

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 78870

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT 09-135635

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las conferidas en el numeral 26 del artículo 3° del Decreto 4886 de 2011, y

CONSIDERANDO:

PRIMERO: Que mediante escrito radicado en esta Superintendencia el 27 de noviembre de 2009, con el N° 09-135635-00000-0000, por las sociedades SYNGENTA PARTICIPATIONS AG y SYNGENTA LIMITED, a través de apoderado, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "PROCESO PARA LA PRODUCCIÓN DE PIRAZOLES", que corresponde a la solicitud internacional PCT/EP2008/003841 del 13 de mayo de 2008.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 614 del 19 de marzo de 2010, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 14139 y notificado por fijación en lista el 14 de agosto de 2012 se requirió a la solicitante en los términos del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, para que presentara respuesta a las observaciones de carácter técnico visibles a folios 69 a 75 del cuaderno administrativo, relacionadas con la patentabilidad o cumplimiento de los requisitos establecidos por esta Decisión, para la concesión de la patente.

CUARTO: Que la solicitante mediante escrito radicado bajo el N° 09-135635-00006-0000 del 2 de noviembre de 2012, respondió oportunamente el requerimiento formulado, y presentó nuevas reivindicaciones 1 a 22 (Fls. 101 a 104) que reemplazan las originalmente presentadas, atendiendo de esta manera las observaciones efectuadas en el examen de fondo. Se aceptó el nuevo capítulo reivindicatorio presentado, comoquiera que se ajusta a las prescripciones contenidas en el artículo 34 de la Decisión 486.

QUINTO: Que en virtud de lo dispuesto en el artículo 14 de la Decisión 486 expedida por la Comisión de la Comunidad Andina *"Los países miembros otorgarán patentes para las invenciones, sean de producto o de procedimiento, en todos los campos de la tecnología, siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial."*

SEXTO: Que las reivindicaciones 1 a 22 contenidas en los folios 101 a 104, no cumplen con los requisitos de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

6.1. Objeto de la invención

El objeto de la presente solicitud de patente de invención se refiere a un proceso para la producción de un compuesto de fórmula (I), el cual comprende una etapa de ciclización en presencia de metilhidrazina, agua y un solvente orgánico inmiscible en agua y posteriormente

Página 1 de 7

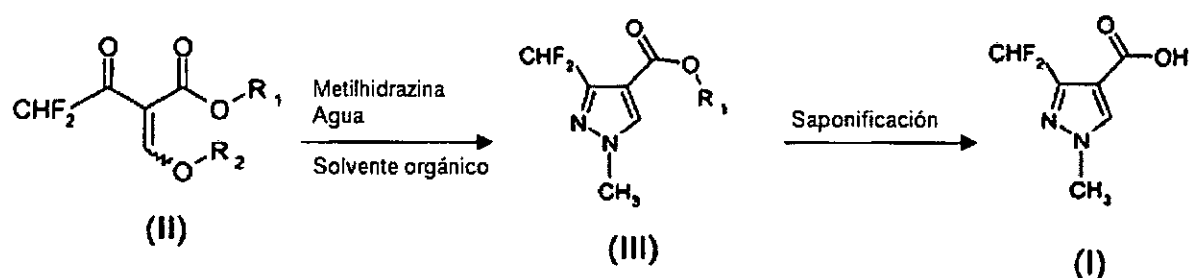
REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 78870

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT 09-135635

una etapa de saponificación, tal como se ilustra en el esquema 1.



6.2. Determinación del estado de la técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de prioridad invocada, es decir, el 31 de mayo de 2007.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontró el siguiente documento que anticipa el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	WO2005003077	Method for producing difluoro-acetyl-acetic acid alkylesters	13 de enero de 2005
D2	WO2005123690	1-methyl-3-difluoromethyl-pyrazol-4-carbonic acid-(ortho-phenyl)-anilides, and use thereof as a fungicide	29 de diciembre de 2005
D3	WO2005042468	Method for producing 2-dihaloacyl-3-amino-acrylic acid esters and 3-dihalomethyl-pyrazole-4-carboxylic acid esters	12 de mayo de 2005

El documento D1¹ hace referencia a un método en tres etapas para producir 4,4-difluor-acetil-acético alquilésteres de ácidos.

El documento D2² hace referencia a N-(orto-fenil)-1-metil-3-difluorometil-pirazol-4-carboxanilidas de fórmula (I) y procesos de obtención de ellas.

¹ [http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=4&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20050113&CC=WO&NR=2005003077A1&KC=A1)

[DB=EPODOC&II=0&ND=4&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20050113&CC=WO&NR=2005003077A1&KC=A1](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=4&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20050113&CC=WO&NR=2005003077A1&KC=A1)

² [http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=1&ND=4&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20051229&CC=WO&NR=2005123690A1&KC=A1)

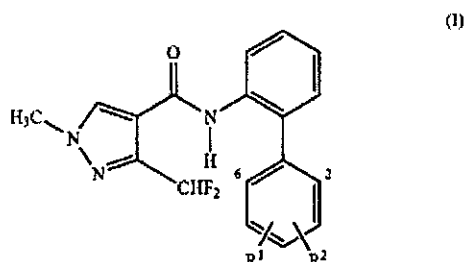
[DB=EPODOC&II=1&ND=4&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20051229&CC=WO&NR=2005123690A1&KC=A1](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=1&ND=4&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20051229&CC=WO&NR=2005123690A1&KC=A1)

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

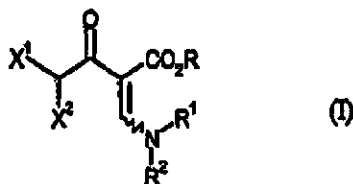
RESOLUCIÓN No: 78870

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT 09-135635



El documento D3³ hace referencia a un método para producir 2-dihaloacil-3-amino-ésteres de ácido acrílico de fórmula (I).



6.3. Nivel Inventivo.

Según lo dispuesto en el artículo 18 de la Decisión 486: “Se considerará que una invención tiene nivel inventivo, si para una persona del oficio normalmente versada en la materia técnica correspondiente, esa invención no hubiese resultado obvia ni se hubiese derivado de manera evidente del estado de la técnica”.

En el presente caso, el proceso reclamado en la solicitud no es inventivo, teniendo en cuenta que, la reivindicación 1 está referida a: “Un proceso para la producción de un compuesto de fórmula I, que comprende:

- a) Hacer reaccionar un compuesto de fórmula (II), en el que R1 y R2 son ambos independientemente alquilo C1-C6, con metilhidrazina, en presencia de agua y un disolvente orgánico inmiscible en agua que es inerte en reacciones de saponificación, para formar un compuesto de fórmula (III), en el que R1 se define como se define para la fórmula I; y
- b) Saponificar ese compuesto in situ lo cual conduce a la formación del compuesto de fórmula (I) por
 - b1) la adición de una base para formar el anión del compuesto de fórmula I y después añadiendo un ácido para formar el compuesto de fórmula I, o
 - b2) añadir un ácido para formar el compuesto de fórmula I. (ver numeral 6.1)

en el que el término “inmiscible en agua” significa que cuando el disolvente orgánico se

³<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?>

DB=EPODOC&II=2&ND=4&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20050512&CC=WO&NR=2005042468A1&KC=A1

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

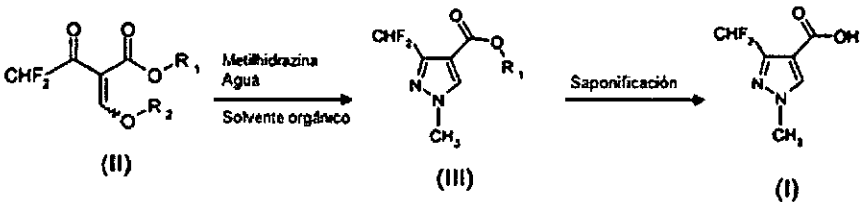
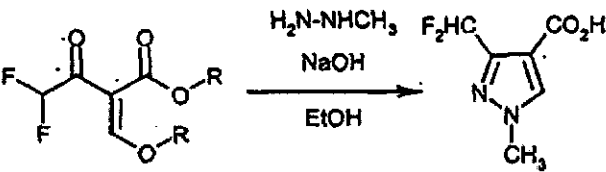
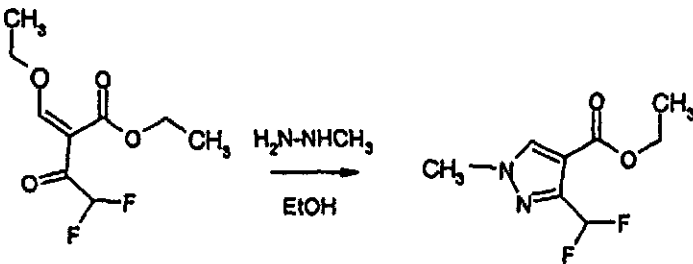
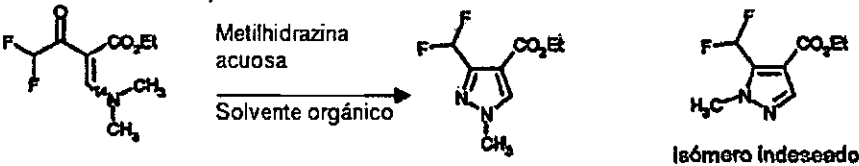
RESOLUCIÓN No: 78870
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT 09-135635

mezcla con agua en las condiciones del proceso se forman dos fases líquidas separadas" (Fls. 101 y 102).

La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la reivindicación 1, y las reveladas en los documentos D1, D2 y D3, que representan el estado de la técnica.

Tabla1.

Características esenciales de la invención	
D1	
D2	
D3	

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 78870

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT 09-135635

Como se dijo anteriormente, los documentos D1 a D3 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque:

La anterioridad D1 divulga un proceso para la preparación del ácido 3-difluormetil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico que comprende reaccionar el éster etílico del ácido 2-(1-etoxi-metilideno-4,4-difluor-3-oxo-butírico) con metilhidrazina en etanol, seguido de una saponificación por adición de NaOH/H₂O. La mezcla obtenida que tiene el anión del compuesto de interés es concentrada bajo presión reducida, el producto es luego diluido en agua y lavado con diclorometano. El crudo es precipitado de la fase acuosa por adición de HCl. El producto es purificado por recristalización en isopropanol. (Página 9, línea 29 a página 10 línea 5, ejemplo 4).

El documento D2 divulga un proceso para la obtención del ácido 3-difluormetil-1-metil-1H-pirazol-carboxílico por una reacción equivalente a la divulgada en D1 (ver tabla). En este documento el intermediario éster, es aislado, purificado y luego saponificado.

La diferencia entre los procesos de D1 o D2 y el proceso de la presente solicitud radica en que ninguno de los procesos conocidos utiliza un solvente orgánico inmiscible en agua en la reacción de ciclización.

El efecto técnico que provoca el incluir un solvente orgánico inmiscible en agua es que mejora de regioselectividad de la reacción, es decir, se obtiene una mayor proporción del isómero deseado sobre el isómero no deseado.

De este modo, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿cómo modificar los procesos de síntesis de los documentos D1 o D2 para mejorar su regioselectividad?

Sin embargo, la utilización de un solvente orgánico inmiscible en agua para mejorar la regioselectividad de la reacción de ciclización, ya había sido divulgada en el documento D3 el cual enseña un proceso para obtener un derivado éster del ácido 3-difluormetil-1-metil-1H-pirazol-carboxílico por medio de la ciclocondensación del éster etílico del ácido 2-difluoroacetil-3-dimetilamino-acrílico con metilhidrazina y un solvente orgánico inmiscible en agua, de preferencia xileno y tolueno (pagina 2, pagina 7 líneas 15-27, ejemplo 12).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría un solvente orgánico inmiscible en agua como en D3 en el procedimiento de D1 o D2 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia. Igualmente, por las mismas razones anteriormente descritas, la reivindicación 22 tampoco es inventiva.

Se le aclara al solicitante que le mejora en cuanto a la proporción del isómero deseado no resulta ser un efecto técnico inesperado o sorprendente dado que, desde el documento D3 se había divulgado que un solvente aprótico inmiscible en agua, como el tolueno o el xileno,

Página 5 de 7

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 78870

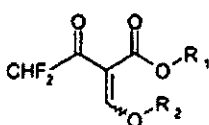
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT 09-135635

aumenta la proporción del isómero deseado (pagina2, líneas 5-9).

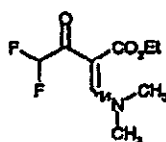
Esta Superintendencia aclara al solicitante, que contrario a lo que se indica en sus argumentos de respuesta, el documento D1 es un documento que se relaciona de forma directa con el objeto de la presente invención toda vez que divulga un método en tres etapas para producir 4,4-difluor-acetil-acético alquilésteres de ácidos. Siendo estrictos, el solicitante se equivoca al descartar el documento D1 puesto que tal como se indica en la página 9 línea 29 a página 10 línea 5 y el ejemplo 4, se esta haciendo referencia a la misma reacción. Esta Oficina reitera que el documento D1 es un documento del estado de la técnica cercano al objeto de invención reclamado.

Ahora bien, respecto al documento D3, el mismo resulta ser completamente relevante debido a que dicha anterioridad enseña al técnico medio en la materia que se puede mejorar la regioselectividad de la misma reacción introduciendo un solvente orgánico. Se aclara al solicitante que pese a que en el documento D3 se utiliza como derivado de partida un compuesto sustituido con N, mientras que en esta solicitud se utiliza un derivado sustituido con O, la reacción es la misma, una ciclización que da lugar al mismo compuesto. Así que una persona medianamente versada en la materia tiene la información suficiente para suponer que al modificar el sistema solvente por la adición de un solvente orgánico puede encontrar una mejora en la regioselectividad del producto y así aumentar las proporciones del isómero deseado. Se llama la atención del solicitante en cuanto a que cualquier químico medianamente versado en la materia puede esperar que tanto el N como el O presente un comportamiento similar, debido a su similitud de distribución electrónica e incluso puede considerarlos grupos isóstericos.



(II)

Solicitud



D3

En conclusión, teniendo en cuenta que los argumentos de la solicitante no desvirtúan de manera alguna las objeciones a la patentabilidad ya sustentada, el Superintendente de Industria y Comercio,

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Denegar la patente de invención a la creación titulada "PROCESO

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 78870

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT 09-135635

PARA LA PRODUCCIÓN DE PIRAZOLES".

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a las sociedades SYNGENTA PARTICIPATIONS AG y SYNGENTA LIMITED., entregándole copia de la misma y advirtiéndole que contra ella procede el recurso de reposición, ante el Superintendente de Industria y Comercio, el cual podrá ser interpuesto en el momento de la notificación o dentro de los cinco 5 días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE

Dada en Bogotá D.C., a los 20 Dic 2012

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctora
MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO
info@castellanosyco.co

Elaboró: Sandra Isabel Calderon Rodriguez ✓
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Roza ✓
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez ✓
Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez ✓