



## (12) BREVET D'INVENTION

- (11) N° de publication : **MA 39121 A3** (51) Cl. internationale : **A61K 31/4439; A61K 31/444;  
A61P 29/00; C07D 417/12;  
C07D 401/12; C07D 401/14;  
C07D 409/12; A61P 37/00**
- (43) Date de publication : **31.05.2019**

- 
- (21) N° Dépôt : **39121**
- (22) Date de Dépôt : **16.12.2014**
- (30) Données de Priorité : **19.12.2013 EP 13198463.5**
- (86) Données relatives à la demande internationale selon le PCT: **PCT/EP2014/077877 16.12.2014**
- (71) Demandeur(s) : **BAYER PHARMA AKTIENGESELLSCHAFT, Müllerstr. 178 13353 Berlin (DE)**
- (72) Inventeur(s) : **BOTHE, Ulrich ; ROTGERI, Andrea ; BÖMER, Ulf ; RING, Sven ; SCHÄFER, Martina ; SIEBENEICHER, Holger ; SCHMIDT, Nicole ; IRLBACHER, Horst ; GÜNTHER, Judith ; STEUBER, Holger ; LANGE, Martin**
- (74) Mandataire : **IP-TOP NOTCH**

- 
- (54) Titre : **NOUVEAUX INDAZOLCARBOXAMIDES, LEUR PROCÉDÉ DE FABRICATION, PRÉPARATIONS PHARMACEUTIQUES QUI LES CONTIENNENT ET LEUR UTILISATION POUR LA PRÉPARATION DE MÉDICAMENTS**
- (57) Abrégé : La présente invention concerne de nouveaux indazoles 6-substitués possédant une chaîne latérale carboxamide, leur procédé de fabrication, leur utilisation, individuellement ou en combinaison pour le traitement et/ou la prophylaxie de maladies, ainsi que leur utilisation pour la production de médicaments pour le traitement et/ou la prophylaxie de maladies, en particulier pour le traitement et/ou la prophylaxie de l'endométriose, du lymphome, de la dégénérescence maculaire, de la maladie pulmonaire obstructive chronique (COPD), et du psoriasis.



**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)

<b>Renseignements relatifs à la demande</b>	
N° de la demande : 39121	Date de dépôt : 16/12/2014 Date d'entrée en phase nationale : 16/06/2016
Déposant : BAYER PHARMA AKTIENGESELLSCHAFT	Date de priorité: 19/12/2013
Intitulé de l'invention : NOUVEAUX INDAZOLCARBOXAMIDES, LEUR PROCÉDÉ DE FABRICATION, PRÉPARATIONS PHARMACEUTIQUES QUI LES CONTIENNENT ET LEUR UTILISATION POUR LA PRÉPARATION DE MÉDICAMENTS	
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 <a href="http://worldwide.espacenet.com">http://worldwide.espacenet.com</a> , 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 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: F.LAHCHIMI	Date d'établissement du rapport : 31/12/2018
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  
386 Pages
- Revendications  
18
- Planches de dessin  
2 Pages

**Partie 2 : Rapport de recherche**

**Classement de l'objet de la demande :**

CIB : C07D409/12, C07D417/12, C07D401/12, C07D401/14, A61K31/444, A61K31/4439, A61P29/00, A61P37/00

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	WO2009019167 ; MERCK SERONO [CH]; 12/02/2009	1, 2, 11-18
A	WO2013042137 ; AURIGENE DISCOVERY TECHNOLOGIES LIMITED [IN], 28/03/2013	1-18

**\*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 14-15 (type suisse) doivent 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 3-10	Oui
	Revendications 1, 2, 11-18	Non
Activité inventive (AI)	Revendications 3-10	Oui
	Revendications 1, 2, 11-18	Non
Possibilité d'application Industrielle (PAI)	Revendications 1-18	Oui
	Revendications aucune	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 : WO2009019167

D2 : WO2013042137

**1. Nouveauté (N) :**

Le document D1 décrit des composés hétérocycliques (exemple 114 et 118) qui sont structurellement superposables à ceux divulgués dans les revendications 1, 2, 11-18 de la présente demande. Par conséquent, l'objet de ces revendications 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 cités ci-dessus ne divulgue l'ensemble des caractéristiques techniques des revendications 3-10, d'où l'objet de celles-ci 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 est considéré comme l'état de la technique le plus proche de l'objet des revendications 3-10 de la présente demande, il divulgue des dérivés carboxamides hétérocycliques utilisés en tant qu'inhibiteurs de la kinase 4 associée au récepteur d'interleukine 1 (IRAK4). Ces composés sont utilisés pour le traitement ou la prévention de certaines pathologies comme les affections allergiques, inflammatoires, auto-immunes et les maladies prolifératives.

La différence entre l'objet des revendications 3-10 et le document D2 réside au niveau de la structure chimique. Les hétéroaryl-carboxamides de D2 présentent un noyau benzimidazole et un groupement morpholine en position 2 alors que les composés revendiqués se caractérisent par un noyau indazole avec un groupement 2-hétérocycle-2-oxoéthyle.

Le problème que la présente demande se propose de résoudre peut être considéré comme la

fourniture de composés alternatifs utilisés en tant qu'inhibiteurs de la kinase 4 associée au récepteur d'interleukine 1(IRAK4).

La solution proposée à ce problème est considérée comme impliquant une activité inventive. En effet, l'homme de métier ne serait pas parvenu d'une manière évidente à reproduire les composés revendiqués en partant du document D2 vu qu'il n'y a aucune donnée qui aurait incité l'homme de métier à effectuer de telles modifications structurelles pour atteindre le résultat recherché.

Par conséquent, l'objet des revendications 3-10 implique une activité inventive au sens 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 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.