérant lui-même considérait l'hydrolyse comme étant sans importance (cf. page 2, lignes 9 à 12 de la demande de brevet publiée). Cette opinion est confirmée par le document (6), qui est le supplément I de "*The Pyrimidines*", dans lequel il est fait référence à l'ouvrage principal (*Hauptwerk*), où, à la page 212, troisième paragraphe, l'hydrolyse d'une 5-bromo-pyrimidine en une 5-hydroxy-pyrimidine est déjà décrite. La Chambre ne voit donc pas quel préjugé aurait pu empêcher l'homme du métier d'hydrolyser les composés de la formule (III) afin d'obtenir les composés hydroxy ultérieurs de la formule (II). Au contraire, elle estime que l'homme du métier aurait suivi l'enseignement du document (6).

La Chambre constate que la caractéristique dite déterminante de la teneur en eau n'a pas été divulguée dans la demande de brevet. Elle ne peut se rallier aux déclarations du requérant faites au cours de la procédure orale, selon lesquelles le dernier paragraphe de la page 3 de la demande de brevet publiée expose cette caractéristique dans la phrase: "l'hydrolyse est de manière avantageuse et de préférence effectuée dans de l'alcool méthylique en tant que solvant". De l'avis de la Chambre, cette divulgation ne permet pas de déduire clairement et directement qu'il est déterminant que l'hydrolyse soit effectuée avec une teneur en eau aussi faible que, par exemple, 0,22 % en poids.



Außerdem wäre schon eine Ausbeute von 77,7 % der Hydroxy- Zwischenverbindung der Formel II, die bei einem Wassergehalt von 2,2 Gew.-% erzielt werden kann, durchaus ausreichend

Furthermore, one may even say that a yield of 77.7% of the hydroxy intermediate compound of formula (II), which can be provided in the case of a water content of 2.2 wt% may suffice also.

Qui plus est, un rendement de 77,7 % du composé intermédiaire hydroxy de la formule (II), qui peut être obtenu avec une teneur en eau de 2,2 % en poids pourrait également suffire.

Wenn also, wie die Beschwerdeführerin in der mündlichen Verhandlung betonte, der geringe Wassergehalt die Erfindung ausmacht, dann ist diese in den eingereichten Dokumenten nicht richtig offenbart worden

If, therefore, as emphasised by the Appellants during the oral proceedings, the low water content was the invention, this invention had not been disclosed properly in the documents as filed.

Si donc, comme l'a souligné le requérant lors de la procédure orale, la faible teneur en eau constitue l'invention, celle-ci n'a pas été divulguée correctement dans les documents déposés.

Gewöhnlich ist die Einreichung von Versuchsdaten zur Stützung einer überlegenen Wirkung selbst in einer späten Verfahrensphase noch zulässig. Im vorliegenden Fall ist jedoch die höhere Ausbeute an Verbindungen der Formel II, die - wie die vorgelegten Daten beweisen - durch Hydrolyse der Verbindungen der Formel III unter ganz besonderen Bedingungen erzielt wird, das Ergebnis einer Bedingung, die in der Patentanmeldung nicht offenbart war

Usually, submissions of experimental data supporting a superior effect might be allowed even at a late stage of the proceedings. However, in the present case the better yield of compounds of formula (II) by hydrolysing compounds of formula (III) under very specific conditions, as proved by these submissions, results only from a feature which was not disclosed in the patent application.

En règle générale, il est possible, même à un stade avancé de la procédure, de produire des données expérimentales étayant un effet supérieur. En l'espèce toutefois, l'amélioration du rendement des composés de la formule (II) par hydrolyse des composés de la formule (III) dans des conditions bien particulières, comme l'ont révélé les données produites, résulte uniquement d'un élément qui n'a pas été divulgué dans la demande de brevet.

10. In ihrer Beschwerdebegründung erklärte die Beschwerdeführerin, daß nur bei dem Weg, der in den als Dokument 8 eingereichten Reaktionsschemata als Methode "F" bezeichnet werde, auf eine sehr teure Verbindung bei der Herstellung der beanspruchten Verbindungen der Formel III verzichtet werden könne (s. Absatz V c)). Alle anderen Wege seien in dieser Hinsicht ungeeignet

10. In their grounds for appeal, the Appellants stated that only by the route exemplified by a method called "F" in reaction schemes submitted as document (8), a very expensive compound can be avoided in preparing the claimed compounds of formula (III) (see paragraph V (c) above). All other routes are disadvantageous in this respect.

10. Dans son mémoire exposant les motifs du recours, le requérant a déclaré que seule la marche à suivre, qualifiée de méthode "F" dans les schémas de réaction soumis sous la forme du document (8), permettait d'éviter un composé très coûteux en préparant les composés revendiqués de la formule (III) (cf. V c supra). De ce point de vue, tous les autres procédés sont inappropriés.

Die Beschwerdeführerin räumte ein, daß bei den in der Patentanmeldung beschriebenen Herstellungswegen ebenfalls die unerwünschten, teuren Verbindungen verwendet und die beanspruchten Verbindungen, wie aus den Beispielen in der Beschreibung der vorliegenden Patentanmeldung hervorgehe, nicht nach der Methode "F" des Dokuments 8 hergestellt würden. Daher ist auch dieses Argument nicht überzeugend

The Appellants admitted that the routes of the preparation described in the patent application also used the undesired expensive compounds and that the preparation according to route "F" of document (8) is not the one according to which the claimed compounds are prepared as exemplified in the description of the present patent application. Thus, also this argument is not convincing

Le requérant a concédé que les méthodes de préparation décrites dans la demande de brevet faisaient également appel à des composés coûteux non désirés, et que les composés revendiqués n'étaient pas obtenus conformément à la méthode "F" du document (8), comme en témoigne la description de la présente demande de brevet. Par conséquent, cet argument non plus n'est pas convaincant.

11 Die Beschwerdeführerin hat behauptet (s. Nr. V d)), daß die Entgegenhaltung 1 (in der eine Verbindung der allgemeinen Formel III offenbart wird, in der R für Methyl steht) keinen Hinweis darauf enthalte, daß Methyl - wie beansprucht - durch einen der drei Alkylreste zu ersetzen sei. Die Kammer hält dies nicht für entscheidend, weil die Entgegenhaltung 1 zum "zwischenproduktnahen" Stand der Technik gehört und somit nicht den nächstliegenden Stand der Technik bildet (s. Nr. 5). Die Offenbarung in der Entgegenhaltung 1 muß also in Kombination mit der Offenbarung der Entgegenhaltungen 4 oder 5 beurteilt werden. Für die Kammer ist nicht ersichtlich, weshalb eine solche Kombination der Lehren den Fachmann nicht dazu geführt hätte, diese Alkylreste in Verbindungen

11. The Appellants have argued, as stated above under paragraph V (d) that document (1) (in which a compound of the general formula (III) is disclosed wherein R is methyl) did not provide any hint to substitute methyl by one of the three alkyl residues as claimed. The Board does not believe this to be decisive because document (1), representing the "close-to-the-intermediates" prior art, after all is not the closest prior art (see paragraph 5 above). The disclosure in document (1) thus has to be evaluated in combination with the disclosure in documents (4) or (5). The Board cannot see any reason how such a combination would not have led the man skilled in the art to use those alkyl residues in compounds of formula (III) which were known to be decisive for the superior

11. Comme indiqué plus haut au point V d), le requérant a fait valoir que le document (1) (dans lequel est divulgué un composé de la formule générale (III), où R est du méthyle) ne suggérerait aucunement qu'il faut remplacer le méthyle par l'un des trois restes alkyles comme revendiqué. De l'avis de la Chambre, cet argument n'est guère déterminant car le document (1), qui représente l'état de la technique "proche des produits intermédiaires" n'est pas, en définitive, l'état de la technique le plus proche (cf. point 5 supra). Aussi faut-il apprécier la divulgation contenue dans le document (1) en association avec celle des documents (4) ou (5). La Chambre ne voit pas pourquoi une telle association n'aurait pas conduit l'homme du métier à utiliser ces restes alkyles dans

der Formel III zu verwenden, von denen aus den Dokumenten 4 oder 5 und 7 bekannt war, daß sie für die überlegene insektizide Wirkung ausschlaggebend sind.

12. Somit kann keines der Argumente der Beschwerdeführerin, also weder die überlegene Wirkung der Endprodukte, noch die erfinderische Tätigkeit eines gesamten Verfahrens, bei dem bestimmte Verbindungen als Zwischenprodukte benutzt werden, noch der erfinderische Charakter eines bestimmten Schritts in diesem Verfahren, eine erfinderische Tätigkeit bei den im vorliegenden Fall beanspruchten Ausgangsverbindungen der Formel III glaubhaft machen. Angesichts der Offenbarung der Entgegenhaltungen 4 und 5, die vorstehend analysiert wurde, ist die Kammer vielmehr der Auffassung, daß das Wissen über die gewünschten, überlegenen Endprodukte der Formel I und ihre Herstellung auf dem Weg über die Hydroxyverbindungen der Formel II sowie die Offenbarung in der Entgegenhaltung 1, wonach Verbindungen der Formel III bekannt sind, in denen R Methyl ist, ohne weiteres zu den gewünschten, anmeldungsgemäßen Verbindungen führen könnten. Da, wie vorstehend dargelegt, im Stand der Technik kein Vorurteil dagegen bestand, die Hydrolyse von Verbindungen der Formel III zur Herstellung von Verbindungen der Formel II zu umgehen, hätte der Fachmann, der aus den Entgegenhaltungen 4 und 5 weiß, daß der entscheidende und erwünschte Rest R Isopropyl oder Cyclopropyl sein muß, zweifellos nicht die in der Entgegenhaltung 1 beschriebene Verbindung, in der R für Methyl steht, sondern die beanspruchten Verbindungen gewählt.

Daher beruhen die Verbindungen des Anspruchs 1 des Hauptantrags nicht auf erfinderischer Tätigkeit.

13. Der Hauptanspruch des Hilfsantrags ist auf die Verwendung von t-Butyl als Rest R beschränkt. Die Kammer räumt ein, daß eine entsprechende Weiterverarbeitungsverbindung der Formel I oder II - anders als die in den Entgegenhaltungen 4 und 5 beschriebenen Verbindungen, in denen der Rest R für Isopropyl oder Cyclopropyl steht - im Stand der Technik nirgends offenbart ist. Die Tatsache, daß die erwähnte Verbindung der Formel I neu ist, macht sie nicht schon zwangsläufig erfinderisch - ebenso wenig wie die beanspruchte Verbindung der Formel III.

Der einzige Unterschied, den die Beschwerdeführerin zugunsten des Hilfsantrags geltend gemacht hat, war die Neuheit der Weiterverarbeitungsverbindung, in der R für t-Butyl steht. Zur erfinderischen Tätigkeit hat sie nichts vorgebracht. Aus den vergleichenden Versuchsdaten, die die Beschwerde-

insecticidal effect from documents (4) or (5) and (7).

12. Thus, none of the arguments of the Appellants in support of an inventive step, be it the superior effect of the end product, the inventive step of a whole procedure using certain compounds as intermediates or the inventiveness of a certain step in that procedure can support the inventive step of the starting material compounds of formula (III) as claimed in the present case. Bearing in mind the disclosure in documents (4) and (5) as analysed above, the Board rather finds that the knowledge about the desired and superior end products of formula (I) and their preparation via the hydroxy compounds of formula (II) and the disclosure provided by document (1) that compounds of formula (III) wherein R is methyl are known, could easily lead to the desired compounds as claimed. Since, as stated above, there was no prejudice in the state of the art to avoid hydrolysis of compounds of formula (III) to get compounds of formula (II), the man skilled in the art obviously would have chosen the claimed compounds instead of the compound described in document (1), in which R is methyl, when it is known to him from documents (4) and (5) that the decisive and desired residual R has to be isopropyl or cyclopropyl.

Thus, the compounds of Claim 1 of the main request do not involve an inventive step.

13. The main claim according to the subsidiary request is limited to the use of t-butyl as the residual R. The Board agrees that there is no subsequent corresponding compound of formula (I) or (II) described in any prior art document as in the cases of the residual R being isopropyl or cyclopropyl, described in documents (4) and (5). The fact that the mentioned compound of formula (I) is new does not render it necessarily inventive, let alone the claimed compound of formula (III).

The only distinction made by the Appellants in favour of the subsidiary request was the novelty of the subsequent compound in which R is t-butyl. No submissions have been made in respect of an inventive step. In the experimental comparative data submitted by the Appellants during the

des composés de la formule (III), qui, comme cela ressort des documents (4) ou (5) et (7), sont déterminants pour l'effet insecticide supérieur.

12. Ainsi, aucun des arguments du requérant, qu'il s'agisse de l'effet supérieur du produit final, de l'activité inventive de l'ensemble d'un procédé utilisant certains composés comme produits intermédiaires, ou du caractère inventif d'une certaine étape dans ledit procédé, ne saurait rendre crédible une activité inventive des substances de départ de la formule (III) comme revendiqué dans le cas présent. Compte tenu de la divulgation des documents (4) et (5) analysée plus haut, la Chambre estime au contraire que la connaissance des produits finals désirés et supérieurs de la formule (I), de leur préparation à l'aide des composés hydroxy de la formule (II), ainsi que la divulgation figurant dans le document (1), d'où il ressort que les composés de la formule (III), dans laquelle R est du méthyle, sont connus, pouvait facilement conduire aux composés désirés revendiqués. Etant donné que, comme indiqué plus haut, aucun préjugé dans l'état de la technique ne s'opposait à ce qu'on évite l'hydrolyse des composés de la formule (III) pour obtenir des composés de la formule (II), l'homme du métier aurait, de toute évidence choisi les composés revendiqués et le composé décrit dans le document (1), où R est du méthyle, puisque les documents (4) et (5) lui enseignent que le R résiduel déterminant et désiré doit être de l'isopropyle ou du cyclopropyle.

En conséquence, les composés de la revendication (1) de la requête principale n'impliquent aucune activité inventive.

13. La revendication principale de la requête subsidiaire est limitée à l'utilisation du t-butyle en tant que R résiduel. La Chambre convient qu'aucun composé correspondant de transformation ultérieure de la formule (I) ou (II) n'est décrit dans aucun document exposant l'état de la technique, alors que le cas où le R résiduel est de l'isopropyle ou du cyclopropyle sont décrits dans les documents (4) et (5). Le fait que le composé de la formule (I) mentionné est nouveau ne le rend pas forcément inventif, de même que le composé revendiqué de la formule (III).

La seule différence invoquée par le requérant à l'appui de la requête subsidiaire est la nouveauté du composé de transformation ultérieure dans lequel R est du t-butyle. Aucun moyen n'a été avancé quant à l'activité inventive. Dans les données expérimentales comparatives produites par le requé-

führerin während des Prüfungsverfahrens als Dokument 7 eingereicht hat, geht nicht hervor, daß eine insektizide Verbindung der Formel I, in der R für t-Butyl steht, den in den Entgegenhaltungen 4 und 5 beschriebenen bekannten Verbindungen in ihrer Wirkung deutlich überlegen ist. Für die erfinderische Tätigkeit der Verbindungen der Formel III ist es nicht entscheidend, ob die gewünschten Endprodukte der Formel I angesichts des Stands der Technik entweder nicht neu oder nicht erfinderisch sind. Die Kammer vertritt daher die Auffassung, daß für den Hilfsantrag dieselben Überlegungen gelten wie für den Hauptantrag. Somit beruht die Verbindung nach Anspruch 1 des Hilfsantrags nicht auf erfinderischer Tätigkeit.

#### Entscheidungsformel

**Aus diesen Gründen wird entschieden:**

Die Beschwerde wird zurückgewiesen.

examination procedure as document (7), no significant superior effect of an insecticidal compound of formula (I), in which R is t-butyl was shown, over the known compounds described in documents (4) and (5). It is not decisive for the inventive step of compounds of formula (III) whether or not the desired end products of formula (I) are either not novel or not inventive in the light of what was known. The Board therefore finds that the same reasoning applies to the subsidiary request as to the main request. Thus, the single compound according to Claim 1 of the subsidiary request does not involve an inventive step.

#### Order

**For these reasons it is decided that:**

The appeal is dismissed.

rant lors de la procédure d'examen sous la forme du document (7), il n'est fait état d'aucun effet supérieur important d'un composé insecticide de la formule (I) dans laquelle R est du t-butyle, par rapport aux composés connus décrits dans les documents (4) et (5). Il n'est pas déterminant pour l'activité inventive des composés de la formule (III) que les produits finals désirés de la formule (I) soient non nouveaux ou non inventifs à la lumière de ce qui est connu. Aussi la Chambre considère-t-elle que le même raisonnement s'applique et à la requête subsidiaire et à la requête principale. En conséquence, l'unique composé selon la revendication 1 de la requête subsidiaire n'implique aucune activité inventive.

#### Dispositif

**Par ces motifs, il est statué comme suit:**

Le recours est rejeté.

### Entscheidung der Technischen Beschwerdekammer 3.3.1 vom 27. März 1990 T 550/88 - 3.3.1\* (Übersetzung)

Zusammensetzung der Kammer

Vorsitzender: K. Jahn  
Mitglieder: G. D. Paterson  
R. K. Spangenberg

**Patentinhaber/Beschwerdegegner:**  
Mobil Oil Corporation

**Einsprechender/Beschwerdeführer:**  
Mobil Oil Corporation

**Stichwort:** älteres nationales Recht/MOBIL

**Artikel:** 54 (3), 99 (1), 137, 138, 139 EPÜ

**Regel:** 55 c), 56 (1), 57 (1), 58 (2) EPÜ

**Schlagwort:** "mangelnde Neuheit nach Artikel 54 (3) EPÜ als einziger Einspruchsgrund"- "ältere nationale Rechte als einzige Stützung dieses Grundes"- "ältere nationale Rechte nicht Stand der Technik im Sinne des Artikels 54 (3) EPÜ"- "Einspruch unzulässig"- "aufgrund älterer nationaler Rechte vorgeschlagene Änderungen nicht zulässig"

### Decision of Technical Board of Appeal 3.3.1 dated 27 March 1990 T 550/88 - 3.3.1\* (Official Text)

Composition of the Board:

Chairman: K. Jahn  
Members: G. D. Paterson  
R. K. Spangenberg

**Patent proprietor/Respondent:**  
Mobil Oil Corporation

**Opponent/Appellant:** Mobil Oil Corporation

**Headword:** National prior right/MOBIL

**Article:** 54(3), 99(1), 137, 138, 139 EPC

**Rule:** 55(c), 56(1), 57(1), 58(2) EPC

**Keyword:** "Lack of novelty under Article 54(3) EPC as only ground of opposition" - "National prior rights as only support for such ground" - "National prior rights not state of the art under Article 54(3) EPC" - "Opposition inadmissible" - "Amendments proposed in view of national prior rights not allowable"

### Décision de la Chambre de recours technique 3.3.1, en date du 27 mars 1990 T 550/88 - 3.3.1\* (Traduction)

Composition de la Chambre:

Président: K. Jahn  
Membres: G. D. Paterson  
R. K. Spangenberg

**Titulaire du brevet/requérant:** Mobil Oil Corporation

**Opposant/intimé:** Mobil Oil Corporation

**Référence:** Droits nationaux antérieurs/MOBIL

**Article:** 54 (3), 99 (1), 137, 138, 139 CBE

**Règle:** 55 c), 56 (1), 57 (1), 58 (2) CBE

**Mot-clé:** "Absence de nouveauté en vertu de l'article 54 (3) CBE, comme seul motif d'opposition" - "Uniquement droits nationaux antérieurs invoqués à l'appui de ce motif" - "Droits nationaux antérieurs non compris dans l'état de la technique au sens de l'article 54 (3) CBE" - "Opposition irrecevable" - "Inadmissibilité de modifications proposées pour tenir compte de droits nationaux antérieurs"

\* Die Entscheidung ist hier nur auszugsweise abgedruckt. Eine Kopie der ungekürzten Entscheidung in der Verfahrenssprache ist bei der Informationsstelle des EPA in München gegen Zahlung einer Fotokopiergebühr von 1.30 DEM pro Seite erhältlich.

\* This is an abridged version of the Decision. A copy of the full text in the language of proceedings may be obtained from the EPO Information Desk in Munich on payment of a photocopying fee of DEM 1.30 per page.

\* Seul un extrait de la décision est publié. Une copie de la décision complète dans la langue de la procédure peut être obtenue auprès du service d'information de l'OEB à Munich moyennant versement d'une taxe de photocopie de 1,30 DM par page.