

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 14-156063- -2	FECHA: 2015-07-02 09:31:43
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 9
ACT: 430 REQUERSOLICITA	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ

Asunto: Radicación: 14-156063- -2
Trámite: 11
Evento: 378
Actuación: 430
Oficio: 7350
Folios: 9

Patente de Invención	X			Patente de Modelo de Utilidad	
Vía Nacional					
Vía PCT (Fase Nacional)	X	Capítulo I	X	Capítulo II	
No. Solicitud Internacional	PCT/US2012/072071				
Fecha de Presentación Internacional	28/12/2012				

1. Documentos estudiados

Descripción:	Rad 14-156063-00000-0000	18/julio/2014
Reivindicaciones:	Rad 14-156063-00000-0000	18/julio/2014
Prioridad:	Rad 14-156063-00000-0000	18/julio/2014
US 61/582,166 30/12/2011		

2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de prioridad porque ésta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

3. Objeto de la invención

De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del capítulo primero del Título 10 de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por el solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es que cuando la solicitud contenga más de diez (10) reivindicaciones y no se haya pagado la tasa complementaria, sólo se estudiarán las cubiertas por la tasa pagada. En este caso se encuentra el pago adicional de la tasa

que cubre 13 reivindicaciones adicionales, de tal forma que se estudiará el capítulo reivindicatorio completo.

Título de la solicitud: Métodos para la producción de 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-2-fluor-3-metoxifenil)piridin-2-carboxilato de metilo. Folio 1.

Objeto de la invención: El objeto de la presente solicitud de patente de invención se refiere a un método para la producción de 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-2-fluor-3-metoxifenil)piridin-2-carboxilato de metilo, que comprende lo siguiente:

Agregado de metil isobutil cetona a una solución acuosa que comprende ácido 4-cloro-2-fluor-3-metoxi-fenilbórico para formar una fase orgánica que comprende el ácido 4-cloro-2-fluor-3-metoxi-fenilbórico y una fase acuosa;

Separación de la fase orgánica que comprende el ácido 4-cloro-2-fluor-3-metoxifenilbórico de la fase acuosa;

Reacción del ácido 4-cloro-2-fluor-3-metoxifenilbórico con 4-(acetilamino)-3,6-dicloropiridin-2-carboxilato de metilo en metil isobutil cetona para producir 4-(acetilamino)-3-cloro-6-(4-cloro-2-fluor-3-metoxifenil)piridin-2-carboxilato de metilo;y

Desacetilación del 4-(acetilamino)-3-cloro-6-(4-cloro-2-fluor-3-metoxifenil)piridin-2-carboxilato de metilo para producir 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-2-fluor-3-metoxifenil)piridin-2-carboxilato de metilo.

El problema técnico planteado en la presente solicitud de patente se refiere a la necesidad de diseñar un método para la producción de 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-2-fluor-3-metoxi-fenil)piridin-2-carboxilato de metilo que tenga mayor rendimiento, sea menos complejo y de bajo costo. Para solucionar ese problema técnico la presente solicitud plantea el método para la producción de 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-2-fluor-3-metoxi-fenil)piridin-2-carboxilato de metilo descrito anteriormente.

El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A01N43/40; C07D213/72; C07D213/75.

4. De la solicitud de Patente

Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

El capítulo reivindicatorio es demasiado amplio y no cumple con el requisito de concisión, asimismo se considera una generalización que no se encuentra enteramente soportada en la descripción, es decir, la descripción no divulga de manera suficientemente clara y completa la materia divulgada en las reivindicaciones. La solicitante debe definir específicamente la materia y el alcance de la invención a través de las características técnicas esenciales que se encuentran enteramente soportadas en la descripción, sírvase limitar el alcance de la invención.

En este sentido sírvase definir específicamente, las condiciones de ejecución de las etapas de proceso de la síntesis de interés. Los términos “*agregado, separación, reacción, desacetilación, contacto de y producción*” son insuficientes para definir específicamente el alcance de la reivindicación 1. Lo mismo sucede en las reivindicaciones independientes 9, 15, 18 y 21.

Asimismo, sírvase definir la base acuosa agregada junto con el ligando de fosfina y el

catalizador de paladio, de las reivindicación 11, 15 y 18, dado que en ninguna parte del capítulo reivindicatorio se define. Se le recuerda a la solicitante que las reivindicaciones deben ser claras por sí mismas.

Sírvase retirar las reivindicaciones, 17, 22 y 23, pues que hacen referencia al rendimiento de la reacción el cual es el resultado a alcanzar. Se le aclara a la solicitante que las reivindicaciones deben definir la invención por sus características esenciales, estructurales o funcionales. No se admite que la reivindicación defina la invención por el resultado a alcanzar, puesto que en realidad equivaldría a definir el problema técnico a resolver y el alcance de la reivindicación incluiría no sólo la solución propuesta por el solicitante, sino todas las alternativas presentes o futuras que lleguen a ese resultado. El resultado a alcanzar no es una característica técnica de la invención.

Finalmente, se llama la atención de la solicitante frente a que el capítulo reivindicatorio no es conciso dado que presenta cinco reivindicaciones independientes para una misma categoría, lo cual es una clara falta de concisión, se le recomienda que defina una única reivindicación independiente de proceso.

En consecuencia, el capítulo reivindicatorio no cumple con el requisito de concisión, claridad y sustento en la descripción de acuerdo al art. 30 de la Decisión 486.

5. Determinación del Estado de la Técnica

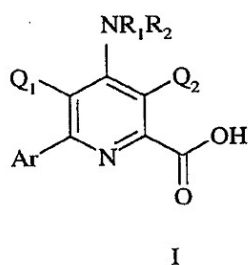
Considerando que la fecha de la solicitud prioritaria es 30 de diciembre de 2011 se realizó la búsqueda en el estado de la técnica y se encontraron los documentos relacionados a continuación que pueden afectar la patentabilidad del objeto de la presente solicitud:

Nº	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	WO2007082098	6-(poly-substituted aryl)-4-aminopicolinates and their use as herbicides	2007-07-19
D2	WO2009046090	2-substituted-6-amino-5-alkyl, alkenyl or alkynyl-4-pyrimidinecarboxylic acids and 6-substituted-4-amino-3- alkyl, alkenyl or alkynyl picolinic acids and their use as herbicides	2009-04-09
D3	WO2010092339	Pyrimidine derivatives and their use as herbicides	2010-08-19
D4	US7611647	Process for the selective deprotonation and functionalization of 1-fluoro-2-substituted-3-chlorobenzenes	2009-11-03

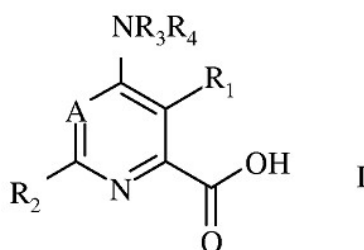
El solicitante podrá consultar los documentos citados en la siguiente dirección URL:

<https://register.epo.org/application?number=EP12862450&lng=en&tab=main>

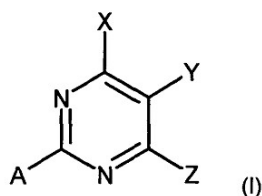
El documento D1 hace referencia a un compuesto de fórmula (I) y procesos para su preparación.



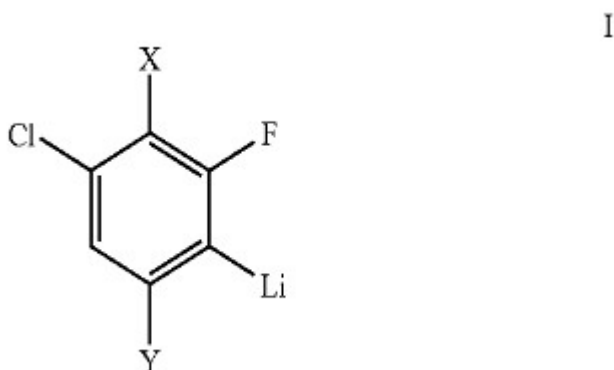
El documento D2 hace referencia a un compuesto de fórmula (I) y procesos para su preparación.



El documento D3 hace referencia a un compuesto de fórmula (I) y procesos para su preparación.



El documento D4 hace referencia a un proceso de preparación de un derivado que contiene litio de fórmula (I).



6. Examen de patentabilidad (artículo 14 D486)

Nivel Inventivo (artículo 18 D486)

La reivindicación 1 divulga un método para la producción de 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-2-fluor-3-metoxi-fenil)piridin-2-carboxilato de metilo (compuesto 1), que comprende lo siguiente:

Agregado de metil isobutil cetona (MIBK) a una solución acuosa que comprende ácido 4-cloro-2-fluor-3-metoxi-fenilbórico (PBA (Compuesto 2)) para formar una fase orgánica que comprende el ácido 4-cloro-2-fluor-3-metoxi-fenilbórico y una fase acuosa;

Separación de la fase orgánica que comprende el ácido 4-cloro-2-fluor-3-metoxifenilbórico (PBA (Compuesto 2)) de la fase acuosa;

Reacción del ácido 4-cloro-2-fluor-3-metoxifenilbórico (PBA (Compuesto 2)) con 4-(acetilamino)-3,6-dicloropiridin-2-carboxilato de metilo (Compuesto 3) en metil isobutil cetona para producir 4-(acetilamino) -3-cloro-6-(4-cloro-2-fluor-3-metoxifenil)piridin-2-carboxilato de metilo (Compuesto4); y

Desacetilación del 4-(acetilamino)-3-cloro-6- (4-cloro-2-fluor-3-metoxifenil)piridin-2-carboxilato de metilo (Compuesto4) para producir 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-2-fluor-3-metoxifenil)piridin-2-carboxilato de metilo (compuesto 1).

Las reivindicaciones 9 y 10 indican además que hay una etapa inicial de producción de una solución acuosa que comprende ácido4-cloro-2-fluor-3-metoxifenilbórico, que comprende:

Contacto de 2-cloro-6-fluoranol (2,6-CFA) con n-butillitio para producir un derivado litiado de 2,6-CFA;

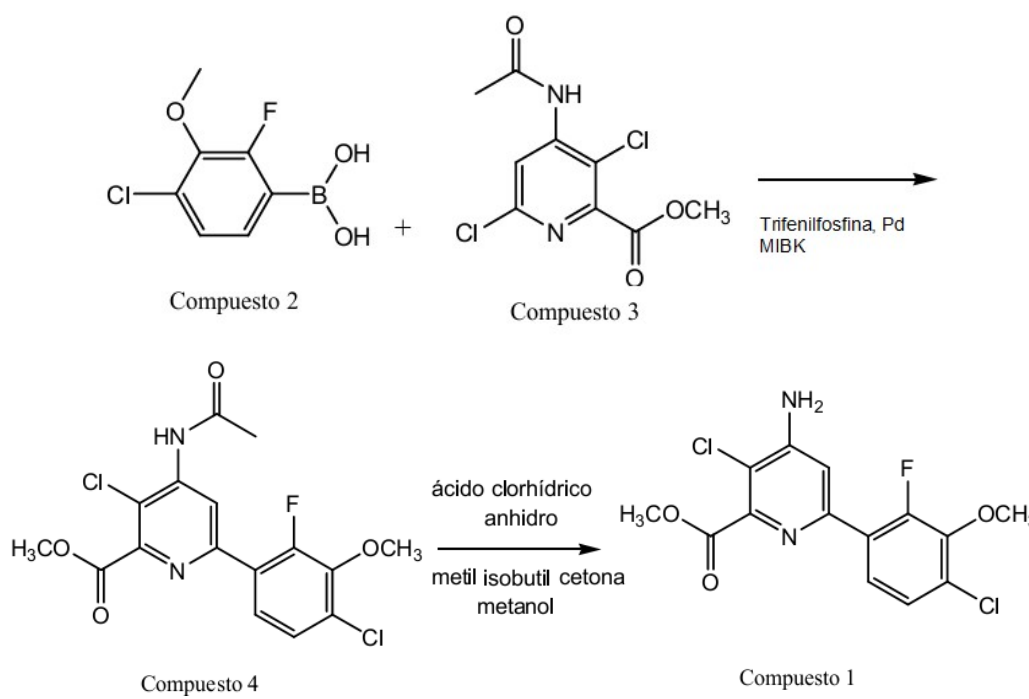
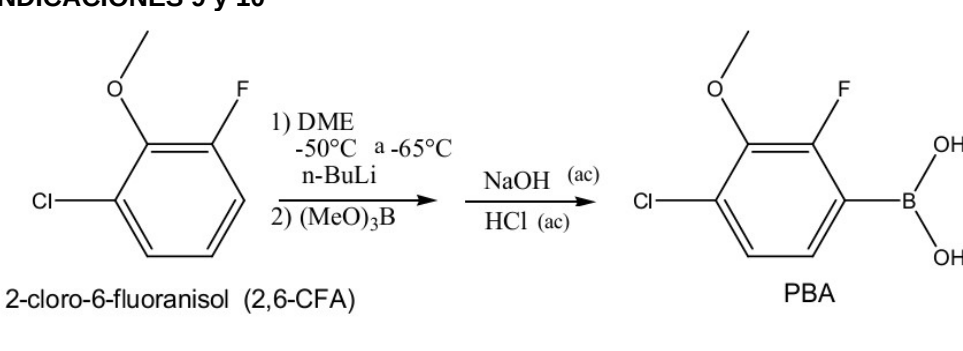
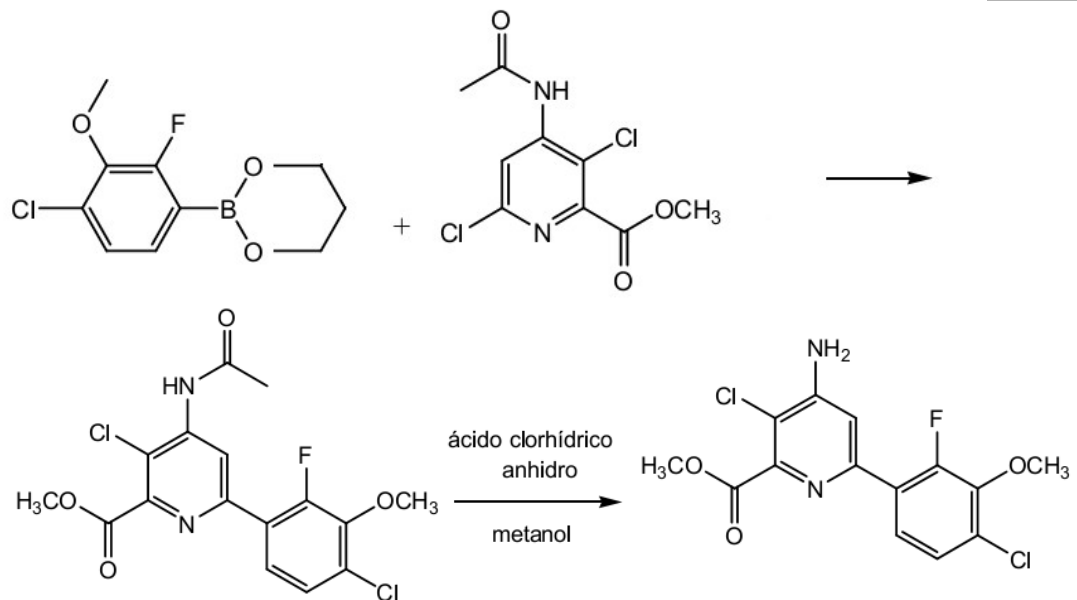
Contacto del derivado litiado de 2,6-CFA con trimetil borato para producir un éster de ácido borónico de 2,6-CFA;

Contacto del éster de ácido borónico de 2,6-CFA con hidróxido de sodio acuoso para producir una sal de sodio del éster de ácido borónico de 2,6-CFA; y

Contacto de la sal de sodio del éster de ácido borónico de 2,6-CFA con ácido clorhídrico acuoso.

Ver radicado 14-156063-00000-0000.

La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la reivindicación 1, y las reveladas en el estado de la técnica.

Solicitud	 Compuesto 2 + Compuesto 3 $\xrightarrow{\text{Trifenilfosfina, Pd MIBK}}$ $\xrightarrow{\text{ácido clorhídrico anhidro, metil isobutil cetona, metanol}}$ Compuesto 1
	REIVINDICACIONES 9 y 10  2-cloro-6-fluoranisol (2,6-CFA) $\xrightarrow[2) (\text{MeO})_3\text{B}]{1) \text{DME } -50^\circ\text{C a } -65^\circ\text{C, n-BuLi}}$ $\xrightarrow[\text{HCl (ac)}]{\text{NaOH (ac)}}$ PBA
D1	

D2	
D3	
D4	

Los documentos D1 a D4 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque:

El documento D1 divulga la síntesis de 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-2-fluor-3-metoxifenil)piridin-2-carboxilato de metilo a partir de una solución de 4-(acetilamino)-3,6-dicloropiridin-2-carboxilato de metilo con 2-(4-cloro-2-fluor-5-metoxifenil)-[1,3,2]-dioxiborinano, en presencia de bis-(difenilfosfino)butano en acetonitrilo y un catalizador de paladio (procedimiento 43, pagina 51 y 52). Posterior deacetilación con HCl anhídrido (obtenido in situ por reacción entre cloruro de acetilo y metanol) en una solución de metanol (procedimiento 55, pagina 63).

La diferencia entre el proceso de la reivindicación 1 y el proceso del documento D1 radica en el 4-(acetilamino)-3,6-dicloropiridin-2-carboxilato de metilo se hace reaccionar con el derivado éster de dioxiborinano, mientras que en esta solicitud se hace reaccionar con el ácido 4-cloro-2-fluor-3-metoxi-fenilbórico (ver tabla).

No obstante, no se observa ningún efecto técnico debido a que se sigue obteniendo el compuesto 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-2-fluor-3-metoxi-fenil)piridin-2-carboxilato de metilo. La descripción de la presente solitud no presento evidencia técnica que muestre alguna mejora en el rendimiento del proceso frente al proceso ya conocido, tal como se planteo inicialmente.

De este modo, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿cómo plantear un procedimiento de obtención de 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-2-fluor-3-metoxi-fenil)piridin-2-carboxilato de metilo alternativo?

En contraste, el documento D4 divulga métodos de preparación tanto para derivados

éster de dioxaborinano como para derivados de ácido bórico (ejemplos 1 y 2) (ver tabla). El ácido bórico es producido como una solución acuosa que se extrae en acetato de etilo (columna 4, líneas 54-59).

En consecuencia, una persona medianamente versada en la materia tiene información suficiente a partir de la combinación de enseñanzas de los documento D1 y D4 para derivar de manera obvia el método de la reivindicación 1, utilizando el ácido 4-cloro-2-fluor-3-metoxi-fenilbórico en lugar del derivado éster de dioxiborinano, con la plena expectativa de éxito en cuento a obtener el derivado 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-2-fluor-3-metoxi-fenil)piridin-2-carboxilato de metilo.

Adicionalmente se llama la atención de la solicitante frente a que ya se encontraba bien documentada la utilización del ácido 4-cloro-2-fluor-3-metoxi-fenilbórico en reacciones de sustitución, tal como lo demuestran los documentos D3 y D4 (ver tabla).

Se aclara además que la modificación de condiciones, tales como solventes, tiempos, temperaturas, etc., que conlleva la variación de un reactante puede considerarse una optimización rutinaria de proceso que no resulta inventiva. Téngase en cuenta que los estudios presentados no presentan evidencia técnica de alguna mejora que pueda entenderse efecto técnico inesperado o sorprendente que pueda explicar el nivel inventivo del procedimiento reclamado.

En consecuencia, esta Oficina considera que el procedimiento de la presente solicitud, se deriva de manera evidente del arte previo, no provoca ningún efecto técnico sorprendente o inesperado y carece de nivel inventivo. De forma análoga, tampoco resultan inventivos los métodos de las reivindicaciones 9, 15, 18 y 21.

Conclusión

Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

N°	Documento N°	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2007082098	1-23	Nivel Inventivo
D2	WO2009046090	1-23	Nivel Inventivo
D3	WO2010092339	1-23	Nivel Inventivo
D4	US7611647	1-23	Nivel Inventivo

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de sesenta (60) días contados a partir del día siguiente de la fecha de notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.

Se invita al solicitante se sirva indicar, si así lo considera, su renuncia al término faltante de sesenta (60) días para dar respuesta a este requerimiento y presentarla por escrito.

Finalmente, se le recuerda al solicitante que si como respuesta a este requerimiento llegara a modificar el capítulo reivindicatorio y éste contenga más de diez (10) reivindicaciones, no pagará la tasa de modificación voluntaria pero sí la correspondiente al pago por reivindicación adicional.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única No. 10 de 2001.



JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ
Director de Nuevas Creaciones (c)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 2015-07-07

Elaboró: Sandra Isabel Calderon Rodriguez
Revisó: Lyna Del Carmen Mordecay Dunoyer