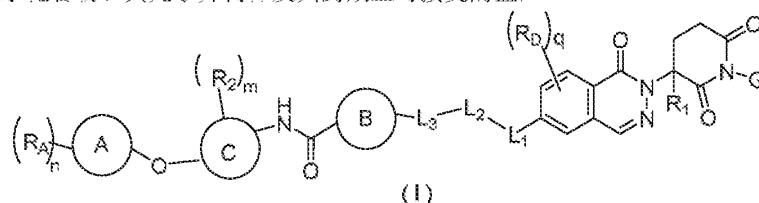


权利要求

1. 式 (I) 所示化合物、其光学异构体及其药效上可接受的盐,



其中, R_1 选自 H、F、Cl、Br、I 和 C_{1-6} 烷基, 所述 C_{1-6} 烷基任选被 1、2 或 3 个 R 取代;

G 选自 H、F、Cl、Br、I 和 C_{1-6} 烷基, 所述 C_{1-6} 烷基任选被 1、2 或 3 个 R 取代;

环 B 选自苯基和 5-6 元杂芳基, 所述苯基或 5-6 元杂芳基任选被 1、2 或 3 个 R 取代;

环 C 选自 C_{4-6} 环烷基;

R_2 选自 H 和 C_{1-6} 烷基, 所述 C_{1-6} 烷基任选被 1、2 或 3 个 R 取代;

环 A 选自 6-12 元芳基和 5-12 元杂芳基;

R_A 选自 H、 NO_2 、卤素、 NH_2 、CN、 C_{1-6} 烷基和 C_{1-6} 烷氧基, 所述 C_{1-6} 烷基或 C_{1-6} 烷氧基任选被 1、2 或 3 个 R 取代;

R_D 选自 H、CN、卤素、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{3-6} 环烷基和 3-6 元杂环烷基, 所述 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{3-6} 环烷基或 3-6 元杂环烷基任选被 1、2 或 3 个 R 取代;

R 分别独立地选自 H、F、Cl、Br、I、OH、 NH_2 和 C_{1-6} 烷基, 所述 C_{1-6} 烷基任选被 1、2 或 3 个 R' 取代;

各 L_1 、 L_2 、 L_3 分别独立地选自单键、O、S、NH、 $C(=O)$ 、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、 C_{1-6} 烷基、 $-C_{1-6}$ 烷基-O-、 C_{2-3} 烯基、 C_{2-3} 炔基、 C_{3-10} 环烷基、3-10 元杂环烷基、苯基和 5-9 元杂芳基, 所述 C_{1-6} 烷基、 $-C_{1-6}$ 烷基-O-、 C_{2-3} 烯基、 C_{2-3} 炔基、 C_{3-10} 环烷基、3-10 元杂环烷基、苯基或 5-9 元杂芳基任选被 1、2 或 3 个 R_L 取代;

R_L 分别独立地选自 H、卤素、OH、 NH_2 、CN、、 C_{1-6} 烷基、 C_{3-6} 环烷基、 C_{1-6} 烷基- $C(=O)-$ 、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 烷硫基和 C_{1-6} 烷氨基, 所述 C_{1-6} 烷基、 C_{3-6} 环烷基、 C_{1-6} 烷基- $C(=O)-$ 、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 烷硫基或 C_{1-6} 烷氨基任选被 1、2 或 3 个 R' 取代;

R' 分别独立地选自 H、卤素、 C_{1-6} 烷基、OH、 NH_2 、、、 CH_3 、 CH_2F 、 CHF_2 和 CF_3 ;

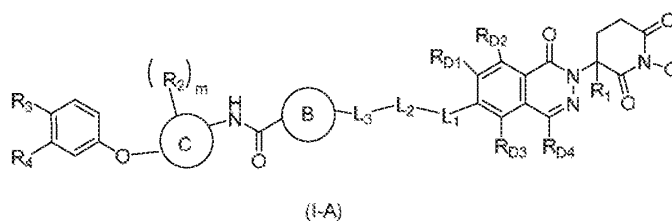
n 为 0、1、2、3 或 4;

m 为 0、1、2、3 或 4;

q 为 1、2、3 或 4;

上述 3-10 元杂环烷基、3-6 元杂环烷基、5-12 元杂芳基、5-6 元杂芳基或 5-9 元杂芳基包含 1、2 或 3 个独立选自 O、NH、S、 $C(=O)$ 、 $C(=O)O$ 、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 和 N 的杂原子或杂原子团。

2. 式 (I-A) 所示化合物、其光学异构体及其药效上可接受的盐,



其中, R_1 选自 H、F、Cl、Br、I 和 C_{1-6} 烷基, 所述 C_{1-6} 烷基任选被 1、2 或 3 个 R 取代;

G 选自 H、F、Cl、Br、I 和 C_{1-6} 烷基, 所述 C_{1-6} 烷基任选被 1、2 或 3 个 R 取代;

环 B 选自苯基和 5-6 元杂芳基, 所述苯基或 5-6 元杂芳基任选被 1、2 或 3 个 R 取代;

环 C 选自 C_{4-6} 环烷基;

R_2 选自 H 和 C_{1-6} 烷基, 所述 C_{1-6} 烷基任选被 1、2 或 3 个 R 取代;

各 R_3 、 R_4 分别独立地选自 H、 NO_2 、卤素、 NH_2 、CN、 C_{1-6} 烷基和 C_{1-6} 烷氧基, 所述 C_{1-6} 烷基或 C_{1-6} 烷氧基任选被 1、2 或 3 个 R 取代;

各 R_{D1} 、 R_{D2} 、 R_{D3} 分别独立地选自 H、CN、卤素、 C_{1-6} 烷基和 C_{1-6} 烷氧基, 所述 C_{1-6} 烷基或 C_{1-6} 烷氧基任选被 1、2 或 3 个 R 取代;

R_{D4} 分别独立地选自 H、CN、卤素、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{3-6} 环烷基和 3-6 元杂环烷基, 所述 C_{1-6} 烷基、 C_{3-6} 环烷基或 3-6 元杂环烷基任选被 1、2 或 3 个 R 取代;

R 分别独立地选自 H、F、Cl、Br、I、OH、 NH_2 和 C_{1-6} 烷基, 所述 C_{1-6} 烷基任选被 1、2 或 3 个 R' 取代;

各 L_1 、 L_2 、 L_3 分别独立地选自单键、O、S、NH、 $C(=O)$ 、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、 C_{1-6} 烷基、 $-C_{1-6}$ 烷基-O-、 C_{2-3} 烯基、 C_{2-3} 炔基、 C_{3-10} 环烷基、3-10 元杂环烷基、苯基和 5-9 元杂芳基, 所述 C_{1-6} 烷基、 $-C_{1-6}$ 烷基-O-、 C_{2-3} 烯基、 C_{2-3} 炔基、 C_{3-10} 环烷基、3-10 元杂环烷基、苯基或 5-9 元杂芳基任选被 1、2 或 3 个 R_L 取代;

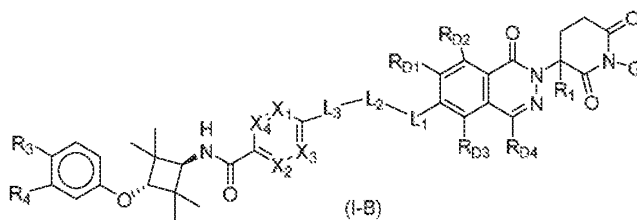
R_L 分别独立地选自 H、卤素、OH、 NH_2 、CN、、 C_{1-6} 烷基、 C_{3-6} 环烷基、 C_{1-6} 烷基- $C(=O)-$ 、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 烷硫基和 C_{1-6} 烷基氨基, 所述 C_{1-6} 烷基、 C_{3-6} 环烷基、 C_{1-6} 烷基- $C(=O)-$ 、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 烷硫基或 C_{1-6} 烷基氨基任选被 1、2 或 3 个 R' 取代;

R' 分别独立地选自 H、卤素、 C_{1-6} 烷基、OH、 NH_2 、、、 CH_3 、 CH_2F 、 CHF_2 和 CF_3 ;

m 为 0、1、2、3 或 4;

上述 3-10 元杂环烷基、3-6 元杂环烷基、5-6 元杂芳基或 5-9 元杂芳基包含 1、2 或 3 个独立选自 O、NH、S、 $C(=O)$ 、 $C(=O)O$ 、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 和 N 的杂原子或杂原子团。

3. 式 (I-B) 所示化合物、其光学异构体及其药效上可接受的盐,



其中, R_1 选自 H、F、Cl、Br、I 和 C_{1-6} 烷基, 所述 C_{1-6} 烷基任选被 1、2 或 3 个 R 取代;

G 选自 H、F、Cl、Br、I 和 C_{1-6} 烷基, 所述 C_{1-6} 烷基任选被 1、2 或 3 个 R 取代;

各 R_3 、 R_4 分别独立地选自 H、 NO_2 、卤素、 NH_2 、CN、 C_{1-6} 烷基和 C_{1-6} 烷氧基, 所述 C_{1-6} 烷基或 C_{1-6} 烷氧基任选被 1、2 或 3 个 R 取代;

各 X_1 、 X_2 、 X_3 、 X_4 分别独立地选自 C(R) 和 N;

各 R_{D1} 、 R_{D2} 、 R_{D3} 分别独立地选自 H、CN、卤素、 C_{1-6} 烷基和 C_{1-6} 烷氧基, 所述 C_{1-6} 烷基或 C_{1-6} 烷氧基任选被 1、2 或 3 个 R 取代;

R_{D4} 分别独立地选自 H、CN、卤素、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{3-6} 环烷基和 3-6 元杂环烷基, 所述 C_{1-6} 烷基、 C_{3-6} 环烷基或 3-6 元杂环烷基任选被 1、2 或 3 个 R 取代;

R 分别独立地选自 H、F、Cl、Br、I、OH、 NH_2 和 C_{1-6} 烷基, 所述 C_{1-6} 烷基任选被 1、2 或 3 个 R' 取代;

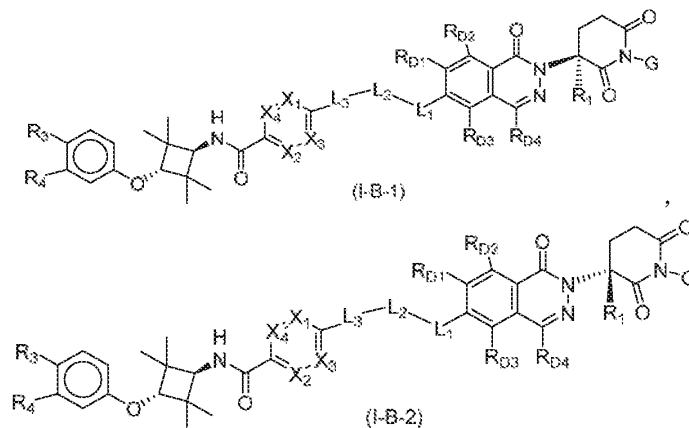
各 L_1 、 L_2 、 L_3 分别独立地选自单键、O、S、NH、C(=O)、S(=O)、S(=O)₂、 C_{1-6} 烷基、- C_{1-6} 烷基-O-、 C_{2-3} 烯基、 C_{2-3} 炔基、 C_{3-10} 环烷基、3-10 元杂环烷基、苯基和 5-9 元杂芳基, 所述 C_{1-6} 烷基、- C_{1-6} 烷基-O-、 C_{2-3} 烯基、 C_{2-3} 炔基、 C_{3-10} 环烷基、3-10 元杂环烷基、苯基或 5-9 元杂芳基任选被 1、2 或 3 个 R_L 取代;

R_L 分别独立地选自 H、卤素、OH、 NH_2 、CN、、 C_{1-6} 烷基、 C_{3-6} 环烷基、 C_{1-6} 烷基-C(=O)-、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 烷硫基和 C_{1-6} 烷氨基, 所述 C_{1-6} 烷基、 C_{3-6} 环烷基、 C_{1-6} 烷基-C(=O)-、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 烷硫基或 C_{1-6} 烷氨基任选被 1、2 或 3 个 R' 取代;

R' 分别独立地选自 H、卤素、 C_{1-6} 烷基、OH、 NH_2 、、 CH_3 、 CH_2F 、 CHF_2 和 CF_3 ;

上述 3-10 元杂环烷基、3-6 元杂环烷基或 5-9 元杂芳基包含 1、2 或 3 个独立选自 O、NH、S、C(=O)、C(=O)O、S(=O)、S(=O)₂ 和 N 的杂原子或杂原子团。

4. 式 (I-B-1) 或式 (I-B-2) 所示化合物、其光学异构体及其药效上可接受的盐,



其中, R_1 、 R_3 、 R_4 、 R_{D1} 、 R_{D2} 、 R_{D3} 、 R_{D4} 、 L_1 、 L_2 、 L_3 、 X_1 、 X_2 、 X_3 、 X_4 、G 如权利要求 3 所定义。

5. 根据权利要求 1 所述化合物、其光学异构体及其药效上可接受的盐, 其中, 环 A 选自苯基。

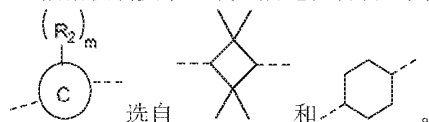
6. 根据权利要求 2-4 任一项所述化合物、其光学异构体及其药效上可接受的盐, 其中, 各 R_3 、 R_4

分别独立地选自 H、NO₂、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、CF₃、甲基、乙基、正丙基、异丙基、甲氧基和乙氧基。

7. 根据权利要求 1 或 2 所述化合物、其光学异构体及其药效上可接受的盐, 其中, R_2 选自 H、甲基和乙基。

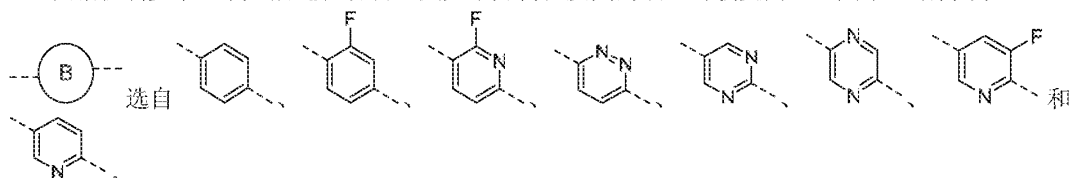
8. 根据权利要求 1 或 2 所述化合物、其光学异构体及其药效上可接受的盐, 其中, 环 C 选自环丁基和环己烷基。

9. 根据权利要求1或2所述化合物、其光学异构体及其药效上可接受的盐, 其中, 结构单元



10. 根据权利要求1或2所述化合物、其光学异构体及其药效上可接受的盐, 其中, 环B选自苯基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基和吡嗪基, 所述苯基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基或吡嗪基任选被1、2或3个R取代。

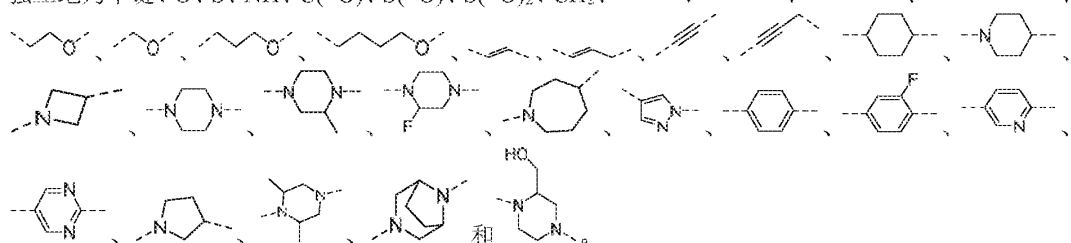
11. 根据权利要求 1 或 2 所述化合物、其光学异构体及其药效上可接受的盐, 其中, 结构单元



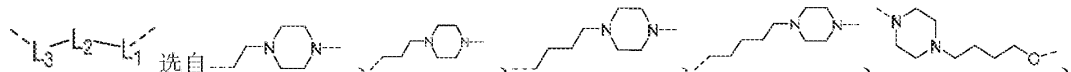
12. 根据权利要求 1-4 任一项所述化合物、其光学异构体及其药效上可接受的盐, 其中, 各 L_1 、 L_2 、 L_3 分别独立地为单键、O、S、NH、C(=O)、S(=O)、S(=O)₂、C₁₋₃ 烷基、-C₁₋₃ 烷基-O-、C₂₋₃ 烯基、C₂₋₃ 炔基、C₃₋₆ 环烷基、4-8 元杂环烷基、苯基和 5-6 元杂芳基, 所述 C₁₋₃ 烷基、-C₁₋₃ 烷基-O-、C₂₋₃ 烯基、C₂₋₃ 炔基、C₃₋₆ 环烷基、4-8 元杂环烷基、苯基或 5-6 元杂芳基任选被 1、2 或 3 个 R₁ 取代。

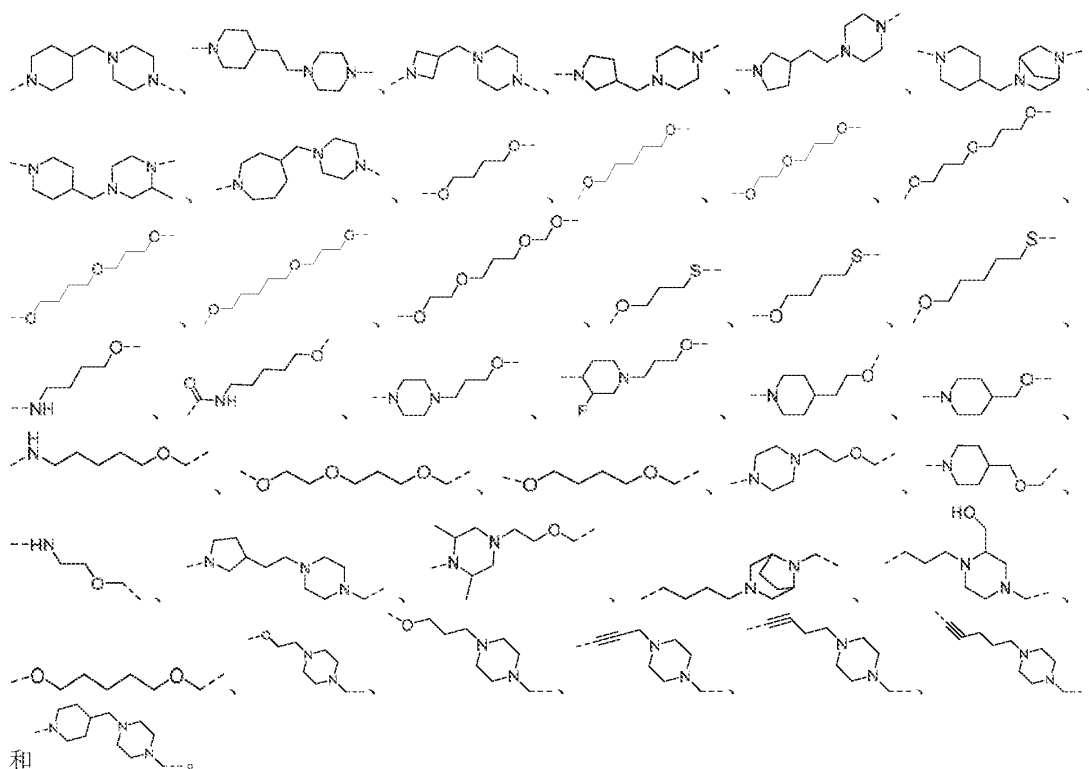
13. 根据权利要求 12 所述化合物、其光学异构体及其药效上可接受的盐, 其中, R_L 分别独立地选自 H、卤素、OH、 NH_2 、CN、、 C_{1-3} 烷基、 C_{3-6} 环烷基、 C_{1-3} 烷基-C(=O)-、 C_{1-3} 烷氧基、 C_{1-3} 烷硫基和 C_{1-3} 烷基氨基, 所述 C_{1-3} 烷基、 C_{3-6} 环烷基、 C_{1-3} 烷基-C(=O)-、 C_{1-3} 烷氧基、 C_{1-3} 烷硫基或 C_{1-3} 烷基氨基任选被 1、2 或 3 个 R' 取代。

14. 根据权利要求 12 所述化合物、其光学异构体及其药效上可接受的盐, 其中, 各 L_1 、 L_2 、 L_3 分别独立地为单键、O、S、NH、C(=O)、S(=O)、S(=O)₂、CH₃、、、、、、、、、、、、、、



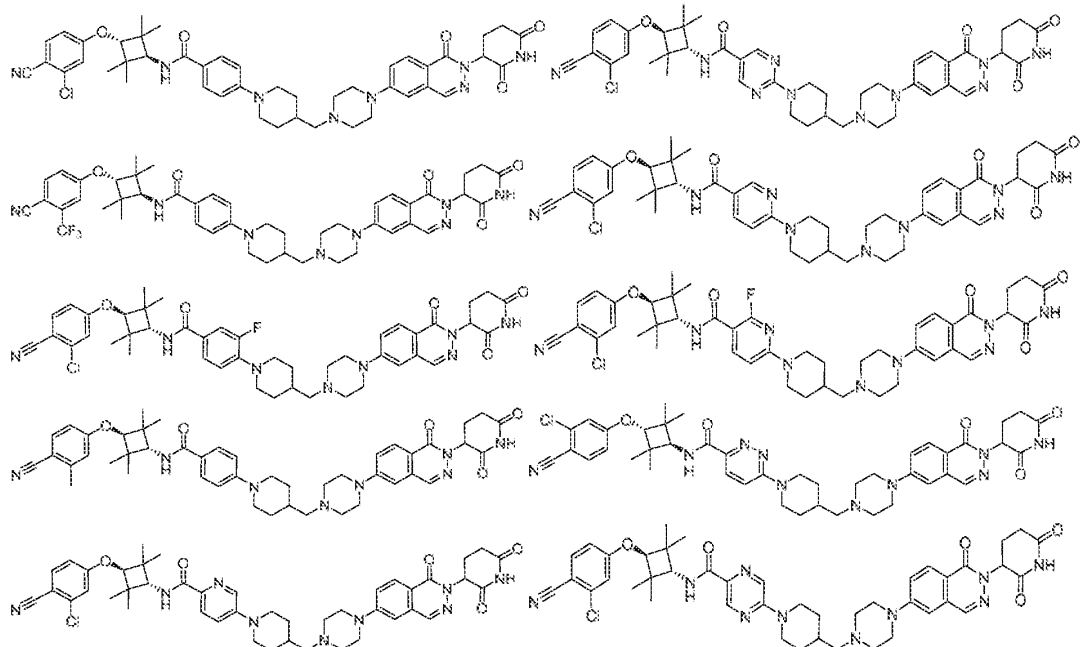
15. 根据权利要求 1-4 任一项所述化合物、其光学异构体及其药效上可接受的盐, 其中, 结构单元

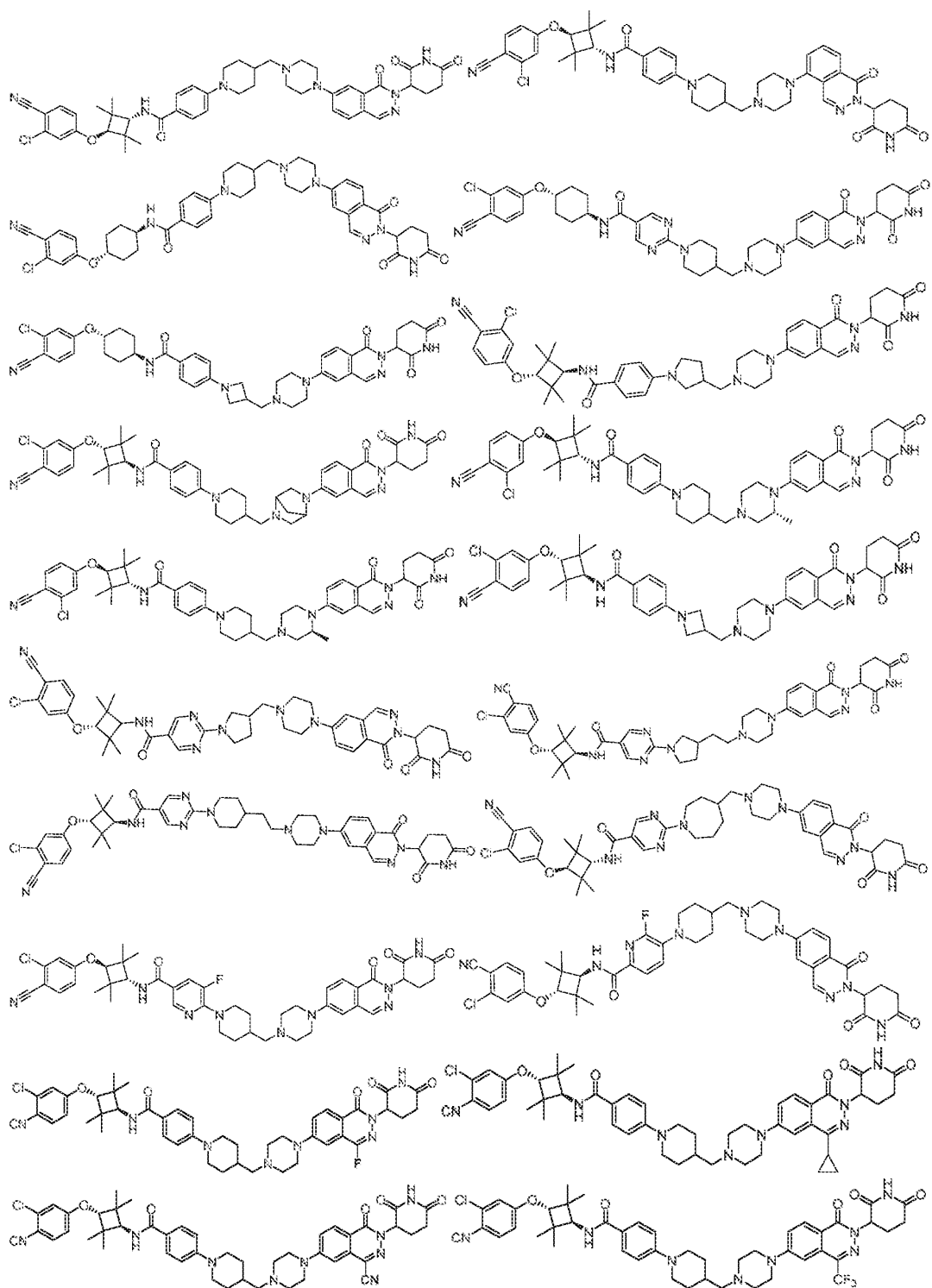




16. 根据权利要求 2-4 任一项所述化合物、其光学异构体及其药效上可接受的盐，其中， R_{D4} 分别独立地选自 H、CN、F、Cl、Br、I、 CF_3 、 CH_3 、 CH_2CH_3 和环丙基。

17. 下式化合物、其光学异构体及其药效上可接受的盐，其选自





18. 权利要求 1-17 任一项所述的化合物、其光学异构体及其药效上可接受的盐在制备预防和/或治疗癌症或肯尼迪氏病的药物中的用途。

19. 根据权利要求 18 所述的用途，其中，所述癌症选自前列腺癌和乳腺癌。