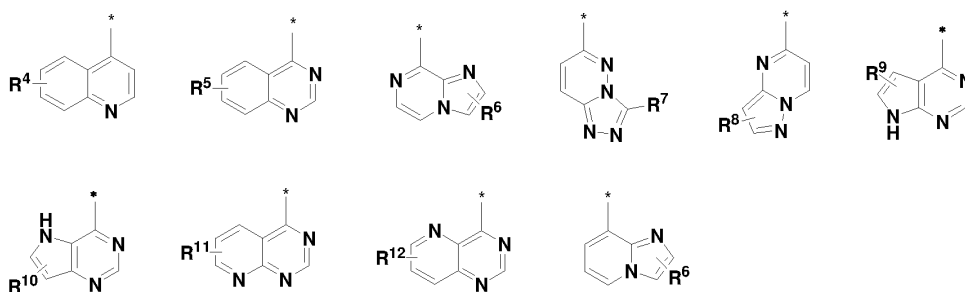


Ar 选自下组：取代或未取代的 C₆-C₁₂ 芳基、取代或未取代的 5-12 元杂芳基；

除非特别说明，所述的取代指基团上的一个或多个氢原子被选自下组的取代基取代：卤素、C₁-C₆ 烷基、卤素取代的 C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 烷氧基羰基、卤素取代的 C₁-C₆ 烷氧基、C₃-C₈ 环烷基、氰基、硝基、氨基、羟基、羟甲基、羧基。

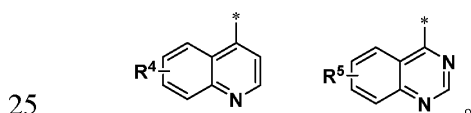
- 5 2、如权利要求 1 所述的并环吡唑啉酮甲酰胺类化合物，或者其外消旋体、R-异构体、S-异构体、可药用盐或它们的混合物，其中，R¹ 和 R² 各自独立地选自下组：氢、氘、氟、卤素、取代或未取代的 C₁-C₆ 烷基、取代或未取代的 C₁-C₆ 烷氧基、氰基、羟基、羧基；其中，所述的取代指基团上的一个或多个氢原子被选自下组的取代基取代：卤素、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 烷氧基羰基、氰基、氨基、羟基、羟甲基、羧基；或
- 10 两个 R¹ 与其相邻的碳原子共同构成选自下组的基团：苯环、5-8 元的杂芳环。

3、如权利要求 1 所述的并环吡唑啉酮甲酰胺类化合物，或者其外消旋体、R-异构体、S-异构体、可药用盐或它们的混合物，其中，^(A)环选自下组：



- 其中，R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹² 分别为 1-4 个选自下组的取代基：
- 15 H、D、T、卤素、取代或未取代的 C₁-C₆ 烷基、取代或未取代的 C₁-C₆ 烷氧基、-O[(CH₂)_qO]_rR³、-NH[(CH₂)_qO]_rR³、-NH(C=O)[(CH₂)_qO]_rR³、-NH(SO₂)[(CH₂)_qO]_rR³、-O(CH₂)_sAr、取代或未取代的 C₃-C₈ 环烷氧基、取代或未取代的 C₃-C₈ 环烷胺基、取代或未取代的 C₃-C₈ 环氧烷基、取代或未取代的 C₃-C₈ 环胺烷基、氰基、硝基、氨基、胺基(较佳地 C₁-C₆ 胺基)、羟基、羟甲基、羧基、C₆-C₁₀ 芳基、C₆-C₁₀ 芳基氧基、取代或未取代的 3-12 元杂环基、
- 20 取代或未取代的 3-12 元杂环基氧基和取代或未取代的 3-12 元杂环基胺基；或两个相邻的上述基团与其相连的原子可共同构成选自下组的结构：取代或未取代的 6-20 元杂环，所述的杂环可任选地包括 1、2、3 或 4 个选自 N、O 或 S 中的杂原子。

4、如权利要求 2 所述的并环吡唑啉酮甲酰胺类化合物或者其外消旋体、R-异构体、S-异构体、可药用盐或它们的混合物，其特征在于，所述的 ^(A)环选自下组：

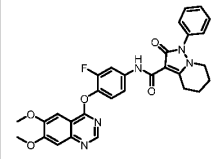
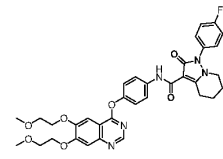
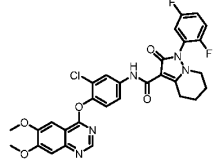
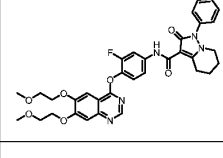
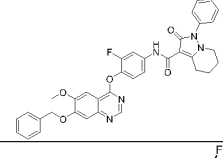
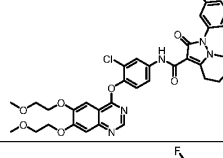
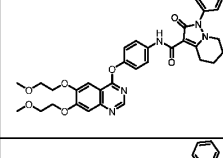
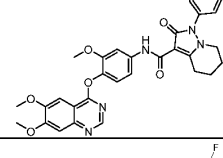
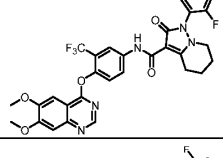
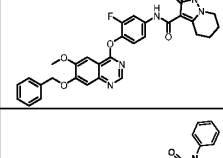
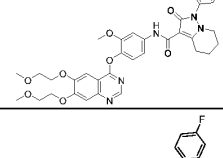
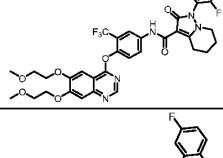
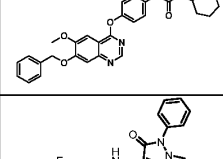
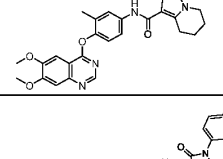
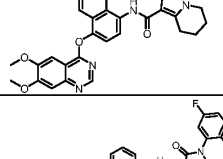
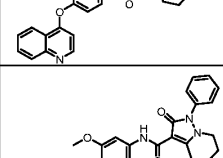
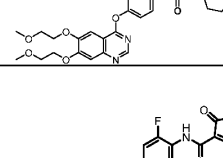
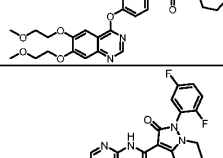
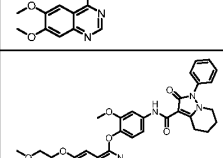
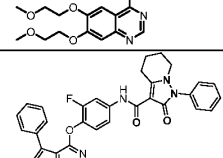
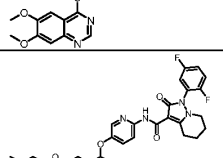
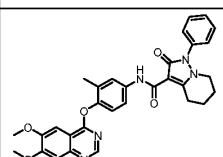
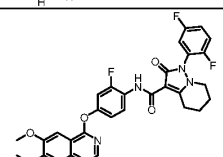
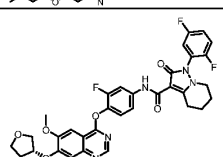
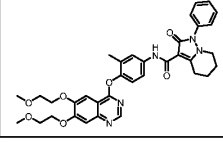
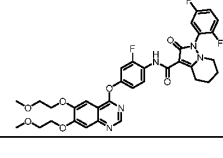
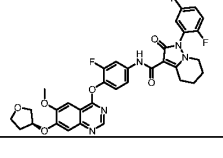
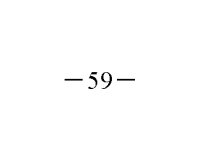


- 5、如权利要求 4 所述的并环吡唑啉酮甲酰胺类化合物或者其外消旋体、R-异构体、S-异构体、可药用盐或它们的混合物，其特征在于：R⁴、R⁵ 分别为 1-4 个选自下组的取代基：取代或未取代的 C₁-C₆ 烷氧基、-O[(CH₂)_qO]_rR³、-NH[(CH₂)_qO]_rR³、-NH(C=O)[(CH₂)_qO]_rR³、-NH(SO₂)[(CH₂)_qO]_rR³、-O(CH₂)_sAr、取代或未取代的 3-12 元杂环基氧基和取代或未取代的 3-12 元杂环基胺基；或两个相邻的上述基团与其相连的原子可共同构成选自下组的结构：取代或未取代的 6-20 元杂环，所述的杂环可任选地包括 1、
- 30

2、3 或 4 个选自 N、O 或 S 中的杂原子。

6、如权利要求 1 所述的并环吡唑啉酮甲酰胺类化合物或者其外消旋体、R-异构体、S-异构体、可药用盐或它们的混合物，其中，所述并环吡唑啉酮甲酰胺类化合物选自如下化合物：

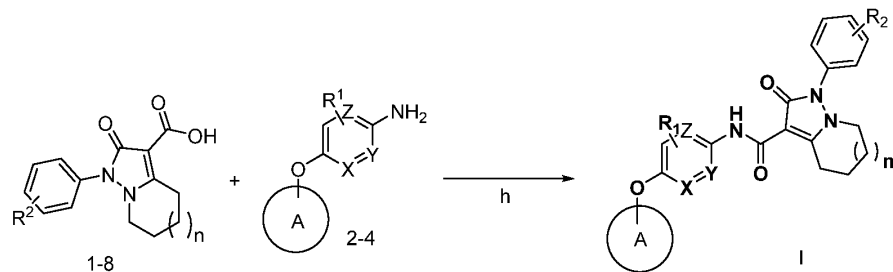
编号	结构	编号	结构	编号	结构
DC621 001		DC621 037		DC621 071	
DC621 002		DC621 038		DC621 072	
DC621 004		DC621 039		DC621 073	
DC621 006		DC621 040		DC621 074	
DC621 007		DC621 041		DC621 075	
DC621 008		DC621 042		DC621 076	
DC621 009		DC621 043		DC621 077	
DC621 010		DC621 044		DC621 078	

DC621 011		DC621 045		DC621 079	
DC621 012		DC621 046		DC621 080	
DC621 013		DC621 047		DC621 081	
DC621 014		DC621 048		DC621 082	
DC621 015		DC621 049		DC621 083	
DC621 016		DC621 050		DC621 084	
DC621 017		DC621 051		DC621 085	
DC621 018		DC621 052		DC621 086	
DC621 019		DC621 053		DC621 087	
DC621 020		DC621 054		DC621 088	

DC621 021		DC621 055		DC621 089	
DC621 022		DC621 056		DC621 090	
DC621 023		DC621 057		DC621 091	
DC621 024		DC621 058		DC621 092	
DC621 025		DC621 059		DC621 093	
DC621 026		DC621 060		DC621 094	
DC621 027		DC621 061		DC621 095	
DC621 028		DC621 062		DC621 096	
DC621 029		DC621 063		DC621 097	
DC621 030		DC621 064		DC621 098	

DC621 031		DC621 065		DC621 099	
DC621 032		DC621 066		DC621 100	
DC621 033		DC621 067		DC621 101	
DC621 034		DC621 068		DC621 102	
DC621 035		DC621 069		DC621 103	
DC621 036		DC621 070		DC621 104	
DC621 105		DC621 107			
DC621 106		DC621 108			

7、如权利要求 1 所述的化合物的制备方法，其特征在于，所述的方法包括步骤：



在惰性溶剂中，用式 1-8 化合物与式 2-4 化合物反应，得到式 I 化合物。

8、一种药物组合物，其特征在于，所述的药物组合物包括：治疗有效量的如权利要求 5 所述的式 I 化合物，或其药学上可接受的盐、外消旋体、R-异构体、S-异构体或它

们的混合物中的一种或多种，以及任选的药学上可接受的载体、赋形剂、佐剂、辅料和/或稀释剂。

- 9、一种激酶抑制剂，其特征在于，所述的抑制剂包括：抑制有效量的如权利要求 1-6 任一所述的式 I 化合物，或其药学上可接受的盐、外消旋体、R-异构体、S-异构体或它们的混合物中的一种或多种，以及任选的药学上可接受的载体、赋形剂、佐剂、辅料和/或稀释剂；且所述的激酶选自下组：AXL、c-Met，或其组合。

- 10、如权利要求 1 所述的式 I 化合物的用途，其特征在于，用于选自下组的一个或多个用途：(i)治疗或预防与激酶酶活或表达量相关的疾病；(ii)抑制激酶的活性，或降低激酶的表达量；(iii)制备治疗或预防与激酶活性相关的疾病的药物组合物；(iv)制备激酶抑制剂；

其中，所述的激酶选自下组：AXL、c-Met，或其组合。