

**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

Oficio N° 11204 de 18 de julio de 2022

Ref. Expediente N° NC2019/0006687

Señor(a)  
SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

TÍTULO DE LA SOLICITUD: **“POLIMORFO DEL COMPUESTO ESPIROPIDION”**

NÚMERO DE SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/EP2017/082983

FECHA DE PRESENTACIÓN INTERNACIONAL: 15 de diciembre de 2017.

PRIORIDADES: 22/12/2016, GB (REINO UNIDO), 1622006.3

/10/2017, GB (REINO UNIDO), 1717104.2

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:

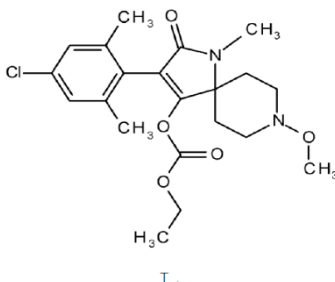
## 1. Objeto de la invención

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 4 del radicado N° NC2019/0006687 del 3 de septiembre de 2020.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad proporcionar nuevas formas cristalinas para mejorar la estabilidad térmica de derivados espiroheterocíclicos de pirrolidina diona sustituidos con N-alquil amida que tienen actividad plaguicida, en particular, actividad insecticida.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona un polimorfo cristalino del compuesto de la Fórmula I.



## 2. De la solicitud de patente

### 2.1. Reivindicaciones (Art. 30 Decisión 486)

- La reivindicación 1 no cumple con el requisito de claridad, ya que cualquier forma sólida cristalina debe ser caracterizada adicional a los picos del patrón de difracción de rayos X en polvo (XPRD) con datos de: (a) método DSC y, opcionalmente, uno o más de



Oficio N° 11204 de 18 de julio de 2022

Ref. Expediente N° NC2019/0006687

DTA, TGA o HSM; y (b) al menos uno de los métodos espectroscópicos. Se requiere caracterizar adecuadamente los cristales, de acuerdo al soporte presente en la descripción.

- La expresión: “*al menos*” (Reivindicación 1, 4); es imprecisa, por lo cual, no permite distinguir la invención del estado de la técnica. Se sugiere sustituirla por un término preciso o un rango concreto.

## 2.2. Descripción (Art. 28 Decisión 486 literal (e))

- El capítulo descriptivo no divulgó de manera suficientemente clara y completa la materia reivindicada para que la persona normalmente versada en la materia técnica correspondiente pueda ejecutarla o reproducirla, debido a que no menciona de forma específica cómo se obtuvo el “*polimorfo de la Forma A*”, el capítulo descriptivo indica que “*El compuesto de fórmula I se preparó de acuerdo con los métodos descritos en el documento WO 2010/066780. Este método conduce a la producción con forma de aguja fina del polimorfo de Forma A de Referencia*” (Pág. 51, Línea 5-8), no obstante, en dicha publicación no se menciona que se obtenga una forma cristalina del compuesto de fórmula I, ni que este tenga forma de aguja; por lo cual es desconocido como se obtuvo ese primer cristal.

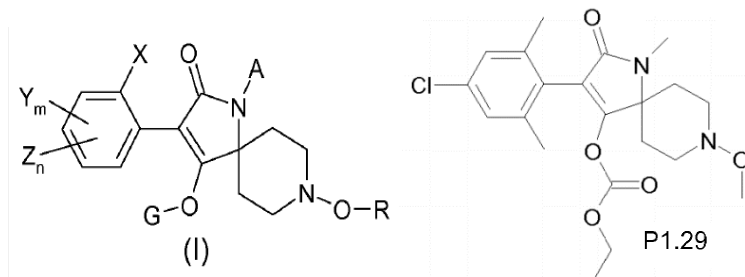
## 3. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 22 de diciembre de 2016 que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de prioridad.

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

| Ítem | Documento                  | Título                                                                                     | Fecha de Publicación  |
|------|----------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------|
| D1   | WO2010066780               | “Spiroheterocyclic n-oxypiperidines as pesticides”                                         | 17 de junio de 2010   |
| D4   | Olenik, B. y Thielking, G. | “Polymorphism and the Organic Solid State: Influence on the Optimization of Agrochemicals” | 15 de octubre de 2012 |

D1<sup>1</sup> divulga compuestos de fórmula (I), con actividad pesticida, entre los que se encuentra el compuesto P1.29 (Reivindicación 1, Pág. 141).



<sup>1</sup>[https://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=2010066780A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20100617&DB=&locale=en\\_EP](https://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=2010066780A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20100617&DB=&locale=en_EP)

Oficio N° 11204 de 18 de julio de 2022

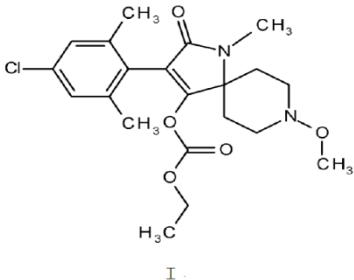
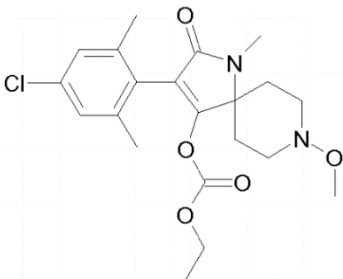
Ref. Expediente N° NC2019/0006687

D4<sup>2</sup> enseña la importancia del polimorfismo en el diseño de productos agroquímicos y su influencia directa en propiedades que incluyen comportamientos de fusión, velocidades de disolución, liberación de sustancias y biodisponibilidad. El documento también se refiere a las técnicas utilizadas para caracterizar los diferentes polimorfos de agroquímicos y la patentabilidad de los polimorfos, con base en un ejemplo de un agroquímico (Pág. 249, Introducción, Pág. 270, Resumen).

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

La reivindicación 1 consiste en: “Un polimorfo cristalino del compuesto de fórmula I (...)” (Radicado N° NC2019/0006687 del 3 de septiembre de 2020).

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

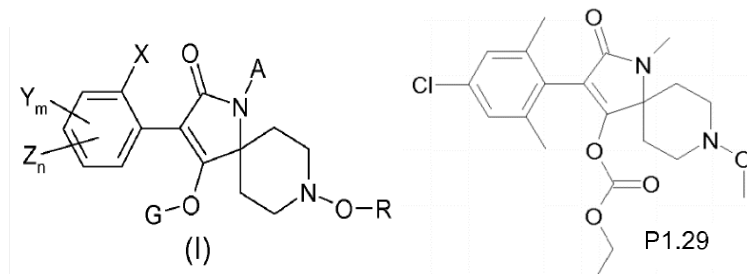
| Características esenciales                                                                                                                                                                                                                                                                           | D1                                                                                                                                 | D4                                                                                                                                                                                                                                          |
|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| Polimorfo cristalino del compuesto de fórmula I<br><br>I.                                                                                                                                                         | Compuesto de fórmula I<br><br>(Pág. 141, P1.29) | Fundamentos teóricos del polimorfismo en agroquímicos y su caracterización analítica.<br><br>(Pág. 249, Introducción)                                                                                                                       |
| Patrón de difracción de rayos X de polvo que comprende valores de ángulo 2θ a 9.4 ± 0.2, 10.3 ± 0.2, 8.1 ± 0.2, 11.6 ± 0.2, 12.0 ± 0.2, 13.9 ± 0.2, 14.8 ± 0.2, 16.0 ± 0.2, 18.2 ± 0.2, 18.8 ± 0.2, 20.4 ± 0.2, 20.6 ± 0.2, 21.2 ± 0.2, 21.7 ± 0.2, 21.9 ± 0.2, 22.1 ± 0.2, 22.4 ± 0.2 y 23.4 ± 0.2. | -----                                                                                                                              | Técnicas utilizadas para caracterizar los diferentes polimorfos de agroquímicos; termogravimetría, calorimetría de barrido diferencial, espectroscopia IR y Raman y análisis por difracción de rayos X<br><br>(Pág. 255- 268, Sección 10.3) |

D1 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga derivados de pirrolidina diona espiroheterocíclica sustituida con N-alquilamida de formula (I), procesos para prepararlos, composiciones pesticidas, insecticidas, acaricidas, molusquicidas y nematocidas que los comprenden y métodos para combatir y controlar plagas tales como: insectos, ácaros, moluscos y nematodos (Pág. 1, Línea 1 -5). Entre los compuestos de fórmula (I) se incluye el compuesto 1.29 (Pág. 141). Los compuestos de fórmula (I), sus tautómeros, y sus sales, pueden obtenerse también en forma de hidratos o incluir otros disolventes, por ejemplo los que hayan sido utilizado para la cristalización de compuestos que están presentes en forma sólida (Pág. 28, Línea 28-31). El compuesto P1.29 mostro actividad contra *Myzus persicae* (Pág. 161, 168)

<sup>2</sup>Olenik, B. y Thielking, G. (2012). Polymorphism and the Organic Solid State: Influence on the Optimization of Agrochemicals. Capítulo 10, pp 249-272. <https://doi.org/10.1002/9783527655908.ch10>

Oficio N° 11204 de 18 de julio de 2022

Ref. Expediente N° NC2019/0006687



La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1 y el compuesto de D1 consiste en que la solicitud menciona específicamente un polimorfo cristalino del compuesto de fórmula I, caracterizado por XRPD.

No obstante, no es posible establecer un efecto técnico asociado al polimorfo cristalino del compuesto de fórmula I, ya que las pruebas de estabilidad del polimorfo se realizan comparando contra la “*Forma A de Referencia*” (Pág. 51), y no contra el sólido amorfo.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿Cómo modificar el compuesto conocido en D1 para proporcionar el compuesto en otras formas sólidas alternativas?

Sin embargo, el estado de la técnica D4 ya enseña que el estado sólido y especialmente el polimorfismo de los agroquímicos es de suma importancia. El conocimiento de la estabilidad termodinámica y fisicoquímica constituye una herramienta que respalda el diseño de productos agroquímicos. Teniendo en cuenta que la protección de cultivos moderna implica la creación de productos de alta tecnología, el diseño de agroquímicos modernos de estado sólido es esencial para maximizar la calidad del producto (Pág. 270, Sección 10.5). De acuerdo con D4 las diferencias en las redes cristalinas de ingredientes activos como los agroquímicos son responsables de las diversas propiedades físico-químicas que influyen en importantes características tales como solubilidad, estabilidad termodinámica y mecánica, puntos de fusión, higroscopicidad, densidad y hábitos cristalinos. En consecuencia, la elección de una forma cristalina óptima es necesaria para impartir una influencia temprana en el desarrollo de procesos y formulaciones, y para crear agroquímicos utilizables (Pág. 250, Sección 10.2.1). De acuerdo con D4 generalmente, el sistema desea escapar de la sobresaturación lo más rápido como sea posible, y por lo tanto acepta la formación de una estructura cristalina que no es necesariamente la ideal y la transformación en la forma termodinámicamente más estable puede ocurrir más tarde, lo que se conoce como maduración de Ostwald (Pág. 255, Sección 10.2.4). D4 también divulga una descripción de las técnicas utilizadas para caracterizar los diferentes polimorfos de agroquímicos entre las que se encuentran: Análisis Térmico Diferencial y Calorimetría Diferencial de Barrido (DSC), termogravimetría, espectroscopia IR y Raman, y difracción de rayos X entre otros (Pág. 255-268, Sección 10.3).

De acuerdo con lo anterior, el polimorfo cristalino del compuesto de fórmula I, aunque es nuevo, por no encontrarse divulgado su espectro XRPD, se deriva de manera evidente de la naturaleza del estado sólido del compuesto 1, por la propiedad que tiene para formar nuevos polimorfos; lo cual es de amplio conocimiento en el estado de la técnica.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, estaría motivada a aplicar los conocimientos que se tienen sobre polimorfismo revelados en D4



Oficio N° 11204 de 18 de julio de 2022

Ref. Expediente N° NC2019/0006687

en el compuesto de D1, para así llegar al objeto de la reivindicación 1. Por lo cual se considera obvia.

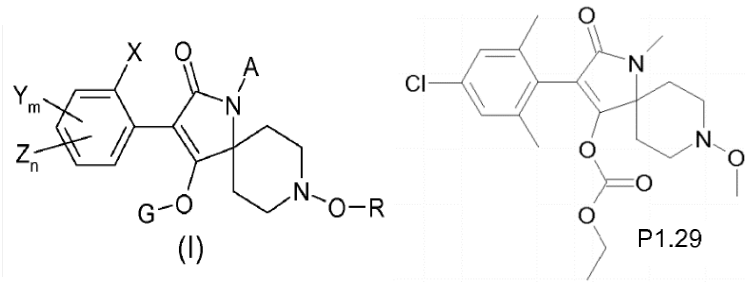
Dado que las reivindicaciones dependientes 2 a 3 no presentan alguna característica adicional que conceda nivel inventivo al polimorfo cristalino del compuesto de fórmula I de la reivindicación 1, se considera que tampoco tienen nivel inventivo.

La reivindicación 4 consiste en: *“Una composición agrícola que comprende (...)”* (Radicado N° NC2019/0006687 del 3 de septiembre de 2020).

**Tabla 2.** Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

| Características esenciales                                                | D1                                                                                                      | D4                                                                                                                     |
|---------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| Composición agrícola                                                      | Composición plaguicida<br><br>(Reivindicación 4)                                                        | Importancia del polimorfismo en formulaciones de compuestos activos agroquímicos.<br><br>(Pág. 255- 268, Sección 10.3) |
| Polimorfo según se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 | Compuesto de fórmula que incluye el compuesto P1. 29 (Espiropidion)<br><br>(Reivindicación 4, Pág. 141) |                                                                                                                        |
| Al menos un portador o diluyente aceptable en agricultura                 | Adyuvantes de formulación<br><br>(Reivindicación 4)                                                     | -----                                                                                                                  |

D1 es considerado como el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 4, ya que divulga una composición plaguicida que comprende el compuesto de fórmula I, que incluye el compuesto P1.29 y adyuvantes de formulación (Reivindicación 4, Pág. 141).



La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 4 y la composición divulgada en D1 consiste en incluir el polimorfo cristalino del compuesto de fórmula (I).

No hay evidencia de que incluir el polimorfo cristalino del compuesto de fórmula (I) proporcione algún efecto técnico diferente al que ya proporciona la composición que comprende el compuesto de D1.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿Cómo modificar la composición conocida en D1 para proporcionar composiciones alternativas?

Sin embargo, el estado de la técnica D4 enseña la optimización de las formulaciones agroquímicas, con la incorporación de polimorfos cristalinos y mediante el mejoramiento del control de proceso de cristalización de los ingredientes activos (Pág. 250, Sección 10.2.1, Pág. 251 Sección 10.2.3).

Oficio N° 11204 de 18 de julio de 2022

Ref. Expediente N° NC2019/0006687

En consecuencia, la persona normalmente versada en la materia estaría motivada a incluir otras formas sólidas del compuesto 1.29 (Espiropidion) de D4, en la composición de D1, para así llegar al objeto de la reivindicación 4. Por lo cual se considera obvia.

## 5. 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   | WO2010066780               | 1 a 4                      | Nivel inventivo      |
| D4   | Olenik, B. y Thielking, G. | 1 a 4                      | Nivel inventivo      |

## 6. Respuesta a los argumentos del solicitante

### Argumentos respecto a la claridad

El solicitante sostiene que “(...) respetuosamente manifiesto mi desacuerdo ya que la Reivindicación 1 no caracteriza el polimorfo mencionando solamente porque éste es un cristal, sino que por el contrario define los elementos técnicos relativos a los picos característicos del patrón de difracción de Rayos X en polvo (DRXP).”

Se aclara la objeción de claridad sobre la reivindicación 1, se refiere a que para la correcta caracterización de un polimorfo es necesario incluir además de los picos característicos del patrón de difracción de rayos X en polvo (DRXP), la caracterización por el método DSC y, opcionalmente, uno o más de DTA, TGA o HSM; y al menos uno de los métodos espectroscópicos. Se sugiere realizar las modificaciones de acuerdo con el sustento presente en la descripción.

### Argumentos respecto a la suficiencia

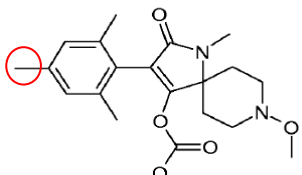
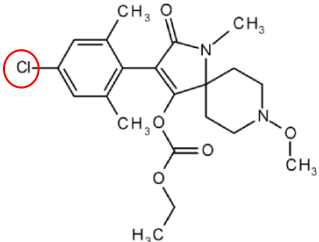
El solicitante sostiene que “Así, a partir de la divulgación de la presente invención el versado en la materia estará en la capacidad de preparar el compuesto denominado “Forma A” de la presente invención, conociendo la información sobre la preparación de los compuestos que divulga WO 2010/066780, para subsecuentemente preparar el polimorfo de la invención de conformidad con el ejemplo 1 de la presente Descripción.”

Esta Oficina aclara que persiste el requerimiento por falta de suficiencia del capítulo descriptivo, porque la divulgación de la invención no es lo suficientemente clara y completa para su comprensión y para que una persona capacitada en la materia técnica correspondiente pueda ejecutarla; porque dentro de la Descripción no existe la referencia a todas las etapas y condiciones del desarrollo del polimorfo cristalino que se reclama; la descripción debió ser redactada con suficiente detalle para que pueda ser reproducida. La descripción de la presente solicitud menciona que el “polimorfo de Forma A se obtuvo mediante el proceso divulgado en WO2010/066780 y que a partir de dicho proceso se obtiene un cristal en forma de agujas denominado A” (Pág. 51), sin embargo, en el documento citado no se encuentra el desarrollo de un proceso específico para sintetizar el compuesto P1.29, D1 en el ejemplo 1 solo describe una ruta sintética general para preparar compuestos de fórmula I en la tabla P1 y se refiere específicamente a la preparación del compuesto P1.2, que es estructuralmente diferente al P1.29, adicionalmente D1 menciona al finalizar la síntesis que: “La suspensión se agitó a 0°C durante una hora. La mezcla de reacción se diluyó con acetato de etilo y agua, las capas

Oficio N° 11204 de 18 de julio de 2022

Ref. Expediente N° NC2019/0006687

se separaron, la fase acuosa se extrajo con acetato de etilo, las fases orgánicas combinadas se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron. El residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo/heptano 5:1), (Pág. 120, Ejemplo 1, Paso 2); claramente el documento no sugiere una etapa de cristalización del compuesto, sino la purificación por cromatografía, por lo que la persona del oficio versada en la materia no tendría los elementos suficientes para reproducir la invención y no es claro cuáles son los materiales de partida, los solventes, las etapas y las condiciones para preparar específicamente el polimorfo mencionado en la presente solicitud.

| Compuesto <b>P1.2</b><br>WO2010/066780                                                                             | Compuesto de <b>Formula I</b><br>(Solicitud actual)                                 |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------|
| <br>(Pág. 120, Ejemplo1, Paso 2) |  |

Argumentos respecto a D1

El solicitante manifiesta que “Por lo tanto, no hay una enseñanza clara e inequívoca en D1 que motive a la preparación del polimorfo específico reivindicado en la presente solicitud; esto es, más allá del hecho que el compuesto preparado en D1 sea un cristal (Ver página 51 de la presente Descripción), D1 no enseña ni sugiere que el compuesto espiropidion pudiera cristalizar en más de una forma cristalina y mucho menos en una forma cristalina con propiedades de estabilidad superiores a la forma A de referencia, como reclama mí representada.”

Es oportuno aclarar que el Solicitante tiene razón al afirmar que D1 no sugiere específicamente una forma cristalina del espiropidion (Compuesto P1.29-D1, Pág. 141). No obstante si menciona que “Los compuestos de fórmula (I), sus tautómeros, y sus sales, pueden obtenerse también en forma de hidratos o incluir otros disolventes, por ejemplo los que hayan sido utilizado para la cristalización de compuestos que están presentes en forma sólida” (Pág. 28, Línea 28-31); y también indica que “Las mezclas de diastereómeros o las mezclas de racematos de los compuestos I, en forma libre o en forma de sal, que pueden obtenerse según los materiales de partida y los procedimientos elegidos, pueden separarse de manera conocida en los diastereómeros o racematos puros en la base de las diferencias fisicoquímicas de los componentes, por ejemplo por cristalización fraccionada, destilación o cromatografía.” (Pág. 27, Línea 33-35, Pág. 28, Línea 1,2); luego D1 si sugiere que los compuestos de Formula (I) pueden cristalizar. También es importante mencionar que D1 no anticipa en su totalidad el polimorfo cristalino del compuesto de formula (I) que se está reclamando, por lo tanto, el documento es empleado para evaluar el nivel inventivo y no la novedad de la presente solicitud.

Argumentos respecto a D3

Oficio N° 11204 de 18 de julio de 2022

Ref. Expediente N° NC2019/0006687

El solicitante manifiesta que *“No obstante, el documento D3 no supe las deficiencias de D1 ya mencionadas, y por lo tanto no hace que la invención sea obvia o evidente a partir de sus enseñanzas. (...) Es de anotar también que, como ya se explicó en detalle en este memorial, a partir de D3 no podría haberse anticipado que el compuesto de fórmula I podría exhibir una serie de formas sólidas y por lo tanto las enseñanzas en cuanto a la estabilidad de una forma cristalina en un sistema no llevaría a “certeza clara y manifiesta de la que no se puede dudar” sobre la existencia de una forma cristalina adicional de dicho compuesto”*.

Se aclara que, D3 se empleó para evaluar el nivel inventivo en el examen de patentabilidad en el Oficio N° 1022 de 29 de enero de 2021. Teniendo en cuenta el memorial de respuesta (Radicado N° NC2019/0006687 del 16 de junio de 2021), y tras realizar una nueva búsqueda, se evalúa el nivel inventivo de la presente solicitud, empleando D1 y D4 como se observa en el numeral 5 del presente Oficio.

#### **Argumentos respecto a nivel inventivo**

El solicitante argumenta que *“Esto es, el hecho que la identificación de polimorfos sea una práctica conocida en el campo técnico no implica que salte a la vista la existencia de una serie de formas cristalinas de un compuesto específico, en donde una forma particular de dicha serie de formas cristalinas se identifique como más estable, ni tampoco que haya certeza clara y manifiesta de la existencia de una serie de formas cristalinas de ese compuesto y que una de estas sea más estable.”*

Esta oficina aclara que para una persona versada en la materia no sería sorprendente obtener formas polimórficas que presenten mayor estabilidad entre ellas, puesto que la obtención de las formas más estables corresponde a un trabajo rutinario en la síntesis de estos compuestos y los hallazgos en relación a características fisicoquímicas del polimorfo cristalino del compuesto de fórmula I, son el resultado de un trabajo rutinario, en el cual el objetivo del investigador consiste en determinar las propiedades fisicoquímicas del compuesto de la presente solicitud, y el efecto de sus formas sólidas en las propiedades fisicoquímicas del activo, para seleccionar aquella que eventualmente pueda representar una ventaja industrial. Por tal razón es evidente para una persona normalmente versada en la materia que diferentes formas cristalinas presentan diferentes estabildades; de tal forma que el efecto señalado por el solicitante no es sorprendente, y por lo tanto la solicitud carece de nivel inventivo.

El solicitante afirma que *“(...) el previo conocimiento de técnicas de cristalización no hace de ningún modo que exista certeza sobre la existencia de una serie de formas cristalinas del compuesto espiropidion, menos aún de una forma cristalina de este compuesto con estabilidad mejorada. (...) me permito reiterar, como ya indiqué durante el trámite de esta invención, que la invención definida en la Reivindicación 1 sí tiene un efecto técnico derivado de las características técnicas que la diferencian del arte previo más cercano. Dicho efecto se demuestra en la Descripción de la presente invención”*

Esta oficina aclara que no es posible establecer el efecto técnico asociado al polimorfo cristalino del compuesto de fórmula I que se está reclamando en la presente solicitud, porque los resultados obtenidos en las pruebas de estabilidad de los polimorfos no se comparan con la forma amorfa; sino que solo determinan la estabilidad de una forma cristalina respecto de otra y adicionalmente se menciona que *“Los patrones de XRD en polvo de los cristales aislados a partir de experimentos realizados a todas las temperaturas mostraron que las reflexiones características de la Forma A de Referencia*



Oficio N° 11204 de 18 de julio de 2022

Ref. Expediente N° NC2019/0006687

*estuvieron ausentes.*" (Pág. 53, Línea 1-4) y se concluye que el polimorfo de la invención es la forma estable en el intervalo de temperatura estudiado; no obstante no es claro cuáles fueron los resultados obtenidos con la Forma A y como se llega a la conclusión de que el polimorfo de la solicitud es la forma más estable sin mencionar específicamente que cambios experimento la Forma A que la vuelven inestable. Por lo que frente a las enseñanzas del documento D1 el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención sería proporcionar otras formas sólidas alternativas del compuesto 1, no obtener formas sólidas más estables. Asimismo es importante mencionar que así se evidenciara el efecto de estabilidad mejorada, este no sería sorprendente, puesto que la obtención de formas cristalinas estables corresponde a un trabajo rutinario en la obtención de polimorfos, teniendo en cuenta que D4 enseña que las diferencias en las redes cristalinas de ingredientes activos como los agroquímicos son responsables de las diversas propiedades físico-químicas que influyen en importantes características tales como solubilidad, estabilidad termodinámica y mecánica, puntos de fusión, higroscopicidad, densidad y hábitos cristalinos. En consecuencia, la elección de una forma cristalina óptima es necesaria para impartir una influencia temprana en el desarrollo de procesos y formulaciones, y para crear agroquímicos utilizables (Pág. 250, Sección 10.2.1). Por lo que la afectación por nivel inventivo con los documentos D1 y D4 es pertinente.

*El solicitante sostiene que "Específicamente, el polimorfo de la presente invención se prepara bajo condiciones específicas de cristalización que consisten en el empleo de una solución de metilciclohexano caliente (85 a 90 °C), que seguidamente se somete a un periodo largo de enfriamiento (de 3 a 6 meses). Estas condiciones no se enseñan ni se sugieren en el documento D1, ya que este documento no muestra en lo absoluto que el compuesto de fórmula I podría exhibir una serie de formas sólidas, menos aún que precisamente una forma cristalina preparada bajo las condiciones específicas antes mencionadas exhibiría propiedades de estabilidad térmica mejorada frente al compuesto 1.29 de D1 (Forma de Referencia A en la presente invención)."*

Esta Oficina aclara que las condiciones de cristalización no están siendo reclamadas en el capítulo reivindicatorio estudiado (radicado N° NC2019/0006687 del 3 de septiembre de 2020.); por lo cual no son objeto de comparación con el estado de la técnica. No obstante, tal como lo afirma el solicitante estas condiciones no se enseñan, ni sugieren el documento D1, por lo que se reitera la falta de sustento en la descripción de la presente solicitud al mencionar en el ejemplo *"El compuesto de fórmula I se preparó de acuerdo con los métodos descritos en el documento WO 2010/066780. Este método conduce a la producción con forma de aguja fina del polimorfo de Forma A de Referencia en los ejemplos como material de partida la Forma A"* (Pág. 51); cuando en realidad el documento D1 no proporciona ninguna guía para la obtención de una forma cristalina del compuesto 1.29.

El solicitante afirma que *"(...) D1 no enseña que el compuesto de fórmula I podría exhibir más de una forma sólida, ni tampoco las condiciones necesarias para lograr un polimorfo tal como el reivindicado por mí representada. D3 tampoco enseña ni sugiere que exista más de una forma sólida para el compuesto de fórmula I; por lo tanto, el arte previo no aporta indicaciones que pudieran inducir a la persona del oficio normalmente versada en la materia técnica a lograr el polimorfo reclamado en la presente Reivindicación 1, por lo tanto el mismo cumple el requisito de nivel inventivo, tal y como lo ha señalado ese Despacho en el aparte citado."*



Oficio N° 11204 de 18 de julio de 2022

Ref. Expediente N° NC2019/0006687

Se reitera que, D3 se empleó para evaluar el nivel inventivo en el examen de patentabilidad en el Oficio N° 1022 de 29 de enero de 2021. Teniendo en cuenta el memorial de respuesta (Radicado N° NC2019/0006687 del 16 de junio de 2021), y tras realizar una nueva búsqueda, persiste la falta de nivel inventivo de la presente solicitud, y este es afectado con los documentos D1 y D4 que son pertinentes para afectar la patentabilidad del polimorfo cristalino del compuesto de fórmula I, porque D1 ya había dado a conocer el compuesto 1 (Pág. 141, Compuesto.29), su actividad pesticida/insecticida y su aplicación en el tratamiento de plagas (Pág. 161-168) y en combinación con el documento D4, que si bien no enseña de manera puntual el polimorfo cristalino reclamado en la presente solicitud, sí señala la importancia del polimorfismo en los compuestos activos agroquímicos (Pág. 249) así como las propiedades que pueden tener dichos cristales (Pág. 250, Sección 10.2.1). De tal manera que no es posible concluir que la identificación de una nueva forma cristalina envuelva actividad inventiva, como quiera que la molécula misma ya había sido sintetizada con anterioridad y que la capacidad de tener distintas formas cristalinas es una propiedad intrínseca de dicho compuesto como lo sugiere D1 y como se enseña en D4 (Pág. 251, 252, Sección 10.2.3.1); es decir, la identificación polimorfo cristalino del compuesto de fórmula I de la solicitud se considera obvia y, en consecuencia, no tiene 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.

Si como respuesta a este requerimiento, el solicitante modifica el 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 de esta Superintendencia. De igual forma, deberá tener presente que de conformidad con el literal a) del numeral 1.2.2.5.1. de la norma ibidem, será necesario acreditar el pago de la tasa por concepto de modificación a solicitudes en trámites, de conformidad con el valor establecido en la resolución de tasas vigentes.

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.



Edna Marcela Ramirez Orozco  
**DIRECTORA DE NUEVAS CREACIONES**



Oficio N° 11204 de 18 de julio de 2022

Ref. Expediente N° NC2019/0006687

**INFORME DE BÚSQUEDA**  
**EXAMEN DE PATENTABILIDAD**

|                                                     |   |                                |   |           |   |                                        |   |        |  |
|-----------------------------------------------------|---|--------------------------------|---|-----------|---|----------------------------------------|---|--------|--|
| Solicitud No.                                       |   | Examen de patentabilidad       |   |           |   |                                        |   |        |  |
| NC2019/0006687                                      |   | 1°                             |   | 2°        |   | 3°                                     | X | Revoca |  |
| Solicitud Internacional No.                         |   | Fecha solicitud internacional: |   |           |   |                                        |   |        |  |
| PCT/EP2017/082983                                   |   | 15 de diciembre de 2017        |   |           |   |                                        |   |        |  |
| Fecha de determinación estado de la técnica         |   |                                |   | Prioridad |   | Presentación                           |   |        |  |
| 22 de diciembre de 2016                             |   |                                |   | X         |   |                                        |   |        |  |
| Solicitante                                         |   |                                |   |           |   |                                        |   |        |  |
| SYNGENTA PARTICIPATIONS AG                          |   |                                |   |           |   |                                        |   |        |  |
| Reivindicaciones que no son objeto de búsqueda por: |   |                                |   |           |   |                                        |   |        |  |
| Art. 14                                             | - | Art. 15                        | - | Art. 20   | - | Art. 25 (Falta de unidad de invención) |   | -      |  |

|                                             |                                                                                                                                                                         |
|---------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| CRITERIOS DE BÚSQUEDA                       |                                                                                                                                                                         |
| Reivindicaciones objeto de búsqueda         | 1 a 4                                                                                                                                                                   |
| Palabras clave utilizadas                   | Búsqueda por estructura, polymorphs, spiroheterocyclic pyrrolidine diones, Spiropidion, crystalline form, polymorphic form, spiroheterocyclic, crystalline Polymorphism |
| Clasificaciones utilizadas para la búsqueda | CIP: C07D 401/04                                                                                                                                                        |
|                                             | CPC:                                                                                                                                                                    |

|                                                                                                                                                                                                                                                                       |                                                                       |                                                                                                                                                                                                                                                              |                                        |                                                               |                                               |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------|---------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------|
| DOCUMENTOS CONSIDERADOS RELEVANTES<br>(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 <sup>(1)</sup> | Fecha de Publicación /Presentación (DD/MM/AAAA)                                                                                                                                                                                                              | Reivindicaciones /Secuencias afectadas | Citas relevantes del estado de la técnica                     | Categoría del documento citado <sup>(2)</sup> |
| SIPI                                                                                                                                                                                                                                                                  | NC2019/0006673                                                        | 21/06/2016                                                                                                                                                                                                                                                   | -                                      | -                                                             | A, P                                          |
| ISA/EPO                                                                                                                                                                                                                                                               | WO2010066780                                                          | 17/06/2010                                                                                                                                                                                                                                                   | 1 a 4                                  | (Reivindicación 1, 3, 8, Pág. 1, Línea 3-7, Pág. 28, Pág.141) | Y                                             |
|                                                                                                                                                                                                                                                                       | WO2014187846                                                          | 27/11/2014                                                                                                                                                                                                                                                   | -                                      | -                                                             | A                                             |
| Derwent                                                                                                                                                                                                                                                               | WO2009049851                                                          | 23/04/2009                                                                                                                                                                                                                                                   | -                                      | -                                                             | A                                             |
|                                                                                                                                                                                                                                                                       | US20150216166                                                         | 6/08/2015                                                                                                                                                                                                                                                    | -                                      | -                                                             | A                                             |
| Google Patents                                                                                                                                                                                                                                                        | WO2013192035                                                          | 27/12/2013                                                                                                                                                                                                                                                   | -                                      | -                                                             | A                                             |
| STNext                                                                                                                                                                                                                                                                | Olenik, B. y Thielking, G. (1)                                        | 15/10/2012                                                                                                                                                                                                                                                   | 1 a 4                                  | (Todo el documento)                                           | Y                                             |
| Patbase                                                                                                                                                                                                                                                               | US6114540                                                             | 5/09/2000                                                                                                                                                                                                                                                    | -                                      | -                                                             | A                                             |
|                                                                                                                                                                                                                                                                       | WO2013079564                                                          | 06/06/2013                                                                                                                                                                                                                                                   | -                                      | -                                                             | A                                             |
| Orbit                                                                                                                                                                                                                                                                 | US20080207588                                                         | 28/08/2008                                                                                                                                                                                                                                                   | -                                      | -                                                             | A                                             |
|                                                                                                                                                                                                                                                                       | US8580962                                                             | 12/11/2013                                                                                                                                                                                                                                                   | -                                      | -                                                             | A                                             |
| <sup>(1)</sup> Cita completa literatura no patente (LNP)<br><br>Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. Nombre de la revista. Volumen(Número), pp-pp.<br>O<br>Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. Nombre de la revista. Recuperado de http://xxxxxxx. |                                                                       | (1)Olenik, B. y Thielking, G. (2012). Polymorphism and the Organic Solid State: Influence on the Optimization of Agrochemicals. Capítulo 10, pp 249-272. <a href="https://doi.org/10.1002/9783527655908.ch10">https://doi.org/10.1002/9783527655908.ch10</a> |                                        |                                                               |                                               |

Oficio N° 11204 de 18 de julio de 2022

Ref. Expediente N° NC2019/0006687

| (2) Categorías de documentos citados                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |
|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| <p>“A” Documento que define el estado general de la técnica no considerado como particularmente relevante.</p> <p>“E” Solicitud de patente o patente anterior pero publicada en la fecha de presentación internacional o en fecha posterior.</p> <p>“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 otra cita, siempre van acompañados de una explicación, por la cual se citan.</p> <p>“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> <p>“P” Documento publicado antes de la fecha de presentación internacional pero con posterioridad a la fecha de prioridad reivindicada.</p> | <p>“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.</p> <p>“X” Documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse nueva o que implique una actividad inventiva por referencia al documento aisladamente considerado.</p> <p>“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.</p> |
| Fecha del reporte de búsqueda: (14/07/2022)                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |