



No. 13-122437- -00003-0000

Fecha: 2013-08-12 17:12:44 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 412 REPOSPRESRECU Folios: 18

Señor Superintendente
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y CO
E. S. D.

Tramite : 011
Actuación : 378
Evento : 412

Referencia : Expediente No. 13.122.437
Asunto : Solicitud de para: **COMPUESTO DE 1-{4-FLUORO-5-(2-FLUOROPIRIDIN-3-IL)-1-[(4-METOXIPYRIDIN-2-IL)SULFONIL]-1H-PIRROL-3-IL}-N-METILMETANAMINA**
Solicitante : **TAKEDA PHARMACEUTICAL COMPANY LIMITED**
Fecha de Solicitud : 25 de marzo de 2011

I. RECURSO VÍA GUBERNATIVA

Yo, Luz Clemencia DE PÁEZ, en mi condición de apoderada de la sociedad **TAKEDA PHARMACEUTICAL COMPANY LIMITED** solicitante de la patente de la referencia, por el presente escrito atentamente manifiesto a usted que debidamente notificada de la Resolución No. **38469** del 27 de junio de 2013, interpongo en su contra el recurso de **REPOSICIÓN**, para que sea revocada y en consecuencia se conceda el privilegio de patente de invención para **"COMPUESTO DE 1-{4-FLUORO-5-(2-FLUOROPYRIDIN-3-IL)-1-[(4-METOXIPYRIDIN-2-IL)SULFONIL]-1H-PIRROL-3-IL}-N-METILMETANAMINA"** a favor de **TAKEDA PHARMACEUTICAL COMPANY LIMITED**.

II. OPORTUNIDAD DE LA IMPUGNACION

La Resolución No. **38469** del 27 de junio de 2013, desfijado el dos (2) de Agosto de dos mil trece (2013), por lo que el término para interponer el recurso de reposición vence el doce (12) de Agosto de dos mil trece (2013)). En consecuencia, me encuentro dentro de la oportunidad legal.

"EXCELENCIA LEGAL EN UN MUNDO SIN FRONTERAS"

BOGOTÁ - Edificio Siski - Carrera 4 No. 72 - 35 - Tel. (57-1) 347 3611 - Fax (57-1) 211 8650 - Fax in U.S.A. (1-305) 675 7743 - COLOMBIA
MEDELLÍN - San Fernando Plaza - Carrera 43 A No. 1 - 50 - Torre Protección Oficina 652 - Tel: (57-4) 604 4794 Ext. 6729 / 6731 - Fax: (57-4) 604 4731 - COLOMBIA

www.cavelier.com
cavelier@cavelier.com

III. LA DECISION RECURRIDA

3.1 Mediante la Resolución objeto de la presente impugnación, el Superintendente de Industria y Comercio decidió:

3.1.1 “La división de la solicitud propuesta (13-122437), no procede comoquiera que la solicitud fraccionaria contiene la misma materia del capítulo reivindicatorio originalmente presentado para la solicitud parental (...), por lo que no requiere un nuevo estudio de patentabilidad ya que no corresponde a un concepto inventivo diferente al estudiado y que por otra parte, no fue requerido por falta de unidad de invención.

3.1.2 “En virtud de lo anterior, se rechaza la solicitud divisional de la solicitud inicialmente propuesta, teniendo en cuenta que es contraria a la normativa aplicable”.

IV. OBJETO DEL RECURSO

De acuerdo con los argumentos que expongo a continuación, solicito atentamente a su Despacho lo siguiente:

1. Revocar la Resolución No. **38469** del 27 de junio de 2013.
2. Conceder el privilegio de patente de invención para **“COMPUESTO DE 1-(4-FLUORO-5-(2-FLUOROPIRIDIN-3-IL)-1-[(4-METOXIPIRIDIN-2-IL)SULFONIL]-1H-PIRROL-3-IL)-N-METILMETANAMINA”** a favor de **TAKEDA PHARMACEUTICAL COMPANY LIMITED**.

V. FUNDAMENTOS DEL RECURSO

Respetuosamente me permito disentir de lo expuesto por ese Despacho en la Resolución objeto del presente recurso, ya que se ha proferido una decisión que carece de sustento jurídico válido, y vulnera el Derecho al debido Proceso de mi representada.

La anterior afirmación tiene plena justificación jurídica, por cuanto se ha desconocido lo dispuesto por el artículo 36 de la decisión 486 de la Comunidad Andina, tal y como se expone a continuación:

5.1 Requisitos para solicitar la división de una solicitud de Patente:

5.1.1. El artículo 36 de la Decisión 486 de la Comunidad Andina, única norma que regula la materia en Colombia, establece lo siguiente:

“El solicitante podrá, en cualquier momento del trámite, dividir su solicitud en dos o más fraccionarias, pero ninguna de estas podrá implicar una ampliación de la protección que corresponda a la divulgación contenida en la solicitud inicial...

“(Subrayado fuera de texto).

“Cada solicitud fraccionaria se beneficiará de la fecha de presentación y, en su caso, de la fecha de prioridad de la solicitud inicial...”.

¡A efectos de la división de la solicitud, el solicitante consignará los documentos que fuesen necesarios para formar las solicitudes fraccionarias correspondientes”.

Adicional a lo anterior, la Superintendencia de Industria y Comercio exige como requisito adicional para realizar este trámite el pago de una tasa de CUATROSCIENTOS CINCUENTA MIL PESOS (\$450.000)M/Cte. (Resolución N° 173 de 2013 de la Superintendencia de Industria y Comercio)

5.1.2. A partir de lo anterior, es posible concluir que existen cuatro requisitos para que una solicitud divisional sea aceptada, se le asigne número de radicación, y se le dé trámite:

5.1.2.1 Que se presente durante el trámite de la solicitud.

5.1.2.2 Que la materia que protege no amplíe la materia de la solicitud inicial.

5.1.2.3 Que se presenten los documentos necesarios para formar su expediente.

5.1.2.4 Que se pague la tasa correspondiente.

En consecuencia, a continuación procederemos a demostrar que la solicitud divisional que se rechaza en la resolución impugnada cumplió con todos los requisitos establecidos para que la misma sea aceptada por nuestra legislación.

5.1.2.1. Que se presente durante el trámite de la solicitud

La ley aplicable establece un límite temporal para solicitar la división de una solicitud de patente, esto es, que la misma sea presentada “en cualquier momento del trámite”. Por lo cual se debe entender que una solicitud divisional es presentada oportunamente siempre que la solicitud parental de la cual se deriva la misma se encuentre en trámite.

Una solicitud de patente se encuentra en trámite desde la fecha en que es presentada ante la Superintendencia de Industria y Comercio y hasta la fecha en la cual esta entidad profiere una decisión final otorgando la patente o confirmando su negativa, al resolver el recurso de reposición correspondiente.

En virtud de lo anterior, cabe resaltar que incluso los casos en los cuales la solicitud de patente es negada por la Superintendencia de Industria y Comercio, y el solicitante ha recurrido esta decisión mediante recurso oportunamente interpuesto, el trámite de dicho recurso forma parte del trámite de la solicitud de patente, el cual culmina al momento de proferirse una decisión en relación con el recurso de reposición agotando con ello la vía gubernativa.

El requisito de la oportunidad en la presentación de la solicitud divisional se cumplió entonces en el presente caso, toda vez que dicha solicitud divisional se presentó ante su Despacho mediante escrito No. 11-036583-00007-0000 del 17 de mayo de 2013 en respuesta a la acción oficial No. 2951 emitida en la solicitud parental No. 11-036583. De tal manera que, es claro que la solicitud divisional de la referencia fue oportunamente propuesta.

Por lo tanto, procederemos a verificar el cumplimiento de los demás requisitos legales existentes para aceptar, asignar número de radicación y dar trámite a una solicitud divisional.

5.1.2.2. Que la materia que protege no amplíe la materia de la solicitud inicial

Para la verificación de este requisito es necesario transcribir nuevamente la objeción formulada por su Despacho para rechazar la divisional, la cual se encuentra en el considerando TERCERO de la resolución impugnada:

“Que en este caso la división de la solicitud propuesta 13-122437 no procede como quiera que la solicitud fraccionaria contiene la misma materia del capítulo reivindicatorio originalmente presentado para la solicitud parental radicado bajo el No. 11-036583-00003-0000 del 20 de marzo de 2011 y que fue rectificada mediante escrito radicado bajo el No. 11-036583-00007-0000 del 17 de mayo de 2013, por lo que no requiere un nuevo estudio de patentabilidad ya que no corresponde a un concepto inventivo diferente al estudiado y que por otra parte, no fue requerido por falta de unidad de invención”.

Así entonces es claro que la objeción formulada a la divisional no estuvo sustentada en la ampliación de la materia de invención reivindicada en la misma frente a la solicitud inicial. Por lo tanto, es claro que la materia incluida en la solicitud divisional no es contraria a la normativa aplicable.

Lo anterior significa que limitada como está la competencia de la Administración a aquello que le está expresamente permitido, el rechazo de una solicitud divisional con base en que la misma tiene una materia idéntica a la solicitud inicial viola el artículo 6° de la Constitución por exceder la competencia dada en el artículo 36 de la Decisión 486.

De otro lado, vale la pena resaltar que si bien en la solicitud parental No. 11 036583 no se objetó la falta de unidad de invención, es claro que el solicitante puede presentar una solicitud divisional con el fin de superar una objeción formulada por falta de unidad de invención o de forma voluntaria. Lo anterior, toda vez que el artículo 36 de la Decisión 486 únicamente exige que la solicitud divisional no amplíe la protección que corresponda a la divulgación contenida en la solicitud parental inicial y por lo tanto, la objeción formulada a este respecto no es de recibo en el presente caso.

5.1.2.3. Que se allegue los documentos necesarios para formar su expediente

Cabe recordar que el día 17 de mayo de 2013, junto con el formulario de conversión, división, y fusión de solicitudes por medio del cual se solicitó la presente

divisional, se presentó el texto completo de la solicitud, y el documento de poder con el cual acredité mi calidad de representante.

Con lo anterior se tiene que efectivamente en su momento se allegaron a este Despacho todos los documentos necesarios para formar la correspondiente solicitud divisional, dando con ello cumplimiento al tercer requisito.

5.1.2.4. Que se pague la tasa correspondiente

Reiterando lo mencionado anteriormente, y tal y como se puede constatar en el expediente que se encuentra en su Despacho, el día de presentación de la solicitud de división se presentó junto con ésta el recibo de pago N° 13-0043155, acreditando el pago de una suma total de CUATROSCIENTOS CINCUENTA MIL PESOS (\$450.000)M/Cte., a favor de la Nación – Superintendencia de Industria y Comercio, el cual corresponde a la tasa establecida para el trámite de solicitud de divisional para el presente año 2013. (Resolución N° 173 de 2013 de la Superintendencia de Industria y Comercio)

Respetuosamente solicitamos al Despacho tener en cuenta que el pago de una tasa está justificado en función de una actuación administrativa. De tal manera que, el pago debe bien derivar en la aceptación de la petición del solicitante o en su devolución, con base en un fundamento legal valido y dentro de la órbita de su competencia. Toda vez que la petición se adecua a la ley, y que su despacho no tiene competencia para rechazar por identidad de materia una solicitud divisional, en el presente caso resulta forzoso para la administración la aceptación de la petición, esto es, aceptar la divisional y darle trámite a la misma.

5.1.3. Todo lo anteriormente afirmado, conlleva a la conclusión de que si se observa lo dispuesto por el artículo 36 de la Decisión 486 de la Comunidad Andina, se debió aceptar la división de la solicitud de patente, y con ello el contenido de la misma debió ser examinado, teniendo en cuenta que: 1) la solicitud inicial aún se encontraba en trámite, 2) la materia contenida en la solicitud divisional no amplió la materia reivindicada en la solicitud inicial, 3) el solicitante allegó los documentos necesarios para formar la correspondiente solicitud divisional, y 4) se pagó la tasa correspondiente al trámite.

Adicionalmente, me permito reiterar que en ningún momento el artículo 36 hace mención a las diferencias o similitudes existentes entre la solicitud inicial y la solicitud de división de la misma, por lo que este criterio a la luz de la norma carece de relevancia para efectos de la admisión o rechazo de una divisional.

5.3. Violación del Derecho al Debido Proceso de mi representado

Por otro lado, me permito citar un aparte del artículo N° 29 de la Constitución Política de Colombia, al tenor del cual se lee que:

“El debido proceso se aplicará a toda clase de actuaciones judiciales y administrativas”.

En este sentido, y al haber esta corporación rechazado de plano mi solicitud radicada el pasado 17 de mayo de 2013, sin existir bases legales para ello tal y como se evidenció en puntos anteriores, se ha producido una vulneración del derecho al debido proceso de mi representada, por cuanto se le ha negado la posibilidad de que sobre la presente solicitud se lleve a cabo el procedimiento usual dentro del cual se conserva la expectativa de obtener un derecho de patente sobre dicha solicitud. En este punto cabe resaltar que dentro de dicho procedimiento al solicitante le es posible realizar modificaciones conducentes a obtener el beneficio de patente, todo lo cual hace parte del debido proceso, y en el presente caso no se le ha reconocido a mi representada.

5.4. Modificaciones a la presente solicitud de división

Debido a un error involuntario en la definición del compuesto de ésta solicitud divisional, el cual consistió en transcribir el compuesto “metil” en vez de “metoxi” en 1-{4-fluoro-5-(2-fluoropiridin-3-il)-1-[(4-metilpiridin-2-il)sulfonil]-1H-pirrol-3-il}-N metilmetanamina, y razón por la cual el señor Examinador denegó ésta solicitud al ser idéntica a la solicitud original, se procedió a corregir el error y por tanto, se presenta un nuevo capítulo reivindicatorio conformado por 2 reivindicaciones. Con base en dicha modificación, se altera el título de la presente solicitud divisional a:

“COMPUESTO DE 1-{4-FLUORO-5-(2-FLUOROPIRIDIN-3-IL)-1-[(4-METOXIPIRIDIN-2-IL)SULFONIL]-1H-PIRROL-3-IL}-N-METILMETANAMINA”

En relación a las dos reivindicaciones que conforman el actual pliego reivindicatorio de esta solicitud divisional, se le informa al señor Examinador que dichas reivindicaciones corresponden a las reivindicaciones 4 y 5 de la patente Europea equivalente a ésta solicitud No. EP2318390 (B1) (ver anexo), las cuales reivindican el compuesto 1-{4-FLUORO-5-(2-FLUOROPIRIDIN-3-IL)-1-[(4-METOXIPIRIDIN-2-

IL)SULFONIL]-1H-PIRROL-3-IL}-N-METILMETANAMINA en lugar de 1-{4-FLUORO-5-(2-FLUOROPIRIDIN-3-IL)-1-[(4-METILPIRIDIN-2-IL)SULFONIL]-1H-PIRROL-3-IL}-N-METILMETANAMINA incluido en el pliego reivindicatorio de la solicitud parental. De esta manera, es claro que el nuevo pliego reivindicatorio de la solicitud parental no se superpone a la materia de invención reivindicada en la solicitud parental No. 11.036.583.

Con la anterior modificación realizada a la presente solicitud, mediante la cual se asegura que difiere de la materia protegida por la solicitud inicial y que igualmente no amplía la materia de la misma, se espera que el presente Despacho le realice el debido examen de patentabilidad, en consecuencia de cumplir con las normas anteriormente discutidas.

En adición a los argumentos presentados, se pone de presente que la materia de invención contenida en la presente solicitud divisional ha sido otorgada por otras oficinas de patentes del mundo, tal como la Oficina Europea la cual concedió la solicitud No. EP2318390 (B1) arriba mencionada.

Si bien es cierto que cada país es autónomo en conceder o negar el privilegio de patente para una solicitud, también es cierto que los requisitos de concesión de dichos privilegios son universales, esto es, novedad, nivel inventivo y aplicación industrial, como también la forma de evaluarlos. Así las cosas, el hecho de que la misma solicitud cumpla con los mencionados requisitos en diferentes países, como se mencionó anteriormente, es un claro indicio de la patentabilidad de la materia de invención reivindicada en la presente solicitud divisional.

VI. PETICIÓN

Por todo lo anterior, solicito a ese Despacho lo siguiente:

- 6.1.** Que al considerar las razones precedentes se revoque la decisión contenida en la Resolución N° 38469 del 27 de Junio de 2013, en cuando resuelve rechazar la división de la solicitud de patente de invención N° 13.122.437, y en consecuencia que se acepte la misma y se le dé trámite.

VII. PRUEBAS

Solicito atentamente a ese Despacho se tengan como pruebas las siguientes:

- 7.1.** Todos y cada uno de los documentos que obran en el expediente de la referencia y que reposan en las oficinas del Despacho a su cargo.

VIII. NOMBRE Y DIRECCION

El nombre y la dirección de la sociedad recurrente son los siguientes:

TAKEDA PHARMACEUTICAL COMPANY LIMITED

1-1, Doshomachi 4-chome, Chuo-ku,
Osaka-shi,
Osaka
Japón

IX. NOTIFICACIONES

Atentamente manifiesto a usted que recibiré notificaciones en la Secretaría de su Despacho o en mi oficina de abogada situada en la Carrera 4ª. No. 72-35, piso 4º, de esta ciudad de Bogotá, D.C.

X. ANEXOS

- Nuevo pliego reivindicatorio con un total de 2 reivindicaciones
- Copia del pliego reivindicatorio de la patente Europea: EP2318390 (B1)
- Tasa oficial por modificación voluntaria, equivalente a \$ 125.000

Señor Superintendente,


LUZ CLEMENCIA DE PAEZ
C.C. 35.456.344 de Usaquén
T.P.A. N° 23.555

COLO-14656-0841-118-6
AHAAHA\ID-248883\WPC14656
No. M-2013-248883\AHA

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA	Espacio reservado para el adhesivo de radicación
---	--

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES
MODIFICACIONES Y/O CORRECCIONES

1. Identificación del Trámite

☐ Error material ☒ Modificación a una Solicitud en trámite

☒ Patente de Invención

☐ Patente de Modelo de Utilidad

☐ Registro de Diseño Industrial

☐ Esquema de Trazado de Circuitos Integrados

2. Datos del solicitante

Persona Natural ☐ Persona Jurídica ☒

TAKEDA PHARMACEUTICAL COMPANY LIMITED

Nombre o denominación / Nombre o razón social completa

Nombre representante legal

Tipo de empresa Micro ☐ Pequeña ☐ Mediana ☐ Otra ☐

Documento de identificación: ☐ C.C. ☐ C.E. ☐ NIT ☐ Otro Número _____

Nacionalidad/País de constitución	Dirección y domicilio del titular	Ciudad
Japón	1-1, Doshomachi 4-chome, Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka, 5410045, Japón.	Osaka
Dirección electrónica	No. Fax	Número telefónico
clientes@cavelier.com	2 11 86 50	3 47 36 11

☐ Autorizo expresamente a la Superintendencia de Industria y Comercio para que todas las comunicaciones sean enviadas a través de la dirección de correo electrónico

3. Datos del apoderado:

Apellidos y Nombre De Páez Luz Clemencia	Documento de identificación C.C. 35.456.344	Tarjeta profesional T.P.A. 23.555
---	--	--------------------------------------

Dirección y domicilio	Ciudad	
Carrera 4ª No. 72 –35	Bogotá	
Dirección electrónica	No. Fax	Número telefónico
cavelier@cavelier.com	2 11 86 50	3 47 36 11

En caso de haber presentado poder general para asuntos que se adelanten ante la Delegatura de Propiedad Industrial, sírvase indicar el número de su radicación o protocolo de poder general

4. Datos del trámite**Corrección:****Expediente No 13.122.437****Aparece****Debe ser****Modificación:****Modificación al capítulo reivindicatorio.**

Presento nuevo capítulo reivindicatorio compuesto por 2 reivindicaciones con el fin de superar las objeciones hechas por Su Despacho a la presente solicitud de patente y pido respetuosamente que el examen de patentabilidad sea realizado sobre estas nuevas reivindicaciones presentadas.

Respetuosamente manifiesto que a pesar de eliminar materia del pliego reivindicatorio originalmente presentado, mi representada no renuncia a la protección que pueda obtener sobre dicha materia y además se reserva el derecho de presentar una solicitud divisional que la contenga durante el trámite de la presente solicitud, beneficiándose de la fecha de prioridad inicialmente reivindicada.

**Modificación al capítulo descriptivo.****Modificación al resumen.****Modificación a los dibujos.****5. Anexos**

Comprobante de pago de la tasa para la presentación de la corrección y/o modificación por \$125.000.



Poder, si fuere el caso.



Documento que contiene las modificaciones o correcciones.



Copia de la solicitud y sus anexos en formato magnético.

6. Firma	
Nombre y apellidos LUZ CLEMENCIA DE PAEZ	Firma <i>Luz Clemencia De Paez</i>
C.C. 35.456.344 DE Usaquén	Tarjeta Profesional 23.555

an AHAI\AHAINCA\ID-AF248978\WPC14656

REIVINDICACIONES DIVISIONAL

1. Un compuesto que es 1-{4-fluoro-5-(2-fluoropiridin-3-il)-1-[(4-metoxipiridin-2-il)sulfonyl]-1H-pirrol-3-il}-N-metilmetanamina o una sal de la misma.
2. Una composición farmacéutica que comprende el compuesto de la reivindicación 1 o una sal farmacéuticamente aceptable.

AHA\AHA\ID-248878\WPC14656



(11) **EP 2 318 390 B1**

(12) **EUROPEAN PATENT SPECIFICATION**

- (45) Date of publication and mention of the grant of the patent:
01.05.2013 Bulletin 2013/18

(21) Application number: **09788053.8**

(22) Date of filing: **26.08.2009**
- (51) Int Cl.:
C07D 401/14 (2006.01) A61K 31/444 (2006.01)

(86) International application number:
PCT/JP2009/065279

(87) International publication number:
WO 2010/024451 (04.03.2010 Gazette 2010/09)

(54) **PYRROLE COMPOUNDS**
PYRROLVERBINDUNGEN
COMPOSÉS PYRROLE

(84) Designated Contracting States: AT BE BG CH CY CZ DE DK EE ES FI FR GB GR HR HU IE IS IT LI LT LU LV MC MK MT NL NO PL PT RO SE SI SK SM TR Designated Extension States: AL BA RS (30) Priority: 27.08.2008 JP 2008218851 17.10.2008 JP 2008269099 (43) Date of publication of application: 11.05.2011 Bulletin 2011/19 (73) Proprietor: Takeda Pharmaceutical Company Limited Osaka 541-0045 (JP) (72) Inventors: • NISHIDA, Haruyuki Osaka-shi Osaka 532-8686 (JP)	• ARIKAWA, Yasuyoshi Osaka-shi Osaka 532-8686 (JP) • FUJIMORI, Ikuo Osaka-shi Osaka 532-8686 (JP) (74) Representative: Jones, Nicholas Andrew et al Withers & Rogers LLP 4 More London Riverside London SE1 2AU (GB) (56) References cited: EP-A- 1 803 709 WO-A-2007/026916 WO-A-2008/108380
---	--

EP 2 318 390 B1

Note: Within nine months of the publication of the mention of the grant of the European patent in the European Patent Bulletin, any person may give notice to the European Patent Office of opposition to that patent, in accordance with the Implementing Regulations. Notice of opposition shall not be deemed to have been filed until the opposition fee has been paid. (Art. 99(1) European Patent Convention).

EP 2 318 390 B1

stomach was reperfused with physiological saline (0.5 mL/min). The perfusate was subjected to a continuous pH measurement using trace flow type glass electrodes (6961-15C and 2461A-15T, HORTBA). Histamine dihydrochloride (8 mg/kg/h) was continuously administered for 1 hr or longer by intravenous infusion. After the pH was stabilized, the test compound was intravenously administered. The pH of the perfusate was measured until 5 hours after administration of the test compound. The results are shown in Figs. 1, 2 and 3.

[0192]

Table 4

Example No.	H ⁺ /K ⁺ -ATPase inhibitory activity (IC ₅₀ , nM)	pKa value (calculated)	ATP content (% , 100 μM)	Caspase-3/7 activity (% , 100 μM)
2	100	7.84	85.5	-1.1
4	140	7.79	84.5	-0.6
23	83	7.84	-	-
24	140	7.84	-	-

[0193] From the results of Table 4, it is clear that compound (I) of the present invention has a superior H⁺/K⁺-ATPase inhibitory activity and a low pKa value, as well as extremely low cytotoxicity even when used at a high concentration. In addition, from the results of Figs. 1, 2 and 3, it is clear that compound (I) has a moderate duration of action.

INDUSTRIAL APPLICABILITY

[0194] Compound (I) of the present invention shows a superior proton pump inhibitory effect. Conventional proton pump inhibitors such as omeprazole, lansoprazole are converted to active forms in an acidic environment of gastric parietal cells and form a covalent bond with a cysteine residue of H⁺/K⁺-ATPase, and irreversibly inhibit the enzyme activity. In contrast, compound (I) inhibits proton pump (H⁺/K⁺-ATPase) activity in a reversible and K⁺ competitive manner, and consequently suppresses acid secretion. Therefore, it is sometimes called a potassium-competitive acid blocker (P-CAB), or an acid pump antagonist (APA). Compound (I) rapidly exhibits the action and shows the maximum efficacy from the initial administration. Furthermore, its metabolism is less influenced by metabolic polymorphism, and variation of efficacy among patients is small. In addition, it has been found that compound (I) is designed to have a characteristic chemical structure wherein (i) the substituent at the 5-position of pyrrole ring is a 2-F-3-pyridyl group, (ii) the substituent at the 4-position of pyrrole ring is a fluorine atom, and (iii) the 1-position of pyrrole ring is a 2-pyridylsulfonyl group having at least one substituent as defined in claim 1, and such chemical structure is conducive to a strong proton pump inhibiting activity, and significantly decreases cytotoxicity. Furthermore, it is characterized in that substitution of the 4-position of pyrrole ring by a fluorine atom in compound (I) lowers basicity (pKa value) of methylaminomethyl moiety due to an electron withdrawing effect of the fluorine atom, and decreases the risk of toxicity expression derived from strong basicity, and that introduction of at least one substituent into A of compound (I) as defined in claim 1 controls the duration of action optimally. Hence, the present invention can provide a clinically useful agent for the prophylaxis or treatment of peptic ulcer (e.g., gastric ulcer, duodenal ulcer, anastomotic ulcer, ulcer caused by non-steroidal anti-inflammatory drug, ulcer due to postoperative stress etc.), Zollinger-Ellison syndrome, gastritis, erosive esophagitis, reflux esophagitis, symptomatic gastroesophageal reflux disease (Symptomatic GERD), Barrett's esophagus, functional dyspepsia, gastric cancer, stomach MALT lymphoma or hyperacidity; or a suppressant of upper gastrointestinal bleeding due to peptic ulcer, acute stress ulcer, hemorrhagic gastritis or invasive stress. Since compound (I) shows low toxicity and is superior in water-solubility, in vivo kinetics and efficacy exhibition, it is useful as a pharmaceutical composition. Since compound (I) is stable even under acidic conditions, it can be administered orally as a conventional tablet without formulating into an enteric-coated preparation. This has an advantageous consequence that the preparation (tablet) can be made smaller, and can be easily swallowed by patients having difficulty in swallowing, particularly the elderly and children. In addition, since it is free of a sustained release effect afforded by enteric-coated preparations, onset of suppression of gastric acid secretion is rapid, and symptoms such as pain can be alleviated rapidly.

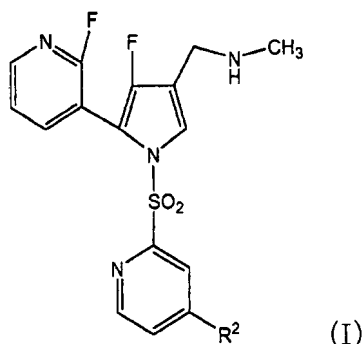
Claims

1. A compound represented by the formula (I)

EP 2 318 390 B1

5

10



15

wherein R² is a halogen atom, a C₁₋₆ alkyl group optionally substituted by halogen or a C₁₋₆ alkoxy group optionally substituted by halogen, or a salt thereof.

20

2. The compound of claim 1, wherein R² is a C₁₋₆ alkyl group or a C₁₋₆ alkoxy group, or a salt thereof.
3. The compound of claim 1, which is 1-{4-fluoro-5-(2-fluoropyridin-3-yl)-1-[(4-methylpyridin-2-yl)sulfonyl]-1H-pyrrol-3-yl}-N-methylmethanamine, or a salt thereof.

25

4. The compound of claim 1, which is 1-{4-fluoro-5-(2-fluoropyridin-3-yl)-1-[(4-methoxypyridin-2-yl)sulfonyl]-1H-pyrrol-3-yl}-N-methylmethanamine, or a salt thereof.

30

5. A pharmaceutical composition comprising the compound of claim 1 or a pharmaceutically acceptable salt thereof.
6. The pharmaceutical composition of claim 5 for use in the suppression of acid secretion.

35

7. The pharmaceutical composition of claim 5, for use in the prophylaxis or treatment of peptic ulcer, Zollinger-Ellison syndrome, gastritis, reflux esophagitis, symptomatic gastroesophageal reflux disease (symptomatic GERD), Barrett's esophagus, functional dyspepsia, gastric cancer, stomach MALT lymphoma, or ulcer caused by non-steroidal anti-inflammatory drug, gastric hyperacidity or ulcer due to postoperative stress; or for use in the inhibition of upper gastrointestinal bleeding due to peptic ulcer, acute stress ulcer, hemorrhagic gastritis or invasive stress.

40

8. The compound of claim 1 or a pharmaceutically acceptable salt thereof, for use for treating or preventing peptic ulcer, Zollinger-Ellison syndrome, gastritis, reflux esophagitis, symptomatic gastroesophageal reflux disease (symptomatic GERD), Barrett's esophagus, functional dyspepsia, gastric cancer, stomach MALT lymphoma, or ulcer caused by non-steroidal anti-inflammatory drug, gastric hyperacidity or ulcer due to postoperative stress; or for use for inhibiting upper gastrointestinal bleeding due to peptic ulcer, acute stress ulcer, hemorrhagic gastritis or invasive stress.

45

9. Use of the compound of claim 1 or a pharmaceutically acceptable salt thereof for the production of a medicament for the prophylaxis or treatment of peptic ulcer, Zollinger-Ellison syndrome, gastritis, reflux esophagitis, symptomatic gastroesophageal reflux disease (symptomatic GERD), Barrett's esophagus, functional dyspepsia, gastric cancer, stomach MALT lymphoma, or ulcer caused by non-steroidal anti-inflammatory drug, gastric hyperacidity or ulcer due to postoperative stress; or for the inhibition of upper gastrointestinal bleeding due to peptic ulcer, acute stress ulcer, hemorrhagic gastritis or invasive stress.

50

Patentansprüche

1. Verbindung, dargestellt durch die Formel (I)

55

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

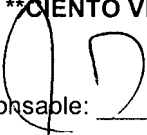
 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA	RECIBO DE CAJA	No. 13 - 0079774
		Bogotá D.C., Agosto 12 de 2013 - 10:52:43

RECIBIDO DE : CAVELIER ABOGADOS NI 860.041.367

*** Soporte del Pago ***					
TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
RECIBO DE CA	999999999	72795	23/07/2013		410.000.00
RECIBO DE CA	999999999	78095	06/08/2013		505.000.00
RECIBO DE CA	999999999	78096	06/08/2013		505.000.00
RECIBO DE CA	999999999	78302	06/08/2013		20.000.00
RECIBO DE CA	999999999	78336	06/08/2013		60.000.00

*** Conceptos Pagados ***			
CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1 50005-01-03 CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICACIONES	SOLICITUD MODIFICACIONES CAMBIO SOLICITANTE POR CESION	125.000.00	125.000.00
			\$125.000.00

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

Responsable: 

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 13-122437- -00003-0000

Fecha: 2013-08-12 17:12:44 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 412 REPOSPRESRECU Folios: 18

0010:000002-006-007-5.