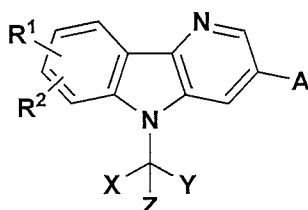


REIVINDICACIONES MODIFICADAS SOLICITUD DE PATENTE

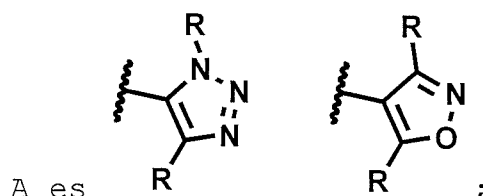
No.NC2016/0000100 OCTUBRE DE 2016

1. Un compuesto de fórmula,



(II)

caracterizado porque:



R es independientemente uno o más hidrógeno, CD₃, halógeno, haloalquilo, hidroxialquilo, CN, CF₃, CH₂F, CHF₂, alquilo(C₁-C₆) opcionalmente sustituido, alcoxi(C₁-C₆) opcionalmente sustituido, cicloalquilo(C₃-C₈) opcionalmente sustituido, heterociclo opcionalmente sustituido, -OR⁴, -CONR³R⁴, -NR³R⁴, NR³R⁴alquilo(C₁-C₆), -NR⁶OCOR³, -NR⁶COR³, NR⁶COR³alquilo(C₁-C₆), -NR⁶CO₂R³, NR⁶CO₂R³alquilo(C₁-C₆), -NR⁶CONR³R⁴, -SO₂NR³R⁴, SO₂alquilo(C₁-C₆), -NR⁶SO₂NR³R⁴, -NR⁶SO₂R⁴ o NR⁶SO₂R⁴alquilo(C₁-C₆);

X e Y se seleccionan independientemente de hidrógeno, alquilo(C₁-C₆) opcionalmente sustituido, cicloalquilo(C₁-C₆) opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido o heterociclo opcionalmente sustituido;

Z es hidrógeno, halógeno, -OH, alquilo(C₁-C₆), alcoxi(C₁-C₆), -NR³R⁴, -CONR³R⁴, -OCONR³R⁴, -NR⁶OCOR³, -NR⁶CONR³R⁴, -NR⁶SO₂NR³R⁴ o -NR⁶SO₂R⁴;

R^1 es, independientemente en cada caso, uno o más hidrógeno, halógeno, $-\text{CN}$, $-\text{OR}^4$, $-\text{NR}^3\text{R}^4$, $-\text{CONR}^3\text{R}^4$, $-\text{COOH}$, $-\text{OCONR}^3\text{R}^4$, $-\text{NR}^6\text{OCOR}^3$, $-\text{NR}^6\text{CONR}^3\text{R}^4$, $-\text{NR}^6\text{SO}_2\text{NR}^3\text{R}^4$, $-\text{NR}^6\text{SO}_2\text{R}^4$, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$) opcionalmente sustituido, alqueno ($\text{C}_2\text{-C}_6$) opcionalmente sustituido, alquino ($\text{C}_2\text{-C}_6$) opcionalmente sustituido, alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$) opcionalmente sustituido, cicloalquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$) opcionalmente sustituido, cicloalquil ($\text{C}_3\text{-C}_8$) alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$) opcionalmente sustituido, cicloalquil ($\text{C}_3\text{-C}_8$)-CO opcionalmente sustituido, cicloalquil ($\text{C}_3\text{-C}_8$)- SO_2 opcionalmente sustituido, aril alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$) opcionalmente sustituido, cicloalquil ($\text{C}_3\text{-C}_8$) alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$) opcionalmente sustituido, heterociclil-CO- opcionalmente sustituido, heterociclilo opcionalmente sustituido, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- SO_2 - opcionalmente sustituido, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- NR^6SO_2 - opcionalmente sustituido, heterociclo- NR^6SO_2 -opcionalmente sustituido, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- NR^6SO_2 -opcionalmente sustituido o heterociclo- NR^6SO_2 - opcionalmente sustituido;

R^2 es hidrógeno, halógeno, $-\text{CN}$, OH , alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$) opcionalmente sustituido, cicloalquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$) opcionalmente sustituido, alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$) opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido o heterociclo opcionalmente sustituido;

R^3 es hidrógeno, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$) opcionalmente sustituido, cicloalquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$) opcionalmente sustituido, alqueno ($\text{C}_2\text{-C}_6$) opcionalmente sustituido, alquino ($\text{C}_2\text{-C}_6$) opcionalmente sustituido, cianoalquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), hidroxialquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), arilo opcionalmente sustituido, arilalquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$) opcionalmente sustituido, ariloxialquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$) opcionalmente sustituido, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- SO_2 - opcionalmente sustituido, heterociclilo

opcionalmente sustituido, heterociclilalquilo (C₁-C₆)
opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente
sustituido o heteroarilalquilo (C₁-C₆) opcionalmente
sustituido,

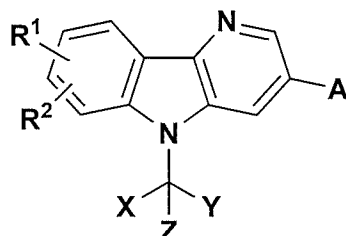
R⁴ es hidrógeno, alquilo (C₁-C₆) opcionalmente
sustituido o cicloalquilo (C₁-C₆) opcionalmente sustituido;

o R³ y R⁴ pueden tomarse junto con el átomo de
nitrógeno al que están unidos para formar un heteroarilo
(C₄-C₈) opcionalmente sustituido o un anillo heterocíclico
(C₄-C₈);

R⁶ es hidrógeno o alquilo (C₁-C₆) opcionalmente
sustituido;

y/o una sal, tautómero o estereoisómero de los
mismos farmacéuticamente aceptables.

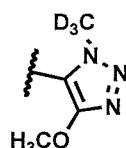
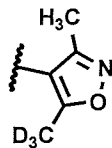
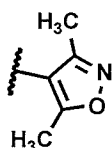
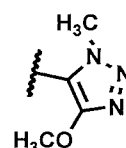
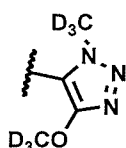
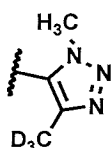
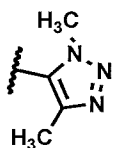
2. Un compuesto de conformidad con la
reivindicación 1 de la fórmula



(II)

caracterizado porque:

A es



;

X e Y se seleccionan independientemente de

hidrógeno, alquilo(C₁-C₆) opcionalmente sustituido, cicloalquilo(C₁-C₆) opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido o heterociclo opcionalmente sustituido;

Z es hidrógeno, halógeno, -OH, alquilo(C₁-C₆), alcoxi(C₁-C₆), -NR³R⁴, -CONR³R⁴, -OCONR³R⁴, -NR⁶OCOR³, -NR⁶CONR³R⁴, -NR⁶SO₂NR³R⁴ o -NR⁶SO₂R⁴;

R¹ es, independientemente en cada caso, uno o más hidrógeno, halógeno, -CN, -OR⁴, -NR³R⁴, -CONR³R⁴, -COOH, -OCONR³R⁴, -NR⁶OCOR³, -NR⁶CONR³R⁴, -NR⁶SO₂NR³R⁴, -NR⁶SO₂R⁴, alquilo(C₁-C₆) opcionalmente sustituido, alquenilo(C₂-C₆) opcionalmente sustituido, alquinilo(C₂-C₆) opcionalmente sustituido, alcoxi(C₁-C₆) opcionalmente sustituido, cicloalquilo(C₁-C₆) opcionalmente sustituido, cicloalquil(C₃-C₈) alquilo(C₁-C₆) opcionalmente sustituido, cicloalquil(C₃-C₈)-CO opcionalmente sustituido, cicloalquil(C₃-C₈)-SO₂ opcionalmente sustituido, aril alcoxi(C₁-C₆) opcionalmente sustituido, cicloalquil(C₃-C₈) alcoxi(C₁-C₆) opcionalmente sustituido, heterociclíil-CO- opcionalmente sustituido, heterociclíilo opcionalmente sustituido, alquilo(C₁-C₆)SO₂- opcionalmente sustituido, alquilo(C₁-C₆) -NR⁶SO₂- opcionalmente sustituido, heterociclo - NR⁶SO₂-opcionalmente sustituido, alquilo(C₁-C₆)NR⁶SO₂-opcionalmente sustituido o heterociclo-NR⁶SO₂- opcionalmente sustituido;

R² es hidrógeno, halógeno, -CN, OH, alquilo(C₁-C₆) opcionalmente sustituido, cicloalquilo(C₁-C₆) opcionalmente sustituido, alcoxi(C₁-C₆) opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido o heterociclo opcionalmente sustituido;

R³ es hidrógeno, alquilo(C₁-C₆) opcionalmente

sustituido, cicloalquilo(C₁-C₆) opcionalmente sustituido, alquenilo(C₂-C₆) opcionalmente sustituido, alquinilo(C₂-C₆) opcionalmente sustituido, cianoalquilo(C₁-C₆), hidroxialquilo(C₁-C₆), arilo opcionalmente sustituido, arilalquilo(C₁-C₆) opcionalmente sustituido, ariloxialquilo(C₁-C₆) opcionalmente sustituido, alquilo(C₁-C₆)SO₂- opcionalmente sustituido, heterociclilo opcionalmente sustituido, heterociclilalquilo(C₁-C₆) opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido o heteroarilalquilo(C₁-C₆) opcionalmente sustituido,

R⁴ es hidrógeno, alquilo(C₁-C₆) opcionalmente sustituido o cicloalquilo(C₁-C₆) opcionalmente sustituido;

o R³ y R⁴ pueden tomarse junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos para formar un heteroarilo (C₄-C₈) opcionalmente sustituido o un anillo heterocíclico (C₄-C₈);

R⁶ es hidrógeno o alquilo(C₁-C₆) opcionalmente sustituido;

y/o una sal, tautómero o estereoisómero de los mismos farmacéuticamente aceptables.

3. Un compuesto caracterizado porque es seleccionado de:

2-[3-(dimetil-1H-1,2,3-triazol-5-il)-5-(1,1,1,7,7,7-hexafluoroheptan-4-il)-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il]propan-2-ol,

2-[3-(dimetil-1,2-oxazol-4-il)-5-[(S)-oxan-4-il(fenil)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il]propan-2-ol,

2-[3-(dimetil-1H-1,2,3-triazol-5-il)-5-[(1S)-

4,4,4-trifluoro-1-fenilbutil]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il]propan-2-ol,

2-[3-(dimetil-1H-1,2,3-triazol-5-il)-5-[(S)-oxan-4-il(fenil)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il]propan-2-ol,

2-[3-(dimetil-1,2-oxazol-4-il)-5-[(S)-(4-fluorofenil)(oxan-4-il)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il]propan-2-ol,

2-[3-(dimetil-1H-1,2,3-triazol-5-il)-5-[(4-fluorofenil)(oxan-4-il)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il]propan-2-ol,

2-[3-(dimetil-1H-1,2,3-triazol-5-il)-6-fluoro-5-[(S)-oxan-4-il(fenil)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il]propan-2-ol,

2-{3-[4-(hidroximetil)-1-metil-1H-1,2,3-triazol-5-il]-5-[(S)-oxan-4-il(fenil)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il}propan-2-ol,

5-{7-metansulfonil-5-[(S)-oxan-4-il(fenil)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-3-il}-4-(²H₃)metil-1-metil-1H-1,2,3-triazol,

5-{5-[(S)-(4-fluorofenil)(oxan-4-il)metil]-7-metansulfonil-5H-pirido[3,2-b]indol-3-il}-4-(²H₃)metil-1-metil-1H-1,2,3-triazol,

2-{5-[(S)-(4-fluorofenil)(oxan-4-il)metil]-3-[4-(²H₃)metil-1-metil-1H-1,2,3-triazol-5-il]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il}propan-2-ol,

(1R)-1-ciclopropil-1-[3-(dimetil-1H-1,2,3-triazol-5-il)-6-fluoro-5-[(S)-oxan-4-il(fenil)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il]etan-1-ol,

2-{3-[5-(²H₃)metil-3-metil-1,2-oxazol-4-il]-5-[(S)-oxan-4-il(fenil)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il}propan-2-ol

2-{3-[4-(²H₃)metoxi-1-metil-1H-1,2,3-triazol-5-il]-5-[(S)-oxan-4-il(fenil)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il}propan-2-ol,

2-[3-(4-metoxi-1-metil-1H-1,2,3-triazol-5-il)-5-[(S)-oxan-4-il(fenil)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il]propan-2-ol,

(1R)-1-ciclopropil-1-[3-(dimetil-1H-1,2,3-triazol-5-il)-6-fluoro-5-[(S)-(2-fluorofenil)(oxan-4-il)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il]etan-1-ol,

2-{6-fluoro-5-[(S)-(2-fluorofenil)(oxan-4-il)metil]-3-[4-(²H₃)metil-1-metil-1H-1,2,3-triazol-5-il]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il}propan-2-ol,

(1S)-1-ciclopropil-1-{6-fluoro-3-[4-(²H₃)metil-1-metil-1H-1,2,3-triazol-5-il]-5-[(S)-oxan-4-il(fenil)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il}etan-1-ol,

(1R)-1-ciclopropil-1-{6-fluoro-3-[4-(²H₃)metil-1-metil-1H-1,2,3-triazol-5-il]-5-[(S)-oxan-4-il(fenil)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il}etan-1-ol,

2-{5-[(3-fluoropiridin-2-il)(oxan-4-il)metil]-3-[4-(²H₃)metil-1-metil-1H-1,2,3-triazol-5-il]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il}propan-2-ol,

2-{8-fluoro-5-[(S)-(2-fluorofenil)(oxan-4-il)metil]-3-[4-(²H₃)metil-1-metil-1H-1,2,3-triazol-5-il]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il}propan-2-ol,

2-{6-fluoro-3-[4-(²H₃)metil-1-metil-1H-1,2,3-triazol-5-il]-5-[(S)-oxan-4-il(fenil)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il}propan-2-ol,

2-{5-[(S)-(4,4-difluorociclohexil)(fenil)metil]-3-[4-(²H₃)metil-1-metil-1H-1,2,3-triazol-5-il]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il}propan-2-ol,

2-{8-fluoro-3-[4-(²H₃)metil-1-metil-1H-1,2,3-

triazol-5-il]-5-[(S)-oxan-4-il(fenil)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il}propan-2-ol,

(1R)-1-ciclopropil-1-{6-fluoro-5-[(S)-(2-fluorofenil)(oxan-4-il)metil]-3-[4-(²H₃)metil-1-metil-1H-1,2,3-triazol-5-il]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il}etan-1-ol,

2-{6-fluoro-5-[(5-metil-1,2-oxazol-3-il)(oxan-4-il)metil]-3-[4-(²H₃)metil-1-metil-1H-1,2,3-triazol-5-il]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il}propan-2-ol,

2-{6-cloro-3-[4-(²H₃)metil-1-metil-1H-1,2,3-triazol-5-il]-5-[(S)-oxan-4-il(fenil)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il}propan-2-ol,

2-[(R)-(4,4-difluorociclohexil)({9-fluoro-7-metansulfonil-3-[4-(²H₃)metil-1-metil-1H-1,2,3-triazol-5-il]-5H-pirido[3,2-b]indol-5-il})metil]-3-fluoropiridina,

(1S)-1-ciclopropil-1-{6-fluoro-5-[(S)-(2-fluorofenil)(oxan-4-il)metil]-3-[4-(²H₃)metil-1-metil-1H-1,2,3-triazol-5-il]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il}etan-1-ol,

2-{8-fluoro-5-[(5-metil-1,2-oxazol-3-il)(oxan-4-il)metil]-3-[4-(²H₃)metil-1-metil-1H-1,2,3-triazol-5-il]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il}propan-2-ol,

2-{5-[(5-cloropiridin-2-il)(oxan-4-il)metil]-3-[4-(²H₃)metil-1-metil-1H-1,2,3-triazol-5-il]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il}propan-2-ol,

2-{5-[(3-cloropiridin-2-il)(oxan-4-il)metil]-3-[4-(²H₃)metil-1-metil-1H-1,2,3-triazol-5-il]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il}propan-2-ol,

2-{5-[(4-cloropiridin-2-il)(oxan-4-il)metil]-3-[4-(²H₃)metil-1-metil-1H-1,2,3-triazol-5-il]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il}propan-2-ol,

2-{5-[(4,4-difluorociclohexil)(3-fluoropiridin-2-il)metil]-6-fluoro-3-[4-(²H₃)metil-1-metil-1H-1,2,3-triazol-

5-il]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il}propan-2-ol,

2-{6-fluoro-5-[(3-fluoropiridin-2-il)(oxan-4-il)metil]-3-[4-(²H₃)metil-1-metil-1H-1,2,3-triazol-5-il]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il}propan-2-ol,

2-{8-fluoro-5-[(3-fluoropiridin-2-il)(oxan-4-il)metil]-3-[4-(²H₃)metil-1-metil-1H-1,2,3-triazol-5-il]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il}propan-2-ol,

2-{3-[4-(²H₃)metoxi-1-(²H₃)metil-1H-1,2,3-triazol-5-il]-5-[(S)-oxan-4-il(fenil)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il}propan-2-ol,

2-{3-[4-metoxi-1-(²H₃)metil-1H-1,2,3-triazol-5-il]-5-[(S)-oxan-4-il(fenil)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il}propan-2-ol,

5-{7-metansulfonil-5-[(S)-oxan-4-il(fenil)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-3-il}-4-metoxi-1-metil-1H-1,2,3-triazol,

2-[3-(dimetil-1H-1,2,3-triazol-5-il)-6-fluoro-5-[(S)-oxan-4-il(fenil)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il}propan-2-amina,

N-{2-[3-(dimetil-1H-1,2,3-triazol-5-il)-6-fluoro-5-[(S)-oxan-4-il(fenil)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il}propan-2-il}acetamida,

N-{2-[3-(dimetil-1H-1,2,3-triazol-5-il)-6-fluoro-5-[(S)-oxan-4-il(fenil)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il}propan-2-il}metansulfonamida,

N-{2-[3-(dimetil-1H-1,2,3-triazol-5-il)-6-fluoro-5-[(S)-oxan-4-il(fenil)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il}propan-2-il}carbamato de metilo,

5-{6-metansulfonil-5-[(S)-oxan-4-il(fenil)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-3-il}-1,4-dimetil-1H-1,2,3-triazol,

5-{9-fluoro-6-metansulfonil-5-[(S)-oxan-4-

il(fenil)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-3-il}-4-(²H₃)metil-1-metil-1H-1,2,3-triazol,

5-{6-metansulfonil-9-metoxi-5-[(S)-oxan-4-il(fenil)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-3-il}-1,4-dimetil-1H-1,2,3-triazol,

N-[3-(dimetil-1H-1,2,3-triazol-5-il)-6-metansulfonil-5-[(S)-oxan-4-il(fenil)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-9-il]ciclopropansulfonamida,

5-{9-metansulfonil-5-[(S)-oxan-4-il(fenil)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-3-il}-1,4-dimetil-1H-1,2,3-triazol,

5-{9-metansulfonil-6,7-dimetoxi-5-[(S)-oxan-4-il(fenil)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-3-il}-4-(²H₃)metil-1-metil-1H-1,2,3-triazol,

5-{9-fluoro-7-metansulfonil-5-[(S)-oxan-4-il(fenil)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-3-il}-4-(²H₃)metil-1-metil-1H-1,2,3-triazol, o

2-{3-[4-(²H₃)metil-1-metil-1H-1,2,3-triazol-5-il]-5-[(S)-oxan-4-il(fenil)metil]-5H-pirido[3,2-b]indol-7-il}propan-2-ol,

y/o una sal, tautómero o estereoisómero de los mismos farmacéuticamente aceptables.