(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
31. Mai 2001 (31.05.2001)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 01/38292 A3

(51) Internationale Patentklassifikation[7]: C12P 41/00, 13/00, C07C 213/08, 213/10, 217/10, 215/08, 235/08, C07B 57/00

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP00/11191

(22) Internationales Anmeldedatum:
13. November 2000 (13.11.2000)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
199 56 786.7 25. November 1999 (25.11.1999) DE

(71) Anmelder *(für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US)*: **BASF AKTIENGESELLSCHAFT** [DE/DE]; 67056 Ludwigshafen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder *(nur für US)*: **DITRICH, Klaus** [DE/DE]; Raiffeisenstrasse 26, 67161 Gönnheim (DE). **SIEGEL, Wolfgang** [DE/DE]; Goethestrasse 34b, 67117 Limburgerhof (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: **BASF AKTIENGESELLSCHAFT**; 67056 Ludwigshafen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten *(national)*: AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten *(regional)*: ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:
— *mit internationalem Recherchenbericht*

(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen Recherchenberichts: 28. Februar 2002

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

WO 01/38292 A3

(54) **Title:** METHOD FOR PRODUCING OPTICALLY ACTIVE AMINES

(54) **Bezeichnung:** VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG OPTISCH AKTIVER AMINE

(57) **Abstract:** The invention relates to a method for producing optically active amines. The invention also relates to a method for producing racemic amines, which can be racemically split using optically active carboxylic acids or enzymes. The invention additionally relates to racemic and optically active amines as well as to optically active amides.

(57) **Zusammenfassung:** Die vorliegende Erfindung betrifft ein Verfahren zur Herstellung optisch aktiver Amine. Weiterhin betrifft die Erfindung ein Verfahren zur Herstellung racemischer Amine, die mit optisch aktiven Carbonsäuren oder Enzymen racematgespalten werden können. Die Erfindung betrifft außerdem racemische und optisch aktive Amine sowie optisch aktive Amide.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Interr ıal Application No
PCT/EP 00/11191

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 7 C12P41/00 C12P13/00 C07C213/08 C07C213/10 C07C217/10
C07C215/08 C07C235/08 C07B57/00

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
IPC 7 C12P C07C C07B

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)
EPO-Internal, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 41, no. 19, 10 October 1947 (1947-10-10) Columbus, Ohio, US; abstract no. 6199d, O. SCHNIDER : "Synthesis of panthenol and its transformation into pantothenic acid." page 6199; column 1; XP002162975 & JUBILEE VOL. EMIL BARELL, 1946, pages 79-84, --- -/--	19,20

[X] Further documents are listed in the continuation of box C.

[X] Patent family members are listed in annex.

° Special categories of cited documents :

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search	Date of mailing of the international search report
3 July 2001	'09. 8. 01

Name and mailing address of the ISA	Authorized officer
European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016	Rufet, J

6

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 1992)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Intern ıal Application No
PCT/EP 00/11191

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	ANDRES C ET AL: "STEREOSELECTIVE RING OPENING OF CHIRAL OXAZOLIDINES BY REFORMATSKY REAGENTS: AN ENANTIOSELECTIVE ENTRY TO BETA-AMINO ESTERS" TETRAHEDRON LETTERS,NL,ELSEVIER SCIENCE PUBLISHERS, AMSTERDAM, vol. 33, no. 20, 12 May 1992 (1992-05-12), pages 2895-2898, XP002043792 ISSN: 0040-4039 page 2897	1,2
X	page 2897	19,20

A	BESSE P ET AL: "Stereoselective chemoenzymatic synthesis of both enantiomers of protected 4-amino-2-pentanone" TETRAHEDRON: ASYMMETRY,NL,ELSEVIER SCIENCE PUBLISHERS, AMSTERDAM, vol. 10, no. 11, 4 June 1999 (1999-06-04), pages 2213-2224, XP004174104 ISSN: 0957-4166 Seite 2215 und Seite 2221	1,2
X	page 2221	19,20

X	DE 247 144 C (FARBENFABRIKEN VORM. FRIEDR. BAYER & CO.) page 2, column 2	20

A	DE 723 498 C (I. G. FARBENINDUSTRIE AG.) 18 August 1942 (1942-08-18) claim 1; example 1	1,2

A	WO 96 23894 A (BASF AG ;BALKENHOHL FRIEDHELM (DE); DITRICH KLAUS (DE); NUEBLING C) 8 August 1996 (1996-08-08) cited in the application the whole document	1,4
X	claim 6	19,20

A	WO 97 28271 A (BAYER AG ;DREISBACH CLAUS (DE); STELZER UWE (DE)) 7 August 1997 (1997-08-07) cited in the application claims 1-10; examples 1-6	1,4

X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN [Online] BEILSTEIN INSTITUT ZUR FOEDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFURT AM MAIN, DE; Database-Accession no. 8253393 (BRN), XP002171088 & J. MED. CHEM., vol. 42, no. 5, 1999, pages 833-848,	20

	-/--	

6

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN [Online] BEILSTEIN INSTITUT ZUR FOEDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFURT AM MAIN, DE; Database-Accession no. 1746407 (BRN), XP002171089 & J. ORG. CHEM., vol. 14, 1949, page 702 ---	20
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN [Online] BEILSTEIN INSTITUT ZUR FOEDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFURT AM MAIN, DE; Database-Accession no. 1734381 (BRN), XP002171090 & MONATSH. CHEM., vol. 91, 1960, pages 363-367, ---	20
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN [Online] BEILSTEIN INSTITUT ZUR FOEDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFURT AM MAIN, DE; Database-Accession no. 2231657 (BRN), XP002171091 & RUSS. CHEM. BL. , vol. 46, no. 11, 1997, pages 1936-1938, ---	19
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN [Online] BEILSTEIN INSTITUT ZUR FOEDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFURT AM MAIN, DE; Database-Accession no. 7174696 (BRN), XP002171092 & J. MED. CHEM., vol. 23, no. 2, 1980, pages 121-127, ---	20
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN [Online] BEILSTEIN INSTITUT ZUR FOEDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFURT AM MAIN, DE; Database-Accession no. 1732216; 1732706 (BRN), XP002171093 & J. AM. PHARM. ASSOC., vol. 41, 1952, pages 328-332, ---	20
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN [Online] BEILSTEIN INSTITUT ZUR FOEDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFURT AM MAIN, DE; Database-Accession no. 5561939 (BRN), XP002171094 & J. ORG. CHEM. , vol. 51, no. 25, 1986, pages 4905-4910, --- -/--	20

6

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Interr ıal Application No
PCT/EP 00/11191

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN [Online] BEILSTEIN INSTITUT ZUR FOEDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFURT AM MAIN, DE; Database-Accession no. 1719513 (BRN), XP002171095 & HEL. CHIM. ACTA, vol. 38, 1955, page 915 ---	19
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN [Online] BEILSTEIN INSTITUT ZUR FOEDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFURT AM MAIN, DE; Database-Accession no. 4304559 (BRN), XP002171096 & SYNTH. COMMUN., vol. 21, no. 1, 1991, pages 1-9, ---	20
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN [Online] BEILSTEIN INSTITUT ZUR FOEDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFURT AM MAIN, DE; Database-Accession no. 1919664 (BRN), XP002171097 & CHEM. PHARM. BULL., vol. 18, 1970, pages 1731-1736, -----	20

6

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/EP 00/11191

Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☐ Claims Nos.:
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:

2. ☒ Claims Nos.: 19-21
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
See supplemental sheet Additional Matter PCT/ISA/210

3. ☐ Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

See supplemental sheet

Due to the findings of the preliminary examination, all additional fees are to be refunded in accordance with PCT Rule 40.(e)

1. ☒ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.

2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.

3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:

4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest

☒ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.

☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

The International Searching Authority has found that this international application contains multiple inventions, as follows:

1. Claims Nos. 1-18

   Alternative method for producing optically active amines of formula (I) or racemates thereof of formula (VII).

2. Claims Nos. 19, 20

   Compounds of formula (I) and racemates thereof of formula (VII).

3. Claim No. 21

   Compounds of formula (IX).

Continuation of Field I.2

Claims Nos. 19-21

1. Relevant Patent Claim Nos. 19-21 relate to an excessively large number of possible compounds of which only a small proportion can be supported by the description under the terms of PCT Article 6 and/or can be regarded as being disclosed in the patent application under the terms of PCT Article 5. In the case in question, the patent claims lack the corresponding support and the patent application lacks the necessary disclosure to such a degree that a meaningful search appears to be impossible to conduct with respect to the entire scope for which protection is sought. For this reason, the search was directed at the portions of the patent claims which can be regarded as supported and disclosed in the above-mentioned sense, namely at the portions relating to the compounds of formula (I) or (VII) and (IX) with the following definitions:

R1: C1-C10 alkyl, alkenyl, alkenyl
R2: C1-C10 alkyl or benzyl
R3: H
R5: H, C1-C10 alkyl
R6: H, C1-C10 alkyl, phenyl
X: O or S

The compounds according to Examples 1-5 as well as Page 22 of the application fall under this limitation.

2. The initial phase of the search revealed a very large number of documents, which are prejudicial as to novelty, for the subject matter of Claims Nos. 19-21. This number is so large that it is impossible to establish the scope of protection that could rightfully be sought for the patent claims in their entirety (PCT Article 6). For these reasons, it appears to be impossible to conduct a meaningful search covering the entire scope of the patent claims. The search was thus limited as in Item No. 1.

The applicant is therefore advised that patent claims or sections of patent claims laid to inventions for which no international search report was drafted normally cannot be the subject of an international preliminary examination (PCT Rule 66.1(e)). Similar to the authority entrusted with the task of carrying out the international preliminary examination, the EPO also does not generally carry out a preliminary examination of subject matter for which no search has been conducted. This is also valid in the case when the patent claims have been amended after receipt of the international search report (PCT Article 19), or in the case when the applicant submits new patent claims pursuant to the procedure in accordance with PCT Chapter II.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

...information on patent family members

Interr ...nal Application No
PCT/EP 00/11191

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
DE 247144 C		NONE	
DE 723498 C		NONE	
WO 9623894 A	08-08-1996	DE 19523151 A	14-08-1996
		CA 2210519 A	08-08-1996
		CN 1172504 A	04-02-1998
		EP 0801683 A	22-10-1997
		JP 10512759 T	08-12-1998
		US 6214608 B	10-04-2001
WO 9728271 A	07-08-1997	DE 19603575 A	07-08-1997
		EP 0877815 A	18-11-1998
		JP 2000504224 T	11-04-2000

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internales Aktenzeichen
PCT/EP 00/11191

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
IPK 7 C12P41/00 C12P13/00 C07C213/08 C07C213/10 C07C217/10
C07C215/08 C07C235/08 C07B57/00

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
IPK 7 C12P C07C C07B

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)
EPO-Internal, CHEM ABS Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 41, no. 19, 10. Oktober 1947 (1947-10-10) Columbus, Ohio, US; abstract no. 6199d, O. SCHNIDER : "Synthesis of panthenol and its transformation into pantothenic acid." Seite 6199; Spalte 1; XP002162975 & JUBILEE VOL. EMIL BARELL, 1946, Seiten 79-84, --- -/--	19,20

[X] Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

[X] Siehe Anhang Patentfamilie

° Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :
"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist
"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden
"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist
"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche	Absendedatum des internationalen Recherchenberichts
3. Juli 2001	09. 8. 01

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde	Bevollmächtigter Bediensteter
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016	Rufet, J

6

Formblatt PCT/ISA/210 (Blatt 2) (Juli 1992)

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Inte onales Aktenzeichen
PCT/EP 00/11191

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	ANDRES C ET AL: "STEREOSELECTIVE RING OPENING OF CHIRAL OXAZOLIDINES BY REFORMATSKY REAGENTS: AN ENANTIOSELECTIVE ENTRY TO BETA-AMINO ESTERS" TETRAHEDRON LETTERS,NL,ELSEVIER SCIENCE PUBLISHERS, AMSTERDAM, Bd. 33, Nr. 20, 12. Mai 1992 (1992-05-12), Seiten 2895-2898, XP002043792 ISSN: 0040-4039 Seite 2897	1,2
X	Seite 2897	19,20

A	BESSE P ET AL: "Stereoselective chemoenzymatic synthesis of both enantiomers of protected 4-amino-2-pentanone" TETRAHEDRON: ASYMMETRY,NL,ELSEVIER SCIENCE PUBLISHERS, AMSTERDAM, Bd. 10, Nr. 11, 4. Juni 1999 (1999-06-04), Seiten 2213-2224, XP004174104 ISSN: 0957-4166 Seite 2215 und Seite 2221	1,2
X	Seite 2221	19,20

X	DE 247 144 C (FARBENFABRIKEN VORM. FRIEDR. BAYER & CO.) Seite 2, Spalte 2	20

A	DE 723 498 C (I. G. FARBENINDUSTRIE AG.) 18. August 1942 (1942-08-18) Anspruch 1; Beispiel 1	1,2

A	WO 96 23894 A (BASF AG ;BALKENHOHL FRIEDHELM (DE); DITRICH KLAUS (DE); NUEBLING C) 8. August 1996 (1996-08-08) in der Anmeldung erwähnt das ganze Dokument	1,4
X	Anspruch 6	19,20

A	WO 97 28271 A (BAYER AG ;DREISBACH CLAUS (DE); STELZER UWE (DE)) 7. August 1997 (1997-08-07) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche 1-10; Beispiele 1-6	1,4

X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN [Online] BEILSTEIN INSTITUT ZUR FOEDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFURT AM MAIN, DE; Database-Accession no. 8253393 (BRN), XP002171088 & J. MED. CHEM., Bd. 42, Nr. 5, 1999, Seiten 833-848,	20

	-/--	

6

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN [Online] BEILSTEIN INSTITUT ZUR FOEDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFURT AM MAIN, DE; Database-Accession no. 1746407 (BRN), XP002171089 & J. ORG. CHEM., Bd. 14, 1949, Seite 702 ---	20
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN [Online] BEILSTEIN INSTITUT ZUR FOEDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFURT AM MAIN, DE; Database-Accession no. 1734381 (BRN), XP002171090 & MONATSH. CHEM., Bd. 91, 1960, Seiten 363-367, ---	20
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN [Online] BEILSTEIN INSTITUT ZUR FOEDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFURT AM MAIN, DE; Database-Accession no. 2231657 (BRN), XP002171091 & RUSS. CHEM. BL. , Bd. 46, Nr. 11, 1997, Seiten 1936-1938, ---	19
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN [Online] BEILSTEIN INSTITUT ZUR FOEDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFURT AM MAIN, DE; Database-Accession no. 7174696 (BRN), XP002171092 & J. MED. CHEM., Bd. 23, Nr. 2, 1980, Seiten 121-127, ---	20
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN [Online] BEILSTEIN INSTITUT ZUR FOEDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFURT AM MAIN, DE; Database-Accession no. 1732216; 1732706 (BRN), XP002171093 & J. AM. PHARM. ASSOC., Bd. 41, 1952, Seiten 328-332, ---	20
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN [Online] BEILSTEIN INSTITUT ZUR FOEDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFURT AM MAIN, DE; Database-Accession no. 5561939 (BRN), XP002171094 & J. ORG. CHEM. , Bd. 51, Nr. 25, 1986, Seiten 4905-4910, --- -/--	20

6

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internales Aktenzeichen
PCT/EP 00/11191

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN [Online] BEILSTEIN INSTITUT ZUR FOEDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFURT AM MAIN, DE; Database-Accession no. 1719513 (BRN), XP002171095 & HEL. CHIM. ACTA, Bd. 38, 1955, Seite 915 ---	19
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN [Online] BEILSTEIN INSTITUT ZUR FOEDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFURT AM MAIN, DE; Database-Accession no. 4304559 (BRN), XP002171096 & SYNTH. COMMUN., Bd. 21, Nr. 1, 1991, Seiten 1-9, ---	20
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN [Online] BEILSTEIN INSTITUT ZUR FOEDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFURT AM MAIN, DE; Database-Accession no. 1919664 (BRN), XP002171097 & CHEM. PHARM. BULL., Bd. 18, 1970, Seiten 1731-1736, -----	20

6

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

rnationales Aktenzeichen
PCT/EP 00/11191

Feld I Bemerkungen zu den Ansprüchen. die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)

Gemäß Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein Recherchenbericht erstellt:

1. ☐ Ansprüche Nr.
weil sie sich auf Gegenstände beziehen. zu deren Recherche die Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich

2. ☒ Ansprüche Nr. 19-21
weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, daß eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich

siehe Zusatzblatt WEITERE ANGABEN PCT/ISA/210

3. ☐ Ansprüche Nr.
weil es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefaßt sind.

Feld II Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 3 auf Blatt 1)

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:

siehe Zusatzblatt

Aufgrund des Ergebnisses der vorläufigen Überprüfung
gemäss Regel 40.2(e) PCT sind alle zusätzlichen Gebühren zu erstatten.

1. ☒ Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche.

2. ☐ Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der eine zusätzliche Recherchengebühr gerechtfertigt hätte, hat die Behörde nicht zur Zahlung einer solchen Gebühr aufgefordert.

3. ☐ Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr.

4. ☐ Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Der internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen erfaßt:

Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs

☒ Die zusätzlichen Gebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt.

☐ Die Zahlung zusätzlicher Recherchengebühren erfolgte ohne Widerspruch.

WEITERE ANGABEN PCT/ISA/ 210

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere (Gruppen von) Erfindungen enthält, nämlich:

1. Ansprüche: 1-18

   Alternatives Verfahren zur Herstellung optisch aktiver Amine der Formel (I) oder deren Racemate der Formel (VII)

2. Ansprüche: 19,20

   Verbindungen der Formel (I) und deren Racemate der Formel (VII)

3. Anspruch : 21

   Verbindungen der Formel (IX)

WEITERE ANGABEN PCT/ISA/ 210

Fortsetzung von Feld I.2

Ansprüche Nr.: 19-21

1. Die geltenden Patentansprüche 19-21 beziehen sich auf eine unverhältnismäßig große Zahl möglicher Verbindungen, von denen sich nur ein kleiner Anteil im Sinne von Art. 6 PCT auf die Beschreibung stützen und/oder als im Sinne von Art.5 PCT in der Patentanmeldung offenbart gelten kann. Im vorliegenden Fall fehlt den Patentansprüchen die entsprechende Stütze und fehlt der Patentanmeldung die nötige Offenbarung in einem solchen Maße, daß eine sinnvolle Recherche über den gesamten erstrebten Schutzbereich unmöglich erscheint. Daher wurde die Recherche auf die Teile der Patentansprüche gerichtet, welche im o.a. Sinne als gestützt und offenbart erscheinen, nämlich die Teile betreffend, die Verbindungen der Formel I, bzw. VII und IX, mit folgenden Definitionen:

R1: C1-C10 Alkyl, alkenyl, Alkenyl,
R2: C1-C10 Alkyl oder Benzyl
R3: H
R5: H, C1-C10 Alkyl
R6: H, C1-C10 Alkyl, Phenyl
X: O oder S

Die Verbindungen gemäss Beispiele 1-5 sowie Seite 22 der Anmeldung fallen unter dieser Beschränkung.

2. Die Recherche ergab in ihrer Anfangsphase eine sehr große Zahl neuheitsschädlicher Dokumente für den Gegenstand der Ansprüche 19-21. Diese Zahl ist so groß, daß sich unmöglich feststellen lässt, für was in der Gesamtheit der Patentansprüche eventuell nach zu Recht Schutz begehrt werden könnte (Art. 6 PCT). Aus diesen Gründen erscheint eine sinnvolle Recherche über den gesamten Bereich der Patentansprüche unmöglich. Die Recherche wurde daher wie unter Punkt 1 beschränkt.

Der Anmelder wird darauf hingewiesen, daß Patentansprüche, oder Teile von Patentansprüchen, auf Erfindungen, für die kein internationaler Recherchenbericht erstellt wurde, normalerweise nicht Gegenstand einer internationalen vorläufigen Prüfung sein können (Regel 66.1(e) PCT). In seiner Eigenschaft als mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragte Behörde wird das EPA also in der Regel keine vorläufige Prüfung für Gegenstände durchführen, zu denen keine Recherche vorliegt. Dies gilt auch für den Fall, daß die Patentansprüche nach Erhalt des internationalen Recherchenberichtes geändert wurden (Art. 19 PCT), oder für den Fall, daß der Anmelder im Zuge des Verfahrens gemäß Kapitel II PCT neue Patentansprüche vorlegt.

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Intern ales Aktenzeichen
PCT/EP 00/11191

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
DE 247144 C		KEINE	
DE 723498 C		KEINE	
WO 9623894 A	08-08-1996	DE 19523151 A	14-08-1996
		CA 2210519 A	08-08-1996
		CN 1172504 A	04-02-1998
		EP 0801683 A	22-10-1997
		JP 10512759 T	08-12-1998
		US 6214608 B	10-04-2001
WO 9728271 A	07-08-1997	DE 19603575 A	07-08-1997
		EP 0877815 A	18-11-1998
		JP 2000504224 T	11-04-2000