(19)日本国特許庁(JP)

# (12)特許公報(B2)

(11)特許番号
特許第7416558号
(P7416558)

(45)発行日　令和6年1月17日(2024.1.17)

(24)登録日　令和6年1月9日(2024.1.9)

| (51)国際特許分類 | | FI | | |
|---|---|---|---|---|
| *C07D 237/32 (2006.01)* | | C07D | 237/32 | CSP |
| *A61K 31/502 (2006.01)* | | A61K | 31/502 | |
| *A61K 31/5025(2006.01)* | | A61K | 31/5025 | |
| *A61K 31/5377(2006.01)* | | A61K | 31/5377 | |
| *A61K 31/55 (2006.01)* | | A61K | 31/55 | |

請求項の数　3　（全91頁）　最終頁に続く

(21)出願番号　特願2021-564330(P2021-564330)
(86)(22)出願日　令和2年5月29日(2020.5.29)
(65)公表番号　特表2022-530528(P2022-530528A)
(43)公表日　令和4年6月29日(2022.6.29)
(86)国際出願番号　PCT/KR2020/006995
(87)国際公開番号　WO2020/242245
(87)国際公開日　令和2年12月3日(2020.12.3)
審査請求日　令和3年10月28日(2021.10.28)
(31)優先権主張番号　10-2019-0063436
(32)優先日　令和1年5月29日(2019.5.29)
(33)優先権主張国・地域又は機関
韓国(KR)
前置審査

(73)特許権者　516017994
エスティー ファーム カンパニー リミテッド
大韓民国 １５０８６ キョンギ－ド，シフン－シ，ヒョムニョク－ロ ２３１ ２３１，Ｈｙｅｏｍｎｙｅｏｋ－ｒｏ，Ｓｉｈｅｕｎｇ－ｓｉ，Ｇｙｅｏｎｇｇｉ－ｄｏ，１５０８６ Ｒｅｐｕｂｌｉｃ ｏｆ Ｋｏｒｅａ
(73)特許権者　591066339
コリア・リサーチ・インスティテュート・オブ・ケミカル・テクノロジー
ＫＯＲＥＡ ＲＥＳＥＡＲＣＨ ＩＮＳＴＩＴＵＴＥ ＯＦ ＣＨＥＭＩＣＡＬ ＴＥＣＨＮＯＬＯＧＹ

最終頁に続く

(54)【発明の名称】　フタラジノン化合物およびこれらの用途

(57)【特許請求の範囲】

【請求項１】

下記の群から選ばれる化合物、またはそのラセミ体、立体異性体または薬学的に許容可能な塩；

１）Ｎ－（３－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；

２）４－（３－アミノフェニル）－２－（４－（トリフルオロメチル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；

３）Ｎ－（３－（４－オキソ－３－（４－（トリフルオロメチル）フェニル）－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；

４）４－（３－（エチルアミノ）フェニル）－２－（４－（トリフルオロメチル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；

５）Ｎ－メチル－Ｎ－（３－（４－オキソ－３－（４－（トリフルオロメチル）フェニル）－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；

６）Ｎ－（３－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンスルホンアミド；

７）Ｎ－メチル－Ｎ－（３－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンスルホンアミド；

８）Ｎ－（４－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；

９）Ｎ－（３－（３－フェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－ジメチルスルファモイルアミド；
１０）Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンスルホンアミド；
１１）Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
１２）Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－ジメチルスルファモイルアミド；
１３）（Ｚ）－Ｎ－メチル－１－（３－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
１４）（Ｚ）－Ｎ－イソプロピル－１－（３－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
１５）（Ｚ）－１－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド；
１６）（Ｚ）－Ｎ－エチル－１－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
１７）（Ｚ）－１－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド；
１８）Ｎ－（２－クロロ－５－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－（メチルスルホニル）メタンスルホンアミド；
１９）Ｎ－（３－（３－（フェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－６－クロロフェニル）－ジメチルスルファモイルアミド；
２０）メチル（Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）スルファモイル）カルバマート；
２１）（Ｚ）－１－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド；
２２）（Ｚ）－１－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド；
２３）（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
２４）４－（３－アミノフェニル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
２５）Ｎ－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
２６）メチル（Ｎ－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）スルファモイル）カルバマート；
２７）（Ｚ）－１－（３－（３－（３－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド；
２８）Ｚ）－１－（３－（３－（３－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド；
２９）（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（３－（３－（３－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
３０）Ｎ－（３－（３－（３－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
３１）（Ｚ）－１－（３－（３－（３，５－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド；
３２）（Ｚ）－Ｎ－イソプロピル－１－（３－（３－（４－メトキシフェニル）－４－

オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
３３）（Ｚ）－１－（３－（３－（３－クロロ－４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド；
３４）（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（３－（３－（３－クロロ－４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
３５）（Ｚ）－Ｎ－ベンジルｌ－１－（３－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
３６）（Ｅ）－１－（４－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド；
３７）（Ｚ）－１－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド；
３８）（Ｅ）－１－（３－フルオロ－４－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド；
３９）（Ｅ）－１－（３－フルオロ－４－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド；
４０）（Ｚ）－１－（２－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド；
４１）（Ｚ）－１－（２－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド；
４２）（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（２－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
４３）（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
４４）（Ｚ）－Ｎ－ベンジル－１－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
４５）（Ｚ）－１－（５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）チオフェン－２－イル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド；
４６）（Ｚ）－１－（５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）チオフェン－２－イル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド；
４７）（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）チオフェン－２－イル）メタンイミンオキシド；
４８）（Ｚ）－１－（５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フラン－２－イル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド；
４９）（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－２－メトキシフェニル）メタンイミンオキシド；
５０）（Ｚ）－Ｎ－ベンジル－１－（５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－２－メトキシフェニル）メタンイミンオキシド；
５１）（Ｚ）－１－（２－フルオロ－５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド；

５２）（Ｚ）－１－（２－フルオロ－５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド；
５３）（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（２－フルオロ－５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
５４）（Ｚ）－Ｎ－ベンジル－１－（２－フルオロ－５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
５５）（Ｚ）－１－（４－フルオロ－３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド；
５６）（Ｚ）－１－（４－フルオロ－３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド；
５７）（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（４－フルオロ－３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
５８）（Ｚ）－Ｎ－ベンジル－１－（４－フルオロ－３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
５９）４－（４－クロロ－３－ニトロフェニル）－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
６０）４－（３－アミノフェニル）－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
６１）Ｎ－（３－（３－ベンジル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
６２）Ｎ－（３－（４－オキソ－３－フェネチル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
６３）Ｎ－（３－（３－（４－フルオロベンジル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
６４）Ｎ－（３－（３－（［１，１’－ビフェニル］－４－イル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
６５）Ｎ－（３－（３－（［１，１’－ビフェニル］－４－イル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルエタンスルホンアミド；
６６）メチル３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ベンゾアート；
６７）Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）プロパン－２－スルホンアミド；
６８）Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）プロパン－１－スルホンアミド；
６９）Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンスルホンアミド；
７０）Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルエタンスルホンアミド；
７１）Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）シクロプロパンスルホンアミド；
７２）Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルプロパン－１－スルホンアミド；
７３）Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフ

タラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルプロパン－２－スルホンアミド；
７４）Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルシクロプロパンスルホンアミド；
７５）Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチル－ジメチルスルファモイルアミド；
７６）メチル（Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルスルファモイル）（メチル）カルバマート；
７７）１，１，１－トリフルオロ－Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンスルホンアミド；
７８）１，１，１－トリフルオロ－Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンスルホンアミド；
７９）３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－（（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル）オキシ）ベンズアミド；
８０）Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチル－メチルスルファモイルアミド；
８１）４－（３－（１Ｈ－テトラゾール－５－イル）フェニル）－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
８２）Ｎ－（５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピリジン－３－イル）エタンスルホンアミド；
８３）３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－ヒドロキシベンズアミド；
８４）（Ｚ）－１－（３－（３－（［１，１’－ビフェニル］－４－イル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド；
８５）（Ｚ）－１－（３－（３－（［１，１’－ビフェニル］－４－イル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド；
８６）３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド；
８７）Ｎ－エチル－３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ベンゼンスルホンアミド；
８８）３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルベンゼンスルホンアミド；
８９）２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
９０）２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（エチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
９１）３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド；
９２）３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－エチルベンゼンスルホンアミド；
９３）３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルベンゼンスルホンアミド；
９４）（Ｚ）－１－（３－（３－（２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド；
９５）（Ｚ）－１－（３－（３－（２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド；

９６）（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（３－（３－（２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
９７）２－（２－フルオロフェニル）－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
９８）４－（３－（エチルスルホニル）フェニル）－２－（２－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
９９）３－（３－（２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド；
１００）Ｎ－エチル－３－（３－（２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ベンゼンスルホンアミド；
１０１）３－（３－（２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルベンゼンスルホンアミド；
１０２）（Ｚ）－１－（３－（３－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド；
１０３）（Ｚ）－１－（３－（３－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド；
１０４）（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（３－（３－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
１０５）２－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
１０６）２－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－（３－（エチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
１０７）３－（３－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド；
１０８）３－（３－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－エチルベンゼンスルホンアミド；
１０９）３－（３－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルベンゼンスルホンアミド；
１１０）６－フルオロ－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）－２－フェニルフタラジン－１（２Ｈ）－オン；
１１１）３－（７－フルオロ－４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド；
１１２）７－フルオロ－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）－２－フェニルフタラジン－１（２Ｈ）－オン；
１１３）３－（６－フルオロ－４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド；
１１４）３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピリジン１－オキシド；
１１５）２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（ピリジン－３－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
１１６）２－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－（ピリジン－３－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
１１７）３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピリジン１－オキシド；
１１８）３－（３－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピリジン１－オキシド；
１１９）２－（２，４－ジフルオロフェニル）－６－フルオロ－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；

１２０）２－（２，４－ジフルオロフェニル）－７－フルオロ－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
１２１）３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－７－フルオロ－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド；
１２２）３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－６－フルオロ－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド；
１２３）２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（エチルスルホニル）フェニル）－６－フルオロフタラジン－１（２Ｈ）－オン；
１２４）３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－７－フルオロ－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－エチルベンゼンスルホンアミド；
１２５）３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－７－フルオロ－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルベンゼンスルホンアミド；
１２６）３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ベンゼンスルホンアミド；
１２７）３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）ベンゼンスルホンアミド；
１２８）Ｎ－（３－（３－シクロヘキシル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
１２９）Ｎ－（３－（３－（１－メチルピペリジン－４－イル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
１３０）３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ベンゾニトリル；
１３１）（Ｅ）－３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ’－ヒドロキシベンズイミドアミド；
１３２）Ｎ－（３－（３－イソプロピル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
１３３）Ｎ－（３－（３－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
１３４）４－（３－アミノピペリジン－１－イル）－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１３５）Ｎ－（１－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）エタンスルホンアミド；
１３６）Ｎ－（３－（３－（オキセタン－３－イル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
１３７）Ｎ－（１－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピロリジン－３－イル）エタンスルホンアミド；
１３８）（Ｓ）－Ｎ－（１－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）エタンスルホンアミド；
１３９）（Ｒ）－Ｎ－（１－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）エタンスルホンアミド；
１４０）Ｎ－（３－（３－（４，４－ジフルオロシクロヘキシル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
１４１）Ｎ－（１－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）アゼパン－３－イル）エタンスルホンアミド；
１４２）３－（３－シクロヘキシル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ベンゼンスルホンアミド；
１４３）４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－シクロヘキシルフタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１４４）Ｎ－（１－（３－シクロヘキシル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）アゼパン－３－イル）エタンスルホンアミド；

１４５）Ｎ－（３－（３－（４－メチルシクロヘキシル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
１４６）（Ｓ）－４－（３－アミノピペリジン－１－イル）－２－シクロヘキシルフタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１４７）（Ｓ）－Ｎ－（１－（３－シクロヘキシル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）エタンスルホンアミド；
１４８）４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１４９）Ｎ－（３－（２－（４－フルオロフェニル）－１－オキソ－１，２－ジヒドロピリド［３，４－ｄ］ピリジン－４－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
１５０）Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－８－メチル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
１５１）Ｎ－（３－（４－オキソ－３－（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－４－イル）－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
１５２）２－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロピオン酸；
１５３）２－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ，２－ジメチルプロパンアミド；
１５４）２－シクロヘキシル－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
１５５）（Ｓ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－シクロヘキシルフタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１５６）（Ｓ）－２－シクロヘキシル－４－（３－（メチルアミノ）アゼパン－１－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１５７）（Ｓ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１５８）（Ｓ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１５９）（Ｒ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－シクロヘキシルフタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１６０）２－（３－（３－シクロヘキシル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロピオン酸；
１６１）３－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）オキサゾリジン－２－オン；
１６２）（Ｒ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１６３）２－（３－（３－シクロヘキシル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロパンアミド；
１６４）２－（３－（３－シクロヘキシル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ，２－ジメチルプロパンアミド；
１６５）（Ｒ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１６６）２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロピオン酸；
１６７）４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１６８）２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロパンニトリル；
１６９）４－（３－（２－（１Ｈ－テトラゾール－５－イル）プロパン－２－イル）フェニル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；

１７０）（Ｅ）－２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ’－ヒドロキシ－２－メチルプロパンイミドアミド；
１７１）２－（３－（３－（２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロピオン酸；
１７２）４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－シクロブチルフタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１７３）４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－シクロペンチルフタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１７４）２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（２－（５－メチル－１，２，４－オキサジアゾール－３－イル）プロパン－２－イル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
１７５）（Ｒ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（２－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１７６）２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピル－２－メチルプロパンアミド；
１７７）２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（２－メチル－１－オキソ－１－（ピロリジン－１－イル）プロパン－２－イル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
１７８）Ｎ－シクロプロピル－２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロパンアミド；
１７９）２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（２－メチル－１－モルホリノ－１－オキソプロパン－２－イル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
１８０）Ｎ－シクロヘキシル－２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロパンアミド；
１８１）Ｎ－シクロヘキシル－２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロパンアミド；
１８２）２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチル－Ｎ－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）プロパンアミド；
１８３）１－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）シクロプロパン－１－カルボン酸；
１８４）４－（１，４－ジアゼパン－１－イル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１８５）（Ｒ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（４－クロロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１８６）２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－２－メチルプロパンアミド；
１８７）（Ｒ）－Ｎ－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）アゼパン－３－イル）エタンスルホンアミド；
１８８）２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロパンアミド；
１８９）（Ｒ）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（メチルアミノ）アゼパン－１－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１９０）（Ｒ）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（メチルアミノ）

アゼパン－１－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１９１）（Ｒ）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（（２－ヒドロキシエチル）アミノ）アゼパン－１－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１９２）（Ｒ）－Ｎ－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）アゼパン－３－イル）アセトアミド；
１９３）２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－オキソアゼパン－１－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
１９４）２－（３－（３－（４－クロロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロピオン酸；
１９５）１－（３－（３－（４－クロロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）シクロプロパン－１－カルボン酸；
１９６）２－（４－クロロフェニル）－４－（３－ヒドロキシアゼパン－１－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
１９７）２－（３－（３－（４－クロロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロパンアミド；
１９８）１－（３－（３－（４－クロロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）シクロプロパン－１－カルボキシアミド；
１９９）２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）酢酸；
２００）４－（３－（２－アミノプロパン－２－イル）フェニル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
２０１）２－（３－（３－（４－クロロ－２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロピオン酸；
２０２）（Ｒ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（４－クロロ－２－フルオロフェニル）フタラジン－１－（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
２０３）１－（３－（４－クロロ－２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）アゼパン－３－カルボニトリル；
２０４）４－（３－（１－アミノ－２－メチルプロパン－２－イル）フェニル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
２０５）２－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）－２－メチルプロピオン酸；
２０６）２－（３－（３－（４－シクロプロピルフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロピオン酸；
２０７）１－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）シクロブタン－１－カルボン酸；
２０８）１－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）シクロブタン－１－カルボン酸；
２０９）２－（１－（３－（４－クロロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）－２－メチルプロピオン酸；
２１０－１および２１０－２）２－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）－２－メチルプロピオン酸；
２１１）メチル１－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）シクロプロパン－１－カルボキシレート；
２１２）１－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）シクロプロパン－１－カルボン酸；
２１３－１および２１３－２）１－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）シクロプロパン－１－カルボン酸；

２１４）２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（ピロリジン－１－イルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
２１５）２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
２１６）３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－エチル－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド；
２１７）３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ，Ｎ－ジエチルベンゼンスルホンアミド；
２１８）２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（１－（エチルスルホニル）－１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
２１９）２－（４－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペラジン－２－イル）－２－メチルプロピオン酸；
２２０）２－（４－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－１－メチルピペラジン－２－イル）－２－メチルプロピオン酸、および
２２１）２－（４－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）モルホリン－２－イル）－２－メチルプロピオン酸。

【請求項２】
請求項１に記載の化合物、またはそのラセミ体、立体異性体または薬学的に許容可能な塩を含むＳｉｒｔ６関連疾患の予防または治療用薬学的組成物。

【請求項３】
Ｓｉｒｔ６関連疾患は、がん、脂肪肝、肝硬変／炎症、インスリン分泌低下および老化関連疾患からなる群から選ばれるものである、請求項２に記載の薬学的組成物。

【発明の詳細な説明】
【技術分野】
【０００１】
本発明は、フタラジノン化合物、またはそのラセミ体、立体異性体または薬学的に許容可能な塩；およびこれを有効成分として含むＳｉｒｔｕｉｎ ６タンパク質（以下、「Ｓｉｒｔ６」という）関連疾患の予防または治療用薬学的組成物に関する。

【背景技術】
【０００２】
Ｓｉｒｔｕｉｎタンパク質は、現在までＳｉｒｔ１からＳｉｒｔ７まで合計７種が明らかにされており、その大半が老化、代謝疾患、遺伝子の安定性などに関与することが報告された。Ｓｉｒｔ６ ｗｈｏｌｅ ｂｏｄｙ Ｋｎｏｃｋ－ｏｕｔマウスは、胎児発生段階では正常であったが、出生後に野生型に比べてサイズが小さく、リンパ球減少症（Ｌｙｍｐｈｏｐｅｎｉａ）、骨減少症（Ｏｓｔｅｏｐｅｎｉａ）、異常代謝、ゲノム不安定性、過剰な炎症、心筋肥大症が発現し、細胞選択的Ｓｉｒｔ６ ｋｎｏｃｋ－ｏｕｔマウスでは、成長遅延、脂肪肝、がん発生、肝硬変／炎症、インスリン分泌低下のような表現型が観察された（Ｐｒｏｃ．Ｎａｔｌ．Ａｃａｄ．Ｓｃｉ．Ｕ Ｓ Ａ．２０１０，１０７，２１７９０－２１７９４；Ｃｅｌｌ Ｍｅｔａｂ．２０１０，１２，２２４－２３６；Ｃｅｌｌ ２０１２，１５１，１１８５－１１９９；Ｊ．Ｂｉｏｌ．Ｃｈｅｍ．２０１２，２８７，４１９０３－４１９１３）。このような多様な動物モデル研究結果を基にＳｉｒｔ６は、ＤＮＡ ｄａｍａｇｅ ｒｅｐａｉｒ、代謝恒常性調節（ブドウ糖代謝および脂肪代謝）、炎症反応調節および寿命関連機序調節の機能を有することが報告された（Ｎａｔｕｒｅ ２００９，４６０，５８７－５９１）。Ｓｉｒｔ６は、細胞質のストレス顆粒および小胞体に一部存在するが、その大半が核内、特にクロマチンに密集しており、ＮＡＤ$^{+}$補助因子により活性化される（Ｓｃｉ．Ｒｅｐ．２０１３，３，３０８５）。

【０００３】
Ｓｉｒｔ６ ｄｅａｃｅｔｙｌａｓｅ酵素活性の主な標的タンパク質としては、Ｈ２Ｋ９、Ｈ３Ｋ５６、Ｈ３Ｋ１８およびｅｔｙｌｔｒａｎｓｆｅｒａｓｅ ＧＣＮ５が知られ

ている（Ｃｕｒｒ．Ｔｏｐ．Ｍｅｄ．Ｃｈｅｍ．２０１３，１３，２９９１－３０００；Ｎａｔｕｒｅ ２００８，４５２，４９２－４９６；Ｃｅｌｌ Ｃｙｃｌｅ ２００９，８，２６６４－２６６６；Ｎａｔ．Ｓｔｒｕｃｔ．Ｍｏｌ．Ｂｉｏｌ．２０１６，２３，４３４－４４０）。Ｓｉｒｔ６タンパク質と関連したＨ３Ｋ９およびＨ３Ｋ５６は、アセチル化／脱アセチル化により特定遺伝子の転写発現およびテロメアのような特定ヘテロクロマチンの安定性を調節することが報告され（Ｃｅｌｌ ２００９，１３６，６２－７４；Ｃｅｌｌ、２０１０，１４０，２８０－２９３）、これを通じて、ゲノムの安定性維持、ブドウ糖代謝および脂肪代謝関連遺伝子の発現を調節し、テロメアの安定性に寄与することが明らかにされた。このようなクロマチン調節機能を通じて、Ｓｉｒｔ６の欠乏は、がん、脂肪肝、心筋肥大症、早期老化などを誘導することが報告された（Ｃｕｒｒ．Ｔｏｐ．Ｍｅｄ．Ｃｈｅｍ．２０１３，１３，２９９１－３０００）。

【０００４】

したがって、Ｓｉｒｔ６活性を有する化合物または薬剤学的に許容可能なその塩は、Ｓｉｒｔ６活性関連疾患の治療または予防に使用できることが期待される。

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【０００５】

本発明の目的は、ｓｉｒｔ６活性を示すフタラジノン化合物、またはそのラセミ体、立体異性体または薬学的に許容可能な塩を提供することにある。

【０００６】

本発明の他の目的は、フタラジノン化合物、またはそのラセミ体、立体異性体または薬学的に許容可能な塩の製造方法を提供することにある。

【０００７】

本発明のさらに他の目的は、ｓｉｒｔ６活性を示すフタラジノン化合物、またはそのラセミ体、立体異性体または薬学的に許容可能な塩を含むＳｉｒｔ６関連疾患の予防または治療用薬学的組成物を提供することにある。

【０００８】

本発明のさらに他の目的は、本発明によるフタラジノン化合物、またはそのラセミ体、立体異性体または薬学的に許容可能な塩をこれを必要とする対象に投与することを含むＳｉｒｔ６関連疾患の予防または治療する方法に関する。

【０００９】

本発明のさらに他の目的は、本発明によるフタラジノン化合物、またはそのラセミ体、立体異性体または薬学的に許容可能な塩；および担体、賦形剤および希釈剤からなる群から選ばれる１種以上を含む薬学的組成物を提供することにある。

【課題を解決するための手段】

【００１０】

本発明において上で述べた課題を解決するための手段は、次の通りである。

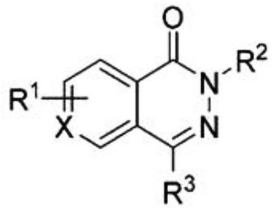
【００１１】

１．下記化学式１で表される化合物、またはそのラセミ体、立体異性体または薬学的に許容可能な塩：

【００１２】

化学式１

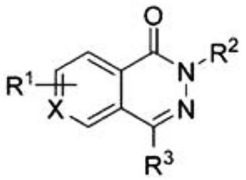
【化１】




【００１３】

式中、
Ｘは、ＣＨまたはＮであり、
$R^1$は、Ｈ、$C_{1-6}$アルキル、またはフルオロ、クロロおよびブロモからなる群から選ばれるハロであり、
$R^2$は、$C_{1-6}$アルキル、アリール置換$C_{1-6}$アルキル、アリール、ヘテロアリール、$C_{3-7}$シクロアルキルおよびヘテロシクリルからなる群から選ばれ、
$R^3$は、アリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクリルからなる群から選ばれ、
前記アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよびヘテロシクリルは、それぞれ１～３個の置換基で置換されてもよく、これらが置換される場合、その置換基は、それぞれ独立して、フルオロ、クロロおよびブロモからなる群から選ばれるハロ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、非置換または１～３個のハロゲン原子で置換された$C_{1-6}$アルキル、$C_{1-6}$アルキルオキシ、アリール、ヘテロアリール、$-NR^4R^5$、$-CH=N^+(O^-)R^6$、－Ｃ（Ｏ）$R^7$、$-SO_2R^8$、－Ｃ（＝ＮＯＨ）$NR^9R^{10}$および$-CR^9R^{10}R^{11}$からなる群から選ばれ、
$R^4$および$R^5$は、それぞれ独立して、Ｈ、$C_{1-6}$アルキル、１～３個のハロゲン原子またはヒドロキシで置換された$C_{1-6}$アルキル、$-SO_2R^{12}$または－Ｃ（Ｏ）$R^{15}$であり、
$R^6$は、$C_{1-6}$アルキルまたはアリール置換$C_{1-6}$アルキルであり、
$R^7$は、$C_{1-6}$アルキルオキシまたは$-NR^{16}R^{17}$であり、
$R^8$は、$C_{1-6}$アルキルまたは$-NR^{18}R^{19}$であり、
$R^9$および$R^{10}$は、それぞれ独立して、Ｈまたは$C_{1-6}$アルキルであるか、または$R^9$と$R^{10}$は、互いに結合してこれらが結合した炭素原子とともにシクロアルキルを形成し、
$R^{11}$は、シアノ、アミノ、非置換またはアミノ置換$C_{1-6}$アルキル、非置換または$C_{1-6}$アルキル置換ヘテロアリール、ヘテロシクリル、$-CO_2R^{20}$または－Ｃ（Ｏ）$NR^{20}R^{21}$であり、
$R^{12}$は、$C_{1-6}$アルキル、１～３個のハロゲン原子で置換された$C_{1-6}$アルキル、$C_{3-6}$シクロアルキルまたは$-NR^{13}R^{14}$であり、
$R^{13}$および$R^{14}$は、それぞれ独立して、Ｈ、$C_{1-6}$アルキルまたは$-CO_2R^{15}$であり、
$R^{15}$は、$-C_{1-6}$アルキルであり、
$R^{16}$および$R^{17}$は、それぞれ独立して、Ｈ、ヘテロシクリルオキシまたはヒドロキシであり、
$R^{18}$および$R^{19}$は、それぞれ独立して、Ｈ、非置換またはヒドロキシ置換$C_{1-6}$アルキルであるか、または$R^{18}$と$R^{19}$は、互いに結合してこれらが結合したＮ原子とともにヘテロシクリルを形成し、
$R^{20}$は、Ｈまたは$C_{1-6}$アルキルであり、$R^{21}$は、Ｈ、非置換またはヒドロキシ置換$C_{1-6}$アルキル、シクロアルキル、アリール、または非置換または$C_{1-6}$アルキル置換ヘテロアリールであるか、または$R^{20}$と$R^{21}$は、互いに結合してこれらが結合したＮ原子とともにヘテロシクリルを形成し、
前記アリールは、$C_{6-10}$芳香族環基であり、
前記シクロアルキルは、$C_{3-7}$脂肪族環基であり、
前記ヘテロアリールは、環内にＮ、ＯおよびＳの中から選ばれる１～４個のヘテロ原子を含む５員または６員のヘテロ芳香族環基であり、
前記ヘテロシクリルは、環内にＮおよびＯの中から選ばれる１～２個のヘテロ原子を含む４～７員のヘテロ環基である。
【００１４】
２．前記化学式１で表される化合物、またはそのラセミ体、立体異性体または薬学的に許容可能な塩を含むＳｉｒｔ６関連疾患の予防または治療用薬学的組成物。
【発明の効果】

【００１５】
本発明によってＳｉｒｔ６活性に優れた新規フタラジノン化合物、またはそのラセミ体、立体異性体または薬学的に許容可能な塩が提供される。本発明の化合物、またはそのラセミ体、立体異性体または薬学的に許容可能な塩は、Ｓｉｒｔ６活性に優れていることが確認されたので、Ｓｉｒｔ６関連疾患の予防または治療に有用に使用されることが期待される。
【発明を実施するための形態】
【００１６】
本発明は、下記化学式１で表される化合物、またはそのラセミ体、立体異性体または薬学的に許容可能な塩に関する：
【００１７】
化学式１
【化２】



【００１８】
式中、
Ｘは、ＣＨまたはＮであり、
$R^1$は、Ｈ、$C_{1-6}$アルキル、またはフルオロ、クロロおよびブロモからなる群から選ばれるハロであり、
$R^2$は、$C_{1-6}$アルキル、アリール置換$C_{1-6}$アルキル、アリール、ヘテロアリール、$C_{3-7}$シクロアルキルおよびヘテロシクリルからなる群から選ばれ、
$R^3$は、アリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクリルからなる群から選ばれ、
前記アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよびヘテロシクリルは、それぞれ１～３個の置換基で置換されてもよく、これらが置換される場合、その置換基は、それぞれ独立して、フルオロ、クロロおよびブロモからなる群から選ばれるハロ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、非置換または１～３個のハロゲン原子で置換された$C_{1-6}$アルキル、$C_{1-6}$アルキルオキシ、アリール、ヘテロアリール、$-NR^4R^5$、$-CH=N^+(O^-)R^6$、$-C(O)R^7$、$-SO_2R^8$、$-C(=NOH)NR^9R^{10}$および$-CR^9R^{10}R^{11}$からなる群から選ばれ、
$R^4$および$R^5$は、それぞれ独立して、Ｈ、$C_{1-6}$アルキル、１～３個のハロゲン原子またはヒドロキシで置換された$C_{1-6}$アルキル、$-SO_2R^{12}$または$-C(O)R^{15}$であり、
$R^6$は、$C_{1-6}$アルキルまたはアリール置換$C_{1-6}$アルキルであり、
$R^7$は、$C_{1-6}$アルキルオキシまたは$-NR^{16}R^{17}$であり、
$R^8$は、$C_{1-6}$アルキルまたは$-NR^{18}R^{19}$であり、
$R^9$および$R^{10}$は、それぞれ独立して、Ｈまたは$C_{1-6}$アルキルであるか、または$R^9$と$R^{10}$は、互いに結合してこれらが結合した炭素原子とともにシクロアルキルを形成し、
$R^{11}$は、シアノ、アミノ、非置換またはアミノ置換$C_{1-6}$アルキル、非置換または$C_{1-6}$アルキル置換ヘテロアリール、ヘテロシクリル、$-CO_2R^{20}$または$-C(O)NR^{20}R^{21}$であり、
$R^{12}$は、$C_{1-6}$アルキル、１～３個のハロゲン原子で置換された$C_{1-6}$アルキル、$C_{3-6}$シクロアルキルまたは$-NR^{13}R^{14}$であり、
$R^{13}$および$R^{14}$は、それぞれ独立して、Ｈ、$C_{1-6}$アルキルまたは$-CO_2R^{15}$であり、

$R^{15}$は、－$C_{1-6}$アルキルであり、
$R^{16}$および$R^{17}$は、それぞれ独立して、H、ヘテロシクリルオキシまたはヒドロキシであり、
$R^{18}$および$R^{19}$は、それぞれ独立して、H、非置換またはヒドロキシ置換$C_{1-6}$アルキルであるか、または$R^{18}$と$R^{19}$は、互いに結合してこれらが結合したN原子とともにヘテロシクリルを形成し、
$R^{20}$は、Hまたは$C_{1-6}$アルキルであり、$R^{21}$は、H、非置換またはヒドロキシ置換$C_{1-6}$アルキル、シクロアルキル、アリール、または非置換または$C_{1-6}$アルキル置換ヘテロアリールであるか、または$R^{20}$と$R^{21}$は、互いに結合してこれらが結合したN原子とともにヘテロシクリルを形成し、
前記アリールは、$C_{6-10}$芳香族環基であり、
前記シクロアルキルは、$C_{3-7}$脂肪族環基であり、
前記ヘテロアリールは、環内にN、OおよびSの中から選ばれる１～４個のヘテロ原子を含む５員または６員のヘテロ芳香族環基であり、
本発明において、前記ヘテロシクリルは、環内にNおよびOの中から選ばれる１～２個のヘテロ原子を含む４～７員のヘテロ環基であって、これらは、場合によって環内に１～２個の二重結合を含むこともできる。

【００１９】

本発明の具体的な一実施様態において、前記$R^{2}$は、$C_{1-6}$アルキル；$C_{6-10}$アリールで置換された$C_{1-6}$アルキル；非置換$C_{6-10}$アリール；$C_{1-6}$アルキル、フルオロ置換$C_{1-6}$アルキル、$C_{1-6}$アルキルオキシ、フルオロ、クロロおよびブロモからなる群から選ばれる１～２個の置換基で置換された$C_{6-10}$アリール；非置換$C_{3-7}$シクロアルキル；フルオロ、クロロ、ブロモおよび$C_{1-6}$アルキルからなる群から選ばれる１～２個の置換基で置換された$C_{3-7}$シクロアルキル；非置換ヘテロアリール；または$C_{1-6}$アルキルで置換されたヘテロアリールである。

【００２０】

本発明の他の具体的な一実施様態において、前記$R^{3}$は、フルオロ、クロロおよびブロモからなる群から選ばれるハロ、ニトロ、シアノ、非置換または１～３個のハロゲン原子で置換された$C_{1-6}$アルキル、$C_{1-6}$アルキルオキシ、アリールおよびヘテロアリールからなる群から選ばれる基で置換されたアリールである。

【００２１】

本発明の他の具体的な一実施様態において、前記$R^{3}$は、－$NR^{4}R^{5}$、－$CH=N^{+}(O^{-})R^{6}$、－C（O）$R^{7}$、－$SO_{2}R^{8}$、－C（＝NOH）$NR^{9}R^{10}$および－$CR^{9}R^{10}R^{11}$からなる群から選ばれる置換基でさらに置換されたアリールであってもよい。

【００２２】

本発明の他の具体的な一実施様態において、前記$R^{3}$が置換基－$NR^{4}R^{5}$でさらに置換されたアリールである場合、$R^{4}$は、H、$C_{1-6}$アルキルまたは$C_{1-6}$アルキルスルホニルであり、$R^{5}$は、H、非置換またはヒドロキシ置換$C_{1-6}$アルキル、－C（O）$R^{15}$または－$SO_{2}R^{12}$であり、$R^{12}$は、$C_{1-6}$アルキル、フルオロ置換$C_{1-6}$アルキル、$C_{3-6}$シクロアルキルまたは－$NR^{13}R^{14}$であり、$R^{13}$および$R^{14}$は、それぞれ独立して、H、$C_{1-6}$アルキルまたは－$CO_{2}R^{15}$であり、$R^{15}$は、－$C_{1-6}$アルキルである。

【００２３】

本発明の他の具体的な一実施様態において、前記$R^{3}$が置換基－$CH=N^{+}(O^{-})R^{6}$でさらに置換されたアリールである場合、$R^{6}$は、$C_{1-6}$アルキルまたはアリール置換$C_{1-6}$アルキルである。

【００２４】

本発明の他の具体的な一実施様態において、前記$R^{3}$が置換基－C（O）$R^{7}$でさらに置換されたアリールである場合、$R^{7}$は、－$NR^{16}R^{17}$であり、$R^{16}$は、Hであり、$R^{17}$は、H、ヘテロシクリルオキシまたはヒドロキシである。

【００２５】
本発明の他の具体的な一実施様態において、前記$R^3$が置換基－$SO_2R^8$でさらに置換されたアリールである場合、$R^8$は、－$NR^{18}R^{19}$であり、$R^{18}$は、Hまたは$C_{1-6}$アルキルであり、$R^{19}$は、H、$C_{1-6}$アルキルまたはヒドロキシ置換$C_{1-6}$アルキルであるか、または$R^{18}$と$R^{19}$は、互いに結合してこれらが結合したN原子とともにヘテロシクリルを形成できる。
【００２６】
本発明の他の具体的な一実施様態において、前記$R^3$が置換基－C（＝NOH）$NR^9R^{10}$でさらに置換されたアリールである場合、$R^9$および$R^{10}$は、それぞれHである。
【００２７】
本発明の他の具体的な一実施様態において、前記$R^3$が置換基－$CR^9R^{10}R^{11}$でさらに置換されたアリールである場合、$R^9$および$R^{10}$は、それぞれHまたは$C_{1-6}$アルキルであるか、または$R^9$と$R^{10}$は、互いに結合してこれらが結合した炭素原子とともにシクロアルキルを形成でき、$R^{11}$は、シアノ、アミノ、非置換または$C_{1-6}$アルキル置換ヘテロアリール、ヘテロシクリル、－$CO_2R^{20}$または－C（O）$NR^{20}R^{21}$であり、ここで、$R^{20}$は、Hまたは$C_{1-6}$アルキルであり、$R^{21}$は、H、非置換またはヒドロキシ置換$C_{1-6}$アルキル、シクロアルキル、アリール、または非置換または$C_{1-6}$アルキル置換ヘテロアリールであるか、または$R^{20}$と$R^{21}$は、互いに結合してこれらが結合したN原子とともにヘテロシクリルを形成できる。
【００２８】
本発明の他の具体的な一実施様態において、前記アリールは、フェニルまたはナフチルである。
【００２９】
本発明の他の具体的な一実施様態において、前記ヘテロアリールは、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、テトラゾリル、オキサゾリル、チエニル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、チアジアゾリル、オキサジアゾリル、フラニル、チオフェニル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジル、トリアジニル、ピラジニルおよびピリジン－N－オキシドからなる群から選ばれる。
【００３０】
本発明の他の具体的な一実施様態において、前記ヘテロシクリルは、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロフラニル、ジヒドロフラニル、ジヒドロピラニル、テトラヒドロピリジニル、ジオキサニル、ジチアニル、ジオキソラニル、イミダゾリジニル、イミダゾリニル、ピロリニル、ピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、ピペリジニル、オキセタニル、ピロリジニルおよびアゼパニルからなる群から選ばれる。
【００３１】
本発明において、前記化学式１の化合物の具体例は、下記化合物を含む：
１）N－（３－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
２）４－（３－アミノフェニル）－２－（４－（トリフルオロメチル）フェニル）フタラジン－１（２H）－オン；
３）N－（３－（４－オキソ－３－（４－（トリフルオロメチル）フェニル）－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
４）４－（３－（エチルアミノ）フェニル）－２－（４－（トリフルオロメチル）フェニル）フタラジン－１（２H）－オン；
５）N－メチル－N－（３－（４－オキソ－３－（４－（トリフルオロメチル）フェニル）－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
６）N－（３－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンスルホンアミド；
７）N－メチル－N－（３－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンスルホンアミド；

８）Ｎ－（４－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
９）Ｎ－（３－（３－フェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－ジメチルスルファモイルアミド；
１０）Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンスルホンアミド；
１１）Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
１２）Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－ジメチルスルファモイルアミド；
１３）（Ｚ）－Ｎ－メチル－１－（３－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
１４）（Ｚ）－Ｎ－イソプロピル－１－（３－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
１５）（Ｚ）－１－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド；
１６）（Ｚ）－Ｎ－エチル－１－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
１７）（Ｚ）－１－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド；
１８）Ｎ－（２－クロロ－５－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－（メチルスルホニル）メタンスルホンアミド；
１９）Ｎ－（３－（３－（フェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－６－クロロフェニル）－ジメチルスルファモイルアミド；
２０）メチル（Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）スルファモイル）カルバマート；
２１）（Ｚ）－１－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド；
２２）（Ｚ）－１－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド；
２３）（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
２４）４－（３－アミノフェニル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
２５）Ｎ－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
２６）メチル（Ｎ－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）スルファモイル）カルバマート；
２７）（Ｚ）－１－（３－（３－（３－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド；
２８）Ｚ）－１－（３－（３－（３－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド；
２９）（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（３－（３－（３－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
３０）Ｎ－（３－（３－（３－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
３１）（Ｚ）－１－（３－（３－（３，５－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシ

ド；
３２）（Ｚ）－Ｎ－イソプロピル－１－（３－（３－（４－メトキシフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
３３）（Ｚ）－１－（３－（３－（３－クロロ－４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド；
３４）（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（３－（３－（３－クロロ－４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
３５）（Ｚ）－Ｎ－ベンジルｌ－１－（３－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
３６）（Ｅ）－１－（４－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド；
３７）（Ｚ）－１－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド；
３８）（Ｅ）－１－（３－フルオロ－４－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド；
３９）（Ｅ）－１－（３－フルオロ－４－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド；
４０）（Ｚ）－１－（２－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド；
４１）（Ｚ）－１－（２－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド；
４２）（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（２－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
４３）（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
４４）（Ｚ）－Ｎ－ベンジル－１－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
４５）（Ｚ）－１－（５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）チオフェン－２－イル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド；
４６）（Ｚ）－１－（５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）チオフェン－２－イル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド；
４７）（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）チオフェン－２－イル）メタンイミンオキシド；
４８）（Ｚ）－１－（５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フラン－２－イル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド；
４９）（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－２－メトキシフェニル）メタンイミンオキシド；
５０）（Ｚ）－Ｎ－ベンジル－１－（５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－２－メトキシフェニル）メタンイミンオキシド；
５１）（Ｚ）－１－（２－フルオロ－５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキ

ソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド；
５２）（Ｚ）－１－（２－フルオロ－５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド；
５３）（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（２－フルオロ－５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
５４）（Ｚ）－Ｎ－ベンジル－１－（２－フルオロ－５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
５５）（Ｚ）－１－（４－フルオロ－３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド；
５６）（Ｚ）－１－（４－フルオロ－３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド；
５７）（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（４－フルオロ－３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
５８）（Ｚ）－Ｎ－ベンジル－１－（４－フルオロ－３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
５９）４－（４－クロロ－３－ニトロフェニル）－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
６０）４－（３－アミノフェニル）－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
６１）Ｎ－（３－（３－ベンジル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
６２）Ｎ－（３－（４－オキソ－３－フェネチル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
６３）Ｎ－（３－（３－（４－フルオロベンジル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
６４）Ｎ－（３－（３－（［１，１’－ビフェニル］－４－イル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
６５）Ｎ－（３－（３－（［１，１’－ビフェニル］－４－イル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルエタンスルホンアミド；
６６）メチル３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ベンゾアート；
６７）Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）プロパン－２－スルホンアミド；
６８）Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）プロパン－１－スルホンアミド；
６９）Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンスルホンアミド；
７０）Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルエタンスルホンアミド；
７１）Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）シクロプロパンスルホンアミド；
７２）Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフ

タラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルプロパン－１－スルホンアミド；
７３）Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルプロパン－２－スルホンアミド；
７４）Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルシクロプロパンスルホンアミド；
７５）Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチル－ジメチルスルファモイルアミド；
７６）メチル（Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルスルファモイル）（メチル）カルバマート；
７７）１，１，１－トリフルオロ－Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンスルホンアミド；
７８）１，１，１－トリフルオロ－Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンスルホンアミド；
７９）３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－（（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル）オキシ）ベンズアミド；
８０）Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチル－メチルスルファモイルアミド；
８１）４－（３－（１Ｈ－テトラゾール－５－イル）フェニル）－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
８２）Ｎ－（５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピリジン－３－イル）エタンスルホンアミド；
８３）３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－ヒドロキシベンズアミド；
８４）（Ｚ）－１－（３－（３－（［１，１’－ビフェニル］－４－イル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド；
８５）（Ｚ）－１－（３－（３－（［１，１’－ビフェニル］－４－イル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド；
８６）３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド；
８７）Ｎ－エチル－３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ベンゼンスルホンアミド；
８８）３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルベンゼンスルホンアミド；
８９）２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
９０）２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（エチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
９１）３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド；
９２）３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－エチルベンゼンスルホンアミド；
９３）３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルベンゼンスルホンアミド；
９４）（Ｚ）－１－（３－（３－（２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド；

９５）（Ｚ）－１－（３－（３－（２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド；
９６）（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（３－（３－（２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
９７）２－（２－フルオロフェニル）－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
９８）４－（３－（エチルスルホニル）フェニル）－２－（２－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
９９）３－（３－（２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド；
１００）Ｎ－エチル－３－（３－（２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ベンゼンスルホンアミド；
１０１）３－（３－（２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルベンゼンスルホンアミド；
１０２）（Ｚ）－１－（３－（３－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド；
１０３）（Ｚ）－１－（３－（３－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド；
１０４）（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（３－（３－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド；
１０５）２－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
１０６）２－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－（３－（エチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
１０７）３－（３－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド；
１０８）３－（３－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－エチルベンゼンスルホンアミド；
１０９）３－（３－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルベンゼンスルホンアミド；
１１０）６－フルオロ－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）－２－フェニルフタラジン－１（２Ｈ）－オン；
１１１）３－（７－フルオロ－４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド；
１１２）７－フルオロ－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）－２－フェニルフタラジン－１（２Ｈ）－オン；
１１３）３－（６－フルオロ－４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド；
１１４）３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピリジン１－オキシド；
１１５）２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（ピリジン－３－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
１１６）２－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－（ピリジン－３－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
１１７）３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピリジン１－オキシド；
１１８）３－（３－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピリジン１－オキシド；

１１９）２－（２，４－ジフルオロフェニル）－６－フルオロ－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
１２０）２－（２，４－ジフルオロフェニル）－７－フルオロ－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
１２１）３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－７－フルオロ－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド；
１２２）３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－６－フルオロ－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド；
１２３）２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（エチルスルホニル）フェニル）－６－フルオロフタラジン－１（２Ｈ）－オン；
１２４）３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－７－フルオロ－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－エチルベンゼンスルホンアミド；
１２５）３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－７－フルオロ－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルベンゼンスルホンアミド；
１２６）３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ベンゼンスルホンアミド；
１２７）３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）ベンゼンスルホンアミド；
１２８）Ｎ－（３－（３－シクロヘキシル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
１２９）Ｎ－（３－（３－（１－メチルピペリジン－４－イル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
１３０）３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ベンゾニトリル；
１３１）（Ｅ）－３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ’－ヒドロキシベンズイミドアミド；
１３２）Ｎ－（３－（３－イソプロピル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
１３３）Ｎ－（３－（３－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
１３４）４－（３－アミノピペリジン－１－イル）－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１３５）Ｎ－（１－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）エタンスルホンアミド；
１３６）Ｎ－（３－（３－（オキセタン－３－イル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
１３７）Ｎ－（１－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピロリジン－３－イル）エタンスルホンアミド；
１３８）（Ｓ）－Ｎ－（１－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）エタンスルホンアミド；
１３９）（Ｒ）－Ｎ－（１－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）エタンスルホンアミド；
１４０）Ｎ－（３－（３－（４，４－ジフルオロシクロヘキシル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
１４１）Ｎ－（１－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）アゼパン－３－イル）エタンスルホンアミド；
１４２）３－（３－シクロヘキシル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ベンゼンスルホンアミド；
１４３）４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－シクロヘキシルフタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；

１４４）Ｎ－（１－（３－シクロヘキシル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）アゼパン－３－イル）エタンスルホンアミド；
１４５）Ｎ－（３－（３－（４－メチルシクロヘキシル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
１４６）（Ｓ）－４－（３－アミノピペリジン－１－イル）－２－シクロヘキシルフタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１４７）（Ｓ）－Ｎ－（１－（３－シクロヘキシル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）エタンスルホンアミド；
１４８）４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１４９）Ｎ－（３－（２－（４－フルオロフェニル）－１－オキソ－１，２－ジヒドロピリド［３，４－ｄ］ピリジン－４－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
１５０）Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－８－メチル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
１５１）Ｎ－（３－（４－オキソ－３－（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－４－イル）－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド；
１５２）２－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロピオン酸；
１５３）２－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ，２－ジメチルプロパンアミド；
１５４）２－シクロヘキシル－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
１５５）（Ｓ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－シクロヘキシルフタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１５６）（Ｓ）－２－シクロヘキシル－４－（３－（メチルアミノ）アゼパン－１－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１５７）（Ｓ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１５８）（Ｓ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１５９）（Ｒ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－シクロヘキシルフタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１６０）２－（３－（３－シクロヘキシル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロピオン酸；
１６１）３－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）オキサゾリジン－２－オン；
１６２）（Ｒ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１６３）２－（３－（３－シクロヘキシル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロパンアミド；
１６４）２－（３－（３－シクロヘキシル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ，２－ジメチルプロパンアミド；
１６５）（Ｒ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１６６）２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロピオン酸；
１６７）４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１６８）２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロパンニトリル；

１６９）４－（３－（２－（１Ｈ－テトラゾール－５－イル）プロパン－２－イル）フェニル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
１７０）（Ｅ）－２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ’－ヒドロキシ－２－メチルプロパンイミドアミド；
１７１）２－（３－（３－（２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロピオン酸；
１７２）４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－シクロブチルフタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１７３）４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－シクロペンチルフタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１７４）２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（２－（５－メチル－１，２，４－オキサジアゾール－３－イル）プロパン－２－イル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
１７５）（Ｒ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（２－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１７６）２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピル－２－メチルプロパンアミド；
１７７）２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（２－メチル－１－オキソ－１－（ピロリジン－１－イル）プロパン－２－イル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
１７８）Ｎ－シクロプロピル－２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロパンアミド；
１７９）２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（２－メチル－１－モルホリノ－１－オキソプロパン－２－イル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
１８０）Ｎ－シクロヘキシル－２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロパンアミド；
１８１）Ｎ－シクロヘキシル－２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロパンアミド；
１８２）２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチル－Ｎ－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）プロパンアミド；
１８３）１－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）シクロプロパン－１－カルボン酸；
１８４）４－（１，４－ジアゼパン－１－イル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１８５）（Ｒ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（４－クロロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１８６）２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－２－メチルプロパンアミド；
１８７）（Ｒ）－Ｎ－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）アゼパン－３－イル）エタンスルホンアミド；
１８８）２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロパンアミド；
１８９）（Ｒ）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（メチルアミノ）

アゼパン－１－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１９０）（Ｒ）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（メチルアミノ）アゼパン－１－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１９１）（Ｒ）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（（２－ヒドロキシエチル）アミノ）アゼパン－１－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
１９２）（Ｒ）－Ｎ－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）アゼパン－３－イル）アセトアミド；
１９３）２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－オキソアゼパン－１－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
１９４）２－（３－（３－（４－クロロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロピオン酸；
１９５）１－（３－（３－（４－クロロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）シクロプロパン－１－カルボン酸；
１９６）２－（４－クロロフェニル）－４－（３－ヒドロキシアゼパン－１－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
１９７）２－（３－（３－（４－クロロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロパンアミド；
１９８）１－（３－（３－（４－クロロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）シクロプロパン－１－カルボキシアミド；
１９９）２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）酢酸；
２００）４－（３－（２－アミノプロパン－２－イル）フェニル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
２０１）２－（３－（３－（４－クロロ－２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロピオン酸；
２０２）（Ｒ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（４－クロロ－２－フルオロフェニル）フタラジン－１－（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
２０３）１－（３－（４－クロロ－２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）アゼパン－３－カルボニトリル；
２０４）４－（３－（１－アミノ－２－メチルプロパン－２－イル）フェニル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
２０５）２－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）－２－メチルプロピオン酸；
２０６）２－（３－（３－（４－シクロプロピルフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロピオン酸；
２０７）１－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）シクロブタン－１－カルボン酸；
２０８）１－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）シクロブタン－１－カルボン酸；
２０９）２－（１－（３－（４－クロロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）－２－メチルプロピオン酸；
２１０－１および２１０－２）２－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）－２－メチルプロピオン酸；
２１１）メチル１－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）シクロプロパン－１－カルボキシレート；
２１２）１－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）シクロプロパン－１－カルボン酸；
２１３－１および２１３－２）１－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４

－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）シクロプロパン－１－カルボン酸；
２１４）２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（ピロリジン－１－イルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
２１５）２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド；
２１６）３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－エチル－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド；
２１７）３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ，Ｎ－ジエチルベンゼンスルホンアミド；
２１８）２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（１－（エチルスルホニル）－１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン；
２１９）２－（４－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペラジン－２－イル）－２－メチルプロピオン酸；
２２０）２－（４－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－１－メチルピペラジン－２－イル）－２－メチルプロピオン酸、および
２２１）２－（４－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）モルホリン－２－イル）－２－メチルプロピオン酸。

【００３２】
本発明の前記化学式１の化合物は、薬学的に許容可能な塩の形態で存在できる。

【００３３】
薬学的に許容可能な塩の例としては、薬学的に許容可能な遊離酸（ｆｒｅｅ　ａｃｉｄ）により形成された酸付加塩が挙げられる。前記用語「薬学的に許容可能な塩」は、患者に比較的非毒性であり、無害な有効作用を有する濃度で塩に起因する副作用が化学式１で表される化合物の効能を低下させない前記化合物の酸付加塩を意味するものであり、前記酸は、有機酸と無機酸が全部可能である。無機酸の例としては、塩酸、リン酸、硫酸、硝酸などが挙げられるが、これらに限定されるものではなく、有機酸の例としては、メタンスルホン酸、ｐ－トルエンスルホン酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、マレイン酸（ｍａｌｅｉｃ　ａｃｉｄ）、コハク酸、シュウ酸、安息香酸、酒石酸、フマル酸（ｆｕｍａｒｉｃ　ａｃｉｄ）、マンデル酸、プロピオン酸（ｐｒｏｐｉｏｎｉｃ　ａｃｉｄ）、クエン酸（ｃｉｔｒｉｃ　ａｃｉｄ）、乳酸（ｌａｃｔｉｃ　ａｃｉｄ）、グリコール酸（ｇｌｙｃｏｌｌｉｃ　ａｃｉｄ）、グルコン酸（ｇｌｕｃｏｎｉｃ　ａｃｉｄ）、ガラクツロン酸、グルタミン酸、グルタル酸（ｇｌｕｔａｒｉｃ　ａｃｉｄ）、グルクロン酸（ｇｌｕｃｕｒｏｎｉｃ　ａｃｉｄ）、アスパラギン酸、アスコルビン酸、カルボン酸、バニリン酸、ヨウ化水素酸（ｈｙｄｒｏｉｏｄｉｃ　ａｃｉｄ）などが挙げられるが、これらに限定されない。

【００３４】
薬学的に許容可能な塩の他の例としては、塩基を使って製造した金属塩でありうる。前記金属塩の例としては、ナトリウム塩、カリウム塩またはカルシウム塩が製薬上特に適しているが、これらに限定されるものではない。また、前記金属塩は、アルカリ金属またはアルカリ土類金属塩を適当な銀塩（例えば、硝酸銀）と反応させて得ることができる銀塩の形態で提供されることもできる。

【００３５】
上で述べた塩は、例示的なものに過ぎず、前記化学式１化合物の塩は、薬学的に許容可能な塩であって、化学式１化合物と同等なレベルのＳｉｒｔ６活性を示す塩であれば、いずれのものでも制限なしで使用できる。

【００３６】
本発明は、前記化学式１の化合物、またはそのラセミ体、立体異性体または薬学的に許容可能な塩を含むＳｉｒｔ６関連疾患の予防または治療用薬学的組成物、および前記化学

式１の化合物、またはそのラセミ体、立体異性体または薬学的に許容可能な塩を用いてＳｉｒｔ６関連疾患を治療する方法に関する。

【００３７】

本発明の化学式１の化合物、またはそのラセミ体、立体異性体またはこれらの薬学的に許容可能な塩は、Ｓｉｒｔ６活性を示すので、Ｓｉｒｔ６関連疾患の予防または治療に有用に使用できる。本発明において前記Ｓｉｒｔ６関連疾患は、がん、脂肪肝、肝硬変／炎症、インスリン分泌低下、老化によって起こる疾患を含んでもよいが、特定の疾患に限定されず、Ｓｉｒｔ６活性と関連があると知られたすべての疾患を含む。

【００３８】

本発明において、前記用語「予防」は、本発明の組成物の投与によってＳｉｒｔ６関連疾患の発生、拡散および再発を抑制させたり遅延させるすべての行為を意味し、前記用語「治療」は、本発明の組成物の投与によって前記疾患の症状が好転したり有益に変更されるすべての行為を意味する。

【００３９】

本発明の他の実施様態によれば、本発明は、化学式１で表される化合物、またはそのラセミ体、立体異性体または薬学的に許容可能な塩をこれを必要とする対象に投与することを含む、Ｓｉｒｔ６関連疾患の予防または治療方法に関する。

【００４０】

本発明の薬学的組成物は、予防または治療しようとする疾患の種類によって、有効成分として前記化学式１の化合物、またはそのラセミ体、立体異性体または薬学的に許容可能な塩以外に、各疾患の予防または治療に使用される公知の薬物をさらに含んでもよい。例えば、Ｓｉｒｔ６関連疾患の予防または治療に使用される場合、有効成分として前記化学式１の化合物、またはそのラセミ体、立体異性体または薬学的に許容可能な塩以外に、本発明の分野において通常使用される公知の添加剤、例えば、薬学的に許容可能な担体、賦形剤および希釈剤のうちいずれか一つをさらに含むことができ、前記疾患の治療のために公知となった他の治療と併用できる。他の治療には、化学療法、放射線治療、ホルモン治療、骨髄移植、幹細胞代替治療、他の生物学的治療、免疫治療などが含まれるが、これらに限定されるものではない。

【００４１】

実施例

以下では、製造例および実施例に基づいて本発明をより詳細に説明する。しかしながら、これらの実施例は、本発明を例示するためのものに過ぎず、本発明の範囲がこれらの実施例によって限定されるものではない。

【００４２】

製造例１：化合物Ｉ－１～Ｉ－８の製造

製造例１－１：２－（［１，１’－ビフェニル］－４－イル）－４－クロロフタラジン－１（２Ｈ）－オン（Ｉ－１）の製造

４－クロロフタラジン－１（２Ｈ）－オン（１．０８ｇ、６．００ｍｍｏｌ）にＤＣＭ（６０ｍＬ）、フェニルボロン酸（１．１０ｇ、９．００ｍｍｏｌ）、酢酸銅（３．２４ｇ、１７．９４ｍｍｏｌ）およびピリジン（２．４０ｍＬ、２９．８８ｍｍｏｌ）を加えた後、常温で２４時間撹拌した。反応生成物をＴＬＣで確認した後、反応液をＤＣＭで希釈し、精製水で洗浄した。有機層を無水$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、３６３ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝２５７．１（$M+H^+$）

【００４３】

製造例１－２：４－クロロ－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン（Ｉ－２）の製造

４－クロロフタラジン－１（２Ｈ）－オン（１．０８ｇ、６．００ｍｍｏｌ）と４－フルオロフェニルボロン酸（０．９２ｇ、６．５８ｍｍｏｌ）を製造例１－１と同じ方法で反応させて、４０１ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝２７４．９（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００４４】

製造例１－３：４－クロロ－２－（４－トリフルオロメチル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン（Ｉ－３）の製造

４－クロロフタラジン－１（２Ｈ）－オン（１．０８ｇ、６．００ｍｍｏｌ）と４－（トリフルオロメチル）フェニルボロン酸（１．２５ｇ、６．５８ｍｍｏｌ）を製造例１－１と同じ方法で反応させて、２１７ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３２５．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００４５】

製造例１－４：４－クロロ－２－（４－メトキシフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン（Ｉ－４）の製造

４－クロロフタラジン－１（２Ｈ）－オン（１．０８ｇ、６．００ｍｍｏｌ）と４－メトキシフェニルボロン酸（１．００ｇ、６．５８ｍｍｏｌ）を製造例１－１と同じ方法で反応させて、４３２ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝２８７．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００４６】

製造例１－５：４－クロロ－２－（２－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン（Ｉ－５）の製造

４－クロロフタラジン－１（２Ｈ）－オン（１．０８ｇ、６．００ｍｍｏｌ）と２－フルオロフェニルボロン酸（０．９２ｇ、６．５８ｍｍｏｌ）を製造例１－１と同じ方法で反応させて、３４５ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝２７４．９（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００４７】

製造例１－６：４－クロロ－２－（３－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン（Ｉ－６）の製造

４－クロロフタラジン－１（２Ｈ）－オン（１．０８ｇ、６．００ｍｍｏｌ）と３－フルオロフェニルボロン酸（０．９２ｇ、６．５８ｍｍｏｌ）を製造例１－１と同じ方法で反応させて、３８１ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝２７４．９（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００４８】

製造例１－７：４－クロロ－２－（３，５－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン（Ｉ－７）の製造

４－クロロフタラジン－１（２Ｈ）－オン（１．０８ｇ、６．００ｍｍｏｌ）と３，５－ジフルオロフェニルボロン酸（１．０４ｇ、６．５８ｍｍｏｌ）を製造例１－１と同じ方法で反応させて、４１０ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝２９３．２（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００４９】

製造例１－８：４－クロロ－２－（３－クロロ－４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン（Ｉ－８）の製造

４－クロロフタラジン－１（２Ｈ）－オン（１．０８ｇ、６．００ｍｍｏｌ）と（３－クロロ－４－フルオロフェニル）ボロン酸（１．１５ｇ、６．５８ｍｍｏｌ）を製造例１－１と同じ方法で反応させて、３８８ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３０８．８（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００５０】

製造例２：化合物Ｉ－９およびＩ－１０の製造

製造例２－１：４－オキソ－３－（２－（トリフルオロメチル）フェニル）－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イルトリフルオロメタンスルホナート（Ｉ－９）の製造

段階１：フタル酸無水物（５ｇ、３３．７６ｍｍｏｌ）と２，４－ジフルオロフェニルヒドラジンヒドロクロリド（６．７０ｇ、３７．１３ｍｍｏｌ）を酢酸（５０ｍＬ）に入れた後、１２０℃で２４時間撹拌した。反応液を常温に冷却し、精製水１００ｍＬを加え

て１時間撹拌後、析出された固体をろ過した。得られた固体とＮａＯＨ（２．０２ｇ、５０．６３ｍｍｏｌ）をＥｔＯＨで希釈した後、４０℃で１時間以上撹拌した。反応液を減圧濃縮後、精製水で希釈し、１Ｎ　ＨＣｌを用いてｐＨ５～６に調節した。析出された結晶を１０分以上撹拌後にろ過して、５．１ｇの２－（２，４－ジフルオロフェニル）－２，３－ジヒドロフタラジン－１，４－ジオンを収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝２７５．３（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００５１】

段階２：段階１から収得した化合物（２．５０ｇ、９．１２ｍｍｏｌ）にＤＣＭ（２５０ｍＬ）、トリメチルアミン（３．０５ｍＬ、２１．８８ｍｍｏｌ）を加えた後、ｉｃｅ－ｓａｌｔ　ｂａｔｈでｃｏｏｌｉｎｇし、トリフルオロメタンスルホン酸無水物（２．３０ｍＬ、１３．６８ｍｍｏｌ）をｄｒｏｐｐｉｎｇした後、常温で２時間撹拌した。反応生成物をＤＣＭで希釈し、２Ｎ　ＨＣｌで洗った後、有機層を抽出した。分離した有機層を無水$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、１．９１ｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４０７．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００５２】

製造例２－２：３－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イルトリフルオロメタンスルホナート（Ｉ－１０）の製造

フタル酸無水物（５．００ｇ、３３．７６ｍｍｏｌ）と２，６－ジフルオロフェニルヒドラジンヒドロクロリド（６．７０ｇ、３７．１３ｍｍｏｌ）を製造例２－１と同じ方法で反応させて、１．７０ｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４０７．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００５３】

製造例３：化合物Ｉ－１１～Ｉ－１４の製造

製造例３－１：４－クロロ－６－フルオロ－２－フェニルフタラジン－１（２Ｈ）－オン（Ｉ－１１）、および４－クロロ－７－フルオロ－２－フェニルフタラジン－１（２Ｈ）－オン（Ｉ－１２）の製造

段階１：４－フルオロフタル酸無水物（１０ｇ、６０．２４ｍｍｏｌ）にフェニルヒドラジンヒドロクロリド（１３ｇ、９０．３６ｍｍｏｌ）と１０％ＨＣｌ（４００ｍＬ）を加えた後、１１０℃で２４時間撹拌した。反応生成物をＴＬＣで確認した後、反応液をＥｔＯＡｃで希釈し、精製水で洗浄した。有機層を無水$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、中間体化合物６－フルオロ－２－フェニル－２，３－ジヒドロフタラジン－１，４－ジオン（４．７０ｇ、収率３０．４％）と７－フルオロ－２－フェニル－２，３－ジヒドロフタラジン－１，４－ジオン（５．１ｇ、収率３３．０％）を合成した。

【００５４】

段階２：段階１から収得した中間体化合物６－フルオロ－２－フェニル－２，３－ジヒドロフタラジン－１，４－ジオンと７－フルオロ－２－フェニル－２，３－ジヒドロフタラジン－１，４－ジオン（１．０７ｇ、４．１７ｍｍｏｌ）にホスホリルクロリド（２５ｍＬ）を加え、１２０℃で２時間撹拌した。反応生成物を常温に冷却した後、過量の溶媒を蒸留除去し、氷水に入れて、生成された固体を回収した。ろ過して得られた固体をＤＣＭに溶かした後、飽和$NaHCO_3$水溶液を加えて中和し、ＤＣＭで抽出した。有機層を無水$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、５５０ｍｇの化合物Ｉ－１１と４２８ｍｇの化合物Ｉ－１２を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝２７５．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００５５】

製造例３－２：３－（２，４－ジフルオロフェニル）－７－フルオロ－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イルトリフルオロメタンスルホナート（Ｉ－１３）、および３－（２，４－ジフルオロフェニル）－６－フルオロ－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イルトリフルオロメタンスルホナート（Ｉ－１４）の製造

フタル酸無水物（５．００ｇ、３３．７６ｍｍｏｌ）と２，４－ジフルオロフェニルヒドラジンヒドロクロリド（６．７０ｇ、３７．１３ｍｍｏｌ）を製造例３－１と同じ方法で反応させて、６４８ｍｇの化合物Ｉ－１３および５３０ｍｇの化合物Ｉ－１４をそれぞれ収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４０７．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００５６】

製造例４：２－（４－フルオロフェニル）－１－オキソ－１，２－ジヒドロピリド［３，４－ｄ］ピリダジン－４－イルトリフルオロメタンスルホナート（Ｉ－１５）の製造

段階１：フロ［３，４－ｃ］ピリジン－１，３－ジオン（２００ｍｇ、１．３４１ｍｍｏｌ）と（４－フルオロフェニル）ヒドラジンヒドロクロリド（２６２ｍｇ、１．６１ｍｍｏｌ）を酢酸（２ｍＬ）で希釈した後、１２０℃で１５時間撹拌した。反応液を０から５℃の間に冷却した後、精製水を加え、３０分間撹拌後、析出された固体をろ過した。得られた固体とＮａＯＨ（８０ｍｇ、２．０１１ｍｍｏｌ）をＥｔＯＨで希釈した後、４０℃で１時間以上撹拌した。反応液を減圧濃縮後、精製水で希釈し、１Ｎ　ＨＣｌを用いてｐＨ６に調節した。析出された結晶を１０分以上撹拌後にろ過して、２６０ｍｇの２－（４－フルオロフェニル）－２，３－ジヒドロピリド［３，４－ｄ］ピリダジン－１，４－ジオンを収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝２５８．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００５７】

段階２：段階１から収得した化合物（２００ｍｇ、０．７７８ｍｍｏｌ）とＴＥＡ（２１７μＬ、１．５５５ｍｍｏｌ）をＤＣＭ　５ｍＬで希釈した後、－１０から－５℃の間に冷却した。トリフルオロメタンスルホン酸無水物（１５８μＬ、０．９３３ｍｍｏｌ）をＤＣＭ　１ｍＬで希釈後、反応液に１０分間滴加後、徐々に常温に温度を上げて、１時間撹拌した。反応液をアンモニウムクロリド水溶液とＤＣＭで希釈した後、有機層を$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、６４ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３９０．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００５８】

製造例５：メチル２－メチル－２－（ピペラジン－２－イル）プロピオネート（Ｉ－１６）の製造

段階１：ジベンジルエチレンジアミン（１．６１ｇ、６．７０ｍｍｏｌ）、メチル（Ｅ）－４－ブロモブト－２－エノアート（１．００ｇ、６．００ｍｍｏｌ）および$Et_3N$（２．８ｍＬ、１６．７５ｍｍｏｌ）を無水トルエン（２０ｍＬ）に溶かした後、常温で４８時間撹拌した。反応生成物をＥｔＯＡｃで希釈し、飽和$NaHCO_3$水溶液で洗った後、有機層を抽出した。分離した有機層を無水$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、１．１ｇのメチル２－（１，４－ジベンジルピペラジン－２－イル）アセテートを収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３３９．２（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００５９】

段階２：段階１から収得した化合物（１．００ｇ、２．９６ｍｍｏｌ）を無水ＴＨＦ（２０ｍＬ）に溶かした後、－７８℃に冷却する。２Ｍ　ＬＤＡ－ＴＨＦ（５．９ｍＬ、１１．８０ｍｍｏｌ）をゆっくり加え、－３０℃で１時間撹拌した。反応液を－７８℃に再冷却後、ヨードメタン（０．５５ｍＬ、８．８６ｍｍｏｌ）とＨＭＰＡ（１０μＬ、０．０６ｍｍｏｌ）を加えた。反応混合物を０℃までゆっくり上げ、以後、常温で５時間撹拌した。反応生成物をＥｔＯＡｃで希釈し、飽和$NaHCO_3$水溶液で洗った後、有機層を抽出した。分離した有機層を無水$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、３６０ｍｇのメチル２－（１，４－ジベンジルピペラジン－２－イル）－２－メチルプロピオネートを収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３６７．２（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００６０】

段階３：段階２から収得した化合物（２６０ｍｇ、０．７１ｍｍｏｌ）を無水ＭｅＯＨ（１０ｍＬ）に溶かした後、Ｐｄ／Ｃ（３８ｍｇ）とＰｄ（ＯＨ）$_2$を加え、常温で４時間撹拌した。反応溶液をＣｅｌｉｔｅ　Ｐａｄを用いてフィルターし、ＭｅＯＨで洗った後、有機溶媒を減圧濃縮して除去した。カラムクロマトグラフィーで分離して、１２５ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３３９．２（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００６１】

実施例１：Ｎ－（３－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド

段階１：化合物Ｉ－１（５００ｍｇ、１．９５ｍｍｏｌ）、３－アミノフェニルボロン酸（２９３ｍｇ、２．１４ｍｍｏｌ）、Ｐｄ（ＯＡｃ）$_2$（１３ｍｇ、０．０６ｍｍｏｌ）およびｓＳＰｈｏｓ（６０ｍｇ、０．１２ｍｍｏｌ）を１，４－ジオキサン／蒸留水（１４ｍＬ、１：１の比率）に入れた後、１００℃で５時間撹拌した。反応生成物をＥｔＯＡｃで希釈し、精製水で洗浄した。分離した有機層を無水Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、４１２ｍｇの４－（３－アミノフェニル）－２－フェニルフタラジン－１（２Ｈ）－オンを収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３１４．４（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００６２】

段階２：段階１から収得した化合物（２００ｍｇ、０．６３ｍｍｏｌ）にピリジン（１０ｍＬ）を加え、エタンスルホニルクロリド（７３μＬ、０．７６ｍｍｏｌ）を滴加した後、常温で５時間撹拌した。反応物をＥｔＯＡｃで希釈し、精製水で洗浄した。分離した有機層を無水Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、１２２ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４０６．５（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００６３】

実施例２：４－（３－アミノフェニル）－２－（４－（トリフルオロメチル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン

化合物Ｉ－１の代わりに化合物Ｉ－３（５００ｍｇ、１．５４ｍｍｏｌ）を使って実施例１の段階１と同じ方法で反応させて、白色固体として４０８ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３８２．２（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００６４】

実施例３：Ｎ－（３－（４－オキソ－３－（４－（トリフルオロメチル）フェニル）－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド

実施例２の化合物（１００ｍｇ、０．２６ｍｍｏｌ）を実施例１の段階２と同じ方法で反応させて、７８ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４７３．９（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００６５】

実施例４：４－（３－（エチルアミノ）フェニル）－２－（４－（トリフルオロメチル）フェニルフタラジン－１（２Ｈ）－オン

実施例２の化合物（１００ｍｇ、０．２６ｍｍｏｌ）、アセトアルデヒド（２４μＬ、０．４０ｍｍｏｌ）および８Ｍボラン－ピリジン錯体（５０μＬ、０．４０ｍｍｏｌ）をＭｅＯＨ（７ｍＬ）に溶かした後、４Å　ｍｏｌｅｃｕｌａｒ　ｓｉｅｖｅｓの存在下に常温で２４時間反応させた。反応溶液をＣｅｌｉｔｅ　Ｐａｄを用いてろ過し、ＭｅＯＨで洗浄して、有機溶媒を減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、白色固体として４５ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４１０．５（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００６６】

実施例５：Ｎ－メチル－Ｎ－（３－（４－オキソ－３－（４－（トリフルオロメチル）フェニル）－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド

実施例３の化合物（５０ｍｇ、０．１１ｍｍｏｌ）をＤＭＦ（２ｍＬ）に溶かした後、$K_2CO_3$（３０ｍｇ、０．２２ｍｍｏｌ）とヨードメタン（８μＬ、０．１３ｍｍｏｌ）を入れ、５０℃で２４時間反応した。反応生成物をＥｔＯＡｃで希釈し、精製水で洗浄した後、有機層を無水$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、４５ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４７４．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００６７】

実施例６：Ｎ－（３－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンスルホンアミド

実施例１の段階１から収得した化合物（５０ｍｇ、０．１６ｍｍｏｌ）とメタンスルホニルクロリド（１４．８μＬ、０．１９ｍｍｏｌ）を実施例１の段階２と同じ方法で反応させて、４８ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３９２．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００６８】

実施例７：Ｎ－メチル－Ｎ－（３－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イルフェニルメタンスルホンアミド

実施例６の化合物（２０ｍｇ、０．０５ｍｍｏｌ）を実施例５と同じ方法で反応させて、２１ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４０６．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００６９】

実施例８：Ｎ－（４－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド

化合物Ｉ－１（５００ｍｇ、１．９５ｍｍｏｌ）と４－アミノフェニルボロン酸（２９３ｍｇ、２．１４ｍｍｏｌ）を実施例１と同じ方法で反応させて、１８７ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４０６．５（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００７０】

実施例９：Ｎ－（３－（３－フェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－ジメチルスルファモイルアミド

実施例１の段階１から収得した化合物（５０ｍｇ、０．１６ｍｍｏｌ）とＮ，Ｎ－ジメチルスルファモイルクロリド（２０μＬ、０．１９ｍｍｏｌ）を実施例１の段階２と同じ方法で反応させて、４１ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２１．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００７１】

実施例１０：Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンスルホンアミド

段階１：化合物Ｉ－２（５００ｍｇ、１．８３ｍｍｏｌ）と３－アミノフェニルボロン酸（３７５ｍｇ、２．７４ｍｍｏｌ）を実施例１の段階１と同じ方法で反応させて、４４０ｍｇの４－（３－アミノフェニル）－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンを収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３３２．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００７２】

段階２：段階１から収得した化合物（１００ｍｇ、０．３０ｍｍｏｌ）とメタンスルホン酸無水物（６８μＬ、０．３６ｍｍｏｌ）を実施例１の段階２と同じ方法で反応させて、７８ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４１０．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００７３】

実施例１１：Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イルフェニル）エタンスルホンアミド

実施例１０の段階１から収得した化合物（５０ｍｇ、０．１５ｍｍｏｌ）とエタンスル

ホニルクロリド（１７μＬ、０．１８ｍｍｏｌ）を実施例１の段階２と同じ方法で反応させて、白色固体として４７ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２４．２（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【００７４】
実施例１２：Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－ジメチルスルファモイルアミド
実施例１０の段階１から収得した化合物（５０ｍｇ、０．１５ｍｍｏｌ）とＮ，Ｎ－ジメチルスルファモイルクロリド（１９μＬ、０．１８ｍｍｏｌ）を実施例１の段階２と同じ方法で反応させて、３４ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４３９．２（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【００７５】
実施例１３：（Ｚ）－Ｎ－メチル－１－（３－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド
段階１：化合物Ｉ－１（１ｇ、３．０２ｍｍｏｌ）、３－ホルミルフェニルボロン酸（５４３ｍｇ、３．６２ｍｍｏｌ）およびＰｄ（ＰＰｈ$_3$）$_4$（１０４ｍｇ、０．０９ｍｍｏｌ）を１，４－ジオキサン（５０ｍＬ）に加え、Ｈ$_2$Ｏ（１５ｍＬ）にＮａ$_2$ＣＯ$_3$（１．５ｇ、１４．４８ｍｍｏｌ）を溶かして共に加えた後、１１０℃で２時間撹拌した。反応生成物をＥｔＯＡｃで希釈し、精製水で洗浄後、分離した有機層を無水Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、１．２ｇの３－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ベンズアルデヒドを収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３２７．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【００７６】
段階２：段階１から収得した化合物（１００ｍｇ、０．３１ｍｍｏｌ）を無水ＥｔＯＨ（５ｍＬ）に溶かし、Ｎ－メチルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（１２８ｍｇ、１．５３ｍｍｏｌ）、ポタシウムアセテート（１５０ｍｇ、１．５３ｍｍｏｌ）を加えた後、常温で４８時間撹拌した。溶媒を濃縮してＥｔＯＨを除去した後、ＥｔＯＡｃで希釈し、精製水で洗浄した。分離した有機層を無水Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、４５ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３５６．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【００７７】
実施例１４：（Ｚ）－Ｎ－イソプロピル－１－（３－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド
実施例１３の段階１から収得した化合物（１００ｍｇ、０．３１ｍｍｏｌ）とＮ－イソプロピルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（１７０ｍｇ、１．５３ｍｍｏｌ）を実施例１３の段階２と同じ方法で反応させて、５１ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３８４．２（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【００７８】
実施例１５：（Ｚ）－１－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド
化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）を出発物質として使って実施例１３と同じ方法で反応させて、４２ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３７４．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【００７９】
実施例１６：（Ｚ）－Ｎ－エチル－１－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド
化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）とＮ－エチルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（１７４ｍｇ、１．８ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、５４ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３８８．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００８０】
実施例１７：（Ｚ）－１－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド
化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）とＮ－イソプロピルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（１９９ｍｇ、１．８ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、４４ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４０２．２（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【００８１】
実施例１８：Ｎ－（２－クロロ－５－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－（メチルスルホニル）メタンスルホンアミド
化合物Ｉ－１（１００ｍｇ、０．３９ｍｍｏｌ）、（３－アミノ－４－クロロフェニル）ボロン酸（８０ｍｇ、０．４７ｍｍｏｌ）およびメタンスルホン酸無水物（１６２μＬ、０．８５ｍｍｏｌ）を実施例１０と同じ方法で反応させて、３７ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝５０４．０４（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【００８２】
実施例１９：Ｎ－（３－（３－（フェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－６－クロロフェニル）－ジメチルスルファモイルアミド
化合物Ｉ－１（１００ｍｇ、０．３９ｍｍｏｌ）、（３－アミノ－４－クロロフェニル）ボロン酸（８０ｍｇ、０．４７ｍｍｏｌ）およびＮ，Ｎ－ジメチルスルファモイルクロリド（５０μＬ、０．４７ｍｍｏｌ）を実施例１０と同じ方法で反応させて、５４ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４５５．０９（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【００８３】
実施例２０：メチル（Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）スルファモイル）カルバマート
実施例１１の段階１から収得した化合物（１００ｍｇ、０．３０ｍｍｏｌ）とメチル（クロロスルホニル）カルバマート（６２ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）を実施例１の段階２と同じ方法で反応させて、白色固体として７７ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４６９．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【００８４】
実施例２１：（Ｚ）－１－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド
化合物Ｉ－１の代わりに化合物Ｉ－９（１００ｍｇ、０．３４ｍｍｏｌ）を使って実施例１３と同じ方法で反応させて、５０ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３９２．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【００８５】
実施例２２：（Ｚ）－１－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド
化合物Ｉ－９（１００ｍｇ、０．３４ｍｍｏｌ）とＮ－イソプロピルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（１９０ｍｇ、１．７０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、５８ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２０．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【００８６】
実施例２３：（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド
化合物Ｉ－９（１００ｍｇ、０．３４ｍｍｏｌ）とＮ－ｔｅｒｔ－ブチルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（２１２ｍｇ、１．７０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応

させて、３６ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４３４．２（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【００８７】
実施例２４：４－（３－アミノフェニル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン
化合物Ｉ－９（１．００ｇ、３．４１ｍｍｏｌ）と３－アミノフェニルボロン酸（５１３ｍｇ、３．７５ｍｍｏｌ）を実施例１の段階１と同じ方法で反応させて、８０１ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３４９．９（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【００８８】
実施例２５：Ｎ－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド
実施例２４から収得した化合物（５０ｍｇ、０．１４ｍｍｏｌ）とエタンスルホニルクロリド（１６μＬ、０．１７ｍｍｏｌ）を実施例１の段階２と同じ方法で反応させて、白色固体として３３ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４４２．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【００８９】
実施例２６：メチル（Ｎ－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）スルファモイル）カルバマート
実施例２４の化合物（１００ｍｇ、０．２８ｍｍｏｌ）とメチル（クロロスルホニル）カルバマート（５７ｍｇ、０．３３ｍｍｏｌ）を実施例１の段階２と同じ方法で反応させて、白色固体として７１ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４８７．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【００９０】
実施例２７：（Ｚ）－１－（３－（３－（３－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド
化合物Ｉ－６（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、３－ホルミルフェニルボロン酸（６４ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびＮ－メチルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（１５１ｍｇ、１．８０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、４２ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３７４．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【００９１】
実施例２８：（Ｚ）－１－（３－（３－（３－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド
化合物Ｉ－６（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、３－ホルミルフェニルボロン酸（６４ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびＮ－イソプロピルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（２０１ｍｇ、１．８０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、５５ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４０２．２（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【００９２】
実施例２９：（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（３－（３－（３－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド
化合物Ｉ－６（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、３－ホルミルフェニルボロン酸（６４ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびＮ－ｔｅｒｔ－ブチルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（２２６ｍｇ、１．８０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、３０ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４１６．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【００９３】
実施例３０：Ｎ－（３－（３－（３－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒド

ロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド

化合物Ｉ－６（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、３－アミノフェニルボロン酸（５９ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびエタンスルホニルクロリド（４１μＬ、０．４３ｍｍｏｌ）を実施例１と同じ方法で反応させて、６６ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２４．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００９４】

実施例３１：（Ｚ）－１－（３－（３－（３，５－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド

化合物Ｉ－７（１００ｍｇ、０．３４ｍｍｏｌ）、３－ホルミルフェニルボロン酸（６４ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびＮ－イソプロピルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（２０１ｍｇ、１．８０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、６４ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２０．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００９５】

実施例３２：（Ｚ）－Ｎ－イソプロピル－１－（３－（３－（４－メトキシフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド

化合物Ｉ－４（１００ｍｇ、０．３５ｍｍｏｌ）、３－ホルミルフェニルボロン酸（６２ｍｇ、０．４２ｍｍｏｌ）およびＮ－イソプロピルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（１９６ｍｇ、１．７５ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、５５ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４１４．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００９６】

実施例３３：（Ｚ）－１－（３－（３－（３－クロロ－４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド

化合物Ｉ－８（１００ｍｇ、０．３３ｍｍｏｌ）、３－ホルミルフェニルボロン酸（６０ｍｇ、０．４０ｍｍｏｌ）およびＮ－イソプロピルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（１８４ｍｇ、１．６５ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、４７ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４３６．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００９７】

実施例３４：（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（３－（３－（３－クロロ－４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド

化合物Ｉ－８（１００ｍｇ、０．３３ｍｍｏｌ）、３－ホルミルフェニルボロン酸（６０ｍｇ、０．４０ｍｍｏｌ）およびＮ－ｔｅｒｔ－ブチルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（２０８ｍｇ、１．６５ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、４１ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４５０．３（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００９８】

実施例３５：（Ｚ）－Ｎ－ベンジル－１－（３－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド

化合物Ｉ－１（１００ｍｇ、０．３８ｍｍｏｌ）、３－ホルミルフェニルボロン酸（６８ｍｇ、０．４５ｍｍｏｌ）およびＮ－ベンジルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（３０２ｍｇ、１．９０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、６０ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４３２．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【００９９】

実施例３６：（Ｅ）－１－（４－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４

－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド
化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、４－ホルミルフェニルボロン酸（６５ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびＮ－メチルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（１４９ｍｇ、１．８０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、５１ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３７４．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１００】
実施例３７：（Ｚ）－１－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド
化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、３－ホルミルフェニルボロン酸（６５ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびＮ－イソプロピルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（２００ｍｇ、１．８０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、４３ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４０２．２（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１０１】
実施例３８：（Ｅ）－１－（３－フルオロ－４－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド
化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、（２－フルオロ－４－ホルミルフェニル）ボロン酸（７２ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびＮ－メチルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（１４９ｍｇ、１．８０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、３７ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３９２．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１０２】
実施例３９：（Ｅ）－１－（３－フルオロ－４－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド
化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、（２－フルオロ－４－ホルミルフェニル）ボロン酸（７２ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびＮ－イソプロピルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（２００ｍｇ、１．８０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、４４ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２０．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１０３】
実施例４０：（Ｚ）－１－（２－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド
化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、２－ホルミルフェニルボロン酸（６５ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびＮ－メチルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（１４９ｍｇ、１．８０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、５４ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３７４．３（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１０４】
実施例４１：（Ｚ）－１－（２－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド
化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、２－ホルミルフェニルボロン酸（６５ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびＮ－イソプロピルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（２００ｍｇ、１．８０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、３０ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４０２．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１０５】
実施例４２：（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（２－（３－（４－フルオロフェニル

）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド

化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、２－ホルミルフェニルボロン酸（６５ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびＮ－ｔｅｒｔ－ブチルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（２２５ｍｇ、１．８０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、３９ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４１６．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０１０６】

実施例４３：（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド

化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、３－ホルミルフェニルボロン酸（６５ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびＮ－ｔｅｒｔ－ブチルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（２２５ｍｇ、１．８０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、４８ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４１６．２（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０１０７】

実施例４４：（Ｚ）－Ｎ－ベンジル－１－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド

化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、３－ホルミルフェニルボロン酸（６５ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびＮ－ベンジルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（２８６ｍｇ、１．８０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、６２ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４５０．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０１０８】

実施例４５：（Ｚ）－１－（５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）チオフェン－２－イル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド

化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、５－ホルミル－２－チエニルボロン酸（６７ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびＮ－メチルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（１４９ｍｇ、１．８０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、５５ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３８０．３（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０１０９】

実施例４６：（Ｚ）－１－（５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）チオフェン－２－イル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド

化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、５－ホルミル－２－チエニルボロン酸（６７ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびＮ－イソプロピルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（２００ｍｇ、１．８０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、４７ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４０７．９（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０１１０】

実施例４７：（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）チオフェン－２－イル）メタンイミンオキシド

化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、５－ホルミル－２－チエニルボロン酸（６７ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびＮ－ｔｅｒｔ－ブチルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（２２５ｍｇ、１．８０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、３５ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２２．２（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１１１】

実施例４８：（Ｚ）－１－（５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フラン－２－イル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド

化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、５－ホルミル－２－フラニルボロン酸（６０ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびＮ－イソプロピルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（２００ｍｇ、１．８０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、４０ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３９２．１（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１１２】

実施例４９：（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－２－メトキシフェニル）メタンイミンオキシド

化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、３－ホルミル－４－メトキシフェニルボロン酸（７７ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびＮ－ｔｅｒｔ－ブチルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（２２５ｍｇ、１．８０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、４５ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４４６．２（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１１３】

実施例５０：（Ｚ）－Ｎ－ベンジル－１－（５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－２－メトキシフェニル）メタンイミンオキシド

化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、３－ホルミル－４－メトキシフェニルボロン酸（７７ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびＮ－ベンジルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（２８６ｍｇ、１．８０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、５０ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４８０．０（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１１４】

実施例５１：（Ｚ）－１－（２－フルオロ－５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド

化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、４－フルオロ－３－ホルミルフェニルボロン酸（７２ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびＮ－メチルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（１４９ｍｇ、１．８０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、４３ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３９２．１（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１１５】

実施例５２：（Ｚ）－１－（２－フルオロ－５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド

化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、４－フルオロ－３－ホルミルフェニルボロン酸（７２ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびＮ－イソプロピルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（２００ｍｇ、１．８０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、４７ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２０．０（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１１６】

実施例５３：（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（２－フルオロ－５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド

化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、４－フルオロ－３－ホルミルフェニルボロン酸（７２ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびＮ－ｔｅｒｔ－ブチルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（２２５ｍｇ、１．８０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、３０ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４３４．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０１１７】

実施例５４：（Ｚ）－Ｎ－ベンジル－１－（２－フルオロ－５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド

化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、４－フルオロ－３－ホルミルフェニルボロン酸（７２ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびＮ－ベンジルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（２８６ｍｇ、１．８０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、５７ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４６７．９（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０１１８】

実施例５５：（Ｚ）－１－（４－フルオロ－３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド

化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、２－フルオロ－５－ホルミルフェニルボロン酸（７２ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびＮ－メチルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（１４９ｍｇ、１．８０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、４６ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３９２．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０１１９】

実施例５６：（Ｚ）－１－（４－フルオロ－３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド

化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、２－フルオロ－５－ホルミルフェニルボロン酸（７２ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびＮ－イソプロピルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（２００ｍｇ、１．８０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、４２ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４１９．８（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０１２０】

実施例５７：（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（４－フルオロ－３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド

化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、２－フルオロ－５－ホルミルフェニルボロン酸（７２ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびＮ－ｔｅｒｔ－ブチルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（２２５ｍｇ、１．８０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、３１ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４３４．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０１２１】

実施例５８：（Ｚ）－Ｎ－ベンジル－１－（４－フルオロ－３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド

化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、２－フルオロ－５－ホルミルフェニルボロン酸（７２ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびＮ－ベンジルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（２８６ｍｇ、１．８０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、４３ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４６８．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０１２２】
実施例５９：４－（４－クロロ－３－ニトロフェニル）－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン
化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）と４－クロロ－３－ニトロフェニルボロン酸（８６ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）を実施例１の段階１と同じ方法で反応させて、１２５ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３９６．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１２３】
実施例６０：４－（３－アミノフェニル）－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン
化合物Ｉ－２（１．００ｇ、３．６４ｍｍｏｌ）と３－アミノフェニルボロン酸（５４８ｍｇ、４．００ｍｍｏｌ）を実施例１の段階１と同じ方法で反応させて、１．１４ｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３３２．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１２４】
実施例６１：Ｎ－（３－（３－ベンジル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド
段階１：４－クロロフタラジン－１（２Ｈ）－オン（２００ｍｇ、１．１０ｍｍｏｌ）をＤＭＦ（１０ｍＬ）に溶かした後、０℃に冷却した。ＮａＨ（５０ｍｇ、１．３ｍｍｏｌ）を入れ、１０分間０℃で撹拌した後、ベンジルブロミド（１４５μＬ、１．２０ｍｍｏｌ）をゆっくり加えた。反応物を室温で２時間反応させた後、反応終結をＴＬＣで確認し、反応液をＥｔＯＡｃで希釈し、精製水で洗浄した。有機層を無水$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、１７０ｍｇの２－ベンジル－４－クロロフタラジン－１（２Ｈ）－オンを収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝２７１．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１２５】
段階２：段階１から収得した化合物（１００ｍｇ、０．３７ｍｍｏｌ）をジオキサン（５ｍＬ）に溶かした後、Ｐｄ（ｄｐｐｆ）$Cl_2$（２７ｍｇ、１０ ｍｏｌ％）、（３－アミノフェニル）ボロン酸（５６ｍｇ、０．４０ｍｍｏｌ）、$K_3PO_4$（２３５ｍｇ、１．１０ｍｍｏｌ）、ｓＳＰｈｏｓ（１９ｍｇ、１０ｍｏｌ％）を加えた。反応物を１００℃で８時間撹拌した後、反応液をＥｔＯＡｃで希釈し、精製水で洗浄した。有機層を無水$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、８３ｍｇの４－（３－アミノフェニル）－２－ベンジルフタラジン－１（２Ｈ）－オンを収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３２８．２（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１２６】
段階３：段階２から収得した化合物（５０ｍｇ、０．１５ｍｍｏｌ）を実施例１の段階２と同じ方法で反応させて、３４ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２０．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１２７】
実施例６２：Ｎ－（３－（４－オキソ－３－フェネチル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド
ベンジルブロミドの代わりに（２－ブロモエチル）ベンゼン（１４７μＬ、１．０８ｍｍｏｌ）を使って実施例６１と同じ方法で反応させて、６１ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４３４．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１２８】
実施例６３：Ｎ－（３－（３－（４－フルオロベンジル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド
ベンジルブロミドの代わりに１－（ブロモメチル）－４－フルオロベンゼン（１３５μＬ、１．０８ｍｍｏｌ）を使って実施例６１と同じ方法で反応させて、５７ｍｇの表題化

合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４３８．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１２９】
実施例６４：Ｎ－（３－（３－（［１，１’－ビフェニル］－４－イル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド
３－アミノフェニルボロン酸の代わりに［１，１’－ビフェニル］－４－イルボロン酸（５１３．２０ｍｇ、２．５９ｍｍｏｌ）を使って実施例１と同じ方法で反応させて、１３０ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４８２．２（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１３０】
実施例６５：Ｎ－（３－（３－（［１，１’－ビフェニル］－４－イル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルエタンスルホンアミド
実施例６４の化合物（６０ｍｇ、０．１０ｍｍｏｌ）を出発物質として使って実施例５と同じ方法で反応させて、５９ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４９６．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１３１】
実施例６６：メチル３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ベンゾアート
化合物Ｉ－２（１．００ｇ、３．６４ｍｍｏｌ）と（３－（メトキシカルボニル）フェニル）ボロン酸（８５１．７６ｍｇ、４．７３ｍｍｏｌ）を実施例１の段階１と同じ方法で反応させて、７８５ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３７４．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１３２】
実施例６７：Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）プロパン－２－スルホンアミド
化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、３－アミノフェニルボロン酸（５９ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）および２－プロパンスルホニルクロリド（４８μＬ、０．４３ｍｍｏｌ）を実施例１と同じ方法で反応させて、６７ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４３８．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１３３】
実施例６８：Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）プロパン－１－スルホンアミド
化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、３－アミノフェニルボロン酸（５９ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）および１－プロパンスルホニルクロリド（４８μＬ、０．４３ｍｍｏｌ）を実施例１と同じ方法で反応させて、６７ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４３８．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１３４】
実施例６９：Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンスルホンアミド
実施例１０の化合物（６０ｍｇ、０．１５ｍｍｏｌ）を出発物質として使って実施例５と同じ方法で反応させて、５６ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２４．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１３５】
実施例７０：Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルエタンスルホンアミド
実施例１１の化合物（６０ｍｇ、０．１４ｍｍｏｌ）を出発物質として使って実施例５と同じ方法で反応させて、５１ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４３８．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１３６】
実施例７１：Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒド

ロフタラジン－１－イル）フェニル）シクロプロパンスルホンアミド
化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、３－アミノフェニルボロン酸（５９ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびシクロプロパンスルホニルクロリド（４３μＬ、０．４３ｍｍｏｌ）を実施例１と同じ方法で反応させて、１２１ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４３６．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１３７】
実施例７２：Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルプロパン－１－スルホンアミド
実施例６８の化合物（３０ｍｇ、０．０７ｍｍｏｌ）を出発物質として使って実施例５と同じ方法で反応させて、２６ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４５２．２（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１３８】
実施例７３：Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルプロパン－２－スルホンアミド
実施例６７の化合物（３０ｍｇ、０．０７ｍｍｏｌ）を出発物質として使って実施例５と同じ方法で反応させて、２５ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４５２．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１３９】
実施例７４：Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルシクロプロパンスルホンアミド
実施例７１の化合物（３０ｍｇ、０．０７ｍｍｏｌ）を出発物質として使って実施例５と同じ方法で反応させて、２０ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４５０．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１４０】
実施例７５：Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチル－ジメチルスルファモイルアミド
実施例１２の化合物（３０ｍｇ、０．０７ｍｍｏｌ）を出発物質として使って実施例５と同じ方法で反応させて、２３ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４５３．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１４１】
実施例７６：メチル（Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルスルファモイル）（メチル）カルバマート
実施例２０の化合物（１５０ｍｇ、０．３２ｍｍｏｌ）を出発物質として使って実施例５と同じ方法で反応させて、１１７ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４９７．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１４２】
実施例７７：１，１，１－トリフルオロ－Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンスルホンアミド
化合物Ｉ－２（２００ｍｇ、０．７２ｍｍｏｌ）、３－アミノフェニルボロン酸（１１８ｍｇ、０．８６ｍｍｏｌ）およびトリフルオロメタンスルホン酸無水物（１４４μＬ、０．８６ｍｍｏｌ）を実施例１と同じ方法で反応させて、５６ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４６３．９（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１４３】
実施例７８：１，１，１－トリフルオロ－Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンスルホンアミド
実施例７７の化合物（３０ｍｇ、０．０７ｍｍｏｌ）を出発物質として使って実施例５と同じ方法で反応させて、１７ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４７７．９（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１４４】

実施例７９：３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－（（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル）オキシ）ベンズアミド

段階１：実施例６６の化合物（７５０ｍｇ、２．００ｍｍｏｌ）をＴＨＦ／ＭｅＯＨ／$H_2O$（１００ｍＬ、３：１：１の比率）に溶かした後。ＬｉＯＨ－$H_2O$（４２０ｍｇ、１０．０２ｍｍｏｌ）を加え、常温で３時間撹拌した。減圧濃縮した反応物は、ＥｔＯＡｃで希釈し、１Ｎ　ＨＣｌ水溶液で洗浄した後、無水$Na_2SO_4$で脱水させて、６６７ｍｇの３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）安息香酸を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３６１．０（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１４５】

段階２：段階１から収得した化合物（１５０ｍｇ、０．４２ｍｍｏｌ）をＤＣＭ（４ｍＬ）に溶かした後、ＤＩＰＥＡ（０．７ｍＬ、４．１６ｍｍｏｌ）、ＥＤＣＩ（１５９ｍｇ、０．８３ｍｍｏｌ）、ＨＯＢｔ（８４ｍｇ、０．６２ｍｍｏｌ）を加え、常温で１２時間撹拌した。反応物を減圧濃縮し、ＥｔＯＡｃで希釈後、精製水で洗浄した。有機層を無水$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、白色固体として１４４ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４６０．０（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１４６】

実施例８０：Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチル－メチルスルファモイルアミド

実施例７６の化合物（６３ｍｇ、０．１３ｍｍｏｌ）をＴＨＦ／ＭｅＯＨ／$H_2O$（５ｍＬ、３：１：１の比率）に溶かした後、ＬｉＯＨ－$H_2O$（１６ｍｇ、０．３８ｍｍｏｌ）を加え、常温で３時間撹拌した。生成された固体化合物をろ過した後、乾燥して、４０ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４３９．０（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１４７】

実施例８１：４－（３－（１Ｈ－テトラゾール－５－イル）フェニル）－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン

段階１：化合物Ｉ－２（２００ｍｇ、０．７２ｍｍｏｌ）と３－シアノフェニルボロン酸（１２７ｍｇ、０．８６ｍｍｏｌ）を実施例１の段階１と同じ方法で反応させて、２１４ｍｇの３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ベンゾニトリルを収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３４２．１（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１４８】

段階２：段階１から収得した化合物（１００ｍｇ、０．２９ｍｍｏｌ）、$NaN_3$（２３ｍｇ、０．３５ｍｍｏｌ）および$NH_4Cl$（１９ｍｇ、０．３５ｍｍｏｌ）をＤＭＦ（５ｍＬ）に入れ、１２０℃で１２時間撹拌した。０．５Ｎ　ＨＣｌ水溶液を入れて、反応溶液のｐＨを５～６に調節し、生成された結晶をろ過して、２４ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３８５．０（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１４９】

実施例８２：Ｎ－（５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピリジン－３－イル）エタンスルホンアミド

化合物Ｉ－２（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、（５－アミノピリジン－３－イル）ボロン酸（５９ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびエタンスルホニルクロリド（４０μＬ、０．４３ｍｍｏｌ）を実施例１と同じ方法で反応させて、４２ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２５．０（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１５０】

実施例８３：３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－ヒドロキシベンズアミド

実施例７９の化合物（１００ｍｇ、０．２２ｍｍｏｌ）にＭｅＯＨ（２０ｍＬ）とＴＦＡ（１０ｍＬ）を加えた後、常温で３時間撹拌した。反応生成物を減圧濃縮し、ＥｔＯＡｃに溶かした後、１Ｎ　ＨＣｌ水溶液で洗浄し、有機層を抽出した。減圧濃縮で有機溶媒を除去した後、少量のジエチルエーテルを加えた後、生成された固体化合物をろ過して、３７ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３７６．０（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１５１】

実施例８４：（Ｚ）－１－（３－（３－（［１，１’－ビフェニル］－４－イル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド

３－ホルミルフェニルボロン酸の代わりに［１，１’－ビフェニル］－４－イルボロン酸（１００ｍｇ、０．５０ｍｍｏｌ）を使って実施例１３と同じ方法で反応させて、３２ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４３２．１（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１５２】

実施例８５：（Ｚ）－１－（３－（３－（［１，１’－ビフェニル］－４－イル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド

Ｎ－エチルヒドロキシルアミンヒドロクロリドの代わりにＮ－イソプロピルヒドロキシルアミンヒドロクロリドを、３－ホルミルフェニルボロン酸の代わりに［１，１’－ビフェニル］－４－イルボロン酸（１００ｍｇ、０．５０ｍｍｏｌ）を使って実施例１６と同じ方法で反応させて、２４ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４６０．０（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１５３】

実施例８６：３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド

化合物Ｉ－２（８０ｍｇ、０．２９ｍｍｏｌ）、メチル３－ボロノベンゼンスルホンアミド（８１ｍｇ、０．３８ｍｍｏｌ）、Ｐｄ［Ｐｈ$_3$Ｐ］$_4$（３３ｍｇ、０．０３ｍｍｏｌ）およびＮａ$_2$ＣＯ$_3$（１２４ｍｇ、１．１７ｍｍｏｌ）を１，４－ジオキサン（１０ｍＬ）に加え、１１０℃で２時間撹拌した。反応生成物をＥｔＯＡｃで希釈し、精製水で洗った後、有機層を抽出した。分離した有機層を無水Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、９５ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４１０．１（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１５４】

実施例８７：Ｎ－エチル－３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ベンゼンスルホンアミド

エチル３－ボロノベンゼンスルホンアミド（８１ｍｇ、０．３８ｍｍｏｌ）を実施例８６と同じ方法で反応させて、８４ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２４．１（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１５５】

実施例８８：３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルベンゼンスルホンアミド

メチル３－ボロノベンゼンスルホンアミドの代わりにＮ，Ｎ－ジメチル３－ボロノベンゼンスルホンアミド（８１ｍｇ、０．３８ｍｍｏｌ）を使って実施例８６と同じ方法で反応させて、４７ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２４．０（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１５６】
実施例８９：２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン
化合物Ｉ－９（７７ｍｇ、０．１９ｍｍｏｌ）と（３－（メチルスルホニル）フェニル）ボロン酸（４９ｍｇ、０．２５ｍｍｏｌ）を実施例８６と同じ方法で反応させて、３４ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４１３．２（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１５７】
実施例９０：２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（エチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン
化合物Ｉ－９（７７ｍｇ、０．１９ｍｍｏｌ）と（３－（エチルスルホニル）フェニル）ボロン酸（５２ｍｇ、０．２５ｍｍｏｌ）を実施例８６と同じ方法で反応させて、３０ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２７．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１５８】
実施例９１：３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド
化合物Ｉ－９（７７ｍｇ、０．１９ｍｍｏｌ）と（３－（Ｎ－メチルスルファモイル）フェニル）ボロン酸（５２ｍｇ、０．２５ｍｍｏｌ）を実施例８６と同じ方法で反応させて、３７ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２７．９（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１５９】
実施例９２：３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－エチルベンゼンスルホンアミド
化合物Ｉ－９（７７ｍｇ、０．１９ｍｍｏｌ）と（３－（Ｎ－エチルスルファモイル）フェニル）ボロン酸（５６ｍｇ、０．２５ｍｍｏｌ）を実施例８６と同じ方法で反応させて、４４ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４４２．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１６０】
実施例９３：３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルベンゼンスルホンアミド
化合物Ｉ－９（７７ｍｇ、０．１９ｍｍｏｌ）と（３－（Ｎ，Ｎ－ジメチルスルファモイル）フェニル）ボロン酸（５６ｍｇ、０．２５ｍｍｏｌ）を実施例８６と同じ方法で反応させて、４４ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４４２．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１６１】
実施例９４：（Ｚ）－１－（３－（３－（２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド
化合物Ｉ－５（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、３－ホルミルフェニルボロン酸（６３ｍｇ、０．４２ｍｍｏｌ）およびＮ－メチルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（１４５ｍｇ、１．７５ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、５１ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３７４．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１６２】
実施例９５：（Ｚ）－１－（３－（３－（２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド
化合物Ｉ－５（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、３－ホルミルフェニルボロン酸（６３ｍｇ、０．４２ｍｍｏｌ）およびＮ－イソプロピルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（１９４ｍｇ、１．７５ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、３２ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４０２．０（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１６３】

実施例９６：（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（３－（３－（２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド

化合物Ｉ－５（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、３－ホルミルフェニルボロン酸（６３ｍｇ、０．４２ｍｍｏｌ）およびＮ－ｔｅｒｔ－ブチルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（２１８ｍｇ、１．７５ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、３０ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４１６．１（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１６４】

実施例９７：２－（２－フルオロフェニル）－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン

化合物Ｉ－５（５２ｍｇ、０．１９ｍｍｏｌ）と（３－（メチルスルホニル）フェニル）ボロン酸（４９ｍｇ、０．２５ｍｍｏｌ）を実施例８６と同じ方法で反応させて、３９ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３９５．０（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１６５】

実施例９８：４－（３－（エチルスルホニル）フェニル）－２－（２－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン

化合物Ｉ－５（５２ｍｇ、０．１９ｍｍｏｌ）と（３－（エチルスルホニル）フェニル）ボロン酸（５３ｍｇ、０．２５ｍｍｏｌ）を実施例８６と同じ方法で反応させて、４１ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４０８．８（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１６６】

実施例９９：３－（３－（２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド

化合物Ｉ－５（５２ｍｇ、０．１９ｍｍｏｌ）と（３－（Ｎ－メチルスルファモイル）フェニル）ボロン酸（５２ｍｇ、０．２５ｍｍｏｌ）を実施例８６と同じ方法で反応させて、２８ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４１０．０（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１６７】

実施例１００：Ｎ－エチル－３－（３－（２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ベンゼンスルホンアミド

化合物Ｉ－５（５２ｍｇ、０．１９ｍｍｏｌ）と（３－（Ｎ－エチルスルファモイル）フェニル）ボロン酸（５６ｍｇ、０．２５ｍｍｏｌ）を実施例８６と同じ方法で反応させて、３６ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２３．８（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１６８】

実施例１０１：３－（３－（２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルベンゼンスルホンアミド

化合物Ｉ－５（５２ｍｇ、０．１９ｍｍｏｌ）と（３－（Ｎ，Ｎ－ジメチルスルファモイル）フェニル）ボロン酸（５６ｍｇ、０．２５ｍｍｏｌ）を実施例８６と同じ方法で反応させて、３０ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２４．１（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１６９】

実施例１０２：（Ｚ）－１－（３－（３－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド

化合物Ｉ－１０（１４０ｍｇ、０．３４ｍｍｏｌ）、３－ホルミルフェニルボロン酸（６４ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびＮ－メチルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（１

５０ｍｇ、１．８０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、４５ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３９２．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１７０】
実施例１０３：（Ｚ）－１－（３－（３－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド
化合物Ｉ－１０（１４０ｍｇ、０．３４ｍｍｏｌ）、３－ホルミルフェニルボロン酸（６４ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびＮ－イソプロピルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（２００ｍｇ、１．８０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、３９ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２０．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１７１】
実施例１０４：（Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（３－（３－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド
化合物Ｉ－１０（１４０ｍｇ、０．３４ｍｍｏｌ）、３－ホルミルフェニルボロン酸（６４ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）およびＮ－ｔｅｒｔ－ブチルヒドロキシルアミンヒドロクロリド（２２５ｍｇ、１．８０ｍｍｏｌ）を実施例１３と同じ方法で反応させて、３６ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４３４．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１７２】
実施例１０５：２－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン
化合物Ｉ－１０（７０ｍｇ、０．１７ｍｍｏｌ）と（３－（メチルスルホニル）フェニル）ボロン酸（４９ｍｇ、０．２５ｍｍｏｌ）を実施例８６と同じ方法で反応させて、３０ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４１３．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１７３】
実施例１０６：２－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－（３－（エチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン
化合物Ｉ－１０（７０ｍｇ、０．１７ｍｍｏｌ）と（３－（エチルスルホニル）フェニル）ボロン酸（５３ｍｇ、０．２５ｍｍｏｌ）を実施例８６と同じ方法で反応させて、４８ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２７．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１７４】
実施例１０７：３－（３－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド
化合物Ｉ－１０（７０ｍｇ、０．１７ｍｍｏｌ）と（３－（Ｎ－メチルスルファモイル）フェニル）ボロン酸（５３ｍｇ、０．２５ｍｍｏｌ）を実施例８６と同じ方法で反応させて、３９ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２８．２（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１７５】
実施例１０８：３－（３－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－エチルベンゼンスルホンアミド
化合物Ｉ－１０（７０ｍｇ、０．１７ｍｍｏｌ）と（３－（Ｎ－エチルスルファモイル）フェニル）ボロン酸（５７ｍｇ、０．２５ｍｍｏｌ）を実施例８６と同じ方法で反応させて、４６ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４４２．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１７６】

実施例１０９：３－（３－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルベンゼンスルホンアミド

化合物Ｉ－１０（７０ｍｇ、０．１７ｍｍｏｌ）と（３－（Ｎ，Ｎ－ジメチルスルファモイル）フェニル）ボロン酸（５７ｍｇ、０．２５ｍｍｏｌ）を実施例８６と同じ方法で反応させて、３０ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４４２．１（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１７７】

実施例１１０：６－フルオロ－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）－２－フェニルフタラジン－１（２Ｈ）－オン

化合物Ｉ－１１（７０ｍｇ、０．２６ｍｍｏｌ）と（３－（メチルスルホニル）フェニル）ボロン酸（６６ｍｇ、０．３３ｍｍｏｌ）を実施例８６と同じ方法で反応させて、９１ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３９５．０（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１７８】

実施例１１１：３－（７－フルオロ－４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド

化合物Ｉ－１１（７０ｍｇ、０．２６ｍｍｏｌ）と（３－（Ｎ－メチルスルファモイル）フェニル）ボロン酸（７１ｍｇ、０．３３ｍｍｏｌ）を実施例８６と同じ方法で反応させて、４４ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４１０．０（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１７９】

実施例１１２：７－フルオロ－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）－２－フェニルフタラジン－１（２Ｈ）－オン

化合物Ｉ－１２（７０ｍｇ、０．２６ｍｍｏｌ）と（３－（メチルスルホニル）フェニル）ボロン酸（６６ｍｇ、０．３３ｍｍｏｌ）を実施例８６と同じ方法で反応させて、８４ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３９５．０（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１８０】

実施例１１３：３－（６－フルオロ－４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド

化合物Ｉ－１２（７０ｍｇ、０．２６ｍｍｏｌ）と（３－（Ｎ－メチルスルファモイル）フェニル）ボロン酸（７１ｍｇ、０．３３ｍｍｏｌ）を実施例８６と同じ方法で反応させて、５１ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４１０．０（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１８１】

実施例１１４：３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピリジン１－オキシド

段階１：化合物Ｉ－２（１７３ｍｇ、０．６３ｍｍｏｌ）と３－ピリジニルボロン酸（１４１ｍｇ、０．９４ｍｍｏｌ）を実施例１の段階１と同じ方法で反応させて、９４ｍｇの２－（４－フルオロフェニル）－４－（ピリジン－３－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンを収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３１８．０（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１８２】

段階２：段階１から収得した化合物（７４ｍｇ、０．２６ｍｍｏｌ）をＤＣＭ（４０ｍＬ）に溶かした後、ｍＣＰＢＡ（１３６ｍｇ、０．７９ｍｍｏｌ）を加え、常温で４時間撹拌した。反応液をＥｔＯＡｃで希釈して、精製水で洗浄し、有機層を無水$Na_2SO_4$で脱水させた後、カラムクロマトグラフィーで分離して、４６ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３３４．０（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０１８３】

実施例１１５：２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（ピリジン－３－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン

化合物Ｉ－９（１８０ｍｇ、０．４４ｍｍｏｌ）と３－ピリジニルボロン酸（９９ｍｇ、０．６６ｍｍｏｌ）を実施例１の段階１と同じ方法で反応させて、８５ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３３６．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０１８４】

実施例１１６：２－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－（ピリジン－３－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン

化合物Ｉ－１０（１８０ｍｇ、０．４４ｍｍｏｌ）と３－ピリジニルボロン酸（９９ｍｇ、０．６６ｍｍｏｌ）を実施例１の段階１と同じ方法で反応させて、９６ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３３６．２（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０１８５】

実施例１１７：３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピリジン１－オキシド

実施例１１５の化合物（７０ｍｇ、０．２１ｍｍｏｌ）を実施例１１４の段階２と同じ方法で反応させて、６０ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３５２．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０１８６】

実施例１１８：３－（３－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピリジン１－オキシド

実施例１１６の化合物（７０ｍｇ、０．２１ｍｍｏｌ）を実施例１１４の段階２と同じ方法で反応させて、５４ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３５２．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０１８７】

実施例１１９：２－（２，４－ジフルオロフェニル）－６－フルオロ－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン

化合物Ｉ－１３（７０ｍｇ、０．１６ｍｍｏｌ）と（３－（メチルスルホニル）フェニル）ボロン酸（４２ｍｇ、０．２１ｍｍｏｌ）を実施例８６と同じ方法で反応させて、３６ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４３１．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０１８８】

実施例１２０：２－（２，４－ジフルオロフェニル）－７－フルオロ－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン

化合物Ｉ－１４（７０ｍｇ、０．１６ｍｍｏｌ）と（３－（メチルスルホニル）フェニル）ボロン酸（４２ｍｇ、０．２１ｍｍｏｌ）を実施例８６と同じ方法で反応させて、３０ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４３１．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０１８９】

実施例１２１：３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－７－フルオロ－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド

化合物Ｉ－１３（７０ｍｇ、０．１６ｍｍｏｌ）と（３－（Ｎ－メチルスルファモイル）フェニル）ボロン酸（４５ｍｇ、０．２１ｍｍｏｌ）を実施例８６と同じ方法で反応させて、９ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４４６．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０１９０】

実施例１２２：３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－６－フルオロ－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド

化合物Ｉ－１４（７０ｍｇ、０．１６ｍｍｏｌ）と（３－（Ｎ－メチルスルファモイル

）フェニル）ボロン酸（４５ｍｇ、０．２１ｍｍｏｌ）を実施例８６と同じ方法で反応させて、３９ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４４６．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１９１】
実施例１２３：２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（エチルスルホニル）フェニル）－６－フルオロフタラジン－１（２Ｈ）－オン
化合物Ｉ－１３（７０ｍｇ、０．１６ｍｍｏｌ）と（３－（エチルスルホニル）フェニル）ボロン酸（４５ｍｇ、０．２１ｍｍｏｌ）を実施例８６と同じ方法で反応させて、２６ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４４５．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１９２】
実施例１２４：３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－７－フルオロ－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－エチルベンゼンスルホンアミド
化合物Ｉ－１３（７０ｍｇ、０．１６ｍｍｏｌ）と（３－（Ｎ－エチルスルホニル）フェニル）ボロン酸（４９ｍｇ、０．２１ｍｍｏｌ）を実施例８６と同じ方法で反応させて、１８ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４６０．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１９３】
実施例１２５：３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－７－フルオロ－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルベンゼンスルホンアミド
化合物Ｉ－１３（７０ｍｇ、０．１６ｍｍｏｌ）と（３－（Ｎ，Ｎ－ジメチルスルホニル）フェニル）ボロン酸（４９ｍｇ、０．２１ｍｍｏｌ）を実施例８６と同じ方法で反応させて、２８ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４６０．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１９４】
実施例１２６：３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ベンゼンスルホンアミド
化合物Ｉ－９（７０ｍｇ、０．１７ｍｍｏｌ）と（３－スルファモイルフェニル）ボロン酸（５２ｍｇ、０．２６ｍｍｏｌ）を実施例８６と同じ方法で反応させて、４４ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４１４．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１９５】
実施例１２７：３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）ベンゼンスルホンアミド
化合物Ｉ－９（７０ｍｇ、０．１７ｍｍｏｌ）と（３－（Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）スルファモイル）フェニル）ボロン酸（６３ｍｇ、０．２６ｍｍｏｌ）を実施例８６と同じ方法で反応させて、５１ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４５８．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１９６】
実施例１２８：Ｎ－（３－（３－シクロヘキシル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド
段階１：４－ブロモフタラジン－１（２Ｈ）－オン（３００ｍｇ、１．３３３ｍｍｏｌ）と$K_2CO_3$（３６８ｍｇ、２．６７ｍｍｏｌ）をＤＭＦ（４．４ｍＬ）で希釈した後、ブロモシクロヘキサン（３２６ｍｇ、２．００ｍｍｏｌ）を加え、１００℃で２４時間撹拌した。反応液を常温に冷却した後、ＥＡで希釈して、精製水で洗浄した。有機層を$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、白色固体として１０８．７ｍｇの４－ブロモ－２－シクロヘキシルフタラジン－１（２Ｈ）－オンを収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝１０７．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０１９７】

段階２：段階１から収得した化合物（１０５ｍｇ、０．３４２ｍｍｏｌ）と（３－アミノフェニル）ボロン酸（５１．５ｍｇ、０．３７６ｍｍｏｌ）を実施例１の段階１と同じ方法で反応させて、白色固体として６０．１ｍｇの４－（３－アミノフェニル）－２－シクロヘキシルフタラジン－１（２Ｈ）－オンを収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３２０．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０１９８】

段階３：段階２から収得した化合物（３２ｍｇ、０．１００ｍｍｏｌ）をピリジンに溶解させた後、０から５℃の間に冷却し、エタンスルホニルクロリド（１１．３９μＬ、０．１２０ｍｍｏｌ）を５分間滴加した後、常温で２時間撹拌した。反応液をＥＡで希釈させた後、飽和ＣｕＳＯ$_4$水溶液で４～５回洗浄した。有機層をＮａ$_2$ＳＯ$_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、白色固体として３１．３ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４１２．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０１９９】

実施例１２９：Ｎ－（３－（３－（１－メチルピペリジン－４－イル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド

ブロモシクロヘキサンの代わりに４－ブロモ－１－メチルピペリジン（３５６ｍｇ、２．００ｍｍｏｌ）を使って実施例１２８と同じ方法で反応させて、白色固体として３４ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２７．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２００】

実施例１３０：３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ベンゾニトリル

化合物Ｉ－２（１４７ｍｇ、０．４６１ｍｍｏｌ）と（３－シアノフェニル）ボロン酸（７４．５，ｍｇ、０．５０７ｍｍｏｌ）を実施例１の段階１と同じ方法で反応させて、白色固体として７１ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３４２．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２０１】

実施例１３１：（Ｅ）－３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ’－ヒドロキシベンズイミドアミド

実施例１３０の化合物（２０ｍｇ、０．０５９ｍｍｏｌ）とヒドロキシルアミンヒドロクロリド（４．８９ｍｇ、０．０７０ｍｍｏｌ）、ＮａＨＣＯ$_3$（７．３８ｍｇ、０．０８８ｍｍｏｌ）をＥｔＯＨ（５８５μＬ）に溶解させて、８０℃で３時間撹拌した。反応液を常温に冷却した後、水を添加して、析出された固体をろ過および蒸留水で洗浄した。ろ過した固体をＤＣＭ、ＭｅＯＨを使って結晶化および乾燥して、白色固体として６．４ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３７５．２（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２０２】

実施例１３２：Ｎ－（３－（３－イソプロピル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド

ブロモシクロヘキサンの代わりに２－ヨードプロパン（３４０ｍｇ、２．００ｍｍｏｌ）を使って実施例１２８と同じ方法で反応させて、白色固体として４５ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３７２．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２０３】

実施例１３３：Ｎ－（３－（３－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド

ブロモシクロヘキサンの代わりに（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ボロン酸（２５２ｍｇ、２．００ｍｍｏｌ）を使って実施例１２８と同じ方法で反応させて、白色固体として４５ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４１０．１（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０２０４】

実施例１３４：４－（３－アミノピペリジン－１－イル）－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド

段階１：化合物Ｉ－２（７０ｍｇ、０．２１９ｍｍｏｌ）とｔｅｒｔ－ブチルピペリジン－３－イルカルバマート（５２．７ｍｇ、０．２６３ｍｍｏｌ）、ＸＰｈｏｓ（９０ｍｇ、０．９４０ｍｍｏｌ）およびＮａＯｔＢｕ（９０ｍｇ、０．９４０ｍｍｏｌ）をトルエン（１．０４ｍＬ）で希釈した後、$Pd_2(dba)_3$を加え、１２０℃で１時間マイクロ波反応装置で反応させた。反応液を常温に冷却した後、ＥＡで希釈して、精製水で洗浄した。有機層を$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、白色固体として４７ｍｇのｔｅｒｔ－ブチル（１－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）カルバマートを収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４３９．１（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０２０５】

段階２：段階１から収得した化合物（５０ｍｇ、０．１１４ｍｍｏｌ）をＤＣＭ（３８０μＬ）に溶解させた後、０℃で４Ｍ　ＨＣｌジオキサン溶液（８５５μＬ）をゆっくり加え、常温で２時間撹拌した。反応液を濃縮した後、析出された固体をろ過し、エーテルで洗浄後、乾燥して、淡黄色固体として４３ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３３９．１（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０２０６】

実施例１３５：Ｎ－（１－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）エタンスルホンアミド

実施例１３４の化合物（２０ｍｇ、０．０５３ｍｍｏｌ）を実施例１２８の段階３と同じ方法で反応させて、白色固体として５．５ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４３１．１（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０２０７】

実施例１３６：Ｎ－（３－（３－（オキセタン－３－イル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド

ブロモシクロヘキサンの代わりに３－トシルオキセタン（７１ｍｇ、０．３３４ｍｍｏｌ）を使って実施例１２８と同じ方法で反応させて、淡黄色固体として５７ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３８６．１（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０２０８】

実施例１３７：Ｎ－（１－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピロリジン－３－イル）エタンスルホンアミド

Ｔｅｒｔ－ブチルピロリジン－３－イルカルバマート（１４０ｍｇ、０．７５２ｍｍｏｌ）と化合物Ｉ－２（２００ｍｇ、０．６２７ｍｍｏｌ）を実施例１３４、引き続いて実施例１２８の段階３と同じ方法で反応させて、淡黄色５５ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４１７．０（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０２０９】

実施例１３８：（Ｓ）－Ｎ－（１－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）エタンスルホンアミド

Ｔｅｒｔ－ブチル（ｓ）－（１－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）カルバマート（１０２ｍｇ、０．２３３ｍｍｏｌ）と化合物Ｉ－２（１５０ｍｇ、０．４７０ｍｍｏｌ）を実施例１３７と同じ方法で反応させて、白色固体として２５ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４３１．１（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０２１０】

実施例１３９：（Ｒ）－Ｎ－（１－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，

４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）エタンスルホンアミド
Ｔｅｒｔ－ブチル（Ｒ）－（１－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）カルバマート（１１３ｍｇ、０．５６４ｍｍｏｌ）と化合物Ｉ－２（１５０ｍｇ、０．４７０ｍｍｏｌ）を実施例１３７と同じ方法で反応させて、白色固体として１４ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４３１．１（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）
【０２１１】
実施例１４０：Ｎ－（３－（３－（４，４－ジフルオロシクロヘキシル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド
段階１：４－ブロモフタラジン－１（２Ｈ）－オン（５０ｍｇ、０．２２２ｍｍｏｌ）と４，４－ジフルオロシクロヘキサン－１－オール（３６．６ｍｇ、０．２６７ｍｍｏｌ）をＴＨＦ（７４１μＬ）に溶解させた後、０℃でＰＰｈ$_3$（８７ｍｇ、０．３３３ｍｍｏｌ）とＤＩＡＤ（６７．４ｍｇ、０．３３３ｍｍｏｌ）を加え、常温で１時間撹拌した。反応液をＥＡで希釈して、精製水で洗浄した。有機層を$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、白色固体として４９．５ｍｇの４－ブロモ－２－（４，４－ジフルオロシクロヘキシル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンを収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３４３．０（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）
【０２１２】
段階２：段階１から収得した化合物（１５０ｍｇ、０．４３７ｍｍｏｌ）を実施例１２８の段階２および３と同じ方法で反応させて、淡黄土色固体として１８．６ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４４８．１（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）
【０２１３】
実施例１４１：Ｎ－（１－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）アゼパン－３－イル）エタンスルホンアミド
Ｔｅｒｔ－ブチルアゼパン－３－イルカルバマート（１２１ｍｇ、０．５６４ｍｍｏｌ）と化合物Ｉ－２（１５０ｍｇ、０．４７０ｍｍｏｌ）を実施例１３７と同じ方法で反応させて、白色固体として１５．６ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４４５．１（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）
【０２１４】
実施例１４２：３－（３－シクロヘキシル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ベンゼンスルホンアミド
実施例１２８の段階１から収得した化合物（１５６ｍｇ、０．５０８ｍｍｏｌ）と（３－スルファモイルフェニル）ボロン酸（１２２ｍｇ、０．６１０ｍｍｏｌ）を実施例１２８の段階２と同じ方法で反応させて、白色固体として２０ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３８４．０（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）
【０２１５】
実施例１４３：４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－シクロヘキシルフタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド
４－ブロモ－２－シクロヘキシルフタラジン－１（２Ｈ）－オン（１３２ｍｇ、０．４３０ｍｍｏｌ）とｔｅｒｔ－ブチルアゼパン－３－イルカルバマート（１１１ｍｇ、０．５１６ｍｍｏｌ）を実施例１３４と同じ方法で反応させて、アイボリー色固体として５５．８ｍｇの標識化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３４１．０（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）
【０２１６】
実施例１４４：Ｎ－（１－（３－シクロヘキシル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）アゼパン－３－イル）エタンスルホンアミド
実施例１４３の化合物（３０ｍｇ、０．０８０ｍｍｏｌ）を実施例１２８の段階３と同じ方法で反応させて、白色固体として１８ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４３３．２（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２１７】

実施例１４５：Ｎ－（３－（３－（４－メチルシクロヘキシル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド

１－ブロモ－４－メチルシクロヘキサン（５９０ｍｇ、３．３３ｍｍｏｌ）と４－ブロモフタラジン－１（２Ｈ）－オン（５００ｍｇ、２．２２ｍｍｏｌ）を実施例１２８と同じ方法で反応させて、淡黄色固体として１５．８ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２６．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２１８】

実施例１４６：（Ｓ）－４－（３－アミノピペリジン－１－イル）－２－シクロヘキシルフタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド

４－ブロモ－２－シクロヘキシルフタラジン－１（２Ｈ）－オン（１４０ｍｇ、０．４５６ｍｍｏｌ）とｔｅｒｔ－ブチル（Ｓ）－ピペリジン－３－イルカルバマート（１１０ｍｇ、０．５４７ｍｍｏｌ）を実施例１３４と同じ方法で反応させて、白色固体として８７ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３２７．２（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２１９】

実施例１４７：（Ｓ）－Ｎ－（１－（３－シクロヘキシル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）エタンスルホンアミド

実施例１４６の化合物（３０ｍｇ、０．０８３ｍｍｏｌ）を実施例１２８の段階３と同じ方法で反応させて、淡黄色化合物として６ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４１９．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２２０】

実施例１４８：４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド

化合物Ｉ－２（１５０ｍｇ、０．４７０ｍｍｏｌ）とｔｅｒｔ－ブチルアゼパン－３－イルカルバマート（１２１ｍｇ、０．５６４ｍｍｏｌ）を実施例１３４と同じ方法で反応させて、黄土色固体として９ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３５３．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２２１】

実施例１４９：Ｎ－（３－（２－（４－フルオロフェニル）－１－オキソ－１，２－ジヒドロピリド［３，４－ｄ］ピリジン－４－イル）フェニル）エタンスルホンアミド

段階１：２－（４－フルオロフェニル）－１－オキソ－１，２－ジヒドロピリド［３，４－ｄ］ピリダジン－４－イルトリフルオロメタンスルホナート（６４ｍｇ、０．１６４ｍｍｏｌ）、（３－アミノフェニル）ボロン酸（２４．７７ｍｇ、０．１８１ｍｍｏｌ）、リチウムクロリド（２０．９１ｍｇ、０．４９３ｍｍｏｌ）、Ｐｄ（ＰＰｈ$_3$）$_4$（１９ｍｇ、０．０１６ｍｍｏｌ）と２Ｍ　Ｎａ$_2$ＣＯ$_3$水溶液（２４７μＬ、０．４９３ｍｍｏｌ）をトルエン１．６ｍＬで希釈し、１００～１１０℃で３時間撹拌した。反応液を常温に冷却した後、ＥＡで希釈して、精製水で洗浄した。有機層をＮａ$_2$ＳＯ$_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、淡黄色固体として３５ｍｇの４－（３－アミノフェニル）－２－（４－フルオロフェニル）ピリド［３，４－ｄ］ピリダジン－１（２Ｈ）－オンを収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３３３．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２２２】

段階２：段階１から収得した化合物（３５ｍｇ、０．１０５ｍｍｏｌ）を実施例１２８の段階３と同じ方法で反応させて、淡黄色固体として１６ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２５．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２２３】

実施例１５０：Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－８－メチル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド

段階１：４－メチルイソベンゾフラン－１，３－ジオン（５００ｍｇ、３．０８ｍｍｏｌ）と（３－アミノフェニル）ボロン酸（６０２ｍｇ、３．７ｍｍｏｌ）を製造例４と同様の方法で反応させて、白色固体として２８１ｍｇの３－（４－フルオロフェニル）－８－メチル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イルトリフルオロメタンスルホナートを収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４０３．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２２４】

段階２：段階１から収得した化合物（７６ｍｇ、０．１８９ｍｍｏｌ）を実施例１４９と同じ方法で反応させて、白色固体として２９ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４３８．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２２５】

実施例１５１：Ｎ－（３－（４－オキソ－３－（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－４－イル）－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド

ブロモシクロヘキサンの代わりに４－ヨードテトラヒドロ－２Ｈ－ピラン（３００ｍｇ、１．３３３ｍｍｏｌ）を使って実施例１２８と同じ方法で反応させて、白色固体として３４ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２７．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２２６】

実施例１５２：２－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロピオン酸

段階１：化合物Ｉ－２（１１０ｍｇ、０．３４５ｍｍｏｌ）とメチル２－メチル－２－（３－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）フェニル）プロピオネート（１１５ｍｇ、０．０．３７９ｍｍｏｌ）を実施例１の段階１と同じ方法で反応させて、白色固体として８２ｍｇのメチル２－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロピオネートを収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４１７．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２２７】

段階２：段階１から収得した化合物（８２ｍｇ、０．１９７ｍｍｏｌ）と２Ｍ　ＮａＯＨ水溶液（１４８μＬ、０．２９５ｍｍｏｌ）をＭｅＯＨとＴＨＦで希釈した後、４０℃で２時間撹拌した。反応液を濃縮した後、精製水を加え、１Ｎ　ＨＣｌを用いてｐＨ６～７に調節した後、ＤＣＭで抽出した。有機層を$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、ジエチルエーテルで結晶化して、白色固体として５０ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４０３．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２２８】

実施例１５３：２－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ，２－ジメチルプロパンアミド

実施例１５２の化合物（４４ｍｇ、０．１０９ｍｍｏｌ）、メチルアミンＨＣｌ（８．８６ｍｇ、０．１３１ｍｍｏｌ）およびＤＩＰＥＡ（５７．３μＬ、０．３２８ｍｍｏｌ）をＤＭＦ（０．４ｍＬ）で希釈し、０～５℃に冷却した後、ＰｙＢＯＰ（８５ｍｇ、０．１６４ｍｍｏｌ）を加え、徐々に常温に昇温しつつ、１８時間撹拌した。反応液をＥＡで希釈して、精製水で洗浄した後、有機層を$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、白色固体として２２ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４１６．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２２９】

実施例１５４：２－シクロヘキシル－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン

４－ブロモ－２－シクロヘキシルフタラジン－１（２Ｈ）－オン（１９ｍｇ、０．０６２ｍｍｏｌ）と（３－（メチルスルホニル）フェニル）ボロン酸（１４．８５ｍｇ、０．０７４ｍｍｏｌ）を実施例１２８の段階２と同じ方法で反応させて、白色固体として１４

ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３８３．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０２３０】
実施例１５５：（Ｓ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－シクロヘキシルフタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド
４－ブロモ－２－シクロヘキシルフタラジン－１（２Ｈ）－オン（２５０ｍｇ、０．８１４ｍｍｏｌ）とｔｅｒｔ－ブチル（Ｓ）－アゼパン－３－イルカルバマート（２０９ｍｇ、０．９７７ｍｍｏｌ）を実施例１３４と同じ方法で反応させて、白色固体として１０８ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３４１．２（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０２３１】
実施例１５６：（Ｓ）－２－シクロヘキシル－４－（３－（メチルアミノ）アゼパン－１－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド
段階１：４－ブロモ－２－シクロヘキシルフタラジン－１（２Ｈ）－オン（２５０ｍｇ、０．８１４ｍｍｏｌ）とｔｅｒｔ－ブチル（Ｓ）－アゼパン－３－イルカルバマート（２０９ｍｇ、０．９７７ｍｍｏｌ）を実施例１３４の段階１と同じ方法で反応させて、白色固体として１０８ｍｇのｔｅｒｔ－ブチル（Ｓ）－（１－（３－シクロヘキシル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）アゼパン－３－イル）カルバマートを収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４４１．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０２３２】
段階２：ＴＨＦで洗浄した６０％ＮａＨをＴＨＦ（２２１μＬ）で希釈して０℃に冷却させた後、段階１から収得した化合物（３０ｍｇ、０．０６６ｍｍｏｌ）を入れ、１２分間同じ温度で撹拌した。その後、ヨードメタン（３７．６ｍｇ、０．２６５ｍｍｏｌ）を０℃で加えた後、徐々に常温に温度を上げて４時間撹拌した。反応液をＥＡで希釈し、精製水で洗浄した。有機層を$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、黄色オイルとして２２．３ｍｇのｔｅｒｔ－ブチル（Ｓ）－（１－（３－シクロヘキシル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）アゼパン－３－イル）（メチル）カルバマートを収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４５４．９（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０２３３】
段階３：段階２から収得した化合物（２２ｍｇ、０．０４７ｍｍｏｌ）を実施例７の段階２と同じ方法で反応させて、白色固体として１１．６ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３５５．３（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０２３４】
実施例１５７：（Ｓ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド
段階１：化合物Ｉ－９（２２ｍｇ、０．０５４ｍｍｏｌ）とｔｅｒｔ－ブチル（Ｓ）－アゼパン－３－イルカルバマート（２９ｍｇ、０．１３５ｍｍｏｌ）をＤＭＳＯで希釈させた後、９０℃で１時間撹拌した。反応液を常温に冷却した後、ＥＡで希釈して、精製水で洗浄した。有機層を$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、白色固体として１４ｍｇのｔｅｒｔ－ブチル（Ｓ）－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）アゼパン－３－イル）カルバマートを収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４７１．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０２３５】
段階２：段階１から収得した化合物（１４ｍｇ、０．０３０ｍｍｏｌ）を実施例１３４の段階２と同じ方法で反応させて、淡褐色固体として２．２ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３７０．９（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０２３６】

実施例１５８：（Ｓ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド

ｔｅｒｔ－ブチル（Ｓ）－アゼパン－３－イルカルバマート（１６１ｍｇ、０．７５２ｍｍｏｌ）と化合物Ｉ－２（２００ｍｇ、０．６２７ｍｍｏｌ）を実施例１３４と同じ方法で反応させて、黄色固体として８．７ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３５３．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２３７】

実施例１５９：（Ｒ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－シクロヘキシルフタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド

４－ブロモ－２－シクロヘキシルフタラジン－１（２Ｈ）－オン（２５０ｍｇ、０．８１４ｍｍｏｌ）とｔｅｒｔ－ブチル（Ｒ）－アゼパン－３－イルカルバマート（２０９ｍｇ、０．９７７ｍｍｏｌ）を実施例１３４と同じ方法で反応させて、白色固体として１０８ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３４１．２（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２３８】

実施例１６０：２－（３－（３－シクロヘキシル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロピオン酸

４－ブロモ－２シクロヘキシルフタラジン－１（２Ｈ）－オン（２５０ｍｇ、０．８１４ｍｍｏｌ）と２－メチル－２－（３－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキソボロラン－２－イル）フェニル）プロピオネート（１３１ｍｇ、０．４３０ｍｍｏｌ）を実施例１５２と同じ方法で反応させて、白色固体として６２．１ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３９１．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２３９】

実施例１６１：３－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）オキサゾリジン－２－オン

段階１：化合物Ｉ－２（２５０ｍｇ、０．７８３ｍｍｏｌ）と（３－アミノフェニル）ボロン酸（１１８ｍｇ、０．８６２ｍｍｏｌ）を実施例１の段階１と同じ方法で反応させて、黄土色固体として８０ｍｇの４－（３－アミノフェニル）－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンを収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３３２．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２４０】

段階２：段階１から収得した化合物（３０ｍｇ、０．０９１ｍｍｏｌ）とエチレンカーボネート（３９．９ｍｇ、０．４５３ｍｍｏｌ）をＤＢＵ（１３．６５μＬ、０．０９１ｍｍｏｌ）で希釈した後、１００℃で３時間撹拌した。反応液を常温に冷却した後、ＤＣＭで希釈して、精製水で洗浄した。有機層を$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、淡黄色固体として２０．７ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４０２．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２４１】

実施例１６２：（Ｒ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド

化合物Ｉ－２（１５０ｍｇ、０．４７０ｍｍｏｌ）とｔｅｒｔ－ブチル（Ｒ）－アゼパン－３－イルカルバマート（１２１ｍｇ、０．５６４ｍｍｏｌ）を実施例１３４と同じ方法で反応させて、白色固体として８．５ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３５３．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２４２】

実施例１６３：２－（３－（３－シクロヘキシル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロパンアミド

実施例１６０の化合物（１４ｍｇ、０．０３６ｍｍｏｌ）とアンモニウムクロリド（２

．８８ｍｇ、０．０５４ｍｍｏｌ）を実施例１５３と同じ方法で反応させて、白色固体として８．６ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３９０．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０２４３】
実施例１６４：２－（３－（３－シクロヘキシル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ，２－ジメチルプロパンアミド
実施例１６０の化合物（１４ｍｇ、０．０３６ｍｍｏｌ）とメチルアミンヒドロクロリド（３．６３ｍｇ、０．０５４ｍｍｏｌ）を実施例１５３と同じ方法で反応させて、白色固体として９．２ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４０４．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０２４４】
実施例１６５：（Ｒ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド
化合物Ｉ－９（３００ｍｇ、０．７３８ｍｍｏｌ）とｔｅｒｔ－ブチル（Ｒ）－アゼパン－３－イルカルバマート（３９６ｍｇ、１．８４６ｍｍｏｌ）を実施例１５７と同じ方法で反応させて、淡黄色固体として１２１．７ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３７１．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０２４５】
実施例１６６：２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロピオン酸
化合物Ｉ－９（３００ｍｇ、０．７３８ｍｍｏｌ）と２－メチル－２－（３－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキソボロラン－２－イル）フェニル）プロピオネート（２４７ｍｇ、０．８１２ｍｍｏｌ）を実施例１５２と同じ方法で反応させて、白色固体として１６５ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２１．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０２４６】
実施例１６７：４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド
化合物Ｉ－９（５０ｍｇ、０．１２３ｍｍｏｌ）とｔｅｒｔ－ブチルアゼパン－３－イルカルバマート（６５．９ｍｇ、０．３０８ｍｍｏｌ）を実施例１５７と同じ方法で反応させて、白色固体として２２．９ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３７１．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０２４７】
実施例１６８：２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロパンニトリル
化合物Ｉ－９（４００ｍｇ、０．９８５ｍｍｏｌ）と２－メチル－２－（３－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキソボロラン－２－イル）フェニル）プロパンニトリル（２９４ｍｇ、１．０８３ｍｍｏｌ）を実施例１５２の段階１と同じ方法で反応させて、白色固体として３１１．５ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４０２．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０２４８】
実施例１６９：４－（３－（２－（１Ｈ－テトラゾール－５－イル）プロパン－２－イル）フェニル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン
実施例１６８の化合物（５０ｍｇ、０．１２５ｍｍｏｌ）、$NaN_3$（１０．５３ｍｇ、０．１６２ｍｍｏｌ）およびアンモニウムクロリド（９．９９ｍｇ、０．１８７ｍｍｏｌ）をＤＭＦで希釈した後、１００℃で１６時間撹拌した。反応液を常温に冷却した後、ＥＡで希釈して、精製水で洗浄した。有機層を$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、淡黄色固体として３．１ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４４５．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２４９】

実施例１７０：（Ｅ）－２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ’－ヒドロキシ－２－メチルプロパンイミドアミド

実施例１６８の化合物（１００ｍｇ、０．２４９ｍｍｏｌ）、$NaHCO_3$（４１．９ｍｇ、０．４９８ｍｍｏｌ）およびヒドロキシルアミンヒドロクロリド（２４．２３ｍｇ、０．３４９ｍｍｏｌ）をＥｔＯＨで希釈した後、８０℃で２７時間撹拌した。反応液を常温に冷却した後、ＥＡで希釈して、精製水で洗浄した。有機層を$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、白色固体として１１．４ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４３５．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２５０】

実施例１７１：２－（３－（３－（２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロピオン酸

製造例４の方法で製造した３－（２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イルトリフルオロメタンスルホナート（１００ｍｇ、０．２５８ｍｍｏｌ）と２－メチル－２－（３－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキソボロラン－２－イル）フェニル）プロピオネート（８６ｍｇ、０．２８３ｍｍｏｌ）を実施例１５２と同じ方法で反応させて、白色固体として３７．５ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４０３．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２５１】

実施例１７２：４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－シクロブチルフタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド

ブロモシクロヘキサンの代わりにブロモシクロブタンを使って実施例１２８の段階１の方法で製造した４－ブロモ－２－シクロブチルフタラジン－１（２Ｈ）－オン（１００ｍｇ、０．３５８ｍｍｏｌ）をｔｅｒｔ－ブチルアゼパン－３－イルカルバマート（９２ｍｇ、０．４３０ｍｍｏｌ）と実施例１５７と同じ方法で反応させて、淡黄色固体として１６．６ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３１３．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２５２】

実施例１７３：４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－シクロペンチルフタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド

ブロモシクロヘキサンの代わりにブロモシクロペンタンを使って実施例１２８の段階１の方法で製造した４－ブロモ－２－シクロペンチルフタラジン－１（２Ｈ）－オン（１００ｍｇ、０．３４１ｍｍｏｌ）をｔｅｒｔ－ブチルアゼパン－３－イルカルバマート（８８ｍｇ、０．４０９ｍｍｏｌ）と実施例１５７と同じ方法で反応させて、黄土色固体として２３ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３２７．２（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２５３】

実施例１７４：２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（２－（５－メチル－１，２，４－オキサジアゾール－３－イル）プロパン－２－イル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン

実施例１７０の化合物（４０ｍｇ、０．０９２ｍｍｏｌ）、ｐ－ＴｓＯＨ（５．２５ｍｇ、０．０２８ｍｍｏｌ）および$ZnCl_2$（３．７６ｍｍｏｌ、０．０２８ｍｍｏｌ）をＣＡＮで希釈した後、８２℃で１７時間撹拌した。反応液を常温に冷却した後、ＥＡで希釈して、精製水と飽和$NaHCO_3$水溶液で洗浄した。有機層を$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、白色固体として１２．５ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４５９．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２５４】
実施例１７５：（Ｒ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（２－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド
製造例４の方法で製造した３－（２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イルトリフルオロメタンスルホナート（１００ｍｇ、０．２５８ｍｍｏｌ）とｔｅｒｔ－ブチル（Ｒ）－アゼパン－３－イルカルバマート（１３８ｍｇ、０．６４４ｍｍｏｌ）を実施例１５７と同じ方法で反応させて、白色固体として２６．９ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３５３．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０２５５】
実施例１７６：２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピル－２－メチルプロパンアミド
実施例１６６の化合物（５０ｍｇ、０．１１９ｍｍｏｌ）とプロパン－２－アミンヒドロクロリド（１７．０５ｍｇ、０，１７８ｍｍｏｌ）を実施例１５３と同じ方法で反応させて、淡黄色固体として１６．４ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４６２．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０２５６】
実施例１７７：２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（２－メチル－１－オキソ－１－（ピロリジン－１－イル）プロパン－２－イル）フェニル）フタラジン－１（２）－オン
実施例１６６の化合物（５０ｍｇ、０．１１９ｍｍｏｌ）とピロリジン（１２．６９ｍｇ、０．１７８ｍｍｏｌ）を実施例１５３と同じ方法で反応させて、白色固体として３０．７ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４７４．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０２５７】
実施例１７８：Ｎ－シクロプロピル－２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロパンアミド
実施例１６６の化合物（５０ｍｇ、０．１１９ｍｍｏｌ）とシクロプロパンアミン（１０．１９ｍｇ、０．１７８ｍｍｏｌ）を実施例１５３と同じ方法で反応させて、淡黄色固体として７．８ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４６０．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０２５８】
実施例１７９：２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（２－メチル－１－モルホリノ－１－オキソプロパン－２－イル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン
実施例１６６の化合物（５０ｍｇ、０．１１９ｍｍｏｌ）とモルホリン（１５．５４ｍｇ、０．１７８ｍｍｏｌ）を実施例１５３と同じ方法で反応させて、白色固体として１０．１ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４９０．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０２５９】
実施例１８０：Ｎ－シクロヘキシル－２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロパンアミド
実施例１６６の化合物（５０ｍｇ、０．１１９ｍｍｏｌ）とシクロヘキサンアミン（１７．６９ｍｇ、０．１７８ｍｍｏｌ）を実施例１５３と同じ方法で反応させて、白色固体として３４．７ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝５０２．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０２６０】
実施例１８１：２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４

－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチル－Ｎ－フェニルプロパンアミド
実施例１６６の化合物（５０ｍｇ、０．１１９ｍｍｏｌ）とアニリン（１６．６１ｍｇ、０．１７８ｍｍｏｌ）を実施例１５３と同じ方法で反応させて、白色固体として１０．３ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４９６．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０２６１】
実施例１８２：２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチル－Ｎ－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）プロパンアミド
実施例１６６の化合物（５０ｍｇ、０．１１９ｍｍｏｌ）と１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－アミン（１７．３３ｍｇ、０．１７８ｍｍｏｌ）を実施例１５３と同じ方法で反応させて、淡い橙色固体として２２．８ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝５００．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０２６２】
実施例１８３：１－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）シクロプロパン－１－カルボン酸
化合物Ｉ－９（１２２ｍｇ、０．３０１ｍｍｏｌ）と１－（３－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）フェニル）シクロプロパン－１－カルボン酸（１００ｍｇ、０．３３１ｍｍｏｌ）を実施例１５２と同じ方法で反応させて、白色固体として４３．１ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４１９．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０２６３】
実施例１８４：４－（１，４－ジアゼパン－１－イル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド
化合物Ｉ－９（１００ｍｇ、０．２４６ｍｍｏｌ）とｔｅｒｔ－ブチル１，４－ジアゼパン－１－カルボキシレート（５９．２ｍｇ、０．２９５ｍｍｏｌ）を実施例１５７と同じ方法で反応させて、白色固体として５ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３９２．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０２６４】
実施例１８５：（Ｒ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（４－クロロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド
製造例２の方法で製造した３－（４－クロロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イルトリフルオロメタンスルホナート（１００ｍｇ、０．２４７ｍｍｏｌ）とｔｅｒｔ－ブチル（Ｒ）－アゼパン－３－イルカルバマート（６３．５ｍｇ、０．２９６ｍｍｏｌ）を実施例１５７と同じ方法で反応させて、白色固体として７２．５ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３６９．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０２６５】
実施例１８６：２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－２－メチルプロパンアミド
段階１：実施例１６６の化合物（１００ｍｇ、０．２３８ｍｍｏｌ）と２－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）エタン－１－アミン（６２．６ｍｇ、０．３５７ｍｍｏｌ）を実施例１５３と同じ方法で反応させて、５０ｍｇのＮ－（２－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）エチル）－２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフタル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロパンアミドを収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝５７７．７（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０２６６】
段階２：段階１から収得した化合物（５０ｍｇ、０．０８７ｍｍｏｌ）をＴＨＦ（４３

３μＬ）に溶解させた後、－５℃で１Ｍ　ＴＢＡＦ　ｉｎ　ＴＨＦ（１０４μＬ、０．１０４ｍｍｏｌ）を滴加した後、４０分間撹拌した。反応液に水（１０ｍＬ）を添加し、ＥＡで希釈して、精製水で洗浄した。有機層を$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、白色固体として１７ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４６４．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２６７】

実施例１８７：（Ｒ）－Ｎ－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）アゼパン－３－イル）エタンスルホンアミド

実施例１６５の化合物（５０ｍｇ、０．１２３ｍｍｏｌ）をＤＣＭ（４１０μＬ）に溶解させた後、０℃でＤＩＰＥＡ（６１．４μＬ、０．３６９ｍｍｏｌ）とエタンスルホニルクロリド（１８．６３μＬ、０．１９７ｍｍｏｌ）を滴加後、３時間常温で撹拌した。反応生成物をＥＡで希釈し、精製水で洗浄後、分離した有機層を無水$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、白色固体として１８．５ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４６３．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２６８】

実施例１８８：２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロパンアミド

実施例１６６の化合物（３３ｍｇ、０．０７８ｍｍｏｌ）とアンモニウムクロリド（６．３ｍｇ、０，１７８ｍｍｏｌ）を実施例１５３と同じ方法で反応させて、白色固体として１０．７ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２０．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２６９】

実施例１８９：（Ｒ）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（メチルアミノ）アゼパン－１－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド

段階１：実施例１６５の化合物（５０ｍｇ、０．１２３ｍｍｏｌ）をＤＭＦに溶解させた後、炭酸カルシウム（５１．０ｍｇ、０．３６９ｍｍｏｌ）とヨードメタン（１７．４４ｍｍｏｌ、０．１２３ｍｍｏｌ）を加えた後、５０℃で１８時間撹拌した。反応生成物をＥＡで希釈し、精製水で洗浄後、分離した有機層を無水$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、淡黄色固体として２０ｍｇのｔｅｒｔ－ブチル（Ｒ）－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）アゼパン－３－イル）（メチル）カルバマートを収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３８４．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２７０】

段階２：段階１から収得した化合物（２０ｍｇ、０．０５２ｍｍｏｌ）をＤＣＭに溶解させた後、４Ｍ　ＨＣｌ　ｉｎ　ｄｉｏｘａｎｅ（６５．０μＬ、０．２６０ｍｍｏｌ）を０℃でゆっくり滴加した後、１時間撹拌した。反応液を減圧濃縮して、淡黄色固体として７．８ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３８４．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２７１】

実施例１９０：２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－ヒドロキシアゼパン－１－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン

段階１：アゼパンオン（２００ｍｇ、１．７６７ｍｍｏｌ）をメタノールに溶解させた後、炭酸水素ナトリウム（６６．９ｍｇ、１．７６７ｍｍｏｌ）を０℃でゆっくり加えた後、常温で３時間撹拌した。応生成物を減圧濃し、水を加えた後、１Ｎ　ＨＣｌを用いてｐＨを８～９に調整した後、ＥＡで希釈し、精製水で洗浄した。有機層を無水$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、淡黄色オイルとして９８ｍｇのアゼパノールを収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝１１６．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２７２】

段階２：段階１から収得した化合物（２５ｍｇ、０．２１７ｍｍｏｌ）と３－（４－クロロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イルトリフルオロメタンスルホナート（７６．５ｍｇ、０．１８１ｍｍｏｌ）およびＤＩＰＥＡ（６３．２μＬ、０．３６２ｍｍｏｌ）を実施例１６５と同じ方法で反応させて、白色固体として３ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３７２．１（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０２７３】

実施例１９１：（Ｒ）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（（２－ヒドロキシエチル）アミノ）アゼパン－１－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド

段階１：実施例１６５の化合物（５０ｍｇ、０．１２３ｍｍｏｌ）をＤＭＦに溶解させた後、（２－ブロモエトキシ）（ｔｅｒｔ－ブチル）ジメチルシラン（３２．３ｍｇ、０．１３５ｍｍｏｌ）と炭酸セシウム（８０ｍｇ、０．２４６ｍｍｏｌ）を加えた後、５０℃で１６時間撹拌した。反応生成物をＥＡで希釈し、精製水で洗浄後、分離した有機層を無水$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、淡黄色オイルとして２６ｍｇの（Ｒ）－４－（３－（（２－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）エチル）アミノ）アゼパン－１－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンを収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝５２８．７（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０２７４】

段階２：段階１から収得した化合物（４４．４ｍｇ、０．０８４ｍｍｏｌ）をＤＣＭに溶解させた後、０℃で４Ｍ　ＨＣｌ　ｉｎ　ｄｉｏｘａｎｅ（８４０μＬ、３．３６ｍｍｏｌ）をゆっくり滴加して、常温で１時間半撹拌した。反応生成物に水を加えた後、$NaHCO_3$飽和溶液を用いてｐＨ９に調整した後、反応目的物をＥＡで抽出し、精製水で洗浄した。有機層を無水$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮して、淡黄色オイルとして２２．８ｍｇの（Ｒ）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（（２－ヒドロキシエチル）アミノ）アゼパン－１－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンを収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４１５．１（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０２７５】

段階３：段階２から収得した化合物（２２．８ｍｇ、０．０５５ｍｍｏｌ）を実施例１８９の段階２と同じ方法で反応させて、白色固体として１０．８ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４１５．１（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０２７６】

実施例１９２：（Ｒ）－Ｎ－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）アゼパン－３－イル）アセトアミド

実施例１６５の化合物（５０ｍｇ、０．１２３ｍｍｏｌ）とアセチルクロリドを実施例１８７と同じ方法で反応させて、白色固体として１２ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４１３．１（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０２７７】

実施例１９３：２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－オキソアゼパン－１－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン

実施例１９０の化合物（３８．５ｍｇ、０．１０４ｍｍｏｌ）をＤＣＭに溶解した後、０℃でデス－マーチンペルヨージナン（４４ｍｇ、０．１０４ｍｍｏｌ）を加えた後、常温で２３時間撹拌した。反応生成物をＤＣＭで希釈し、精製水で洗浄後、分離した有機層を無水$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、白色固体として５．７ｍｇの表題化合物を収得した

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３７０．１（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）

【０２７８】

実施例１９４：２－（３－（３－（４－クロロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒド

ロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロピオン酸

製造例２の方法で製造した３－（４－クロロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イルトリフルオロメタンスルホナート（４００ｍｇ、０．９８８ｍｍｏｌ）とメチル２－メチル－２－（３－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）フェニル）プロピオネート（３３１ｍｇ、１．０８７ｍｍｏｌ）を実施例１５２と同じ方法で反応させて、白色固体として２１９．７ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４１９．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２７９】

実施例１９５：１－（３－（３－（４－クロロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）シクロプロパン－１－カルボン酸

３－（４－クロロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イルトリフルオロメタンスルホナート（１００ｍｇ、０．２４７ｍｍｏｌ）とメチル１－（３－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）フェニル）シクロプロパン－１－カルボキシレート（８２ｍｇ、０．２７２ｍｍｏｌ）を実施例１５２と同じ方法で反応させて、白色固体として１３．５ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４１７．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２８０】

実施例１９６：２－（４－クロロフェニル）－４－（３－ヒドロキシアゼパン－１－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン

３－（４－クロロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イルトリフルオロメタンスルホナート（１７９ｍｇ、０．４４２ｍｍｏｌ）とアゼパノン（１０２ｍｇ、０．８８４ｍｍｏｌ）を実施例１９０と同じ方法で反応させて、淡黄色固体として４ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３７０．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２８１】

実施例１９７：２－（３－（３－（４－クロロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロパンアミド

実施例１９４の化合物（５０ｍｇ、０．１１９ｍｍｏｌ）を実施例１６３と同じ方法で反応させて、白色固体として３７．２ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４１８．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２８２】

実施例１９８：１－（３－（３－（４－クロロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）シクロプロパン－１－カルボキシアミド

実施例１９５の化合物（１１ｍｇ、０．０２６ｍｍｏｌ）を実施例１６３と同じ方法で反応させて、白色固体として６．７ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４１６．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２８３】

実施例１９９：２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）酢酸

化合物Ｉ－９（１００ｍｇ、０．２４６ｍｍｏｌ）とメチル２－（３－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）フェニル）アセテート（８２ｍｇ、０．２９５ｍｍｏｌ）を実施例１５２と同じ方法で反応させて、白色固体として３１．９ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３９３．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２８４】

実施例２００：４－（３－（２－アミノプロパン－２－イル）フェニル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド

段階１：化合物Ｉ－９（１９．７ｍｇ、０．０４８ｍｍｏｌ）と２－（３－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）フェニル）カルバマ

ート（２１ｍｇ、０．０５８ｍｍｏｌ）を実施例１５２と同じ方法で反応させて、白色固体として１４．５ｍｇのｔｅｒｔ－ブチル（２－（３－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）フェニル）プロパン－２－イル）カルバマートを収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４９２．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２８５】

段階２：段階１から収得した化合物（２１ｍｇ、０．０５８ｍｍｏｌ）を実施例１５７度の段階２と同じ方法で反応させて、白色固体として８．３ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３９３．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２８６】

実施例２０１：２－（３－（３－（４－クロロ－２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロピオン酸

製造例２の方法で製造した２－（４－クロロ－２－フルオロフェニル）－４－（（トリフルオロメチル）スルホニル）－３，４－ジヒドロフタラジン－１（２Ｈ）－オン（１００ｍｇ、０．２３７ｍｍｏｌ）を実施例１５２と同じ方法で反応させて、白色固体として３１．６ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４３７．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２８７】

実施例２０２：（Ｒ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（４－クロロ－２－フルオロフェニル）フタラジン－１－（２Ｈ）－オンヒドロクロリド

２－（４－クロロ－２－フルオロフェニル）－４－（（トリフルオロメチル）スルホニル）－３，４－ジヒドロフタラジン－１（２Ｈ）－オン（１００ｍｇ、０．２３７ｍｍｏｌ）を出発物質として使って実施例１５７と同じ方法で反応させて、白色固体として３８．７ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３８７．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２８８】

実施例２０３：１－（３－（４－クロロ－２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）アゼパン－３－カルボニトリル

２－（４－クロロ－２－フルオロフェニル）－４－（（トリフルオロメチル）スルホニル）－３，４－ジヒドロフタラジン－１（２Ｈ）－オン（１２７ｍｇ、０．３０１ｍｍｏｌ）とアゼパン－３－カルボニトリル（７４．７ｍｇ、０．６０２ｍｍｏｌ）を実施例１５７と同じ方法で反応させて、白色固体として５０．８ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３９７．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２８９】

実施例２０４：４－（３－（１－アミノ－２－メチルプロパン－２－イル）フェニル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド

段階１：実施例１６８の化合物（３０ｍｇ、０．０７５ｍｍｏｌ）をメタノールに溶解させた後、１０％Ｐｄ／Ｃ（１０ｍｇ、０．０７５ｍｍｏｌ）と４Ｍ　ＨＣｌ（２ｄｒｏｐ）を加えた後、水素（ｇ）で充填後、常温で１８時間撹拌した。反応生成物をＥＡで希釈した後、精製水で洗浄した。有機層を$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、淡褐色固体として５ｍｇの４－（３－（１－アミノ－２－メチルプロパン－２－イル）フェニル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンを収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４０６．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２９０】

段階２：段階１から収得した化合物（５ｍｇ、０．０１２ｍｍｏｌ）を実施例１５７の段階２と同じ方法で反応させて、淡褐色固体として１．１ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４０６．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２９１】

実施例２０５：２－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４

－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）－２－メチルプロピオン酸

段階１：化合物Ｉ－９（１００ｍｇ、０．２４６ｍｍｏｌ）とメチル２－メチル－２－（ピペリジン－３－イル）プロピオネート（９１ｍｇ、０．４９２ｍｍｏｌ）を実施例１５７と同じ方法で反応させて、淡黄色固体として４２．６ｍｇのメチル２－（１－３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－２－メチルプロピオネートを収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４４２．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２９２】

段階２：段階１から収得した化合物（４２．６ｍｇ、０．０９６ｍｍｏｌ）を実施例１５２の段階２と同じ方法で反応させて、淡黄色固体として６．２ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２８．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２９３】

実施例２０６：２－（３－（３－（４－シクロプロピルフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロピオン酸

段階１：４－ブロモフタラジン－１（２Ｈ）－オン（３００ｍｇ、１．３３３ｍｍｏｌ）と（４－シクロプロピルフェニル）ボロン酸（３２４ｍｇ、２．０ｍｍｏｌ）を実施例１２８と同じ方法で反応させて、白色固体として１１０ｍｇの４－ブロモ－２－（４－シクロプロピルフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンを収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３４２．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２９４】

段階２：段階１から収得した化合物（１１０ｍｇ、０．３２２ｍｍｏｌ）を実施例１５２と同じ方法で反応させて、白色固体として６２．８ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２５．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２９５】

実施例２０７：１－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）シクロブタン－１－カルボン酸

化合物Ｉ－９（１００ｍｇ、０．２４６ｍｍｏｌ）とメチル１－（３－ブロモフェニル）シクロブタン－１－カルボキシレート（９３ｍｇ、０．２９５ｍｍｏｌ）を実施例１５２と同じ方法で反応させて、淡黄色として７６．３ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４３３．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２９６】

実施例２０８：１－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）シクロペンタン－１－カルボン酸

化合物Ｉ－９（１００ｍｇ、０．２４６ｍｍｏｌ）とメチル１－（３（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，４－ジオキサボロラン－２－イル）フェニル）シクロペンタン－１－カルボキシレート（９８ｍｇ、０．２９５ｍｍｏｌ）を実施例１５２と同じ方法で反応させて、白色固体として７７．３ｍｇの表題化合物を収得した

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４４７．０（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２９７】

実施例２０９：２－（１－（３－（４－クロロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）－２－メチルプロピオン酸

実施例１９５の化合物（１００ｍｇ、０．２４７ｍｍｏｌ）とメチル２－メチル－２－（ピペリジン－３－イル）プロピオネートを実施例２０５と同じ方法で反応させて、淡いピンク色固体として３．５ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２６．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）

【０２９８】

実施例２１０－１および２：２－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）－２－メチルプロピオン酸

段階１：実施例２０９の化合物（１１７ｍｇ、０．２７４ｍｍｏｌ）をＴＨＦ（０．５５ｍＬ）に溶解させ、ＨＡＴＵ（１１４ｍｇ、０．３０１ｍｍｏｌ）とＤＩＰＥＡ（５７．４μＬ）を加えた後、３５℃で１時間撹拌した。他の反応容器にＴＨＦで洗浄した６０％ＮａＨをＴＨＦ（０．５５ｍＬ）で希釈して、０℃に冷却させた後、（Ｒ）－４－ベンジルオキサゾリジン－２－オン（１５０ｍｇ、０．８４９ｍｍｏｌ）を加えて３０分間撹拌した。この溶液を２－（１－（３－（４－クロロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）－２－メチルプロピオン酸が溶解している混合液に０℃で加えた後、１時間撹拌した。反応生成物をＥＡで抽出した後、蒸留水で３回洗浄した。有機層を$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、化合物ａ（ｕｐ　ｓｐｏｔ）およびｂ（ｄｏｗｎ　ｓｐｏｔ）（５－ベンジル－３－（２－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）－２－メチルプロパノイル）オキサゾリジン－２－オン）をそれぞれ淡黄色固体として５６ｍｇずつ収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝５８７．１（Ｍ＋$H^+$）

【０２９９】

段階２：段階１から収得した化合物ａ（ｕｐ　ｓｐｏｔ）（２４．９ｍｇ、０．０４２ｍｍｏｌ）をＴＨＦ：Ｗａｔｅｒ（４：１、０．２９ｍＬ：０．０７ｍＬ）に溶解させた後、０℃で３０％過酸化水素（１５．６９μＬ、０．５１４ｍｍｏｌ）を加えた後、１時間撹拌した。反応液を濃縮させた後、水を加えて、１Ｎ　ＨＣｌを用いてｐＨ２に調整した。反応生成物をＥＡで抽出し、蒸留水で洗浄した。有機層を$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮して、白色固体として７．９ｍｇの実施例２１０－１の化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２８．１（Ｍ＋$H^+$）

【０３００】

段階１から収得した化合物ｂ（ｄｏｗｎ　ｓｐｏｔ）（３２ｍｇ、０．０５５ｍｍｏｌ）を使って化合物ａと同じ方法で反応させて、白色固体として１２．７ｍｇの実施例２１０－２の化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２８．１（Ｍ＋$H^+$）

【０３０１】

<u>実施例２１１：メチル１－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）シクロプロパン－１－カルボキシレート</u>

化合物Ｉ－９（４２０ｍｇ、１．０３ｍｍｏｌ）、メチル１－（ピペリジン－３－イル）シクロプロパン－１－カルボキシレートヒドロクロリド（３０３ｍｇ、１．６５ｍｍｏｌ）およびＤＩＰＥＡ（０．３６ｍＬ、２．０７ｍｍｏｌ）をＴＨＦ（１５ｍＬ）に溶かした後、１１０℃で４８時間撹拌した。反応生成物をＥｔＯＡｃで希釈し、精製水で洗浄した。分離した有機層を無水$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、２７５ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４４０．０（Ｍ＋$H^+$）

【０３０２】

<u>実施例２１２：１－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）シクロプロパン－１－カルボン酸</u>

実施例２１１の化合物（１００ｍｇ、０．２３ｍｍｏｌ）を実施例１５２の段階２と同じ方法で反応させて、８７ｍｇの表題化合物を収得した。

ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２６．０（Ｍ＋$H^+$）

【０３０３】

<u>実施例２１３－１および２１３－２：１－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）シクロプロパン－１－カルボン酸</u>

実施例２１２の化合物（１６３ｍｇ、０．３８３ｍｍｏｌ）を使って実施例２１０と同

じ方法で反応させて、白色固体として２８．２ｍｇの実施例２１３－１と１１．８ｍｇの実施例２１３－２化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２６．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０３０４】
実施例２１４：２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（ピロリジン－１－イルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン
化合物Ｉ－９（１００ｍｇ、０．２５ｍｍｏｌ）と（３－（ピロリジン－１－イルスルホニル）フェニル）ボロン酸（７１ｍｇ、０．２８ｍｍｏｌ）、Ｐｄ（ＰＰｈ$_3$）$_4$（３０ｍｇ、０．０２ｍｍｏｌ）、Ｎａ$_2$ＣＯ$_3$（１３０ｍｇ、１．２３ｍｍｏｌ）を１，４－ジオキサン／蒸留水（１０ｍＬ、１：１の比率）に入れた後、１００℃で５時間撹拌した。反応生成物をＥｔＯＡｃで希釈し、精製水で洗浄した。分離した有機層を無水Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、５５ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４６８．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０３０５】
実施例２１５：２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド
段階１：化合物Ｉ－９（１００ｍｇ、０．２５ｍｍｏｌ）とｔｅｒｔ－ブチル４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）－３，６－ジヒドロピリジン－１（２Ｈ）－カルボキシレート（９２ｍｇ、０．３０ｍｍｏｌ）を実施例２１４と同じ方法で反応させて、８０ｍｇのｔｅｒｔ－ブチル４－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－３，６－ジヒドロピリジン－１（２Ｈ）－カルボキシレートを収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４４４．２（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０３０６】
段階２：段階１から収得した化合物（７０ｍｇ、０．１６ｍｍｏｌ）を実施例１５７の段階２と同じ方法で反応させて、５０ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝３４０．２（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０３０７】
実施例２１６：３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－エチル－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド
実施例９１の化合物（７０ｍｇ、０．１６ｍｍｏｌ）を無水ＭｅＣＮ（５ｍＬ）に溶かした後、Ｋ$_2$ＣＯ$_3$（９０ｍｇ、０．６６ｍｍｏｌ）、ブロモエタン（２０μＬ、０．３３ｍｍｏｌ）を入れ、９０℃で２時間撹拌した。反応生成物をＥｔＯＡｃで希釈し、精製水で洗浄した。分離した有機層を無水Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、６６ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４５６．５（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０３０８】
実施例２１７：３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ，Ｎ－ジエチルベンゼンスルホンアミド
実施例９２の化合物（７０ｍｇ、０．１６ｍｍｏｌ）を使って実施例２１６と同じ方法で反応させて、６５ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４７０．５（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０３０９】
実施例２１８：２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（１－（エチルスルホニル）－１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン
実施例２１６の化合物（４０ｍｇ、０．１０ｍｍｏｌ）をＤＣＭ（３ｍＬ）に溶かした後、エタンスルホニルクロリド（２０ｍｇ、０．１６ｍｍｏｌ）およびピリジン（１８μｌ、０．２１ｍｍｏｌ）を加え、常温で４時間撹拌した。反応生成物をＥｔＯＡｃで希釈し、精製水で洗浄した。分離した有機層を無水Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カ

ラムクロマトグラフィーで分離して、３５ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４３２．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０３１０】
実施例２１９：２－（４－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペラジン－２－イル）－２－メチルプロピオン酸
段階１：化合物Ｉ－９（２００ｍｇ、０．５０ｍｍｏｌ）と化合物Ｉ－１６（１００ｍｇ、０．５４ｍｍｏｌ）を実施例２１２と同様の方法で反応させて、１３０ｍｇのメチル２－（４－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペラジン－２－イル）－２－メチルプロピオネートを収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４４３．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０３１１】
段階２：段階１から収得した化合物（４０ｍｇ、０．０９ｍｍｏｌ）をＴＨＦ／ＭｅＯＨ／$H_2O$（４ｍＬ、３：１：１の比率）に溶かした後、ＬｉＯＨ・$H_2O$（１１ｍｇ、０．２７ｍｍｏｌ）を加え、常温で５時間撹拌した。反応生成物をＥｔＯＡｃで希釈し、飽和$NH_4Cl$水溶液で洗浄した。分離した有機層を無水$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮して、１６ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４２９．２（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０３１２】
実施例２２０：２－（４－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－１－メチルピペラジン－２－イル）－２－メチルプロピオン酸
段階１：実施例２１９の段階１から収得した化合物（８０ｍｇ、０．１８ｍｍｏｌ）を１，４－ジオキサン（５ｍＬ）に溶かした後、ヨードメタン（２０μｌ、０．２７ｍｍｏｌ）および$K_2CO_3$（７５ｍｇ、０．５４ｍｍｏｌ）を加え、常温で４時間撹拌した。反応生成物をＥｔＯＡｃで希釈し、精製水で洗浄した。分離した有機層を無水$Na_2SO_4$で脱水させ、減圧濃縮後、カラムクロマトグラフィーで分離して、６５ｍｇのメチル２－（４－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－１－メチルピペラジン－２－イル）－２－メチルプロピオネートを収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４５７．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０３１３】
段階２：段階１から収得した化合物（６５ｍｇ、０．１４ｍｍｏｌ）を実施例２１９の段階２のように反応させて、４６ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４４３．２（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０３１４】
実施例２２１：２－（４－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）モルホリン－２－イル）－２－メチルプロピオン酸
段階１：化合物Ｉ－９（５００ｍｇ、１．２３ｍｍｏｌ）とメチル２－（モルホリン－２－イル）アセテート（２６５ｍｇ、１．３５ｍｍｏｌ）を実施例２１１と同じ方法で反応させて、３６０ｍｇのメチル２－（４－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）モルホリン－２－イル）アセテートを収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４１６．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０３１５】
段階２：段階１から収得した化合物（２５０ｍｇ、０．６０ｍｍｏｌ）を製造例５の段階２のような方法で反応させて、１２０ｍｇのメチル２－（４－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）モルホリン－２－イル）－２－メチルプロピオネートを収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４４４．１（Ｍ＋Ｈ$^+$）
【０３１６】

段階３：段階２から収得した化合物（７０ｍｇ、０．１６ｍｍｏｌ）を実施例２１９の段階２のような方法で反応させて、１６ｍｇの表題化合物を収得した。
ＬＣ－ＭＳ（ＥＳＩ，ｍ／ｚ）＝４３０．１（Ｍ＋Ｈ$^{+}$）
【０３１７】
実験例１：Ｓｉｒｔ６活性の測定
Ｃｙｃｌｅｘ社のｃｙｃｌｅｘ Ｓｉｒｔ６ ｄｅａｃｅｔｙｌａｓｅ Ｆｌｕｏｔｏｍｅｔｉｃ ａｓｓａｙ ｋｉｔ（ｃａｔ．ＣＹ－１１５６Ｖ２）を使ってｓｉｒｔ６活性を有する化合物を選別した。
【０３１８】
蛍光標識アセチル化リジン基質にｓｉｒｔ６酵素を処理して、ｓｉｒｔ６が基質のアセチル化リジン（ａｃｅｔｙｌａｔｅｄ ｌｙｓｉｎｅ）を脱アセチル化（ｄｅａｃｅｔｙｌａｔｉｏｎ）し、Ｌｙｓｙｌｅｎｄｏｐｅｐｔｉｄａｓｅがリジンに連結されたＣ末端側ペプチド結合を切断することで、蛍光を発することになる。この際、化合物を一緒に処理したときに出る蛍光強さを測定する方式で活性度を計算する。化合物を一緒に処理したとき、化合物がｓｉｒｔ６酵素の活性を助けて蛍光値がさらに高く現れるので、処理しない蛍光値（ｐｏｓｉｔｉｖｅ ｃｏｎｔｒｏｌ群）に対して相対的な活性値を計算する。
【０３１９】
活性評価は、以下のような手続きによって行った。
【０３２０】
活性評価する化合物を所望の濃度の１０倍でＰＢＳで希釈して準備する（例えば１０μＭでｓｉｒｔ６ ａｓｓａｙ活性測定をしようとするとき、ＰＢＳに１００μＭの濃度で準備する）。１０ｘ ｓｉｒｔ６ ａｓｓａｙ ｂｕｆｆｅｒ １μＬ、５０ｘフルオロ－ｓｕｂｓｔｒａｔｅ ｐｅｐｔｉｄｅ ０．８μＬ、ＮＡＤ １μＬ、Ｄｅｖｅｌｏｐｅｒ １μＬ、$H_2O$ ４．２μＬを試料の個数で混ぜて混合物を作成し、ｂｌａｃｋ ３８４ウェルに８μＬずつ入れる。酵素未処理群（ｎｏ ｅｎｚｙｍｅ ｇｒｏｕｐ）と陽性対照群（ｐｏｓｉｔｉｖｅ ｃｏｎｔｒｏｌ ｇｒｏｕｐ）に追加でＰＢＳを１μＬずつ入れ、活性評価群には、ＰＢＳで希釈して準備した化合物を１μＬ追加する。１ｘ ｓｉｒｔ６ ａｓｓａｙ ｂｕｆｆｅｒにＲｅｃｏｍｂｉｎａｎｔ ｓｉｒｔ６を１／８希釈して、ｐｏｓｉｔｉｖｅ ｃｏｎｔｒｏｌ群、活性評価群に１μＬずつ追加する。Ｎｏ ｅｎｚｙｍｅ ｃｏｎｔｒｏｌ群には、１ｘ ｓｉｒｔ６ ａｓｓａｙ ｂｕｆｆｅｒ １μＬずつ追加する。常温で１時間反応させ、蛍光分析装置（ｆｌｕｏｒｅｓｃｅｎｃｅ ｓｐｅｃｔｒｏｍｅｔｅｒ，ｅｘｃｉｔａｔｉｏｎ ４９０±１０ｎｍ，ｅｍｉｓｓｉｏｎ ５３０±１０ｎｍ）にて結果値を測定して、ｓｉｒｔ６活性の有無およびその強度を測定する。
【０３２１】
下記の表１に本発明の実施例による化合物名称およびＳｉｒｔ６活性を整理した。
【０３２２】

【表１】

| 実施例 | 化合物名称 | Ｓｉｒｔ６活性（％活性、１０μＭ） |
|---|---|---|
| １ | Ｎ－（３－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド | １７０ |
| ２ | ４－（３－アミノフェニル）－２－（４－（トリフルオロメチル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン | ８８ |
| ３ | Ｎ－（３－（４－オキソ－３－（４－（トリフルオロメチル）フェニル）－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド | １０４ |
| ４ | ４－（３－（エチルアミノ）フェニル）－２－（４－（トリフルオロメチル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン | １０２ |
| ５ | Ｎ－メチル－Ｎ－（３－（４－オキソ－３－（４－（トリフルオロメチル）フェニル）－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド | １０５ |
| ６ | Ｎ－（３－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンスルホンアミド | １０２ |
| ７ | Ｎ－メチル－Ｎ－（３－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンスルホンアミド | １７３ |
| ８ | Ｎ－（４－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド | １００ |
| ９ | Ｎ－（３－（３－フェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－ジメチルスルファモイルアミド | １５４ |
| １０ | Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンスルホンアミド | １９８ |
| １１ | Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド | １６２ |
| １２ | Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－ジメチルスルファモイルアミド | １８９ |

| | | |
|---|---|---|
| １３ | （Ｚ）－Ｎ－メチル－１－（３－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド | １８１ |
| １４ | （Ｚ）－Ｎ－イソプロピル－１－（３－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド | １２１ |
| １５ | （Ｚ）－１－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド | ２３１ |
| １６ | （Ｚ）－Ｎ－エチル－１－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド | ２２１ |
| １７ | （Ｚ）－１－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド | ２０７ |
| １８ | Ｎ－（２－クロロ－５－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－（メチルスルホニル）メタンスルホンアミド | １１４ |
| １９ | Ｎ－（３－（３－（フェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－６－クロロフェニル）－ジメチルスルファモイルアミド | １２０ |
| ２０ | メチル（Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）スルファモイル）カルバマート | ２１１ |
| ２１ | （Ｚ）－１－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド | １６７ |
| ２２ | （Ｚ）－１－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド | ２０１ |
| ２３ | （Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド | １９２ |
| ２４ | ４－（３－アミノフェニル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン | １４７ |

| | | |
|---|---|---|
| ２５ | Ｎ－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド | １４７ |
| ２６ | メチル（Ｎ－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）スルファモイル）カルバマート | １８０ |
| ２７ | （Ｚ）－１－（３－（３－（３－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド | １４８ |
| ２８ | （Ｚ）－１－（３－（３－（３－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド | １５４ |
| ２９ | （Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（３－（３－（３－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド | １６２ |
| ３０ | Ｎ－（３－（３－（３－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド | １１７ |
| ３１ | （Ｚ）－１－（３－（３－（３，５－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド | １７１ |
| ３２ | （Ｚ）－Ｎ－イソプロピル－１－（３－（３－（４－メトキシフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド | １２４ |
| ３３ | （Ｚ）－１－（３－（３－（３－クロロ－４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド | １８３ |
| ３４ | （Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（３－（３－（３－クロロ－４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド | １７６ |
| ３５ | （Ｚ）－Ｎ－ベンジルｌ－１－（３－（４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド | １１３ |
| ３６ | （Ｅ）－１－（４－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド | １４２ |

| | | |
|---|---|---|
| ３７ | （Ｚ）－１－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド | １２６ |
| ３８ | （Ｅ）－１－（３－フルオロ－４－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド | １４３ |
| ３９ | （Ｅ）－１－（３－フルオロ－４－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド | １０６ |
| ４０ | （Ｚ）－１－（２－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド | １６０ |
| ４１ | （Ｚ）－１－（２－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド | １２９ |
| ４２ | （Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（２－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド | １６１ |
| ４３ | （Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド | ２０５ |
| ４４ | （Ｚ）－Ｎ－ベンジル－１－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド | １４２ |
| ４５ | （Ｚ）－１－（５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）チオフェン－２－イル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド | １９５ |
| ４６ | （Ｚ）－１－（５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）チオフェン－２－イル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド | １５４ |
| ４７ | （Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）チオフェン－２－イル）メタンイミンオキシド | １３２ |
| ４８ | （Ｚ）－１－（５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フラン－２－イル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド | １０７ |

| | | |
|---|---|---|
| ４９ | （Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－２－メトキシフェニル）メタンイミンオキシド | １０７ |
| ５０ | （Ｚ）－Ｎ－ベンジル－１－（５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－２－メトキシフェニル）メタンイミンオキシド | １０５ |
| ５１ | （Ｚ）－１－（２－フルオロ－５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド | １３９ |
| ５２ | （Ｚ）－１－（２－フルオロ－５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド | １７２ |
| ５３ | （Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（２－フルオロ－５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド | １７２ |
| ５４ | （Ｚ）－Ｎ－ベンジル－１－（２－フルオロ－５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド | １６１ |
| ５５ | （Ｚ）－１－（４－フルオロ－３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド | １５１ |
| ５６ | （Ｚ）－１－（４－フルオロ－３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド | １１５ |
| ５７ | （Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（４－フルオロ－３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド | １４９ |
| ５８ | （Ｚ）－Ｎ－ベンジル－１－（４－フルオロ－３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド | １３１ |
| ５９ | ４－（４－クロロ－３－ニトロフェニル）－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン | １０９ |
| ６０ | ４－（３－アミノフェニル）－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン | １７６ |
| ６１ | Ｎ－（３－（３－ベンジル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド | １０４ |

| | | |
|---|---|---|
| ６２ | Ｎ－（３－（４－オキソ－３－フェネチル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド | １１１ |
| ６３ | Ｎ－（３－（３－（４－フルオロベンジル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド | １０３ |
| ６４ | Ｎ－（３－（３－（［１，１’－ビフェニル］－４－イル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド | １０６ |
| ６５ | Ｎ－（３－（３－（［１，１’－ビフェニル］－４－イル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルエタンスルホンアミド | ９６ |
| ６６ | メチル３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ベンゾアート | １０３ |
| ６７ | Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）プロパン－２－スルホンアミド | １６６ |
| ６８ | Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）プロパン－１－スルホンアミド | １６０ |
| ６９ | Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンスルホンアミド | ２０９ |
| ７０ | Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルエタンスルホンアミド | １３５ |
| ７１ | Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）シクロプロパンスルホンアミド | １５０ |
| ７２ | Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルプロパン－１－スルホンアミド | １１５ |
| ７３ | Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルプロパン－２－スルホンアミド | １２４ |

| | | |
|---|---|---|
| ７４ | Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルシクロプロパンスルホンアミド | １２８ |
| ７５ | Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチル－ジメチルスルファモイルアミド | １３９ |
| ７６ | メチル（Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルスルファモイル）（メチル）カルバマート | １２５ |
| ７７ | １，１，１－トリフルオロ－Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンスルホンアミド | １９４ |
| ７８ | １，１，１－トリフルオロ－Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンスルホンアミド | １２２ |
| ７９ | ３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－（（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル）オキシ）ベンズアミド | １６７ |
| ８０ | Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチル－メチルスルファモイルアミド | ２１６ |
| ８１ | ４－（３－（１Ｈ－テトラゾール－５－イル）フェニル）－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン | １１５ |
| ８２ | Ｎ－（５－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピリジン－３－イル）エタンスルホンアミド | １１１ |
| ８３ | ３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－ヒドロキシベンズアミド | １６２ |
| ８４ | （Ｚ）－１－（３－（３－（［１，１’－ビフェニル］－４－イル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド | １２３ |
| ８５ | （Ｚ）－１－（３－（３－（［１，１’－ビフェニル］－４－イル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド | １１８ |

| | | |
|---|---|---|
| ８６ | ３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド | １９６ |
| ８７ | Ｎ－エチル－３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ベンゼンスルホンアミド | ２２６ |
| ８８ | ３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルベンゼンスルホンアミド | １８０ |
| ８９ | ２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン | ３３９ |
| ９０ | ２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（エチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン | ２８３ |
| ９１ | ３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド | ２７２ |
| ９２ | ３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－エチルベンゼンスルホンアミド | ２０８ |
| ９３ | ３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルベンゼンスルホンアミド | ２２７ |
| ９４ | （Ｚ）－１－（３－（３－（２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド | ２７２ |
| ９５ | （Ｚ）－１－（３－（３－（２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド | １３３ |
| ９６ | （Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（３－（３－（２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド | １７６ |
| ９７ | ２－（２－フルオロフェニル）－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン | ２８６ |
| ９８ | ４－（３－（エチルスルホニル）フェニル）－２－（２－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン | ２６４ |

| | | |
|---|---|---|
| ９９ | ３－（３－（２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド | ２５９ |
| １００ | Ｎ－エチル－３－（３－（２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ベンゼンスルホンアミド | １９６ |
| １０１ | ３－（３－（２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルベンゼンスルホンアミド | １５３ |
| １０２ | （Ｚ）－１－（３－（３－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－メチルメタンイミンオキシド | ２０６ |
| １０３ | （Ｚ）－１－（３－（３－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピルメタンイミンオキシド | ３２４ |
| １０４ | （Ｚ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－（３－（３－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）メタンイミンオキシド | ２８４ |
| １０５ | ２－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン | ２２６ |
| １０６ | ２－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－（３－（エチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン | １４１ |
| １０７ | ３－（３－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド | ２３３ |
| １０８ | ３－（３－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－エチルベンゼンスルホンアミド | ２０９ |
| １０９ | ３－（３－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルベンゼンスルホンアミド | １８８ |
| １１０ | ６－フルオロ－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）－２－フェニルフタラジン－１（２Ｈ）－オン | １２９ |
| １１１ | ３－（７－フルオロ－４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド | １２６ |

| | | |
|---|---|---|
| １１２ | ７－フルオロ－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）－２－フェニルフタラジン－１（２Ｈ）－オン | １０３ |
| １１３ | ３－（６－フルオロ－４－オキソ－３－フェニル－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド | １１６ |
| １１４ | ３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピリジン１－オキシド | ２２６ |
| １１５ | ２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（ピリジン－３－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン | ４０５ |
| １１６ | ２－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－（ピリジン－３－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン | ２２７ |
| １１７ | ３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピリジン１－オキシド | ３１８ |
| １１８ | ３－（３－（２，６－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピリジン１－オキシド | ２３１ |
| １１９ | ２－（２，４－ジフルオロフェニル）－６－フルオロ－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン | １６６ |
| １２０ | ２－（２，４－ジフルオロフェニル）－７－フルオロ－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン | １７８ |
| １２１ | ３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－７－フルオロ－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド | １５７ |
| １２２ | ３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－６－フルオロ－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド | １７７ |
| １２３ | ２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（エチルスルホニル）フェニル）－６－フルオロフタラジン－１（２Ｈ）－オン | ２５３ |
| １２４ | ３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－７－フルオロ－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－エチルベンゼンスルホンアミド | １４６ |

| | | |
|---|---|---|
| １２５ | ３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－７－フルオロ－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルベンゼンスルホンアミド | １７２ |
| １２６ | ３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ベンゼンスルホンアミド | １８５ |
| １２７ | ３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）ベンゼンスルホンアミド | ３２１ |
| １２８ | Ｎ－（３－（３－シクロヘキシル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド | １７７．５３ |
| １２９ | Ｎ－（３－（３－（１－メチルピペリジン－４－イル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド | １０４．１６ |
| １３０ | ３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ベンゾニトリル | １２０．１６ |
| １３１ | （Ｅ）－３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ’－ヒドロキシベンズイミドアミド | １０２．０８ |
| １３２ | Ｎ－（３－（３－イソプロピル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド | １０７．５８ |
| １３３ | Ｎ－（３－（３－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド | １１８．８ |
| １３４ | ４－（３－アミノピペリジン－１－イル）－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド | １６７．５３ |
| １３５ | Ｎ－（１－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）エタンスルホンアミド | １７４．９３ |
| １３６ | Ｎ－（３－（３－（オキセタン－３－イル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド | １０１．２７ |
| １３７ | Ｎ－（１－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピロリジン－３－イル）エタンスルホンアミド | １１２．５８ |

| | | |
|---|---|---|
| １３８ | （Ｓ）－Ｎ－（１－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）エタンスルホンアミド | １７５．９８ |
| １３９ | （Ｒ）－Ｎ－（１－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）エタンスルホンアミド | １３０．０７ |
| １４０ | Ｎ－（３－（３－（４，４－ジフルオロシクロヘキシル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド | １３４．４１ |
| １４１ | Ｎ－（１－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）アゼパン－３－イル）エタンスルホンアミド | ２１２．５５ |
| １４２ | ３－（３－シクロヘキシル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ベンゼンスルホンアミド | １６２．３ |
| １４３ | ４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－シクロヘキシルフタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド | ２３８．３ |
| １４４ | Ｎ－（１－（３－シクロヘキシル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）アゼパン－３－イル）エタンスルホンアミド | １６４．１ |
| １４５ | Ｎ－（３－（３－（４－メチルシクロヘキシル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド | １３６．６ |
| １４６ | （Ｓ）－４－（３－アミノピペリジン－１－イル）－２－シクロヘキシルフタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド | １３５．２ |
| １４７ | （Ｓ）－Ｎ－（１－（３－シクロヘキシル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）エタンスルホンアミド | １２７．７ |
| １４８ | ４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド | １８４．３ |
| １４９ | Ｎ－（３－（２－（４－フルオロフェニル）－１－オキソ－１，２－ジヒドロピリド［３，４－ｄ］ピリジン－４－イル）フェニル）エタンスルホンアミド | １１４．９ |
| １５０ | Ｎ－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－８－メチル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド | １０４．７ |

| | | |
|---|---|---|
| １５１ | Ｎ－（３－（４－オキソ－３－（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－４－イル）－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）エタンスルホンアミド | １４５．６４ |
| １５２ | ２－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロピオン酸 | １９５．５ |
| １５３ | ２－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ，２－ジメチルプロパンアミド | ２８０．４ |
| １５４ | ２－シクロヘキシル－４－（３－（メチルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン | ２６３．７ |
| １５５ | （Ｓ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－シクロヘキシルフタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド | ２３０．９ |
| １５６ | （Ｓ）－２－シクロヘキシル－４－（３－（メチルアミノ）アゼパン－１－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド | ２２３．９ |
| １５７ | （Ｓ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド | ２４４．１ |
| １５８ | （Ｓ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド | １６４．７ |
| １５９ | （Ｒ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－シクロヘキシルフタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド | ３９８．８ |
| １６０ | ２－（３－（３－シクロヘキシル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロピオン酸 | ２８９．８ |
| １６１ | ３－（３－（３－（４－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）オキサゾリジン－２－オン | １７７ |
| １６２ | （Ｒ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（４－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド | ２０５．５ |
| １６３ | ２－（３－（３－シクロヘキシル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロパンアミド | ２７７ |

| | | |
|---|---|---|
| １６４ | ２－（３－（３－シクロヘキシル－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ，２－ジメチルプロパンアミド | ２８５．５ |
| １６５ | （Ｒ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド | ２７７．１ |
| １６６ | ２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロピオン酸 | ２３９．２ |
| １６７ | ４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド | ２４９．４ |
| １６８ | ２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロパンニトリル | １５５．７ |
| １６９ | ４－（３－（２－（１Ｈ－テトラゾール－５－イル）プロパン－２－イル）フェニル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン | ２１１．３ |
| １７０ | （Ｅ）－２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ’－ヒドロキシ－２－メチルプロパンイミドアミド | ２６２．７ |
| １７１ | ２－（３－（３－（２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロピオン酸 | １３４．７ |
| １７２ | ４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－シクロブチルフタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド | ９９．５ |
| １７３ | ４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－シクロペンチルフタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド | １１２．２ |
| １７４ | ２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（２－（５－メチル－１，２，４－オキサジアゾール－３－イル）プロパン－２－イル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン | １１４．２ |
| １７５ | （Ｒ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（２－フルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド | １５５．３ |

| | | |
|---|---|---|
| １７６ | ２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－イソプロピル－２－メチルプロパンアミド | ２４４．３０ |
| １７７ | ２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（２－メチル－１－オキソ－１－（ピロリジン－１－イル）プロパン－２－イル）フェニル）フタラジン－１（２）－オン | ２４１．６ |
| １７８ | Ｎ－シクロプロピル－２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロパンアミド | ３３１．００ |
| １７９ | ２－（２，４，－ジフルオロフェニル）－４－（３－（２－メチル－１－モルホリノ－１－オキソプロパン－２－イル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン | ２２１．６０ |
| １８０ | Ｎ－シクロヘキシル－２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロパンアミド | １３３．３０ |
| １８１ | ２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチル－Ｎ－フェニルプロパンアミド | １２２．１０ |
| １８２ | ２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチル－Ｎ－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）プロパンアミド | ２１９．６０ |
| １８３ | １－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）シクロプロパン－１－カルボン酸 | １９４．７０ |
| １８４ | ４－（１，４－ジアゼパン－１－イル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド | １７６．８０ |
| １８５ | （Ｒ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（４－クロロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド | ２７３．８０ |
| １８６ | ２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－２－メチルプロパンアミド | ３０５．８０ |

| | | |
|---|---|---|
| １８７ | （Ｒ）－Ｎ－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）アゼパン－３－イル）エタンスルホンアミド | ３０３．８０ |
| １８８ | ２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロパンアミド | ３５８．４０ |
| １８９ | （Ｒ）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（メチルアミノ）アゼパン－１－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド | ２７３．７０ |
| １９０ | ２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－ヒドロキシアゼパン－１－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン | ３３２．６０ |
| １９１ | （Ｒ）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（（２－ヒドロキシエチル）アミノ）アゼパン－１－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド | ３１２．７０ |
| １９２ | （Ｒ）－Ｎ－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）アゼパン－３－イル）アセトアミド | ２８６．６０ |
| １９３ | ２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－オキソアゼパン－１－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン | ２０６．１０ |
| １９４ | ２－（３－（３－（４－クロロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロピオン酸 | ３５０．２０ |
| １９５ | １－（３－（３－（４－クロロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）シクロプロパン－１－カルボン酸 | ２８７．３０ |
| １９６ | ２－（４－クロロフェニル）－４－（３－ヒドロキシアゼパン－１－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン | １３５．１０ |
| １９７ | ２－（３－（３－（４－クロロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロパンアミド | １５３．６０ |
| １９８ | １－（３－（３－（４－クロロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）シクロプロパン－１－カルボキシアミド | ２２５．４０ |
| １９９ | ２－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）酢酸 | １４９．４１ |

| | | |
|---|---|---|
| ２００ | ４－（３－（２－アミノプロパン－２－イル）フェニル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド | ２５５．３３ |
| ２０１ | ２－（３－（３－（４－クロロ－２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロピオン酸 | ２０４．５８ |
| ２０２ | （Ｒ）－４－（３－アミノアゼパン－１－イル）－２－（４－クロロ－２－フルオロフェニル）フタラジン－１－（２Ｈ）－オンヒドロクロリド | ２６１．７３ |
| ２０３ | １－（３－（４－クロロ－２－フルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）アゼパン－３－カルボニトリル | １０９．８４ |
| ２０４ | ４－（３－（１－アミノ－２－メチルプロパン－２－イル）フェニル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド | １６１．５０ |
| ２０５ | ２－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）－２－メチルプロピオン酸 | １０５．７０ |
| ２０６ | ２－（３－（３－（４－シクロプロピルフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）－２－メチルプロピオン酸 | １８２．７０ |
| ２０７ | １－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）シクロブタン－１－カルボン酸 | ３０９．９０ |
| ２０８ | １－（３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）フェニル）シクロペンタン－１－カルボン酸 | １１７．３０ |
| ２０９ | ２－（１－（３－（４－クロロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）－２－メチルプロピオン酸 | １６９．１０ |
| ２１０－１ | ２－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）－２－メチルプロピオン酸 | １９９．００ |
| ２１０－２ | ２－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）－２－メチルプロピオン酸 | １００．５０ |

| | | |
|---|---|---|
| ２１１ | メチル１－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）シクロプロパン－１－カルボキシレート | １７０．００ |
| ２１２ | １－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）シクロプロパン－１－カルボン酸 | １７０．１０ |
| ２１３－１ | １－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）シクロプロパン－１－カルボン酸 | １６８．１０ |
| ２１３－２ | １－（１－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペリジン－３－イル）シクロプロパン－１－カルボン酸 | １０２．６０ |
| ２１４ | ２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（３－（ピロリジン－１－イルスルホニル）フェニル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン | ２３３．９０ |
| ２１５ | ２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オンヒドロクロリド | ２２６．６０ |
| ２１６ | ３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ－エチル－Ｎ－メチルベンゼンスルホンアミド | １８４．８０ |
| ２１７ | ３－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－Ｎ，Ｎ－ジエチルベンゼンスルホンアミド | １８５．１０ |
| ２１８ | ２－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－（１－（エチルスルホニル）－１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル）フタラジン－１（２Ｈ）－オン | １７６．５０ |
| ２１９ | ２－（４－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）ピペラジン－２－イル）－２－メチルプロピオン酸 | １１４．６０ |
| ２２０ | ２－（４－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）－１－メチルピペラジン－２－イル）－２－メチルプロピオン酸 | １２５．８０ |
| ２２１ | ２－（４－（３－（２，４－ジフルオロフェニル）－４－オキソ－３，４－ジヒドロフタラジン－１－イル）モルホリン－２－イル）－２－メチルプロピオン酸 | １２５．５０ |

フロントページの続き

| (51)国際特許分類 | | FI | | |
|---|---|---|---|---|
| *A61P 1/16 (2006.01)* | | A61P | 1/16 | |
| *A61P 3/10 (2006.01)* | | A61P | 3/10 | |
| *A61P 29/00 (2006.01)* | | A61P | 29/00 | |
| *A61P 35/00 (2006.01)* | | A61P | 35/00 | |
| *A61P 43/00 (2006.01)* | | A61P | 43/00 | 105 |
| *C07D 401/04 (2006.01)* | | A61P | 43/00 | 111 |
| *C07D 403/04 (2006.01)* | | C07D | 401/04 | |
| *C07D 403/10 (2006.01)* | | C07D | 403/04 | |
| *C07D 403/12 (2006.01)* | | C07D | 403/10 | |
| *C07D 405/04 (2006.01)* | | C07D | 403/12 | |
| *C07D 409/04 (2006.01)* | | C07D | 405/04 | |
| *C07D 413/04 (2006.01)* | | C07D | 409/04 | |
| *C07D 413/10 (2006.01)* | | C07D | 413/04 | |
| *C07D 471/04 (2006.01)* | | C07D | 413/10 | |
| | | C07D | 471/04 | 119 |

大韓民国、３４１１４ テジョン、ユソンーク、カジョンーロ １４１
１４１，Ｇａｊｅｏｎｇ－ｒｏ，Ｙｕｓｅｏｎｇ－ｇｕ，Ｄａｅｊｅｏｎ ３４１１４ Ｋｏｒｅａ
(74)代理人 100130111
弁理士 新保 斉
(72)発明者 キム，キョンジン
大韓民国、０６１９４ ソウル、カンナムーク、テヘランーロ・７８－ギル １２、エムエスエー・ビルディング ７ティーエイチフロア
(72)発明者 キム，クァンロク
大韓民国、３４１１４ テジョン、ユソンーク、カジョンーロ １４１
(72)発明者 キム，ウクイル
大韓民国、１５６１０ キョンギード、アンサンーシ、タンウォンーク、ヘアンーロ １７１
(72)発明者 パン，ヒョンテ
大韓民国、１５６１０ キョンギード、アンサンーシ、タンウォンーク、ヘアンーロ １７１
(72)発明者 イ，スルギ
大韓民国、１５６１０ キョンギード、アンサンーシ、タンウォンーク、ヘアンーロ １７１
(72)発明者 チョン，クァンヨン
大韓民国、３４１１４ テジョン、ユソンーク、カジョンーロ １４１
(72)発明者 カン，スンギュ
大韓民国、３４１１４ テジョン、ユソンーク、カジョンーロ １４１
(72)発明者 チョン，ヒジョン
大韓民国、３４１１４ テジョン、ユソンーク、カジョンーロ １４１
(72)発明者 イ，サンダル
大韓民国、３４１１４ テジョン、ユソンーク、カジョンーロ １４１
(72)発明者 チョン，ウォンフン
大韓民国、３４１１４ テジョン、ユソンーク、カジョンーロ １４１
(72)発明者 イ，ジュンミ
大韓民国、３４１１４ テジョン、ユソンーク、カジョンーロ １４１

審査官 藤代 亮

(56)参考文献
特表２０１１－５０７９１０（ＪＰ，Ａ）
特開平０６－２２００２５（ＪＰ，Ａ）
西独国特許出願公開第０２５３１７７６（ＤＥ，Ａ１）
中国特許出願公開第１０９２８００３２（ＣＮ，Ａ）
特表２０１８－５０７２３８（ＪＰ，Ａ）
Alhamzah Dh.Hameed et al.，Synthesis and Biological Evaluation of New Phthalazinone Derivatives as Anti-Inflammatory and Anti-Proliferative Agents，Archiv der Pharmazie，2016

年，349巻，150-159頁
K.Kormendy et al.，Aminophthalazinone derivatives. VII.，Acta Chimica Academiae Scientiarum Hungaricae，1981年，106巻，155-166頁

(58)調査した分野 (Int.Cl.，ＤＢ名)

ＣＯ７Ｄ ２３７／３２
Ａ６１Ｋ ３１／５０２
Ａ６１Ｋ ３１／５０２５
Ａ６１Ｋ ３１／５３７７
Ａ６１Ｋ ３１／５５
Ａ６１Ｐ １／１６
Ａ６１Ｐ ３／１０
Ａ６１Ｐ ２９／００
Ａ６１Ｐ ３５／００
Ａ６１Ｐ ４３／００
ＣＯ７Ｄ ４０１／０４
ＣＯ７Ｄ ４０３／０４
ＣＯ７Ｄ ４０３／１０
ＣＯ７Ｄ ４０３／１２
ＣＯ７Ｄ ４０５／０４
ＣＯ７Ｄ ４０９／０４
ＣＯ７Ｄ ４１３／０４
ＣＯ７Ｄ ４１３／１０
ＣＯ７Ｄ ４７１／０４
ＣＡｐｌｕｓ／ＲＥＧＩＳＴＲＹ（ＳＴＮ）