

Señor Director
NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

Referencia : Expediente No. **16.104.340**
Asunto : Solicitud de patente para: **“PROCESOS PARA LA
PREPARACIÓN DE COMPUESTOS PLAGUICIDAS”**
Solicitante : DOW AGROSCIENCES LLC
Fecha de solicitud : 17 de mayo de 2016

RESPUESTA A EXAMEN PRELIMINAR

ANDRÉS RINCÓN USCÁTEGUI, identificado como aparece al pie de mi firma, en mi condición de apoderado de la sociedad solicitante de la patente de la referencia, doy respuesta al Oficio 7109, notificado por fijación en lista el 21 de junio de 2016.

I. MODIFICACIONES AL PLIEGO REIVINDICATORIO

Con el fin de atender las observaciones realizadas por el examinador de manera preliminar al examen de patentabilidad, el solicitante decide aportar un nuevo capítulo reivindicatorio conformado por 31 reivindicaciones en las que se han incluido las siguientes modificaciones:

1. Las reivindicaciones 1 a 10 han sido modificadas para identificar claramente la materia de cada una de las reivindicaciones mediante la modificación del preámbulo para recitar “un procedimiento para preparar...” y que recita el compuesto específico que es preparado por cada procedimiento reivindicado. En consecuencia, las reivindicaciones tal como fueron modificadas son más claras en cuanto al producto a ser obtenido.
2. Por otro lado, las reivindicaciones 1 a 10 fueron modificadas de manera que ahora el procedimiento objeto de protección se encuentra caracterizado por una secuencia

“EXCELENCIA LEGAL EN UN MUNDO SIN FRONTERAS”

BOGOTÁ - Edificio Siski - Carrera 4 No. 72 - 35 - Código Postal 110221 - Tel. (57-1) 347 3611 - Fax (57-1) 211 8650 - Fax in U.S.A: (1-305) 676 7743 - COLOMBIA
MEDELLÍN - San Fernando Plaza - Carrera 43 A No. 1 - 50 - Torre Protección Oficina 852 - Código Postal 050021 - Tel: (57-4) 520 4760 / (57-4) 326 0789 / (57) 317 365 8663 / (57) 318 532 2365 - COLOMBIA
BARRANQUILLA - Calle 64 No. 50-20 - Oficina 201 - Código Postal 080002 - Barrio El Prado - Tel. (57-5) 3 51 64 40 - COLOMBIA

www.cavelier.com
cavelier@cavelier.com

lógica de pasos en el que cada proceso reivindicado se lleva a cabo por al menos dos pasos.

Estas modificaciones se ajustan al artículo 34 de la Decisión 486 de 2000 y no constituyen una ampliación de la protección que correspondería a la divulgación contenida en la solicitud inicial.

II. EN CUANTO A LAS OBJECIONES DE SUPUESTA FALTA DE CLARIDAD

1. Con respecto a las condiciones técnicas específicas del procedimiento reivindicado, mi representada amablemente señala su inconformidad ya que las limitaciones con respecto a las condiciones técnicas limitarían indebidamente el alcance de las reivindicaciones. Adicionalmente, una persona versada en la materia a partir de la lectura de la descripción y las reivindicaciones podría reproducir la invención sin necesidad de especificar las condiciones.

2. Por otro lado, con respecto a la objeción por falta de claridad de la reivindicación 1 por no ser concisa porque contiene la expresión “en condiciones básicas” y lo cual posibilita el uso de diversos compuestos que pueden actuar como bases, es deseo de mi representada mantener la expresión citada de momento, reservándose el derecho de modificarla o eliminarla más adelante en caso de considerarlo pertinente teniendo en cuenta que es posible realizar modificaciones a la solicitud en cualquier etapa del trámite, con el fin de no limitar indebidamente el campo de protección en esta etapa temprana.

3. Con respecto a la objeción elevada hacia las reivindicaciones 5, 6 y 8 a 10 por no ser concisas debido a que las definiciones de X^1 y X^2 corresponden a familia química, funcionalidades o actividades, pero no a un radical, mi representada señala que una persona del oficio normalmente versada en la materia apreciaría fácilmente el significado de los términos basada en las definiciones proporcionadas en la descripción y por lo tanto, modificaciones a dichos términos limitaría el alcance de protección en una etapa muy temprana del trámite, teniendo en cuenta que es posible realizar modificaciones a la solicitud en cualquier etapa, es deseo del solicitante mantener las expresiones citadas de momento, reservándose el derecho de modificarlas o eliminarlas más adelante en caso de considerarlo pertinente.

5. Finalmente, con respecto a la objeción por falta claridad de la reivindicación 7 debido a que menciona la obtención del compuesto “5b”, que ya se había mencionado en la reivindicación 2, mi representada amablemente señala que la reivindicación 7 es un proceso para obtener el compuesto 5b diferente al proceso abarcado por la reivindicación 2, y además, la reivindicación 7 describe adecuadamente una serie lógica de pasos. Por lo tanto, la objeción a este respecto es superada.

III. EN CUANTO A LA OBJECCIÓN DE SUPUESTA FALTA DE CLARIDAD DEL RESUMEN

Con respecto a la objeción elevada por el señor Examinador con respecto al resumen de la presente invención, mi representada manifiesta amablemente su desacuerdo ya que no existe una disposición legal específica en virtud de la ley de patentes en Colombia que establezca una longitud determinada del Resumen y por lo tanto, el Resumen pendiente de la presente solicitud de patente cumple con el Artículo 31d de la Decisión 486 de la Comunidad Andina.

IV. EN CUANTO AL PAGO DE TASA ADICIONAL POR EL NÚMERO DE REIVINDICACIONES

Presento junto con este escrito el pago de tasa adicional para el estudio de 31 reivindicaciones.

V. PETICIÓN

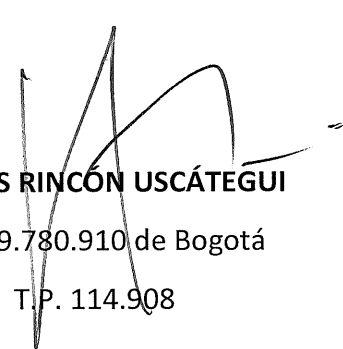
Teniendo en cuenta que la presente solicitud cumple con los requisitos de los artículos 26 y 27 de la Decisión 486 de 2000 y considerando que se ha dado respuesta a cada una de las observaciones de la Dirección de Nuevas Creaciones con respecto a otros aspectos que tienen que ver con la patentabilidad de la invención, solicito a su Despacho continuar con el trámite administrativo correspondiente.

VI. ANEXOS

1. Nuevo pliego reivindicatorio conformado por 31 reivindicaciones;

2. Pago de tasa por reivindicaciones adicionales.

Señor Director,



ANDRÉS RINCÓN USCÁTEGUI

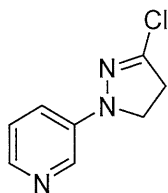
C.C. 79.780.910 de Bogotá

T.P. 114.908

COLO-10975-0841-0326-3
SGD\SGD\ID-290051\WPC10975
No. M-2016-290051\SGD

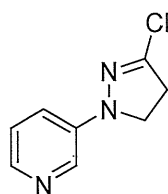
REIVINDICACIONES

1. Un procedimiento para preparar cloruro de dihidropirazol (5a)



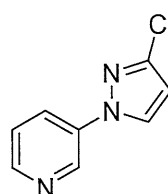
(5a) que comprende:

- (a) hacer reaccionar diclorhidrato de 3-hidrazinopiridina con acrilato de metilo, en condiciones básicas, para obtener 1-(piridin-3-il)pirazolidin-3-ona; y
- (b) clorar 1-(piridin-3-il)pirazolidin-3-ona con cloruro de fosforilo (POCl_3) para obtener cloruro de dihidropirazol (5a)



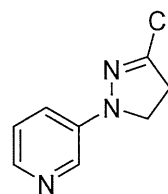
(5a).

2. Un procedimiento para preparar 3-(3-cloro-1H-pirazol-1-il)piridina (5b)



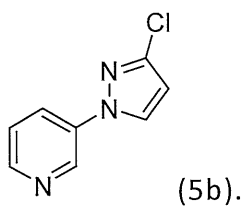
(5b) que comprende

- (a) clorar 1-(piridin-3-il)pirazolidin-3-ona con cloruro de fosforilo (POCl_3) para obtener cloruro de dihidropirazol (5a)

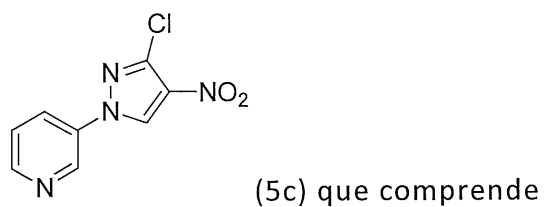


(5a); y

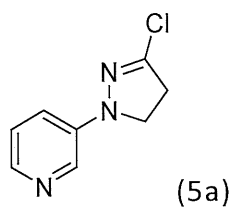
(b) oxidar cloruro de dihidropirazol (5a) para obtener 3-(3-cloro-1*H*-pirazol-1-il)piridina (5b)



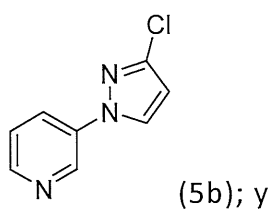
3. Un procedimiento para preparar 3-(3-cloro-4-nitro-1*H*-pirazol-1-il)piridina (5c)



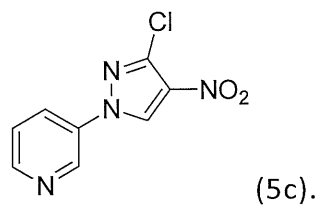
(a) oxidar cloruro de dihidropirazol (5a)



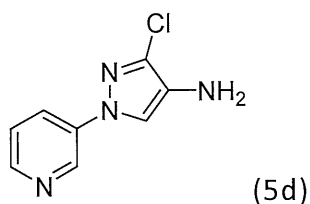
para obtener 3-(3-cloro-1*H*-pirazol-1-il)piridina (5b)



(b) nitrar la 3-(3-cloro-1*H*-pirazol-1-il)piridina (5b) para obtener 3-(3-cloro-4-nitro-1*H*-pirazol-1-il)piridina (5c)

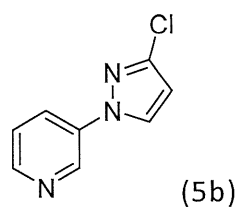


4. Un procedimiento para preparar 3-cloro-1-(piridin-3-il)-1*H*-pirazol-4-amina (5d)

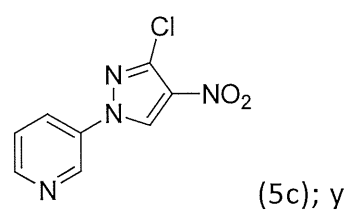


que comprende

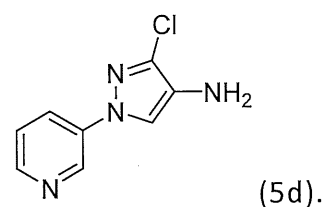
(a) nitrar la 3-(3-cloro-1*H*-pirazol-1-il)piridina (5b)



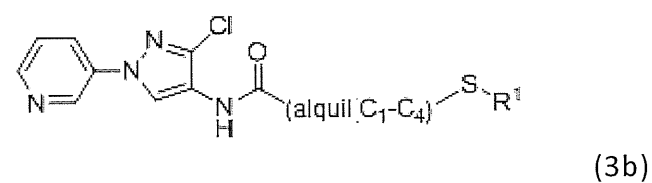
para obtener 3-(3-cloro-4-nitro-1*H*-pirazol-1-il)piridina (5c)



(b) reducir la 3-(3-cloro-4-nitro-1*H*-pirazol-1-il)piridina (5c) para obtener 3-cloro-1-(piridin-3-il)-1*H*-pirazol-4-amina (5d)



5. Un procedimiento para preparar tioéter plaguicida (3b)

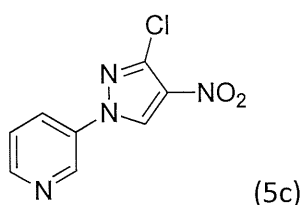


en donde

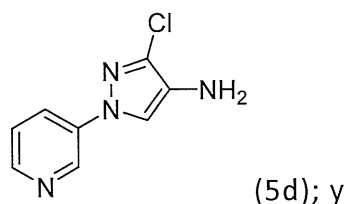
R¹ está seleccionado del grupo que consiste en haloalquilo C1-C4 y alquil C1-C4-halocicloalquilo C3-C6,

que comprende

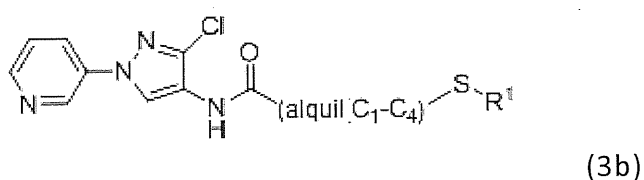
(a) reducir la 3-(3-cloro-4-nitro-1*H*-pirazol-1-il)piridina (5c)



para obtener 3-cloro-1-(piridin-3-il)-1*H*-pirazol-4-amina (5d)



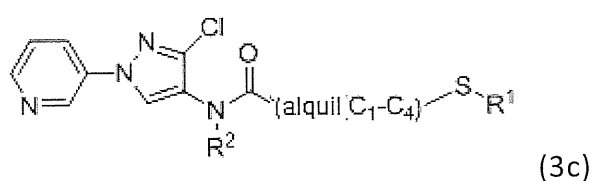
(b) hacer reaccionar la 3-cloro-1-(piridin-3-il)-1*H*-pirazol-4-amina (5d) con un carboniltioéter activado de la fórmula $X^1C(=O)$ alquil C1-C4-S-R¹ para obtener tioéter plaguicida (3b)



en donde,

X¹ está seleccionado del grupo que consiste en Cl, OC(=O)alquilo C1-C4 y un grupo que forma un ácido carboxílico activado.

6. Un procedimiento para preparar tioéter plaguicida (3c)

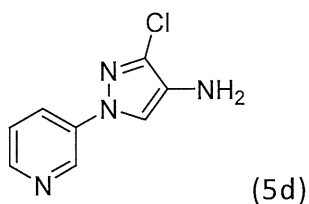


en donde,

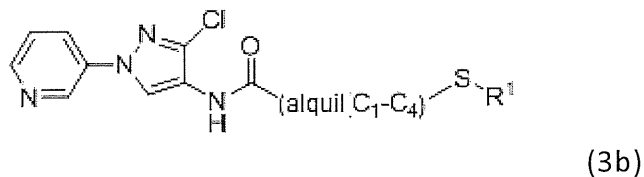
R¹ está seleccionado del grupo que consiste en haloalquilo C1-C4 y alquil C1-C4-halocicloalquilo C₃-C₆, y

R² está seleccionado del grupo que consiste en alquilo C1-C4 y alquino C2-C4; que comprende

(a) hacer reaccionar la 3-cloro-1-(piridin-3-il)-1*H*-pirazol-4-amina (5d)



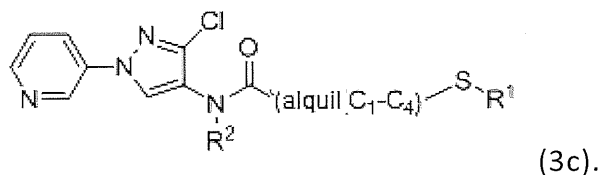
con un carbonil tioéter activado de la fórmula $X^1C(=O)alquil\ C1-C4-S-R^1$ para obtener tioéter plaguicida (3b)



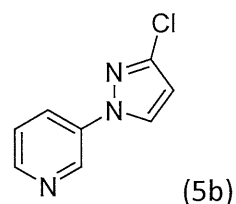
en donde,

R^1 está seleccionado del grupo que consiste en haloalquilo C1-C4 y alquil C1-C4-halocicloalquilo C3-C6,

(b) alquilar el tioéter plaguicida (3b) con R^2-X^2 para obtener tioéter plaguicida (3c),



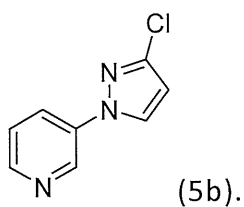
7. Un procedimiento para producir 3-(3-cloro-1*H*-pirazol-1-il)piridina (5b)



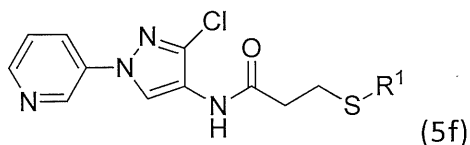
que comprende

(a) hacer reaccionar diclorhidrato de 3-hidrazinopiridina con 2-acetamidoacrilato de metilo para obtener *N*-(3-oxo-1-(piridin-3-il)pirazolidin-4-il)acetamida; y

(b) clorar/eliminar la *N*-(3-oxo-1-(piridin-3-il)pirazolidin-4-il)acetamida para obtener la 3-(3-cloro-1*H*-pirazol-1-il)piridina (5b)



8. Un procedimiento para preparar tioéter plaguicida (5f)

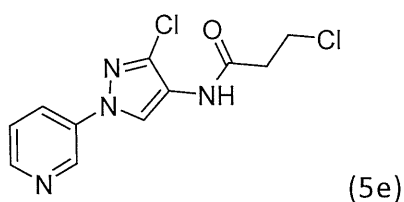


en donde,

R¹ está seleccionado del grupo que consiste en haloalquilo C1-C4 y alquil C1-C4-halocicloalquilo C₃-C₆;

que comprende

(a) hacer reaccionar la 3-cloro-*N*-etil-1-(piridin-3-il)-1*H*-pirazol-amina (5d) con cloruro de 3-cloropropionilo para obtener 3-cloro-*N*-(3-cloro-1-(piridin-3-il)-1*H*-pirazol-4-il)-*N*-etilpropanamida (5e);

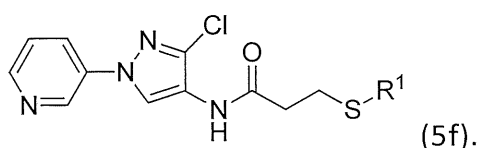


(b) hacer reaccionar compuesto (5e) con HSR¹

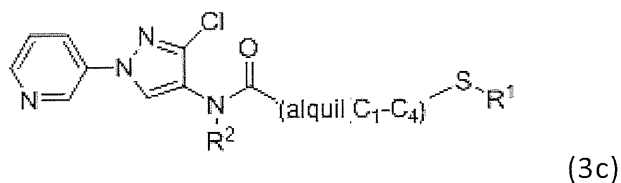
en donde

R¹ está seleccionado del grupo que consiste en haloalquilo C1-C4 y alquil C1-C4-halocicloalquilo C₃-C₆

para obtener el tioéter plaguicida (5f)



9. Un procedimiento para preparar el tioéter plaguicida (3c),

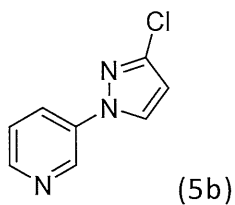


en donde,

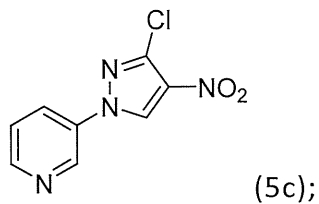
R¹ está seleccionado del grupo que consiste en haloalquilo C1–C4 y alquil C1–C4–halocicloalquilo C3–C6, y

R² está seleccionado del grupo que consiste en alquilo C1–C4 y alquinilo C2–C4; que comprende:

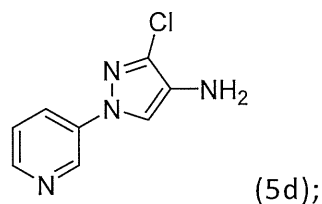
(a) nitrar la 3-(3-cloro-1H-pirazol-1-il)piridina (5b)



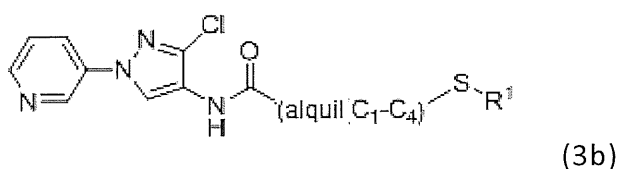
para obtener 3-(3-cloro-4-nitro-1H-pirazol-1-il)piridina (5c)



(b) reducir la 3-(3-cloro-4-nitro-1H-pirazol-1-il)piridina (5c) para obtener 3-cloro-1-(piridin-3-il)-1H-pirazol-4-amina (5d)



(c) hacer reaccionar la 3-cloro-1-(piridin-3-il)-1H-pirazol-4-amina (5d) con un carboniltioéter activado de la fórmula X¹C(=O)alquil C1–C4–S–R¹ para dar el tioéter plaguicida (3b)

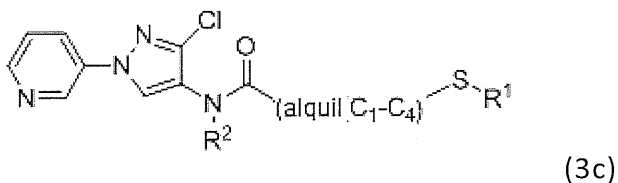


en donde,

R^1 está seleccionado del grupo que consiste en haloalquilo C1–C4 y alquil C1–C4–halocicloalquilo C3–C6, y

X^1 está seleccionado del grupo que consiste en Cl, $OC(=O)$ alquilo C1–C4 y un grupo que forma un ácido carboxílico activado; y

(d) alquilar tioéter plaguicida (3b) con R^2-X^2 para obtener el tioéter plaguicida (3c),

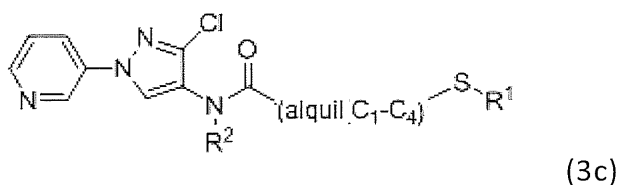


en donde,

X^2 es un grupo saliente, y

R^2 está seleccionado del grupo que consiste en alquilo C1–C4 y alquínilo C2–C4.

10. Un procedimiento para preparar el tioéter plaguicida (3c),



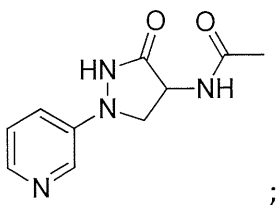
en donde,

R^1 está seleccionado del grupo que consiste en haloalquilo C1–C4 y alquil C1–C4–halocicloalquilo C3–C6, y

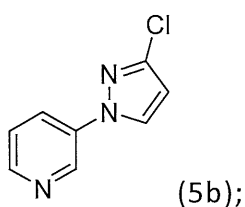
R^2 está seleccionado del grupo que consiste en alquilo C1–C4 y alquínilo C2–C4;

que comprende:

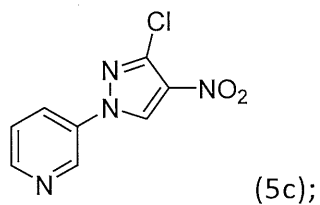
(a) hacer reaccionar el diclorhidrato de 3-hidrazinopiridina con 2-acetamidoacrilato de metilo para obtener la *N*-(3-oxo-1-(piridin-3-il)pirazolidin-4-il)acetamida



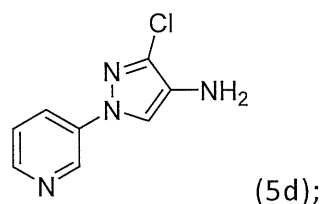
(b) clorar / eliminar la *N*-(3-oxo-1-(piridin-3-il)pirazolidin-4-il)acetamida para obtener la 3-(3-cloro-1*H*-pirazol-1-il)piridina (5b)



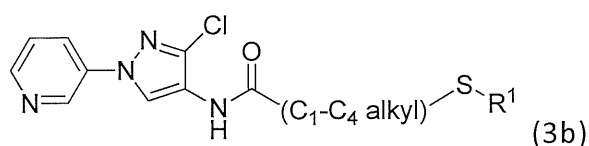
(c) nitrar la 3-(3-cloro-1*H*-pirazol-1-il)piridina (5b) para obtener la 3-(3-cloro-4-nitro-1*H*-pirazol-1-il)piridina (5c)



(d) reducir la 3-(3-cloro-4-nitro-1*H*-pirazol-1-il)piridina (5c) para obtener 3-cloro-1-(piridin-3-il)-1*H*-pirazol-4-amina (5d)



(e) hacer reaccionar la 3-cloro-1-(piridin-3-il)-1*H*-pirazol-4-amina (5d) con un carboniltioéter activado de la fórmula $X^1C(=O)$ alquil C1-C4-S-R¹ para obtener tioéter plaguicida (3b)

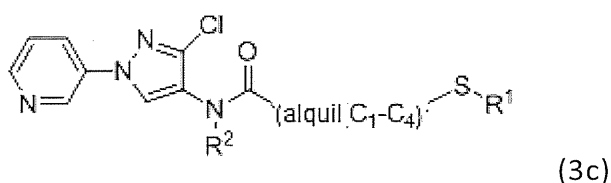


en donde

R^1 está seleccionado del grupo que consiste en haloalquilo C1–C4 y alquil C1–C4–halocicloalquilo C3–C6, y

X^1 está seleccionado del grupo que consiste en Cl, $OC(=O)$ alquilo C1–C4 y un grupo que forma un ácido carboxílico activado; y

(f) alquilar el tioéter plaguicida (3b) con R^2-X^2 para obtener el tioéter plaguicida (3c),

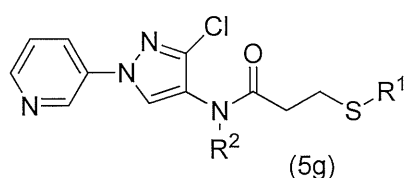


en donde,

X^2 es un grupo saliente, y

R^2 está seleccionado del grupo que consiste en alquilo C1–C4 y alquínilo C2–C4.

11. Un procedimiento para prepepar tioéter plaguicida (5g),

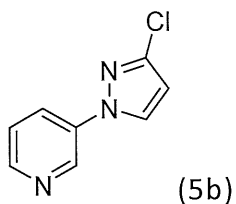


en donde,

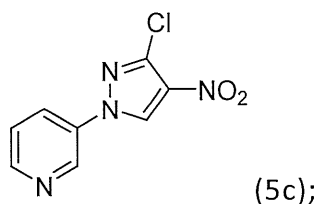
R^1 está seleccionado del grupo que consiste en haloalquilo C1–C4 y alquil C1–C4–halocicloalquilo C3–C6, y

R^2 está seleccionado del grupo que consiste en alquilo C1–C4 y alquínilo C2–C4; que comprende:

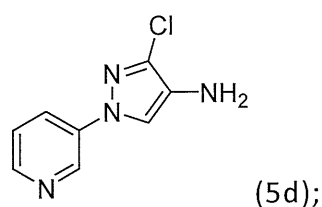
(a) nitrar 3-(3-cloro-1H-pirazol-1-il)piridina (5b)



para obtener la 3-(3-cloro-4-nitro-1*H*-pirazol-1-il)piridina (5c)

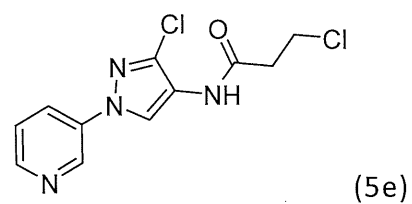


(b) reducir la 3-(3-cloro-4-nitro-1*H*-pirazol-1-il)piridina (5c) para obtener 3-cloro-1-(piridin-3-il)-1*H*-pirazol-4-amina (5d)



(c)

(1) hacer reaccionar la 3-cloro-*N*-etil-1-(piridin-3-il)-1*H*-pirazol-amina (5d) con cloruro de 3-cloropropionilo para obtener la 3-cloro-*N*-(3-cloro-1-(piridin-3-il)-1*H*-pirazol-4-il)-*N*-etilpropanamida (5e);

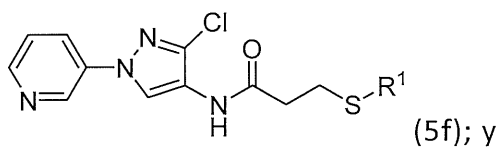


(2) hacer reaccionar compuesto (5e) con HSR¹

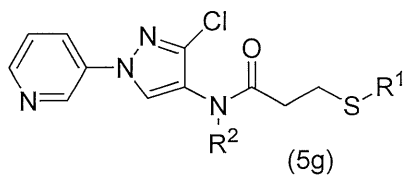
en donde,

R¹ está seleccionado del grupo que consiste en haloalquilo C1-C4 y alquil C1-C4-halocicloalquilo C₃-C₆

para obtener el tioéter plaguicida (5f)



(d) alquilar el tioéter plaguicida (5f) con R^2-X^2 para obtener tioéter plaguicida (5g),

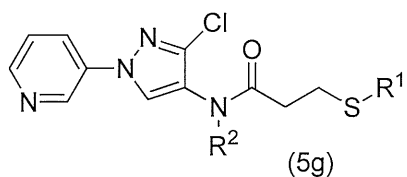


en donde,

X^2 es un grupo saliente y

R^2 está seleccionado del grupo que consiste en alquilo C1–C4 y alquinilo C2–C4.

12. Un procedimiento para preparar tioéter plaguicida (5g),



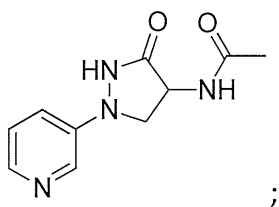
en donde,

R^1 está seleccionado del grupo que consiste en haloalquilo C1–C4 y alquil C1–C4–halocicloalquilo C₃–C₆, y

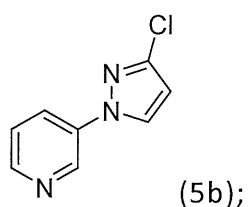
R^2 está seleccionado del grupo que consiste en alquilo C1–C4 y alquinilo C2–C4;

que comprende:

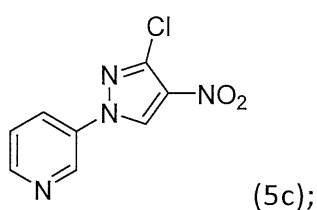
(a) hacer reaccionar el diclorhidrato de 3–hidrazinopiridina con 2–acetamidoacrilato de metilo para obtener la *N*–(3–oxo–1–(piridin–3–il)pirazolidin–4–il)acetamida



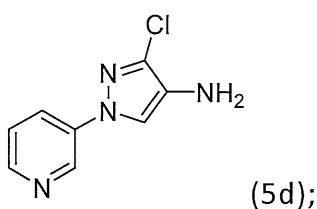
(b) clorar / eliminar la *N*-(3-oxo-1-(piridin-3-il)pirazolidin-4-il)acetamida para obtener 3-(3-cloro-1*H*-pirazol-1-il)piridina (5b)



(c) nitrar la 3-(3-cloro-1*H*-pirazol-1-il)piridina (5b) para obtener 3-(3-cloro-4-nitro-1*H*-pirazol-1-il)piridina (5c)

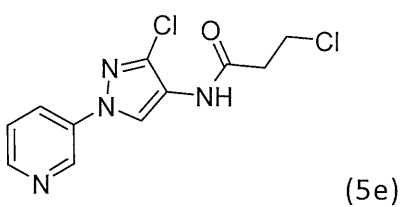


(d) reducir la 3-(3-cloro-4-nitro-1*H*-pirazol-1-il)piridina (5c) para obtener 3-cloro-1-(piridin-3-il)-1*H*-pirazol-4-amina (5d)



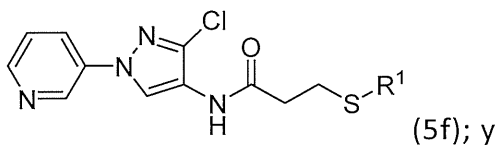
(e)

(1) hacer reaccionar la 3-cloro-*N*-etil-1-(piridin-3-il)-1*H*-pirazol-amina (5d) con cloruro de 3-cloropropionilo para obtener la 3-cloro-*N*-(3-cloro-1-(piridin-3-il)-1*H*-pirazol-4-il)-*N*-etilpropanamida (5e);

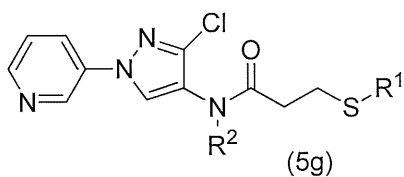


(2) hacer reaccionar el compuesto (5e) con HSR¹
en donde

R¹ está seleccionado del grupo que consiste en haloalquilo C1–C4 y alquil C1–C4–halocicloalquilo C₃–C₆ para obtener el tioéter plaguicida (5f)



(f) alquilar el tioéter plaguicida (5f) con R²-X² para obtener el tioéter plaguicida (5g),

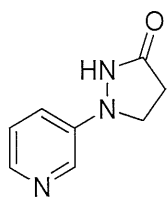


en donde,

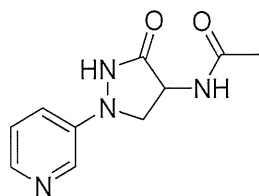
X² es un grupo saliente, y

R² está seleccionado del grupo que consiste en alquilo C1–C4 y alquinilo C2–C4.

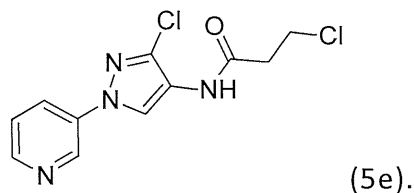
13. Un compuesto 1-(piridin-3-il)pirazolidin-3-ona



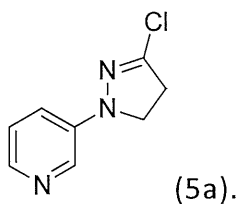
14. Un compuesto *N*-(3-oxo-1-(piridin-3-il)pirazolidin-4-il)acetamida



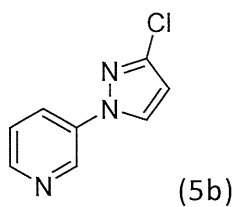
15. Un compuesto 3-cloro-*N*-(3-cloro-1-(piridin-3-il)-1*H*-pirazol-4-il)propanamida (5e)



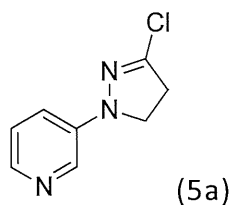
16. Un compuesto 3-(3-cloro-4,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)piridina (5a)



17. Un procedimiento de acuerdo con las reivindicaciones 2, 9 u 11, en donde la 3-(3-cloro-1*H*-pirazol-1-il)piridina

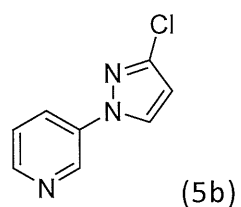


se prepara oxidando 3-(3-cloro-4,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)piridina

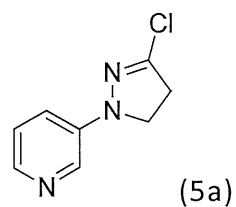


con aproximadamente 0,3 equivalentes a aproximadamente 0,5 equivalentes de sulfato de cobre (I) o cloruro de cobre (I), en presencia de oxígeno, en un solvente aprótico polar.

18. Un procedimiento de acuerdo con las reivindicaciones 2, 9 u 11, en donde la 3-(3-cloro-1*H*-pirazol-1-il)piridina

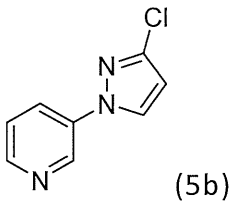


se prepara oxidando 3-(3-cloro-4,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)piridina

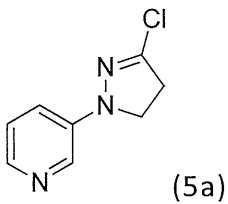


con aproximadamente 2 equivalentes a aproximadamente 4 equivalentes de ferricianuro de potasio en agua en presencia de aproximadamente 2 equivalentes a aproximadamente 20 equivalentes de una base de metal alcalino, a temperaturas que van de aproximadamente 50°C a aproximadamente 100°C.

19. Un procedimiento de acuerdo con las reivindicaciones 2, 9 u 11, en donde la 3-(3-cloro-1*H*-pirazol-1-il)piridina

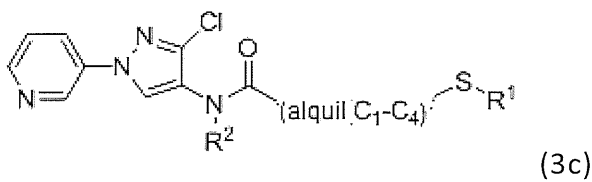


se prepara oxidando 3-(3-cloro-4,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)piridina

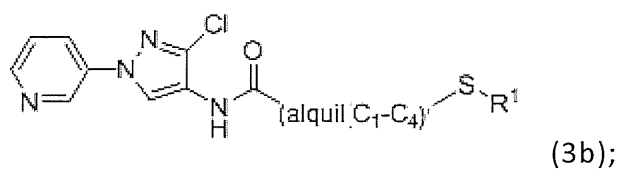


con aproximadamente 1,5 equivalentes a aproximadamente 10 equivalentes de óxido de manganeso (IV) in, a temperaturas que van de aproximadamente 60°C a aproximadamente 90°C.

20. Un procedimiento de acuerdo con las reivindicaciones 6, 9 ó 10, en donde el tioéter (3c)

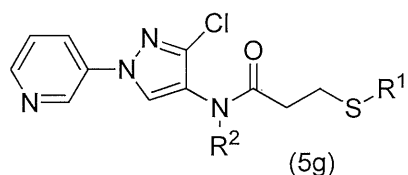


se prepara alquilando tioéter (3b) con R^2-X^2

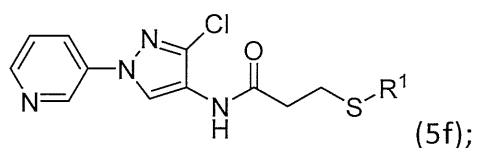


en donde R^2 está seleccionado del grupo que consiste en alquilo C1–C4 y alquinilo C2–C4, en donde X^2 es un grupo saliente, en presencia de una base, en presencia de un solvente aprótico polar y en presencia de un aditivo.

21. Un procedimiento de acuerdo con las reivindicaciones 11 ó 12, en donde el tioéter (5g)

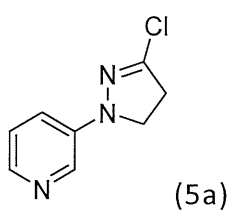


se prepara alquilando tioéter (5f) con R^2-X^2



en donde R^2 está seleccionado del grupo que consiste en alquilo C1–C4 y alquinilo C2–C4, en donde X^2 es un grupo saliente, en presencia de una base, en presencia de un solvente aprótico polar y en presencia de un aditivo.

22. Un procedimiento de acuerdo con las reivindicaciones 17, 18 ó 19, en donde el cloruro de dihidropirazol (5a)

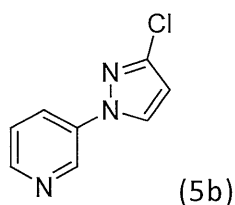


se prepara

(1) haciendo reaccionar diclorhidrato de 3–hidrazinopiridina con acrilato de metilo, en condiciones básicas, para obtener 1–(piridin–3–il)pirazolidin–3–ona; y

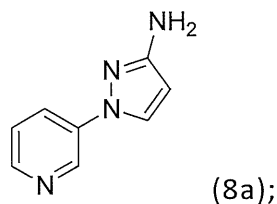
(2) clorando la 1-(piridin-3-il)pirazolidin-3-ona con tricloruro de fosforilo (POCl_3).

23. Un procedimiento de acuerdo con las reivindicaciones 2, 9 u 11, en donde la 3-(3-cloro-1*H*-pirazol-1-il)piridina



se prepara

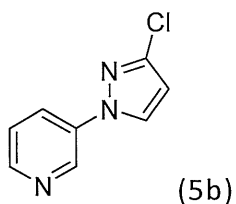
a) tratando el diclorhidrato de 3-hidrazinopiridina con 3-etoxiacrilonitrilo en un alcohol alifático C1-C4 a una temperatura de aproximadamente 25°C a aproximadamente 100°C en presencia de un alcóxido C1-C4 de metal alcalino para proporcionar la 3-(3-amino-1*H*-pirazol-1-il)piridina (8a)



b) tratando la 3-(3-amino-1*H*-pirazol-1-il)piridina (8a) en ácido clorhídrico acuoso con nitrito de sodio a una temperatura de aproximadamente 0°C a aproximadamente 25°C para proporcionar la correspondiente sal de diazonio; y

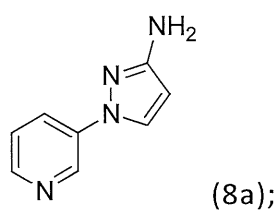
c) tratando la sal de diazonio con cloruro de cobre a una temperatura de aproximadamente 0°C a aproximadamente 25°C.

24. Un procedimiento de acuerdo con las reivindicaciones 2, 9 u 11, en donde la 3-(3-cloro-1*H*-pirazol-1-il)piridina



se prepara

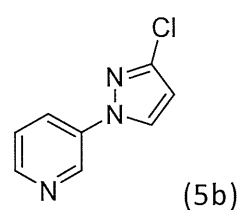
a) tratando la 3-bromopiridina con 3-aminopirazol en un solvente orgánico aprótico polar miscible en agua a una temperatura de aproximadamente 75°C a aproximadamente 155°C en presencia de una cantidad catalítica de cloruro de cobre y una base para proporcionar 3-(3-amino-1*H*-pirazol-1-il)piridina (8a)



b) tratando la 3-(3-amino-1*H*-pirazol-1-il)piridina (8a) en ácido clorhídrico acuoso con nitrito de sodio a una temperatura de aproximadamente 0°C a aproximadamente 25°C para proporcionar la correspondiente sal de diazonio; y

c) tratando la sal de diazonio con cloruro de cobre una temperatura de aproximadamente 0°C a aproximadamente 25°C.

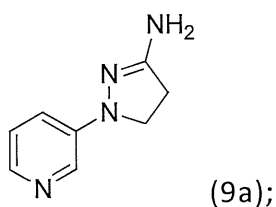
25. Un procedimiento de acuerdo con las reivindicaciones 2, 9 u 11, en donde la 3-(3-cloro-1*H*-pirazol-1-il)piridina



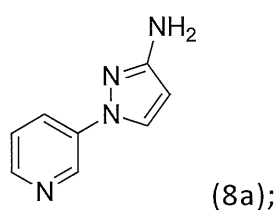
se prepara

a) tratando el diclorhidrato de 3-hidrazinopiridina con acrilonitrilo en un alcohol alifático C1-C4 a una temperatura de aproximadamente 25°C a

aproximadamente 100°C en presencia de un alcóxido C1–C4 de metal alcalino para proporcionar la 1-(piridin-3-il)-4,5-dihidro-1*H*-pirazol-3-amina (9a)



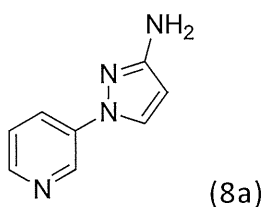
b) tratando la 1-(piridin-3-il)-4,5-dihidro-1*H*-pirazol-3-amina (9a) con oxidante en un solvente orgánico a una temperatura de aproximadamente 25°C a aproximadamente 100°C para proporcionar la 3-(3-amino-1*H*-pirazol-1-il)piridina (8a)



c) tratando la 3-(3-amino-1*H*-pirazol-1-il)piridina (8a) en ácido clorhídrico acuoso con nitrito de sodio a una temperatura de aproximadamente 0°C a aproximadamente 25°C para proporcionar la correspondiente sal de diazonio; y

d) tratando la sal de diazonio con cloruro de cobre a una temperatura de aproximadamente 0°C a aproximadamente 25°C.

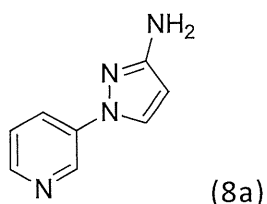
26. Un procedimiento de acuerdo con las reivindicaciones 23, 24 ó 25, en donde la 3-(3-amino-1*H*-pirazol-1-il)piridina (8a)



se prepara tratando la 3-bromopiridina con 3-aminopirazol en un solvente orgánico aprótico polar miscible en agua a una temperatura de aproximadamente

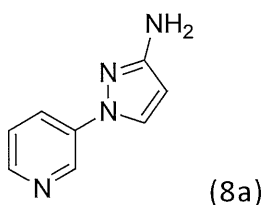
75°C a aproximadamente 155°C en presencia de una cantidad catalítica de cloruro de cobre y una base.

27. Un procedimiento de acuerdo con las reivindicaciones 23, 24 ó 25, en donde la 3-(3-amino-1*H*-pirazol-1-il)piridina (8a)



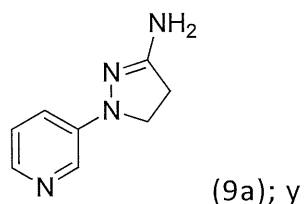
se prepara tratando el diclorhidrato de 3-hidrazinopiridina con 3-etoxiacrilonitrilo en un alcohol alifático C₁-C₄ a una temperatura de aproximadamente 25°C a aproximadamente 100°C en presencia de un alcóxido de metal C₁-C₄.

28. Un procedimiento de acuerdo con las reivindicaciones 23, 24 ó 25, en donde la 3-(3-amino-1*H*-pirazol-1-il)piridina (8a)



se prepara

a) tratando el diclorhidrato de 3-hidrazinopiridina con acrilonitrilo en un alcohol alifático C₁-C₄ a una temperatura de aproximadamente 25°C a aproximadamente 100°C en presencia de un alcóxido C₁-C₄ de metal alcalino para proporcionar la 1-(piridin-3-il)-4,5-dihidro-1*H*-pirazol-3-amina (9a); y



b) tratando la 1-(piridin-3-il)-4,5-dihidro-1H-pirazol-3-amina (9a) con oxidante en un solvente orgánico a una temperatura de aproximadamente 25°C a aproximadamente 100°C.

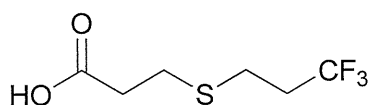
29. Un procedimiento de acuerdo con las reivindicaciones 5, 9 ó 10, en donde $X^1C(=O)$ alquil C1-C4-S-R¹,

en donde,

R¹ está seleccionado del grupo que consiste en haloalquilo C1-C4 y alquil C1-C4-halocicloalquilo C3-C6, y

X¹ está seleccionado del grupo que consiste en Cl, OC(=O)alquilo C1-C4 y un grupo que forma un ácido carboxílico activado

se prepara a partir de



que se prepara por acoplamiento fotoquímico de radicales libres de ácido 3-mercaptopropiónico y sus ésteres con 3,3,3-trifluoropropeno en presencia del iniciador de 2,2-dimetoxi-2-fenilaceto-fenona y luz UV de longitud de onda larga en un solvente orgánico inerte.

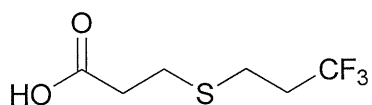
30. Un procedimiento de acuerdo con las reivindicaciones 5, 9 ó 10, en donde $X^1C(=O)$ alquil C1-C4-S-R¹,

en donde,

R¹ está seleccionado del grupo que consiste en haloalquilo C1-C4 y alquil C1-C4-halocicloalquilo C3-C6, y

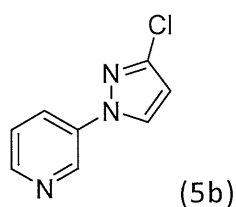
X¹ está seleccionado del grupo que consiste en Cl, OC(=O)alquilo C1-C4 y un grupo que forma un ácido carboxílico activado

se prepara a partir de



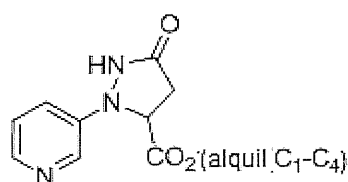
que se prepara por acoplamiento iniciado por radicales libres a baja temperatura de ácido 3-mercaptopropiónico con 3,3,3-trifluoropropeno en presencia de iniciador de 2,2'-azobis(4-metoxi-2,4-dimetil)valeronitrilo (V-70) a temperaturas de aproximadamente -50°C a aproximadamente 40°C en un solvente orgánico inerte.

31. Un procedimiento de acuerdo con las reivindicaciones 2, 9 u 11, en donde la 3-(3-cloro-1*H*-pirazol-1-il)piridina



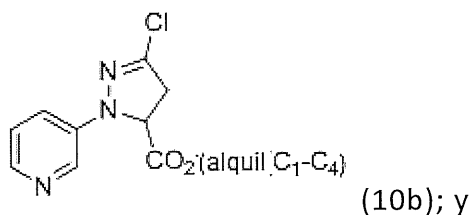
se prepara

a) tratando el diclorhidrato de 3-hidrazinopiridina con un maleato de di-alquilo $\text{C}_1\text{--C}_4$ en un alcohol alifático $\text{C}_1\text{--C}_4$ a una temperatura de aproximadamente 25°C a aproximadamente 100°C en presencia de un alcóxido $\text{C}_1\text{--C}_4$ de metal alcalino para proporcionar carboxilato de pirazolidina

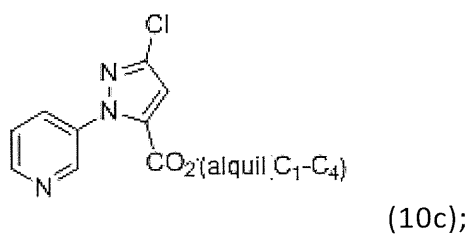


(10a); y

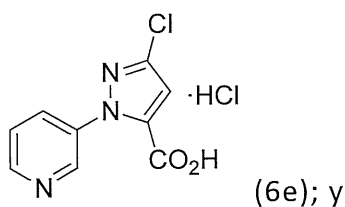
b) tratando el carboxilato de pirazolidina con un reactivo clorante en un solvente orgánico inerte a una temperatura de aproximadamente 25°C a aproximadamente 100°C para proporcionar carboxilato de dihidropirazol clorado



c) tratando el carboxilato de dihidropirazol clorado con un oxidante en un solvente orgánico inerte a una temperatura de aproximadamente 25°C a aproximadamente 100°C para proporcionar carboxilato de pirazol clorado



d) tratando el carboxilato de pirazol clorado con ácido clorhídrico acuoso a una temperatura de aproximadamente 25°C a aproximadamente 100°C para proporcionar clorhidrato de ácido 3-cloro-1-(piridin-3-il)-1H-pirazol-5-carboxílico (6e)



e) tratando ácido clorhidrato de 3-cloro-1-(piridin-3-il)-1H-pirazol-5-carboxílico (6e) con óxido de cobre (II) en un solvente aprótico polar a una temperatura de aproximadamente 80°C a aproximadamente 140°C.