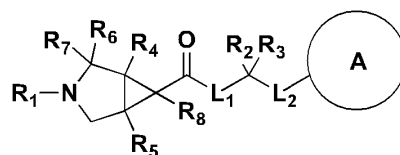


权 利 要 求 书

1. 式(I)的化合物, 或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药:



(I)

其中, R₁选自-H和C₁₋₆烷基;

L₁选自-NH-和-O-;

R₂、R₃各自独立地选自-H、C₁₋₆烷基和C₃₋₆环烷基, 其中R₂和R₃不同时为-H; 或R₂和R₃一起形成包含0至1个选自-O-、-NR₉-、-SO-和-SO₂-的基团的3至6元饱和环状基团;

R₄、R₅、R₆、R₇、R₈各自独立地选自-H、C₁₋₆烷基、C₁₋₆烷氧基、C₁₋₆烷氧基C₁₋₆烷基、-(CH₂)_m-C₃₋₁₀碳环基、-(CH₂)_m-(3至10元杂环基)、-(CH₂)_m-O-C₃₋₁₀碳环基、-(CH₂)_m-O-(3至10元杂环基)、苯基和5至6元杂芳基, 所述的杂环基或杂芳基含有1至4个选自N、O或S的杂原子, 且R₄、R₅、R₆、R₇、R₈中所述的烷基、烷氧基、碳环基、苯基、杂芳基或杂环基各自独立任选进一步被0至4个选自-H、-F、-Cl、-Br、-I、羟基、巯基、氰基、氨基、C₁₋₄烷基和C₁₋₄烷氧基的取代基所取代;

R₉选自-H、C₁₋₆烷基、C₁₋₄烷氧基C₁₋₆烷基、卤素、羟基、氰基和C₃₋₆环烷基;

A选自C₆₋₁₄芳基、5至14元杂芳基、5至14元杂环基和5至14元环烷基, 且A中所述芳基、杂芳基、杂环基、环烷基任选进一步被1至4个R₁₀取代; 其中所述杂芳基或杂环基包含1至4个选自N、O或S的杂原子;

当L₂选自单键、-(CR_aR_b)_n-和-(CR_aR_b)_nO-时, R₁₀各自独立地选自-H、-F、-Cl、-Br、-I、羟基、氰基、氨基、C₁₋₆烷基、C₁₋₄烷氧基C₁₋₆烷基、C₃₋₆环烷基和-SR₁₁, 且至少一个R₁₀为-SR₁₁, 其中R₁₁各自独立地选自-H、C₁₋₆烷基、C₁₋₄烷氧基C₁₋₆烷基、-(CH₂)_n-C₂₋₆烯基、-(CH₂)_n-C₂₋₆炔基、-(CH₂)_n-C₃₋₁₀碳环基、-(CH₂)_n-(3至10元杂环基)、C₆₋₁₀芳基或5至6元杂芳基, 所述的杂环基和杂芳基含有1至4个选自N、O或S的杂原子, 所述的烷基、烷氧基、芳基、杂芳基、碳环基或杂环基各自独立任选进一步被0至4个选自-H、卤素、羟基、氰基、C₁₋₄烷基和C₁₋₄烷氧基的取代基所取代;

当L₂选自-(CR_aR_b)_nS-时, R₁₀各自独立地选自-H、-F、-Cl、-Br、-I、羟基、氰基、氨基、C₁₋₄烷基、C₁₋₄烷氧基、C₁₋₄烷氧基C₁₋₆烷基、-(CH₂)_n-C₂₋₆烯基、-(CH₂)_n-C₂₋₆炔基、-(CH₂)_n-C₃₋₁₀碳环基、-(CH₂)_n-(3至10元杂环基)、-O-(CH₂)_n-C₃₋₁₀碳环基或者-O-(CH₂)_n-(3至10元杂环基)和-SR₁₁, 其中R₁₁各自独立地选自-H、C₁₋₆烷基、C₁₋₄烷氧基C₁₋₆烷基、-(CH₂)_n-C₂₋₆烯基、-(CH₂)_n-C₂₋₆炔基、-(CH₂)_n-C₃₋₁₀碳环基、-(CH₂)_n-(3至10元杂环基)、C₆₋₁₀芳基和5至6元杂芳基, 所述的杂环基或杂芳基含有1至4个选自N、O和S的杂原子, 所述的烷基、烷氧基、芳基、杂芳基、碳环基或杂环基各自独立任选进一步被0至4个选自H、卤素、羟基、氰基、C₁₋₄烷基和C₁₋₄烷氧基的取代基所取代;

R_a和R_b各自独立地选自-H和C₁₋₆烷基;

m 每次出现时独立地选自 0、1、2 和 3；

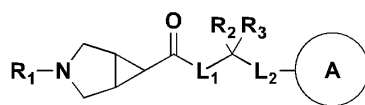
n 每次出现时独立地选自 0、1、2 和 3。

2. 根据权利要求 1 所述的化合物，或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药，其特征在于，

5 L_1 为-NH-；

R_1 为-H。

3. 根据权利要求 1 所述的化合物，或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药，其特征在于，所述化合物具有式(VI)结构特征：



(VI)

10

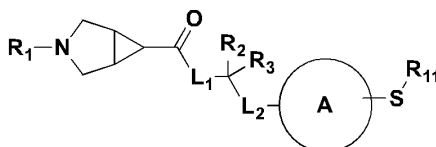
L_1 选自-NH-和-O-；

L_2 选自单键和 $-(CR_aR_b)_n-$ 或 $-(CR_aR_b)_nO-$ ；其中 R_a , R_b 独立地选自-H 和 C_{1-6} 烷基；

n 每次出现时独立地选自 0、1、2 和 3。

4. 根据权利要求 1 所述的化合物，或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药，其特征在于，所述化合物具有式(II)结构特征：

15



(II)

L_1 选自-NH-和-O-；

L_2 选自单键、 $-(CR_aR_b)_n-$ 和 $-(CR_aR_b)_nO-$ ；其中 R_a 和 R_b 各自独立地选自-H 和 C_{1-6} 烷基；

20 n 每次出现时独立地选自 0、1、2 和 3。

5. 根据权利要求 4 所述的化合物，或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药，其特征在于，

R_1 为-H；

L_1 为-NH-；

25 L_2 选自单键、 $-CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2O-$ 和 $-CH_2CH_2O-$ 。

6. 根据权利要求 4 所述的化合物，或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药，其特征在于，

R_2 和 R_3 各自独立地选自 C_{1-6} 烷基和 C_{3-6} 环烷基；

或 R_2 和 R_3 一起形成包含 0 至 1 个选自-O-、-SO-和-SO₂-的基团的 3 至 6 元饱和环状基团。

7. 根据权利要求 4 所述的化合物，或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、

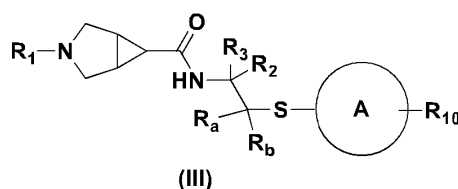
30

药学上可以接受的盐、多晶型或前药, 其特征在于,

R_{11} 各自独立地选自-H、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n$ -烯基、 $-(CH_2)_n$ -炔基、 $-(CH_2)_n$ - C_{3-10} 碳环基、 $-(CH_2)_n$ -(3 至 10 元杂环基)、 C_{6-10} 芳基和 5 至 6 元杂芳基, 所述的杂环基或杂芳基含有 1 至 4 个选自 N、O 和 S 的杂原子, 所述的烷基、烷氧基、芳基、杂芳基、碳环基或杂环基各自独立任选进一步被 0 至 4 个选自-H、卤素、羟基、氰基、 C_{1-4} 烷基和 C_{1-4} 烷氧基的取代基所取代。

8. 根据权利要求 7 所述的化合物, 或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药, 其特征在于, R_{11} 各自独立地选自甲基、乙基、异丙基、三氟甲基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、咪唑基、吡咯基、呋喃基、噻吩基和吡啶基。

9. 根据权利要求 1 所述的化合物, 或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药, 其特征在于, 所述化合物具有式(III)结构特征:

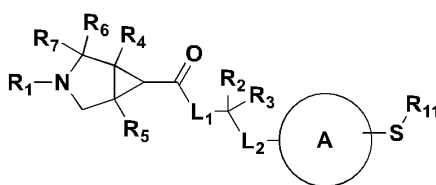


R_{10} 各自独立地选自-H、-F、-Cl、-Br、-I、羟基、氰基、氨基、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n$ -烯基、 $-(CH_2)_n$ -炔基、 $-(CH_2)_n$ - C_{3-10} 碳环基、 $-(CH_2)_n$ -(3 至 10 元杂环基)、 $-O-(CH_2)_n$ - C_{3-10} 碳环基、 $-O-(CH_2)_n$ -(3 至 10 元杂环基)和-SR₁₁, 其中 R_{11} 各自独立地选自-H、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n$ -烯基、 $-(CH_2)_n$ -炔基、 $-(CH_2)_n$ - C_{3-10} 碳环基、 $-(CH_2)_n$ -(3 至 10 元杂环基)、 C_{6-10} 芳基和 5 至 6 元杂芳基, 所述的杂环基或杂芳基含有 1 至 4 个选自 N、O 和 S 的杂原子, 所述的烷基、烷氧基、芳基、杂芳基、碳环基或杂环基各自独立任选进一步被 0 至 4 个选自-H、卤素、羟基、氰基、 C_{1-4} 烷基和 C_{1-4} 烷氧基的取代基所取代;

20 R_a 和 R_b 各自独立地选自-H和 C_{1-6} 烷基。

10. 根据权利要求 9 所述的化合物, 或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药, 其特征在于, R_{10} 各自独立地选自-H、-F、-Cl、-Br、-I、羟基、氰基、氨基、甲基、乙基、异丙基、三氟甲基、环丙基、环丁基、环戊基、环丁氧基、四氢呋喃基和-SR₁₁, 其中 R_{11} 各自独立地选自甲基、乙基、异丙基、三氟甲基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、咪唑基、吡咯基、呋喃基、噻吩基和吡啶基; R_a 和 R_b 各自独立地选自-H、甲基、乙基和异丙基。

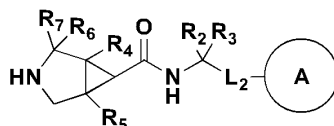
11. 根据权利要求 1 所述的化合物, 或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药, 其特征在于, 所述化合物具有式(IV)结构特征:



(IV)

R₄选自C₁₋₆烷基、C₁₋₆烷氧基、C₁₋₆烷氧基C₁₋₆烷基、-(CH₂)_m-C₃₋₁₀碳环基、-(CH₂)_m-(3至10元杂环基)、-(CH₂)_m-O-C₃₋₁₀碳环基、-(CH₂)_m-O-(3至10元杂环基)、苯基和5至6元杂芳基,所述的杂环基或杂芳基含有1至4个选自N、O或S的杂原子,且R₄中所述的烷基、烷氧基、碳环基、苯基、杂芳基或杂环各自独立任选进一步被0至4个选自-H、-F、-Cl、-Br、-I、羟基、巯基、氰基、氨基、C₁₋₄烷基和C₁₋₄烷氧基的取代基所取代。

12. 根据权利要求1所述的化合物,或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药,其特征在于,所述化合物具有式(V)结构特征:



(V)

R₂和R₃各自独立地选自C₁₋₆烷基和C₃₋₆环烷基,其中R₂和R₃不同时为-H;或R₂和R₃一起形成3至6元饱和环烷基;

R₄、R₅、R₆、R₇各自独立地选自-H、C₁₋₆烷基、C₁₋₆烷氧基和C₁₋₆烷氧基C₁₋₆烷基,且R₄、R₅、R₆、R₇中所述的烷基和烷氧基各自独立任选进一步被0至4个选自-H、-F、-Cl、-Br、-I、羟基、巯基、氰基、氨基、C₁₋₄烷基和C₁₋₄烷氧基的取代基所取代;

A选自C₆₋₁₄芳基、5至14元杂芳基、5至14元杂环基和5至14元环烷基,且A中所述芳基、杂芳基、杂环基和环烷基任选进一步被1至4个R₁₀取代;其中所述杂芳基或杂环基包含1至4个N原子;

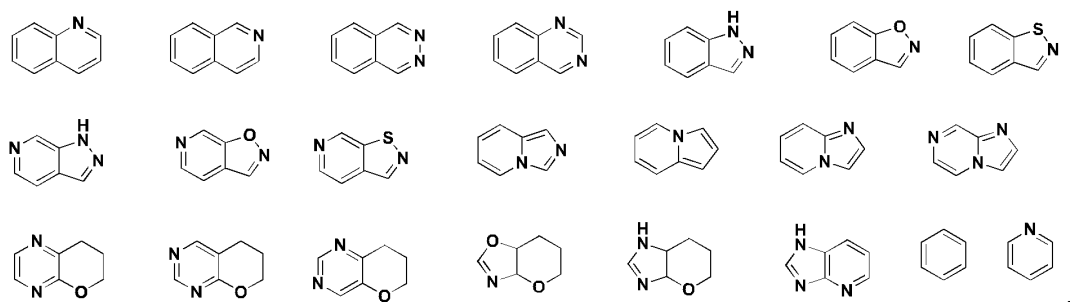
当L₂选自单键时,R₁₀各自独立地选自-H、-F、-Cl、-Br、-I、羟基、氰基、氨基、C₁₋₆烷基、C₁₋₄烷氧基C₁₋₆烷基、C₃₋₆环烷基和-SR₁₁,且至少一个R₁₀为-SR₁₁,其中R₁₁各自独立地选自-H、C₁₋₆烷基、C₁₋₄烷氧基C₁₋₆烷基、-(CH₂)_n-C₃₋₁₀碳环基、-(CH₂)_n-(3至10元杂环基)和5至6元杂芳基,所述的杂环基或杂芳基含有1至4个选自O、S或N的杂原子,所述的烷基、烷氧基、碳环基或杂环基各自独立任选进一步被0至4个选自-H、卤素、羟基、氰基、C₁₋₄烷基和C₁₋₄烷氧基的取代基所取代;

当L₂选自-(CR_aR_b)_nS-时,R₁₀各自独立地选自-H、-F、-Cl、-Br、-I、羟基、氰基、氨基、C₁₋₄烷基、C₁₋₄烷氧基和C₁₋₄烷氧基C₁₋₆烷基,所述的烷基和烷氧基各自独立任选进一步被0至4个选自H、卤素、羟基、氰基、C₁₋₄烷基和C₁₋₄烷氧基的取代基所取代;

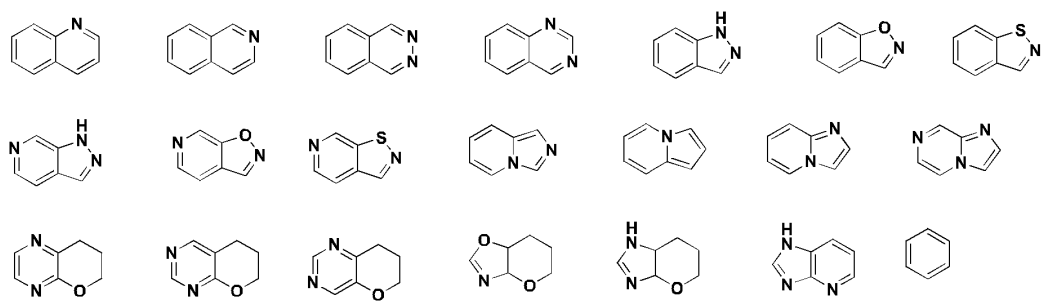
R_a和R_b各自独立地选自-H和C₁₋₆烷基;

n每次出现时独立地选自0、1、2和3。

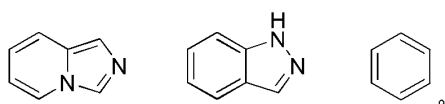
13. 根据权利要求 1 所述的化合物, 或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药, 其特征在于, A 选自如下结构:



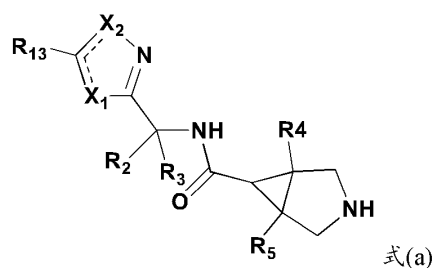
14. 根据权利要求 1 所述的化合物, 或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药, 其特征在于, A 选自如下结构之一:



15. 根据权利要求 1 所述的化合物, 或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药, 其特征在于, A 选自如下结构:



16. 式(a)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药,



其中:

---表示单键或双键, 条件是两个---中有且仅有一个表示双键;

X_1 为 CR_{13} 或 NR_{12} ;

X_2 为 CR_{13} 或 NR_{12} ;

或者, X_1 及其取代基与相邻的碳原子及其取代基 R_{13} 一起形成苯环或 5-至 6-元杂芳环, 所述苯环或 5-至 6-元杂芳环任选被 1-4 个 R_{13} 取代;

R_{13} 各自独立地选自 -H、卤素、氨基、 $-(CH_2)_n-NR'R''$ 、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n-OR$ 、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 烯基、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 炔基、 $-(CH_2)_n-C_{3-10}$ 碳环基、 $-(CH_2)_n$ -(3 至 10 元杂环基)、 $-(CH_2)_n-C_{6-10}$

5 芳基、 $-(CH_2)_n$ -5 至 6 元杂芳基和 $-SR_{11}$;

R_{12} 选自 H、 C_{1-6} 烷基和卤代 C_{1-6} 烷基;

R_{11} 选自 -H、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 烯基、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 炔基、 $-(CH_2)_n-C_{3-10}$ 碳环基、 $-(CH_2)_n$ -(3 至 10 元杂环基)、 $-(CH_2)_n-C_{6-10}$ 芳基和 $-(CH_2)_n$ -5 至 6 元杂芳基;

R' 和 R'' 各自选自氢、 C_{1-6} 烷基和卤代 C_{1-6} 烷基, 或者 R' 和 R'' 与它们连接的氮原子一起形成 3 至 10 元杂环基;

R 选自氢、 C_{1-6} 烷基和卤代 C_{1-6} 烷基;

R_2 和 R_3 各自独立地选自 H、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基和 $-(CH_2)_n-OR$;

R_4 和 R_5 各自独立地选自 H、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基和 $-(CH_2)_n-OR$;

n 为 0、1、2 或 3;

15 条件是至少一个 R_{13} 为 $-SR_{11}$ 取代基。

17. 权利要求 16 的式(a)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药理学上可以接受的盐、多晶型或前药, 其中:

X_2 为 CR_{13} ;

20 X_1 及其取代基与相邻的碳原子及其取代基 R_{13} 一起形成苯环或 5-至 6-元杂芳环, 所述苯环或 5-至 6-元杂芳环被 1-4 个 R_{13} 取代;

R_{13} 各自独立地选自 -H、卤素、氨基、 $-(CH_2)_n-NR'R''$ 、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n-OR$ 、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 烯基、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 炔基、 $-(CH_2)_n-C_{3-10}$ 碳环基、 $-(CH_2)_n$ -(3 至 10 元杂环基)、 $-(CH_2)_n-C_{6-10}$ 芳基、 $-(CH_2)_n$ -5 至 6 元杂芳基和 $-SR_{11}$;

25 R_{11} 选自 -H、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 烯基、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 炔基、 $-(CH_2)_n-C_{3-10}$ 碳环基、 $-(CH_2)_n$ -(3 至 10 元杂环基)、 $-(CH_2)_n-C_{6-10}$ 芳基和 $-(CH_2)_n$ -5 至 6 元杂芳基;

R' 和 R'' 各自选自氢、 C_{1-6} 烷基和卤代 C_{1-6} 烷基, 或者 R' 和 R'' 与它们连接的氮原子一起形成 3 至 10 元杂环基;

R 选自氢、 C_{1-6} 烷基和卤代 C_{1-6} 烷基;

R_2 和 R_3 各自独立地选自 H、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基和 $-(CH_2)_n-OR$;

30 R_4 和 R_5 各自独立地选自 H、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基和 $-(CH_2)_n-OR$;

n 为 0、1、2 或 3;

条件是至少一个 R_{13} 为 $-SR_{11}$ 取代基。

18. 权利要求 16 的式(a)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药理学上可以接受的盐、多晶型或前药, 其中:

35 X_2 为 NR_{12} ;

X_1 及其取代基与相邻的碳原子及其取代基 R_{13} 一起形成苯环或 5-至 6-元杂芳环, 所述苯环或 5-至 6-元杂芳环被 1-4 个 R_{13} 取代;

R_{13} 各自独立地选自 -H、卤素、氰基、 $-(CH_2)_n-NR'R''$ 、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n-OR$ 、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 烯基、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 炔基、 $-(CH_2)_n-C_{3-10}$ 碳环基、 $-(CH_2)_n$ -(3 至 10 元杂环基)、 $-(CH_2)_n-C_{6-10}$ 芳基、 $-(CH_2)_n$ -5 至 6 元杂芳基和 $-SR_{11}$;

R_{11} 选自 -H、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 烯基、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 炔基、 $-(CH_2)_n-C_{3-10}$ 碳环基、 $-(CH_2)_n$ -(3 至 10 元杂环基)、 $-(CH_2)_n-C_{6-10}$ 芳基和 $-(CH_2)_n$ -5 至 6 元杂芳基;

R' 和 R'' 各自选自氢、 C_{1-6} 烷基和卤代 C_{1-6} 烷基, 或者 R' 和 R'' 与它们连接的氮原子一起形成 3 至 10 元杂环基;

R 选自氢、 C_{1-6} 烷基和卤代 C_{1-6} 烷基;

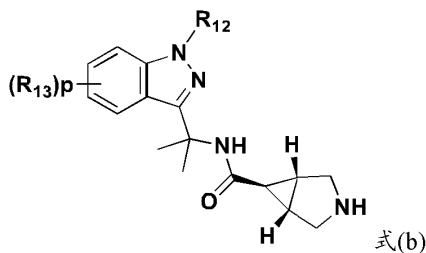
R_2 和 R_3 各自独立地选自 H、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基和 $-(CH_2)_n-OR$;

R_4 和 R_5 各自独立地选自 H、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基和 $-(CH_2)_n-OR$;

n 为 0、1、2 或 3;

条件是至少一个 R_{13} 为 $-SR_{11}$ 。

19. 式(b)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药,



其中:

R_{13} 各自独立地选自 H、卤素、氰基、 $-(CH_2)_n-NR'R''$ 、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n-OR$ 、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 烯基、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 炔基、 $-(CH_2)_n-C_{3-10}$ 碳环基、 $-(CH_2)_n$ -(3 至 10 元杂环基)、 $-(CH_2)_n-C_{6-10}$ 芳基、 $-(CH_2)_n$ -5 至 6 元杂芳基和 $-SR_{11}$, 且至少一个 R_{13} 为 $-SR_{11}$;

R_{12} 选自 H、 C_{1-6} 烷基或卤代 C_{1-6} 烷基;

R_{11} 选自 H、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 烯基、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 炔基、 $-(CH_2)_n-C_{3-10}$ 碳环基、 $-(CH_2)_n$ -(3 至 10 元杂环基)、 $-(CH_2)_n-C_{6-10}$ 芳基和 $-(CH_2)_n$ -5 至 6 元杂芳基;

R 选自氢、 C_{1-6} 烷基和卤代 C_{1-6} 烷基;

R' 和 R'' 各自选自氢、 C_{1-6} 烷基和卤代 C_{1-6} 烷基, 或者 R' 和 R'' 与它们连接的氮原子一起形成 3 至 10 元杂环基;

n 为 0、1、2 或 3;

p 为 1、2、3 或 4。

20. 权利要求 19 的式(b)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药

学上可以接受的盐、多晶型或前药，其中：

p 为 1、2 或 3；

R₁₃ 各自独立地选自 H、卤素、C₁₋₆ 烷基、卤代 C₁₋₆ 烷基、-(CH₂)_n-C₃₋₁₀ 碳环基和-SR₁₁，且至少一个 R₁₃ 为-SR₁₁；

5 R₁₁ 选自 C₁₋₆ 烷基、卤代 C₁₋₆ 烷基和-(CH₂)_n-C₃₋₆ 碳环基；

R₁₂ 选自 H、C₁₋₆ 烷基和卤代 C₁₋₆ 烷基；

n 为 0 或 1。

21. 权利要求 19 的式(b)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药

10 p 为 1 或 2；

R₁₃ 各自独立地选自 H、C₁₋₆ 烷基、卤代 C₁₋₆ 烷基和-SR₁₁，且至少一个 R₁₃ 为-SR₁₁；

R₁₁ 选自 C₁₋₄ 烷基和-(CH₂)_n-C₃₋₄ 碳环基；

R₁₂ 选自 H、C₁₋₄ 烷基和卤代 C₁₋₄ 烷基；

n 为 0 或 1。

15 22. 权利要求 19 的式(b)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药

学上可以接受的盐、多晶型或前药，其中：

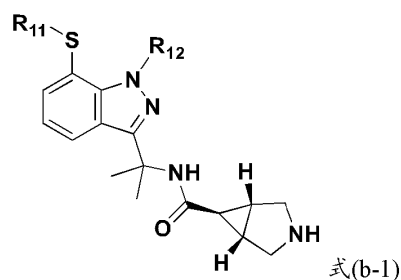
P 为 1；

R₁₃ 为-SMe；

R₁₂ 为 H 或 C₁₋₄ 烷基。

20 23. 式(b-1)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药

学上可以接受的盐、多晶型或前药，



其中：

25 R₁₁ 选自 H、C₁₋₆ 烷基、卤代 C₁₋₆ 烷基、-(CH₂)_n-C₂₋₆ 烯基、-(CH₂)_n-C₂₋₆ 炔基、-(CH₂)_n-C₃₋₁₀ 碳环基、-(CH₂)_n-(3 至 10 元杂环基)、-(CH₂)_n-C₆₋₁₀ 芳基和-(CH₂)_n-5 至 6 元杂芳基；

R₁₂ 选自 H、C₁₋₆ 烷基和卤代 C₁₋₆ 烷基；和

n 为 0、1、2 或 3。

24. 权利要求 23 的式(b-1)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、

30 药上可以接受的盐、多晶型或前药，其中：

R_{11} 选自 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基和 $-(CH_2)_n-C_{3-6}$ 碳环基；

R_{12} 选自 H、 C_{1-6} 烷基和卤代 C_{1-6} 烷基；和

n 为 0 或 1。

25. 权利要求 23 的式(b-1)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、
5 药上可以接受的盐、多晶型或前药，其中：

R_{11} 选自 C_{1-4} 烷基和 $-(CH_2)_n-C_{3-4}$ 碳环基；

R_{12} 选自 H、 C_{1-4} 烷基和卤代 C_{1-4} 烷基；

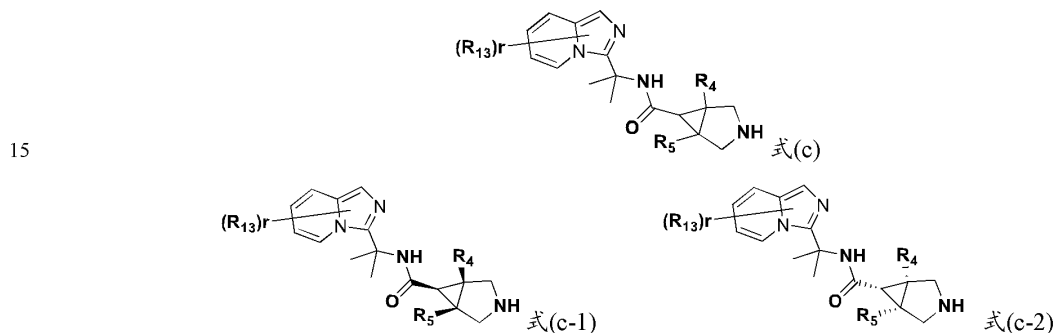
n 为 0 或 1。

26. 权利要求 23 的式(b-1)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、
10 药上可以接受的盐、多晶型或前药，其中：

R_{11} 为甲基；

R_{12} 为 H 或 C_{1-4} 烷基。

27. 式(c)化合物或其立体异构体式(c-1)或式(c-2)、其 N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、
药上可以接受的盐、多晶型或前药，



其中：

- R_{13} 各自独立地选自 H、卤素、氰基、 $-(CH_2)_n-NR'R''$ 、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n-OR$ 、
- $(CH_2)_n-C_{2-6}$ 烯基、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 炔基、 $-(CH_2)_n-C_{3-10}$ 碳环基、 $-(CH_2)_n$ -(3 至 10 元杂环基)、 $-(CH_2)_n-C_{6-10}$
20 芳基、 $-(CH_2)_n$ -5 至 6 元杂芳基和 $-SR_{11}$ ，且至少一个 R_{13} 为 $-SR_{11}$ ；

R_{11} 选自 H、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 烯基、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 炔基、 $-(CH_2)_n-C_{3-10}$ 碳环基、
- $(CH_2)_n$ -(3 至 10 元杂环基)、 $-(CH_2)_n-C_{6-10}$ 芳基和 $-(CH_2)_n$ -5 至 6 元杂芳基；

R_4 和 R_5 各自独立地选自 H、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基和 $-(CH_2)_n-OR$ ；

- R' 和 R'' 各自选自氢、 C_{1-6} 烷基和卤代 C_{1-6} 烷基，或者 R' 和 R'' 与它们连接的氮原子一起形成 3 至
25 10 元杂环基；

R 选自氢、 C_{1-6} 烷基和卤代 C_{1-6} 烷基；

n 为 0、1、2 或 3；

r 为 1、2、3、4 或 5。

28. 权利要求 27 的式(c)化合物或其立体异构体式(c-1)或式(c-2)、其 N-氧化物、水合物、溶剂化
30 物、代谢产物、药上可以接受的盐、多晶型或前药，其中：

r 为 1、2 或 3;

R_{13} 各自独立地选自 H、卤素、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n-C_{3-10}$ 碳环基和 $-SR_{11}$, 且至少一个 R_{13} 为 $-SR_{11}$;

R_{11} 选自 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基和 $-(CH_2)_n-C_{3-6}$ 碳环基;

5 R_4 和 R_5 各自独立地选自 H 和 C_{1-6} 烷基;

n 为 0 或 1。

29. 权利要求 27 的式(c)化合物或其立体异构体式(c-1)或式(c-2)、其 N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药, 其中:

r 为 1 或 2;

10 R_{13} 各自独立地选自 H、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基和 $-SR_{11}$, 且至少一个 R_{13} 为 $-SR_{11}$;

R_{11} 选自 C_{1-4} 烷基和 $-(CH_2)_n-C_{3-4}$ 碳环基;

R_4 和 R_5 各自独立地选自 H 和 C_{1-6} 烷基;

n 为 0 或 1。

30. 权利要求 27 的式(c)化合物或其立体异构体式(c-1)或式(c-2)、其 N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药, 其中:

r 为 2;

R_{13} 中一个为 $-SMe$, 另一个选自 H 和 C_{1-4} 烷基;

R_4 和 R_5 各自独立地选自 H 和 C_{1-4} 烷基。

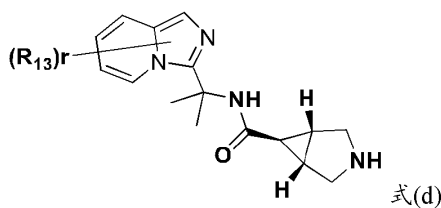
31. 权利要求 27 的式(c)化合物或其立体异构体式(c-1)或式(c-2)、其 N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药, 其中

r 为 1;

R_{13} 为 $-SMe$;

R_4 和 R_5 各自独立地选自 H 和 C_{1-4} 烷基。

32. 式(d)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药,



其中:

R_{13} 各自独立地选自 H、卤素、氰基、 $-(CH_2)_n-NR^1R^2$ 、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n-OR$ 、
30 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 烯基、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 炔基、 $-(CH_2)_n-C_{3-10}$ 碳环基、 $-(CH_2)_n$ -(3 至 10 元杂环基)、 $-(CH_2)_n-C_{6-10}$ 芳基、 $-(CH_2)_n$ -5 至 6 元杂芳基和 $-SR_{11}$, 且至少一个 R_{13} 为 $-SR_{11}$;

R_{11} 选自 H、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 烯基、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 炔基、 $-(CH_2)_n-C_{3-10}$ 碳环基、

$-(\text{CH}_2)_n$ -(3 至 10 元杂环基)、 $-(\text{CH}_2)_n$ -C₆₋₁₀ 芳基和 $-(\text{CH}_2)_n$ -5 至 6 元杂芳基；

R'和 R''各自选自氢、C₁₋₆烷基和卤代 C₁₋₆烷基，或者 R'和 R''与它们连接的氮原子一起形成 3 至 10 元杂环基；

R 选自氢、C₁₋₆烷基和卤代 C₁₋₆烷基；

5 n 为 0、1、2 或 3；

r 为 1、2、3、4 或 5。

33. 权利要求 32 的式(d)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药，其中：

r 为 1、2 或 3；

10 R₁₃ 各自独立地选自 H、卤素、C₁₋₆烷基、卤代 C₁₋₆烷基、 $-(\text{CH}_2)_n$ -C₃₋₁₀ 碳环基和-SR₁₁，且至少一个 R₁₃ 为-SR₁₁；

R₁₁ 选自 C₁₋₆烷基、卤代 C₁₋₆烷基和 $-(\text{CH}_2)_n$ -C₃₋₆ 碳环基；

n 为 0 或 1。

34. 权利要求 32 的式(d)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药
15 学上可以接受的盐、多晶型或前药，其中：

r 为 1 或 2；

R₁₃ 各自独立地选自 H、C₁₋₆烷基、卤代 C₁₋₆烷基和-SR₁₁，且至少一个 R₁₃ 为-SR₁₁；

R₁₁ 选自 C₁₋₄烷基和 $-(\text{CH}_2)_n$ -C₃₋₄ 碳环基；

n 为 0 或 1。

20 35. 权利要求 32 的式(d)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药，其中：

r 为 2；

R₁₃ 中一个为-SMe，另一个选自 H 和 C₁₋₄烷基。

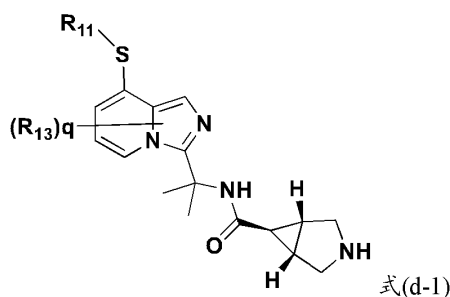
36. 权利要求 32 的式(d)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药
25 学上可以接受的盐、多晶型或前药，其中：

r 为 1；

R₁₃ 为-SMe。

37. 式(d-1)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药，

30



其中：

R_{11} 选自 H、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 烯基、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 炔基、 $-(CH_2)_n-C_{3-10}$ 碳环基、 $-(CH_2)_n-(3 \text{ 至 } 10 \text{ 元杂环基})$ 、 $-(CH_2)_n-C_{6-10}$ 芳基和 $-(CH_2)_n-5 \text{ 至 } 6 \text{ 元杂芳基}$ ；

5 R_{13} 各自独立地选自 H、卤素、氰基、 $-(CH_2)_n-NR'R''$ 、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n-OR$ 、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 烯基、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 炔基、 $-(CH_2)_n-C_{3-10}$ 碳环基、 $-(CH_2)_n-(3 \text{ 至 } 10 \text{ 元杂环基})$ 、 $-(CH_2)_n-C_{6-10}$ 芳基、 $-(CH_2)_n-5 \text{ 至 } 6 \text{ 元杂芳基}$ 和 $-SR_{11}$ ；

R' 和 R'' 各自选自氢、 C_{1-6} 烷基和卤代 C_{1-6} 烷基，或者 R' 和 R'' 与它们连接的氮原子一起形成 3 至 10 元杂环基；

10 R 选自氢、 C_{1-6} 烷基和卤代 C_{1-6} 烷基；

n 为 0、1、2 或 3；

q 为 0、1、2、3 或 4。

38. 权利要求 37 的式(d-1)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药，其中：

15 q 为 0、1 或 2；

R_{13} 各自独立地选自 H、卤素、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n-C_{3-10}$ 碳环基和 $-SR_{11}$ ；

R_{11} 选自 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基和 $-(CH_2)_n-C_{3-6}$ 碳环基；

n 为 0 或 1。

39. 权利要求 37 的式(d-1)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药，其中：

q 为 0 或 1；

R_{11} 选自 C_{1-4} 烷基和 $-(CH_2)_n-C_{3-4}$ 碳环基；

R_{13} 选自 H、 C_{1-4} 烷基和卤代 C_{1-4} 烷基；

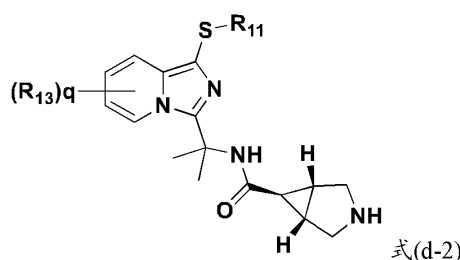
n 为 0 或 1。

25 40. 权利要求 37 的式(d-1)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药，其中：

q 为 0；

R_{11} 为 C_{1-4} 烷基。

41. 式(d-2)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药，



其中：

R_{11} 选自 H、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 烯基、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 炔基、 $-(CH_2)_n-C_{3-10}$ 碳环基、
5 $-(CH_2)_n-(3 \text{ 至 } 10 \text{ 元杂环基})$ 、 $-(CH_2)_n-C_{6-10}$ 芳基和 $-(CH_2)_n-5 \text{ 至 } 6 \text{ 元杂芳基}$ ；

R_{13} 各自独立地选自 H、卤素、氰基、 $-(CH_2)_n-NR'R''$ 、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n-OR$ 、
 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 烯基、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 炔基、 $-(CH_2)_n-C_{3-10}$ 碳环基、 $-(CH_2)_n-(3 \text{ 至 } 10 \text{ 元杂环基})$ 、 $-(CH_2)_n-C_{6-10}$
芳基、 $-(CH_2)_n-5 \text{ 至 } 6 \text{ 元杂芳基}$ 和 $-SR_{11}$ ；

R' 和 R'' 各自选自氢、 C_{1-6} 烷基和卤代 C_{1-6} 烷基，或者 R' 和 R'' 与它们连接的氮原子一起形成 3 至
10 10 元杂环基；

R 选自氢、 C_{1-6} 烷基和卤代 C_{1-6} 烷基；

n 为 0、1、2 或 3；

q 为 0、1、2、3 或 4。

42. 权利要求 41 的式(d-2)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药
15 学上可以接受的盐、多晶型或前药，其中：

q 为 0、1 或 2；

R_{11} 选自 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基和 $-(CH_2)_n-C_{3-6}$ 碳环基；

R_{13} 各自独立地选自 H、卤素、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n-C_{3-10}$ 碳环基和 $-SR_{11}$ ；

n 为 0 或 1。

43. 权利要求 41 的式(d-2)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、
20 药上可以接受的盐、多晶型或前药，其中：

q 为 0 或 1；

R_{11} 选自 C_{1-4} 烷基、卤代 C_{1-4} 烷基和 $-(CH_2)_n-C_{3-4}$ 碳环基；

R_{13} 各自独立地选自 H、 C_{1-6} 烷基和卤代 C_{1-6} 烷基；

25 n 为 0 或 1。

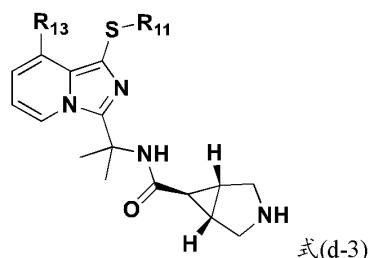
44. 权利要求 41 的式(d-2)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、
药上可以接受的盐、多晶型或前药，其中：

q 为 1；

R_{11} 为甲基；

30 R_{13} 为 H 或 C_{1-4} 烷基。

45. 式(d-3)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药,



5 其中:

R_{11} 选自 H、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 烯基、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 炔基、 $-(CH_2)_n-C_{3-10}$ 碳环基、 $-(CH_2)_n$ -(3 至 10 元杂环基)、 $-(CH_2)_n-C_{6-10}$ 芳基和 $-(CH_2)_n$ -5 至 6 元杂芳基;

R_{13} 选自 H、卤素、氟基、 $-(CH_2)_n-NR'R''$ 、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n-OR$ 、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 烯基、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 炔基、 $-(CH_2)_n-C_{3-10}$ 碳环基、 $-(CH_2)_n$ -(3 至 10 元杂环基)、 $-(CH_2)_n-C_{6-10}$ 芳基、 $-(CH_2)_n$ -5 至 6 元杂芳基和 $-SR_{11}$;

R' 和 R'' 各自选自氢、 C_{1-6} 烷基和卤代 C_{1-6} 烷基,或者 R' 和 R'' 与它们连接的氮原子一起形成 3 至 10 元杂环基;

R 选自氢、 C_{1-6} 烷基和卤代 C_{1-6} 烷基;

n 为 0、1、2 或 3。

15 46. 权利要求 45 的式(d-3)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药, 其中:

R_{11} 选自 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基和 $-(CH_2)_n-C_{3-6}$ 碳环基;

R_{13} 各自独立地选自 H、卤素、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n-C_{3-10}$ 碳环基和 $-SR_{11}$;

n 为 0 或 1。

20 47. 权利要求 45 的式(d-3)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药, 其中:

R_{11} 选自 C_{1-4} 烷基、卤代 C_{1-4} 烷基和 $-(CH_2)_n-C_{3-4}$ 碳环基;

R_{13} 选自 H、 C_{1-4} 烷基和卤代 C_{1-4} 烷基;

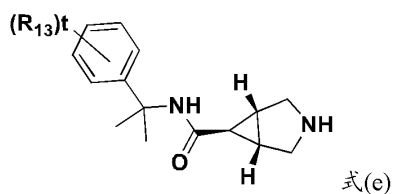
n 为 0 或 1。

25 48. 权利要求 45 的式(d-3)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药, 其中:

R_{11} 为甲基;

R_{13} 为 H 或 C_{1-4} 烷基。

30 49. 式(e)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药,



其中:

R_{13} 选自 H、卤素、氰基、 $-(CH_2)_n-NR'R''$ 、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n-OR$ 、 $-(CH_2)_n-C_{3-6}$ 环烷基和 $-SR_{11}$ ，且至少一个 R_{13} 为 $-SR_{11}$ ；

5 R_{11} 选自 H、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n-OR$ 、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 烯基、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 炔基、 $-(CH_2)_n-C_{3-10}$ 碳环基、 $-(CH_2)_n$ -(3 至 10 元杂环基)、 $-(CH_2)_n-C_{6-10}$ 芳基和 $-(CH_2)_n$ -5 至 6 元杂芳基；

R' 和 R'' 各自选自氢、 C_{1-6} 烷基和卤代 C_{1-6} 烷基，或者 R' 和 R'' 与它们连接的氮原子一起形成 3 至 10 元杂环基；

R 选自氢、 C_{1-6} 烷基和卤代 C_{1-6} 烷基；

10 n 为 0、1、2 或 3；

t 为 1、2、3、4 或 5。

50. 权利要求 49 的式(c)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药，其中：

t 为 1、2 或 3；

15 R_{13} 各自独立地选自 H、卤素、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n-C_{3-10}$ 碳环基和 $-SR_{11}$ ，且至少一个 R_{13} 为 $-SR_{11}$ ；

R_{11} 选自 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基和 $-(CH_2)_n-C_{3-6}$ 碳环基；

n 为 0 或 1。

20 51. 权利要求 49 的式(c)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药，其中：

t 为 1 或 2；

R_{13} 各自独立地选自 H、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基和 $-SR_{11}$ ，且至少一个 R_{13} 为 $-SR_{11}$ ；

R_{11} 选自 C_{1-4} 烷基和 $-(CH_2)_n-C_{3-4}$ 碳环基；

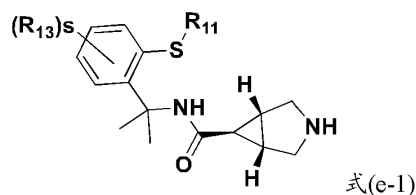
n 为 0 或 1。

25 52. 权利要求 49 的式(c)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药，其中：

t 为 1；

R_{11} 为 C_{1-4} 烷基。

30 53. 式(c-1)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药，



其中：

R_{13} 选自 H、卤素、氟基、 $-(CH_2)_n-NR'R''$ 、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n-OR$ 、 $-(CH_2)_n-C_{3-6}$ 环烷基和 $-SR_{11}$ ，

5 R_{11} 选自 H、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n-OR$ 、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 烯基、 $-(CH_2)_n-C_{2-6}$ 炔基、 $-(CH_2)_n-C_{3-10}$ 碳环基、 $-(CH_2)_n$ -(3 至 10 元杂环基)、 $-(CH_2)_n-C_{6-10}$ 芳基和 $-(CH_2)_n$ -5 至 6 元杂芳基；

R' 和 R'' 各自选自氢、 C_{1-6} 烷基和卤代 C_{1-6} 烷基，或者 R' 和 R'' 与它们连接的氮原子一起形成 3 至 10 元杂环基；

R 选自氢、 C_{1-6} 烷基和卤代 C_{1-6} 烷基；

10 n 为 0、1、2 或 3；

s 为 0、1、2、3 或 4。

54. 权利要求 53 的式(e-1)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药，其中：

s 为 0、1 或 2；

15 R_{13} 各自独立地选自 H、卤素、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基、 $-(CH_2)_n-C_{3-10}$ 碳环基和 $-SR_{11}$ ；

R_{11} 选自 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基和 $-(CH_2)_n-C_{3-6}$ 碳环基；

n 为 0 或 1。

55. 权利要求 53 的式(e-1)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药，其中：

20 s 为 0 或 1；

R_{13} 各自独立地选自 H、 C_{1-6} 烷基、卤代 C_{1-6} 烷基和 $-SR_{11}$ ；

R_{11} 选自 C_{1-4} 烷基和 $-(CH_2)_n-C_{3-4}$ 碳环基；

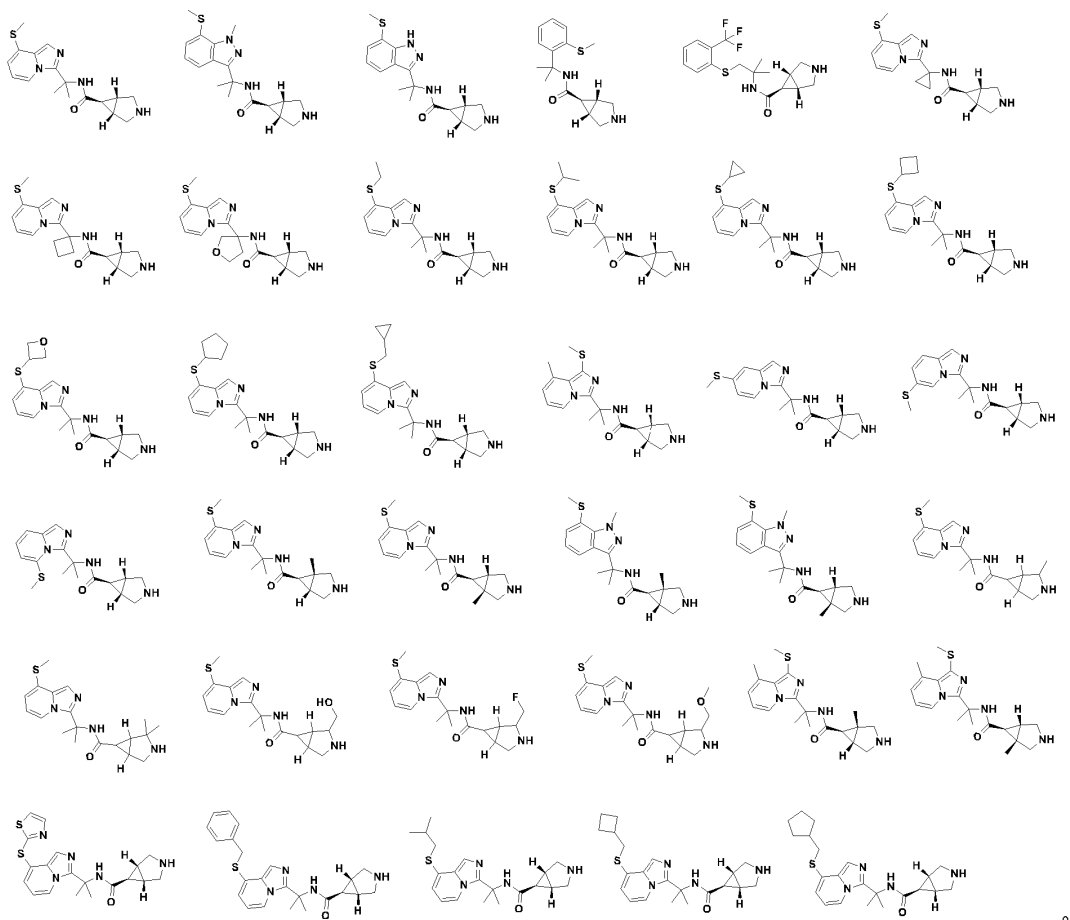
n 为 0 或 1。

56. 权利要求 53 的式(e-1)化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药，其中：

s 为 0；

R_{11} 为 C_{1-4} 烷基。

57. 根据权利要求 1 所述的化合物，或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药，其特征在于，选自如下结构：



58. 根据权利要求 1~57 任一项所述的化合物, 或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药, 其特征在于, 所述药学上可以接受的盐选自盐酸盐、
 5 氯溴酸盐、硫酸盐、硝酸盐、磷酸盐、乙酸盐、马来酸盐、琥珀酸盐、扁桃酸盐、富马酸盐、丙二酸盐、苹果酸盐、2-羟基丙酸盐、草酸盐、羟乙酸盐、水杨酸盐、葡萄糖醛酸盐、半乳糖醛酸盐、枸橼酸盐、酒石酸盐、门冬氨酸盐、谷氨酸盐、苯甲酸盐、肉桂酸盐、对甲苯磺酸盐、苯磺酸盐、甲磺酸盐、乙磺酸盐和三氟甲磺酸盐, 或它们的组合。

59. 一种药物组合物, 其特征在于, 所述药物组合物含有治疗有效剂量的权利要求 1~58 中任一
 10 项所述的化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药, 以及药学上可接受的载体或者赋形剂。

60. 如权利要求 1~58 中任一项所述的化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药或如权利要求 59 所述的药物组合物, 在制备具有治
 疗和/或预防受 SSTR4 活化影响的疾病或症状的药物中的应用。

61. 如权利要求 1~58 中任一项所述的化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、
 15 代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药或如权利要求 59 所述的药物组合物, 在制备具有治
 疗和/或预防疼痛的药物中的应用。

62. 根据权利要求 61 所述的应用, 其特征在于, 所述疼痛为神经痛。

63. 根据权利要求 61 所述的应用, 其特征在于, 所述疼痛为背痛、慢性背痛、三叉神经痛、I 型复杂区域疼痛综合征、II 型复杂区域疼痛综合征、肠激惹综合征、糖尿病性神经病变、骨关节炎所引起的疼痛、肿瘤疼痛和肌肉纤维疼痛。

64. 如权利要求 1~58 中任一项所述的化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药或如权利要求 59 所述的药物组合物, 其用于治疗或/或预防受 SSTR4 活化影响的疾病或症状。

65. 如权利要求 1~58 中任一项所述的化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药或如权利要求 59 所述的药物组合物, 其用于治疗或/或预防疼痛。

66. 根据权利要求 65 所述的化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药或权利要求 65 所述的药物组合物, 其特征在于, 所述疼痛为神经痛。

67. 根据权利要求 65 所述的化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药或权利要求 65 所述的药物组合物, 其特征在于, 所述疼痛为背痛、慢性背痛、三叉神经痛、I 型复杂区域疼痛综合征、II 型复杂区域疼痛综合征、肠激惹综合征、糖尿病性神经病变、骨关节炎所引起的疼痛、肿瘤疼痛和肌肉纤维疼痛。

68. 一种治疗受 SSTR4 活化影响的疾病或症状的方法, 其包括给予如权利要求 1~58 中任一项所述的化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药或如权利要求 59 所述的药物组合物。

69. 一种治疗疼痛的方法, 其包括给予如权利要求 1~58 中任一项所述的化合物或其立体异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物、代谢产物、药学上可以接受的盐、多晶型或前药或如权利要求 59 所述的药物组合物。

70. 权利要求 69 的方法, 其中所述疼痛为神经痛。

71. 权利要求 69 的方法, 其中所述疼痛为背痛、慢性背痛、三叉神经痛、I 型复杂区域疼痛综合征、II 型复杂区域疼痛综合征、肠激惹综合征、糖尿病性神经病变、骨关节炎所引起的疼痛、肿瘤疼痛和肌肉纤维疼痛。