

Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA		SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO No. 11-036583- -00003-0000 Fecha: 2012-03-20 16:26:41 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 7	
1 SOLICITUD DE: ☐ Corrección de Error Material ☒ Modificación a una solicitud			
2 SOLICITANTE		Nombre: TAKEDA PHARMACEUTICAL COMPANY LIMITED sociedad constituida y existente bajo las leyes de Japón. Dirección: 1-1, Doshomachi 4-chome, Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka, Japón Domicilio: Osaka, Japón Teléfono: 546 09 70 Fax: 249 40 70 E-mail: clientes@cavelier.com IDENTIFICACION C.C. ☐ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Número: _____	
3 REPRESENTANTE O APODERADO		Nombre: LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ Dirección: Carrera 4ª. No. 72-35 Teléfono: 347 36 11 Fax: 211 86 50 E-mail: clientes@cavelier.com Domicilio: Bogotá, Colombia. IDENTIFICACIÓN C.C. ☒ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Cual _____ Número <u>35.456.344</u> T. P. <u>23.555</u>	
4 Número de expediente: <u>11.036.583</u>			
5 Descripción de la corrección o modificación solicitada: Presento nuevas páginas 17, 30, 88 y 101 de los capítulos descriptivo y reivindicatorio, en las cuales se han realizado correcciones de errores tipográficos. Por lo tanto, solicito a ese Despacho tener en cuenta estas página al momento de realizar el examen de patentabilidad.			
6 Comprobante de pago No. <u>12-0024901</u> Fecha: <u>12 de marzo de 2012</u>			
7 Anexos ☒ Comprobante de pago de la tasa por \$120.000, por concepto de modificaciones. ☐ Comprobante de pago por reivindicaciones adicionales después de la décima reivindicación por ☐ Poderes, si fuere el caso ☐ Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.			

8

NOMBRE: LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ

FIRMA: Luz Clemencia de Páez

C.C. 35.456.344 de Usaquén T.P.A. 23.555

JGG

hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alcoxi C₁₋₆ opcionalmente sustituido con halógeno, preferiblemente particular, un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alcoxi C₁₋₆.

[0043]

R² de la fórmula (Ia-2) es un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido con halógeno o un grupo alcoxi C₁₋₆ opcionalmente sustituido con halógeno. Como R² de la fórmula (Ia-2) se prefiere un grupo alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido con halógeno o un grupo alcoxi C₁₋₆ opcionalmente sustituido con halógeno, preferiblemente particular, un grupo alquilo C₁₋₆ o un grupo alcoxi C₁₋₆.

[0044]

R⁴ de la fórmula (Ib) es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido con halógeno. Como R⁴ se prefiere un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido con halógeno, preferiblemente particular, un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁₋₆.

R⁵ de la fórmula (Ib) es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido con halógeno o un grupo alcoxi C₁₋₆ opcionalmente sustituido con halógeno. Como R⁵ se prefiere un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido con halógeno, preferiblemente particular, un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C₁₋₆.

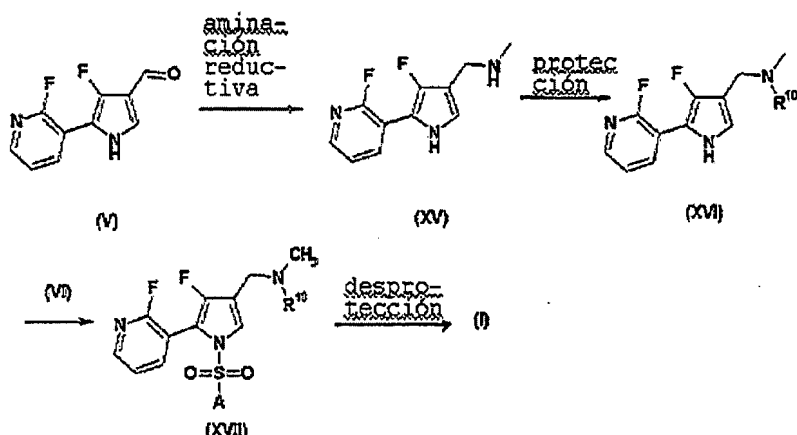
[0045]

R⁶ de la fórmula (Ic) es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido con halógeno. Como R⁶ se prefiere un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido con halógeno, preferiblemente particular, un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁₋₆.

R⁷ de la fórmula (Ic) es un átomo de hidrógeno o un

con metilamina protegida por Boc, etc., seguido de desprotección y similares. Adicionalmente, también se puede producir el compuesto (I) de acuerdo con el siguiente método.

[0080]



[0081]

Se puede producir el compuesto (XV) tal como se definió con anterioridad a partir del compuesto (V) de acuerdo con un método similar ^{despro-}atección para producir el compuesto (I) a partir del compuesto (VII).

[0082]

Se puede producir el compuesto (XVI), en donde R¹⁰ es un grupo protector de amino, al proteger el grupo amino del compuesto (XV). Los ejemplos del grupo protector de amino incluyen, pero sin limitación particular, un grupo tert-butoxicarbonilo (grupo BOC), un grupo benciloxicarbonilo (grupo Cbz), un grupo 2,4-dimetoxibencilo y similares. Esta reacción de protección se puede llevar a cabo de acuerdo con un método conocido per se, por ejemplo, el método descrito en Protective Groups in Organic Synthesis, 3rd Ed., Theodora W. Greene, Peter G. M. Wuts, pp. 494-653, Wiley-Interscience (1999) y similares.

[0083]

Se puede producir el compuesto (XVII), en donde cada símbolo es tal como se definió con anterioridad, a partir del compuesto (XVI) de acuerdo con un método similar al método para producir el compuesto (VII) a partir del compuesto (V).

[0084]

Clorhidrato de 1-{4-fluoro-5-(2-fluoropiridin-3-il)-1-[(4-metilpiridin-2-il)sulfonil]-1H-pirrol-3-il}-N-metilmetanamina (751 mg) se disuelve en hidrógeno carbonato de sodio acuoso saturado y se extrae dos veces con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se lavan con solución salina saturada, se secan sobre sulfato de magnesio anhidro y se concentran bajo presión reducida para dar el compuesto del título como un aceite de color amarillo pálido (rendimiento de 647 mg, 95%).

¹H-RMN (CDCl₃) δ: 2.38 (3H, s), 2.45 (3H, s), 3.64 (2H, s), 7.23-7.30 (2H, m), 7.33 (1H, d, J = 5.7Hz), 7.36 (1H, s), 7.88 (1H, ddd, J = 9.3, 7.4, 1.9Hz), 8.22-8.29 (1H, m), 8.45 (1H, d, J = 4.5Hz), 1H no detectado.

[0197]

Ejemplo 22

1-{4-Fluoro-5-(2-fluoropiridin-3-il)-1-[(5-fluoropiridin-3-il)sulfonil]-1H-pirrol-3-il}-N-metilmetanamina

Clorhidrato de 1-{4-fluoro-5-(2-fluoropiridin-3-il)-1-[(5-fluoropiridin-3-il)sulfonil]-1H-pirrol-3-il}-N-metilmetanamina (780 mg) se disuelve en hidrógeno carbonato de sodio acuoso saturado y la mezcla se extrae dos veces con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se lavan con solución salina saturada, se secan sobre sulfato de magnesio anhidro y se concentran bajo presión reducida. El residuo se purifica por cromatografía en columna de gel de sílice básica (eluyente: hexano-acetato de etilo = 3:1→3:7) para dar el compuesto del título como un aceite de color amarillo pálido (rendimiento de 619 mg, 87%).

¹H-RMN (CDCl₃) δ: 2.46 (3H, s), 3.65 (2H, s), 7.28-7.36 (2H, m), 7.41 (1H, dt, J = 7.3, 2.2Hz), 7.80 (1H, ddd, J = 9.2, 7.4, 2.0Hz), 8.28-8.39 (1H, m), 8.48 (1H, s), 8.68 (1H, d, J = 2.6Hz), 1H no detectado.

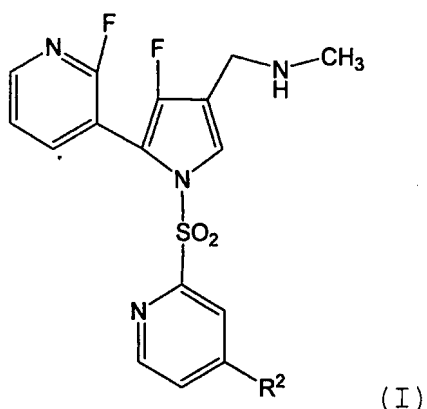
[0198]

Ejemplo 23

Fumarato de 1-{4-Fluoro-5-(2-fluoropiridin-3-il)-1-[(4-metilpiridin-2-il)sulfonil]-1H-pirrol-3-il}-N-metilmetanamina

Reivindicaciones

1. Un compuesto representado por la fórmula (I)



en donde R^2 es un átomo de halógeno, un grupo alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido con halógeno o un grupo alcoxí C_{1-6} opcionalmente sustituido con halógeno, o una sal del mismo.

2. El compuesto de la reivindicación 1, en donde R^2 es un grupo alquilo C_{1-6} o un grupo alcoxí C_{1-6} o una sal del mismo.

3. 1-{4-Fluoro-5-(2-fluoropiridin-3-il)-1-[(4-metilpiridin-2-il)sulfonil]-1H-pirrol-3-il}-N-metilmetanamina o una sal de la misma.

4. 1-{4-Fluoro-5-(2-fluoropiridin-3-il)-1-[(4-metoxipiridin-2-il)sulfonil]-1H-pirrol-3-il}-N-metilmetanamina o una sal de la misma.

5. Un profármaco del compuesto de la reivindicación 1 o una sal del mismo.

6. Una composición farmacéutica que comprende el compuesto de la reivindicación 1 o una sal del mismo o un profármaco del mismo.

7. La composición farmacéutica de la reivindicación 6, que es un inhibidor de la secreción ácida.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -



RECIBO DE CAJA

No. 12 - 0024901

Bogotá D.C., Marzo 12 de 2012 - 07:29:37

RECIBIDO DE : CAVELIER ABOGADOS NI 860.041.367

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	157717630	09/03/2012	64.070.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICACIONES EN CREACION CORRECCION A SOLICITUD EN TRAMITE / MODIFICA	120.000.00	120.000.00
				\$120.000.00

SON: **CIENTO VEINTE MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-036583- -00003-0000

Fecha: 2012-03-20 16:26:41 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 7

Colo: 14656-841-073-3.

Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C.- Colombia

Web: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Línea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

Marzo 12 de 2012 - 07:29:49