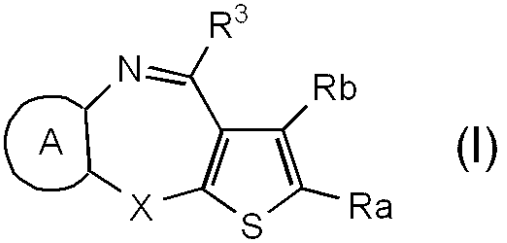
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成21年2月5日(2009.2.5)

【公開番号】特開2001-72684(P2001-72684A)
【公開日】平成13年3月21日(2001.3.21)
【出願番号】特願2000-289527(P2000-289527)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 495/04　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/5513　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/553　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/554　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/18　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/20　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/24　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/28　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 498/04　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 513/04　(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 495/04　１０８
Ａ６１Ｋ 31/5513
Ａ６１Ｋ 31/553
Ａ６１Ｋ 31/554
Ａ６１Ｐ 25/18
Ａ６１Ｐ 25/20
Ａ６１Ｐ 25/24
Ａ６１Ｐ 25/28
Ｃ０７Ｄ 498/04　１１６
Ｃ０７Ｄ 513/04　３９１

【手続補正書】
【提出日】平成20年12月11日(2008.12.11)
【手続補正１】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】特許請求の範囲
【補正方法】変更
【補正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項１】　一般式（Ｉ）



(I)

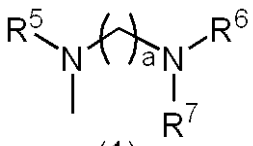
{式中、Ｒａ、Ｒｂは同一または異なって水素、アルキル、シクロアルキル、アシル、アルケニル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アミノアルキル、モノアルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、アルコキシアルキル、アシロキシアルキル、アシルアミノアルキル、ハロゲン、ハロゲン化アルキル

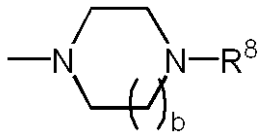
またはニトロを示す。または、Ｒａ、Ｒｂは互いに結合して置換基Ｒ^{1}、Ｒ^{2}を有していてもよいベンゼン環またはシクロヘキセン環を形成することもできる（ここで、Ｒ^{1}、Ｒ^{2}は同一または異なって水素、アルキル、アルコキシ、ヒドロキシル、またはハロゲンを示す）。

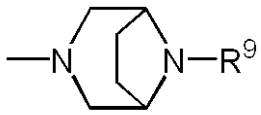
ＸはＮＨ、Ｎ－Ｒ^{4}（Ｒ^{4}はアルキルを示す）、Ｏ、Ｓ、ＳＯまたはＳＯ$_{2}$を示す。ただし、ＸがＮＨのとき、Ｒａ、Ｒｂは互いに結合して置換基Ｒ^{1}、Ｒ^{2}を有していてもよいベンゼン環を形成する。また、ＸがＳ、ＳＯまたはＳＯ$_{2}$のとき、Ｒａ、Ｒｂは互いに結合して置換基Ｒ^{1}、Ｒ^{2}を有していてもよいシクロヘキセン環またはベンゼン環を形成する。

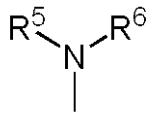
環Ａはベンゼン環上にアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アルコキシアルキル、ハロゲン、ハロゲン化アルキル、ニトロ、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アシルアミノ、ヒドロキシルおよびシアノから選ばれる同一または異なる置換基を１～４個有するか、もしくは置換基を有しないベンゼン環を示す。

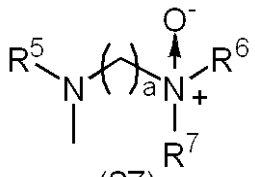
Ｒ^{3}は式(1)、式(2)、式(3)、式(26)、式(27)、式(28)、式(29)または式(30)により表される基を示す。

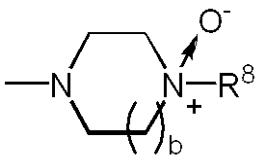

(1)

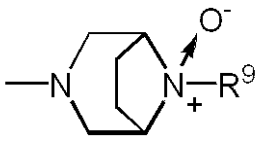

(2)

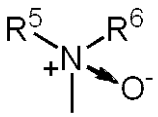

(3)


(26)


(27)


(28)


(29)


(30)

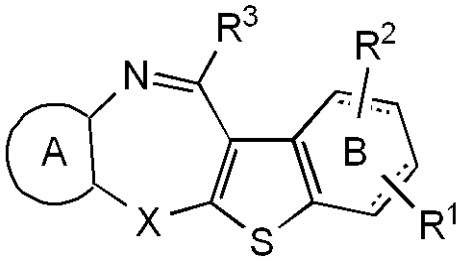
〔式(1)、式(26)、式(27)、式(30)中、Ｒ^{5}、Ｒ^{6}、Ｒ^{7}は同一または異なって、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、ヒドロキシアルコキシアルキル、アミノアルキル、モノアルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキルまたはアルコキシアルキルを示す。ａは２～４の整数を示す。

式(2)、式(28)中、Ｒ^{8}は水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、ヒドロキシアルコキシアルキル、アミノアルキル、モノアルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、アシル、アルコキシカルボニルまたはアルコキシアルキルを示す。ｂは１または２を示す。ただし、ＸがＯのとき、Ｒ^{8}がアラルキルである場合を除く。また、ＸがＯのとき、Ｒ^{8}のアルキル、ヒドロキシアルキルまたはアルコキシアルキルにおけるアルキルの炭素数は１～４である。

式(3)、式(29)中、Ｒ^{9}は水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、ヒドロキシアルコキシアルキル、アミノアルキル、モノアルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、アシル、アルコキシカルボニルまたはアルコキシアルキルを示す。〕｝

により表される縮合チオフェン化合物、その医薬上許容される塩またはそれらの水和物。

【請求項２】　一般式（Ｉ）が一般式（ＩＡ）



(IA)

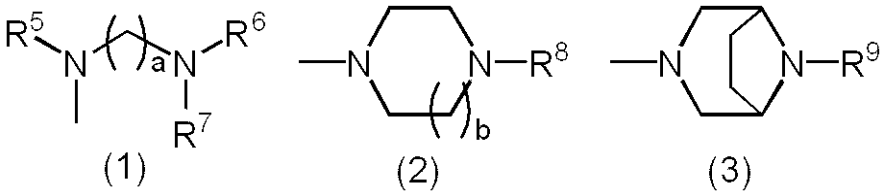
{式中、ＸはＮＨ、Ｎ－Ｒ[4]（Ｒ[4]はアルキルを示す）、Ｏ、Ｓ、ＳＯまたはＳＯ[2]を示す。

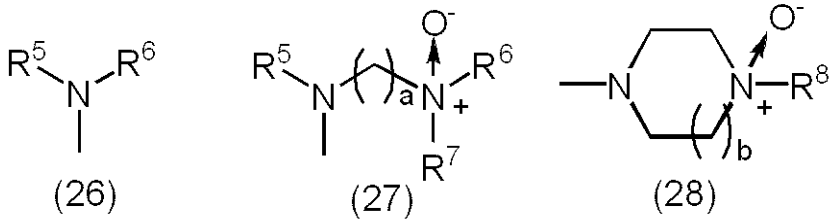
Ｒ[1]、Ｒ[2]は同一または異なって水素、アルキル、アルコキシ、ヒドロキシル、またはハロゲンを示す。

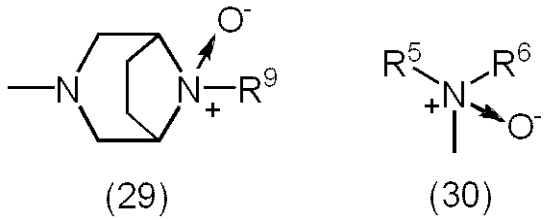
環Ａはベンゼン環上にアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アルコキシアルキル、ハロゲン、ハロゲン化アルキル、ニトロ、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アシルアミノ、ヒドロキシルおよびシアノから選ばれる同一または異なる置換基を１～４個有するか、もしくは置換基を有しないベンゼン環を示す。

環Ｂは点線と実線で示される結合が二重結合として表されるベンゼン環、あるいは単結合として表されるシクロヘキサン環を示す。ただし、ＸがＮＨのとき、点線と実線で示される結合が単結合である場合を除く。

Ｒ[3]は式(1)、式(2)、式(3)、式(26)、式(27)、式(28)、式(29)または式(30)により表される基を示す。







〔式(1)、式(26)、式(27)、式(30)中、Ｒ[5]、Ｒ[6]、Ｒ[7]は同一または異なって、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、ヒドロキシアルコキシアルキル、アミノアルキル、モノアルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキルまたはアルコキシアルキルを示す。ａは２～４の整数を示す。

式(2)、式(28)中、Ｒ[8]は水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、ヒドロキシアルコキシアルキル、アミノアルキル、モノアルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、アシル、アルコキシカルボニルまたはアルコキシアルキルを示す。ｂは１または２を示す。

式(3)、式(29)中、Ｒ[9]は水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、ヒドロキシアルコキシアルキル、アミノアルキル、モノアルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、アシル、アルコキシカルボニルまたはアルコキシアルキルを示す。〕}

である請求項１記載の縮合チオフェン化合物、その医薬上許容される塩またはそれらの水和物。

【請求項３】　環Ｂは点線と実線で示される結合が二重結合として表されるベンゼン環である請求項２記載の縮合チオフェン化合物、その医薬上許容される塩またはそれらの水和物。

【請求項４】　ＸはＮＨ、ＯまたはＳを示し、R^1、R^2は同一または異なって水素、ハロゲン、アルコキシまたはアルキルを示し、環Ａはベンゼン環上にアルキル、アルコキシ、ハロゲンおよびハロゲン化アルキルから選ばれる同一または異なる置換基を１～４個有するか、もしくは置換基を有しないベンゼン環を示し、環Ｂは点線と実線で示される結合が二重結合として表されるベンゼン環を示し、R^3は式(2)により表される基を示し、ここでR^8はヒドロキシアルコキシアルキル、メチルまたはエチルを示し、ｂは１である請求項２記載の縮合チオフェン化合物、その医薬上許容される塩またはそれらの水和物。

【請求項５】　ＸはＮＨを示し、R^1、R^2は同一または異なって水素、ハロゲン、アルコキシまたはアルキルを示し、環Ａはベンゼン環上にアルキル、アルコキシ、ハロゲンおよびハロゲン化アルキルから選ばれる同一または異なる置換基を１～４個有するか、もしくは置換基を有しないベンゼン環を示し、環Ｂは点線と実線で示される結合が二重結合として表されるベンゼン環を示し、R^3は式(2)により表される基を示し、ここでＲ８はメチルまたはエチルを示し、ｂは１である請求項２記載の縮合チオフェン化合物、その医薬上許容される塩またはそれらの水和物。

【請求項６】　１２－（４－メチルピペラジン－１－イル）－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン、

８－フルオロ－１２－（４－メチルピペラジン－１－イル）－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン、

８－メチル－１２－（４－メチルピペラジン－１－イル）－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン、

８－クロロ－１２－（４－メチルピペラジン－１－イル）－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン、

８－ブロモ－１２－（４－メチルピペラジン－１－イル）－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン、

９－フルオロ－１２－（４－メチルピペラジン－１－イル）－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン、

９－メチル－１２－（４－メチルピペラジン－１－イル）－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン、

９－クロロ－１２－（４－メチルピペラジン－１－イル）－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン、

９－ブロモ－１２－（４－メチルピペラジン－１－イル）－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン、

９－メトキシ－１２－（４－メチルピペラジン－１－イル）－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン、

８，９－ジフルオロ－１２－（４－メチルピペラジン－１－イル）－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン、

８，１０－ジフルオロ－１２－（４－メチルピペラジン－１－イル）－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン、

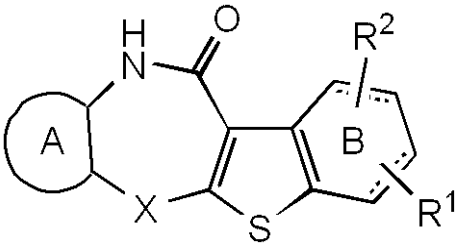
３－メチル－１２－（４－メチルピペラジン－１－イル）－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン、

８－フルオロ－３－メチル－１２－（４－メチルピペラジン－１－イル）－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン、

２－メチル－１２－（４－メチルピペラジン－１－イル）－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン、

８－フルオロ－２－メチル－１２－（４－メチルピペラジン－１－イル）－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン、
３－メトキシ－１２－（４－メチルピペラジン－１－イル）－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン、
８－フルオロ－３－メトキシ－１２－（４－メチルピペラジン－１－イル）－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン、
８，９－ジクロロ－１２－（４－メチルピペラジン－１－イル）－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン、
７，８－ジクロロ－１２－（４－メチルピペラジン－１－イル）－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン、
３－ブロモ－８－フルオロ－１２－（４－メチルピペラジン－１－イル）－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン、
３－フルオロ－１２－（４－メチルピペラジン－１－イル）－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン、
３－クロロ－１２－（４－メチルピペラジン－１－イル）－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン、
１－メチル－１２－（４－メチルピペラジン－１－イル）－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン、
４－メチル－１２－（４－メチルピペラジン－１－イル）－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン、
３，８－ジフルオロ－１２－（４－メチルピペラジン－１－イル）－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン、
３－フルオロ－８－メチル－１２－（４－メチルピペラジン－１－イル）－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン、
および１２－（４－エチルピペラジン－１－イル）－８－フルオロ－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピンから選ばれる請求項２記載の縮合チオフェン化合物、その医薬上許容される塩またはそれらの水和物。

【請求項７】　一般式（ＩＩＡ）



(IIA)

（式中、ＸはＮＨ、Ｎ－Ｒ^{4}（Ｒ^{4}はアルキルを示す）、Ｏ、Ｓ、ＳＯまたはＳＯ$_{2}$を示す。
Ｒ^{1}、Ｒ^{2}は同一または異なって水素、アルキル、アルコキシ、ヒドロキシルまたはハロゲンを示す。
環Ａはベンゼン環上にアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アルコキシアルキル、ハロゲン、ハロゲン化アルキル、ニトロ、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アシルアミノ、ヒドロキシルおよびシアノから選ばれる同一または異なる置換基を１～４個有するか、もしくは置換基を有しないベンゼン環を示す。
環Ｂは点線と実線で示される結合が二重結合として表されるベンゼン環、あるいは単結合として表されるシクロヘキサン環を示す。ただし、ＸがＮＨのとき、点線と実線で示される結合が単結合である場合を除く。）
により表されるベンゾチオフェン化合物。

【請求項８】　ＸはＮＨ、ＯまたはＳを示し、Ｒ^{1}、Ｒ^{2}は同一または異なって水素、ハロゲン、アルコキシまたはアルキルを示し、環Ａはベンゼン環上にアルキル、アルコキシ、ハロゲン、ヒドロキシルおよびハロゲン化アルキルから選ばれる同一または異なる

置換基を１～４個有するか、もしくは置換基を有しないベンゼン環を示し、環Ｂは点線と実線で示される結合が二重結合として表されるベンゼン環、あるいは単結合として表されるシクロヘキサン環である（ただし、ＸがＮＨのとき、点線と実線で示される結合は単結合である場合を除く。）請求項７記載のベンゾチオフェン化合物。

【請求項９】　６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、

８－フルオロ－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、

８－クロロ－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、

８－ブロモ－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、

８－メチル－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、

９－フルオロ－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、

９－クロロ－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、

９－ブロモ－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、

９－メチル－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、

９－メトキシ－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、

８，９－ジフルオロ－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、

３－メチル－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、

８－フルオロ－３－メチル－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、

３－メトキシ－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、

８－フルオロ－３－メトキシ－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、

２－メチル－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、

８－フルオロ－２－メチル－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、

３，９－ジメチル－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、

１，２，３，４－テトラヒドロ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾオキサゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、

１，２，３，４－テトラヒドロ－８－メチル－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾオキサゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、

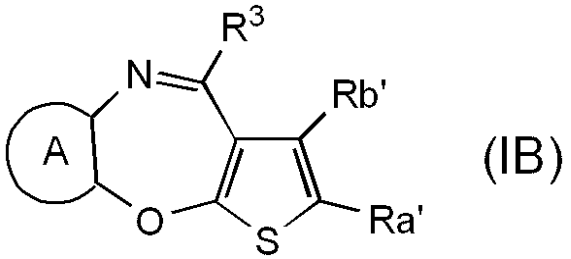
８－フルオロ－１，２，３，４－テトラヒドロ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾオキサゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、

〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾオキサゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、

８－メチル－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾオキサゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、

８－フルオロ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾオキサゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、
１，２，３，４－テトラヒドロ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾチアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、
１，２，３，４－テトラヒドロ－８－メチル－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾチアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、
８－フルオロ－１，２，３，４－テトラヒドロ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾチアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、
〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾチアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、
８－メチル－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾチアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、
８－フルオロ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾチアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、
８，９－ジクロロ－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、
７，８－ジクロロ－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、
９－トリフルオロメチル－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、
３－ブロモ－８－フルオロ－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、
６－メチル〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、
３－フルオロ－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、
３－クロロ－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、
１－メチル－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、
４－メチル－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、
３，８－ジフルオロ－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン、
および３－フルオロ－８－メチル－６Ｈ－〔１〕ベンゾチエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンゾジアゼピン－１２（１１Ｈ）－オン
から選ばれる請求項７記載のベンゾチオフェン化合物。

【請求項１０】　一般式（Ｉ）が一般式（ＩＢ）



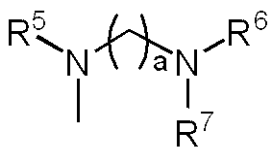
(IB)

｛式中、Ｒａ’、Ｒｂ’は同一または異なって水素、アルキル、シクロアルキル、アシル、アルケ
ニル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アミノアルキル、モノアルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、アルコキシアルキル、アシロキシアルキル、アシルアミノアルキル、ハロゲン、ハロゲン化アルキルまた

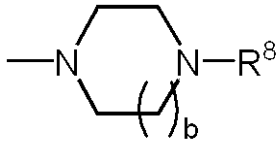
はニトロを示す。

環Ａはベンゼン環上にアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アルコキシアルキル、ハロゲン、ハロゲン化アルキル、ニトロ、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アシルアミノ、ヒドロキシルおよびシアノから選ばれる同一または異なる置換基１～４個を有するか、もしくは置換基を有しないベンゼン環を示す。

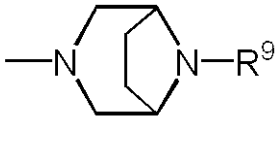
R^3は式(1)、式(2)、式(3)、式(26)、式(27)、式(28)、式(29)または式(30)により表される基を示す。



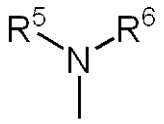
(1)



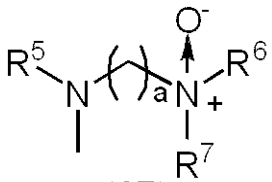
(2)



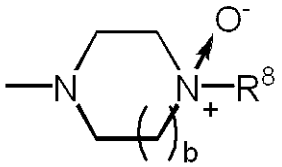
(3)



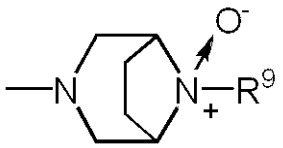
(26)



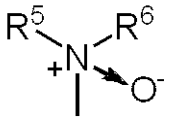
(27)



(28)



(29)



(30)

〔式(1)、式(26)、式(27)、式(30)中、R^5、R^6、R^7は同一または異なって、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、ヒドロキシアルコキシアルキル、アミノアルキル、モノアルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキルまたはアルコキシアルキルを示す。ａは２～４の整数を示す。

式(2)、式(28)中、R^8は水素、炭素数１～４のアルキル、シクロアルキル、炭素数１～４のヒドロキシアルキル、ヒドロキシアルコキシアルキル、アミノアルキル、モノアルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、アシル、アルコキシカルボニルまたは炭素数１～４のアルキルにアルコキシが置換したアルコキシアルキルを示す。ｂは１または２を示す。

式(3)、式(29)中、R^9は水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、ヒドロキシアルコキシアルキル、アミノアルキル、モノアルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、アシル、アルコキシカルボニルまたはアルコキシアルキルを示す。〕｝

である請求項１記載の縮合チオフェン化合物、その医薬上許容される塩またはそれらの水和物。

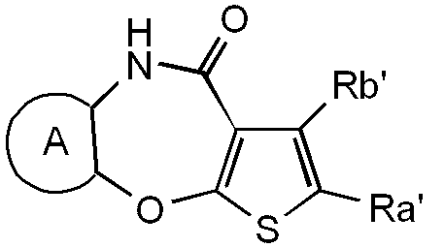
【請求項１１】　Ｒａ’、Ｒｂ’が同一または異なって水素またはアルキルを示し、環Ａはベンゼン環上にアルキル、アルコキシ、ハロゲンおよびハロゲン化アルキルから選ばれる同一または異なる置換基１～４個を有するか、もしくは置換基を有しないベンゼン環を示し、R^3が式(2)で表される基を示し、ここでR^8はヒドロキシアルコキシアルキル、メチルまたはエチルを示し、ｂは１である請求項１０記載の縮合チオフェン化合物、その医薬上許容される塩またはそれらの水和物。

【請求項１２】　Ｒａ’がアルキルを示し、Ｒｂ’が水素またはアルキルを示し、環Ａはベンゼン環上にアルキル、アルコキシおよびハロゲンから選ばれる置換基１個を有するか、もしくは置換基を有しないベンゼン環を示し、R^3が式(2)で表される基を示し、

ここでR8がメチルを示し、ｂは１である請求項１０記載の縮合チオフェン化合物、その医薬上許容される塩またはそれらの水和物。

【請求項１３】　２－メチル－４－（４－メチルピペラジン－１－イル）チエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンズオキサゼピン、
２－エチル－４－（４－メチルピペラジン－１－イル）チエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンズオキサゼピン、
２，８－ジメチル－４－（４－メチルピペラジン－１－イル）チエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンズオキサゼピン、
８－メトキシ－２－メチル－４－（４－メチルピペラジン－１－イル）チエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンズオキサゼピン、
２，６－ジメチル－４－（４－メチルピペラジン－１－イル）チエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンズオキサゼピン、
２，９－ジメチル－４－（４－メチルピペラジン－１－イル）チエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンズオキサゼピン、
２，３－ジメチル－４－（４－メチルピペラジン－１－イル）チエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンズオキサゼピン、
８－クロロ－２－メチル－４－（４－メチルピペラジン－１－イル）チエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンズオキサゼピン、
および８－フルオロ－２－メチル－４－（４－メチルピペラジン－１－イル）チエノ〔２，３－ｂ〕〔１，５〕ベンズオキサゼピン
から選ばれる請求項１０記載の縮合チオフェン化合物、その医薬上許容される塩またはそれらの水和物。

【請求項１４】　一般式（IIＢ）



(IIB)

（式中、Ｒａ’、Ｒｂ’は同一または異なって水素、アルキル、シクロアルキル、アシル、アルケニル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アミノアルキル、モノアルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、アルコキシアルキル、アシロキシアルキル、アシルアミノアルキル、ハロゲン、ハロゲン化アルキルまたはニトロを示す。
環Ａはベンゼン環上にアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アルコキシアルキル、ハロゲン、ハロゲン化アルキル、ニトロ、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アシルアミノ、ヒドロキシルおよびシアノから選ばれる同一または異なる置換基１～４個を有するか、もしくは置換基を有しないベンゼン環を示す。）
により表されるチエノベンズオキサゼピノン化合物。

【請求項１５】　Ｒａ’、Ｒｂ’が同一または異なって水素またはアルキルを示し、環Ａはベンゼン環上にアルキル、アルコキシ、ハロゲン、ヒドロキシルおよびハロゲン化アルキルから選ばれる同一または異なる置換基１～４個を有するか、もしくは置換基を有しないベンゼン環である請求項１４記載のチエノベンズオキサゼピノン化合物。

【請求項１６】　請求項１～６、１０～１３のいずれか記載の縮合チオフェン化合物、その医薬上許容される塩またはそれらの水和物からなる医薬。

【請求項１７】　抗精神病薬である請求項１７記載の医薬。

【請求項１８】　請求項１～６、１０～１３のいずれか記載の縮合チオフェン化合物、その医薬上許容される塩またはそれらの水和物縮合チオフェン化合物、その医薬上許容

される塩またはそれらの水和物と医薬上許容される添加剤とからなる医薬組成物。