

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第4029960号
(P4029960)

(45) 発行日 平成20年1月9日(2008.1.9)

(24) 登録日 平成19年10月26日(2007.10.26)

(51) Int. Cl.

F I

C O 7 C 217/84 (2006.01)

C O 7 C 217/84

A O 1 G 7/00 (2006.01)

A O 1 G 7/00 6 O 4 Z

A O 1 N 33/10 (2006.01)

A O 1 N 33/10

A O 1 N 37/44 (2006.01)

A O 1 N 37/44

C O 7 C 215/56 (2006.01)

C O 7 C 215/56

請求項の数 4 (全 11 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2001-309508 (P2001-309508)
 (22) 出願日 平成13年10月5日 (2001.10.5)
 (65) 公開番号 特開2003-113148 (P2003-113148A)
 (43) 公開日 平成15年4月18日 (2003.4.18)
 審査請求日 平成16年10月5日 (2004.10.5)

(73) 特許権者 503359821
 独立行政法人理化学研究所
 埼玉県和光市広沢2番1号
 (73) 特許権者 500350243
 浅見 忠男
 東京都新宿区二十騎町1-6
 (73) 特許権者 500350254
 吉田 茂男
 東京都練馬区貫井3-28-15
 (74) 代理人 100092635
 弁理士 塩澤 寿夫
 (74) 代理人 100096219
 弁理士 今村 正純
 (74) 代理人 100095843
 弁理士 釜田 淳爾

最終頁に続く

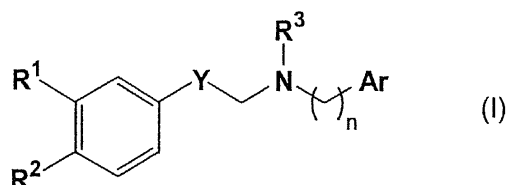
(54) 【発明の名称】 アブシジン酸生合成阻害剤

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記の一般式(Ⅰ)：

【化1】



(式中、 R^1 は水素原子、水酸基、又はアルコキシ基を示し； R^2 は水酸基、無置換アルコキシ基、又はアルコキシカルボニル基、カルボキシル基、もしくは水酸基を置換基として有するアルコキシ基を示し； R^3 は水素原子、無置換アルキル基、又はアルコキシカルボニル基、カルボキシル基、もしくは水酸基を置換基として有するアルキル基を示し；Yは -CH=CH- 又は -CH₂- を示し；nは0又は1を示し；Arは無置換アリール基、又は水酸基、アルコキシ基、もしくはハロゲン原子を置換基として有するアリール基を示すか、又は、Arは無置換ヘテロアリール基、又は水酸基、アルコキシ基、もしくはハロゲン原子を置換基として有するヘテロアリール基を示す)で表される化合物又はその塩、ただし以下の場合を除く：

R^1 が水素原子、 R^2 がエトキシ基又はn-プロピル基、 R^3 が水素原子、Yが -CH₂-、

n が 0、かつ Ar が 4 - ピリジル基である場合；

R^1 が水素原子、 R^2 が水酸基、 R^3 が水素原子、 Y が $-CH_2-$ 、 n が 1、かつ Ar が 3 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル基である場合；

R^1 が水素原子、 R^2 が水酸基又はメトキシ基、 R^3 がメチル基、 Y が $-CH=CH-$ 、 n が 1、かつ Ar がナフチル基である場合；

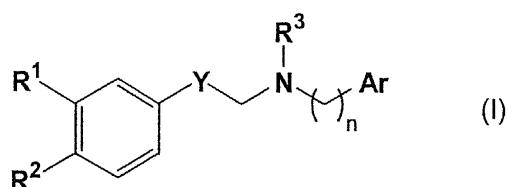
R^1 及び R^2 がそれぞれ水酸基又は R^1 及び R^2 がそれぞれメトキシ基、 R^3 がメチル基、 Y が $-CH_2-$ 、 n が 1、かつ Ar がフェニル基である場合；ならびに

R^1 が水素原子、 R^2 がメトキシ基、 R^3 が水素原子、 Y が $-CH=CH-$ 、 n が 1、かつ Ar がフェニル基である場合。

【請求項 2】

下記の一般式 (I)：

【化 2】



(式中、 R^1 は水素原子、水酸基、又はアルコキシ基を示し； R^2 は水酸基、無置換アルコキシ基、又はアルコキシカルボニル基、カルボキシ基、もしくは水酸基を置換基として有するアルコキシ基を示し； R^3 は水素原子、無置換アルキル基、又はアルコキシカルボニル基、カルボキシ基、もしくは水酸基を置換基として有するアルキル基を示し； Y は $-CH=CH-$ 又は $-CH_2-$ を示し； n は 0 又は 1 を示し； Ar は無置換アリール基、又は水酸基、アルコキシ基、もしくはハロゲン原子を置換基として有するアリール基を示すか、又は、 Ar は無置換ヘテロアリール基、又は水酸基、アルコキシ基、もしくはハロゲン原子を置換基として有するヘテロアリール基を示す) で表される化合物又はその塩を有効成分として含むアブシジン酸生合成阻害剤。

【請求項 3】

請求項 2 に記載の一般式 (I) で表される化合物又はその塩を有効成分として含むエポキシカロテノイド・ジオキシゲナーゼ阻害剤。

【請求項 4】

請求項 2 に記載の一般式 (I) で表される化合物又はその塩を有効成分として含む植物生長調節剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】

本発明はアブシジン酸生合成阻害作用を有する化合物又はその塩、及び該化合物又はその塩を有効成分として含むアブシジン酸生合成阻害剤又は植物生長調節剤に関する。

【0002】

【従来の技術】

アブシジン酸は植物の多様な環境ストレス応答に関連した植物ホルモンである。例えば、植物が乾燥ストレスにさらされると速やかにアブシジン酸が蓄積され、その後、気孔の閉鎖やストレス関連遺伝子である *rab18*、*kin1* や *rd29B* などの発現が促進される。植物におけるアブシジン酸生合成は、炭素原子 40 個からなる化合物であるカロテノイドを経由し、この分解によって生じる炭素数 15 個のザントキシン (xanthoxin) を前駆体として 3' の水酸基の酸化、エポキシの開裂に伴う二重結合の異性化、そしてアルデヒドのカルボン酸への酸化を経てアブシジン酸を生成する経路が主要な経路である。特にエポキシカロテノイドのジオキシゲナーゼ [nine-cis-epoxycarotenoid dioxygenase (NCED)] によるザントキシンへの開裂反応は、アブシジン酸生合成の制御反応と考えられている。

【0003】

植物生長に必須な植物ホルモンであるアブシジン酸の生理機能を解明するために、これまではアブシジン酸を植物に直接処理する方法やアブシジン酸の生合成遺伝子が破壊された変異体を用いて、現れてきた生理現象を解析する方法が用いられてきた。しかし植物体中に既に存在しているアブシジン酸を処理しても、実際に内生アブシジン酸が行っている生理作用をあきらかにすることは難しい。一方、変異体を用いた方法はアブシジン酸欠損状態にあり野生株との生理現象や形態を比較することによりアブシジン酸の機能を調べるうえで有用であるが、多様な植物に応用できないことや任意の生長時期にアブシジン酸欠損状態にできないという弱点を有している。

【 0 0 0 4 】

このような既存の方法の欠点を補う方法としてアブシジン酸生合成阻害剤の利用が挙げられる。既にアブシジン酸欠損状態の植物を任意に得るためには生合成中間体であるカロテノイドの生合成を阻害する薬剤が用いられているが、それら薬剤は強力な白化作用を有するために副作用が現れない状態でアブシジン酸欠損状態を研究するためには不適當であった。このような状況下において、特異的アブシジン酸生合成阻害剤を提供することができれば多様な植物を容易にアブシジン酸欠損状態とすることが可能になり、アブシジン酸の機能解析研究の進展を図ることができる。またアブシジン酸生合成阻害剤は植物生長調節剤として、植物の多様な生長過程に対して効果的な薬剤として利用できる。なお、パーオキシダーゼ阻害剤として知られるNDGA〔4,4'-(2,3-ジメチル-1,4-ブタンジイル)ビス-1,2-ベンゼンジオール〕がアブシジン酸生合成阻害活性を有することが、気孔閉鎖活性の阻害試験とその際の内生量分析の結果に基づき報告されている(Plant Physiology (1992) 99, 1258-1260)。

【 0 0 0 5 】

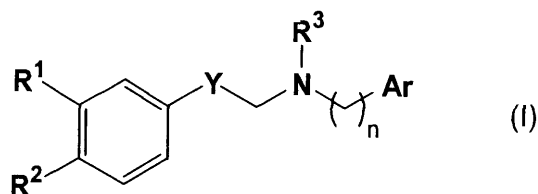
【発明が解決しようとする課題及び課題を解決するための手段】

本発明の課題はアブシジン酸生合成阻害作用を有する化合物を提供することにある。本発明者らは上記の課題を解決すべく鋭意研究を行った結果、下記的一般式(Ⅰ)で表される化合物又はその塩がアブシジン酸生合成阻害作用を有しており、植物生長調節剤として有用であることを見出し、本発明を完成した。

【 0 0 0 6 】

すなわち、本発明は、下記的一般式(Ⅰ)：

【化 2】



(式中、 R^1 は水素原子、水酸基、又はアルコキシ基を示し； R^2 は水酸基、置換基を有してもよいアルコキシ基を示し； R^3 は水素原子又は置換基を有してもよいアルキル基を示し；Yは $-\text{CH}=\text{CH}-$ 又は $-\text{CH}_2-$ を示し；nは0又は1を示し；Arは置換基を有してもよいアリール基又は置換基を有してもよいヘテロアリール基を示す)で表される化合物又はその塩を提供するものである。

【 0 0 0 7 】

別の観点からは、上記一般式(Ⅰ)で表される化合物又はその塩を有効成分として含むアブシジン酸生合成阻害剤；上記一般式(Ⅰ)で表される化合物又はその塩を有効成分として含むエポキシカロテノイド・ジオキシゲナーゼ阻害剤；上記一般式(Ⅰ)で表される化合物又はその塩を有効成分として含む植物生長調節剤；及び上記阻害剤又は上記調節剤の製造のための上記一般式(Ⅰ)で表される化合物又はその塩の使用が本発明により提供される。

【 0 0 0 8 】

10

20

30

40

50

さらに本発明により、植物生体内においてアブシジン酸生合成を阻害する方法であって、上記一般式(Ⅰ)で表される化合物又はその塩を植物に適用する工程を含む方法；植物生体内においてエポキシカロテノイド・ジオキシゲナーゼを阻害する方法であって、上記一般式(Ⅰ)で表される化合物又はその塩を植物に適用する工程を含む方法；及び植物の生長を調節する方法であって、上記一般式(Ⅰ)で表される化合物又はその塩を植物に適用する工程を含む方法が提供される。

【0009】

【発明の実施の形態】

R¹が示すアルコキシ基としては、例えば炭素数1～6個程度の直鎖状又は分枝鎖状のアルコキシ基を用いることができる。好ましくはメトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基などのアルコキシ基を用いることができ、さらに好ましくはメトキシ基を用いることができる。R¹としては水素原子又はメトキシ基が好ましい。R²が示すアルコキシ基についても同様であり、好ましくはメトキシ基を用いることができる。R²が示すアルコキシ基が置換基を有する場合には、置換基の種類、個数、及び置換位置は特に限定されないが、例えばアルコキシカルボニル基、カルボキシ基、水酸基など酸素原子を含む置換基が好ましい。R²が示す置換アルコキシ基としては、例えば、アルコキシカルボニル置換アルコキシ基が好ましく、より好ましくはメトキシカルボニル置換メトキシ基を用いることができる。R²としては水酸基、メトキシ基、又はメトキシカルボニルメトキシ基が好ましい。

【0010】

R³が示すアルキル基としては、例えば炭素数1～6程度の直鎖状又は分枝鎖状のアルキル基を用いることができる。好ましくはメチル基、エチル基、n-プロピル基などのアルキル基を用いることができ、さらに好ましくはメチル基を用いることができる。R³が示すアルキル基が置換基を有する場合には、置換基の種類、個数、及び置換位置は特に限定されないが、例えばアルコキシカルボニル基、カルボキシ基、水酸基など酸素原子を含む置換基が好ましい。R³としては水素原子、メチル基、又はメトキシカルボニルメチル基が好ましい。

【0011】

A_rが示すアリール基としては、例えばフェニル基又はナフチル基などを挙げることができる。好ましくはフェニル基を用いることができる。A_rが示すヘテロアリール基としては、例えば、窒素原子、酸素原子、及びイオウ原子からなる群から選ばれる1又は2以上のヘテロ原子を環構成原子として含む5ないし10員のヘテロアリール基を用いることができる。より好ましくは窒素原子又は酸素原子を環構成原子として1個又は2個含む5又は6員のヘテロアリール基を用いることができ、さらに好ましくは窒素原子又は酸素原子を環構成原子として1個含む5又は6員のヘテロアリール基を用いることができる。より具体的には、ヘテロアリール基としてピリジル基又はフリル基などが好適である。A_rが示すアリール基又はヘテロアリール基が置換基を有する場合には、置換基の種類、個数、及び置換位置は特に限定されないが、例えば水酸基、アルコキシ基(メトキシ基など)、ハロゲン原子(フッ素原子、塩素原子、又は臭素原子など)を1個又は2個程度有することが好ましい。好ましい置換基は、水酸基、メトキシ基、又はフッ素原子である。A_rがフェニル基である場合には3位及び/又は4位に置換基を有することが好ましい。

【0012】

一般式(Ⅰ)で表される化合物は置換基の種類に応じて1個または2個以上の不斉炭素を有している場合がある。従って、1個または2個以上の不斉炭素に基づく光学的に純粋な形態の任意の光学異性体、光学異性体の任意の混合物、ラセミ体、純粋な形態のジアステレオ異性体、ジアステレオ異性体の混合物などはいずれも本発明の範囲に包含される。また、一般式(Ⅰ)で表される化合物はナトリウム塩、カリウム塩などの塩基付加塩、又は塩酸塩、硫酸塩、パラトルエンスルホン酸塩などの酸付加塩として存在する場合があるが、これらの任意の塩も本発明の範囲に包含される。遊離形態の化合物又は塩の形態の化合物は水和物や溶媒和物として存在する場合もあるが、これらの物質も本発明の範囲に包含

10

20

30

40

50

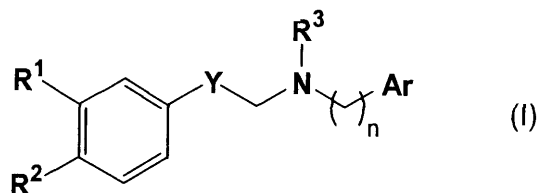
されることはいうまでもない。

【 0 0 1 3 】

一般式 (I) に包含される化合物の好ましい例を以下に挙げるが、本発明の範囲は下記の化合物に限定されることはない。

【 0 0 1 4 】

【 化 3 】



10

【 0 0 1 5 】

【 表 1 】

化合物 No.	R ¹	R ²	Y	R ³	n	Ar
S Y 8 7	CH ₃ O-	CH ₃ O-	-CH=CH-	H-	0	Ph (4-OCH ₃)
S Y 8 8	H-	HO-	-CH ₂ -	H-	1	Ph (3, 4-di-OCH ₃)
S Y 9 0	H-	HO-	-CH ₂ -	H-	1	Ph (3, 4-di-OH)
S Y 9 4	H-	CH ₃ O-CO-CH ₂ -O-	-CH ₂ -	CH ₃ O-CO-CH ₂ -	1	Ph (3, 4-di-OCH ₃)
S Y 9 5	CH ₃ O-	CH ₃ O-	-CH=CH-	H-	1	Ph (4-F)
S Y 9 6	H-	CH ₃ O-	-CH ₂ -	CH ₃ -	1	Ph (3, 4-di-OCH ₃)
S Y 9 7	CH ₃ O-	CH ₃ O-	-CH=CH-	CH ₃ O-CO-CH ₂ -	1	Ph (4-F)
S Y 9 9	CH ₃ O-	CH ₃ O-	-CH=CH-	CH ₃ -	1	Ph (4-F)
S Y 1 0 6	H-	HO-	-CH ₂ -	H-	1	4-Pyridyl
S Y 1 0 7	H-	HO-	-CH ₂ -	H-	1	3-Furyl
S Y 1 0 9	H-	HO-	-CH ₂ -	H-	1	Ph (2-OH)

20

30

【 0 0 1 6 】

上記一般式 (I) で表される化合物は、例えば、対応するアミン化合物とアルデヒドとを縮合させてイミンを合成し、合成したイミンを適当な還元剤で還元することにより容易に製造することができる。その具体例を本明細書の実施例に示した。縮合は無溶媒で行うこともできるが、適当な溶媒と酸性触媒とを適宜組み合わせることによって好適に行うことができる。また還元剤としてはホウ素化水素ナトリウムを用いることができるが、これに限定されるものではない。さらに還元により生じたアミンは、水素化ナトリウムのような強い塩基の存在下適当なハロゲン化アルキルなどと反応させることによりアルキル化などの修飾を施すことができる。上記の製造方法に従う製造例を本明細書の実施例に具体的に示したので、当業者は上記の一般的説明及び実施例の具体的説明を参照しつつ、出発原料、反応試薬、反応条件などを適宜選択し、さらに必要に応じて上記方法に適宜の修飾ないし改変を加えることにより、一般式 (I) に包含される化合物をいずれも製造することが可能である。

40

【 0 0 1 7 】

上記一般式 (I) で表される化合物又はその塩はアブシジン酸の生合成を阻害する作用を

50

有しており、例えば植物生長調節剤の有効成分として有用である。また、本発明の化合物又はその塩は、エポキシカロテノイド・ジオキシゲナーゼの特異的阻害剤として用いることができる。上記一般式 (I) で表される本発明の化合物を植物生長調節剤として植物に適用することにより、植物生長、発根、及び発芽などを促進させることができる。本明細書において用いられる「植物生長調節」という用語は、例えば、植物の伸長調節、花粉生長調節、花の鮮度保持、熱、乾燥、寒さ、病害などのストレスに対する植物の抗ストレス性増強、生殖制御による雑草防除、植物の老化抑制、根の肥大化などを含めて、最も広義に解釈する必要がある。本発明の化合物又はその塩は、例えばアブシジン酸の生合成経路や機能解明のための研究において生化学試薬として用いることも可能である。

【0018】

本発明により提供されるアブシジン酸生合成阻害剤、エポキシカロテノイド・ジオキシゲナーゼの特異的阻害剤、及び植物生長調節剤は、例えば、当業界で周知の製剤用添加物を用いて、農薬用組成物として調製することができる。農薬用組成物の形態は特に限定されず、当業界で利用可能な形態であればいかなる形態を採用してもよい。例えば、乳剤、液剤、油剤、水溶剤、水和剤、フロアブル、粉剤、微粒剤、粒剤、エアゾール、くん蒸剤、又はペースト剤などの形態の組成物を用いることができる。農薬用組成物の製造方法も特に限定されず、当業者に利用可能な方法を適宜採用することができる。本発明の阻害剤の有効成分としては、上記一般式 (I) で表される化合物またはそれらの塩の2種以上を組み合わせて用いてもよい。また、殺虫剤、殺菌剤、殺虫殺菌剤、除草剤などの他の農薬の有効成分を配合してもよい。本発明の阻害剤の適用方法及び適用量は、適用目的、剤型、適用場所などの条件に応じて当業者が適宜選択可能である。至適な作用を得るための濃度は以下の実施例を参照することにより当業者が適宜決定できる。

【0019】

【実施例】

以下、実施例により本発明をさらに具体的に説明するが、本発明の範囲は下記の実施例に限定されることはない。

【0020】

例1：化合物SY109〔4-〔2-〔2-ヒドロキシ-ベンジルアミノ〕-エチル〕-フェノール〕

(a)化合物SY108〔4-〔2-〔2-ヒドロキシ-ベンジリデン〕-アミノ〕-エチル〕-フェノール〕の合成

4-ヒドロキシフェネチルアミン (1.37 g, 10 mmol) と2-ヒドロキシベンジルアミン (1.22 g, 10 mmol) をトルエン中で過熱還流を行い反応させた。反応終了後、溶媒を減圧下留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン:酢酸エチル) で生成し、目的のイミンを得た。収量2.15 g。

¹H-NMR (MeOH-d₆) 7.25 (1H, s), 7.36-7.23 (2H, m), 7.06 (2H, d), 6.85 (2H, m), 6.72 (2H, d), 4.90 (2H, br s), 3.82 (2H, t), 2.92 (2H, t)

【0021】

(b)化合物SY109の合成

化合物SY108 (1.2 g, 5 mmol) を20mlのエタノールに溶かし、攪拌しながら水素化ホウ素ナトリウムを過剰量加え、反応の進行を薄層クロマトグラフィーでモニターした。原料が消失した時点で反応を止め、反応液に水50 mlを加えてエタノールを減圧化留去し、水層を酢酸エチルで3回抽出後、乾燥濃縮してシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム:酢酸エチル) で精製して目的物を得た。収量0.8 g。

¹H-NMR (CDCl₃+Acetone-d₆) 7.08 (1H, t), 6.97 (2H, d), 6.91 (2H, d), 6.74 (2H, d), 6.76-6.67 (2H, m), 3.91 (2H, s), 2.87 (2H, t), 2.72 (2H, t)

【0022】

例2：化合物SY94〔{(3, 4-ジメトキシ-ベンジル)-〔2-(4-メトキシカルボニルメトキシ-フェニル)-エチル〕-アミノ}-酢酸・メチルエステル〕

(a)化合物SY73〔4-〔2-〔(3, 4-ジメトキシ-ベンジリデン)-アミノ〕-エチル〕-フェノール〕の合成

チル } - フェノール }

例 1 (a)と同様にして化合物SY73を得た。

¹H-NMR (Acetone-d₆) 8.14 (1H, s), 7.46 (1H, s), 7.19 (1H, d), 7.09 (2H, d), 6.99 (1H, d), 6.77 (2H, d), 3.86 (3H, s), 3.85 (3H, s), 3.74 (2H, t), 2.87 (2H, t)

【 0 0 2 3 】

(b)化合物SY88〔4 - [2 - (3 , 4 - ジメトキシ - ベンジルアミノ) - エチル] - フェノール〕の合成

例 1 (b)と同様にして化合物SY88を得た。

¹H-NMR (CDCl₃+Acetone-d₆) 6.98 (2H, d), 6.73 (1H, s), 6.67-6.63 (4H, m), 3.73 (3H, s), 3.72 (3H, s), 3.61 (2H, s), 2.75-2.70 (2H, m), 2.64-2.60 (2H, m)

【 0 0 2 4 】

(c)化合物SY94の合成

化合物SY88 (287 mg, 1 mmol) を乾燥した3 mlのジメチルホルムアミドに溶解し、1.3当量の水素化ナトリウムを加えて10分撹拌した後、1.3当量の臭素化酢酸メチルを加え、室温で4時間反応させた。反応終了後、反応液を20 mlの水に注ぎ、酢酸エチルで3回抽出後、乾燥濃縮して、シリカゲルカラム (ヘキサン : 酢酸エチル) で生成し、目的の化合物を得た。収量125 mg。

¹H-NMR (CDCl₃) 7.08 (2H, d), 6.87 (1H, s), 6.78 (2H, d), 6.76 (2H, m), 4.59 (2H, s), 3.85 (3H, s), 3.83 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.75 (2H, s), 3.67 (3H, s), 3.35 (2H, s), 2.80-2.85 (2H, m), 2.76-2.71 (2H, m)

【 0 0 2 5 】

例 3

例 1 及び例 2 と同様にして下記の間体化合物及び本発明の化合物を製造した。

化合物SY72〔4 - { [2 - (4 - ヒドロキシ - フェニル) - エチルイミノ] - メチル } - ベンゼン - 1 , 2 - ジオール〕

¹H-NMR (Acetone-d₆+DMSO-d₆) 8.03 (1H, s), 7.31 (1H, s), 7.06 (2H, d), 6.90 (1H, d), 6.80 (1H, d), 6.72 (2H, d), 3.68 (2H, t), 3.15 (3H, br s), 2.82 (2H, t)

化合物SY76〔3 - (3 , 4 - ジメトキシ - フェニル) - プロパ - 2 - エン - 1 - オール〕

¹H-NMR (Acetone-d₆) 7.08 (1H, s), 7.07-6.87 (2H, m), 6.54 (1H, d), 6.29 (1H, td), 4.23 (2H, d), 3.84 (3H, s), 3.80 (3H, s), 3.05 (1H, br s)

化合物SY78〔3 - (3 , 4 - ジメトキシ - フェニル) - プロペナール〕

¹H-NMR (CDCl₃) 7.44 (1H, d), 7.17 (1H, d), 7.09 (1H, s), 6.93 (1H, d), 6.63 (1H, dd), 3.96 (3H, s), 3.95 (3H, s), 9.68 (1H, d)

【 0 0 2 6 】

化合物SY83〔[3 - (3 , 4 - ジメトキシ - フェニル) - アリリデン] - (4 - メトキシ - フェニル) - アミン〕

¹H-NMR (Acetone-d₆) 8.37 (1H, s), 7.33 (1H, s), 7.32-7.15 (4H, m), 7.05-6.94 (4H, m), 3.93 (3H, s), 3.87 (3H, s), 3.83 (3H, s)

化合物SY93〔[3 - (3 , 4 - ジメトキシ - フェニル) - アリリデン] - (4 - フルオロ - ベンジル) - アミン〕

¹H-NMR (Acetone-d₆) 8.19 (1H, d), 7.42-7.26 (3H, m), 7.15-6.83 (6H, m), 4.67 (2H, s), 3.89 (3H, s), 3.85 (3H, m)

化合物SY104〔4 - { 2 - [(ピリジン - 4 - イルメチレン) - アミノ] - エチル } - フェノール〕

¹H-NMR (Acetone-d₆) 8.68 (2H, d), 8.26 (1H, s), 7.67 (2H, d), 7.09 (2H, d), 6.76 (2H, d), 3.86 (2H, t), 2.94 (1H, br s), 2.91 (2H, t)

化合物SY105〔4 - { 2 - [(フラン - 3 - イルメチレン) - アミノ] - エチル } - フェノール〕

¹H-NMR (Acetone-d₆) 8.19 (1H, s), 7.91 (1H, s), 7.59 (1H, s), 7.06 (2H, d), 6.81 (1H, s), 6.75 (2H, d), 3.71 (2H, t), 2.89 (1H, br s), 2.843 (2H, t)

【 0 0 2 7 】

化合物 S Y 8 7 [[3 - (3 , 4 - ジメトキシ - フェニル) - アリル] - (4 - メトキシ - フェニル) - アミン]

¹H-NMR (MeOH-d₆) 7.44 (2H, d), 7.14-6.94 (5H, m), 6.78 (1H, d), 6.19 (1H, td), 4.89 (1H, br s), 4.14 (2H, d), 3.87 (9H, s)

化合物 S Y 9 0 [4 - { [2 - (4 - ヒドロキシ - フェニル) - エチルアミノ] - メチル } - ベンゼン - 1 , 2 - ジオール]

¹H-NMR (MeOH-d₆) 7.09 (2H, d), 7.01 (1H, s), 6.87 (2H, m), 6.79 (2H, d), 4.9 10 5 (4H, br s), 4.06 (2H, s), 3.17 (2H, m), 2.81 (2H, m)

化合物 S Y 9 5 [[3 - (3 , 4 - ジメトキシ - フェニル) - アリル] - (4 - フルオロ - ベンジル) - アミン]

¹H-NMR (MeOH-d₆) 7.58 (2H, m), 7.27-7.05 (4H, m), 6.97 (1H, d), 6.84 (1H, d), 6.20 (1H, td), 4.89 (1H, br s), 4.26 (2H, s), 3.88 (3H, s), 3.87 (3H, s), 3.84 (2H, d)

【 0 0 2 8 】

化合物 S Y 9 6 [(3 , 4 - ジメトキシ - ベンジル) - [2 - (4 - メトキシ - フェニル) - エチル] - メチル - アミン]

¹H-NMR (CDCl₃) 7.12 (2H, d), 7.86 (2H, d), 6.86 (3H, m), 3.89 (3H, s), 3.87 (3 20 H, m), 3.80 (3H, s), 3.51 (2H, s), 2.82-2.77 (2H, m), 2.65-2.60 (2H, m), 2.30 (3 H, s)

化合物 S Y 9 7 [[[3 - (3 , 4 - ジメトキシ - フェニル) - アリル] - (4 - フルオロ - ベンジル) - アミノ] - 酢酸・メチルエステル]

¹H-NMR (CDCl₃) 7.34 (2H, m), 7.03-6.87 (4H, m), 6.79 (1H, d), 6.47 (1H, d), 6 .22-6.12 (1H, td), 3.89 (3H, s), 3.86 (3H, s), 3.77 (2H, s), 3.66 (3H, s), 3.38 (2H, d), 3.34 (2H, s)

化合物 S Y 9 9 [[3 - (3 , 4 - ジメトキシ - フェニル) - アリル] - (4 - フルオロ - ベンジル) - メチル - アミン]

¹H-NMR (CDCl₃) 7.31 (2H, m), 7.05-6.97 (4H, m), 6.82 (1H, d), 6.48 (1H, d), 30 6.22-6.12 (1H, td), 3.90 (3H, s), 3.88 (3H, s), 3.52 (2H, s), 3.17 (2H, d), 2.23 (3H, s)

【 0 0 2 9 】

化合物 S Y 1 0 6 [4 - { 2 - [(ピリジン - 4 - イルメチル) - 2 - アミノ] - エチル } - フェノール]

¹H-NMR (Acetone-d₆) 8.47 (2H, d), 7.33 (2H, d), 7.05 (2H, d), 6.75 (2H, d), 3. 83 (2H, s), 2.88 (2H, br s), 2.82-2.77 (2H, m), 2.74-2.69 (2H, m)

化合物 S Y 1 0 7 [4 - { 2 - [(フラン - 3 - イルメチル) - アミノ] - エチル } - フェノール]

¹H-NMR (Acetone-d₆) 7.45 (2H, d), 7.05 (2H, d), 6.75 (2H, d), 6.42 (1H, s), 3. 40 63 (2H, s), 2.90 (2H, br s), 2.81-2.76 (2H, m), 2.72-2.61 (2H, m)

【 0 0 3 0 】

試験例 1

エポキシカロテノイド・ジオキシゲナーゼに対する阻害作用を検討した。試験はThe Plant Journal (2001) 27(4), 325-333に記載された方法に従って行った。その結果、NDGA [4 , 4' - (2,3-ジメチル-1,4-ブタンジイル)ビス-1,2-ベンゼンジオール] はネオキサントンの NCED による開裂反応を 100 μ M の濃度で完全に阻害することが明らかとなった。従って、この化合物は NCED を阻害することによりアブシジン酸生合成阻害活性を示すものと結論された。

【 0 0 3 1 】

試験例 2

上記の化合物を用いて気孔閉鎖阻害試験を行った。この試験は気孔が開いた状態で化合物を処理し、高濃度のマンノース溶液に移して閉じる状態にした時の気孔閉鎖を調べるものである。気孔の閉鎖はマンノース濃度の変化を関知した植物が体内で生合成したアブシジン酸の効果によるものである。試験はPlant Physiology (1992) 99,1258-1260の文献の方法に従い、ハウレンソウを材料にして行った。

【 0 0 3 2 】

その結果、化合物SY109, 87, 94, 99, 96, 97, 95に強い気孔閉鎖阻害活性が認められた。これらの化合物で処理した植物では、アブシジン酸の添加により気孔が閉鎖したが、一方、NDGAで処理した植物ではアブシジン酸を添加しても気孔は閉鎖しなかった。このことはNDGAがアブシジン酸生合成以外の部位に悪影響を与えて毒性を示したことによるものと予想される。以上の結果から、本発明の化合物はNDGAよりも特異的なアブシジン酸生合成阻害剤であると結論できた。

10

【 0 0 3 3 】

試験例 3

本発明の化合物のNCED阻害活性を調べた。その結果、SY109, 87, 94, 99, 96, 97, 95の化合物はいずれも100 μ Mの濃度で30%～100%のNCED阻害活性を示すことが明らかとなった。

【 0 0 3 4 】

試験例 4

本発明化合物を植物体に適用した。25℃で生育させた播種後6日目のマングビーンの胚軸をかみそりで水中で切り、所定の濃度にした化合物の溶液に胚軸部分を2cm浸漬し、浸漬6日後に根の長さを測定した。下記の結果は、一本当たりの平均の長さで示した。

20

【 0 0 3 5 】

【表 2】

化合物	長さ (cm)
SY87	0.6
SY88	>0.1
SY90	>0.1
SY94	2.1
SY95	0.6
SY96	1.5
SY97	0.7
SY99	0.4
SY106	>0.1
SY107	>0.1
SY109	1.5
コントロール	>0.1

30

40

【 0 0 3 6 】

試験例

発芽率が極端に悪くなったオオムギの種子の発芽率を化合物を処理した場合としない場合

50

で比較した。試験は15cmシャーレにろ紙を2枚しき、所定の濃度にした被験液を10 ml加え、そこに種子を100個並べ25 の明所下で培養した。1週間後に発芽した種子の割合を算出した。

【 0 0 3 7 】

【表 3】

化合物	発芽率(%)	
SY87	40	
SY88	8	10
SY90	12	
SY94	52	
SY95	29	
SY96	21	
SY97	18	
SY99	15	20
SY106	9	
SY107	10	
SY109	35	
コントロール	9	

【 0 0 3 8 】

【発明の効果】

本発明の化合物はアブシジン酸生合成阻害作用を有しており、植物の生長、発根、及び発芽の促進などのための植物生長調節剤として有用である。 30

フロントページの続き

(51) Int.Cl.		F I
C 0 7 C 217/68	(2006.01)	C 0 7 C 217/68
C 0 7 C 229/14	(2006.01)	C 0 7 C 229/14
C 0 7 D 213/38	(2006.01)	C 0 7 D 213/38
C 0 7 D 307/14	(2006.01)	C 0 7 D 307/14

(72)発明者 浅見 忠男
東京都新宿区二十騎町 1 - 6
(72)発明者 吉田 茂男
東京都練馬区貫井 3 - 2 8 - 1 5

審査官 天野 宏樹

(56)参考文献 特表平 0 6 - 5 0 1 7 1 5 (J P , A)
国際公開第 9 7 / 0 1 1 0 7 8 (W O , A 1)
特開昭 5 2 - 1 3 1 5 6 4 (J P , A)
特開昭 6 1 - 1 2 2 2 5 1 (J P , A)
特開平 1 0 - 2 5 1 2 3 4 (J P , A)
Tetrahedron , 1 9 9 5 年 , Vol. 51, No. 39 , 10737-10750
Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters , 1 9 9 6 年 , Vol. 6, No. 7 , 919-922

(58)調査した分野(Int.Cl. , D B 名)

C07C 217/84
A01N 33/10
A01N 37/44
CA(STN)
REGISTRY(STN)