חוק הפטנטים, תשכ"ז-1967 (להלן: "חוק הפטנטים")

**בפני כבוד רשם הפטנטים, המדגמים וסימני המסחר**

|  |  |  |
| --- | --- | --- |
| **בעניין:** | **בקשת פטנט מספר 221005** | (להלן: "**הבקשה**") |
|  | שהוגשה על ידי **FINCHIMICA S.P.A**  באמצעות עוה"ד ליעד וטשטיין ושות'  שמענם לצורך מסירת כתבי בי-דין הוא:  מגדל ב.ס.ר 2  דרך בן גוריון 1 בני ברק 5120149  טל': 073-7880882; פקס': 073-7880883 | (להלן: "**המבקשת**") |
| **ובעניין:** | **התנגדות למתן פטנט על-פי הבקשה** | (להלן: **"ההתנגדות"**) |
|  | שהוגשה על ידי **אדמה מכתשים בע"מ**  באמצעות עוה"ד גילת, ברקת ושות'  שמענם לצורך מסירת כתבי בי-דין הוא:  בית ריינהולד כהן  רחוב הברזל 26א, תל אביב 6971036  טל': 03-5672000; פקס': 03-5672030  דוא"ל: [info@gilatadv.co.il](mailto:info@gilatadv.co.il) | (להלן: "**המתנגדת**") |

## 

## ראיות מטעם המתנגדת-

## חוות דעת פרופ' חבר יואב אישן

תוכן עניינים

[חוק הפטנטים, תשכ"ז-1967 (להלן: "חוק הפטנטים") - 1 -](#_Toc453524389)

[בפני כבוד רשם הפטנטים, המדגמים וסימני המסחר - 1 -](#_Toc453524390)

[ראיות מטעם המתנגדת- - 1 -](#_Toc453524391)

[חוות דעת פרופ' חבר יואב אישן - 1 -](#_Toc453524392)

[א. השכלה ורקע אקדמי, מומחיות וניסיון - 3 -](#_Toc453524393)

[ב. חומרים שסקרתי והיקף חוות דעתי - 3 -](#_Toc453524394)

[ג. השאלות עליהן נתבקשתי לענות - 5 -](#_Toc453524395)

[ד. הרקע לאמצאה - 6 -](#_Toc453524396)

[ד.1. כללי - 6 -](#_Toc453524397)

[ד.2. תהליכי חמצון - 9 -](#_Toc453524398)

[ד.3. חמצון של סולפידים לסולפאוקסידים - 10 -](#_Toc453524399)

[ה. האמצאה הנתבעת בבקשת הפטנט - 14 -](#_Toc453524400)

[ה.1. תביעה מס' 1 - 14 -](#_Toc453524401)

[ה.2. התביעות התלויות - 18 -](#_Toc453524402)

[ו. האמצאה הנתבעת בבקשת הפטנט אינה חדשה - 20 -](#_Toc453524403)

[ז. השימוש ב-DCPA היה מובן מאליו לאיש מקצוע, לאור הידע הכללי שהיה קיים בתחום ואין כל הפתעה בחמצון באמצעות DCPA. - 25 -](#_Toc453524404)

[ח. האמצאה הנתבעת בתביעה 1 הייתה מובנת מאליה בשל שורה של פרסומים קודמים - 30 -](#_Toc453524405)

[ח.1. האמצאה הנתבעת בתביעה מס' 1 הייתה מובנת מאליה לאור פרסום 760' והידע הכללי המדעי הבסיסי שהיה ידוע בתחום - 31 -](#_Toc453524406)

[ח.2. האמצאה הנתבעת בתביעה מס' 1 הייתה מובנת מאליה לאור פרסום 440' והידע הכללי המדעי הבסיסי שהיה ידוע בתחום - 32 -](#_Toc453524407)

[ח.3. האמצאה הנתבעת בתביעה מס' 1 הייתה מובנת מאליה לאור פרסום 761' בשילוב עם פרסום 440' או פרסום 760'. - 34 -](#_Toc453524408)

[ט. האמצאה הנתבעת בכל אחת מהתביעות התלויות הייתה מובנת מאליה - 36 -](#_Toc453524409)

[י. סיכום ומסקנות - 36 -](#_Toc453524410)

**חוות דעת מומחה**

אני, הח''מ, פרופסור חבר יואב אישן, ת"ז 057170219, מרחוב אביגיל 20 , חיפה, ישראל, נתבקשתי על ידי ב"כ המתנגדת, משרד עו"ד גילת ברקת ושות', לתת את חוות דעתי מטעם חברת **אדמה מכתשים בע"מ** (להלן: "**אדמה**"או "**המתנגדת**"), במסגרת התנגדות שהוגשה ע"י אדמה נגד בקשת פטנט ישראלית מספר 221005 (להלן: "**בקשת הפטנט**" או "**הבקשה**") ע"ש חברת **FINCHIMICA S.P.A** (להלן: "**המבקשת**").

ב"כ המתנגדת הסבירו לי כי בקשת הפטנט תובעת קדימה כדין על בסיס בקשת פטנט איטלקית מספר BS2010A000118 מתאריך 7 ביולי 2010 (להלן: "**המועד הקובע**").

אני נותן את חוות דעתי זו במקום עדות בבית המשפט ואני מצהיר בזאת כי ידוע לי היטב, שלעניין הוראות החוק הפלילי בדבר עדות שקר בשבועה, דין חוות דעתי זו כשהיא חתומה על ידי, כדין עדות בשבועה בפני רשם הפטנטים הנכבד.

## השכלה ורקע אקדמי, מומחיות וניסיון

1. בשנת 1993 הוענק לי תואר דוקטור לפילוסופיה, PhD, מהאוניברסיטה העברית בירושלים על מחקרי בתחום הכימיה. בימים אלו אני מכהן כפרופסור חבר בפקולטה לכימיה ע"ש שוליך בטכניון.
2. ניסיוני בתחום הכימיה מתבטא ומתועד במאמרי הרבים הנוגעים אף הם, בין השאר, לתחום הכימיה האורגנית במהלך השנים, הייתי שותף במחקרים רבים ופרסמתי למעלה מתשעים וחמישה מאמרים מדעיים בכתבי עת מקצועיים ובעלי שם עולמי בתחומי הכימיה והחומרים ופרקים באסופות מאמרים ופטנטים, הכל כמפורט בקורות חיי המצורפים לחוות דעתי זו כ**נספח א'**.
3. בנוסף לעיסוקי האקדמיים יזמתי והקמתי חברה על בסיס פיתוח בו השתתפתי, שימשתי בה כדירקטור מיום הקמתה בשנת 2003, כמנהל הפיתוח במשך מספר שנים ואני משמש לה יועץ בענייני כימיה עד עצם היום הזה.
4. השכלתי, ניסיוני האקדמי, רשימת הפרסומים שהשתתפתי בכתיבתם ומידע נוסף, מופיעים ביתר פירוט בקורות החיים המצורפים לחוות דעתי זו ואני מאמין כי ניסיוני מאפשר לי לתת את חוות דעתי זו.

## חומרים שסקרתי והיקף חוות דעתי

1. לצורך חוות דעת זו, סקרתי את בקשת הפטנט, את כתב טענות המתנגדת ואת כתב הטענות בתשובה מטעם המבקשת (על נספחיהם). כמו כן, סקרתי חומרים רלוונטיים אחרים כמפורט להלן.
2. בטבלה להלן רשימת המסמכים שעמדו לנגד עיני לצורך מתן חוות דעתי זו לשם הנוחות סומנו הנספחים בחוות דעתי זו בהתאם לסימנם בכתב טענות המתנגדת). רשימת מסמכים זו, מצורפת לחוות דעתי ומסומנת כ**נספח ב'**.
3. יצוין כי כל ההדגשות בציטוטים מהפרסומים השונים הוספו על ידי הח"מ אלא אם כן צוין אחרת.

|  |  |  |
| --- | --- | --- |
| סימון הפרסום | הפרסום | נספח |
| (להלן: "462'") | [**AU 2010100462** A4 (Australian Patent) to Gharda, published on June 17, 2010](iwl:dms=GBWS-SRV&&lib=GB_DMS&&num=1084380&&ver=1&&latest=1) |  |
| (להלן: "372'") | [**US 3,928,372** published on December 23, 1975](iwl:dms=GBWS-SRV&&lib=GB_DMS&&num=1084371&&ver=1&&latest=1) |  |
| (להלן: "760'") | **WO 01/30760** (PCT International Application Publication) (Clavel *et al*.)Published on May 3, 2001. |  |
| (להלן: "761'") | [**US 6,013,761** to Zierer et al](iwl:dms=GBWS-SRV&&lib=GB_DMS&&num=1084381&&ver=1&&latest=1). Published on January 11, 2000 |  |
| (להלן: "440'") | [**WO 2007/122440** to Gharda et al.](iwl:dms=GBWS-SRV&&lib=GB_DMS&&num=1084394&&ver=1&&latest=1#Doc Num: 1084394 Description: Exhibit 2009) published on November 1st 2007. |  |
| (להלן: "896'") | **US 2,813,896** to Krimm et al. Published on November 19, 1957. |  |
| (להלן: "Kaczorowska") | **Kaczorowska et al**.,”Oxidation of Sulfides to Sulfoxides. Part 2: Oxidation by Hydrgen Peroxide,” Tetrahedron, 61: 8315-8327 (2005). |  |
| (להלן: "Modern Oxidation Methods") | Chapter 7 of ***Modern Oxidation Methods***, J.E. Backvall, ed., WILEY-VCH  Verlag GmbH & Co. KGaA (2004) |  |
| (להלן: "Swern") | **Swern**, D. “Organic Peracids,” Chem. Rev., 1949, 45 (1), pp 1–68 |  |
| (להלן: "Golchoubian") | **Golchoubian et al**.,”Effective Oxidation of Sulfides to Sulfoxides with Hydrogen Peroxide under Transition-Metal-Free Conditions” Molecules 2007, 12, 304-311 |  |
| (להלן: "Uemura") | **Uemura**, Sakae; 6.2 Oxidation of Sulfur, Selenium and Tellurium ; Kyoto University, Japan, vol. 7, Ley. S..V. Ed.; Pergman: Oxford, 1991, 757-787. |  |
| (להלן: "Greenspan") | Frank P. **Greenspan**, "The Convenient Preparation of Per-acids", *J. Am. Chem. Soc.*, 1946, *68* (5), pp 907–907 |  |
| (להלן: "Hussain") | **Hussain**, S.; Bharadwaj, S. K.; Pandey, R.; Chaudhuri, M. K. Eur. J. Org. Chem2009, 20, 3322–3319 . |  |
| (להלן: "Treiber") | Alexander **Treiber**, J. Org. Chem. 2002, 67, 7261-7266. |  |
| (להלן: "Venier") | Clifford G. **Venier**, Thomas G. Squires, Yu Ying Chen, Barbara F. Smith, "Peroxytrifluoroacetic acid oxidation of sulfides to sulfoxides and sulfones", J. Org. Chem. 1982, 47, 3773-3774 |  |
| (להלן: "390'") | EP 2 035 390 B1 |  |
| (להלן: "Scifinder") | Samples of search results from 'Scifinder' |  |
| (להלן:  "Slides Chemistry") | Slides from course in organic chemistry |  |
| (להלן: "March" ( | **March**’s Advanced Organic Chemistry Reactions, mechanisms, and structure, 6th edition, M.B. Smith, J. March Wiley-Interscience, 2007, pp.1780-1783 |  |
| (להלן:  "Pandeeswaran") | M. **Pandeeswaran,** Kinetics and mechanism of the oxidation of methionine by quinolinium chlorochromate,  J Serb. Chem. Soc. 70 (2) 145–151 (2005) |  |
| (להלן: "Hsu") | Fu-Lian **Hsu**, Oxidation of 2-Chloroethyl Sulfides to Sulfoxides by Dimethyl Sulfoxide,J. Org. Chem. 1990,55, 4153-4155 |  |
| (להלן: "Searles") | Scott **Searles**, Jr., Oxidation of Organic Sulfides with Dimethyl Sulfoxide, Journal of Organic Chemistry, 23, 2028-2029; 1958 |  |

## 

## השאלות עליהן נתבקשתי לענות

1. נתבקשתי על ידי המתנגדת לתת את חוות דעתי בנוגע לשאלות הבאות:
   1. מהי האמצאה הנתבעת בבקשת הפטנט?
   2. האם האמצאה הנתבעת בבקשת הפטנט הייתה חדשה במועד הקובע?
   3. האם במועד הקובע האמצאה הנתבעת בבקשת הפטנט הייתה מובנת מאליה לבעל מקצוע ממוצע?
2. בטרם אענה על שאלות אלה אפרט מעט על הרקע המדעי הרלבנטי להבנת האמצאה והידע הקודם בתחום.

## הרקע לאמצאה

### כללי

1. נגזרות שונות של משפחת ה- 1-phenyl pyrazole ( **1** בציור 1 להלן), דוגמת החומר Fipronil(**2** בציור 1 להלן), נמצאו יעילות כקוטלי חרקים (insecticide) רחבי-טווח בחקלאות. מחקרים הראו שהחומר Fipronil משבש את פעילות מערכת העצבים המרכזית של חרקים ובכך משמש בהצלחה להדברת מקקים, זבובים, צרעות, נמלים וחרקים אחרים ולריסון אוכלוסיות מזיקים בחקלאות.

|  |
| --- |
|  |
| **ציור 1** |

1. אחת הדרכים לייצר Fipronil כוללת כשלב אחרון תהליך חמצון בררני ((selective של אטום הגופרית בקבוצת הסולפיד לקבלת קבוצת סולפאוקסיד,[[1]](#footnote-1) כמוצג בציור 2 להלן. שני הריבועים האדומים בציור תוחמים את אתר התגובה הכימית בו קבוצת הסולפיד בחומר **3** הופכת לקבוצת הסולפאוקסיד בחומר **1**, כאשר בשאר חלקי המולקולה לא חל כל שינוי כימי.

|  |
| --- |
|  |
| **ציור 2**  דרך אפשרית להכנת החומר Fipronil, **1**, מחומר המוצא **3** בתהליך חמצון בררני של קבוצת הסולפיד של **3** לקבוצת הסולפאוקסיד בתוצר **1**. |

1. בררנות תהליך החמצון משמעותה חמצון קבוצה פונקציונלית ספציפית במגיב, במקרה שלנו קבוצת הסולפיד, לקבוצה ספציפית בתוצר הרצוי, במקרה שלנו לקבוצת הסולפאוקסיד, ללא חמצון או תגובה מתחרה אחרת של קבוצות פונקציונאליות אחרות במגיב או בתוצר אשר עלולה לפגוע משמעותית בניצולת התהליך (למשל, מבלי שקבוצת הסולפאוקסיד בתוצר תמשיך להגיב בתגובת חמצון לתוצר הסולפון, כמוסבר להלן).
2. בשיטה הנתבעת בבקשת הפטנט החומר המתחמצן (חומר המוצא) הוא חומר ממשפחת החומרים בעלי הנוסחה הכללית **II**, כמתואר בציור 3 (להלן: **חומר מוצא II**/**תרכובת II**/**נוסחה II**), אשר בו R1 ו- R2 הם באופן בלתי תלוי אטומי מימן או הלוגן.
3. על פי השיטה שבבקשת הפטנט, אטום הגופרית (S, מסומן ב**ציור 3** בחץ אדום) של תרכובת **II** מהווה מוקד לחמצון סלקטיבי בתהליך ההופך את קבוצת הסולפיד לקבוצת סולפאוקסיד (המתוארת בחץ אדום ב**ציור 4**), ובכך הופך את תרכובת **II** לתרכובת **I**, שהמבנה הכללי שלה מתואר בציור 4 (להלן: **התוצר I**/**תרכובת I**/**נוסחה I**), אשר בו R1 ו- R2 הם באופן בלתי תלוי אטומי מימן או הלוגן.

|  |
| --- |
|  |
| **ציור 3:**  המבנה המולקולארי הכללי של משפחת תרכובת **II**, אשר בו R1 ו- R2 הם באופן בלתי תלוי אטומי מימן או הלוגן. האטום המתחמצן בתגובה מצוין בחץ אדום. |

|  |
| --- |
|  |
| **ציור 4:**  המבנה המולקולארי הכללי של משפחת תרכובת **I**, אשר בו R1 ו- R2 הם באופן בלתי תלוי אטומי מימן או הלוגן. האטום המתחמצן בתגובה מצוין בחץ אדום. |

1. כאמור לעיל, התהליך המתואר והנתבע בבקשה הוא תהליך חמצון בררני של משפחת תרכובות ספציפית לקבלת משפחת תוצרים מבוקשת. להלן אפרט את הידע המדעי הבסיסי שהיה בידי בעל מקצוע ממוצע בתחום במועד הקובע, בעניין תהליכי חמצון באופן כללי, בעניין חמצון של סולפידים לסולפאוקסידים ובעניין תהליכי חמצון של משפחת תרכובת **II** או אנלוגיות להן למשפחת תרכובת **I** או אנלוגיות לה.

### תהליכי חמצון

1. תהליך חמצון של חומר נתון מוגדר כתהליך בו מתקיים אחד או יותר מהאירועים הבאים:[[2]](#footnote-2) (1) החומר מאבד אלקטרון אחד או יותר; (2) אטום אחד או יותר של המולקולה עולה במצב החמצון שלו; (3) המולקולה רוכשת אטום חמצן אחד או יותר ו/או המולקולה מאבדת אטום מימן אחד או יותר.
2. לתהליך החמצון מצומד בדרך כלל תהליך חיזור[[3]](#footnote-3) המניע אותו. יחדיו, התהליך נקרא תהליך חמצון-חיזור (Oxidation-Reduction) או תהליך חימזור (RedOx). עקב הקושי לצמד ביעילות תגובת חמצון מועילה עם תגובת חיזור מועילה, כדי לחמצן חומר נתון עושים בדרך כלל שימוש בחומר מחמצן קורבני (sacrificial) העובר תהליך חיזור בחמצנו את חומר המטרה ומתכלה במהלך התהליך מבלי ליצור מצדו תוצרים בעלי משמעות. כתוצאה מכך, בדברנו על תגובת חמצון, אנו מתעלמים בדרך כלל מתוצרי תגובת החיזור הנלווית לתגובה הרצויה לנו.
3. **ציור 5** להלן מתאר את שרשרת תהליכי החמצון של סולפאניל (הידוע גם בשם "סולפיד") לסולפאט דרך סולפיניל (במסמך זה יקרא בשמו הקלאסי "סולפאוקסיד"), סולפוניל (הידוע גם בשם "סולפון") וסולפונאט ואת שרשרת תהליכי החיזור ההפוכים. הציור מתאר רק חלק מעושר התגובות החימזור האפשריות בנגזרות גופרית והוא מתעלם מפרטי התגובות המשרות את התהליכים הרצויים על נגזרות הגופרית.

|  |
| --- |
|  |
| **ציור 5:**  שרשרת תהליכי החימצון של סולפאניל לסולפאט דרך די סולפאניל, סולפיניל, סולפוניל וסולפונאט, ותהליכי החיזור ההפוכים. הסימון [Ox) מעל לחץ מסמל תהליך חמצון בעוד שהסימון [Red] מתחת לחץ מסמן תהליך חיזור. הקיצור O.S. (O.S.=Oxidation State) מתאר את מצב החימצון של אטום הגופרית. הקבוצות A ו- A’ מתארות קבוצות שונות בהן הקשר מבוצע לאטום פחמן. |

1. להלן אתמקד בתהליך החמצון הבררני של סולפידים לסולפאוקסידים (התגובה הראשונה משמאל ב**ציור 5**), תהליך חמצון הרלבנטי לאמצאה כפי שהיה ידוע במועד הקובע.

### חמצון של סולפידים לסולפאוקסידים

1. במועד הקובע[[4]](#footnote-4) היה ידוע מנעד רחב ומגוון של מחמצנים ותהליכי חמצון המאפשרים חמצון בררני (מי פחות, מי יותר) של סולפידים לסולפאוקסידים, בין באמצעות **חמצון ישיר,** בו חומר מחמצן גורם לחמצון ישיר של המולקולה המתחמצנת, ובין באמצעות **חמצון עקיף**, בוהמחמצן מחמצן מולקולת ביניים, המחמצנת בתורה את המולקולה המתחמצנת המייצרת את התוצר הרצוי.
2. בספרות פורסמו דוגמאות רבות ומגוונות לתהליכי **חמצון ישיר**. למשל, מאמר הסקירה של Kaczorowska et. al. משנת 2005[[5]](#footnote-5) מתאר, בין השאר, תגובות חמצון של סולפידים לסולפאוקסידים בתהליך של חמצון ישיר כשהחומר המחמצן הוא פראוקסיד מסוג מי חמצן (Hydrogen Peroxide, H2O2).[[6]](#footnote-6)
3. בחמצון ישיר של סולפיד באמצעות פראוקסיד, כגון מי חמצן, התוצר הראשון הוא סולפאוקסיד (שלב A ב**ציור 6**) והוא עשוי להמשיך להתחמצן לקבלת סולפון (שלב B ב**ציור 6**) בין במנגנון דומה, אך איטי בהרבה, המערב תקיפה נוקלאופילית של אטום הגופרית של הסולפאוקסיד את קבוצת הפראוקסיד, ובין במנגנון שנחשב בדרך כלל כיעיל יותר ומהיר יותר בו אניון הפראוקסיד תוקף כנוקלאופיל את אטום הגופרית של הסולפאוקסיד (שלב B ב**ציור 6**). חמצון הסולפאוקסיד לסולפון הוא תהליך לוואי נפוץ בתהליך החמצון של סולפידים לסולפאוקסידים והוא פוגע בסלקטיביות של התגובה ומקטין את הניצולת של התהליך הרצוי.[[7]](#footnote-7)

|  |
| --- |
|  |
| **ציור 6:**  המנגנונים המקובלים לחמצון סולפיד לסולפאוקסיד (A) ולחמצון סולפאוקסיד לסולפון (B) על ידי פראוקסיד*.* |

1. חמצון הסולפאוקסיד לסולפון הוא תהליך לוואי נפוץ בתהליך החמצון של סולפידים לסולפאוקסידים והוא פוגע בסלקטיביות של התגובה ומקטין את הניצולת של התהליך הרצוי.[[8]](#footnote-8)
2. על מנת להבטיח חמצון בררני של הסולפיד לסולפאוקסיד יש לדכא את תהליך ההמשך של חמצון הסולפאוקסיד לסולפון. הידע הקודם מלמד שניתן לעשות זאת באמצעות שליטה על תנאי התגובה.[[9]](#footnote-9)
3. לדוגמה, במאמר משנת 2009 תארו [[10]](#footnote-10)Hussain et. al. דרך פשוטה וכללית לשליטה בתגובת ההמשך של חמצון של סולפאוקסידים לסולפונים בתגובות חמצון של סולפידים לסולפאוקסידים באמצעות פראוקסיד מסוג מי חמצן. **החוקרים מצאו כי שימוש בפראוקסיד מסוג מי חמצן בתנאים חומציים מדכא את תגובת חמצון ההמשך הבלתי רצויה**, כנראה על ידי כך שהתנאים החומציים מורידים את ריכוזו של אניון הפראוקסיד בתמיסת התגובה. המחקר הראה גם ששימוש בפראוקסיד מסוג מי חמצן בתנאים דומים אך בסביבה בסיסית מעודד את תגובת ההמשך לחמצון הסולפאוקסיד לסולפון, כנראה על ידי הגדלת ריכוזו של אניון הפראוקסיד בתמיסת התגובה. בתנאים בסיסיים התוצר העיקרי הוא הסולפון בעוד שבתנאים חומציים התוצר העיקרי הוא הסולפאוקסיד.
4. החוקרים הראו גם כי כשעובדים בתנאים עדינים (טמפרטורת החדר) ובסביבה חומצית ניתן לבצע תהליכי חמצון סלקטיביים של סולפידים לסולפאוקסידים בניצולות גבוהות, גם במולקולות המכילות קבוצות נוספות הרגישות גם הן לתגובות חמצון, כגון אלקנים (Alkenes, C=C), ניטרילים (Nitriles, -C≡N) וכהלים (Alcohols, -OH).

גם מאמר הסקירה של Swern משנת 1949 מסביר כי מי חמצן יכולים לחמצן באופן ישיר סולפידים, אולם תגובת החמצון של סולפיד לסולפאוקסיד יעילה יותר כאשר היא מתבצעת בנוכחות חומצה אורגנית.[[11]](#footnote-11)

1. איש המקצוע בתחום הפועל לפתח תהליך לחמצון בררני של סולפיד לסולפאוקסיד צפוי להכיר או לדלות מהספרות, למשל מאחד מספרי הבסיס של הכימיה האורגנית[[12]](#footnote-12) וממראי המקום שהוא מצטט, את מנגנון התגובה של חמצון סולפיד לסולפאוקסיד. מהידע הקיים בתאריך הקובע צפוי איש מקצוע שכזה להסיק שכדי להגיע לחמצון בררני הוא יכול להשתמש בפראוקסיד, למשל מי חמצן, שהם מחמצן נפוץ, זול, בטוח לשימוש, "ירוק" ויעיל לתגובות אלה. איש המקצוע בתחום צפוי גם לנסות ולמנוע את תהליך המשך החמצון של הסולפאוקסיד לסולפון על ידי עבודה בתנאים חומציים. בחירת הסביבה החומצית המתאימה היא עניין רוטיני שאיש מקצוע במועד הקובע היה יכול לבצע באמצעים פשוטים, תוך שקלול עלויות חומרי הגלם והתהליכים המעורבים, בטיחות, השפעה סביבתית וידע ספרותי קודם, כפי שיפורט בהמשך.
2. בידע הקודם פורסמו גם דוגמאות רבות בהן החומר המחמצן מבצע את תהליך החמצון של המולקולה המתחמצנת באמצעות תהליך **חמצון "עקיף"**.בתהליך כזה החומר המחמצן פועל על מולקולת ביניים (למשל דיכלורו חומצה אצטית - Dichloroacetic acid (להלן:"**DCA**")[[13]](#footnote-13), המחמצנת בתורה את המולקולה המתחמצנת לתת את התוצר הרצוי. בחלק מהתהליכים האלה מולקולת הביניים משמשת כזרז (Catalyst). בחלק מהמקרים נהוג לייצר את מולקולת הביניים בכלי התגובה (In Situ). לשיטה זו יתרונות רבים, בייחוד במקרים בהם מולקולת הביניים היא חומר לא יציב ו/או לא מצוי באופן מסחרי (יקר או לא ניתן לרכישה) ו/או לא בטוח לטיפול.

במקרים אחרים מולקולת הביניים תורמת לבררנות תהליך החמצון בכך שהיא מחמצנת בהעדפה את המגיב לתוצר הרצוי. במקרים אלה, עיקר תפקיד מולקולת הביניים היא למתן את עצמתו של החומר המחמצן בכך שחומר מחמצן זול אך חזק ולא בררני מספיק מבצע את תהליך החמצון שלו על מולקולת ביניים ומתפרק. מולקולת הביניים הנה חומר מחמצן עדין יותר ותהליך החמצון שהיא מפעילה על המולקולה המתחמצנת עדין וסלקטיבי יותר.[[14]](#footnote-14)

1. בידע הקודם מתוארות תגובות חמצון של סולפידים אורגנים לסולפאוקסידים בנוכחות חומצות אורגניות כגון טריפלואורו חומצה אצטית -Trifluoroacetic acid (להלן:"**TFA**")[[15]](#footnote-15), טריכלורו חומצה אצטית - Trichloroacetic acid (להלן:"**TCA**")[[16]](#footnote-16), דיכלורו חומצה אצטית - Dichloroacetic acid (להלן:"**DCA**")[[17]](#footnote-17), כלורו חומצה אצטית - Chloroacetic acid (להלן: "**CAA**")[[18]](#footnote-18), חומצה אצטית - Acetic acid (להלן: "**AA**")[[19]](#footnote-19), וחומצות אחרות.[[20]](#footnote-20)
2. במאמר הסקירה שלו מציג Swern שורה ארוכה של תגובות חמצון של סולפידים לסולפאוקסידים בנוכחות פר-חומצות אורגניות(Organic peracids) מסוגים שונים וכן בנוכחות חומצות אורגניות ומי חמצן תוך ייצור הפר-חומצה האורגנית בכלי התגובה (*In Situ*).[[21]](#footnote-21)
3. **פֶרְחוּמְצָה** אורגנית הנה תוצר חמצון של חומצה אורגנית עם מחמצן כגון מי חמצן, כמתואר בדוגמה שב**ציור 7**. הציור מציג דוגמה לתגובת ייצור פֶרְחוּמְצָה מחומצה אורגנית. בדוגמה מגיבה החומצה DCA עם מי חמצן, ליצירת הפֶרְחוּמְצָה - dichloro**per**acetic acid (להלן:"**DCPA**")[[22]](#footnote-22):

|  |
| --- |
|  |
| **ציור 7:**  תגובה של החומצה הקרבוקסילית DCA עם מי חמצן לקבלת הפֶרְחוּמְצָה DCPA. |

1. שיטות להכנת פֶרְחוּמְצָה אורגנית היו ידועות כבר בתחילת המאה הקודמת, הרבה לפני התאריך הקובע, והן מסוכמות גם במאמר הסקירה של Swern משנת 1949. פרסום Greenspan[[23]](#footnote-23) משנת 1946 מתאר גם הוא שיטה להכנת פֶרְחוּמְצָה מתגובה בין מי חמצן לבין חומצות אורגניות אליפטיות ((Aliphatic acids.[[24]](#footnote-24) באופן דומה, פטנט אמריקאי מספר[[25]](#footnote-25)US 2,813,896 משנת 1957 מתאר שיטה להכנת פֶרְחוּמְצָה מחומצה כלורואצטית, **CAA**, ומי חמצן, ופטנט אמריקאי מספר 3,928,372 [[26]](#footnote-26)US מתאר שיטה להכנת פֶרְחוּמְצָה מחומצה די-כלורואצטית, **DCA**, ומי חמצן.
2. כאמור, תהליכי החמצון המתוארים לעיל, ורבים אחרים שלא נסקרו לעיל, היו חלק מהידע הכללי בתחום בתאריך הקובע. במועד הקובע היו בידי איש המקצוע בתחום אשר היה מבקש לחמצן באופן בררני סולפיד לסולפאוקסיד שורה של חומרים מחמצנים מתאימים ושורה של חומצות אורגניות ואי אורגניות מתאימות, אשר מתוכם היה יכול לבחור באמצעים פשוטים את המחמצן והתנאים המתאימים.
3. אינני מסכים לטענת המבקשת בסעיף 52 לכתב הטענות כי Swern, Greenspan ו- 896' אינם רלוונטיים לדיון במידת החדשנות שבאמצאה הנוכחית[[27]](#footnote-27). העובדה שמדובר בפרסומים ישנים ביותר, Swern למשל מפנה למקורות שהם רלוונטיים כחומר רקע בני יותר ממאה שנים, רק מדגישה את רוחב הידע, הבסיסי והפרטני לנושא הבקשה, והוא אינדיקציה לכך שמדובר בידע כללי שהיה קיים והיה מוטמע אצל בעלי המקצוע בתחום בתאריך הקובע . הידע הנרחב והמפורט בנושא חמצון שימש את אנשי המקצוע בתחום בבחנם את האפשרויות העומדות בפניהם, ולכן רלוונטי ביותר לדיון.

Swern מראה חמצון סלקטיבי של סולפידים לסולפאוקסידים בנוכחות מי חמצן וחומצה אצטית ונגזרות חומצה אצטית כבר באמצע המאה הקודמת[[28]](#footnote-28) ומפנה למראי מקום בני יותר ממאה שנים.[[29]](#footnote-29) היות שהידע הזה לא נסתר על ידי פרסומים חדשים יותר הוא רלוונטי ביותר. בדומה, 896' מלמד תהליך פשוט ובטיחותי לייצור של פרחומצות אורגניות בניצולת טובה ובריכוז גבוה, באמצעות הגבה של החומצות המתאימות עם מי חמצן בריכוז המתאים לשימוש בטוח, כולל פרחומצה דיכלורואצטית “DCPA”, שהמבקשת מזכירה באמצאה שלה. כבר בשנת 1952 נטען ב- 896' שמטרת האמצאה (896') היא לספק דרך לייצר פרחומצות המשמשות בתהליכי חמצון.

"This invention comprises a process whereby organic peracids may be obtained in good yield and in high concentrations in a technically simple and safe manner. The uses of such organic peracids as oxidation agents, disinfecting agents, bleaching agents and catalysts are well known and have been previously set forth in such publications…”.

Greenspan מחזק את הכתוב ב- 896' ומדווח לא רק על שיטה להכנת פרחומצות אורגניות באמצעות מי חמצן 30%, שהם בטיחותיים יחסית לשימוש, אלא גם על היציבות של הפרחומצות בתמיסה. ידע מוקדם זה, המובא בשלושת הפרסומים הקודמים הנו רק חלק קטן מעושר הידע הקודם שעמד בפני בעל המקצוע הממוצע בתחום בבואו לפתח את התהליך הנדון. שלושת הפרסומים הקודמים הנ"ל מציבים את בקשת הפטנט הנדונה בהקשר הנכון שלה.

## האמצאה הנתבעת בבקשת הפטנט

1. הבקשה מתארת ותובעת שיטה (תהליך) להכנת סולפאוקסידים בעלי מבנה המתואר על ידי הנוסחה הכללית של משפחת חומר **I** שבציור 4 אשר בה R1 ו- R2הם באופן בלתי תלוי אטומי מימן או אטומי הלוגן. הסולפאוקסידים ממשפחת חומר **I** מתקבלים על ידי חמצון קבוצת הסולפיד בחומרי המוצא בעלי המבנה המתואר על ידי הנוסחה הכללית של משפחת חומר **II** שבציור 3, אשר בה R1 ו- R2הם באופן בלתי תלוי אטומי מימן או אטומי הלוגן.
2. בבקשה תביעה ראשית אחת (תביעה מס' 1) וחמש עשרה תביעות משנה התלויות בה.

### תביעה מס' 1

1. תגובת החמצון על פי האמצאה, כפי שהיא מוגדרת בתביעה מס' 1 בבקשת הפטנט מתוארת סכמתית ב**ציור 8**.

|  |
| --- |
|  |
| **ציור 8:**  תיאור סכמתי של תגובת החמצון על פי האמצאה, כפי שהיא מוגדרת בתביעה מס' 1 בבקשת הפטנט. |

1. תביעה מס' 1 היא התביעה העצמאית היחידה בבקשה ושאר 15 התביעות תלויות בה באופן ישיר או עקיף. טבלה שלהלן אבחן את רכיביה השונים של תביעה מס' 1:

|  |  |  |
| --- | --- | --- |
| תרגום | IL 221005 application | Element |
| שיטה להכנת | Method for the preparation of | a |
| תרכובת בעלת הנוסחה הכללית (I):    אשר בה R1 ו- R2הם באופן בלתי תלוי מימן או הלוגן | The compound having the following general formula (**I**):    wherein Rl and R2 are independently hydrogen or halogen | b |
| בדרך של חמצון של תרכובת בעלת הנוסחה הכללית (II):    אשר בה R1 ו- R2 כמוגדר למעלה | through oxidation of a compound having  the general formula (**II**):    wherein Rl and R2 are defined as above | c |
| בנוכחות חומצה דיכלורואצטית [DCA][[30]](#footnote-30) | in the presence of dichloroacetic acid [**DCA**]30 | d |
| וחומר מחמצן | and of an oxidizing agent | e |
| כשהחומר המחמצן נבחר מתוך קבוצה הכוללת:  benzoyl peroxides,  sodium peroxides,  t-butyl peroxides  and/or  hydrogen peroxide, | where the oxidizing agent is selected from the group consisting of:  benzoyl peroxides,  sodium peroxides  t-butyl peroxides  **and/or**  hydrogen peroxide, | e1 |
| ואשר בה [בשיטה] החמצון מתבצע בהעדר  [חומצה] טרי-כלורואצטית [TCA]30  ו/או  חומצה טאיכלורופראצטית [TCPA]30 | and wherein the oxidation is conducted in the absence of  trichloroacetic  and/or  trichloroperacetic acid. | f |

1. השיטה ((Method הנתבעת בתביעה 1 של בקשת הפטנט היא של חמצון של תרכובת ממשפחת תרכובת **II** לתרכובת ממשפחת תרכובת **I** (Elements a-c). תהליך החמצון נעשה בנוכחות (in the presence of) החומר **DCA** Dichloroacetic acid, (Element d) וחומר מחמצן (להלן: "**המחמצן**") (and of an oxidizing agent) הנבחר (selected) מתוך קבוצה ((group של חומרים מחמצנים (Elements e and e1). ובהעדר (in the absence of) החומר **TCA**, Trichloroacetic acid, ו/או החומר **TCPA**, Trichloroperacetic acid (Element f).
2. מהאופן בו מנוסחת תביעה 1 אני מבין כי תביעה זו תובעת **כל תהליך חמצון** של חומר ממשפחת תרכובת **II** להכנת החומר התואם ממשפחת תרכובת **I** וזאת בסייגים הבאים:
   1. המחמצן נבחר מרשימה הכוללת מחמצן (Hydrogen peroxide) ושלוש **משפחות** של מחמצנים (benzoyl peroxides, sodium peroxides, t-butyl peroxides) הכוללות מחמצנים רבים, חלקם נפוצים וידועים.
   2. החמצון מתבצע בנוכחות **DCA**.
   3. החמצון מתבצע בהעדר החומר **TCA** ו/או החומר **TCPA**.
3. לפיכך, ההגדרה בתביעה 1 מכסה תנאי תגובה בהם קיימים במערכת גם חומרים נוספים, כגון ממסים, חומצות, פראוקסי-חומצות, בסיסים, פראוקסי-בסיסים, זרזים, תוספים למניעת קורוזיה וכן כל חומר אחר. בנוסף, תביעה 1 מכסה את כל תנאי התגובה מבחינת טמפרטורות ומשטר הטמפרטורה, חומציות ומשטר החומציות, צורת הוספת החומרים ומשטר הוספת החומרים ועוד משתנים רבים אחרים כגון היחסים המולאריים בין החומרים המצויים בכלי התגובה, כמותם האבסולוטית, סוגי העיבודים לפני ואחרי התגובה, שימוש בכלי תגובה מסוגים שונים ועוד משתנים שלא מוזכרים בה במפורש אך גם לא מוחרגים מהתביעה.

### התביעות התלויות

1. **תביעה מס' 2** תלויה בתביעה מס' 1 ומגבילה אותה לחומרים בהם מתמירים R1 ו- R2 הם אטומי ברום או כלור.
2. **תביעה מס' 3** תלויה בתביעות מס' 1 ו-2 ומגבילה אותן כך שהחומר ממשפחת תרכובת **I** הוא:

5-amino-1-(2,6-dichloro-4-trifluoromethyl-phenyl)-4-trifluorometansulfinyl-1H-pyrazole-3-carbonitril, (**1**).

1. **תביעה מס' 4** הנה תביעה התלויה בכל התביעות הקודמות לה והיא מצרה אותן בכך שהחומר **DCA** מתחמצן לחומר **DCPA** על ידי החומר המחמצן מתביעה מס' 1.
2. **תביעה מס' 5** הנה תביעה התלויה בתביעה מס' 4 והיא מצרה אותה בכך שתהליך החימצון של החומר **DCA** לחומר **DCPA** מתבצע בכלי התגובה (במקור מוגדר כ- *in-situ*[[31]](#footnote-31)).
3. **תביעה מס' 6** הנה תביעה התלויה בכל אחת מהתביעות הקודמות לה והיא מצרה אותן בכך שעל כל מול של חומר ממשפחת תרכובת **I** משתמשים ב- 1.0 עד 5.0 מולים של החומר המחמצן.
4. **תביעה מס' 7** הנה תביעה התלויה בכל אחת מהתביעות הקודמות לה והיא מצרה אותן בכך שעל כל מול של חומר ממשפחת תרכובת **I** משתמשים ב- 1.0 עד 2.0 מולים של החומר המחמצן.
5. **תביעה מס' 8** הנה תביעה התלויה בכל אחת מהתביעות הקודמות לה והיא מצרה אותן בכך שעל כל מול של חומר ממשפחת תרכובת **II** נעשה שימוש ב- 1.5 קילוגרם עד 5.0 קילוגרם **DCA**.
6. **תביעה מס' 9** הנה תביעה התלויה בכל אחת מהתביעות הקודמות לה והיא מצרה אותן בכך שהטמפרטורה בה מתרחש החמצון היא בין 0 מ"צ[[32]](#footnote-32) לבין 35 מ"צ.
7. **תביעה מס' 10** הנה תביעה התלויה בכל אחת מהתביעות הקודמות לה והיא מצרה אותן בכך שהטמפרטורה בה מתרחש החמצון היא בין 0 מ"צ לבין 20 מ"צ כשהטמפרטורה המועדפת היא 5 מ"צ.
8. **תביעה מס' 11** הנה תביעה התלויה בכל אחת מהתביעות הקודמות לה והיא מצרה אותן בכך שהיא כוללת בנוסף להן שלב בו נאסף החומר ממשפחת תרכובת **II** שלא עבר את תהליך החימצון.
9. **תביעה מס' 12** הנה תביעה התלויה בתביעה מס' 11 והיא מצרה אותה בכך שהשלב בו נאסף החומר ממשפחת תרכובת **II** שלא עבר את תהליך החימצון כולל תהליכים עוקבים של המסה וגיבוש מחדש של החומר ממשפחת תרכובת **I** עם אחד או יותר מהממסים הנבחרים מהקבוצה toluene, xylene, chlorobenzene, chlorinated aliphatic solvents, isopropanol.
10. **תביעה מס' 13** הנה תביעה התלויה בכל אחת מהתביעות הקודמות לה והיא מצרה אותן בכך שתהליך החמצון של החומר ממשפחת תרכובת **II** מתרחש בנוכחות זרז מסוג חומצה.
11. **תביעה מס' 14** הנה תביעה התלויה בתביעה מס' 13 והיא מצרה אותה בכך שהזרז מסוג חומצה הינו חומצה מינראלית חזקה מהקבוצה הכוללת sulphuric acid, methanesulphonic acid, hydrochloric acid, nitric acid ותערובות שלהן.
12. **תביעה מס' 15** הנה תביעה התלויה בתביעות מס' 13 ומס' 14 והיא מצרה אותן בכך שהיחס המולי שבין החומר ממשפחת תרכובת **II** לבין הזרז חומצה הוא בין 0.3 לבין 1.5 כשהיחס המולי המועדף הוא 0.7.
13. **תביעה מס' 15 נוספת** - בנוסח הבקשה כפי שמופיע באתר הרשם מופיעה תביעה 15 פעמיים. תביעה 15 הנוספת הנה תביעה התלויה בתביעה מס' 1 והיא מצרה אותה בכך שהחומר המחמצן הוא hydrogen peroxide.
14. כאמור, את תנאי תהליך החמצון הנתבעים ניתן ללמוד מלשון התביעה כמפורט בסעיף ‏40 לעיל, אך גם מהיקף התביעות התלויות בה. מצמצום התביעה הראשית על ידי התביעות התלויות בה אני למד, בין השאר, כי תביעה 1 כוללת במשתמע גם את הדברים הבאים:
    1. מצמצום תביעה 1 באמצעות תביעה תלויה [[33]](#footnote-33)4 עולה כי תביעה 1 מכסה שיטות בהן **DCA** אינו מתחמצן ל- **DCPA**. משמעות הצמצום בתביעה 4 היא שתביעה 1 מכסה גם תהליכי חמצון ישיר של חומרים ממשפחת תרכובת **II** על ידי החומר/ים המחמצן/ים שברשימה המופיעה בתביעה 1 ו/או תהליכי חמצון עקיף המתווכים על ידי חומר/ים אחר/ים שאינם מוזכרים במפורש בתביעה.
    2. עולה מכך שהחמצון של תרכובת **II** אפשר שיעשה על ידי **DCPA** או על ידי כל פֶרְחוּמְצָה אחרת (שאינה (**TCPA** לדוגמא **TFPA**[[34]](#footnote-34). יתרה מזאת, החמצון של חומרים ממשפחת תרכובת **II** יכול להתבצע גם ישירות על ידי המחמצן המצוי במערכת, לדוגמא **Benzoyl peroxide**, או מי חמצן, אשר במקום להגיב עם **TCA** או **TFA** יכול לחמצן ישירות את תרכובת **II**.
    3. מצמצום תביעה 1 באמצעות תביעה תלויה [[35]](#footnote-35)5 עולה כי חמצון על פי האמצאה כפי שהיא מוגדרת בתביעה 1[[36]](#footnote-36) יכול להתבצע גם על ידי **DCPA** שלא נוצר*in situ*  אלא שנוצר מחוץ למערכת ומוסף למערכת התגובה כמחמצן של תרכובת **II**.

## האמצאה הנתבעת בבקשת הפטנט אינה חדשה

1. כאמור לעיל, האמצאה, כפי שהיא מוגדרת בתביעות, מתארת שיטה לחמצון חומר מוצא, תרכובת ממשפחת תרכובת **II**, לתוצר, התרכובת המתאימה ממשפחת תרכובת **I**. עיקר השיטה הנתבעת באמצאה כלול במלואו בתיאור ובתביעות שבבקשת הפטנט האוסטרלית AU 2010100462 A4 (להלן: "**462**") שכותרתה -A Process for The Synthesis of Fipronil. הבקשה **462'** פורסמה לפני המועד הקובע, בתאריך ה- 17 ביוני 2010.
2. גוף הבקשה ותביעה 1 של בקשה 462' מתארים תהליך רב-שלבי להכנת Fipronil ותוצרים דומים הכלולים בנוסחה כללית החופפת את משפחת תרכובת **I** על פי הבקשה.[[37]](#footnote-37) שלב **i** של התהליך בבקשה **462'** הוא חמצון של חומר מוצא בעל נוסחה כללית **IX** שקיימת חפיפה בינה לבין משפחת תרכובת **I** שבבקשה.[[38]](#footnote-38) להלן לשון שלב **i** בתביעה 1:

*"Oxidizing the isolated thio pyrazole compound of formula IX in a reaction medium comprising a oxidizing agent, preferably the oxidizing agent is a peroxide compound* *selected from the group consisting of hydrogen peroxide, tert-butyl hydrogen peroxide, benzoyl peroxide and sodium peroxide, preferably hydrogen peroxide in the range of 0.8 to 1.2 molar equivalent ; a solvent system; and a corrosion inhibitor, preferably boric acid, to yield a product mixture containing trifluoromethyl sulfenyl pyrazole compound of formula I."*

1. בטבלה שלהלן אבחן את האלמנטים השונים של תביעה 1 בבקשת הפטנט כפי שנותחו לעיל[[39]](#footnote-39) ואשווה אותם לתביעה 1 ולפירוט המופיע בגוף הבקשה בבקשה **462'**:

|  |  |  |
| --- | --- | --- |
| According to AU 2010100462 A4 | According to Claim 1 of IL 221005 | Element |
| Claim 1:  A process for the preparation of a trifluoromethylsulfenyl pyrazole  compound of formula 1,    wherein Rl, R2 contain elements  of halogen group respectively,; and R3: is  perhaloalkyl  Claim 1(i)  "to yield a product mixture containing trifluoromethyl sulfenyl pyrazole compound of formula I" | Method for the preparation of  the compound having the following general formula (I):    wherein Rl and R2 are independently hydrogen or halogen; | a + b |
| Claim 1(i)  oxidizing the isolated thio pyrazole compound of formula IX | through oxidation of a compound having the general formula (II) | c |
| Claim 1- a solvent system  Page 12 lines 21-25  In preferred embodiment of the present invention, the solvent system in oxidation step (i) is a mixture of at least two solvents selected from a group of halogenated solvents consisting of trifluoroacetic acid, trichloroacetic acid,  dichloroacetic acid, chlorobenzene, dichloromethane and dichloroethane | in the presence of dichloroacetic acid | d |
| Claim 1(i)  preferably the oxidizing agent is a peroxide compound selected from the group consisting of hydrogen peroxide, tert-butyl hydrogen peroxide, benzoyl peroxide ,and sodium  peroxide, preferably hydrogen peroxide  Page 13 line 24-26  The oxidizing agent is a peroxide compound selected from the group  consisting of hydrogen peroxide, tert-butyl hydrogen peroxide, benzoyl  peroxide and sodium peroxide. | and of an oxidizing agent:  and where the oxidizing agent is selected from the group consisting of  benzoyl peroxides,  sodium peroxides  t-butyl peroxides  **and/or**  hydrogen peroxide, | e+e1 |
|  | and wherein the oxidation is conducted in the absence of  trichloroacetic [**DCA**]30  and/or  trichloroperacetic acid [**DCPA**]30. | f |

1. **לסיכום:** למיטב הבנתי, כל רכיביה של האמצאה הנתבעת בבקשת הפטנט גולו בפרסום **462'**. אפרט על פי האלמנטים השונים בטבלה לעיל:
2. **משפחת חומרי התוצר (אלמנטa+b**  **בטבלה)**: קיימת חפיפה בין משפחת תרכובת **I** של בקשת הפטנט למשפחת חומרי התוצר (**I**) שבבקשה **462'**.[[40]](#footnote-40)
3. **משפחת החומרים המתחמצנים (אלמנט c בטבלה)**: קיימת חפיפה בין קבוצת החומרים המתחמצנים, משפחת תרכובת (**II**) בבקשת הפטנט, לקבוצת החומרים המתחמצנים (**IX**) בבקשה **462'**. הקבוצה הפונקציונלית המתחמצנת לסולפאוקסיד זהה וכך גם הקבוצות הפונקציונליות הסמוכות לה.[[41]](#footnote-41)
4. **הממס בתגובה** (**אלמנט d+f בטבלה**): האמצאה הנתבעת בבקשת הפטנט מחייבת נוכחות **DCA** בתהליך החמצון, אך אינה שוללת נוכחותם בתהליך של חומרים אחרים בתמיסה, למעט **TCA** ו/או **TCPA**, והאפשרות לנוכחות חומרים אחרים בתהליך משתמעת, בין היתר, מהתביעות התלויות.[[42]](#footnote-42) חלק מהדוגמאות לתהליך החמצון המתוארות בבקשה **462'** כולל שימוש בתמיסה המכילה **DCA** (ביחד עם חומרים אחרים). בנוסף, בתיאור של בקשה **462'** מצויינת העדפה לעשות שימוש בממס המורכב מתערובת של ממסים (לפחות שני ממסים) מתוך רשימה מסויימת הכוללת **DCA**. אולם, התיאור בבקשה **462'**, בוודאי אינו שולל אפשרות להשתמש בחומר בודד כממס, ובפרט בחומר בודד מתוך הרשימה המומלצת הנ"ל, כגון ה- **DCA**. מסקנתי היא שקיימת חפיפה בין רכיב הממס בבקשה **462'** לבין רכיב הממס בבקשת הפטנט.
5. **החומר המחמצן (אלמנט e+e1)**: כל אחת ממשפחות החומרים הנתבעות בבקשת הפטנט מיוצגת על ידי חומר אחד לפחות בבקשה **462'** הקודמת לה, המוזכר באופן מפורש כיישום מועדף, כפי שתואר לעיל, תהליך החמצון הנתבע בבקשת הפטנט גולה על כל רכיביו בבקשת הפטנט **462'** ולכן אין בו לדעתי כל חידוש.
6. אני לא מסכים לאופן שבו מתארת המבקשת[[43]](#footnote-43) את אשר גולה בפרסום **462'**, כמו גם עם טענותיה המבוססות על פרסום זה.

אכן, **462'** מלמדת ותובעת תהליך סינתזה מקיף יותר מאשר בבקשת הפטנט. אולם, הדבר אינו משפיע כלל על העובדה שבגוף הבקשה **462'** מתואר שלב בו מבודד תוצר **IX** [[44]](#footnote-44), ואף בדוגמה 12 מופיעה הניצולת לקבלת חומר ממשפחת **IX**, נתון המצריך את בידודו של החומר.[[45]](#footnote-45) גם דוגמה 13, המתארת תהליך חמצון של חומר ממשפחת **IX**, מתארת שקילה של החומר והוספתו לכלי התגובה.[[46]](#footnote-46) גם בתביעה מס, 1 סעיף (**i**) של **462'** מופיע במפורש שתהליך החמצון מתבצע על חומר ממשפחת חומרי **IX** שעבר בידוד.[[47]](#footnote-47) אי לכך, להבנתי, לעובדה שבתיאור ובתביעות של בקשה 462' מוזכר תהליך מורכב יותר אין כל משמעות (אם בכלל, הדבר יכול לשמש אינדיקציה לכך שהממציא של בקשה 462' לא ראה בתהליך זה כשלעצמו אלמנט המצאתי), וניתן למקד את הדיון בתהליך החמצון המתואר בה כתהליך עצמאי.

1. המבקשת מציגה שלל דוגמאות המופיעות בבקשה **462'** וטוענת כי היא *"מלמדת ששלב החמצון מתבצע בתערובות של חומצה טריפלואורואצטית ו/או חומצה טריכלורואצטית ושל לפחות ממס אחד נוסף הנבחר מרשימה הכוללת chlorobenzene, dichloroacetic acid, dichloromethane ו- dichloroethane.* אכן, בקשה **462'** מלמדת זאת, **אבל לא רק זאת**. הבקשה **462'** מלמדת בפירוש ש-

*“In preferred embodiment of the present invention, the solvent system in oxidation step (i) is a mixture of at least two solvents selected from a group of halogenated solvents consisting of trifluoroacetic acid, trichloroacetic acid, dichloroacetic acid, chlorobenzene, dichloromethane and dichloroethane.”*[[48]](#footnote-48)

1. משורות אלה ברור שהמלצת הממציא שם היא לעשות שימוש בתמיסה המורכבת מתערובת של ממסים, לפחות שניים, מתוך קבוצה מוגדרת של ממסים, וביניהם חומצה דיכלורואצטית. אולם מדובר אך ורק ב- preferred embodiment, ולפי התיאור עולה שניתן להשתמש בממס שאינו תערובת, ובכלל זה ממס הכולל רק חומצה דיכלורואצטית, **DCA**, או בתערובת של ממסים אשר ביניהם חומצה דיכלורואצטית.
2. היות ובקשה **462'** מזכירה מי חמצן (ואחרים) כחומר מחמצן בתגובה,[[49]](#footnote-49) היא מגלה את האפשרות להשתמש בחומצה דיכלורואצטית, **DCA**, כממס ומי חמצן כמחמצן.
3. יועציה המשפטיים של המתנגדת הסבירו לי, ואני מקבל את ההסבר, כי אמצאה אינה נחשבת לחדשה אם פורסמה לפני המועד הקובע באופן שבעל המקצוע יכול היה לבצע אותה על-פי האמור בפרסום. עוד הוסבר לי כי קריאת הפרסום הקודם עלי ידי בעל מקצוע נעשית בהנחה שהוא מצויד בידע הכללי בתחום ההמצאה.
4. **לפיכך, לאור העובדה שהתהליך הנתבע, על כל רכיביו, תואר בבקשה 462' באופן שבעל מקצוע היה יכול לבצע אותו במועד הקובע, מתחייבת הקביעה כי האמצאה הנתבעת אינה חדשה**.
5. מעבר לכך אציין כי אני כלל לא מסכים עם טענת המבקשת ש-**"***בעל מקצוע בתחום היה מבין בנקל כי חומצה דיכלורואצטית משמשת להורדת נקודת ההיתוך ולא ניתן להשתמש בה לשם חמצון ה- sulfide intermediate".*
6. טענה זו אינה סבירה גם מהסיבה שכממס גרידא אין לחומצה הדיכלורואצטית יתרונות בולטים על פני שורה ארוכה של ממסים נפוצים וזולים הרבה יותר, עם נקודות התכה נמוכות בהרבה. יתרונה המשתמע היחיד של החומצה הוא בכך שהיא יכולה בעיקרון לשמש גם כמחמצן משני בתהליך החמצון.
7. גם הטענה שבקשה **462'** "מאשרת את הקביעה של Gharda בבקשה **440'** כי חומצה דיכלורואצטית היא "poor medium for oxidation" והתכלית היחידה להוספתה היא לדכא את נקודת ההיתוך של חומצה טריכלורואצטית" אין לה על מה להסתמך, לאור הכתוב לעיל. איש המקצוע בתחום היה מסיק מבקשה **462'** ומהידע הקודם בתחום כי Gharda מצא תנאים בהם קביעתו מבקשה **440'** בדבר החומצה הדיכלורואצטית אינה מתקיימת, וכי ניתן להשתמש בה כמדיום בתהליכי חמצון.

## השימוש ב-DCPA היה מובן מאליו לאיש מקצוע, לאור הידע הכללי שהיה קיים בתחום ואין כל הפתעה בחמצון באמצעות DCPA.

1. אחת הטענות המובאת בתחילת בקשת הפטנט IL 221005 היא ההפתעה הגדולה כביכול, ובעקבותיה הטענה לאמצאה, בכך שניתן להשתמש ב- **DCPA** כמחמצן (עמ' 6, שורות 12-19 בבקשת הפטנט).

*“the use of dichloroperacetic acid as an oxidant has never been described in the literature. Surprisingly it was found that DCA, in the presence of an oxidant species such as hydrogen peroxide, peroxide or similar, is also itself transformed at low temperatures into the corresponding dichloroperacetic acid and that this species is an excellent oxidant of the compound having the general formula(II).”*

בפסקה זו מגולמות שתי קביעות עובדתיות: האחת, שהשימוש ב- **DCPA** כחומר מחמצן לא תואר מעולם בספרות והשנייה, ש- **DCA** בנוכחות חומר מחמצן פראוקסידי או דומה, בטמפרטורות נמוכות, הופך ל- **DCPA** ושחומר זה משמש מחמצן מצוין לחומרים מקבוצת חומרים **II**. אינני מסכים עם הטענה הראשונה ואינני מסכים עם הטענה שאמורה להיות הפתעה כלשהי לגבי התהליך המוזכר בטענה השנייה.

1. ראשית, וכפי שפורט בפרק ‏ד.3, השימוש ב- **DCPA** בתהליכי חמצון הכוללים מחמצן ו-**DCA** תואר בספרות הגלויה שהייתה קיימת בתאריך הקובע.[[50]](#footnote-50)
2. שנית, לאור הידע הכללי בתחום לפני המועד הקובע, לא הייתה אמורה להיות כל הפתעה בכך שהחומצה **DCA** תהפוך לפרחומצה שלה, **DCPA**, בנוכחות מחמצן כדוגמת מי-חמצן, דבר שתואר לא אחת בספרות לפני התאריך הקובע[[51]](#footnote-51),ושחומר זה יהיה מחמצן מתאים לתרכובת ממשפחת תרכובת  **II**לשם קבלת תוצרים ממשפחת תרכובת **I** בניצולת טובה.
3. בטרם אתייחס לפרסומים ספציפיים אפרט מספר מושכלות יסוד בעבודתו של איש המקצוע בתחום שמוטלת עליו המטלה לפתח תהליך חמצון של חומרים מקבוצת תרכובת **II** לחומרים מקבוצת תרכובת **I**.
4. בבואו לתכנן תגובת חמצון, עומד בפני הכימאי מגוון רחב ביותר של חומרים מחמצנים, אורגנים ואי-אורגנים אשר מבניהם עליו לבחור את המגיבים המתאימים ותנאי התגובה המיטביים.
5. דרך מקובלת להגיע לתנאי תגובת חמצון שיתאימו לתגובה הרצויה כוללת, בין השאר, אפיון חומר המוצא לתגובה והגדרת תגובות הלוואי האפשריות. למשל, במשפחת חומרי המוצא ממשפחת תרכובת **II**, אטום הגופרית אינו אתר התגובה היחיד, ואפילו לא אתר החמצון היחיד האפשרי, לכן קיימת דרישה שהחמצון יעשה בהעדפה מספקת בקבוצה הפונקציונלית המתאימה (במקרה שלפנינו - אטום הגופרית) ולדרגת החמצון המתאימה (במקרה שלפנינו, אטום הגופרית צריך לעבור ממצב חמצון (-2) שבסולפיד למצב חמצון (0) שבסולפאוקסיד). תהליך זה צריך לצאת לפועל מבלי שיפגע באופן משמעותי בקבוצות אחרות הקיימות בחומר המוצא ממשפחת תרכובת **II** ובחומר התוצר ממשפחת תרכובת **I**, ומבלי שתתרחש בחומר התוצר, שהוא סולפאוקסיד ממשפחת תרכובת **I**, תגובת חמצון המשך לקבלת הסולפון.
6. אחד האמצעים החשובים והמרכזיים שיש לנקוט, כעניין שבשגרה, לצורך בחירת המחמצן ותנאי התגובה במקרים כאלה הוא עריכת סקר ספרות, במטרה לברר את זהות המחמצן/ים ותנאי התגובות הידועים לביצוע תגובת החמצון הרצויה על אחד או יותר ממשפחת תרכובת **II**, ו/או מבנים שהם "קרובי משפחה" של ממשפחת תרכובת **II** (למשל נגזרות דומות למשפחת תרכובת **II**).
7. עבור חמצון של חומרים ממשפחת תרכובת **II** לחומרים ממשפחת תרכובת **I** קיימות בספרות דוגמאות אחדות, חלקן הגדול אף עוסק בחומר מעניין מבחינה מסחרית, Fipronil. בנספח [20] מוצגות תוצאות חיפושים מכוונים תוך שימוש בתוכנת Scifinder והגדרת מגיב ותוצר רצויים, המשתנה עם מידת החופש המותרת לתוכנה בזהות המגיבים והתוצרים (בהדגמה זו לא הגבלתי את תחום החיפוש לתאריך הקובע). ניתן לראות שמספר התגובות הידועות הולך וגדל ככל שאנו מרחיבים את משפחת החומרים אותה אנו מחפשים. ממראי המקום המופיעים כתוצאות החיפוש ניתן לראות כי תוצר הלוואי העיקרי ברוב התגובות האלה הוא הסולפון.
8. סקר ספרות נוסף שאמור בעל המקצוע הממוצע בתחום לערוך יתמקד בתגובה הכללית שעליו לבצע, בחומרים ובתנאים המתאימים ליציאתה לפועל בדרגת הניקיון הרצויה, במנגנון שלה, בתוצרי הלוואי הנפוצים שלה. במקרה שלפנינו בעל המקצוע הפועל בדרך הרוטינית ילמד את נושא החמצון של סולפידים לסולפאוקסידים ואת הדרכים להשיג סלקטיביות בתהליך ולהימנע ככל הניתן מקבלת תוצר הלוואי מסוג סולפון. בתוך החומר שפורסם לגבי התגובה המבוקשת ותגובות דומות, בעל המקצוע יחפש את החומר המחמצן העדיף עבורו ועבור התגובה אותה הוא מתכנן לבצע, ואת הממס/ים ותנאי התגובה שהשתמשו בהם בעבר. במונח "עדיף עבורו" כוונתי שקיימים שיקולים שונים בבחירת חומרים, כגון זמינות ומחיר, ועל כך ארחיב בהמשך.
9. סקירה של תוצאות החיפוש בנספח [20] (בניכוי התגובות שפורסמו אחרי התאריך הקובע) מעלה כי היה ידוע לבצע את תגובת החמצון הרצויה ודומות לה במגוון דרכים ובניצולת טובה עד גבוהה.[[52]](#footnote-52)
10. רוב תגובות החמצון כוללות שימוש במי חמצן או פראוקסיד אורגני אחר כחומר המחמצן. עוד כוללות תגובות אלה שימוש בממס או בתערובת ממסים. הידע הקודם מלמד כי תגובת החמצון של תרכובת ממשפחת תרכובת **II** לתרכובת ממשפחת תרכובת **I** וגם מערכות דומות יכולה להתבצע ביעילות גבוהה באמצעות שילוב של מי חמצן כמחמצן ו- **TCA**[[53]](#footnote-53) ו/או **TFA**[[54]](#footnote-54) כמתווך תהליך החמצון.

באופן דומה, צפוי כי גם חומצות נוספות מאותה שורה הומולוגית יפגינו תכונות חימזור דומות, כשתכונותיהן משתנות, בדרך כלל בצורה הדרגתית, מנגזרת לנגזרת.[[55]](#footnote-55) שלוש החומצות הקרובות ביותר ל- **TCA** ו- **TFA**, אשר היו המועמדות הראשונות לניסוי הן חומצה דיפלוארואצטית, חומצה דיכלורואצטית (**DCA**) וחומצה טריברומואצטית. לאיש מקצוע לא הייתה כל סיבה להניח ש- **DCA** לא תהיה יעילה בחמצון בדומה ל- **TCA**, להיפך. על פי הידע הכללי בתחום שלפני המועד הקובע היה ידוע כי חומצה זו יכולה לשמש בתהליכי חמצון עקיף של סולפידים לסולפאוקסידים ואף בתהליכי חמצון של חומרים ממשפחת תרכובת **II** לחומרים ממשפחת תרכובת **I**, דוגמת [[56]](#footnote-56)Fipronil, דבר המחזק את דעתי כי איש המקצוע הממוצע היה בוחר ב- **DCA** כאחת מבחירותיו הראשונות. בפני בעל המקצוע גם לא עמד שום מכשול טכנולוגי שמנע ממנו להשתמש ב - **DCA** במקום ב- **TCA**, וכאמור, שימוש ב- **DCA** הוצע במפורש בפרסום האוסטרלי השולל להבנתי חידוש מהאמצאה. בנוסף, פרסום Swern מלמד כי חסרון משמעותי של החומצה טריכלורו פרחומצה אצטית, **TCPA**, הוא שהיא לא יציבה באופן קיצוני וכי היא מתפרקת לחומרים פעילים, כגון פוסגן, כלור וחומצה מלחית, במהירות בעוד שמונוכלורו חומצה אצטית, **MCPA**, יציבה מספיק לעבור תהליך ניקוי בזיקוק.[[57]](#footnote-57) לו רק מטעם זה יש לומר שבעל המקצוע בתחום היה בוחן את האפשרות להשתמש ב- **DCA** כאמצעי לשלב יציבות, ראקטיביות ובטיחות.

הפרסום הראשון שהראה כי חומצה טריכלורו אצטית, **TCA**, יכולה לשמש כמתווכת יעילה בתהליכי חמצון (לא כממס יחיד בשל היותה במצב מוצק בטמפרטורת החדר), היה מפנה את תשומת הלב של איש מקצוע בתחום להשתמש בשורה ההומולוגית של נגזרות הכלור של חומצה אצטית, כגון **DCA**, כמתווכי חמצון בתהליכי חמצון, קל וחומר כאשר היו קיימים פרסומים ספציפיים לגבי תהליכי חמצון של חומרים ממשפחת חומר מוצא **II** לחומרים ממשפחת חומר מוצא **I** בהם חומצה טריכלורו אצטית דווחה כיעילה בתיווך תהליכי החמצון.

בשורה ההומולוגית של נגזרות הכלור של החומצה האצטית קיימות שלוש נגזרות רלוונטיות, כאשר רק אחת מתוכן מתאפיינת בנקודת התכה נמוכה ויכולה לשמש גם כממס והיא ה- **DCA**. בנוסף, מכולן, DCA צפויה להיות הקרובה ביותר בתכונותיה הכימיות ל- **TCA,** כך שחומר זה הוא החומר הראשון שבעל מקצוע הפועל בדרך רוטינית מתבקש שיבחר לנסות.

1. בטבלה שלהלן מתוארת שורה הומולגית של נגזרות ההלוגן של חומצה אצטית וכן תלות החומציות באופי ובמספר אטומי ההלוגן שעליה. לא מפתיע לראות שעם העלייה במספר אטומי ההלוגן נצפית עליה בחומציות החומצה. כמו כן, עם העלייה במספר האטומי של אטום ההלוגן מוצאים ירידה בחומציות החומצה. [זהו חומר שאני מלמד בקורס בסיסי של כימיה אורגנית ללא כימאים (למשל סטודנטים לרפואה) בטכניון, מס קורס 125801, מצ"ב **כנספח** **21** שקפים רלוונטיים ממצגת הקורס.[[58]](#footnote-58)
2. יצוין כי חוזק החומצה מתבטא בערך ה- pKaשלה וככל שהחומצה חזקה יותר ה- pKa שלה נמוך יותר. גם נקודות ההיתוך של נגזרות אלה היו ידועות.

|  |  |  |
| --- | --- | --- |
| **טבלה 2 :שורה הומולגית של נגזרות ההלוגן של חומצה אצטית וכן תלות החומציות באופי ובמספר אטומי ההלוגן שעליה** | | |
| **CH3COOH**  pKa=4.76 (25C)a |  |  |
| **CH2FCOOH**  pKa=2.59 (25C) a  250mg=595 ILS (Sigma-Aldrich)  Mp=+35 °C | **CHF2COOH**  pKa=1.24b  25g=1,658 ILS (Sigma-Aldrich)  Mp=−1 °C | **CF3COOH**  pKa=0.52 (25C)a  CRC  3kg=3,898 ILS (Sigma-Aldrich)  Mp=−15.4 °C |
| **CH2ClCOOH**  pKa=2.87 (25C) a  1kg=268 ILS (Sigma-Aldrich)  Mp=+63 °C | **CHCl2COOH**  pKa=1.35 (25C) a  3.9kg=1040 ILS (Sigma-Aldrich)  Mp=+9-11 °C | **CCl3COOH**  pKa=0.66 (20C) a  Mp=+57-58 °C |
| **CH2BrCOOH**  pKa=2.90 (25C)a  2kg=1,498 ILS (Sigma-Aldrich)  Mp=+47-49 °C | **CHBr2COOH**  pKa=1.47c  25g=1,150 ILS (Sigma-Aldrich)  Mp=+32-38 °C | **CBr3COOH**  pKa=0.72d  25g=411 ILS (Sigma-Aldrich)  Mp=+128-132 °C |
| **CH2ICOOH**  pKa=3.18 (25C)a  100g=1,152 ILS (Sigma-Aldrich)  Mp=+77-79 °C |  |  |
| a: CRC  b: Acetic Acid and its Derivatives  c: Chemicaldictionary  d: Guidechem | | |

1. בתעשייה, בה מתקיימים אילוצים אחרים מאשר במעבדות מחקר, סביר שיעשה מאמץ לעשות שימוש בחומרים מחמצנים זמינים וזולים לשימוש ו/או כאלה הניתנים למחזור בדרכים זולות. חלק מהשיקולים הנוספים בתעשייה בתהליך בחירת החומר המחמצן יהיו שיקולי בטיחות (חלק מהחומרים המחמצנים הנם נפיצים ומסוכנים לאחסון ועבודה בכמויות גדולות), רעילות לאדם (חלק מהחומרים המחמצנים ידועים כמסרטנים ו/או רעילים) ורעילות לסביבה (חלק מהחומרים המחמצנים ידועים כרעילים וככאלה הפוגעים בחי ובצומח שסביבנו).
2. כך למשל חומצה טריברומו אצטית ההומולוגית ל- **TCA** ו- **TFA** צפויה להתאים כחומצה מבחינת ערך ה- pKaאך לא בהכרח תשמש בתעשייה בשל נקודת ההיתוך הגבוהה שלה, העלויות הגבוהות של תרכובות ברום, והאפשרות לתגובות לוואי הנובעות מהעובדה שהקשר פחמן-ברום חלש משמעותית מהקשר פחמן-פחמן ואפילו מהקשר פחמן-כלור.
3. באופן דומה, לא סביר יהיה להשתמש בחומצה דיפלואורואצטית לחמצון בתעשייה, זאת בשל זמינותה הנמוכה ועלותה הגבוהה יחסית ל- **TCA**.
4. לעומתם, **DCA** הינו חומר זמין וזול ומתאפיין בנקודת היתוך נמוכה (נוזל בטמפרטורת החדר). לחומר pKa שמעיד על פניו שהחומר מתאים לביצוע התגובה בצורה בררנית.
5. לאור הידע הכללי בתחום, אני מסיק שבעל מקצוע שהיה מבקש במועד הקובע לחמצן חומר ממשפחת תרכובת**II** לקבלת חומר ממשפחת תרכובת **I** היה מנסה את השימוש בתהליך הנתבע בבקשת הפטנט על כל רכיביו המפורטים, עם ציפייה גבוהה להצלחה, ובפרט השימוש ב- **DCA**, השימוש בנציגים מכל אחת ממשפחות המחמצנים המוזכרות בבקשה, ובתנאי תגובה זהים או דומים ביותר לתנאים המפורטים בבקשה (כגון משטר טמפרטורה וזמן, ריכוזים, יחסים מולאריים וכדומה) כמוצהר וכמצופה מאיש המקצוע הממוצע גם בבקשה עצמה.[[59]](#footnote-59)

## האמצאה הנתבעת בתביעה 1 הייתה מובנת מאליה בשל שורה של פרסומים קודמים

1. בפרק זה אציג פרסומים שנעשו ביחס לאמצאה הנתבעת בבקשה לפני התאריך הקובע. להבנתי, פרסומים אלה, הן כשלעצמם והן ביחד עם הידע הכללי שהיה קיים בתחום לפני התאריך הקובע, הופכים את האמצאה הנתבעת בבקשה למובנת מאליה. מנציגי המתנגדת אני למד כי די בפרסום אחד מבין אלו המתוארים להלן, או בשילוב של פרסום כזה עם הידע הכללי בתחום, בכדי שהאמצאה תחשב כמובנת מאליה וכי אין צורך בשילוב של מכלול הפרסומים הנ״ל לשם כך.
2. בנוסף, וכפי שהסברתי לעיל, לדעתי פרסום **462'** גילה את כל רכיביה של האמצאה ולכן ברור שאם האמצאה אינה חדשה, ממילא לא יכולה להיות בה כל הפתעה. בחלק זה לא אתייחס שוב לפרסום **462'** אך ברור כי פרסום זה, בשילוב הידע הקודם הופך את האמצאה למובנת מאליה.

### האמצאה הנתבעת בתביעה מס' 1 הייתה מובנת מאליה לאור פרסום 760' והידע הכללי המדעי הבסיסי שהיה ידוע בתחום

1. **פרסום** 760' של Aventis Cropscience S.A. משנת 2001 שכותרתו: Process for Preparing 4- Trifluoromethylsulfinylpyrazole Derivates, מתאר, בין השאר, חמצון של חומר מוצא סולפיד (חלקם ממשפחת תרכובת **II**) לסולפאוקסיד (חלקם ממשפחת תרכובת **I**). החמצון נעשה באמצעות פֶרְחומצה אורגנית מסוג trifluoroperacetic acid (**TFPA**) המתקבל כתוצאה מחמצון של **TFA** באמצעות מי חמצן, בין אם in situ ובין אם במערכת נפרדת[[60]](#footnote-60), בנוכחות מונע קורוזיה (הנובעת מהיווצרות תוצר הלוואי חומצה פלואורית, **HF**). להבנתי, האמצאה בפרסום **760'** בנושא זה אינה השימוש ב-**TFA** עם מי חמצן לחמצון סולפיד לסולפאוקסיד, תהליך שהיה ידוע שנים לפני פרסום זה[[61]](#footnote-61), אלא שיפור התגובה על-ידי שימוש בחומר מונע קורוזיה שמונע את נזקי החומצה הפלואורית.
2. בעל מקצוע שהיה מודע לשימוש ב- **TFA**לצורך חמצון כמתואר בפרסום **760'** היה מניח כי ניתן להמיר את ה- **TFA** ותוצר החמצון שלו **TFPA** בחומצות אחרות מאותה שורה הומולוגית, והאפשרויות הקרובות, כפי שהוסבר לעיל,[[62]](#footnote-62) אינן רבות. בתאריך הקובע כבר פורסם כי ניתן לבצע את התהליך המבוקש ביעילות ובניקיון של עד 95% בנוכחות **TCA** ומי חמצן (כנראה תוך יצירת **TCPA**)[[63]](#footnote-63) כך שהליכה בדרך הרוטינית תוביל לכך שנגזרות ההלוגן של חומצה אצטית יהוו את החומרים הראשונים שיבחנו. **DCA** היא נגזרת כלור של חומצה אצטית וככלל זולה וזמינה יותר מנגזרות הפלואור והברום שלה. לא היה בצבר הידע הקודם כל מידע אשר היה מסיט איש מקצוע מלנסות את השימוש ב-**DCA** או אשר היה בו כדי להעיד כי חמצון כזה אינו אפשרי. נהפוך הוא. מהידע הכללי של איש מקצוע בתחום ברור כי האנלוגים של **TFA** הם המועמדים הראשונים להחליפה בתגובה.
3. אני לא מסכים עם טענת המבקשת בסעיף 11 לכתב טענותיה ולפרשנות שהיא עושה לפרסום **760'**.[[64]](#footnote-64) פרסום **760'** מלמד כי חומרים מחמצנים מסוימים שנבדקו נמצאו לא מספקים מסיבה כזו או אחרת:

*A number of oxidants (including amongst others sodium vanadate, sodium tungstate, peracetic acid, performic acid and* ***pertrichloroacetic acid****)**[****TCPA****] have been employed in an attempt to obtain an efficient and region selective oxidation which will provide 5-amino-1- (2, 6-di chloro-4-trifl uoromethy l pheny 1)-3 -cyano-4- trifluoromethylsulphinylpyrazole in pure form and which may also be utilized for large scale preparations.* ***All of the above methods were found to be unsatisfactory in one respect or another***. *[[65]](#footnote-65)*

1. המשפט האחרון בציטוט לעיל קובע קביעה כוללנית ומעורפלת ביותר (*in one respect or another*) שיכולה הייתה להתבסס על שיקולים ו/או אילוצים שאינם קיימים אצל איש המקצוע הקורא את פרסום **760'**.
2. העובדה שבשנת 2001 מספר חומרים מסוימים נמצאו לא מספקים מסיבה כזאת או אחרת בתנאי הניסוי שנבדקו, אין משמעה בהכרח שתגובה כזו אינה אפשרית וספק רב אם בעל מקצוע היה מייחס להן כל חשיבות לאור הידע הכללי בתחום.
3. בשנת 2010 (לפני המועד הקובע) איש מקצוע בתחום, שכבר הכיר את פרסום **440'** משנת 2007, שלימד על חמצון יעיל של חומרים ממשפחת תרכובת **II** למשפחת תרכובת **I**, באמצעות **TCPA**, היה מייחס לאמירות הכלליות שפורסמו בפרסום **760'** משנת 2001 משמעות מוגבלת מאוד, אם בכלל. בכל מקרה, זהו דיון מעט תיאורטי לאור הפרסום האוסטרלי **462'**, שגם הוא היה מוכר לבעל המקצוע בתחום לפני המועד הקובע*.*

### האמצאה הנתבעת בתביעה מס' 1 הייתה מובנת מאליה לאור פרסום 440' והידע הכללי המדעי הבסיסי שהיה ידוע בתחום

1. פרסום 440' של Gharda et al, שכותרתוProcess for the Preparation of Fipronil , שפורסם בשנת 2007, מתאר חמצון של חומר מוצא סולפיד בעל מבנה החופף למשפחת תרכובת **II** לסולפאוקסיד בעל מבנה החופף למשפחת תרכובת **I** (הכוללת (fipronil. החמצון נעשה בנוכחות **TCA** וחומר מחמצן אחד או יותר, או בנוכחות תוצר/י התגובה של **TCA** עם החומר/ים המחמצן/ים ובנוכחות לפחות חומר אחד המנמיך את נקודת ההתכה (melting point depressant).
2. על פי אחת האפשרויות שבפרסום **440'** החמצון של משפחת תרכובת **II** נעשה על ידי פֶרְחוּמְצָה אורגנית מסוג Trichloroperacetic acid (**TCPA**) המתקבל כתוצאה מחמצון של **TCA**, *in situ* או במערכת נפרדת[[66]](#footnote-66).
3. על פי פרסום **440'**, אחד החומרים האפשריים לשמש להנמכת נקודת ההתכה של התערובת הוא **DCA**.[[67]](#footnote-67) עוד עולה מפרסום **440'** כי בתנאים המתוארים בו **DCA** הוא מחמצן נחות לעומת **TCA**. יחד עם זאת, ואפילו אם למרות האמור לעיל בעל מקצוע היה סבור ש- **TCA** יעיל מ- **DCA** לצורך ביצוע התגובה המבוקשת, הדבר לא היה מונע מאיש מקצוע לנסות את השימוש ב-**DCA** כממס במערכת התגובה מהטעמים המובאים בדיון בפרסום **760'**.
4. בעל מקצוע אינו קורא את פרסום **440'** במנותק מהידע הכללי בתחום. הידע הכללי לימד בבירור כי כל השורה ההומולוגית של חומצות כלורו-אצטיות מתאימה בעיקרון לחמצון בררני של סולפידים לסולפוקסידים,[[68]](#footnote-68). לפיכך, הפרסום **440'** לא היה מונע מבעל מקצוע מלנסות את השימוש ב- **DCA** כמחמצן, וכמוסבר לעיל פעולה כזאת הייתה נעשית באופן רוטיני על ידי בעל מקצוע ממוצע שהיה מבקש לחמצן חומר ממשפחת חומר **II** לחומר ממשפחת חומר **I**.
5. על פי הידע המדעי הבסיסי, כאשר**DCA** מגיב עם חומר מחמצן כדוגמת מי חמצן הוא יכול להתחמצן לפֶרְחומצה אורגנית-**DCPA**[[69]](#footnote-69). פֶרְחוּמְצות אורגניות ידועות כמחמצנים חזקים בתגובות חמצון של סולפידים לסולפוקסידים[[70]](#footnote-70), ועל כן לא ניתן ולא סביר היה לשלול את האפשרות ש- **DCA** משתתף פעיל בתהליך החמצון על פי השיטה שבפרסום **440'**.
6. אינני מסכים עם האופן בו קוראת המבקשת את פרסום **440'** בסעיפים 15-13 לכתב טענותיה. בפרסום **440'** נעשה החמצון של תרכובת ממשפחת חומר **II** בנוכחות **TCA** ו- **DCA**. הגם שהתכלית המוצהרת של הוספת**DCA** על פי פרסום **440'** הייתה להוריד את נקודת ההיתוך של **TCA** לא היה בכך כדי לשלול או להרחיק איש מקצוע משימוש ב- **DCA** ללא **TCA**.
7. בפרסום **440'** לא נטען כי **DCA** אינו מתחמצן ל-**DCPA** ואינו מחמצן מתאים לתגובה, אלא שבתנאי השיטה (למשל יחס הריכוזים, טמפרטורה, צורת ההוספה ועוד משתנים שלא פורטו בפרסום) תפקידו של **DCA** הוא הורדת נק' ההיתוך של **TCA**. תימוכין לכך שבעל מקצוע ממוצע היה מבין שגם **DCPA**, למשל כזו הנוצרת מ- **DCA** ומי חמצן in situ יכולה לשמש כמחמצן ניתן למצוא אפילו בבקשת הפטנט של המבקשת בה היא מסבירה כי הסיבה לכך ש- **DCPA** איננו המחמצן בתגובה המתוארת בפרסום **440'**[[71]](#footnote-71) איננה בגלל ש- **DCA** איננה מסוגלת להפוך ל- **DCPA** ולחמצן את התרכובת ממשפחת תרכובת **II**, אלא מפני שבמערכת הספציפית המתוארת **DCA** נמצא בריכוז נמוך לעומת **TCA**:

*“In addition, it is realistic to believe that, in the teaching of the prior art document WO 2007/122440A1, the dichloroacetic acid does not transform into dichloroperacetic acid by means of the hydrogen peroxide or other oxidant, because the species TCA, present in significant molar excess of the oxidant and more reactive towards the oxidants, captures all the available oxygen”*

1. לאור האמור לעיל, אינני מסכים עם טענת המבקשת[[72]](#footnote-72) כאילו בעל מקצוע בתחום לא סבר כי יש מקום לנסות את **DCA** כממס וחומר מוצא ל- **DCPA** כמחמצן בתגובה.

גם כאן, מדובר בדיון מעט תאורטי לאור הפרסום האוסטרלי **462'**, שגם הוא היה מוכר לבעל המקצוע בתחום לפני המועד הקובע*.*

### האמצאה הנתבעת בתביעה מס' 1 הייתה מובנת מאליה לאור פרסום 761' בשילוב עם פרסום 440' או פרסום 760'.

1. פרסום **761'** שכותרתו Oxidation of Polyarylene Sulfides מתאר שיטה לחמצון קבוצת סולפיד לסולפאוקסיד. על פי השיטה, החמצון נעשה בנוכחות חומצה ומי חמצן. רשימת החומצות המועדפות לתגובה המפורטת בפרסום כוללת בין השאר**TFA** ,**TCA** ו- **DCA** באותה מידת העדפה:[[73]](#footnote-73)

*"Particularly preferred acids are concentrated sulfuric acid, methanesulfonic acid, trifiuoromethanesulfonic acid, trichloromethanesulfonic acid, chlorosulfonic acid, trifluoroacetic acid, trichloroacetic acid and dichloroacetic acid."*

1. פרסום **761'** מלמד ומפרט בדוגמאות 13-16 את רכיבי השיטה ומדגים את יעילותה. איש מקצוע ממוצע, אשר היה מבקש להמיר את השימוש ב- **TCA**, למשל בגלל העדפה שנובעת מנקודת ההתכה הגבוהה, חוסר היציבות או הנטייה ליצור חומרי לוואי מסוכנים וראקטיביים, היה מנסה עם ציפייה גבוהה להצלחה, להמיר את **TCA**המתואר ב- **440'** ב- **DCA** על פי פרסום **761'**. לשם הדוגמא, לו מאסטרנט במעבדה שלי היה ממיר את השימוש המתואר ב-**TCA** ל- **DCA** לצורך תגובה כאמור, וההמרה הייתה מצליחה, לא הייתה בכך הפתעה (מבחינתי הייתה זאת הפתעה אלמלא ההמרה הייתה מצליחה). באופן דומה, היה זה מובן מאליו לאיש מקצוע ממוצע בתחום אשר היה מבקש לעשות בתגובה שימוש בחומר אחר במקום **TFA** שבפרסום **760'** היה מנסה, במידה גבוהה של ציפייה להצלחה, להמיר חומר זה ב- **DCA** על פי פרסום **761'**.
2. אני לא מסכים לטענת המתנגדת בסעיף 49 לכתב טענותיה ועם המסקנות אותן היא גוזרת מטענה זו. אכן, פטנט **761'** מלמד חמצון של polyarylene sulfide ל- polyarylene sulfoxide ואכן מדובר בחמצון של פולימרים. אבל המסקנה שהתחום המדעי של הפולימרים שונה מהתחום המדעי שבבקשה 221005 לחלוטין אינה נכונה. הכימיה היא אותה הכימיה. מדובר בכימיה בסיסית המשותפת לכל התחומים, והמחשבה שבעל מקצוע יסבור שחמצון סולפיד בתחום הפולימרים אינו שייך לחימצון בתחום התרופות או בתחום חומרי ההדברה נראית תלושה מהמציאות ׁ. המגיבים, התוצרים והראגנטים בתמיסה אינם מודעים לקיומו של "תחום הפולימרים").
3. פולימרים יגיבו תגובה שונה מאשר מולקולות קטנות (שהן, במשתמע מהטענה, "התחום המדעי" של בקשה 221005) כשיהיו סיבות כימיות או פיסיקליות הנובעות מהבדלי הגודל הקיימים בין מולקולות קטנות לפולימרים, כגון המסה חלקית של הפולימר, אגרגציה בתמיסה של הפולימר, שקיעה של הפולימר אחרי תגובה חלקית, הפרעות סטריות לתגובה הנובעות מגודל המתמירים בפולימר ושיקולים דומים. בכל שאר המקרים, בהם לא קיימים אילוצים הנובעים מהתכונות הייחודיות של הפולימר כחומר גבה-מולקולארי, התגובה לא תבחין בין פולימר למולקולה קטנה. בכל מקרה, אם קיימים הבדלים בראקטיביות הכימית בין פולימרים למולקולות קטנות הרי הם בדרך כלל כאלה המקשים עלינו להסיק מכימיה המתרחשת על מולקולה קטנה לכימיה המתרחשת על פולימר ובדרך כלל לא להפך. במקרה שלפנינו ברור כי arylene sulfide הם חלק ממשפחת הסולפידים וכי הם עוברים תגובה לקבלת סולפאוקסידים ובתנאים חריפים יותר לקבלת סולפונים, כמו כל סולפיד אחר, כפי שבא לכדי ביטוי בפרסום SWERN בו לא קיימת הפרדה בין דוגמאות אריליות לדוגמאות אחרות. אין ספק שבעל מקצוע בתחום יביא בחשבון וילמד מדוגמאות חמצון של arylene sulfide ואף מדוגמאות חמצון של poly arylene sulfide לשם ביצוע החמצון הנדרש בבקשה. ההבדל בתכונות המתמירים שעל אטום הגופרית יובאו בחשבון כמובן, כחלק מהידע הקודם בתחום אבל גם כאן אין כל חידוש. לראיה, צבר הידע הכולל בתחום בתאריך הקובע מלמד כל על מקצוע בתחום כי החמצון הנדרש אינו דורש תנאים קיצוניים כדי שיצא לפועל.

לא ברורה לי הדרך למסקנתה של המבקשת ש*: "הראקטיביות של ה- sulfide intermediate והראקטיביות של polyaryl sulfide שונות לחלוטין ומדיום החמצון של polyarylenesulfide כלל אינו רלוונטי לעיניינינו. ככל שניתן לייחס רלבנטיות כלשהי לפטנט 761' הרי שהוא מצביע על כך שחומצה דיכלואורצטית לא צפויה להתאים לחמצון של sulfide intermediate, הרי שהוא רק מצביע על כך שחומצה דיכלורואצטית לא צפויה להתאים לחמצון sulfide intermediate, המתאפיין בנוכחות של קבוצות מושכות אלקטרונים חזקות לפיפרוניל, כפי שאכן גם מדגישה הספרות הספציפית העוסקת בחמצון של ה-sulfide intermediate".*

1. מקריאת הספרות הכללית והשוואת תנאי התגובה המפורטים ב- 761' אני למד כי ניתן לחמצן בניצולת ובבררנות גבוהות יחסית סולפידים לסולפאוקסידים בתערובת של מי חמצן וחומצה דיכלורואצטית, **DCA**,[[74]](#footnote-74) היות ולשם תגובה, חלק, ולו קטן, של הפולימר סביר ביותר שיתמוסס בתערובת התגובה הרי ש- **DCA** משמש בדוגמה זו כממס וגם, כפי שאני למד מהפירוט - כמתווך תהליך החמצון.[[75]](#footnote-75) בכל מקרה, בעוד שבעיני פרסום **761'** מכוון בברור את בעל המקצוע בתחום לכיוון שימוש ב- **DCA**, אני לא מצליח לחשוב ולו על טיעון לוגי אחד המבוסס על פרסום **761'** שירחיק את בעל המקצוע משימוש ב- **DCA** בהתבסס על הכתוב בו. להבנתי, הטענה הזו של המבקשת אין לה על מה להתבסס והיא אינה נכונה. [כזכור, זהו דיון מעט תיאורטי לאור הפרסום האוסטרלי **462'**, שגם הוא היה מוכר לבעל המקצוע בתחום לפני המועד הקובע]*.*

## האמצאה הנתבעת בכל אחת מהתביעות התלויות הייתה מובנת מאליה

1. בפרק ‏ה.2 לעיל, פרטתי כיצד כל אחת מהתביעות התלויות מגבילה את תביעה 1. ההגבלה של תביעה 1 התקבלת על ידי שילוב פירוט מצר של אלמנטים שונים לתהליך החמצון הנתבע בתביעה זו. להבנתי, אף אחד מהאלמנטים המצרים את תביעה 1 אינו חדש או מפתיע. גם המבקשת אינה מיחסת את אלמנט ההפתעה לאף אחד מהשילובים השונים שהתביעות התלויות.[[76]](#footnote-76) להבנתי, השילוב של תביעה 1, שאינה מחדשת דבר יחסית לידע הקודם, עם אלמנטים מצרים בתביעות התלויות השונות אינו מייצר באף אחת מהתביעות התלויות אמצאה חדשה שיש בה הפתעה או גילוי שהוא מעבר למסלול הרוטני של איש המקצוע.

## סיכום ומסקנות

1. לאור האמור לעיל מסקנתי היא, באופן חד משמעי, כי במועד הקובע:
   1. האמצאה הנתבעת בבקשת הפטנט תוארה בעיקרה בפרסום **462'** ולכן לא הייתה חדשה.
   2. האמצאה לא הייתה מפתיעה בעיניו של בעל מקצוע בתחום, אשר, לאור הידע הקודם בתחום, היה מומרץ לנסות לבצע את האמצאה, תוך ציפייה גבוהה להצלחה. במלים אחרות, האמצאה לא הייתה מחוץ למסלול הרוטיני שבו היה פועל בעל מקצוע ממוצע במועד הקובע, כאשר היה מבקש לחמצן חומר ממשפחת חומר  **II** לחומר ממשפחת חומר **I**, ולא היה כל קושי או מכשול שבעל מקצוע היה צריך להתגבר עליו על מנת להגיע לאמצאה. דברים אלה נכונים גם בהתעלם מהפרסום **462'** ומקבלים משנה תוקף לאורו.

1. מולקולה בה אטום גופרית קשור לשני אטומי פחמן תקרא להלן סולפיד (sulfide) או תיו-אתר (thio-ether) או סולפאניל (Sulfanyl). בחמצון של אטום הגופרית שבקבוצת הסולפיד, המתבטא בקישור אטום חמצן אחד לאטום הגופרית, מתקבלת קבוצה שתקרא להלן **סולפאוקסיד** (סולפיניל, sulfinyl, S=O). [↑](#footnote-ref-1)
2. “Compendium of Chemical Terminology” Gold Book, International Union of Pure and Applied Chemistry, Version 2.3.3, 2014-02-24, pp. 1048-1049. <http://goldbook.iupac.org/O04362.html>. [↑](#footnote-ref-2)
3. “Compendium of Chemical Terminology” Gold Book, International Union of Pure and Applied Chemistry, Version 2.3.3, 2014-02-24, p. 1271; <http://goldbook.iupac.org/R05222.html> [↑](#footnote-ref-3)
4. בסקירה הספרותית אכלול רק ידע שהיה קיים באופן פומבי בזמן הגשת בקשת הפטנט, אלא אם יצוין במפורש אחרת. [↑](#footnote-ref-4)
5. ר' פרסום**Kaczorowska** , נספח [**10**] לחוות דעתי, עמ' 8317 - 8324. [↑](#footnote-ref-5)
6. גם המבקשת בכתב טענותיה מפנה למספר פרסומים העוסקים בחמצון ישיר של סולפידים (נספחים 1, 2, 5, 7 שצורפו לכתב טענות המבקשת) אולם פרסומים אלה אינם רלבנטיים לבקשת הפטנט. [↑](#footnote-ref-6)
7. ר' **March** (נספח [**22**] לחוות דעתי). [↑](#footnote-ref-7)
8. ר' **March** (נספח [**22**] לחוות דעתי). [↑](#footnote-ref-8)
9. ר'**Modern Oxidation Methods** עמ' 194 (נספח [**11**] לחוות דעתי). [↑](#footnote-ref-9)
10. ר' **Hussain**, (נספח [**16**] לחוות דעתי). [↑](#footnote-ref-10)
11. ר' **Swern**, עמ' 34 (נספח [**12**] לחוות דעתי). [↑](#footnote-ref-11)
12. ר' **March** (נספח [**22**] לחוות דעתי). [↑](#footnote-ref-12)
13. פה צריכים לבוא **כל** המקומות בהם ח' דיכלורואצטית משמשת לתיווך תהליך החמצון. [↑](#footnote-ref-13)
14. ר' דוגמאות בפרסום **Hsu**, נספח [**24**] לחוות דעתי וכן בפרסום **Searles**, נספח [**25**] לחוות דעתי. [↑](#footnote-ref-14)
15. ר' **390'** נספח [**6**] לחוות דעתי ר' גם **760'** נספח [**19**] לחוות דעתי. [↑](#footnote-ref-15)
16. מדובר בחמצון תיופן לתיופן אוקסיד, השקול לחמצון סולפיד לסולפאוקסיד, ר' פרסום **440'**, (נספח [**8**] לחוות דעתי).

    ר' גם **761'** נספח [**7**] לחוות דעתי. [↑](#footnote-ref-16)
17. ר' פרסום **Treiber**, נספח [**17**] לחוות דעתי, טבלה 5 בעמ' 7262. [↑](#footnote-ref-17)
18. ר' פרסום **Pandeeswaran**, נספח [**23**] לחוות דעתי [↑](#footnote-ref-18)
19. ר' פרסום **Swern** עמ' 34 (נספח [**12**] לחוות דעתי). [↑](#footnote-ref-19)
20. ר' פרסום **Swern**, טבלה 5 עמ' 36-35 (נספח [**12**] לחוות דעתי). [↑](#footnote-ref-20)
21. ר' פרסום **Swern**, טבלה 5 עמ' 36-35 (נספח [**12**] לחוות דעתי). [↑](#footnote-ref-21)
22. ר' פרסום **372'**, (נספח [**5**] לחוות דעתי). [↑](#footnote-ref-22)
23. ר' פרסום **Greenspan** (נספח [**15**] לחוות דעתי). [↑](#footnote-ref-23)
24. שם, עמ' 907. חומצות אורגניות האליפטיות הן חומצות אשר לא מכילות קבוצות ארומטיות ובכלל זה חומצה אצטית וחומצה דיכלוראצטית וכיוצא באלה. [↑](#footnote-ref-24)
25. ר' פרסום **896'** (נספח [**9**] לחוות דעתי). [↑](#footnote-ref-25)
26. ר' פרסום **372'** (נספח [**5**] לחוות דעתי). [↑](#footnote-ref-26)
27. ר' סעיף 52 לכתב טענות המתנגדת. [↑](#footnote-ref-27)
28. ר' פרסום **Swern** עמ' \_\_(נספח [**12**] לחוות דעתי). [↑](#footnote-ref-28)
29. ר' פרסום **Swern** עמ' ֹֹֹ\_\_\_ (נספח [**12**] לחוות דעתי). [↑](#footnote-ref-29)
30. המידע בסוגריים הריבועיים הוא תוספת שלי לשם הבהירות. [↑](#footnote-ref-30)
31. <http://www.merriam-webster.com/dictionary/in%20situ> . [↑](#footnote-ref-31)
32. מעלות צלזיוס. [↑](#footnote-ref-32)
33. כאמור, תביעה המצרה את התביעות הקודמות לה בכך שהחומר **DCA** מתחמצן לחומר **DCPA** על ידי החומר המחמצן המופיע ברשימה שבתביעה מס' 1. [↑](#footnote-ref-33)
34. בין שנוצר מחוץ לכלי התגובה או בתוכה (*in situ* , למשל מתגובה שבין **TFA** לחומר מחמצן). [↑](#footnote-ref-34)
35. “Method according to claim 4 wherein oxidation of the dichloroacetic acid takes place in situ” [↑](#footnote-ref-35)
36. כלומר החמצון של חומרים ממשפחת תרכובת **II**למשפחת תרכובת I. [↑](#footnote-ref-36)
37. במונח חפיפה כוונתי לזהות, לפחות חלקית, בין מרכיבי הקבוצה. במקרה שלפנינו R3 הוגדר ב- 462' כ- perhaloalkyl ואילו בבקשה כ- CF3-, המוכל בקבוצת ה- perhaloalkyl. R1 ו- R2 הוגדרו ב- 462' כהלוגנים, ואילו בבקשה הוגדרו כהלוגנים או מימן באופן בלתי תלוי. [↑](#footnote-ref-37)
38. בשינויים המחויבים בעניין R1, R2 ו- R3. [↑](#footnote-ref-38)
39. ר' פרק ‏ה.1 לעיל. [↑](#footnote-ref-39)
40. השוני בין שתי משפחות החומרים ( Iלפי בקשת הפטנט ו-I בבקשה 462') הוא בהגדרת קבוצות ה-R . R1  ו- R2 בבקשת הפטנט הם הלוגן או מימן בעוד שבבקשה 462' R1 ו- R2 הם הלוגנים בלבד. כמו כן R3בבקשת הפטנט הוא CF3- בעוד שבבקשה 462' R3 הוא רחב יותר וכולל בנוסף ל- CF3- גם Perhaloalkyl אחרים. [↑](#footnote-ref-40)
41. השוני בין שתי משפחות החומרים ( **II**לפי בקשת הפטנט ו-**IX** בבקשה **462'**) הוא בהגדרת קבוצות ה-R . R1  ו- R2 בבקשת הפטנט הם הלוגן או מימן בעוד שבבקשה **462'** R1 ו- R2 הם הלוגנים בלבד. כמו כן R3בבקשת הפטנט הוא CF3- בעוד שבבקשה **462'** R3 הוא רחב יותר וכולל, בנוסף ל- CF3-, גם Perhaloalkyl אחרים. [↑](#footnote-ref-41)
42. ר' פרק ‏ה.2 לעיל. [↑](#footnote-ref-42)
43. סעיפים 47-45 לכתב הטענות. [↑](#footnote-ref-43)
44. ר' למשל פרסום **462'** עמ' 19 שורות 7-4. [↑](#footnote-ref-44)
45. ר' למשל פרסום **462'** עמ' 28 שורות 21-20. [↑](#footnote-ref-45)
46. ר' פרסום **462'** עמ' 32 שורה 14. [↑](#footnote-ref-46)
47. ר' פרסום **462'** עמ' 32 שורה 14. [↑](#footnote-ref-47)
48. ר' פרסום **462'** עמ' 12 שורות 24-21, (נספח [**4**] לחוות דעתי). [↑](#footnote-ref-48)
49. ר' למשל פרסום **462**' עמוד 14 שורה 1, (נספח **[4**] לחוות דעתי). [↑](#footnote-ref-49)
50. חשוב לשים פה את כל מה שיש לנו על זה. [↑](#footnote-ref-50)
51. לשים פה את כל הרפרנסים שמתארים את הפיכת DCA ל- DCPA. [↑](#footnote-ref-51)
52. ר' סעיף ‏22 לעיל. [↑](#footnote-ref-52)
53. ר' פרסום **462'** (נספח [**4**] לחוות דעתי), **440'** (נספח [**8**] לחוות דעתי), **761'** (נספח [**7**] לחוות דעתי). [↑](#footnote-ref-53)
54. ר' פרסום **670'** (נספח [**6**] לחוות דעתי), **462'** (נספח [**4**] לחוות דעתי) , **761'** (נספח [**7**] לחוות דעתי). [↑](#footnote-ref-54)
55. שורה של תרכובות כימיות מטיפוס אחיד המראות שינויים הדרגתיים בתכונותיהן הפיסיקליות, אשר ניתן לייצגם בנוסחה כללית. כל תרכובת שונה מקודמתה בגלל תוספת קבוצת אטומים זהה. homologous series [↑](#footnote-ref-55)
56. ר' פרסום **462'** (נספח [**4**] לחוות דעתי). [↑](#footnote-ref-56)
57. ר' פרסום **Swern** עמ' 10 שורות 31-27 (נספח [**12**] לחוות דעתי). [↑](#footnote-ref-57)
58. ר' שקפים מתוך הקורס (נספח [**21**] לחוות דעתי). [↑](#footnote-ref-58)
59. ר' למשל פסקה [0078] בבקשת הפטנט "Even if not previously specified, a person skilled in the art may, using the expertise typical of the sector, vary or replace some of the aspects described above with other technically equivalent ones.". [↑](#footnote-ref-59)
60. ר' פרסום **760'** עמ' 7 ש' 19-17 וכן תביעה 1 ותביעה 2 בפרסום זה (נספח [**6**] לחוות דעתי). [↑](#footnote-ref-60)
61. ר' למשל פרסום **Venier (**נספח [**18**] לחוות דעתי). [↑](#footnote-ref-61)
62. ר' פרק ‏ז לעיל. [↑](#footnote-ref-62)
63. ר' פרסום **440**' (נספח [**8**] לחוות דעתי) וכן ר' פרסום **462'** (נספח [**4**] לחוות דעתי). [↑](#footnote-ref-63)
64. "בקשה760'WO מלמדת, אפוא, כי חומרים מחמצנים אלה שניסו החוקרים נמצאו בלתי מתאימים ומלמדת נגד השימוש בחומרים אלה." [↑](#footnote-ref-64)
65. התוכן בסוגריים המרובעים וההדגשות הוספו ע"י הח"מ למען בהירות הדברים ואינם מופיעים במקור. [↑](#footnote-ref-65)
66. ר' פרסום **440'**, נספח [**8**] לחוות דעתי, עמ' 8 ש' 24-21 עמ' 9 ש' 2-1. [↑](#footnote-ref-66)
67. ר' פרסום **440'**, נספח [**8**] לחוות דעתי, עמ' 9 ש' 21-17. [↑](#footnote-ref-67)
68. ר' פרסום **Treiber** (נספח [**17**] לחוות דעתי). [↑](#footnote-ref-68)
69. ר' פרסום **896'**, עמ' טור 2 ש' 22-19 (נספח [**9**] לחוות דעתי) פה שווה להוסיף את כל מה שיש לנו בנדון. [↑](#footnote-ref-69)
70. ר' פרסום **Swern**, טבלה 5 עמ' 36-35 (נספח [**12**] לחוות דעתי). [↑](#footnote-ref-70)
71. ר' **בקשת הפטנט** עמ' 4 ש' 25 עד עמ' 5 ש' 7. [↑](#footnote-ref-71)
72. ר' סעיף 44 לכתב טענות המבקשת. [↑](#footnote-ref-72)
73. ר' פרסום **761'**, טור 3 ש' 59-56 (נספח [**7**] לחוות דעתי) [↑](#footnote-ref-73)
74. ר' פרסום **761'**, דוגמאות 16-13 (נספח [**7**] לחוות דעתי) [↑](#footnote-ref-74)
75. ר' פרסום **761'**, טור 1 שורות 60-53 וכן טור 3 שורות 11-7 (נספח [**7**] לחוות דעתי) [↑](#footnote-ref-75)
76. ר' **בקשת הפטנט** עמ' 6 פסקה 22, למעט תביעות 15-13 העוסקת בתוספת של הזרז החומצי עמ' 12 פסקה 50. [↑](#footnote-ref-76)