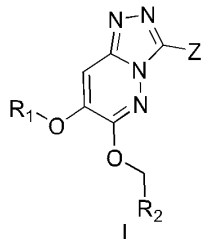


权利要求

1. 一种如式 I 所示的化合物、其顺反异构体、其对映异构体、其非对映异构体、其外消旋体、其溶剂合物、其水合物、其药学上可以接受的盐或其前体药物，



其中，Z 为含有 1、2 或 3 个独立选自氧、氮和硫的杂原子的 5 元或 6 元杂芳环，所述杂芳环任选地被一个或多个 R₃ 取代；

R₃ 独立地为卤素、氰基、C₁₋₆ 烷基、C₁₋₆ 烷氧基(C₁₋₆)烷基、C₃₋₆ 环烷基(C₁₋₆)烷氧基、C₃₋₆ 环烷基(C₁₋₆)烷氧基(C₁₋₆)烷基、C₃₋₇ 杂环烷基或 C₃₋₇ 杂环烷基(C₁₋₆)烷基，R₃ 任选地被 1-4 个独立选自下列基团的取代基取代：卤素、氰基、羟基、C₁₋₆ 烷基和 C₁₋₆ 烷基氨基；

R₁ 为 H、C₁₋₆ 烷基、C₃₋₆ 环烷基、C₃₋₇ 杂环烷基、C₃₋₆ 环烷基(C₁₋₆)烷基或 C₁₋₆ 烷氧基(C₁₋₆)烷基，R₁ 任选地被 1-4 个独立选自下列基团的取代基取代：卤素、氰基、羟基、C₁₋₆ 烷基、C₁₋₆ 烷氧基和 C₁₋₆ 烷基氨基；

R₂ 为杂环基、苯基或杂芳基，R₂ 任选地被 1-4 个独立选自下列基团的取代基取代：卤素、氰基、氧代、-R、-OR、-C(O)R、-NHR、C₃₋₆ 烯基环烷基、-NR₄R₅、-C(O)NR₄R₅、-COOH、-SO₂-C₁₋₆ 烷基和 -SO₂NR₆R₇；

R 独立地为 H、C₁₋₆ 烷基、C₁₋₆ 烯基、C₃₋₆ 环烷基、C₃₋₆ 环烯基、杂环基、芳基或杂芳基，R 任选地被 1-3 个 R' 取代；

R' 独立地为卤素、氰基、羟基、C₃₋₆ 环烷基、C₁₋₆ 烷基氨基、C₁₋₆ 烷基、(C₁₋₆)烷氧基、氰基或卤素取代的 C₁₋₃ 烷基、C₁₋₆ 烷基砜、杂环基、杂芳基、被 1-3 个 R⁻¹ 取代的 5-10 元的杂芳基、-(C=O)NR₈R₉、被 1-3 个氰基取代的 C₃₋₆ 环烷基、-(C=O)R⁻²、C₆₋₁₈ 芳基或被 1-3 个 R⁻³ 取代的 3-9 元的杂环基、-SO₂R₁₀；

R⁻¹ 独立地为 C₁₋₆ 烷基；

R₈ 和 R₉ 独立地为 H 或 C₁₋₆ 烷基，或者 R₈ 和 R₉ 与其相连的氮原子一起形成 5 或 6 元的杂环基，杂原子选自 N、S 和 O 中一种或多种，个数为 1、2 或 3 个；

R⁻² 为 C₃₋₆ 环烷基或 C₁₋₆ 烷基；

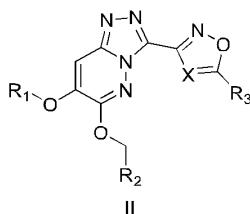
R⁻³ 独立地为 C₁₋₆ 烷基；

R₁₀ 为 C₁₋₆ 烷基；

R₄ 和 R₅ 独立的为 H、C₁₋₆ 烷基或 C₃₋₆ 环烷基，或者 R₄ 和 R₅ 与其相连的氮原子一起形成 5 或 6 元的杂环基，杂原子选自 N、S 和 O 中一种或多种，个数为 1、2 或 3 个；可各自任选地被 1-5 个取代基取代，所述取代基独立地选自：氨基、卤素、羟基、C₁₋₆ 烷基和 C₁₋₆ 烷氧基；

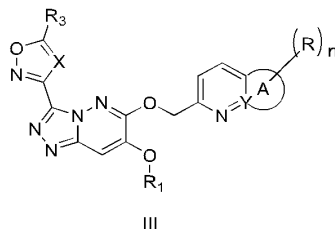
R₆ 和 R₇ 独立地为 C₁₋₆ 烷基。

2. 如权利要求 1 所述的如式 I 所示的化合物、其顺反异构体、其对映异构体、其非对映异构体、其外消旋体、其溶剂合物、其水合物、其药学上可以接受的盐或其前体药物，其特征在于，所述的式 I 为如式 II 所示，



其中，X 为 N 或 CH；

较佳地，所述的式 II 为如式 III 所示：



其中，Y 为 C 或 N；A 为 5-6 元杂环、5-6 元杂芳环或不存在，所述的 5-6 元杂环和 5-6 元杂芳环中的杂原子独立地为 N，个数为 1 个或 2 个；n 为 0-4 任一整数。

3. 如权利要求 1 所述的如式 I 所示的化合物、其顺反异构体、其对映异构体、其非对映异构体、其外消旋体、其溶剂合物、其水合物、其药学上可以接受的盐或其前体药物，其特征在于，

R₃ 为 C₁₋₆ 烷基或 C₁₋₆ 烷氧基(C₁₋₆)烷基，R₃ 任选地被 1-4 个羟基取代；

R₁ 为 C₁₋₆ 烷基或 C₃₋₆ 环烷基(C₁₋₆)烷基，R₁ 任选地被 1-4 个卤素取代；

R₂ 为苯基或杂芳基；R₂ 任选地被 1-4 个独立选自下列基团的取代基取代：卤素、氰基、氧代、-R、-OR、-C(O)R、C₃₋₆ 烯基环烷基、-NR₄R₅、-C(O)NR₄R₅、-COOH、-SO₂-C₁₋₆ 烷基和-SO₂NR₆R₇；

其中，所述的-R 为-C₁₋₆ 烷基、-C₁₋₆ 烯基、-C₃₋₆ 环烷基、-杂环基、-芳基或-杂芳基；所述的-OR 为-O-C₁₋₆ 烷基或-O-杂环基；所述的-C(O)R 为-C(O)-C₁₋₆ 烷基、-C(O)-C₁₋₆ 烯基、-C(O)-C₃₋₆ 环烷基或-C(O)-芳基。

4. 如权利要求 1-3 至少一项所述的如式 I 所示的化合物、其顺反异构体、其对映异构体、其非对映异构体、其外消旋体、其溶剂合物、其水合物、其药学上可以接受的盐或其前体药物，其特征在于，R₃ 为 C₁₋₆ 烷基或 C₁₋₆ 烷氧基(C₁₋₆)烷基，R₃ 任选地被 1-4 个羟基取代；

R₁ 为 C₁₋₆ 烷基或 C₃₋₆ 环烷基(C₁₋₆)烷基，R₁ 任选地被 1-4 个卤素取代；

R₂ 为苯基或杂芳基，所述的杂芳基为 5-6 元单环杂芳基或 9-10 元双环杂芳基，所述的 9-10 元双环杂芳基为 5-6 元杂芳基并 5-6 元杂芳基的双环杂芳基；

R₂ 任选地被 1-4 个独立选自下列基团的取代基取代：卤素、氰基、氧代、-R、-OR、C₃₋₆ 烯基环烷

基、-NR₄R₅、-SO₂-C₁₋₆烷基和-SO₂NR₆R₇；所述的-R为-C₁₋₆烷基、-C₁₋₆烯基、-C₃₋₆环烷基、-杂环基、-芳基或-杂芳基；所述的-OR为-O-C₁₋₆烷基或-杂环基；所述的-C(O)-R为-C(O)-C₁₋₆烷基、-C(O)-C₁₋₆烯基、-C(O)-C₃₋₆环烷基或-C(O)-芳基。

5. 如权利要求1-3至少一项所述的如式I所示的化合物、其顺反异构体、其对映异构体、其非对映异构体、其外消旋体、其溶剂合物、其水合物、其药学上可以接受的盐或其前体药物，其特征在于，R₃为C₁₋₆烷基；

R₁为C₁₋₆烷基；

R₂为9-10元双环杂芳基，所述的9-10元双环杂芳基为5-6元杂芳基并5-6元杂环基的双环杂芳基；

R₂任选地被1-4个独立选自下列基团的取代基取代：卤素、氰基、氧代、-R、-OR、C₃₋₆烯基环烷基、-NR₄R₅、-SO₂-C₁₋₆烷基和-SO₂NR₆R₇；所述的-R为-C₁₋₆烷基、-C₁₋₆烯基、-C₃₋₆环烷基、-杂环基、-芳基或-杂芳基；所述的-OR为-O-C₁₋₆烷基或-杂环基；所述的-C(O)-R为-C(O)-C₁₋₆烷基、-C(O)-C₁₋₆烯基、-C(O)-C₃₋₆环烷基或-C(O)-芳基。

6. 如权利要求1-3至少一项所述的如式I所示的化合物、其顺反异构体、其对映异构体、其非对映异构体、其外消旋体、其溶剂合物、其水合物、其药学上可以接受的盐或其前体药物，其特征在于，

R₁为C₁₋₆烷基；

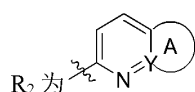
R₃为C₁₋₆烷基；

R₂为杂芳基；所述的杂芳基为5-10元杂芳基，杂原子为N，个数为1、2或3个；R₂任选地被1-4个独立选自下列基团的取代基取代：氰基、-R或-OR；R独立地为C₁₋₆烷基或杂环基，R任选地被1-3个R'取代；R'独立地为卤素、羟基、被1-3个R³取代的3-9元的杂环基、R³⁻¹取代的5-10元的杂芳基或(C₁₋₆)烷氧基。

7. 如权利要求6所述的如式I所示的化合物、其顺反异构体、其对映异构体、其非对映异构体、其外消旋体、其溶剂合物、其水合物、其药学上可以接受的盐或其前体药物，其特征在于，

R₁为C₁₋₆烷基；

R₃为C₁₋₆烷基；



R₂为；Y为C或N；A为5-6元杂环，所述的5-6元杂环中的杂原子为N，个数为

1个或2个；R₂任选地被1-4选自下列的取代基取代：C₁₋₆烷基或杂环基取代；

R'独立地为羟基或被1-3个R³⁻¹取代的5-10元的杂芳基；

当R₂任选地被1-4个C₁₋₆烷基或杂环基取代时，所述的取代的位置位于A环的杂原子上。

8. 如权利要求1所述的如式I所示的化合物、其顺反异构体、其对映异构体、其非对映异构体、其外消旋体、其溶剂合物、其水合物、其药学上可以接受的盐或其前体药物，其特征在于，Z为含有1、2或3个独立选自氧、氮和硫的杂原子的5元或6元杂芳环，所述杂芳环可被一个或多个R₃取代；

R_3 选自卤素、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烷氧基(C_{1-6})烷基、 C_{3-6} 环烷基(C_{1-6})烷氧基、 C_{3-6} 环烷基(C_{1-6})烷氧基(C_{1-6})烷基、 C_{3-7} 杂环烷基、 C_{3-7} 杂环烷基(C_{1-6})烷基，其各自任选地被 1-4 个独立选自下列基团的取代基取代：卤素、氰基、羟基、 C_{1-6} 烷基和 C_{1-6} 烷基氨基；

R_1 选自 H、 C_{1-6} 烷基、 C_{3-6} 环烷基、 C_{3-7} 杂环烷基、 C_{3-6} 环烷基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷氧基(C_{1-6})烷基，其各自任选地被 1-4 个独立选自下列基团的取代基取代：卤素、氰基、羟基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烷氧基和 C_{1-6} 烷基氨基；

R_2 为杂环基、苯基或杂芳基；其各自任选地被 1-4 个独立选自下列基团的取代基取代：卤素、氰基、氧代、-R、-OR、-C(O)R、-NHR、 C_{3-6} 烯基环烷基、-NR₄R₅、-C(O)NR₄R₅、-COOH、-SO₂- C_{1-6} 烷基；

R 选自 H、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烯基、 C_{3-6} 环烷基、杂环基、芳基、杂芳基，其可各自任选地被 1-3 个 R' 取代；

R' 选自卤素、氰基、羟基、 C_{3-6} 环烷基、 C_{1-6} 烷基氨基、 C_{1-6} 烷基、(C_{1-6})烷氧基、氰基或卤素取代的 C_{1-3} 烷基、 C_{1-6} 烷基砜、杂环基或杂芳基；

R_4 或 R_5 独立地为 H 或 C_{1-6} 烷基，所述 C_{1-6} 烷基任选地被 1-5 个取代基取代，所述取代基独立地选自：氨基、卤素、羟基、 C_{1-6} 烷基或 C_{1-6} 烷氧基。

9. 如权利要求 1 所述的如式 I 所示的化合物、其顺反异构体、其对映异构体、其非对映异构体、其外消旋体、其溶剂合物、其水合物、其药学上可以接受的盐或其前体药物，其特征在于， R_3 独立地为 C_{1-6} 烷基或 C_{1-6} 烷氧基(C_{1-6})烷基； R_3 任选地被 1-4 个羟基取代；

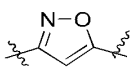
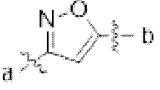
和/或，Z 为含有 2 个独立选自氧和氮的杂原子的 5 元杂芳环；

和/或， R_1 为 C_{1-6} 烷基或 C_{3-6} 环烷基(C_{1-6})烷基， R_1 任选地被 1-4 个卤素取代；

和/或， R_2 为苯基或杂芳基；所述的杂芳基为 5-10 元杂芳基，所述 5-10 元杂芳基中杂原子为氮和/或氧，杂原子个数为 1-4 个，例如为 5-6 元单环杂芳基或 9-10 元双环杂芳基；所述的 9-10 元双环杂芳基例如为 5-6 元杂芳基并 5-6 元杂芳基的双环杂芳基、或、5-6 元杂芳基并 5-6 元杂环基的双环杂芳基；

和/或，所述的 R_2 任选地被 1-4 个独立选自下列基团的取代基取代：卤素、氰基、氧代、-R、-OR、-NHR、 C_{3-6} 烯基环烷基、-NR₄R₅、-SO₂- C_{1-6} 烷基和 -SO₂NR₆R₇，较佳地为氰基、-R 和 -OR。

10. 如权利要求 1-9 至少一项所述的如式 I 所示的化合物、其顺反异构体、其对映异构体、其非对映异构体、其外消旋体、其溶剂合物、其水合物、其药学上可以接受的盐或其前体药物，其特征在于，当所述的 Z 为含有 1、2 或 3 个独立选自氧、氮和硫的杂原子的 5 元杂芳环时，所述的含有 1、2 或 3 个独立选自氧、氮和硫的杂原子的 5 元杂芳环为含 2 个独立选自氧、氮和硫的杂原子的 5 元杂芳

环，例如为异噁唑，又例如为 ，还例如为 ，其 b 端与所述的 R_3 连接；

和/或，当 R_3 为多个时，所述的 R_3 为相同或不同；

和/或, 所述的 R_3 的个数为 1 个或 2 个;

和/或, 当所述的 R_3 为 C_{1-6} 烷基时, 所述的 C_{1-6} 烷基为甲基、乙基、正丙基或异丙基, 例如为甲基;

和/或, 当所述的 R_3 为 C_{1-6} 烷氧基 C_{1-6} 烷基时, 其烷基端与所述的 Z 相连;

和/或, 所述的 R_3 为 C_{1-6} 烷氧基 C_{1-6} 烷基时, 所述的 C_{1-6} 烷氧基为甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、异丁氧基、仲丁氧基或叔丁氧基, 例如为甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基, 又例如为甲氧基;

和/或, 当所述的 R_3 为 C_{1-6} 烷氧基 C_{1-6} 烷基时, 所述的 C_{1-6} 烷基为甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基, 例如为甲基、乙基、正丙基或异丙基, 又例如为甲基;

和/或, 当所述的 R_3 被 1-4 个取代基取代时, 所述的取代基的个数为 1 个、2 个、3 个或 4 个, 例如为 1 个或 2 个;

和/或, 当所述的 R_3 为 C_{1-6} 烷基时, 所述的 C_{1-6} 烷基为甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基, 例如为甲基、乙基、正丙基或异丙基, 又例如为甲基;

和/或, 当所述的 R_1 为 C_{1-6} 烷基时, 所述的 C_{1-6} 烷基例如为甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基;

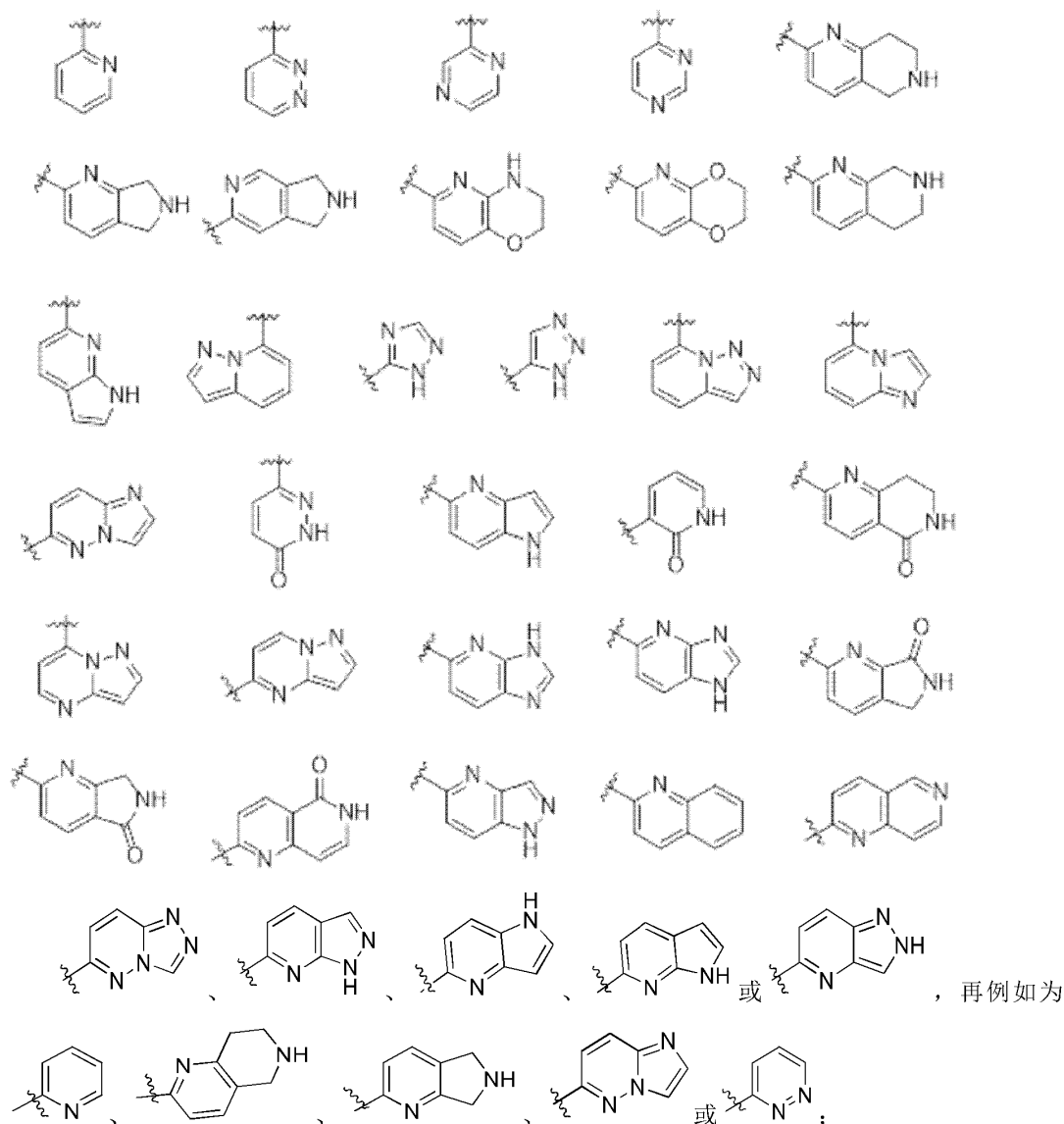
和/或, 当所述的 R_1 被卤素取代时, 所述的卤素为氟、氯、溴或碘, 例如为氟;

和/或, 当所述的 R_1 被 1-4 个取代基取代时, 所述的取代基的个数为 1 个、2 个、3 个或 4 个, 例如为 1 个或 2 个;

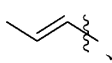
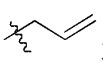
和/或, 当所述的 R_1 为 C_{3-6} 环烷基(C_{1-6})烷基时, 所述的 C_{1-6} 烷基为甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基, 还例如为甲基;

和/或, 当所述的 R_1 为 C_{3-6} 环烷基(C_{1-6})烷基时, 所述的 C_{3-6} 环烷基为环丙基、环丁基、环戊基或环己基, 例如为环丙基或环丁基;

和/或, 当所述的 R_2 为杂芳基时, 所述的杂芳基为 5-10 元杂芳基, 杂原子为氮和/或氧, 个数 1-4 个; 例如为 5-6 元单环杂芳基或 9-10 元双环杂芳基, 又例如为 5-6 元单环杂芳基、5-6 元杂芳基并 5-6 元杂芳基的 9-10 元双环杂芳基、或、5-6 元杂芳基并 5-6 元杂环基的 9-10 元双环杂芳基; 还例如为三唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、吡唑并吡啶基、吡咯并吡啶基、吡啶并吡咯酮基、蔡啶基、喹啉基、咪唑并吡啶基、二噁烷并吡啶基、吡啶并噁嗪基、吡唑并嘧啶基、吡啶并吡唑基、吡啶并吡咯基、吡啶并吡唑基、吡啶酮基、吡啶并咪唑基、吡啶并三唑基、吡啶酮基、吡啶并三唑基、哒嗪酮基、杂蔡基、蔡啶酮基、咪唑并哒嗪基、吡啶基、二氮杂蔡基、四氢蔡啶基或蔡啶基, 还例如为

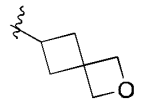


基、异丁基、仲丁基或叔丁基，例如为甲基、乙基、正丙基、异丙基或叔丁基；

和/或，当所述的 R 独立地为 C₁₋₆ 烯基时，所述的 C₁₋₆ 烯基为乙烯、、 或 ；

和/或，当所述的 R 独立地为 C₃₋₆ 环烷基时，所述的 C₃₋₆ 环烷基为环丙基、环丁基、环戊基或环己基，例如为环丁基或环丙基；

和/或，当所述的 R 独立地为杂环基时，所述的杂环基为 3-10 元杂环基，杂原子为氮和/或氧，个数为 1 或 2 或 3 个，又例如为 5-6 元单杂环基或 7-8 元杂螺环基，杂原子独立地为氮和/或氧，个数为 1 或 2 个，还例如为吗啉基、吡咯烷基、氮杂环丁基、氧杂环丁基、哌啶基、四氢吡喃、四氢呋喃或

2-氧-[3,3]庚烷基，还例如为 、、、、、、 或 ，再例如为 、、 或 ；

和/或，所述的 R 为 C₃₋₆ 环烯基时，所述的 C₃₋₆ 环烯基为环己烯、环丙基或环丁基，例如为 ；

和/或，当所述的 R 为芳基时，所述的芳基为 C₆₋₁₄ 芳基，例如为苯基、萘基、菲基或蒽基，又例如为苯基；

和/或，当所述的 R 为杂芳基时，所述的杂芳基为 5-10 元杂芳基，杂原子为氮和/或氧，个数为 1、2 或 3 个，例如为 5 元单环杂芳基，杂原子为氮和/或氧，个数为 2 或 3 个，又例如为嘧啶基、噁二唑

基或异噁唑，又例如为 、 或 ；

和/或，当所述的 R' 独立地为卤素时，所述的卤素为氟、氯、溴或碘，例如为氟；

和/或，当所述的 R' 独立地为 C₃₋₆ 环烷基时，所述的 C₃₋₆ 环烷基为环丙基、环丁基、环戊基或环己基，例如为环丙基；

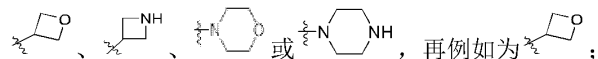
和/或，所述的 R' 独立地为 C₁₋₆ 烷基氨基时，所述的 C₁₋₆ 烷基氨基为 C₁₋₃ 烷基氨基，例如为乙基氨基，还例如为 -NH₂；

和/或，当所述的 R' 独立地为 C₁₋₆ 烷基时，所述的 C₁₋₆ 烷基为如甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基，又例如为甲基、乙基、正丙基或异丙基，还例如为甲基；

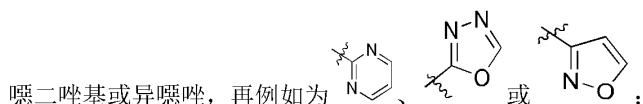
和/或，当所述的 R' 独立地为 C₁₋₆ 烷氧基时，所述的 C₁₋₆ 烷氧基为甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、异丁氧基、仲丁氧基或叔丁氧基，例如为甲氧基、乙氧基、正丙氧基或异丙氧基，又例如为甲氧基；

和/或，当所述的 R' 独立地为氰基或卤素取代的 C₁₋₃ 烷基时，所述的 C₁₋₃ 烷基为甲基、乙基、正丙基或异丙基，例如为甲基；

和/或, 所述的 R^* 独立地为杂环基时, 所述的杂环基为 3-6 元单环杂环基, 杂原子为氮和/或氧, 个数为 1 或 2 个, 例如为四氢呋喃基、氧杂环丁基、氮杂环丁基、吗啉基或哌嗪基, 又例如为 、



和/或, 当所述的 R^* 独立地为杂芳基时, 所述的杂芳基为 5-10 元杂芳基, 杂原子为氮和/或氧, 个数为 1、2 或 3 个, 例如为 5 元单环杂芳基, 杂原子为氮和/或氧, 个数为 2 或 3 个, 又例如为嘧啶基、



和/或, 当所述的 R^* 独立地为被 1-3 个 R^{*1} 取代的 5-10 元的杂芳基时, 所述的杂芳基为 5-6 元杂芳基, 杂原子为氮和/或氧, 个数为 1、2 或 3 个, 例如为噁二唑或噁二唑, 例如为  或 ;

和/或, 当所述的 R^{*1} 独立地为 C_{1-6} 烷基时, 所述的 C_{1-6} 烷基为甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基, 例如为如甲基、乙基、正丙基或异丙基, 还例如为甲基;

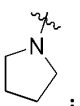
和/或, 当所述的 R^* 独立地为被 1-3 个氧基取代的 C_{3-6} 环烷基时, 所述的 C_{3-6} 环烷基为 5 元双环桥环烷基, 例如为 ;

和/或, 当所述的 R^* 独立地为 C_{6-14} 芳基时, 所述的 C_{6-14} 芳基为苯基、萘基、菲基或蒽基, 例如为苯基;

和/或, 当所述的 R^* 独立地为被 1-3 个 R^{*3} 取代的 3-6 元的杂环基时, 所述的 3-6 元的杂环基为 4-6 元单杂环基, 杂原子为氮和/或氧, 个数为 1 或 2 个, 例如为哌嗪基或氧杂环丁基, 还例如为  或 ;

和/或, 当所述的 R^{*3} 独立地为 C_{1-6} 烷基时, 所述的 C_{1-6} 烷基为如甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基, 例如为如甲基、乙基、正丙基或异丙基, 还例如为甲基;

和/或, 当所述的 R_8 和 R_9 独立地为 C_{1-6} 烷基时, 所述的 C_{1-6} 烷基为甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基, 例如为甲基、乙基、正丙基或异丙基, 还例如为甲基;

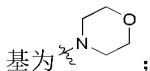
和/或, 当所述的 R_8 和 R_9 与其相连的氮原子一起形成 5 或 6 元的杂环基时, 所述的 5 或 6 元的杂环基为 ;

和/或, 当所述的 R_{10} 为 C_{1-6} 烷基时, 所述的 C_{1-6} 烷基为甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基, 例如为甲基、乙基、正丙基或异丙基, 又例如为甲基;

和/或, 当所述的 R_4 和 R_5 独立地为 C_{1-6} 烷基时, 所述的 C_{1-6} 烷基为甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基, 还例如为甲基、乙基或正丙基;

和/或, 当所述的 R_4 和 R_5 独立地为 C_{3-6} 环烷基时, 所述的 C_{3-6} 环烷基为环丙基、环丁基、环戊基或环己基, 例如为环己基;

和/或, 当 R_4 和 R_5 与其相连的氮原子一起形成 5 或 6 元的杂环烷基时, 所述的 5 或 6 元的杂环烷基为



和/或, 当所述的 R_4 和 R_5 独立地被 1-5 个取代基取代, 所述取代基独立地为卤素时, 所述的卤素为氟、氯、溴或碘, 例如为氟;

和/或, 所述的 R_4 和 R_5 独立地被 1-5 个取代基取代时, 所述的取代基的个数为 1 个或 2 个或 3 个;

和/或, 所述的 R_6 和 R_7 独立地为 C_{1-6} 烷基时, 所述的 C_{1-6} 烷基为甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基或叔丁基, 例如为甲基、乙基、正丙基或异丙基, 还例如为甲基;

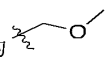
和/或, 当 R_2 被 1-4 个取代基取代, 所述的取代基为 $-R$ 时, 所述的 $-R$ 为 $-C_{1-6}$ 烷基、 $-C_{1-6}$ 烯基、 $-C_{3-6}$ 环烷基、 $-$ 杂环基、 $-$ 芳基或 $-$ 杂芳基

和/或, 当 R_2 被 1-4 个取代基取代, 所述的取代基为 $-OR$ 时, 所述的 $-OR$ 为 $-O-C_{1-6}$ 烷基或 $-O-$ 杂环基;

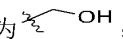
和/或, 当 R_2 被 1-4 个取代基取代, 所述的取代基为 $-C(O)R$ 时, 所述的 $-C(O)R$ 为 $-C(O)-C_{1-6}$ 烷基、 $-C(O)-C_{1-6}$ 烯基、 $-C(O)-C_{3-6}$ 环烷基或 $-C(O)-$ 芳基。

11. 如权利要求 8 所述的如式 I 所示的化合物、其顺反异构体、其对映异构体、其非对映异构体、其外消旋体、其溶剂合物、其水合物、其药学上可以接受的盐或其前体药物, 其特征在于, 当所述的

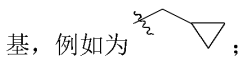
R_3 为 C_{1-6} 烷氧基 C_{1-6} 烷基时, 所述的 C_{1-6} 烷氧基 C_{1-6} 烷基为 C_{1-3} 烷氧基 C_{1-3} 烷基, 例如为



和/或, 当所述的 R_3 为羟基取代的 C_{1-6} 烷基时, 所述的 R_3 为



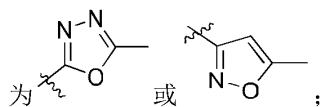
和/或, 当所述的 R_1 为 C_{3-6} 环烷基(C_{1-6})烷基时, 所述的 C_{3-6} 环烷基(C_{1-6})烷基为 C_3 环烷基(C_{1-3})烷基, 例如为



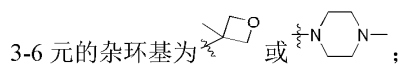
和/或, 当所述的 R_2 被 2 个、3 个或 4 个取代基取代时, 所述的取代基为相同或不同;

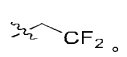
和/或, 当所述的 R_2 为 5-6 元杂芳基并 5-6 元杂环基的 9-10 元双环杂芳基时, 所述的取代基取代位置位于所述的 5-6 元杂环基中的杂原子上;

和/或, 当所述的 R' 独立地为 R'^{-1} 取代的 5-10 元的杂芳基时, 所述的 R'^{-1} 取代的 5-10 元的杂芳基

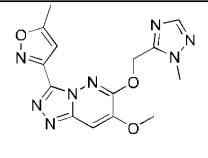
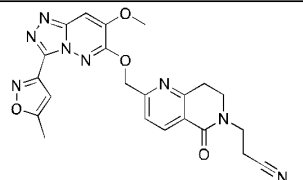
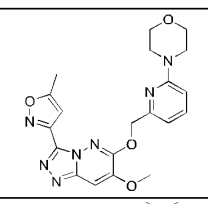
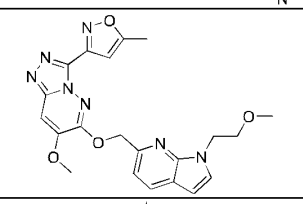
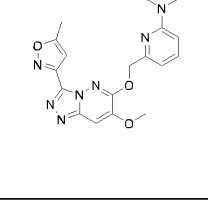
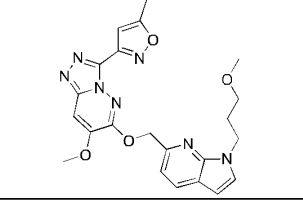
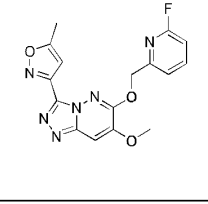
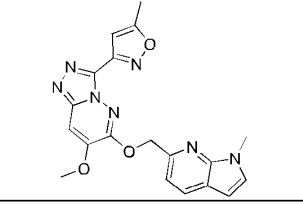
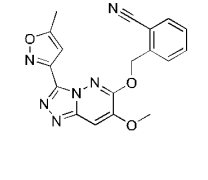
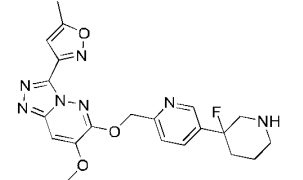


和/或, 当所述的 R' 独立地为被 1-3 个 R^{3-3} 取代的 3-6 元的杂环基时, 所述的被 1-3 个 R^{3-3} 取代的



和/或, 当所述的 R_4 和 R_5 独立地被 1-5 个取代基取代时, 所述的 R_4 和 R_5 独立地为  CF_3 或  CF_2 。

12. 如权利要求 1 所述的如式 I 所示的化合物、其顺反异构体、其对映异构体、其非对映异构体、其外消旋体、其溶剂合物、其水合物、其药学上可以接受的盐或其前体药物, 其特征在于, 所述的化合物 I 为如下任一化合物:

实施例	结构	实施例	结构
1		91	
2		92	
3		93	
4		94	
5		95	

6		96	
7		97	
8		98	
9		99	
10		100	
11		101	
12		102	
13		103	

14		104	
15		105	
16		106	
17		107	
18		108	
19		109	
20		110	
21		111	

22		112	
23		113	
24		114	
25		115	
26		116	
27		117	
28		118	
29		119	

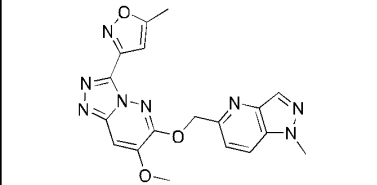
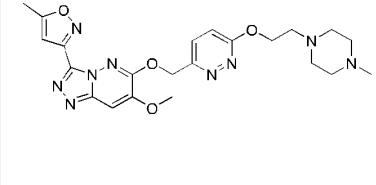
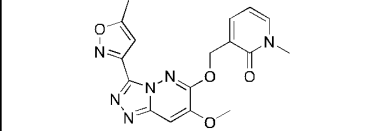
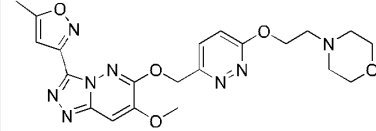
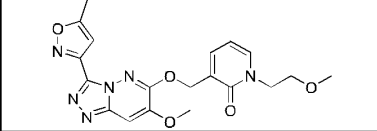
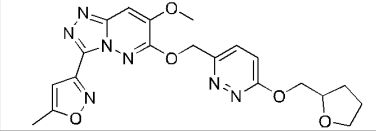
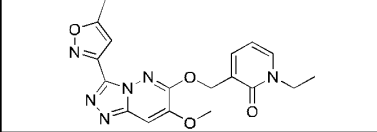
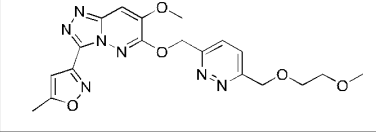
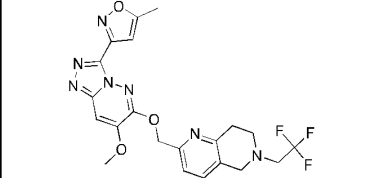
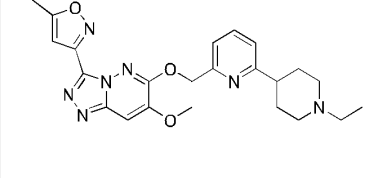
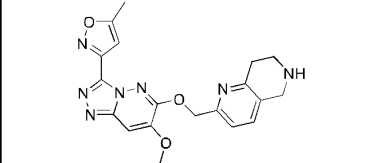
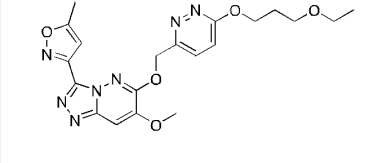
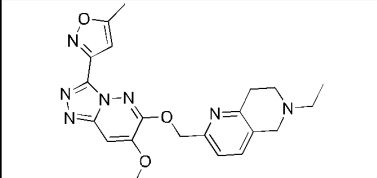
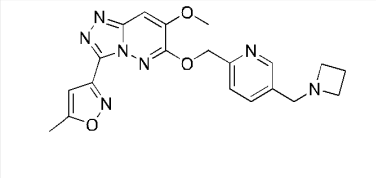
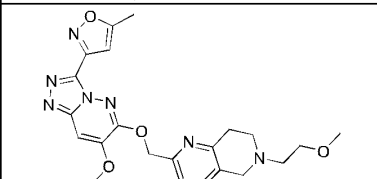
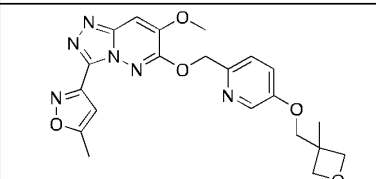
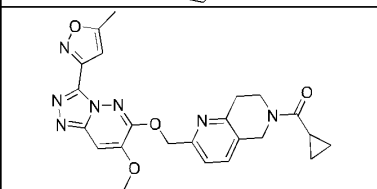
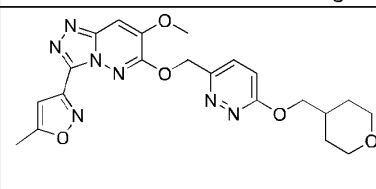
30		120	
31		121	
32		122	
33		123	
34		124	
35		125	
36		126	
37		127	
38		128	

39		129	
40		130	
41		131	
42		132	
43		133	
44		134	
45		135	
46		136	
47		137	

48		138	
49		139	
50		140	
51		141	
52		142	
53		143	
54		144	
55		145	

56		146	
57		147	
58		148	
59		149	
60		150	
61		151	
62		152	
63		153	
64		154	

65		155	
66		156	
67		157	
68		158	
69		159	
70		160	
71		161	
72		162	

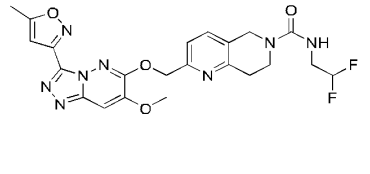
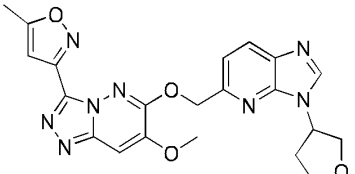
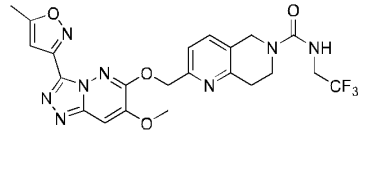
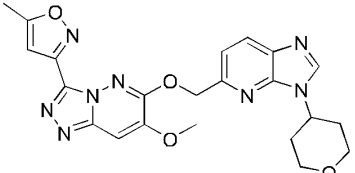
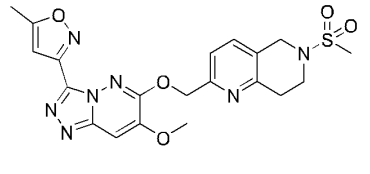
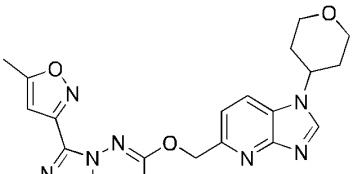
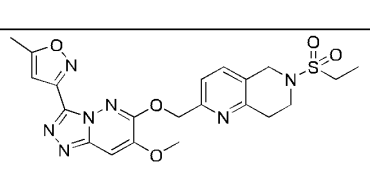
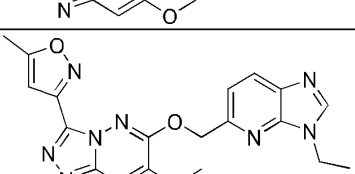
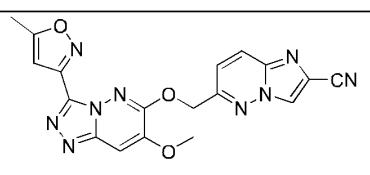
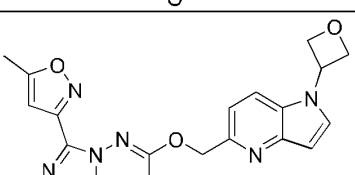
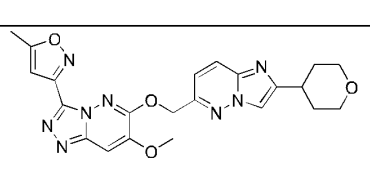
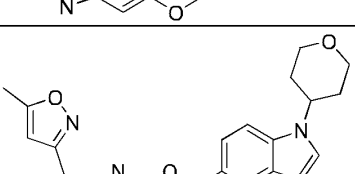
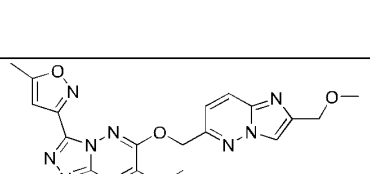
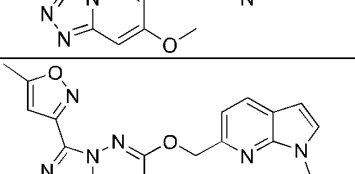
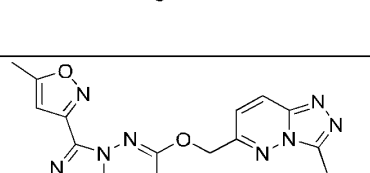
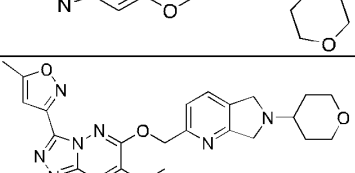
73		163	
74		164	
75		165	
76		166	
77		167	
78		168	
79		169	
80		170	
81		171	

82		172	
83		173	
84		174	
85		175	
86		176	
87		177	
88		178	
89		179	

90		180	
181		220	
182		221	
183		222	
184		223	
185		224	
186		225	
187		226	
188		227	

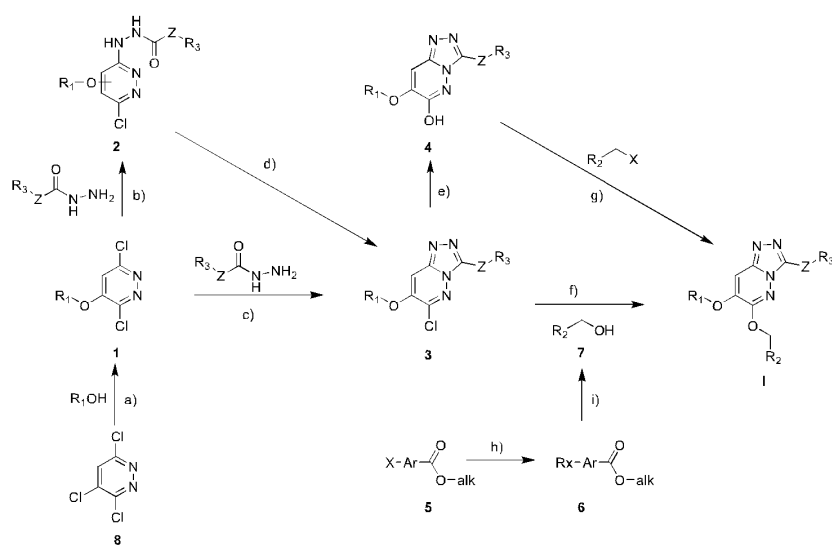
189		228	
190		229	
191		230	
192		231	
193		232	
194		233	
195		234	
196		235	
197		236	

198		237	
199		238	
200		239	
201		240	
202		241	
203		242	
204		243	
205		244	
206		245	

207		246	
208		247	
209		248	
210		249	
211		250	
212		251	
213		252	
214		253	

215		254	
216		255	
217		256	
218		257	
219		258	

13. 如权利要求 1-12 至少一项所述的如式 I 所示的化合物、其顺反异构体、其对映异构体、其非对映异构体、其外消旋体、其溶剂合物、其水合物或其药学上可以接受的盐或其前体药物,其特征在于,其包括以下步骤:



其中，X 为卤素，Z、R₁ 和 R₂ 的定义均如权利要求 1-12 任一项所述。

14. 一种药物组合物，其包含如权利要求 1-12 至少一项所述的如式 I 所示的化合物、其顺反异构体、其对映异构体、其非对映异构体、其外消旋体、其溶剂合物、其水合物或其药学上可以接受的盐或其前体药物，以及药学上可接受的载体。

15. 一种如权利要求 1-12 至少一项所述的如式 I 所示的化合物、其顺反异构体、其对映异构体、其非对映异构体、其外消旋体、其溶剂合物、其水合物或其药学上可以接受的盐或其前体药物，或如权利要求 14 所述的药物组合物在制备药物中的用途。

16. 如权利要求 15 所述的用途，其特征在于，所述的药物用于治疗、预防或改善与 $\alpha 5$ -GABA_A 受体有关的疾病；所述的与 $\alpha 5$ -GABA_A 受体有关的疾病例如认知疾病、阿尔茨海默氏病、记忆障碍、唐氏综合征、肌萎缩侧索硬化症、药物成瘾、下肢不宁综合征、认知不足、多梗塞性痴呆、疼痛、中风和注意缺陷中的一种或多种，又例如疼痛。

17. 一种如权利要求 1-12 至少一项所述的如式 I 所示的化合物、其顺反异构体、其对映异构体、其非对映异构体、其外消旋体、其溶剂合物、其水合物或其药学上可以接受的盐或其前体药物，或者如权利要求 14 所述的药物组合物在制备用于治疗或预防与 $\alpha 5$ -GABA_A 受体有关的疾病的药物中的用途。

18. 一种如权利要求 1-12 至少一项的如式 I 所示的化合物、其顺反异构体、其对映异构体、其非对映异构体、其外消旋体、其溶剂合物、其水合物或其药学上可以接受的盐或其前体药物，或者如权利要求 14 所述的药物组合物在制备用于治疗或预防疾病的药物中的用途，所述的疾病为疼痛、阿尔茨海默氏病、多梗塞性痴呆和脑卒中的一种或多种。

19. 一种治疗或预防与 $\alpha 5$ -GABA_A 受体有关的疾病的方法，其包括向患者施用有效剂量的如权利要求 1-14 至少一项所述的如式 I 所示的化合物、其顺反异构体、其对映异构体、其非对映异构体、其外消旋体、其溶剂合物、其水合物或其药学上可以接受的盐或其前体药物，或者如权利要求 12 所述的药物组合物。

20. 一种治疗或预防疾病的方法，包括向患者施用有效剂量如权利要求 1-12 至少一项所述的如式 I 所示的化合物、其顺反异构体、其对映异构体、其非对映异构体、其外消旋体、其溶剂合物、其水合物或其药学上可以接受的盐或其前体药物，或者如权利要求 14 所述的药物组合物，所述的疾病为疼痛、阿尔茨海默氏病、多梗塞性痴呆和脑卒中的一种或多种。