

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 187 de 10 de enero de 2020

Ref. Expediente N° 16104347

Señor(a)
DOW AGROSCIENCES LLC

TÍTULO DE LA SOLICITUD: **“PROCESOS PARA LA PREPARACIÓN DE UN COMPUESTO PESTICIDA”**

NÚMERO DE SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/US2014/061009

FECHA DE PRESENTACIÓN INTERNACIONAL: 17 de octubre de 2014.

PRIORIDAD(ES): 17/10/2013, US (ESTADOS UNIDOS), 61/892,118
20/08/2014, US (ESTADOS UNIDOS), 62/039,730

Como resultado del examen de patentabilidad realizado a la solicitud indicada en la referencia, atendiendo a lo consagrado en el artículo 45 de la Decisión 486 de 2000, se le comunica que esta Dirección ha encontrado que la materia objeto de solicitud no cumple con algunos requisitos establecidos en la Decisión, con fundamento en los siguientes aspectos:

2. Modificaciones presentadas (Art. 34 Decisión 486)

Se aceptan las modificaciones radicadas el 25 de agosto de 2016, bajo el número 16104347, por ajustarse a los requisitos legales.

3. Objeto de la invención

De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del Capítulo Primero del Título X de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, 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 al momento de realizar el examen de patentabilidad consagrado en el artículo 45 de la Decisión 486.

Por lo tanto, se estudiarán las reivindicaciones 1 a 15 del radicado N° 16104347 del 25 de agosto de 2016.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de mejorar el rendimiento de la reacción con el fin de obtener el producto de interés y los intermediarios (1a) en una mayor proporción molar, frente al producto halogenado no deseado (1H-pirazol-4-amina clorhidrato).

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona un proceso químico por vía sintética para obtener pesticidas tipo tioéter y pesticidas tipo sulfóxido con un alto rendimiento.

4. Reivindicaciones relativas a un uso (Art. 14 Decisión 486)

El proceso para el control de insectos que habitan en un lugar de las reivindicaciones 8 y 9 no es patentable, de acuerdo con el artículo 14, teniendo en cuenta que aun cuando el preámbulo de las reivindicaciones hace referencia al procedimiento en realidad caracteriza el proceso por la aplicación o uso del pesticida 3-cloro-N-(3-cloro-1-(piridin-3-il)-1H-pirazol-4-il)-N-etil-propanamida (2a) sobre el insecto BEMITA o MYZUPE, por lo



Oficio N° 187 de 10 de enero de 2020

Ref. Expediente N° 16104347

cual, no corresponde a una reivindicación de producto o de procedimiento en los términos del artículo 14 de la Decisión 486.

5. De la solicitud de patente

5.1 Título (Art. 27 literal d) Decisión 486)

El nombre de la invención de que trata el artículo 27 literal d) de la Decisión 486 debe reflejar el objeto y el campo industrial con el cual se relaciona la misma, y ser concordante con la materia reivindicada.

En el escrito radicado bajo el N° 16104347 del 25 de abril de 2016, el solicitante tituló la invención en la siguiente forma: “PROCESO PARA LA PREPARACIÓN DE UN COMPUESTO PESTICIDA”. Este título no se relaciona con el objeto de la solicitud contenido en la descripción y en las reivindicaciones, por lo cual se sugiere ajustarlo a la estructura química de los compuestos de interés obtenidos en la serie de procesos reivindicados, es decir, pesticidas tioéter y sulfóxido.

5.2 Reivindicaciones (Art. 30 Decisión 486)

La solicitud presenta dos reivindicaciones independientes dentro de la categoría de proceso, cada una dirigida a un intermediario diferente. Se trata de las reivindicaciones 1 a 7 y por otra parte, las reivindicaciones 10 a 14. La presentación de un número de reivindicaciones independientes dentro de la misma categoría inventiva evidencia falta de concisión en el capítulo reivindicatorio, por lo que es necesario que se presente una única reivindicación independiente en la que se incluyan las etapas esenciales del procedimiento de síntesis química para obtener pesticidas tipo tioéter / sulfóxido y a partir de la misma, se presenten las modalidades particulares del proceso en reivindicaciones dependientes, con sus variantes de procedimiento.

En el caso de la reivindicación 15 se presenta dependencia múltiple de las reivindicaciones independientes 1 y 10 para un proceso de dos etapas, sin embargo, su enunciado no implica necesariamente que todas las características de las reivindicaciones independientes a las que hace referencia están incluidas en ella. Teniendo en cuenta lo anterior, se sugiere incluir una reivindicación independiente y a partir de la misma, reivindicaciones dependientes para ilustrar las formas particulares de llevar a cabo el proceso en las etapas relevantes.

6. Unidad de invención (Art. 25 Decisión 486)

La solicitud no cumple con el requisito de unidad de invención porque se refiere al menos a dos (2) grupos inventivos que no comparten elementos técnicos particulares.

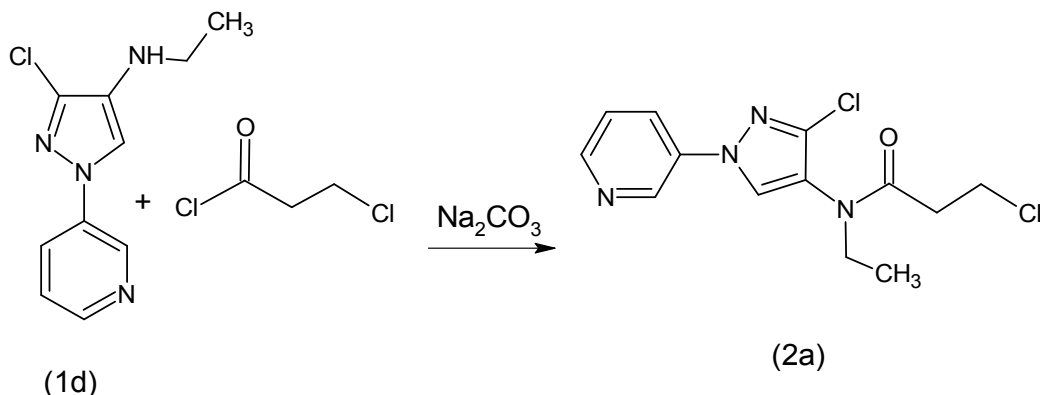
Los grupos inventivos están definidos por las siguientes características esenciales:

Grupo inventivo 1: Proceso para la preparación de tioéteres pesticidas (2b), que comprende hacer reaccionar 3-cloro-N-etil-1-(piridina-3-ilo)-1H-pirazol-amina (1d) con 1 a 2 equivalentes de cloruro de 3-cloropropionilo en presencia de una base inorgánica para obtener N-(3-cloro-1-(piridina-3-ilo)-1H-pirazol-4-ilo)-N-etilpropanamida (2a). (reivindicaciones 1 a 7).



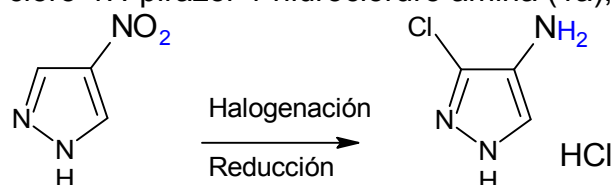
Oficio N° 187 de 10 de enero de 2020

Ref. Expediente N° 16104347

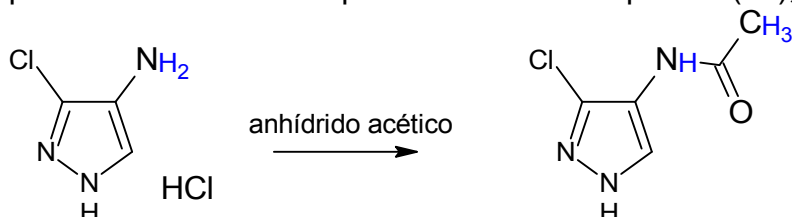


Grupo inventivo 2: Proceso que incluye: (reivindicaciones 10 a 14).

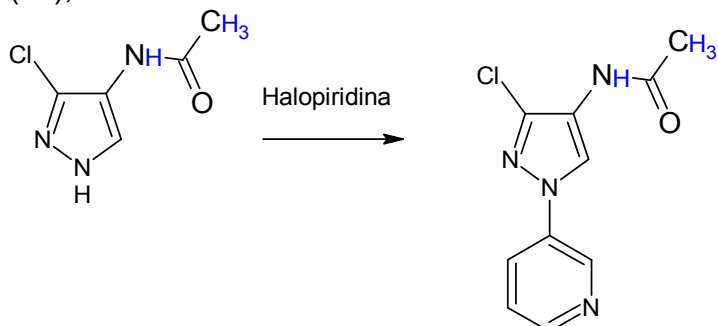
a) halogenación y reducción de 4-nitropirazol con ácido hidroc্লórico concentrado a una temperatura entre alrededor de 10°C y alrededor de 20°C entre 1 a 4 equivalentes de trietilsilano y alrededor de 1 a 10% del peso de paladio sobre alúmina, para obtener 3-cloro-1H-pirazol-4-hidrocloruro amina (1a);



b) mono-acilación 3-cloro-1H-pirazol-4-hidrocloruro amina (1a) con anhídrido acético en presencia de una base para obtener el compuesto (1b);



c) hacer reaccionar (1b) con una halopiridina adecuada en presencia de una sal de cobre, una amina y una base para obtener N-(3-cloro-1-(piridina-3-il)-1H-pirazol-4-il)acetamida (1c);

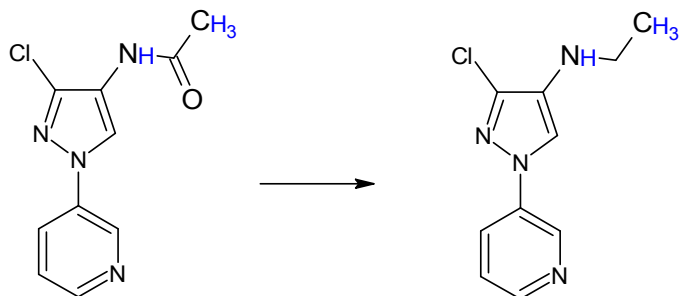


d) reaccionar (1c) con un agente de reducción adecuado en presencia de un ácido para obtener 3-cloro-N-etil-1-(piridina-3-il)-1H-pirazol-4-il)amina (1d);

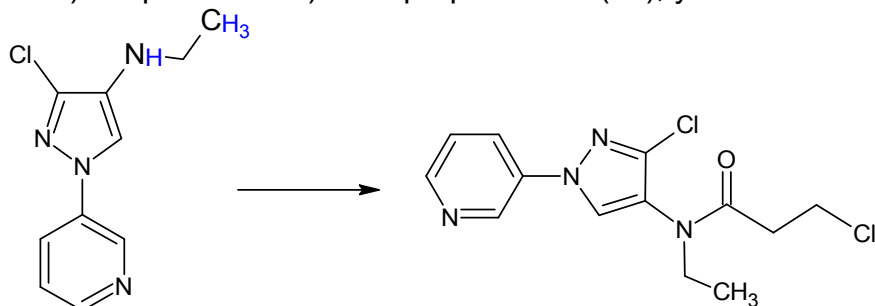


Oficio N° 187 de 10 de enero de 2020

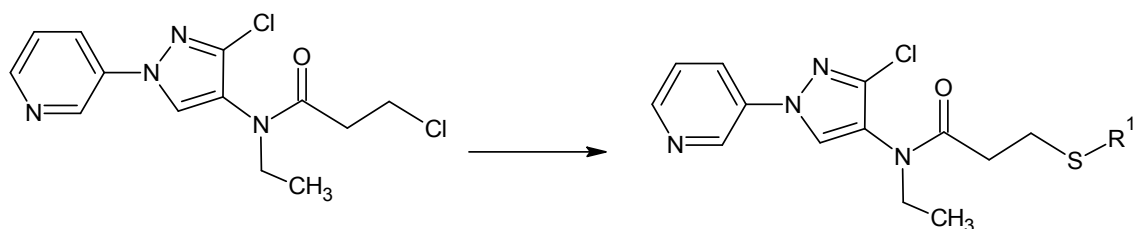
Ref. Expediente N° 16104347



e) reaccionar (1d) con entre alrededor de 1 y 2 equivalentes de cloruro de 3-cloropropionilo en presencia de una base inorgánica para generar N-(3-cloro-1-(piridina-3-ilo)-1H-pirazol-4-ilo)-N-etilpropanamida (2a); y



f) reaccionar (2a) con un tiol HS-R¹ en presencia de una base para generar tioéteres pesticidas (2b) (reivindicaciones 10 a 14).



Grupo inventivo 3: Proceso de acuerdo con la reivindicación 1 en donde 3-cloro-N-etilo-1-(piridina-3-ilo)-1H-pirazol-amina (1d) se prepara por:

a) alquilar N-(3-cloro-1-(piridina-3-ilo)-1H-pirazol-4-ilo)acetamida (1c) con bromuro de etilo en presencia de una base para producir N-(3-cloro-1-(piridina-3-ilo)-1H-pirazol-4-ilo)-N-etilacetamida (1c'); y

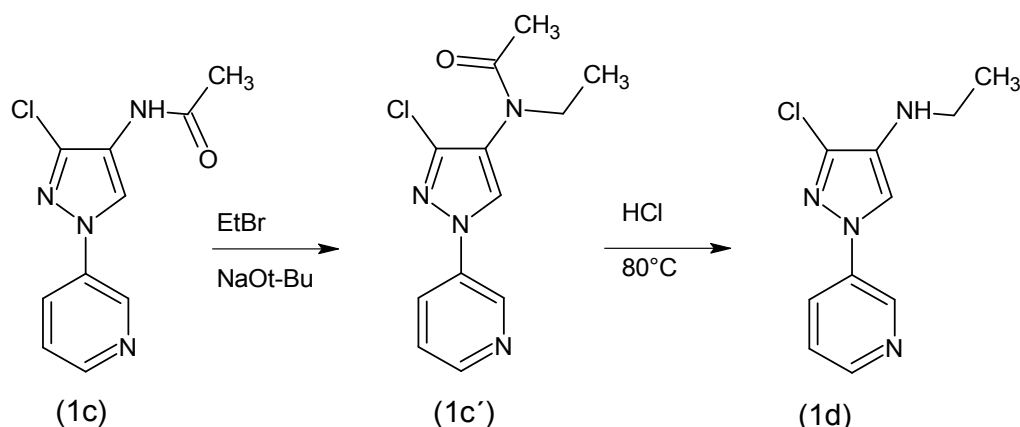
b) reaccionar (1c') con ácido hidroclicórico en agua a temperaturas entre alrededor de 70°C y alrededor de 90°C.

(reivindicación 15)



Oficio N° 187 de 10 de enero de 2020

Ref. Expediente N° 16104347



Al respecto se encuentra que los productos finales en cada proceso de reacción: (2a), (2b) y (1d) no comparten los mismos elementos técnicos particulares y se trata de intermediarios de reacción que presentan diferencias significativas. Se sugiere presentar las solicitudes divisionales que considere necesarias, o limitar la solicitud inicial a una sola invención, presentando el proceso de reacción en la forma de una secuencia lógica de etapas derivada de una única reivindicación independiente.

7. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 17 de octubre de 2013 en el caso de la materia de las reivindicaciones 1 a 14 y la del 20 de agosto de 2014 para el caso de la materia de la reivindicación 15 que corresponde a la fecha de presentación de las solicitudes de las cuales se reivindica prioridad.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Estado de la técnica			
Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	US2013/0109566	"Pesticidal compositions and processes related thereto"	02 de mayo de 2013
D2	US2006/0135778	"Pesticidal 5-(acylamino) pyrazole derivatives"	22 de junio de 2006

El documento D1¹ divulga un procedimiento de síntesis para la preparación de N-(3-cloro-1-(piridin-3-il)-1H-pirazol-4-il)-N-etil-2-metoxiacetamida (Compuesto 512). A una solución de 3-cloro-N-etil-1-(piridin-3-il)-1H-pirazol-4-amina se adicionan 2 equivalentes de HCl y DMC para hacerlo reaccionar con N-etil-N-isopropilpropan-2-amina seguido por cloruro de 2-metoxiacetilo. El proceso cursa durante 15 horas a temperatura ambiente en ambiente saturado de bicarbonato de sodio (Ejemplo 38, Párrs. [0327 y 0328]).

¹

https://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2013109566A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20130502&DB=EPODOC&locale=en_EP

Oficio N° 187 de 10 de enero de 2020

Ref. Expediente N° 16104347

El documento D2² divulga el procedimiento de acilación de un 5-aminopirazol con 1 a 2 equivalentes de cloruro de 3-cloropropionilo para producir el producto acilado como intermediario de pesticidas (Intermediarios Ejemplo 2, Párr. [0196]).

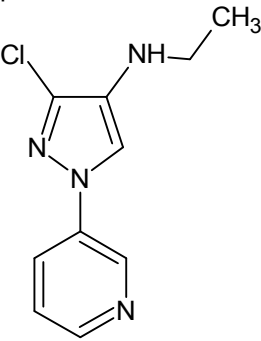
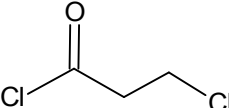
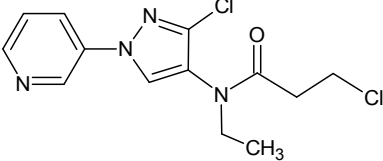
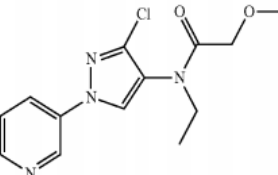
8. Examen de Patentabilidad (Art. 14 Decisión 486)

8.1 Nivel Inventivo (Art 18 Decisión 486)

El estudio de nivel inventivo se presenta respecto del primer grupo inventivo identificado, como se muestra a continuación:

La reivindicación 1 consiste en: “Un proceso que comprende reaccionar 3-cloro-N-etil-1-(piridina-3-ilo)-1H-pirazol-amina (1d) con entre alrededor de 1 y alrededor de 2 equivalentes de cloruro de 3-cloropropionilo en presencia de una base inorgánica para la preparación de N-(3-cloro-1-(piridina-3-ilo)-1H-pirazol-4-ilo)-N-etilpropanamida (2a)”. (Radicado N° 16104347 del 25 de agosto de 2016).

Tabla 1. Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica

Características esenciales	D1	D2
Proceso	Procedimiento de síntesis (Compuesto 512, Párr. 0327)	Procedimiento para producir el intermediario (Ejemplo 2, Párr. [0196])
Reacción de 3-cloro -N-etil-1-(piridin-3-ilo)-1H-pirazol-amina  con	Hacer reaccionar 3-cloro -N-etil-1-(piridin-3-ilo)-1H-pirazol-amina	A una mezcla de 5-amino-1-(2,5-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-4-trifluorometiltiopirazol en tolueno
Cloruro de 3-cloropropionilo 	2 equivalentes de HCl y N-etil-N-isopropilpropan-2-amina	Adicionar cloruro de 3-cloropropionilo y ZnCl ₂ Reflujo por 4h
Para obtener N-(3-cloro-1-(piridin-3-ilo)-1H-pirazol-4-ilo)-N-etilpropanamida 	Para obtener N-(3-cloro-1-(piridin-3-il)-1H-pirazol-4-il)-N-etil-2-metoxiacetamida 	Para obtener 3-cloropropionilamino-1-82,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-4-trifluorometiltiopirazol.

2
https://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2006135778A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20060622&DB=EPODOC&locale=en_EP

Oficio N° 187 de 10 de enero de 2020

Ref. Expediente N° 16104347

El documento D1 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga un procedimiento de síntesis para la preparación de N-(3-cloro-1-(piridin-3-il)-1H-pirazol-4-il)-N-etil-2-metoxiacetamida (Compuesto 512). A una solución de 3-cloro-N-etil-1-(piridin-3-il)-1H-pirazol-4-amina se adicionan 2 equivalentes de HCl y DMC para hacerlo reaccionar con N-etil-N-isopropilpropan-2-amina seguido por cloruro de 2-metoxiacetilo. El proceso cursa durante 15 horas a temperatura ambiente en ambiente saturado de bicarbonato de sodio (Ejemplo 38, Párrs. [0327 y 0328]).

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1 y el procedimiento divulgado en el documento D1 consiste en el reactivo utilizado, el cual consiste en cloruro de 3-cloropropionilo. Por su parte, el proceso del documento D1 comprende la reacción con HCl y N-etil-N-isopropilpropan-2-amina.

El efecto que se logra al hacer reaccionar 3-cloro -N-etil-1-(piridin-3-ilo)-1H-pirazol-amina con un haluro de acilo como cloruro de 3-cloropropionilo, consiste en mejorar el rendimiento de la reacción para obtener los intermediarios de síntesis de los pesticidas, y evitar la obtención de compuestos indeseados.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿Cómo modificar el procedimiento divulgado en el documento D1 para mejorar el rendimiento en la producción de pesticidas tipo tioéteres?.

Sin embargo, el documento D2 enseña un procedimiento para producir pesticidas tipo tioéteres, en el que compuestos como 5-amino-1-(2,5-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-4-trifluorometiltiopirazol en tolueno se hacen reaccionar con un haluro de acilo como cloruro de 3-cloropropionilo en $ZnCl_2$ a reflujo y por un periodo de 4h.

En consecuencia, la persona normalmente versada en la materia, estaría motivada a incluir un haluro de acilo como reactivo en los procesos de obtención de pesticidas tipo tioéteres, basado en las enseñanzas del documento D2, con la expectativa razonable de alcanzar un mejor rendimiento de reacción y evitar la producción de intermediarios de síntesis indeseables, tal y como se enseña en el documento D1, por lo que la reivindicación 1 se considera obvia.

Las reivindicaciones dependientes 2 a 7 no presentan elementos adicionales que hagan inventivo el procedimiento reivindicado, por lo que también se consideran obvias.

9. Conclusión con respecto a nivel inventivo.

Los requisitos de Patentabilidad de la presente solicitud están afectados así:

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	US2013/0109566	1 a 7	Nivel Inventivo
D2	US2006/0135778	1 a 7	Nivel Inventivo

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de 2000, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de sesenta (60) días contados a partir 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.

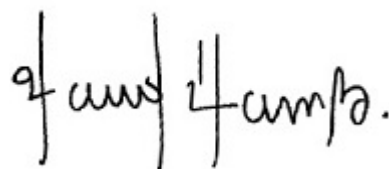


Oficio N° 187 de 10 de enero de 2020

Ref. Expediente N° 16104347

Si como respuesta a este requerimiento, el solicitante modifica: i) el capítulo reivindicatorio, ii) la descripción de la invención a proteger, iii) o presenta un nuevo capítulo reivindicatorio deberá observar las instrucciones contenidas en el numeral 1.2.2.1.1., del Capítulo Primero del Título X de la Circular Única y la Dirección de Nuevas Creaciones seguirá el procedimiento descrito en el numeral 1.2.2.5.1.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 6.2 del Capítulo Sexto del Título I de la Circular Única, informándoles que contra el mismo no procede recurso alguno en actuación administrativa.



MARÍA JOSÉ LAMUS BECERRA
DIRECTORA DE NUEVAS CREACIONES



Oficio N° 187 de 10 de enero de 2020

Ref. Expediente N° 16104347

**INFORME DE BÚSQUEDA
EXAMEN DE PATENTABILIDAD**

Solicitud No.	Examen de patentabilidad							
16104347	1°	X	2°		3°		Revoca	
Solicitud Internacional No.	Fecha solicitud internacional: (DD/MM/AÑO)							
PCT/US2014/061009	17 de octubre de 2014							
Fecha de determinación estado de la técnica (DD/MM/AÑO)				Prioridad		Presentación		
17/10/2013				US61/892,118		17/10/2013		
20/08/2014				US62/039,730		20/08/2014		
Solicitante								
DOW AGROSCIENCES LLC.								
Reivindicaciones que no son objeto de búsqueda por:								
Art. 14	8 y 9	Art. 15	-	Art. 20	-	Art. 25 (Falta de unidad de invención)		10 a 15

CRITERIOS DE BÚSQUEDA	
Reivindicaciones objeto de búsqueda	1 a 7
Palabras clave utilizadas	Pesticidal sulfoxides and thioethers Pyrazol and pyridinil substitution
Clasificaciones utilizadas para la búsqueda	CIP: A01N 43/84, A01N43/653, A01N43/56
	CPC:

DOCUMENTOS CONSIDERADOS RELEVANTES (Documentos patente, Literatura no patente (LNP): Artículos, catálogos, etc.)					
Informes de búsqueda / Bases de datos consultadas	N° de solicitud de patente / N° de patente / Autor LNP ⁽¹⁾	Fecha de Publicación /Presentación (DD/MM/AAAA)	Reivindicaciones /Secuencias afectadas	Citas relevantes del estado de la técnica	Categoría del documento citado ⁽²⁾
EPO Orbit	US2013/0109566 US2006/0135778	02/05/2013 22/0672006	1 a 7	(Ejemplo 38, Párrs. [0327 y 0328]) (Ejemplo 2, Párr. [0196])	Y
⁽¹⁾ Cita completa literatura no patente (LNP)					
Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. Nombre de la revista. Volumen(Número), pp-pp.					
O					
Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. Nombre de la revista. Recuperado de http://xxxxxxx.					
⁽²⁾ Categorías de documentos citados					
“A” Documento que define el estado general de la técnica no considerado como particularmente relevante.					
“E” Solicitud de patente o patente anterior pero publicada en la fecha de presentación internacional o en fecha posterior.					
“L” Documento citado para llamar la atención sobre por ejemplo, dudas acerca de una reivindicación de prioridad o para determinar la fecha de publicación de una cita, siempre van acompañados de una explicación, por la cual se citan.					
“O” Documento del tipo actas de conferencia, este tipo de documentos siempre estará acompañado por otra letra que indique la pertinencia del documento, por ejemplo, O,X, O,Y o bien O,A.					
“P” Documento publicado antes de la fecha de presentación internacional pero con posterioridad a la fecha de prioridad reivindicada.					
“T” Documento publicado en fecha posterior a la de presentación o la de prioridad de la solicitud internacional y no entra en conflicto con dicha solicitud, pero puede ser útil para la mejor comprensión del principio o teoría en que se basa la invención, o para demostrar que el razonamiento o los hechos en los que se basa dicha invención son incorrectos.					
“X” Documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse nueva o que implique una actividad inventiva por referencia al documento aisladamente considerado.					
“Y” Documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse que implique una actividad inventiva cuando el documento se asocia a otro u otros documentos de la misma naturaleza, cuya combinación resulta evidente para un experto en la materia.					

Oficio N° 187 de 10 de enero de 2020

Ref. Expediente N° 16104347

Fecha del reporte de búsqueda: 15/12/2019
Examinador: JUAN CARLOS CORTES GARCIA