ROYAUME DU MAROC

OFFICE MAROCAIN DE LA PROPRIETE INDUSTRIELLE ET COMMERCIALE
---

(19)

المملكة المغربية

المكتب المغربي
للملكية الصناعية و التجارية
---

(12) BREVET D'INVENTION

(11) N° de publication :
MA 38325 A3

(43) Date de publication :
31.05.2018

(51) Cl. internationale :
A61K 31/381; A61P 35/00; C07D 333/64; C07D 333/66; C07D 417/12; C07D 409/10; C07D 409/12; C07D 413/04; C07D 413/12; C07D 409/04

---

(21) N° Dépôt :
38325

(22) Date de Dépôt :
12.02.2014

(30) Données de Priorité :
19.02.2013 US 61/766,439

(86) Données relatives à la demande internationale selon le PCT:
PCT/US2014/015938 12.02.2014

(71) Demandeur(s) :
NOVARTIS AG, Lichtstrasse 35 CH-4056 Basel (US)

(72) Inventeur(s) :
BURKS, Heather Elizabeth ; DECHANTSREITER, Michael A. ; HE, Guo ; NUNEZ, Jill ; PEUKERT, Stefan ; SPRINGER, Clayton ; SUN, Yingchuan ; THOMSEN, Noel Marie-France ; TRIA, George Scott ; YU, Bing

(74) Mandataire :
SABA&CO

---

(54) Titre : **DÉRIVÉS DE BENZOTHIOPHÈNE ET COMPOSITIONS CORRESPONDANTES EN TANT QU'AGENTS DE DÉGRADATION SÉLECTIFS DES RÉCEPTEURS DES ŒSTROGÈNES**

(57) Abrégé : La présente invention concerne des composés répondant à la formule I : dans laquelle n, m, X, Y1, R1, R2, R3, R4 et R5 sont définis dans le résumé de l'invention ; qui sont capables d'être à la fois de puissants antagonistes et des agents de dégradation des récepteurs des œstrogènes. L'invention concerne en outre un procédé de préparation des composés de l'invention, des préparations pharmaceutiques comprenant de tels composés et des procédés d'utilisation de tels composés et compositions dans la prise en charge de maladies ou de troubles associés à une activité aberrante des récepteurs des œstrogènes.

MA 38325A3

ROYAUME DU MAROC
****
OFFICE MAROCAIN DE LA PROPRIETE INDUSTRIELLE ET COMMERCIALE
****

OMPIC

المملكة المغربية

المكتب المغربي للملكية الصناعية و التجارية

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 telle que modifiée et complétée par la loi 23-13)

Renseignements relatifs à la demande	
N° de la demande : 38325	Date de dépôt : 12/02/2014 ; Date d'entrée en phase nationale : 05/08/2015
Déposant : NOVARTIS AG	Date de priorité: 19/02/2013
Intitulé de l'invention : DÉRIVÉS DE BENZOTHIOPHÈNE ET COMPOSITIONS CORRESPONDANTES EN TANT QU'AGENTS DE DÉGRADATION SÉLECTIFS DES RÉCEPTEURS DES ŒSTROGÈNES	

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 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
- ☒ Cadre 1 : Base du présent rapport
- ☐ Cadre 2 : Priorité
- ☐ Cadre 3 : Titre et/ou Abrégé tel qu'ils sont définitivement arrêtés

Partie 2 : Rapport de recherche

Partie 3 : Opinion sur la brevetabilité
- ☐ Cadre 4 : Remarques de clarté
- ☒ Cadre 5 : Déclaration motivée quant à la Nouveauté, l'Activité Inventive et l'Application Industrielle
- ☐ Cadre 6 : Observations à propos de certaines revendications dont aucune recherche significative n'a pu être effectuée
- ☐ Cadre 7 : Défaut d'unité d'invention

Examinateur: S.BENCHEKROUN	**Date d'établissement du rapport** : 30/04/2018
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
  246 Pages
- Revendications
  20

Partie 2 : Rapport de recherche

Classement de l'objet de la demande :

CIB : A 61K 31/381, A 61P 35/00, C 07D 333/64, C 07D 333/66, C 07D 409/04, C 07D 409/10, C 07D 409/12, C 07D 413/04, C 07D 413/12, C 07D 417/12

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
A	Karen J. Kieser; "Characterization of the Pharmacophore Properties of Novel Selective Estrogen Receptor Downregulators (SERDs)" ; 22/04/2010 Paragraphe 1, figures 1,2	1-20
A	Cassia R. Overk; "Structure–Activity Relationships for a Family of Benzothiophene Selective Estrogen Receptor Modulators Including Raloxifene and Arzoxifene " 08/10/2007 Schema 1	1-20

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

Nouveauté (N)	Revendications 1-20 Revendications aucune	Oui Non
Activité inventive (AI)	Revendications 1-20 Revendications aucune	Oui Non
Possibilité d'application Industrielle (PAI)	Revendications 1-20 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 : Characterization of the Pharmacophore Properties of Novel Selective Estrogen Receptor Downregulators (SERDs)"

1. **Nouveauté (N) :**

Aucun des documents ci-dessus ne divulgue l'ensemble des caractéristiques techniques des revendications 1-20, 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 D1 qui est considéré comme l'état de la technique le plus proche de l'objet de la revendication 1 décrit des composés qui sont des inhibiteurs sélectifs du récepteur des œstrogènes (SERD)(composés 1,4,7,42) et explique que ces composés sont distincts des ligands des récepteurs aux œstrogènes qui agissent comme agonistes, appelés modulateurs sélectifs des récepteurs aux œstrogènes.
Par conséquent l'objet de la revendication 1 diffère de D1 par l'absence du noyau de Benzothiophène.
Le problème que la présente invention se propose de résoudre peut donc être considéré comme la fourniture d'autres récepteurs des œstrogènes (SERD).
La solution proposée par le déposant est considérée inventive puisqu'il n'y a aucune incitation dans l'art antérieur, 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 des revendications 1-20 implique une activité inventive conformément à l'article 28 de la loi 17-97 modifiée et complétée par la loi 23-13.

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.