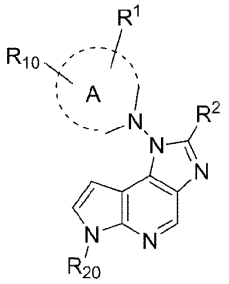
权 利 要 求 书

1. 一种氰基取代的环肼衍生物，其特征在于：为由如下结构式所示的化合物或其立体异构体，几何异构体，互变异构体，消旋体，水合物，溶剂化物，代谢产物以及药学上可接受的盐或前药；



其中，环 A 为杂环基、稠合杂环基、螺杂环基；

所述 R^1 为相同或不相同的一个或多个取代基；

所述 R^1 选自氢、羟基、卤素、氨基、氰基、取代或未取代的烷基、取代或未取代的烷氧基、取代或未取代的杂烷基、取代或未取代的环烷基、取代或未取代的杂环烷基；

所述 R_{10} 选自氰基或末端为氰基的基团；

R^2 选自氢、羟基、卤素、硝基、氨基、取代的胺基、取代或未取代的烷基、取代或未取代的杂烷基、取代或未取代的环烷基、取代或未取代的杂环烷基；

R_{20} 选自氢、氨基保护基。

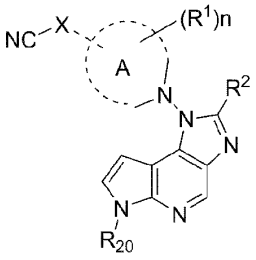
2. 如权利要求 1 所述的一种氰基取代的环肼衍生物，其特征在于：

所述环 A 为由 4-9 个原子构成的杂环基、或由 6-12 个原子构成的稠合杂双环基，或由 6-12 个原子构成的螺杂双环；

其中，杂原子为 1-3 个，选自氮、氧或硫。

3. 如权利要求 1 所述的一种氰基取代的环肼衍生物，其特征在于，为如下结构

所示的化合物：



其中，n选自于1-3的自然数；

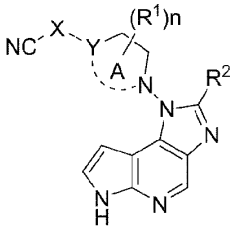
所述X选自取代或未取代的亚烷基、取代或未取代的杂亚烷基、$-(CH_2)_mN(R_3)-$、$-(CH_2)_mC(O)N(R_3)-$、$-(CH_2)_mC(O)-$；

X跟环A的连接键为单键或双键；

R_3选自氢，取代或未取代的烷基、取代或未取代的杂烷基；

m选自于1-3的自然数。

4. 如权利要求1所述的一种氰基取代的环肼衍生物，其特征在于，为如下结构所示的化合物：

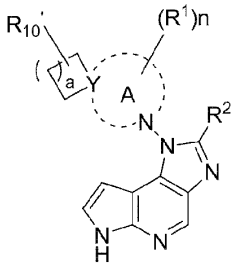


其中A，X，R^1，和R^2如上定义；

Y选自CR^4，N；

R^4选自氢、羟基、取代或未取代的烷基、取代或未取代的烷氧基。

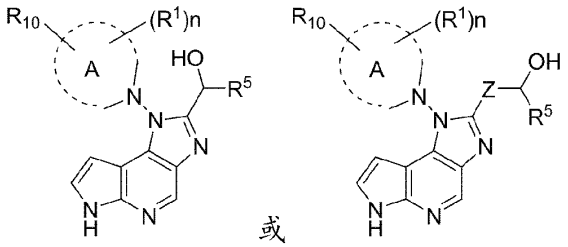
5. 如权利要求1所述的一种氰基取代的环肼衍生物，其特征在于，为如下结构所示的化合物：



其中，所述 a 为 0，1，2，3；

所述 R_{10} 选自末端为氰基的基团。

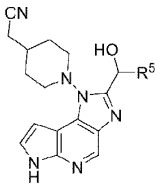
6. 如权利要求 1 所述的一种氰基取代的环肼衍生物，其特征在于，为如下结构所示的化合物：



其中，Z 选自取代或未取代的亚烷基；

R^5 选自氢、取代或未取代的烷基，取代或未取代的杂烷基。

7. 如权利要求 1 所述的一种氰基取代的环肼衍生物，其特征在于，为如下结构所示的化合物，及其立体异构体，同位素异构体，盐：



其中，R^5 选自氢、甲基；

8. 如权利要求 1-6 任一所述的一种氰基取代的环肼衍生物的制备方法，其特征

在于，由如下工艺步骤制造而成：

S1、以 II-1 为原料，其上的 NH 基团被亚硝基化形成亚硝基产物 II-2；

S2、亚硝基产物 II-2 经还原反应转化成化合物 II-3；

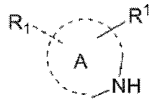
S3、将化合物 II-3 与化合物 II-4，在碱性条件下反应，得到化合物 II-5；

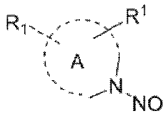
S4、化合物 II-5 中的硝基用氢化还原成氨基得到化合物 II-6；

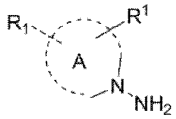
S5、化合物 II-6 经关环反应获得化合物 II-7；

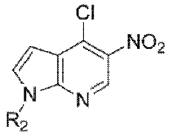
S6、化合物 II-7 脱保护得到目标产物；

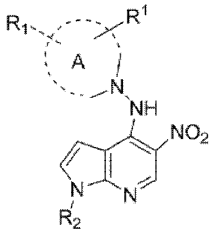
其中，II-1 至 II-7 的结构如下所示：

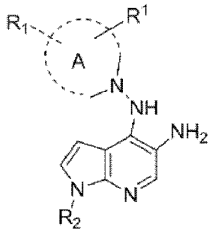

II-1

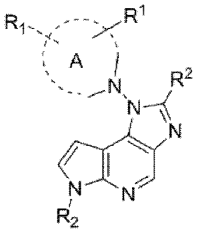

II-2


II-3


II-4


II-5


II-6


II-7

。

9. 一种药物组合物，其特征在于：包含权利要求1-7任一项所述氰基取代的环肼衍生物和药学上可接受的载体、赋形剂、稀释剂、辅剂或媒介物中的至少

一种；

其中，所述氰基取代的环肼衍生物的用量为药物组合物总质量的0.01-99.9%。

10. 如权利要求8所述的一种药物组合物，其特征在于：

还包含附加治疗剂；

所述附加治疗剂选自抗炎药、免疫调节剂或免疫抑制剂、神经营养因子、用于治疗心血管疾病的活性剂、用于治疗糖尿病的活性剂和用于治疗自体免疫疾病的活性剂。

11. 如权利要求1-7任一项所述的化合物或如权利要求9或8所述的药物组合物在制备药物中的用途，其特征在于：

用于预防、处理、治疗或减轻患者自体免疫疾病或增殖性疾病，和/或用于抑制或调节蛋白激酶活性。