



(12) DEMANDE DE BREVET D'INVENTION

(11) N° de publication :
MA 37385 A3

(51) Cl. internationale :
C07D 471/04

(43) Date de publication :
30.12.2016

(21) N° Dépôt :
37385

(22) Date de Dépôt :
26.03.2013

(30) Données de Priorité :
06.04.2012 US 61/621,144

(86) Données relatives à la demande internationale selon le PCT:
N° Dépôt international Date D'entrée en phase nationale
PCT/IB2013/052404 02.10.2014

(71) Demandeur(s) :
PFIZER INC.(ETAT DE DELAWARE), 235 East 42nd Street, New York, New York 10017 (US)

(72) Inventeur(s) :
AHN KAY ; BOEHM MARKUS ; CABRAL SHAWN ; CARPINO PHILIP A ; FUTATSUGI KENTARO ; HEPWORTH DAVID ; KUNG DANIEL W ; ORR SUVI ; WANG JIAN

(74) Mandataire :
CABINET PATENTMARK SARL

(54) Titre : **INHIBITEURS DE DIACYLGLYCÉROL-ACYLTRANSFÉRISE 2**

(57) Abrégé : Dérivés de la purine, 3H-imidazo [4,5-b] pyrimidine et 1H-imidazo [4,5-d] pyrazine de Formule I qui inhibent l'activité de la diacylglycéról acyltransférase 2 (DGAT2) et leurs utilisations dans le traitement de maladies liées à ceux-ci dans des animaux sont décrits ici.

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 : 37385	Date de dépôt : 02/10/2014
Déposant : PFIZER INC.	Date de Priorité : 26/03/2013
Intitulé de l'invention : INHIBITEURS DE DIACYLGLYCÉROL-ACYLTRANSFÉrase 2	
<p>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.</p> <p>Les documents cités par l'examineur dans la partie rapport de recherche sont joints au présent document</p>	
<p>Le présent rapport contient des indications relatives aux éléments suivants :</p> <p>Partie 1 : Considérations générales</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Cadre 1 : Base du présent rapport</p> <p><input type="checkbox"/> Cadre 2 : Priorité</p> <p><input type="checkbox"/> Cadre 3 : Titre et/ou Abrégé tel qu'ils sont définitivement arrêtés</p> <p>Partie 2 : Rapport de recherche</p> <p>Partie 3 : Opinion sur la brevetabilité</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Cadre 4 : Remarques de clarté</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Cadre 5 : Déclaration motivée quant à la Nouveauté, l'Activité Inventive et l'Application Industrielle</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Cadre 6 : Observations à propos de certaines revendications dont aucune recherche significative n'a pu être effectuée</p> <p><input type="checkbox"/> Cadre 7 : Défaut d'unité d'invention</p>	
Examineur: M. Bendaoud	Date d'établissement du rapport : 27/09/2016
Téléphone: 0522586400	

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
Pages 1-354
- Revendications
1-31
- Planches de dessin
Pages 5

Partie 2 : Rapport de recherche**Classement de l'objet de la demande :**

CIB : A61K31/4184; A61K31/437; A61K31/4439; A61K31/496; A61K31/52; A61K31/5377; A61K31/551; A61P25/00; A61P25/16; A61P25/28; A61P3/10; A61P35/00; A61P37/00; A61P37/02; A61P43/00; A61P5/50; A61P9/00; C07D401/14; C07D403/04; C07D403/14; C07D413/14; C07D471/04; C07D473/00; C07D487/04; C07D487/08; C07D491/056;
CPC : C07D403/04

Bases de données électroniques consultées au cours de la recherche :

EPOQUE, Espacenet, Orbit

Catégorie*	Documents cités avec, le cas échéant, l'indication des passages pertinents	N° des revendications visées
A	US2003207883; 2003-11-06; RENHOWE PAUL A [US]	1-31
A	WO20101125402. 2010-11-04. NOVARTIS AG [CH]; ASTEX THERAPEUTICS LTD [GB]; HOWARD STEVEN [GB];	1-31
A	"Antibacterial activity in serum of the 3,5-diaminopiperidine translation inhibitors", 01/06/2008; ZHOU Y ET AL	1-31

***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*

Les revendications 25 à 28 et 31 ne satisfont pas à l'exigence de clarté, car l'objet de la protection demandée n'est pas clairement défini conformément à l'article 35 de la loi 17-97 telle que modifiée et complétée par la loi 23-13.

En effet ces revendications de 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 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 1-28 ; 31 Revendications aucune	Oui Non
Activité inventive (AI)	Revendications 1-28 ; 31 Revendications aucune	Oui Non
Possibilité d'application Industrielle (PAI)	Revendications 1-28 ; 31 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 : US2003207883; 2003-11-06; RENHOWE PAUL A [US]

D2 : WO20101125402. 2010-11-04. NOVARTIS AG [CH]; ASTEX THERAPEUTICS LTD [GB]; HOWARD STEVEN [GB];

D3 : "Antibacterial activity in serum of the 3,5-diaminopiperidine translation inhibitors", 01/06/2008; ZHOU Y ET AL

1. Nouveauté (N) :

Aucun des documents mentionnés ci-dessus ne décrit l'utilisation de dérivés de la purine, 3H-imidazo [4,5-b] pyrimidine et 1H-imidazo [4,5-d] pyrazine de Formule I qui inhibent l'activité de la diacylglycéról acyltransférase 2 (DGAT2) et leurs utilisations dans le traitement de maladies liées à ceux-ci dans des animaux sont décrites ici, d'où l'objet de la revendication 1 est nouveau. Par la suite toutes les revendications dépendantes le sont.

2. Activité inventive (AI) :

Le document D1 qui est considéré comme l'état de la technique le plus proche de l'objet de la revendication 1 décrit 3H-imidazo [4,5-b]pyridines (249-253) composés utilisés contre le diabète de type 2 ([O01 31]). D1 est différent de la portée de la présente revendication 1 dans la mesure que D1

décrit des composés avec A étant un groupe NH et R1 étant un groupe méthyle.

D2 divulgue 3H-imidazo [4,5-b]pyridines et purines (par exemple ex 133, 135..) Utilisés contre le diabète (page 76, 1. août 17 à 1; Page 77, 1. 7). D2 est différente de la portée de la présente revendication 1 dans la mesure où D2 divulgue que des composés avec R1 étant un atome d'hydrogène et R3 étant diméthylamine.

D3 décrit un dérivé de purine qui présente une activité antibactérienne (composé 25). D3 diffère de la portée de la présente revendication 1 dans la mesure que D3 décrit des composés avec le carbone étant un C-hétérocycle et l'anneau de purine n'est pas connecté à un autre groupe N-hétérocycle.

L'objet des revendications 1-31 ne semble pas dériver de manière évidente de l'art antérieur

l'objet de la revendication 1 diffère de D1 dans la mesure où D1 décrit des composés avec A NH et R1 étant un méthyle.

Aucun effet n'est divulgué pour cette différence comme il n'y a pas d'exemples de composés équivalents connus de D1.

Le problème à résoudre est donc considéré comme la fourniture d'autres composés pour le traitement du diabète.

Le demandeur résout ce problème en proposant des composés de formule (1). Le demandeur fournit la voie de synthèse et des données biologiques pour 233 composés avec des variations dans toutes les variables de postes AD et R1 à R4.

L'homme du métier sait 3H-imidazo [4,5-b]pyridines purines et de DI -D2 pour le traitement du diabète. Il n'y a cependant aucune indication dans ledit état de la technique qui conduirait l'homme du métier pour des composés de formule (1) étant biologiquement active. L'objet de la présente revendication 1 est donc considéré comme inventif.

Ceci est également valable pour les revendications dépendantes 2-12 et la composition pharmaceutique et revendications d'utilisation médicale 13-31

3. Possibilité d'application industrielle (PAI) :

L'objet de la présente invention 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

Les objets des revendications 29 et 30 concernent des méthodes thérapeutiques qui ne sont pas brevetables au sens de l'article 24 de la loi 17-97 telle que modifiée et complétée par la loi 23-13.