



(12) BREVET D'INVENTION

- (11) N° de publication : **MA 37378 A3** (51) Cl. internationale : **A61K 31/435; C07D 401/14; A61P 29/00**
- (43) Date de publication : **28.02.2018**

-
- (21) N° Dépôt : **37378**
- (22) Date de Dépôt : **01.03.2013**
- (30) Données de Priorité : **01.03.2012 US 61/605,523**
- (86) Données relatives à la demande internationale selon le PCT: **PCT/US2013/028622 01.03.2013**
- (71) Demandeur(s) :
• **GENENTECH, INC, 1 DNA Way, South San Francisco CA 94080-4990 (US)**
• **ARRAY BIOPHARMA, INC, 3200 Walnut Street, Boulder CO 80301 (US)**
- (72) Inventeur(s) :
BLAKE, James F ; CHICARELLI, Mark Joseph ; GARREY, Rustam Ferdinand ; GAUDINO, John ; GRINA, Jonas ; MORENO, David A ; MOHR, Peter J. ; REN, Li ; SCHWARZ, Jacob ; CHEN, Huifen ; ROBARGE, Kirk ; ZHOU, Aihe
- (74) Mandataire :
ABU-GHAZALEH INTELLECTUAL PROPERTY TMP AGENTS

(54) Titre : **INHIBITEURS DE LA SÉRINE / THRÉONINE KINASE**

- (57) Abrégé : La présente invention concerne des composés de formule I ou un stéréoisomère, un tautomère, un promédicament ou un sel pharmaceutiquement acceptable de ceux-ci, qui sont utiles pour le traitement de la douleur et des maladies inflammatoires, hyperprolifératives. L'invention concerne aussi des procédés d'utilisation des composés de formule I ou d'un stéréoisomère, un tautomère, un promédicament ou un sel pharmaceutiquement acceptable de ceux-ci, pour le diagnostic in vitro, in situ et in vivo, la prévention ou le traitement de telles affections ou d'états pathologiques associés dans des cellules de mammifères.

ROYAUME DU MAROC


OFFICE MAROCAIN DE LA PROPRIÉTÉ
INDUSTRIELLE ET COMMERCIALE



المملكة المغربية

المكتب المغربي
للملكية الصناعية والتجارية

**RAPPORT DE RECHERCHE
AVEC OPINION SUR LA BREVETABILITE**
(Conformément aux articles 43 et 43.2 de la loi 17-97 relative à la
protection de la propriété industrielle)

Renseignements relatifs à la demande	
N° de la demande : 37378	Date de dépôt : 01/03/2013 Date d'entrée en phase nationale : 26/09/2014
Déposant : ARRAY BIOPHARMA, INC et GENENTECH, INC	Date de priorité: 01/03/2012
Intitulé de l'invention : INHIBITEURS DE LA SÉRINE / THRÉONINE KINASE	
Le présent document est le rapport de recherche avec opinion sur la brevetabilité établi par l'OMPIC conformément aux articles 43 et 43.2, et notifié au déposant conformément à l'article 43.1 de la loi 17-97 relative à la protection de la propriété industrielle telle que modifiée et complétée par la loi 23-13.	
Les documents cités par l'examineur dans la partie rapport de recherche sont joints au présent document	
Les documents brevets cités dans le rapport de recherche sont téléchargeables à partir du site http://worldwide.espacenet.com , et les documents non brevets sont joints au présent document, s'il y en a lieu.	
Le présent rapport contient des indications relatives aux éléments suivants :	
Partie 1 : Considérations générales	
<input checked="" type="checkbox"/> Cadre 1 : Base du présent rapport	
<input type="checkbox"/> Cadre 2 : Priorité	
<input type="checkbox"/> Cadre 3 : Titre et/ou Abrégé tel qu'ils sont définitivement arrêtés	
Partie 2 : Rapport de recherche	
Partie 3 : Opinion sur la brevetabilité	
<input checked="" type="checkbox"/> Cadre 4 : Remarques de clarté	
<input checked="" type="checkbox"/> Cadre 5 : Déclaration motivée quant à la Nouveauté, l'Activité Inventive et l'Application Industrielle	
<input checked="" type="checkbox"/> Cadre 6 : Observations à propos de certaines revendications dont aucune recherche significative n'a pu être effectuée	
<input type="checkbox"/> Cadre 7 : Défaut d'unité d'invention	
Examineur: S.BENCHEKROUN	Date d'établissement du rapport: 29/04/2018
Téléphone: 212 5 22 58 64 14/00	

Partie 1 : Considérations générales

* Cadre 1 : base du présent rapport

Les pièces suivantes de la demande servent de base à l'établissement du présent rapport :

- Description
335 Pages
- Revendications
177

Partie 2 : Rapport de recherche

Classement de l'objet de la demande :

CIB : A61K31/435, A61K31/506, C07D401/14, C 07D 405/14, C07D413/14, C07D409/14, C07D417/14, C07D471/04, A61P35/00, A61P29/00

Bases de données électroniques consultées au cours de la recherche :

EPOQUE, Orbit

Catégorie*	Documents cités avec, le cas échéant, l'indication des passages pertinents	N° des revendications visées
X	P. STANETTY ET AL: Novel and Efficient Access to Phenylamino-pyrimidine Type Protein Kinase C Inhibitors Utilizing a Negishi Cross-Coupling Strategy; 13/03/2005 (Schéma 6, composé 7; Schéma 7, composé 13)	99-101
A	WO01/42241 ; MERCK & CO INC [US] ; 14/06/2001 Page 19, composé 9 ; page 20, composé 69 ; page 32, composé 5, 6 ; page 33, composé 8 ; page 34, composé 9 ; page 41, composé 69 Revendication 1, 5, 8, 9	1-64,72-74,77-98,102-177
A	WO2010/077275 ; ARENA PHARM INC ; 08/07/2010 Page 48, ligne 19 ; page 50, ligne 16 ; Revendication 1, 30, 42, 49 Page 36, composé 51,56 ; page 37, composé 59, page 39	1-64,72-74,77-98,102-177
A	WO2003/099809; ELAN PHARM INC [US] ; 04/12/2003 Revendication 1, 7, 8, 10 ; exemple 10	1-64,72-74,77-98,102-177
A	WO2005/123680 ; SQUIBB BRISTOL MYERS CO [US]; 29/12/2005 Page 111, exemple 74 Revendication 1, 16, 17	1-64,72-74,77-98,102-177

***Catégories spéciales de documents cités :**

-« X » document particulièrement pertinent ; l'invention revendiquée ne peut être considérée comme nouvelle ou comme impliquant une activité inventive par rapport au document considéré isolément
-« Y » document particulièrement pertinent ; l'invention revendiquée ne peut être considérée comme impliquant une activité inventive lorsque le document est associé à un ou plusieurs autres documents de même nature, cette combinaison étant évidente pour une personne du métier
-« A » document définissant l'état général de la technique, non considéré comme particulièrement pertinent
-« P » documents intercalaires ; Les documents dont la date de publication est située entre la date de dépôt de la demande examinée et la date de priorité revendiquée ou la priorité la plus ancienne s'il y en a plusieurs
-« E » Éventuelles demandes de brevet interférentes. Tout document de brevet ayant une date de dépôt ou de priorité antérieure à la date de dépôt de la demande faisant l'objet de la recherche (et non à la date de priorité), mais publié postérieurement à cette date et dont le contenu constituerait un état de la technique pertinent pour la nouveauté

Partie 3 : Opinion sur la brevetabilité

Cadre 4 : Remarques de clarté

- 1- Les revendications 55-57 contiennent des références aux exemples dans la description, les revendications ne doivent pas contenir de telles références, sauf lorsque cela est absolument nécessaire, ce qui est pas le cas ici.
- 2- Les revendications 61,73 (type suisse) devraient être reformulées dans une forme correcte "composé pour une utilisation médicale", selon l'article 26 (alinéas 4 et 5) de la loi 17-97 telle que modifiée et complétée par la loi 23-13.

Cadre 5 : Déclaration motivée quant à la Nouveauté, l'Activité Inventive et l'Application Industrielle

Nouveauté (N)	Revendications 1-64,72-74,77- 98,102-177 Revendications 99-101	Oui Non
Activité inventive (AI)	Revendications 1-64,72-74,77- 98,102-177 Revendications 99-101	Oui Non
Possibilité d'application Industrielle (PAI)	Revendications 1-64,72-74,77-177 Revendications aucune	Oui Non

Il est fait référence aux documents suivants. Les numéros d'ordre qui leur sont attribués ci-après seront utilisés dans toute la suite de la procédure

- D1 : P. STANETTY ET AL: Novel and Efficient Access to Phenylamino-pyrimidine Type Protein Kinase C Inhibitors Utilizing a Negishi Cross-Coupling Strategy; 13/03/2005
D2 : WO01/42241

1. Nouveauté (N) :

Le document D1 décrit des composés phénylamino-pyrimidine qui sont des inhibiteurs de la protéine kinase (Schéma 6, composé 7; Schéma 7, composé 13).

Par conséquent l'objet des revendications 99-101 n'est pas nouveau au sens de l'article 26 de la loi 17-97 telle que modifiée et complétée par la loi 23-13.

Aucun des documents ci-dessus ne divulgue l'ensemble des caractéristiques techniques des revendications 1-64,72-74,77- 98,102-177, d'où l'objet desdites revendications est nouveau au sens de l'article 26 de la loi 17-97 telle que modifiée et complétée par la loi 23-13.

2. Activité inventive (AI) :

Le document D2 qui est considéré comme l'état de la technique le plus proche de l'objet de la revendication 1 décrit des composés de pyridazine substitués qui ont une activité inhibitrice des cytokines qui sont utiles pour le traitement de maladie à médiation par des cytokines telle que l'arthrite.

Par conséquent l'objet de la revendication 1 diffère de D2 par l'absence du substituant R2, R3, et le groupe R4.

Le problème que la présente invention se propose de résoudre peut donc être considéré comme de fournir d'autres composés étant utiles dans le traitement du cancer, des affections inflammatoires et d'autres maladies.

La solution proposée par le déposant est considérée inventive puisqu'il n'y a aucune incitation dans l'art

antérieur qui ont le substituant R1-NH- et le groupe céto au niveau du noyau Y et le substituant comprenant les groupes R2 et R3, et qu'il n'est pas évident pour l'homme du métier, à effectuer les modifications structurelles citées pour obtenir le composé de formule (I) tout en gardant la même activité pharmacologique.

Par conséquent, l'objet de la revendication 1 implique une activité inventive conformément à l'article 28 de la loi 17-97 telle que modifiée et complétée par la loi 23-13.

Les revendications 2-64,72-74,77- 98,102-177satisfont donc, en tant que telles, aux exigences de l'article 28 de la loi 17-97 telle que modifiée et complétée par la loi 23-13.

3. Possibilité d'application industrielle (PAI) :

L'objet des revendications 1-64,72-74,77-177 est susceptible d'application industrielle au sens de l'article 29 de la loi 17-97 telle que modifiée et complétée par la loi 23-13, parce qu'il présente une utilité déterminée, probante et crédible.

Cadre 6: Observations à propos de certaines revendications dont aucune recherche significative n'a pu être effectuée

L'objet des revendications 65-71,75-76 concerne une méthode de traitement thérapeutique qui n'est pas brevetable au sens de l'article 24 de la loi 17-97 telle que modifiée et complétée par la loi 23-13.