


Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

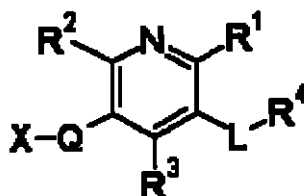
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad 06-050514-00001-0000
Fec: 2008-06-01 16:43.13 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra. 11 PATENTEYII
Cve. 378 FASINACIONALI
Act 329 CTOINFORMACION
Folios. 11

FORMULARIO UNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES
2000-F03

1		SOLICITUD DE	
☐ Corrección de Error Material		☒ Modificación a una solicitud	
2 SOLICITANTE	Nombre TAKEDA PHARMACEUTICAL COMPANY LIMITED		IDENTIFICACION C C ☐ NIT ☐ C E ☐ Otro ☐ Número _____
	Dirección 1-1, Doshomachi 4-chome, Chuo-Ku, Osaka-shi Osaka 5410045 Japón		
	Domicilio , Osaka 5410045 Japón		
	Lugar de Constitución Japón		
	Teléfono 546 09 70	Fax 547 31 70	
	E-mail clientes@camyp.com		
3 REPRESENTANTE O APODERADO	Nombre Emilio FERRERO		IDENTIFICACION C C ☒ NIT ☐ C E ☐ Otro ☐ Número <u>438.019 TP 31 929</u>
	Dirección Carrera 4ª No 72-35		
	Teléfono 347 38 11		
	Fax 211 88 50		
	E-mail caveller@caveller.com		
4 Número de expediente <u>06 050 514</u>			
5 Descripción de la corrección o modificación solicitada Presento nuevo capítulo reivindicatorio compuesto por 17 reivindicaciones. Adicionalmente, presento copia de las páginas 33, 46, 78 y 179 donde se han realizado correcciones de carácter tipográfico. Por lo tanto, solicito que se realice el examen de patentabilidad sobre este nuevo capítulo reivindicatorio.			
6 Comprobante de pago No. <u>06-38.495</u> Fecha <u>22 de mayo de 2008</u>			
7 Anexos ☒ Comprobante de pago de la tasa por \$ 95 000 ☐ Poderes, si fuere el caso ☐ Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas			
8 NOMBRE EMILIO FERRERO FIRMA  G.C 438 019 de Usaquén T.P.A 31 929			

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto representado por la fórmula



caracterizado por que

R¹ y R² son iguales o diferentes y cada uno es un grupo de hidrocarburo opcionalmente sustituido o un grupo hidroxilo opcionalmente sustituido;

R³ es un grupo aromático opcionalmente sustituido;

R⁴ es un grupo amino opcionalmente sustituido;

L es un grupo de hidrocarburo de cadena bivalente;

Q es un enlace o un grupo hidrocarburo de cadena bivalente; y

X es un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo acilo, un grupo hidroxilo sustituido, un grupo tiol opcionalmente sustituido, un grupo amino opcionalmente sustituido o un grupo cíclico opcionalmente sustituido;

con la condición que

cuando X es un grupo etoxicarbonilo, entonces Q es un grupo hidrocarburo de cadena bivalente, y el compuesto no es

2,6-diisopropil-3-metilaminometil-4-(4-fluorofenil)-5-pentilpiridina;

2,6-diisopropil-3-aminometil-4-(4-fluorofenil)-5-pentilpiridina;

2,6-diisopropil-3-(dimetilamino)metil-4-(4-fluorofenil)-5-pentilpiridina;

2,6-diisopropil-3-(etilamino)metil-4-(4-fluorofenil)-5-

856

pentilpiridina; y

3-(terc-butildimetilsililoximetil)-2,6-diisopropil-4-(4-fluorofenil)-5-(indolil-5-aminometil)piridina;
o una sal del mismo.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado por que R^1 y R^2 son iguales o diferentes y cada uno es un grupo hidrocarburo opcionalmente sustituido, y X es un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo acilo, un grupo hidroxilo sustituido, un grupo tiol opcionalmente sustituido o un grupo cíclico opcionalmente sustituido.

3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado por que el grupo acilo para X es un grupo carbonilo.

4. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado por que R^1 y R^2 son iguales o diferentes y cada uno es un grupo alquilo C_{1-10} opcionalmente sustituido por 1 a 3 sustituyente(s) seleccionados de un grupo cicloalquilo C_{3-10} , un grupo alcoxycarbonilo C_{1-6} y un grupo alcoxilo C_{1-6} .

5. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado por que R^3 es un grupo arilo C_{6-14} opcionalmente sustituido por 1 a 3 sustituyente(s) seleccionado(s) de un grupo alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido por 1 a 3 átomo(s) halógenos y un átomo halógeno.

6. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado por que R^4 es un grupo amino.

7. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado por que L es un grupo alquileno C_{1-10} .

8. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado por que Q es un enlace.

857

9. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado por que X es un grupo acilo, un grupo hidroxilo sustituido, un grupo tiol opcionalmente sustituido o un grupo amino opcionalmente sustituido.

10. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado por que X es un grupo carbonilo.

11. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado por que es ácido 5-(aminometil)-2-metil-4-(4-metilfenil)-6-neopentilnicotínico;

ácido 5-(aminometil)-6-isobutil-2-metil-4-(4-metilfenil)nicotínico;

metil 3-{[5-(aminometil)-6-isobutil-2-metil-4-(4-metilfenil)piridin-3-il]metoxi}-1-metil-1H-pirazol-4-carboxilato;

{[2-isobutil-6-metil-4-(4-metilfenil)-5-(2-morfolin-4-il-2-oxoetil)piridin-3-il]metil}amina;

metil 3-([5-(aminometil)-6-isobutil-2-metil-4-(4-metilfenil)piridin-3-il]acetil)amino)benzoato;

N-[5-(aminometil)-6-isobutil-2-metil-4-(4-metilfenil)piridin-3-il]isoxazol-4-carboxamida,
o una sal del mismo.

12. Una prodroga caracterizada por que es de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o una sal del mismo.

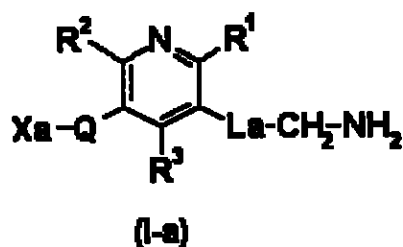
13. Un agente farmacéutico caracterizado por que comprende un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o una sal del mismo o una prodroga del mismo.

14. Un agente farmacéutico de acuerdo con la reivindicación 13, caracterizado por que es un agente para profilaxis o tratamiento de diabetes, complicaciones diabéticas, tolerancia a glucosa disminuída u obesidad.

15. Un inhibidor de peptidasa caracterizado por que comprende un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o una sal del mismo o una prodroga del mismo.

16. Un inhibidor de acuerdo con la reivindicación 15, caracterizado por que la dipeptidil peptidasa es dipeptidasa-IV.

17. Un método de producción de un compuesto representado por la fórmula



caracterizado por que

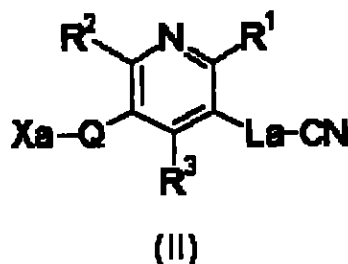
R^1 , R^2 , R^3 y Q

son iguales a los definidos en la reivindicación 1;

La es un enlace o un grupo de hidrocarburo de cadena bivalente;
y

Xa es un átomo de hidrógeno, un grupo nitro, un grupo acilo, un grupo hidroxilo sustituido, un grupo tiol opcionalmente sustituido, un grupo amino opcionalmente sustituido o un grupo cíclico opcionalmente sustituido;

o una sal del mismo que comprende someter un compuesto representado por la fórmula



en donde cada símbolo es igual al definido anteriormente, o una

sal del mismo a una reacción de reducción.

CH=CH-, -CH=CH-CH₂-, -CH=CH-CH₂-CH₂-, -C(CH₃)₂-CH=CH-, -CH₂-CH=CH-CH₂-, -CH₂-CH₂-CH=CH-, -CH=CH-CH=CH-, -CH=CH-CH₂-CH₂-CH₂-);

(3) un grupo alquinileno C₂₋₁₀ (por ejemplo, -C≡C-, -CH₂-C≡C-, -CH₂-C≡C-CH₂-CH₂-)

y lo similar.

El "grupo hidrocarburo de cadena bivalente" es preferentemente un grupo alquileno C₁₋₁₀ o un grupo alquenileno C₂₋₁₀, más preferentemente -CH₂-, -(CH₂)₂-, -CH=CH- y lo similar.

L es preferentemente un grupo alquileno C₁₋₁₀, más preferentemente -CH₂- y lo similar.

Q es preferentemente un enlace, un grupo alquileno C₁₋₁₀ o un grupo alquenileno C₂₋₁₀, más preferentemente un enlace, -CH₂-, -(CH₂)₂-, -CH=CH- y lo similar. Q es preferentemente en particular un enlace.

Como "grupo acilo" para X, por ejemplo, un grupo representado por la fórmula: -COR⁵, -CO-OR⁵, -SO₂R⁵, -SOR⁵, -PO₃R⁵R⁶, -CO-NR^{5a}R^{6a}, -C-NR^{5a}R^{6a} [en donde R⁵ y R⁶ son iguales o diferentes y cada uno es un átomo de hidrógeno, un grupo hidrocarburo opcionalmente sustituido o un grupo heterocíclico opcionalmente sustituido; R^{5a} y R^{6a} son iguales o diferentes y cada uno es un átomo de hidrógeno, un grupo hidrocarburo opcionalmente sustituido o un grupo

(35) un grupo heterocíclico aromático (por ejemplo, tienil, furil, piridil, oxazolil, tiazolil, tetrazolil, quinolil, indolil)-aralquiloxi C₇₋₁₁-carbonilo (por ejemplo, tetrazolilbenciloxicarbonilo);

(36) un grupo heterocíclico aromático (por ejemplo, tienil, furil, piridil, tiazolil, oxazolil, indolil)-carbamoilo (por ejemplo, tienilcarbamoilo, furilcarbamoilo, tiazolilcarbamoilo, oxazolilcarbamoilo) opcionalmente sustituido por 1 a 3 sustituyente(s) seleccionado(s) de un grupo carbonilo, un grupo alcoxycarbonilo C₁₋₆ y un grupo carbamoilo;

y lo similar puede mencionarse.

El "grupo acilo" para X es preferentemente

- (1) un grupo carbonilo;
- (2) un grupo carbamoilo;
- (3) un grupo alcoxycarbonilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido por 1 a 3 sustituyente(s) seleccionado(s) de un grupo carbonilo, un grupo carbamoilo, un grupo tiocarbamoilo, un grupo alcoxycarbonilo C₁₋₆ y un grupo alquil C₁₋₆-carboniloxilo (por ejemplo, metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, propoxycarbonilo, terc-butoxycarbonilo, carboximetoxycarbonilo, carboxietoxycarbonilo, carboxibutoxycarbonilo, carbamoilmetoxycarbonilo, tiocarbamoilmetoxycarbonilo, etoxycarbonilmetoxycarbonilo, etoxycarboniletoxycarbonilo, metoxycarbonilbutoxycarbonilo, etoxycarbonilbutoxycarbonilo;

inorgánicos convencionalmente usados como materiales para preparaciones farmacéuticas se utilizan como un portador farmacológicamente aceptable que es agregado como excipiente, lubricante, aglomerante, desintegrador para preparaciones sólidas; y solvente, auxiliar de disolución, agente de suspensión, agente de isotonización, agente de amortiguación, agente suavizante y lo similar para preparaciones líquidas. Cuando sea necesario, puede usarse un aditivo para preparaciones farmacéuticas tal como conservante, antioxidante, agente colorante, agente endulcorante y lo similar.

Los ejemplos preferibles del vehículo incluyen lactosa, sacarosa, D-manitol, D-sorbitol, almidón, almidón pregelatinizado, dextrina, celulosa cristalina, hidroxipropil celulosa sustituida inferior, carboximetilcelulosa de sodio, acacia pulverizada, pullulan, anhídrido silícico ligero, silicato de aluminio sintético, metasilicato de aluminio de magnesio y lo similar.

Los ejemplos preferibles del lubricante incluyen estearato de magnesio, estearato de calcio, talco, sílice coloidal y lo similar.

Los ejemplos preferibles del aglomerante incluyen almidón pregelatinizado, sacarosa, gelatina, acacia pulverizada, metilcelulosa, carboximetilcelulosa, carboximetilcelulosa de sodio, celulosa cristalina, sacarosa,

2) Dihidrocloruro de 2-Etoxi-1-metil-2-oxoetil 5-(aminometil)-2-metil-4-(4-metilfenil)-6-neopentilnicotinato (0,16 g; rendimiento 85%) fue obtenido como polvo blanco de 2-etoxi-1-metil-2-oxoetil 5-[[[(terc-butoxicarbonil)amino]metil]-2-metil-4-(4-metilfenil)-6-neopentilnicotinato (0,2 g; 0,38 mmol) según un método similar al método del Ejemplo 22-2).

¹H-RMN (DMSO-d₆) δ:1,02 (9 H; s); 1,06 (3H; d; J = 7,0 Hz); 1,16 (3H; t; J = 7,1 Hz); 2,37 (3H; s); 2,58 (3H; s); 2,95 (2H; s); 3,88 (2H; s); 4,11 (2H; q; J = 7,0 Hz); 4,77 (1H; q; J = 7,1 Hz); 7,13-7,16 (1H; m); 7,23-7,32 (3H; m); 8,24 (3H; s).

Ejemplo 39

dihidrocloruro de (5-metil-2-oxo-1,3-dioxol-4-il)metil 5-(aminometil)-2-metil-4-(4-metilfenil)-6-neopentilnicotinato

1) (5-metil-2-oxo-1,3-dioxol-4-il)metil 5-[[[(terc-butoxicarbonil)amino]metil]-2-metil-4-(4-metilfenil)-6-neopentilnicotinato (0,9 g; rendimiento 73%) fue obtenido como polvo blanco de ácido 5-[[[(terc-butoxicarbonil)amino]metil]-2-metil-4-(4-metilfenil)-6-neopentilnicotínico (1,0 g; 2,3 mmol) y 4-clorometil-5-metil-1,3-dioxol-2-ona (0,42 g; 2,8 mmol) según un método similar al método del Ejemplo 33-1).

¹H-RMN (CDCl₃) δ:1,01 (9H; s); 1,36 (9H; s); 1,97 (3H; s); 2,39

864

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 06-050514-00001-0000
Fec: 2006-06-01 16:43:13 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra. 11 PATENTEYII
Cve: 378 FASCNACIONALI
Act 328 CTOINFORMACION Folios: 11

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 06 - 38,495
FECHA : MAYO 22 DE 2006

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	54982577	22/05/2006	34,522,500.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LEYAS COMERCIALES	95,000.00
		TOTAL :	\$ 95,000.00

SON: NOVENTA Y CINCO MIL PESOS



RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Colo 14656- 841-009-7

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCI

Folio 865

2020
Bogotá D.C.,

Doctor(a)
FERRERO EMILIO
Apoderado(a) y/o Representante de
TAKEDA PHARMACEUTICAL COMPANY LIMITED

REFERENCIA	Radicación No.	06 50514
	Solicitud internacional	JP2004/016457
	Fecha inicio fase nacional	31/05/2006
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	416
	Oficio No.	1088
	Folios	1

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, el Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), el Reglamento y la Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de Comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial.

Cúmplase
Dado en Bogotá DC, 29 AGO 2006

ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

adpa1