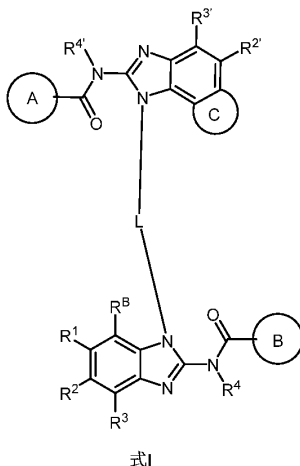


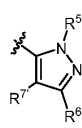
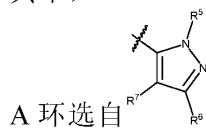
权 利 要 求

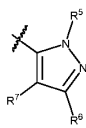
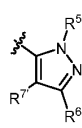
1、具有通式 (I) 的杂环酰胺类化合物、其可药用的盐：



5

其中，



A 环选自 ；B 环选自 ；C 选自被 0~4 个 R^i 取代的饱和或不饱和的 4~6 元碳环或杂环；

R^4 、 $R^{4'}$ 分别选自氢、 $C_1\sim C_6$ 烷基、卤素；

10 R^5 、 $R^{5'}$ 分别选自氢、 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_3\sim C_6$ 环烷基、 $C_3\sim C_6$ 炔烃基、 $C_3\sim C_6$ 烯烃基、卤素取代的 $C_1\sim C_6$ 烷基；

R^6 、 R^7 分别选自氢、 $C_1\sim C_6$ 烷基、硝基、卤素、卤素取代的 $C_1\sim C_6$ 烷基，或者 R^6 、 R^7 及与 R^6 、 R^7 连接的原子三者之间环化成饱和或不饱和的 4~6 元碳环或杂环；

15 $R^{6'}$ 、 $R^{7'}$ 分别选自氢、 $C_1\sim C_6$ 烷基、硝基、卤素、卤素取代的 $C_1\sim C_6$ 烷基，或者 $R^{6'}$ 、 $R^{7'}$ 及与 $R^{6'}$ 、 $R^{7'}$ 连接的原子三者之间环化成饱和或不饱和的 4~6 元碳环或杂环；

R^1 、 R^2 、 R^3 、 $R^{2'}$ 、 $R^{3'}$ 分别选自氢、 $-OR^d$ 、 $-NR^dR^e$ 、卤素、CN、 $C(O)OR^d$ 、 $C_1\sim C_6$ 烷基、卤素取代的 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $-SO_2NH_2$ 、 $-C(O)NR^aR^b$ ；

R^a 、 R^b 、 R^d 、 R^e 分别选自氢、 $C_1\sim C_6$ 烷基；

20 R^B 选自氢、卤素、被 0~4 个 R^h 取代的 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $-OR^f$ 、 $-NR^fR^g$ 、 $-C(O)R^f$ 、 $-CO_2R^f$ 、 $-C(O)NR^fR^g$ 、 $-NR^fC(O)R^g$ 、 $-NR^fC(O)R$ ；或者 R^B 、 R^1 以及 R^B 、 R^1 连接的原子三者之间环化成饱和或不饱和的 4~6 元碳环或杂环； R^f 、 R^g 分别选自氢、被 0~4 个 R^h 取代的 $C_1\sim C_6$ 烷基、被 0~4 个 R^i 取代的 3~6 元环烷基、被 0~4 个 R^i 取代的 3~6 元杂环烷基；

R^h 选自卤素、 $-OR^j$ 、 $-NR^jR^k$ 、 $-C(O)R^j$ 、 $-CO_2R^k$ 、 $-C(O)NR^jR^k$ 、 $-NR^jC(O)R^k$ 、-

$\text{NR}^j\text{C}(\text{O})\text{R}^k$ 、被 0~4 个 R^i 取代的 3~6 元环烷基、被 0~4 个 R^i 取代的 3~6 元杂环烷基；

R^i 选自卤素、羟基、氨基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷氧基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷氨基、卤素取代的 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基、氰基；

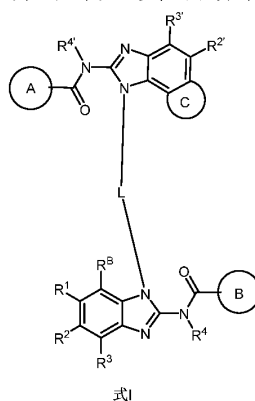
R^j 、 R^k 分别选自氢、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基；

- 5 L 选自被 0~4 个 R^n 取代的 $\text{C}_4\sim\text{C}_6$ 的亚烷基、被 0~4 个 R^n 取代的 $\text{C}_4\sim\text{C}_6$ 的亚烯基、被 0~4 个 R^n 取代的 $\text{C}_4\sim\text{C}_6$ 的亚炔基；所述 $\text{C}_4\sim\text{C}_6$ 的亚烷基、 $\text{C}_4\sim\text{C}_6$ 的亚烯基、 $\text{C}_4\sim\text{C}_6$ 的亚炔基中的碳原子可以被 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{NR}^m$ -取代；

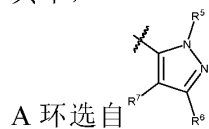
R^m 选自氢、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基；

- 10 R^n 选自卤素、羟基、氨基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷氧基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷氨基、卤素取代的 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基。

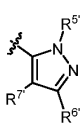
2、具有通式 (I) 的杂环酰胺类化合物、其可药用的盐：



其中，



A 环选自



- 15 B 环选自

R^4 、 $\text{R}^{4'}$ 分别选自氢、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基、卤素；

R^5 、 $\text{R}^{5'}$ 各自独立地为分别选自氢、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ 环烷基、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ 炔烃基、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ 烯烃基、卤素取代的 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基、 $-(\text{CH}_2)_s-\text{L}_3$ ；其中，s 为 1、2 或 3， L_3 选自： $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ 环烷基、3~6 元杂环基；

- 20 R^6 、 R^7 分别选自氢、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基、硝基、卤素、卤素取代的 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基，或者 R^6 、 R^7 及与 R^6 、 R^7 连接的原子三者之间环化成饱和或不饱和的 4~6 元碳环或杂环；

$\text{R}^{6'}$ 、 $\text{R}^{7'}$ 分别选自氢、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基、硝基、卤素、卤素取代的 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基，或者 $\text{R}^{6'}$ 、 $\text{R}^{7'}$ 及与 $\text{R}^{6'}$ 、 $\text{R}^{7'}$ 连接的原子三者之间环化成饱和或不饱和的 4~6 元碳环或杂环；

- 25 R^1 、 R^2 、 R^3 、 $\text{R}^{2'}$ 、 $\text{R}^{3'}$ 分别选自氢、 $-\text{OR}^d$ 、 $-\text{NR}^d\text{R}^e$ 、卤素、CN、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^d$ 、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基、卤素取代的 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基、 $-\text{SO}_2\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^a\text{R}^b$ 、 $-\text{L}_1\text{-L}_2\text{-C}(\text{O})\text{NR}^a\text{R}^b$ ；

R^a 、 R^b 、 R^d 、 R^e 分别选自氢、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基；

L¹选自: $-(CH_2)_t-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-C(O)-$; 其中, t 为 0、1、2 或 3;

L²选自: C₁~C₆ 烷基、C₂~C₆ 炔烃基、C₂~C₆ 烯烃基、C₃~C₆ 环烷基、3-6 元杂环基;

R^B选自氢、卤素、被 0~4 个 R^h 取代的 C₁~C₆ 烷基、 $-OR^f$ 、 $-NR^fR^g$ 、 $-C(O)R^f$ 、 $-CO_2R^f$ 、 $-C(O)NR^fR^g$; 或者 R^B、R¹ 以及与 R^B、R¹ 连接的原子三者之间环化成饱和或不饱和的 4~6 元碳环或杂环;

R^f、R^g 分别选自氢、被 0~4 个 R^h 取代的 C₁~C₆ 烷基、被 0~4 个 Rⁱ 取代的 3~6 元环烷基、被 0~4 个 Rⁱ 取代的 3~6 元杂环烷基;

R^h选自卤素、 $-OR^j$ 、 $-NR^jR^k$ 、 $-C(O)R^j$ 、 $-CO_2R^k$ 、 $-C(O)NR^jR^k$ 、被 0~4 个 Rⁱ 取代的 3~6 元环烷基、被 0~4 个 Rⁱ 取代的 3~6 元杂环烷基;

Rⁱ选自卤素、羟基、氨基、C₁~C₆ 烷基、C₁~C₆ 烷氧基、C₁~C₆ 烷基氨基、卤素取代的 C₁~C₆ 烷基、氰基;

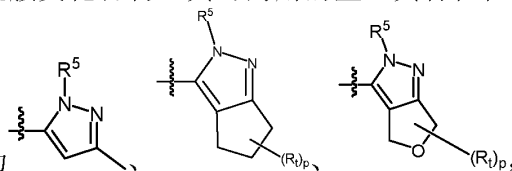
R^j、R^k 分别选自氢、C₁~C₆ 烷基;

L 选自被 0~4 个 Rⁿ 取代的 C₄~C₆ 的亚烷基、被 0~4 个 Rⁿ 取代的 C₄~C₆ 的亚烯基、被 0~4 个 Rⁿ 取代的 C₄~C₆ 的亚炔基; 所述 C₄~C₆ 的亚烷基、C₄~C₆ 的亚烯基、C₄~C₆ 的亚炔基中的碳原子可以被 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-NR^m-$ 取代;

R^m选自氢、C₁~C₆ 烷基;

Rⁿ选自卤素、羟基、氨基、C₁~C₆ 烷基、C₁~C₆ 烷氧基、C₁~C₆ 烷基氨基、卤素取代的 C₁~C₆ 烷基。

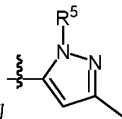
3. 如权利要求 1 或 2 所述的式 I 杂环酰胺类化合物、其可药用的盐, 其特征在



于, A 环与 B 环相同或不同, 各自独立地为各 R_t 独立地选自: C₁~C₆ 烷基、卤素取代的 C₁~C₆ 烷基、C₁~C₆ 烷氧基; p 为 0、1、2、3 或 4;

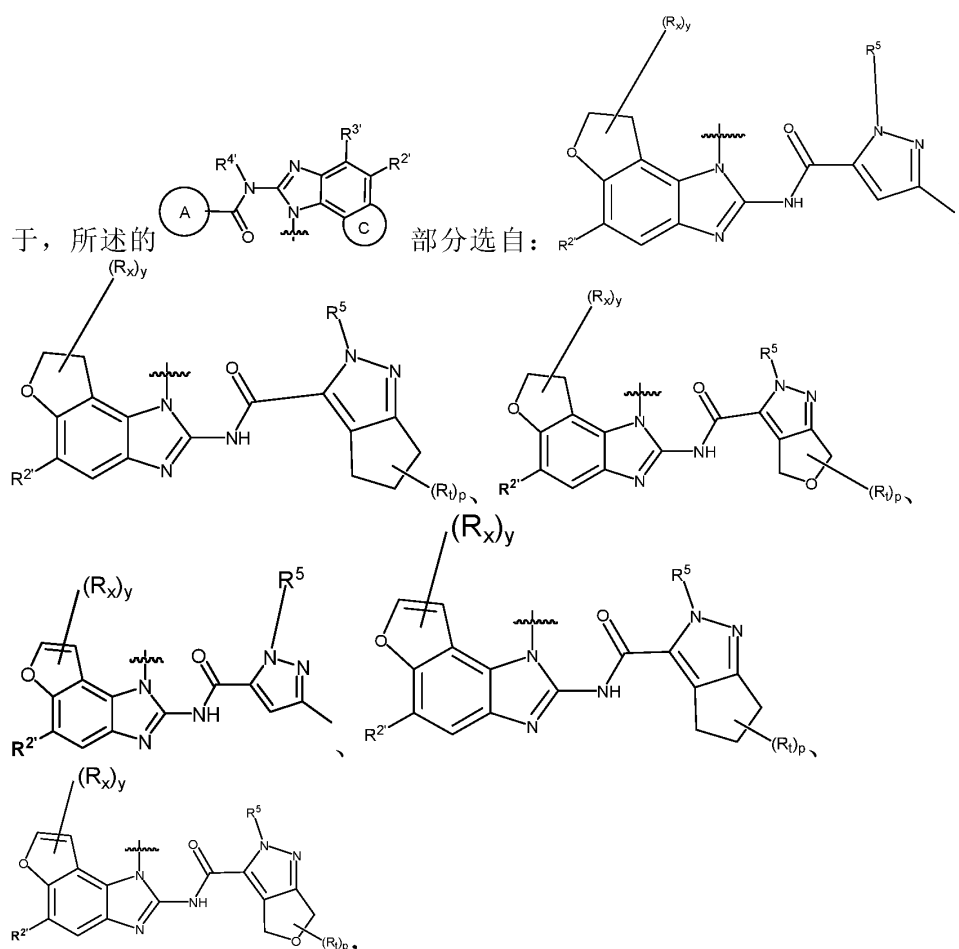
R⁵ 的定义如权利要求 1 所述。

4. 如权利要求 1 或 2 所述的式 I 杂环酰胺类化合物、其可药用的盐, 其特征在



A 环与 B 环相同, 各自独立地为, 其中, R⁵ 选自: 氢、C₁~C₆ 烷基、C₃~C₆ 烯烃基、卤素取代的 C₁~C₆ 烷基。

5. 如权利要求 1 或 2 所述的式 I 杂环酰胺类化合物、其可药用的盐, 其特征在



5 其中, y 为 0、1、2、3 或 4;

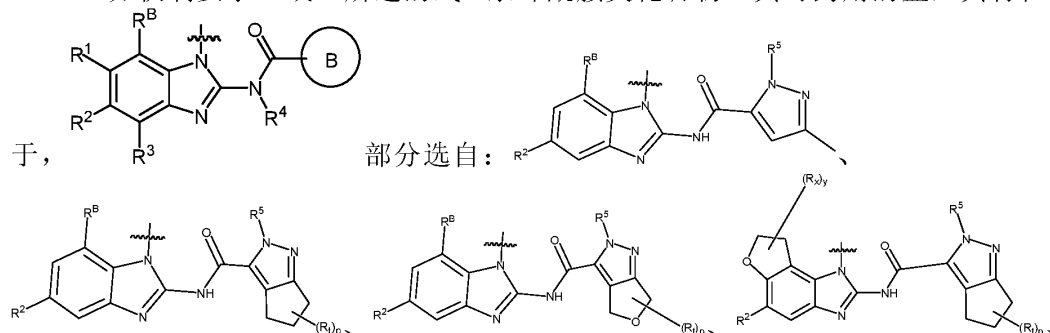
p 为 0、1、2、3 或 4;

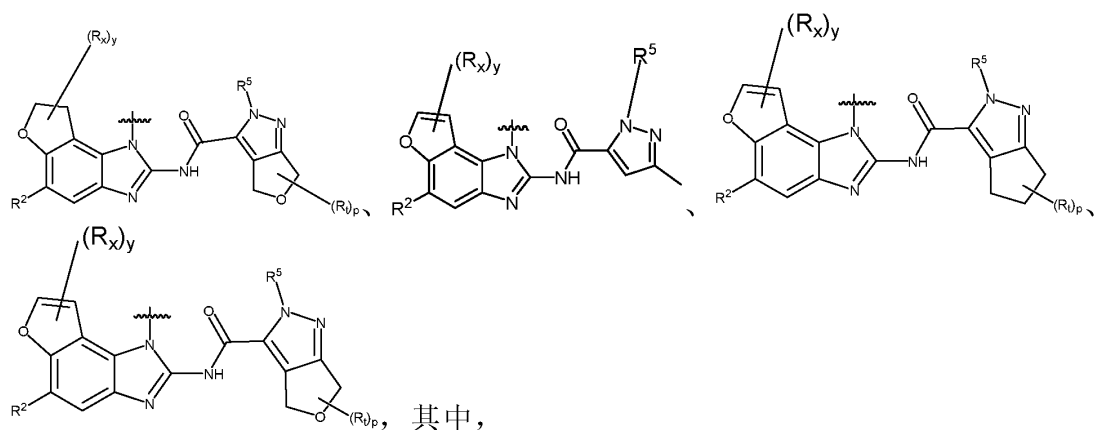
各 R_x 独立地选自：卤素、羟基、氨基、C₁~C₆ 烷基、卤素取代的 C₁~C₆ 烷基，

各 R_i 独立地选自：C₁~C₆ 烷基、卤素取代的 C₁~C₆ 烷基、C₁~C₆ 烷氧基，

R⁵、R^{2'}的定义如权利要求 1 所述。

10 6. 如权利要求 1 或 2 所述的式 I 杂环酰胺类化合物、其可药用的盐, 其特征在





y 为 0、1、2、3 或 4;

p 为 0、1、2、3 或 4;

5 各 R_x 独立地选自: 卤素、羟基、氨基、 $C_1\sim C_6$ 烷基、卤素取代的 $C_1\sim C_6$ 烷基;

各 R_i 独立地选自: $C_1\sim C_6$ 烷基、卤素取代的 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 烷氧基;

R^5 选自: 氢、 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_3\sim C_6$ 烯烷基、卤素取代的 $C_1\sim C_6$ 烷基;

R^2 独立地选自: 氢、 $-\text{SO}_2\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^a\text{R}^b$;

其中, R^a 、 R^b 各自独立地选自: 氢、 $C_1\sim C_6$ 烷基;

10 R^B 选自: 氢、 $-\text{OR}^f$;

R^f 自氢、被 0~4 个 R^h 取代的 $C_1\sim C_6$ 烷基、被 0~4 个 R^i 取代的 3~6 元环烷基、被 0~4 个 R^i 取代的 3~6 元杂环烷基;

R^h 选自卤素、 $-\text{OR}^j$ 、 $-\text{NR}^j\text{R}^k$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^j$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}^k$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^j\text{R}^k$ 、 $-\text{NR}^j\text{C}(\text{O})\text{R}^k$ 、被 0~4 个 R^i 取代的 3~6 元环烷基、被 0~4 个 R^i 取代的 3~6 元杂环烷基;

15 R^i 选自卤素、羟基、氨基、 $C_1\sim C_6$ 烷基;

R^j 、 R^k 分别独立地选自氢、 $C_1\sim C_6$ 烷基。

7. 如权利要求 1 或 2 所述的具有通式 (I) 的杂环酰胺类化合物、其可药用的盐, 其特征在于, R^B 选自氢、 $-\text{OR}^f$;

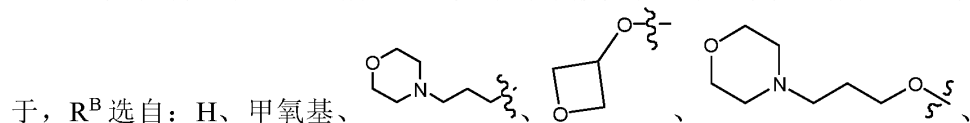
20 R^f 自氢、被 0~4 个 R^h 取代的 $C_1\sim C_6$ 烷基、被 0~4 个 R^i 取代的 3~6 元环烷基、被 0~4 个 R^i 取代的 3~6 元杂环烷基;

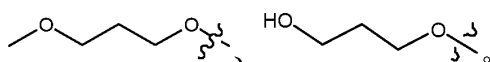
R^h 选自卤素、 $-\text{OR}^j$ 、 $-\text{NR}^j\text{R}^k$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^j$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}^k$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^j\text{R}^k$ 、 $-\text{NR}^j\text{C}(\text{O})\text{R}^k$ 、被 0~4 个 R^i 取代的 3~6 元环烷基、被 0~4 个 R^i 取代的 3~6 元杂环烷基;

R^i 选自卤素、羟基、氨基、 $C_1\sim C_6$ 烷基;

R^j 、 R^k 分别独立地选自氢、 $C_1\sim C_6$ 烷基。

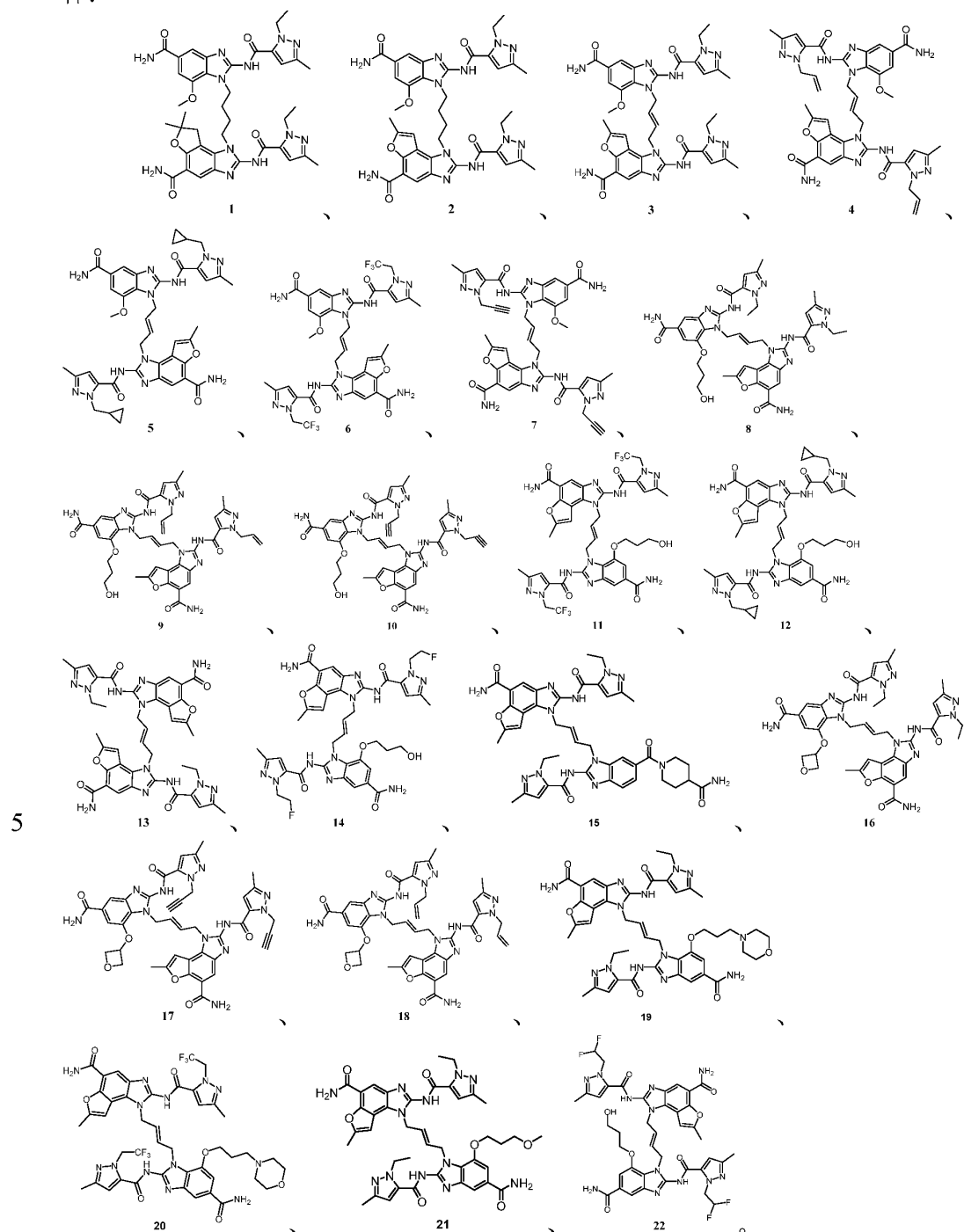
25 8. 如权利要求 1 或 2 所述的式 I 杂环酰胺类化合物、其可药用的盐, 其特征在





- 9、如权利要求 1 或 2 所述的杂环酰胺类化合物、其可药用的盐，其特征在于，
 R^4 、 $R^{4'}$ 分别为氢；
 R^5 、 $R^{5'}$ 分别选自氢、 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_3\sim C_6$ 环烷基、 $C_3\sim C_6$ 炔烃基、 $C_3\sim C_6$ 烯烃基、
 5 卤素取代的 $C_1\sim C_6$ 烷基；
 R^6 、 R^7 分别选自氢、 $C_1\sim C_6$ 烷基， R^6 、 R^7 及与 R^6 、 R^7 连接的原子三者之间环化成饱和或不饱和的 4~6 元碳环或杂环；
 $R^{6'}$ 、 $R^{7'}$ 分别选自氢、 $C_1\sim C_6$ 烷基， $R^{6'}$ 、 $R^{7'}$ 及与 $R^{6'}$ 、 $R^{7'}$ 连接的原子三者之间环化成饱和或不饱和的 4~6 元碳环或杂环；
 10 R^1 、 R^3 、 $R^{3'}$ 分别选自氢、 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $-OR^d$ ；
 R^2 、 $R^{2'}$ 分别选自氢、 $-SO_2NH_2$ 、 $-C(O)NR^aR^b$ ；
 R^a 、 R^b 分别选自氢、 $C_1\sim C_6$ 烷基；
 R^d 选自氢、 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_3\sim C_6$ 环烷基、 $C_3\sim C_6$ 炔烃基、 $C_3\sim C_6$ 烯烃基、卤素取代的 $C_1\sim C_6$ 烷基；
 15 R^B 选自氢、被 0~4 个 R^h 取代的 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $-OR^f$ ；
 R^f 自氢、被 0~4 个 R^h 取代的 $C_1\sim C_6$ 烷基、被 0~4 个 R^i 取代的 3~6 元环烷基、被 0~4 个 R^i 取代的 3~6 元杂环烷基；
 R^h 选自卤素、 $-OR^j$ 、 $-NR^jR^k$ 、 $-C(O)R^j$ 、 $-CO_2R^k$ 、 $-C(O)NR^jR^k$ 、 $-NR^jC(O)R^k$ 、 $-NR^jC(O)R^k$ 、被 0~4 个 R^i 取代的 3~6 元环烷基、被 0~4 个 R^i 取代的 3~6 元杂环烷基；
 20 R^i 选自卤素、羟基、氨基、 $C_1\sim C_6$ 烷基；
 R^j 、 R^k 分别选自氢、 $C_1\sim C_6$ 烷基；
 L 选自 $C_4\sim C_6$ 的亚烯基、 $C_4\sim C_6$ 的亚烷基。
 10、如权利要求 1 或 2 所述的杂环酰胺类化合物、其可药用的盐，其特征在于，
 R^6 、 R^7 分别独立地选自氢、 $C_1\sim C_6$ 烷基；
 25 $R^{6'}$ 、 $R^{7'}$ 分别独立地选自氢、 $C_1\sim C_6$ 烷基；
 R^1 、 R^3 、 $R^{3'}$ 分别独立地选自氢、 $C_1\sim C_6$ 烷基；
 R^2 、 $R^{2'}$ 分别独立地选自氢、 $-SO_2NH_2$ 、 $-C(O)NH_2$ ；
 R^B 选自氢、 $-OR^f$ ；
 R^f 自氢、被 0~4 个 R^h 取代的 $C_1\sim C_6$ 烷基、被 0~4 个 R^i 取代的 3~6 元环烷基、被
 30 0~4 个 R^i 取代的 3~6 元杂环烷基；
 R^h 选自卤素、 $-OR^j$ 、 $-NR^jR^k$ 、 $-C(O)R^j$ 、 $-CO_2R^k$ 、 $-C(O)NR^jR^k$ 、 $-NR^jC(O)R^k$ 、 $-NR^jC(O)R^k$ 、被 0~4 个 R^i 取代的 3~6 元环烷基、被 0~4 个 R^i 取代的 3~6 元杂环烷基；
 R^i 选自卤素、羟基、氨基、 $C_1\sim C_6$ 烷基；
 R^j 、 R^k 分别独立地选自氢、 $C_1\sim C_6$ 烷基。
 35 11、如权利要求 1 或 2 所述的杂环酰胺类化合物、其可药用的盐，为如下任一

种:

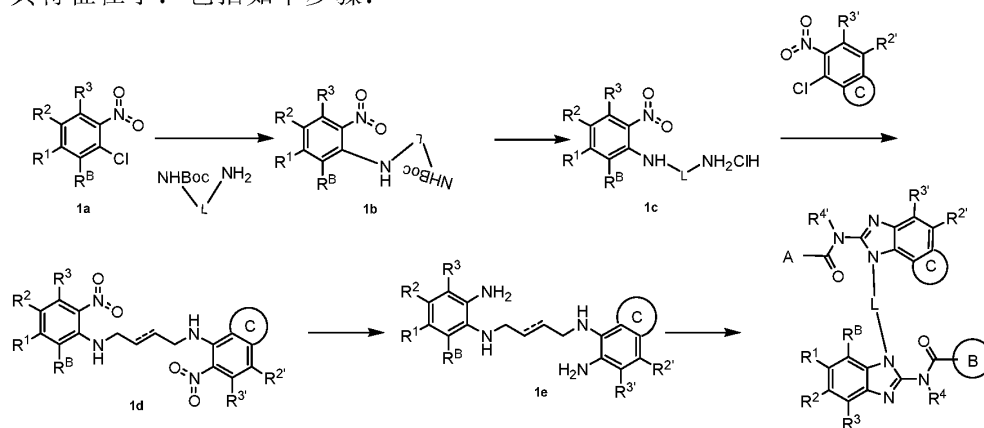


12、一种药物组合物，其含有治疗有效量的一种或多种如权利要求 1-11 中任一项所述的具有通式 (I) 的的杂环酰胺类化合物、其可药用的盐，及药学上可接受的载体。

13、一种药物组合物，其含有治疗有效量的一种或多种如权利要求 1-11 中任一项

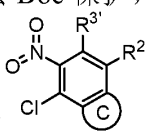
所述的具有通式 (I) 的杂环酰胺类化合物、其可药用的盐, 及药学上可接受的辅料。

14、如权利要求 1 所述具有通式 (I) 的杂环酰胺类化合物、其可药用的盐的制备方法, 其特征在于: 包括如下步骤:

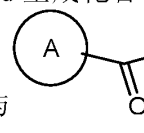
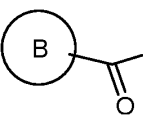


5 (i) 在惰性溶剂中, 碱存在下, 原料 1a 与单 Boc 保护的二胺 NH-Boc-L-NH_2 发生亲核取代反应, 生成化合物 1b;

(ii) 在惰性溶剂中, 酸存在下, 化合物 1b 脱去 Boc 保护, 生成中间体 1c;

(iii) 在惰性溶剂中, 碱存在下, 中间体 1c 与  发生取代反应, 生成中间体 1d;

10 (iv) 在惰性溶剂中, 在还原剂存在下, 中间体 1d 生成化合物 1e;

(v) 在惰性溶剂中, 催化剂存在下, 化合物 1e 与  或  反应, 获得目标化合物 I;

式中, A、B、L、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^B 、 $\text{R}^{2'}$ 、 $\text{R}^{3'}$ 、 $\text{R}^{4'}$ 的定义如权利要求 1 所述。

15 15、权利要求 1-11 所述的具有通式 (I) 的杂环酰胺类化合物、其可药用的盐在制备免疫佐剂或激活 STING 药物中的用途。

16、权利要求 1-11 所述的具有通式 (I) 的杂环酰胺类化合物、其可药用的盐在制备治疗与 STING 活性相关的疾病的药物中的用途, 所述与 STING 活性相关的疾病是与炎性、自身免疫性疾病、感染性疾病、癌症、癌前期综合征相关的疾病中的一种或几种。