

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° **34468**

Ref. Expediente N° 14040327 000009

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

En ejercicio de sus facultades legales, en especial de las que se confirieron en el numeral 34 del artículo 3 del Decreto 4886 de 2011, y

CONSIDERANDO

PRIMERO: Que mediante Resolución No. 22085 del 28 de abril de 2016, la Superintendencia de Industria y Comercio denegó patente de invención a la creación denominada: “MÉTODOS PARA AISLAR ÁCIDOS 4-CLORO-2-FLUORO-3-FENILBORÓNICOS SUSTITUIDOS”, con fundamento en los artículos 14, 18 y 30 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, al estimar que la invención en estudio se encontraba referida a un uso y, además, no cumplía con los requisitos de nivel inventivo, claridad, concisión y sustento descriptivo.

SEGUNDO: Que mediante escrito radicado en esta Entidad el 20 de junio de 2016, con el No. 14-040327-00009-0000, encontrándose dentro del término establecido para el efecto, la sociedad DOW AGROSCIENCES LLC, interpuso recurso de reposición contra la citada Resolución, con fundamento en los argumentos que a continuación se sintetizan:

Como primera medida la recurrente presenta, junto al escrito del recurso, un nuevo capítulo reivindicatorio conformado por 11 reivindicaciones y argumenta que las reivindicaciones 12 y 13 han sido eliminadas, las reivindicaciones 1 y 9 han sido modificadas para incluir las características técnicas de la anterior reivindicación 12 y la reivindicación 3 ha sido modificada para incluir las características de la reivindicación 13.

La recurrente manifiesta su desacuerdo cuando esta Oficina señala que las reivindicaciones 1 a 11 carecen de soporte porque la descripción de la solicitud no divulga ni el nombre específico o la estructura química del reactivo de acoplamiento Suzuki, ni las condiciones de la reacción de acoplamiento Suzuki. Para tal efecto, la recurrente remite a la página 16 (segundo párrafo) hasta la página 17 (primer párrafo) de la descripción. Adicionalmente, indica que existen publicaciones que permiten a una persona medianamente versada en la materia reproducir y ejecutar la reacción de acoplamiento Suzuki tales como US2003/0114311 publicado el 19 de junio de 2003; US2007/0179060 publicado el 2 de agosto de 2007 y US2008/0045734 publicado el 21 de febrero de 2008 (Ejemplos 42-49 y 52-62). Por lo tanto, concluye que la objeción de las reivindicaciones 1-11 por falta de soporte no tiene validez y es superada.

Frente a D1 la recurrente afirma que “*enseña la preparación de ácido 4-cloro-2-fluoro-3- metoxifenilborónico en el Ejemplo 2: ‘El producto se extrajo de la mezcla acidificada usando acetato de etilo (2 x 304 ml). Las capas de acetato de etilo se*

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 34468

Ref. Expediente N° 14040327 000009

combinaron, se lavaron con cloruro de sodio acuoso saturado (304 ml), se secaron con sulfato de magnesio anhidro, se filtraron, y concentraron en un evaporador rotatorio para obtener un sólido blanco. El producto sólido se secó en vacío durante la noche a temperatura ambiente para obtener 45,1 g de ácido 4-cloro-2-fluoro-3-metoxifenilborónico' D1 enseña el método en el que el ácido 4-cloro-2-fluoro-3-metoxifenilborónico es concentrado y aislado primero como un sólido blanco, y luego se hace reaccionar el compuesto sólido aislado con el agente de acoplamiento Suzuki (...) D1 no enseña o sugiere un método que comprende 'sin concentración o aislamiento del ácido 4-cloro-2-fluoro-3-fenilborónico sustituido del acetonitrilo, hacer reaccionar el ácido 4-cloro-2-fluoro-3-fenilborónico sustituido en el acetonitrilo con 1,3-propanodiol para producir 4-cloro-2-fluoro-3-fenil sustituido-[1,3,2]- dioxaborinano; y sin concentración o aislamiento de (4-cloro-2-fluoro-3-fenil sustituido)- [1,3,2]-dioxaborinano a partir de acetonitrilo, hacer reaccionar el dioxaborinano con una reacción de acoplamiento Suzuki...', de acuerdo con la versión modificada de las reivindicaciones 1, 3 o 9".

Por otro lado la recurrente argumenta respecto a D2 que ***"enseña el desalado asistido por extracción líquido/líquido con acetonitrilo. D2 no enseña ni sugiere un método en el que la reacción de acoplamiento Suzuki se lleva a cabo sin concentración o aislamiento del compuesto 4-cloro-2-fluoro-3- fenilborónico del disolvente orgánico (por ejemplo, acetonitrilo). De hecho, D2 incluso no enseña nada acerca de compuesto 4-cloro-2-fluoro-3-sustituido-fenilborónico o la reacción de acoplamiento Suzuki de tal compuesto"***.

Con relación a la combinación de enseñanzas de los documentos D1 y D2 la recurrente considera que *"se limitan a indicar los métodos que eran conocidos y practicados en la fecha de prioridad de la presente solicitud, es decir, el ácido 4-cloro-2-fluoro-3-fenilborónico sustituido se concentra a partir de un disolvente orgánico, y se aisló como un sólido antes de su uso en una reacción subsiguiente (...)".* Por lo que concluye que no hubiera sido obvio para la persona medianamente versada en la materia, a partir de las enseñanzas combinadas de D1 con D2, derivar el método reivindicado en las nuevas cláusulas 1 a 11 allegadas con el recurso de reposición.

TERCERO: Que dentro del contexto antes descrito, esta Entidad procede a resolver el recurso de reposición interpuesto teniendo en cuenta los argumentos de la recurrente en los siguientes términos:

Se acepta el nuevo capítulo reivindicatorio allegado con el recurso de reposición ya que no implica una ampliación de la materia inicialmente presentada, de acuerdo con el artículo 34 de la Decisión 486. De igual forma, la recurrente paga la tasa correspondiente por la modificación voluntaria que realiza.

Teniendo en cuenta lo anterior, la nueva reivindicación 1 se encuentra referida a:

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 34468

Ref. Expediente N° 14040327 000009

1. Un método para preparar 6-(4-cloro-2-fluoro-3-metoxifenil)-4-aminopicolinato que comprende:

Hacer reaccionar una mezcla de agua, acetonitrilo y un ácido 4-cloro-2- fluoro-3- fenilborónico sustituido con una sal para formar una capa de acetonitrilo y una capa de agua;

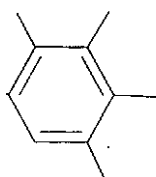
separar el ácido 4-cloro-2-fluoro-3-fenilborónico sustituido en la capa de acetonitrilo;

separar la capa de acetonitrilo que comprende ácido 4-cloro-2-fluoro-3- fenilborónico sustituido de la capa de agua;

sin concentración o aislamiento del ácido 4-cloro-2-fluoro-3- fenilborónico sustituido del acetonitrilo, hacer reaccionar el ácido 4-cloro-2- fluoro-3-fenilborónico sustituido en el acetonitrilo con 1,3-propanodiol para producir 4-cloro-2-fluoro-3-fenil sustituido-[1,3,2]-dioxaborinano; y

sin concentración o aislamiento de (4-cloro-2-fluoro-3-fenil sustituido)- [1,3,2]-dioxaborinano a partir de acetonitrilo, hacer reaccionar el dioxaborinano con una reacción de acoplamiento Suzuki para producir 6-(4- cloro-2-fluoro-3-fenil sustituido)-4-aminopicolinato,

en donde el ácido 4-cloro-2-fluoro-3-fenilborónico sustituido tiene la siguiente estructura



donde X es F, OR₁ o NR₂R₃; Y es H o F; y cada uno de R₁, R₂, y R₃ es independientemente un grupo alquilo C₁-C₄.

A su vez, la nueva reivindicación 9 se encuentra referida a:

Un método para preparar 6-(4-cloro-2-fluoro-3-fenil sustituido)-4- aminopicolinato, el método comprende:

Hacer reaccionar 2-cloro-6-fluoroanisol (2,6-CFA, por sus siglas en inglés) con n-butillitio para formar un derivado litiado de 2,6-CFA;

hacer reaccionar el derivado litiado de 2,6-CFA con B(OCH₃)₃ para formar un éster de ácido borónico de 2,6-CFA;

hacer reaccionar el éster de ácido borónico de 2,6-CFA con hidróxido de sodio acuoso para formar una sal de sodio del ácido borónico de 2,6-CFA;

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 34468

Ref. Expediente N° 14040327 000009

hacer reaccionar la sal de sodio del ácido borónico de 2,6-CFA con ácido clorhídrico acuoso para formar una solución de ácido 4-cloro-2-fluoro-3- metoxifenilborónico;

agregar acetonitrilo a la solución de ácido 4-cloro-2-fluoro-3- metoxifenilborónico para formar una mezcla de acetonitrilo, agua y ácido 4- cloro-2-fluoro-3- metoxifenilborónico;

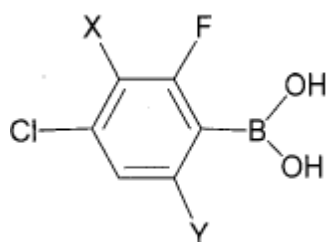
agregar una sal a la mezcla de acetonitrilo, agua y ácido 4-cloro-2- fluoro-3- metoxifenilborónico para formar una capa de acetonitrilo y una capa de agua, en donde la capa de acetonitrilo comprende ácido 4-cloro-2-fluoro-3- fenilborónico;

separar la capa de acetonitrilo que comprende el ácido 4-cloro-2-fluoro- 3- fenilborónico de la capa de agua;

sin concentración o aislamiento del ácido 4-cloro-2-fiuoro-3- fenilborónico sustituido del acetonitrilo, hacer reaccionar el ácido 4-cloro-2- fluoro-3-fenilborónico sustituido en el acetonitrilo con 1,3-propanodiol para producir 4-cloro-2-fluoro-3-fenil sustituido-[1,3,2]-dioxaborinano; y

sin concentración o aislamiento de (4-cloro-2-fluoro-3-fenil sustituido)- [1,3,2]- dioxaborinano a partir de acetonitrilo, hacer reaccionar el dioxaborinano con una reacción de acoplamiento Suzuki para producir 6-(4- cloro-2-fluoro-3-fenil sustituido)-4-aminopicolinato,

en donde el ácido 4-cloro-2-fluoro-3-fenilborónico sustituido tiene la siguiente estructura



donde X es F, OR₁ o NR₂R₃; Y es H o F; y cada uno de R₁, R₂, y R₃ es independientemente un grupo alquilo C₁-C₄.

La recurrente manifiesta su desacuerdo cuando esta Oficina señala que las reivindicaciones 1 a 11 carecen de soporte en la descripción de la presente solicitud de patente de invención, porque no se divulga ni el nombre específico o la estructura química del reactivo de acoplamiento de Suzuki. Sin embargo, esta Oficina al revisar las páginas 16 y 17 de la descripción encuentra suficiente sustento técnico para el método reclamado en las reivindicaciones 1 a 11. Además, tal como lo afirma la recurrente, la reacción de acoplamiento de Suzuki es de amplio conocimiento en el campo de la síntesis química como se puede observar en los

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 34468

Ref. Expediente N° 14040327 000009

documentos citados US2003/0114311, US2007/0179060 y US2008/0045734. Por lo tanto, esta Oficina indica que la objeción trasladada en cuanto a la falta de soporte en la descripción es superada.

Con relación al documento D1, esta Oficina encuentra que divulga en el ejemplo 3 un método para aislar 4-cloro-2-fluoro-3-metoxifenilborónico que consiste en mezclar la capa acuosa que comprende ácido 4-cloro-2-fluoro-3-fenilborónico con acetonitrilo y posteriormente acidificar con unas gotas de ácido clorhídrico 6M. La capa acuosa es extraída con acetonitrilo adicional, para finalmente obtener un producto total con un rendimiento de 80,3%. Entonces, la diferencia entre el método reclamado y el método divulgado en D1 consiste en que en la anterioridad no enseña la etapa de poner en contacto la mezcla de agua-acetonitrilo con una sal y tampoco divulga que el método se realice sin concentración o aislamiento del ácido 4-cloro-2-fluoro-3-fenilborónico sustituido del acetonitrilo, hacer reaccionar el ácido 4-cloro-2-fluoro-3-fenilborónico sustituido en el acetonitrilo con 1,3-propanodiol para producir 4-cloro-2-fluoro-3-fenil sustituido-[1,3,2]- dioxaborinano y sin concentración o aislamiento de (4-cloro-2-fluoro-3-fenil sustituido)- [1,3,2]-dioxaborinano a partir de acetonitrilo, hacer reaccionar el dioxaborinano con una reacción de acoplamiento Suzuki.

Por otra parte, el documento D2 se refiere al *salting out* y los efectos que se obtienen por el desalado asistido por la extracción líquido/líquido con acetonitrilo. Sin embargo, dicha anterioridad tampoco sugiere o divulga que la reacción de acoplamiento Suzuki se lleva a cabo sin concentración o aislamiento del compuesto 4-cloro-2-fluoro-3- fenilborónico del disolvente orgánico (por ejemplo, acetonitrilo).

Ahora bien, en el ejemplo comparativo 4 de la descripción (que equivale al ejemplo 3 de D2) se obtiene un producto final con un rendimiento de 80,3% (pág. 23-24) mientras que en los ejemplos 1 a 3 que divulgan la mejor manera de llevar a cabo el método reclamado en la presente solicitud de patente de invención se obtienen rendimientos de 90%, 93% y 89% respectivamente. Lo anterior indica que el método reclamado conduce a un rendimiento mejorado de aproximadamente un 10 % con respecto al ejemplo 3 divulgado en el estado de la técnica más cercano (D2).

Así las cosas, teniendo en cuenta que ni D1 ni D2 enseñan o sugieren el método para preparar 6-(4-cloro-2-fluoro-3-fenil sustituido)-4- aminopicolinato reclamado en la presente solicitud de patente de invención y teniendo en cuenta que el mismo representa un efecto mejorado con respecto al estado de la técnica (D2), esta Oficina coincide con la recurrente en que la persona medianamente versada en la materia consideraría que los hallazgos derivados de los ejemplos descritos en la presente solicitud de patente de invención son inventivos frente al estado de la técnica citado (documento D2 con D3).

Por lo anterior, esta Oficina encuentra que la materia reclamada en la presente solicitud de patente de invención definida en las nuevas reivindicaciones 1 a 11 es

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 34468

Ref. Expediente N° 14040327 000009

novedosa y presenta un efecto que se considera sorprendente frente a lo revelado en el documento D2.

CUARTO: De acuerdo con lo anteriormente expuesto, en el presente caso las reivindicaciones 1 a 11, incluidas en el escrito radicado bajo el No 14-040327-00009-0000, cumplen con los requisitos de patentabilidad de que trata el artículo 14 de la Decisión 486 y, en consecuencia, este Despacho encuentra procedente conceder para las mismas la patente solicitada.

QUINTO: Que de acuerdo con el objeto al cual se concede la patente el título de la invención, quedará de la siguiente manera: “MÉTODO PARA PREPARAR 6-(4-CLORO-2-FLUORO-3-METOXIFENIL)-4- AMINOPICOLINATO”.

Con fundamento en las anteriores consideraciones, el Superintendente de Industria y Comercio

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Revocar la decisión contenida en la Resolución No 22085 del 28 de abril de 2016, por medio de la cual se denegó una patente de invención.

ARTÍCULO SEGUNDO: Otorgar patente de invención a la solicitud que entró en fase nacional en virtud del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), para la creación titulada:

“MÉTODO PARA PREPARAR 6-(4-CLORO-2-FLUORO-3-METOXIFENIL)-4-AMINOPICOLINATO”

Clasificación IPC: C07F 5/02; C07C 43/205; C07B 63/00.

Reivindicación(es): 1 a 11 incluidas en el radicado N° 14-040327-00009-0000.

Titular(es): DOW AGROSCIENCES LLC.

Domicilio(s): Indianápolis, Indiana -Estados Unidos de América-

Inventor(es): Jossian Oppenheimer.

Prioridad(es) N° 61/511,867 **Fecha:** 26 de julio de 2011 **País:** US.

Solicitud internacional N°: PCT/US2012/048371 **Fecha:** 26 de julio de 2012

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° **34468**

Ref. Expediente N° 14040327 000009

Vigente desde: 26 de julio de 2012

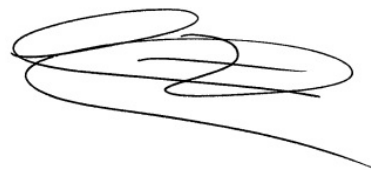
Hasta: 26 de julio de 2032

ARTÍCULO TERCERO: El titular tendrá los derechos y las obligaciones establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina y en las demás disposiciones legales vigentes sobre propiedad industrial, precisando que para mantener vigente la patente se deberá cancelar la tasa anual de mantenimiento, conforme lo dispone el artículo 80 de la referida norma comunitaria.

ARTÍCULO CUARTO: Notificar el contenido de la presente resolución a la solicitante DOW AGROSCIENCES LLC, advirtiéndole que contra ella no procede recurso alguno, por encontrarse agotada la etapa administrativa.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE

Dada en Bogotá D.C., a los 14 de junio de 2017



FELIPE GARCÍA PINEDA
SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO (E)