

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2012 年 11 月 22 日(22.11.2012)



(10) 国際公開番号
WO 2012/157404 A1

- (51) 国際特許分類:
A01N 43/12 (2006.01) A01P 21/00 (2006.01)
A01M 21/04 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2012/060817
- (22) 国際出願日: 2012 年 4 月 23 日(23.04.2012)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:
特願 2011-111819 2011 年 5 月 18 日(18.05.2011) JP
- (71) 出願人(米国を除く全ての指定国について): 国立
大学法人 神戸大学(NATIONAL UNIVERSITY
CORPORATION KOBE UNIVERSITY) [JP/JP]; 〒
6578501 兵庫県神戸市灘区六甲台町 1 番 1 号 Hy-
ogo (JP).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人(米国についてのみ): 杉本 幸裕
(SUGIMOTO, Yukihiko) [JP/JP]; 〒6578501 兵庫県神
戸市灘区六甲台町 1 番 1 号 国立法人神戸大学
内 Hyogo (JP). 滝川 浩郷(TAKIKAWA, Hirosato)
[JP/JP]; 〒6578501 兵庫県神戸市灘区六甲台町 1
番 1 号 国立法人神戸大学内 Hyogo (JP). 佐々木
満(SASAKI, Mitsuru) [JP/JP]; 〒6578501 兵庫県神戸

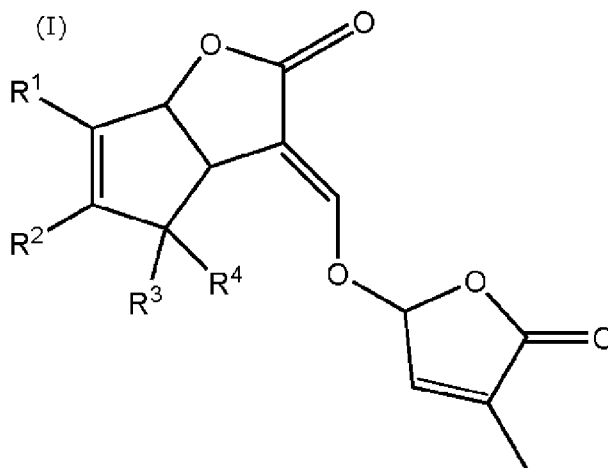
市灘区六甲台町 1 番 1 号 国立法人神戸大学内
Hyogo (JP).

- (74) 代理人: 庄司 隆, 外(SHOJI, Takashi et al.); 〒
5320011 大阪府大阪市淀川区西中島五丁目 6 番
1 3 号 御幸ビル 307 号 Osaka (JP).
- (81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保
護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA,
BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO,
CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI,
GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS,
JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS,
LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX,
MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT,
QA, RO, RS, RU, RW, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST,
SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ,
VC, VN, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保
護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW,
MZ, NA, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシ
ア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨー
ロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE,
ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC,
MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR),

[続葉有]

(54) Title: ROOT PARASITIC PLANT GERMINATION MODIFIER AND METHOD FOR CONTROL OF ROOT PARASITIC PLANT USING SAME

(54) 発明の名称: 根寄生植物発芽調節剤及びそれを用いる根寄生植物の防除方法



(57) Abstract: The present invention provides a novel root parasitic plant germination modifier, a root parasitic plant control agent comprising that germination modifier, and a method for controlling a root parasitic plant using that control agent. The root parasitic plant germination modifier is a compound with a specific steric structure and is represented by formula (I) (In the formula (I), R¹ and R² are bonded together to form a five- or six-member ring that is a benzene ring, an unsubstituted cycloalkenyl ring, or an optionally methyl-substituted cycloalkenyl ring, or R¹ and R² independently represent a hydrogen atom, methyl group, ethyl group, or a C₃-C₆ straight chain or branched lower alkyl group; R³ is selected from a group consisting of a hydrogen atom, hydroxyl group, or acetoxy group; and R⁴ is a hydrogen atom).

(57) 要約:

[続葉有]



WO 2012/157404 A1



OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告 (条約第 21 条(3))

発明は、新規な根寄生植物発芽調節剤を提供する。また、当該根寄生植物発芽調節剤を含む根寄生植物防除剤を提供する。さらには、当該根寄生植物防除剤を用いて根寄生植物を防除する方法を提供する。下記の一般式(I)で表され、かつ特定の立体構造を有する化合物による。(式(I)中、 R^1 と R^2 は、結合して五～六員環のいずれかの環を形成していてもよく、前記環はベンゼン環、又は非置換若しくはメチル基で置換されていてもよいシクロアルケニル環であり、あるいはそれぞれ独立して水素原子、メチル基、エチル基、又は $C_3\sim C_6$ の直鎖状若しくは分枝状の低級アルキル基を表し、 R^3 は、水素原子、水酸基、アセトキシ基より選択され、 R^4 は、水素原子である。)

明 細 書

発明の名称：

根寄生植物発芽調節剤及びそれを用いる根寄生植物の防除方法

技術分野

[0001] 本発明は、新規な根寄生植物発芽調節剤に関する。また本発明は、当該根寄生植物発芽調節剤を含む根寄生植物防除剤に関する。さらには、当該根寄生植物防除剤を用いて根寄生植物を防除する方法に関する。

[0002] 本出願は、参照によりここに援用されるところの日本出願、特願2011-111819号優先権を請求する。

背景技術

[0003] 異種の生物と一緒に生活している現象を共生といい、このうち、一方（寄生者）が利益を受け、他方（宿主）が何らかの害を被っている関係を寄生という。寄生植物は吸器と呼ばれる特殊な器官を形成して宿主に侵入し、通導組織を連結し、そこを通して養水分を奪って成長する。宿主との連結部位に応じて、茎寄生植物、根寄生植物と呼ぶ。ストライガ(Striga spp.)やオロバンキ(Orobancha spp.)などは根寄生植物であり、多くのマメ科植物や穀物を宿主とし、農業に甚大な被害をもたらしている。ストライガは、アフリカ、南アジアの熱帯から亜熱帯の半乾燥地域に分布している根寄生植物であり、ソルガム、トウモロコシ等の主要な植物を宿主とし、農業生産に甚大な被害を与えている。ストライガには、S. hermonthica、S. aspera、S. forbesii、S. asiatica、S. gesnerioidesなどがある。オロバンキは、地中海沿岸、中東地域を中心地域として温帯から亜寒帯まで広く分布しており、ヨーロッパ、オーストラリアで被害が拡大している。オロバンキには、O. ramosa、O. minor、O. cernua、O. aegyptiacaなどがある。

[0004] これらの根寄生植物の種子は、宿主となる植物（以降、単に「宿主植物」ともいう。）の根の近傍でのみ発芽することが知られている。これは、宿主植物の根から何らかの種子発芽刺激活性物質が分泌されており、それを感じ

して根寄生植物の種子が発芽するということを示唆している。1966年、ストリゴール(Strigol)がワタの根滲出液から種子発芽刺激活性物質として初めて単離された(非特許文献1)。さらに1990年代になって、ストリゴールと類似した構造を持つソルゴラクトン(Sorgolactone)とアレクトロール(Alectrol)が、それぞれストライガの宿主植物であるソルガムとササゲから単離された(非特許文献2)。また、オロバンキの宿主植物であるアカクローバーの根滲出液からはオロバンコール(Orobanchol)が単離された。これらの物質はストリゴラクトン(Strigolactones)と総称され、根寄生植物の種子発芽刺激活性物質として作用することが判明している。

[0005] 根寄生植物は、宿主植物の根に寄生するため、宿主植物に作用する除草剤を使用することができない。従って、ストライガやオロバンキ等の根寄生植物の防除方法の一つとして、宿主植物を播種する前の土壌に、種子発芽刺激活性物質(発芽促進物質)を散布し、土壌中の根寄生植物種子を強制的に発芽させ、周囲に宿主植物がない状態で枯死に至らしめるという方法が提案されている。この方法は、上記根寄生植物が宿主に寄生することなく、独立しては生存できないことを利用している。この種子発芽刺激活性物質としては、ストリゴール、ソルゴラクトン、アレクトール、オロバンコール、ジャスモン酸、ブラシノライド、ブラシノステロイド(カステステロン等)、ククルビン酸、ジヒドロソルゴレオン、コチレニン、フシコクシン、GR-7、GR-24、ナイメヘン-1などが挙げられる。これらの中でも、下記の天然物であるストリゴール及びソルゴラクトン、並びに合成物であるGR-7及びGR-24の活性が高いことが知られており、種子発芽刺激活性物質を用いた根寄生植物の防除方法について開示がある(特許文献1)。また、ストリゴラクトンと類似する化合物のうち、ソラナコール(Solanacol)についての報告もある(非特許文献3)。ここではソラナコールのうち特定の立体構造を有する化合物について、マメ科植物に対する腋芽成長抑制活性が、GR-24との比較において報告されている。

[0006] その後、根寄生植物の防除への利用を目的として、様々なストリゴラクト

ン類縁体の合成が行われたが、これまでのところ実用化に至ったものはない。

先行技術文献

非特許文献

- [0007] 非特許文献1 : C. E. Cook, et al., Science, 1966, 154, 1189-1190
非特許文献2 : Y. Sugimoto, et al., Journal of Organic Chemistry, 1998, 63, 1259-1267
非特許文献3 : Victor X. Chen, et al., Chem. Eur. J., 2010, 16, 13941-13945

特許文献

- [0008] 特許文献1 : 特開 2 0 0 6 - 2 8 2 5 1 3 号公報

発明の概要

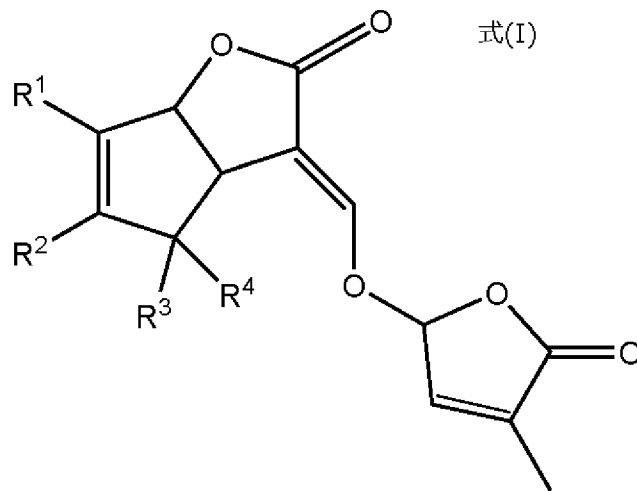
発明が解決しようとする課題

- [0009] 本発明は、新規な根寄生植物発芽調節剤を提供することを課題とする。また本発明は、当該根寄生植物発芽調節剤を含む根寄生植物防除剤を提供することを課題とする。さらには、当該根寄生植物防除剤を用いて根寄生植物を防除する方法を提供することを課題とする。

課題を解決するための手段

- [0010] 本発明者らは、上記課題を解決するために鋭意検討を重ねた結果、下記の一般式(I)で表され、かつ特定の立体構造を有する化合物が、根寄生植物の発芽調節剤として機能しうることを見出し、本発明を完成した。本発明において、同じ分子式からなる化合物であっても、立体構造の違いにより、根寄生植物に対して種子発芽阻害作用又は種子発芽刺激活性作用を有することを確認した。さらに、本発明の根寄生植物発芽調節剤、即ち種子発芽阻害物質及び／又は種子発芽刺激活性物質を利用することで、根寄生植物を防除しうることを見出し、本発明を完成した。

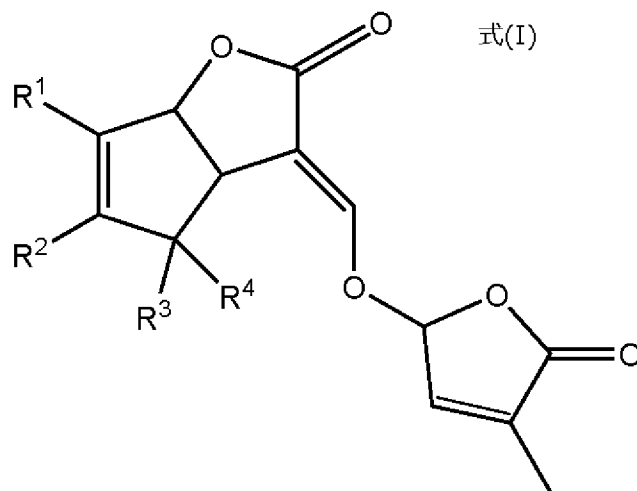
[化1]



[0011] すなわち本発明は、以下よりなる。

1. 下記の一般式(I)で表され、かつ特定の立体構造を有する化合物からなる根寄生植物発芽調節剤。

[化1]

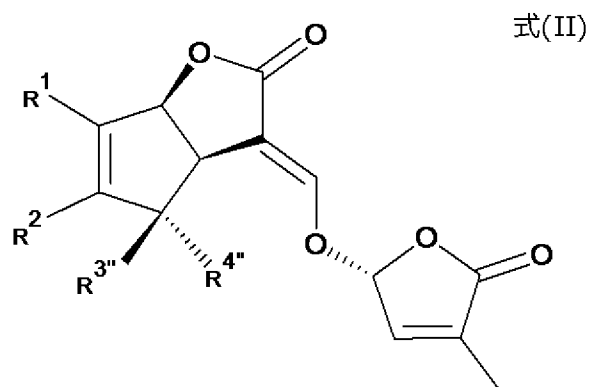


(式(I)中、 R^1 と R^2 は、結合して五～六員環のいずれかの環を形成していてもよく、前記環はベンゼン環、又は非置換若しくはメチル基で置換されていてもよいシクロアルケニル環であり、あるいはそれぞれ独立して水素原子、メチル基、エチル基、又は $C_3 \sim C_6$ の直鎖状若しくは分枝状の低級アルキル基を表

し、R³は、水素原子、水酸基、アセトキシ基より選択され、R⁴は、水素原子である。)

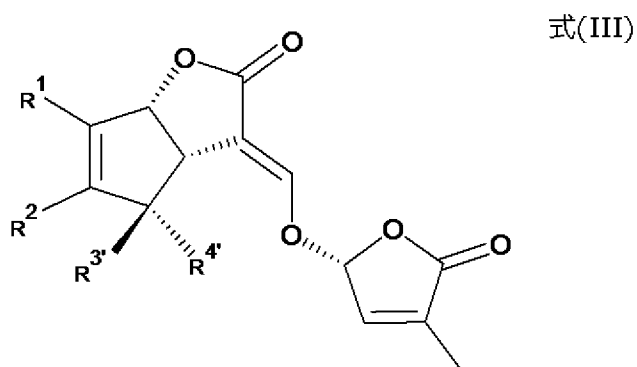
2. 特定の立体構造を有する化合物が、以下の一般式(II)又は一般式(III)で表され、一般式(II)で表される化合物が根寄生植物の種子発芽阻害物質であり、一般式(III)で表される化合物が根寄生植物の種子発芽刺激活性物質であることを特徴とする、前項1に記載の根寄生植物発芽調節剤。

[化2]



(式(II)中、 R^1 と R^2 は、結合して五～六員環のいずれかの環を形成していてもよく、前記環はベンゼン環、又は非置換若しくはメチル基で置換されていてもよいシクロアルケニル環であり、あるいはそれぞれ独立して水素原子、メチル基、エチル基、又は $C_3\sim C_6$ の直鎖状若しくは分枝状の低級アルキル基を表し、 $R^{3'}$ は、水素原子であり、 $R^{4'}$ は、水素原子、水酸基、若しくはアセトキシ基である。)

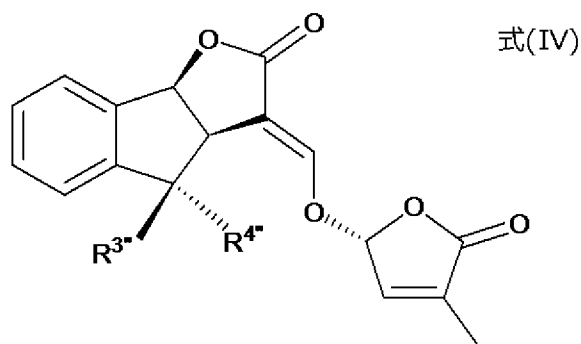
[化3]



(式(III)中、 R^1 と R^2 は、結合して五～六員環のいずれかの環を形成していてもよく、前記環はベンゼン環、又は非置換若しくはメチル基で置換されていてもよいシクロアルケニル環であり、あるいはそれぞれ独立して水素原子、メチル基、エチル基、又は $C_3 \sim C_6$ の直鎖状若しくは分枝状の低級アルキル基を表し、 $R^{3'}$ は、水素原子、水酸基、アセトキシ基より選択され、 $R^{4'}$ は、水素原子である。ただし、上記一般式(III)で表される化合物のうち、 R^1 と R^2 が結合してベンゼン環を構成する場合は、 $R^{3'}$ 及び $R^{4'}$ が共に水素原子である場合を除く。)

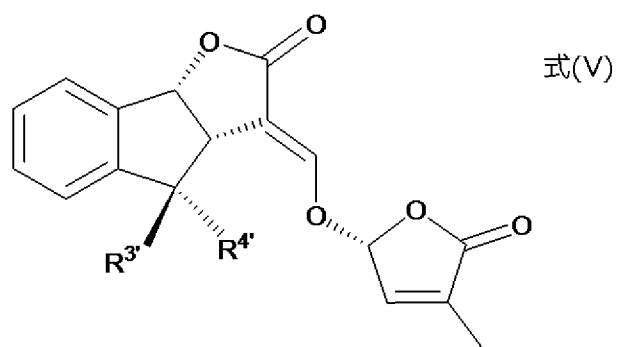
3. 特定の立体構造を有する化合物が、以下の一般式(IV)又は一般式(V)で表され、一般式(IV)で表される化合物が根寄生植物の種子発芽阻害物質であり、一般式(V)で表される化合物が根寄生植物の種子発芽刺激活性物質であることを特徴とする、前項2に記載の根寄生植物発芽調節剤。

[化4]



(式(IV)中、 $R^{3'}$ は、水素原子であり、 $R^{4'}$ は、水素原子、水酸基、若しくはアセトキシ基である。)

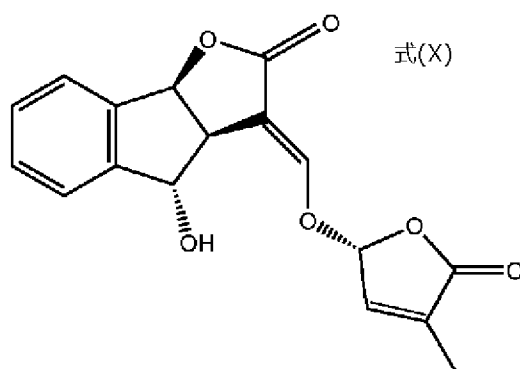
[化5]



(式(V)中、 $R^{3'}$ は、水酸基、若しくはアセトキシ基であり、 $R^{4'}$ は、水素原子である。)

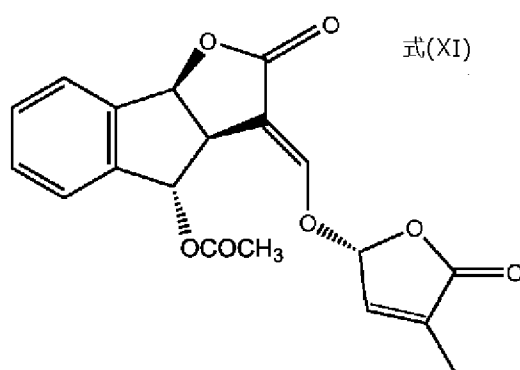
4. 特定の立体構造を有する化合物が、以下の式(X)～(XVI)のいずれかで表される化合物であり、根寄生植物の種子発芽阻害物質であることを特徴とする、前項2又は3に記載の根寄生植物発芽調節剤。

[化10]



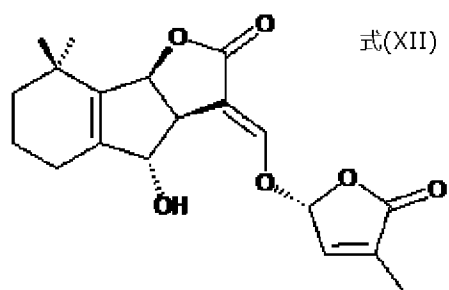
(3a*S*, 4*S*, 8b*S*, 2' *R*)-3-{[(*E*)-(2', 5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furanyl)oxy]methylene}-3, 3a, 4, 8b-tetrahydro-4-hydroxy-2*H*-indeno[1, 2-*b*]furan-2-one

[化11]



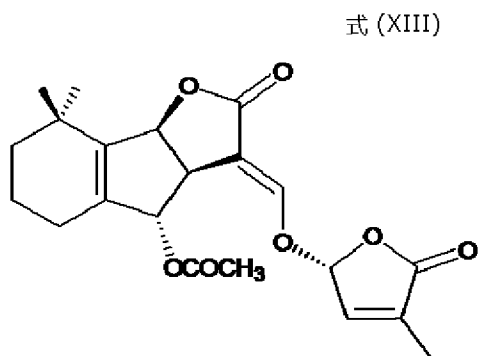
(3a*S*, 4*S*, 8b*S*, 2' *R*)-4-acetoxy-3-{[(*E*)-(2', 5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furan-2-yl)oxy]methylene}-3, 3a, 4, 8b-tetrahydro-2H-indeno[1, 2-*b*]furan-2-one

[化12]



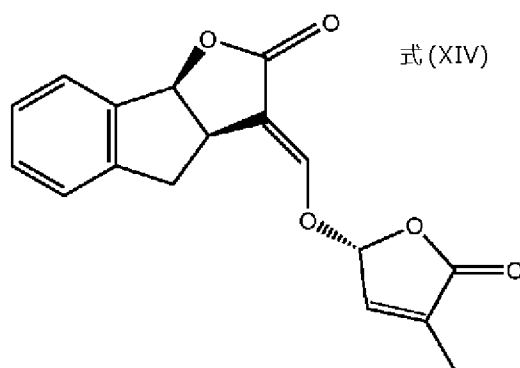
(3a*S*, 4*S*, 8b*S*, 2' *R*)-3-{[(*E*)-(2', 5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furan-2-yl)oxy]methylene}-3, 3a, 4, 5, 6, 7, 8, 8b-octahydro-4-hydroxy-8, 8-dimethyl-2H-indeno[1, 2-*b*]furan-2-one

[化13]



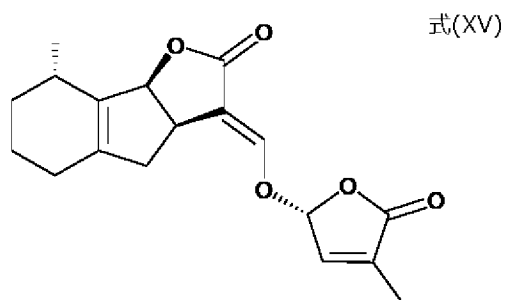
(3a*S*, 4*S*, 8*bS*, 2' *R*)-4-acetoxy-3-{[(*E*)-(2', 5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furanyl)oxy]methylene}-3, 3a, 4, 5, 6, 7, 8, 8*b*-octahydro-8, 8-dimethyl-2*H*-Indeno[1, 2-*b*]furan-2-one

[化14]



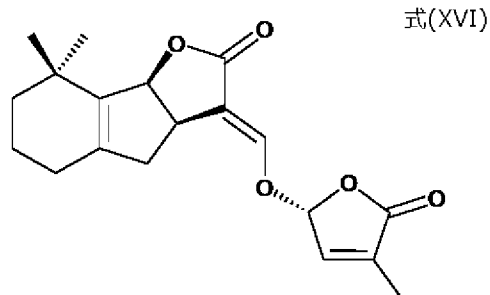
(3a*R*, 8*bS*, 2' *R*)-3-{[(*E*)-(2', 5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furanyl)oxy]methylene}-3, 3a, 4, 8*b*-tetrahydro-2*H*-indeno[1, 2-*b*]furan-2-one

[化15]



(3a*R*, 8*S*, 8*bS*, 2' *R*)-3-{[(*E*)-(2', 5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furanyl)oxy]methylene}-3, 3a, 4, 5, 6, 7, 8, 8*b*-octahydro-8-methyl-2*H*-Indeno[1, 2-*b*]furan-2-one

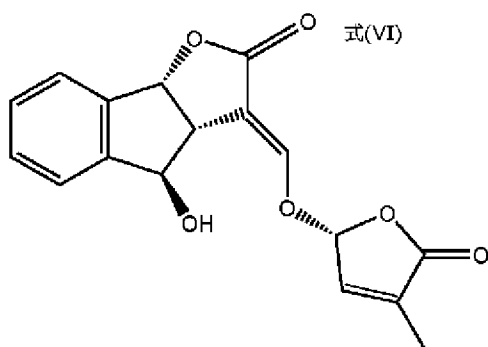
[化16]



(3aR, 8bS, 2' R)-3-{[(E)-(2', 5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furan-2-yl)oxy]methylene}-3, 3a, 4, 5, 6, 7, 8, 8b-octahydro-8, 8-dimethyl-2H-Indeno[1, 2-b]furan-2-one

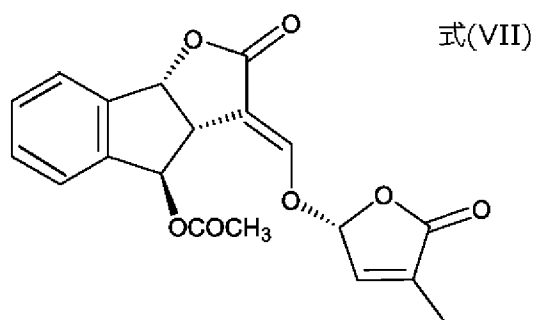
5. 特定の立体構造を有する化合物が、以下の式(VI)～(IX)のいずれかで表される化合物であり、根寄生植物の種子発芽刺激活性物質であることを特徴とする、前項2又は3に記載の根寄生植物発芽調節剤。

[化6]



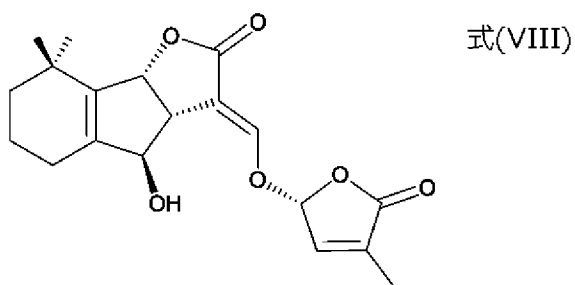
(3aR, 4R, 8bR, 2' R) -3-{[(E)-(2', 5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furan-2-yl)oxy]methylene}-3, 3a, 4, 8b-tetrahydro-4-hydroxy-2H-indeno[1, 2-b]furan-2-one

[化7]



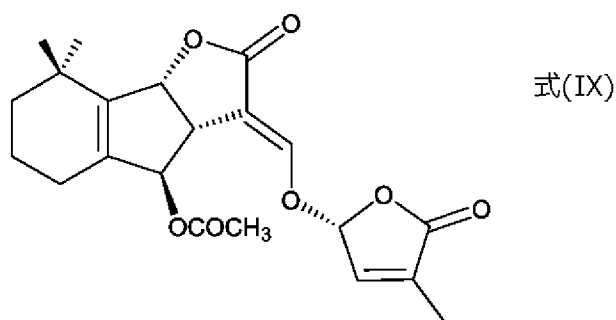
(3aR, 4R, 8bR, 2' R)-4-acetoxy-3-{[(E)-(2', 5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furan-2'-oxy)methylene]-3, 3a, 4, 8b-tetrahydro-2H-indeno[1, 2-b]furan-2-one

[化8]



(3aR, 4R, 8bR, 2' R)-3-{[(E)-(2', 5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furan-2'-oxy)methylene]-3, 3a, 4, 5, 6, 7, 8, 8b-octahydro-4-hydroxy-8, 8-dimethyl-2H-Indeno[1, 2-b]furan-2-one

[化9]



(3aR, 4R, 8bR, 2' R)-4-acetoxy-3-{[(E)-(2', 5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-

-furanyl)oxy]methylene}-3,3a,4,5,6,7,8,8b-octahydro-8,8-dimethyl-2H-Indeno[1,2-b]furan-2-one

6. 根寄生植物が、ストライガゲスネルオイデス (*S. gesnerioides*) である、前項 1～5 のいずれか 1 に記載の根寄生植物発芽調節剤。

7. 前項 1～6 のいずれか 1 に記載の根寄生植物発芽調節剤を含む根寄生植物防除剤。

8. 前項 1～6 のいずれか 1 に記載の根寄生植物発芽調節剤を用いることを特徴とする、根寄生植物の防除方法。

発明の効果

[0012] 本発明の根寄生植物発芽調節剤によると、同じ化学式で示される化合物であっても、立体構造の違いにより、根寄生植物に対して種子発芽阻害作用又は種子発芽刺激活性作用を有する。本発明の根寄生植物発芽調節剤のうち、例えば、一般式(II)で表される立体構造式からなる化合物は、根寄生植物の種子発芽阻害作用を示し、一般式(III)で表される構造式からなる化合物は、根寄生植物の種子発芽刺激活性作用を示す。本発明の種子発芽阻害物質は、種子発芽刺激物質が存在する場合であっても、種子発芽を阻害することが確認された。

[0013] 土壌等に、本発明の根寄生植物発芽調節剤のうち種子発芽阻害物質を用いて処理することで、根寄生植物の種子発芽を阻害することができ、根寄生植物が宿主植物に寄生するのを防除することができる。また、土壌等に、本発明の根寄生植物発芽調節剤のうち種子発芽刺激活性物質を用いて処理することで、宿主植物が存在しない場合に宿主植物から根寄生植物に対する栄養が供給されない状態で種子を発芽させ、根寄生植物を枯死させることができる。これにより、根寄生植物を防除することができる。

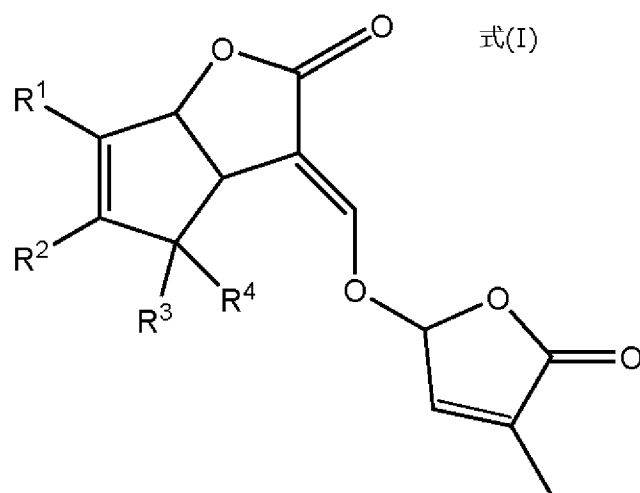
発明を実施するための形態

[0014] 本明細書において、「根寄生植物」とは、前述のごとく宿主の根に連結して寄生する植物をいう。本明細書における根寄生植物の具体例として、背景技術の欄でも示したが、ストライガ(*Striga* spp.)やオロバンキ(*Orobanch*

pp.)が挙げられる。ストライガとして、*S. hermonthica*、*S. aspera*、*S. forbesii*、*S. asiatica*、*S. gesnerioides*などが例示され、オロバンキとして、*O. ramosa*、*O. minor*、*O. cernua*、*O. aegyptiaca*などが例示される。本発明の根寄生植物発芽調節剤は、特に好適には*S. gesnerioides*に対して作用する。本明細書において「宿主植物」とは、本明細書の根寄生植物が寄生しうる植物であればよく、特に限定されない。例えばマメ科植物やナス科植物、穀物等が挙げられ、より具体的には、ササゲ及びタバコなどが挙げられる。

[0015] 本発明の根寄生植物発芽調節剤は、下記の一般式(I)で表され、かつ特定の立体構造を有する化合物からなる。

[化1]



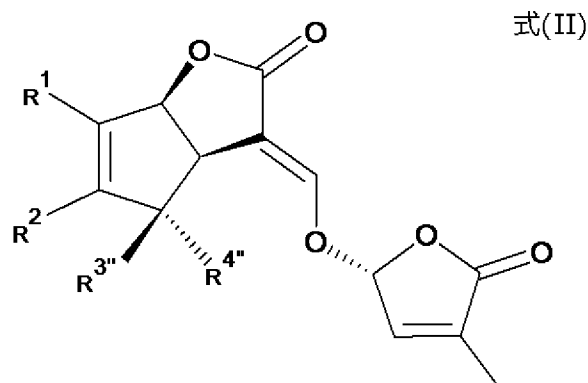
(式(I)中、 R^1 と R^2 は、結合して五～六員環のいずれかの環を形成していてもよく、前記環はベンゼン環、又は非置換若しくはメチル基で置換されていてもよいシクロアルケニル環であり、あるいはそれぞれ独立して水素原子、メチル基、エチル基、又は $C_3 \sim C_6$ の直鎖状若しくは分枝状の低級アルキル基を表し、 R^3 は、水素原子、水酸基、アセトキシ基より選択され、 R^4 は、水素原子である。ただし、本発明において、上記一般式(I)で表される化合物のうち、 R^1 と R^2 が結合してベンゼン環を構成する場合は、 R^3 及び R^4 が共に水素原子である場合を除く。)

[0016] 本発明において、根寄生植物の種子発芽調節剤としては、種子発芽阻害物

質及び種子発芽刺激活性物質が挙げられ、何れであってもよいが、特に好適には種子発芽阻害物質が挙げられる。以下、種子発芽阻害物質及び種子発芽刺激活性物質の立体構造式を一般式で示し、さらに具体的に例示して説明する。以下の具体的な例示としては、種子発芽阻害物質及び種子発芽刺激活性物質は、順不同で説明する。

[0017] 本発明において、根寄生植物発芽調節剤の立体構造の具体例として、以下の一般式(II)又は一般式(III)で表すことができる。本発明において、一般式(II)で表される立体構造式からなる化合物は、根寄生植物の種子発芽阻害物質であり、一般式(III)で表される立体構造式からなる化合物は、根寄生植物の種子発芽刺激活性物質である。

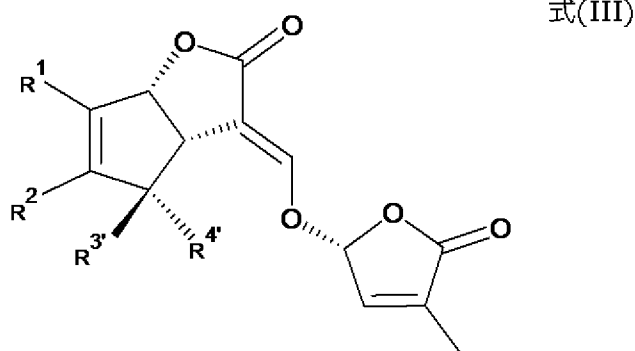
[化2]



(式(II)中、 R^1 と R^2 は、結合して五～六員環のいずれかの環を形成していてもよく、前記環はベンゼン環、又は非置換若しくはメチル基で置換されていてもよいシクロアルケニル環であり、あるいはそれぞれ独立して水素原子、メチル基、エチル基、又は $C_3 \sim C_6$ の直鎖状若しくは分枝状の低級アルキル基を表し、 R^3 は、水素原子であり、 R^4 は、水素原子、水酸基、若しくはアセトキシ基である。)

[0018]

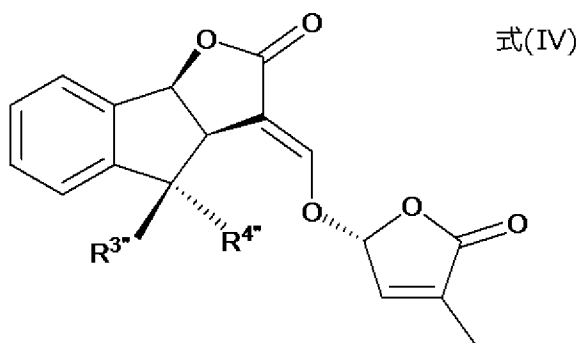
[化3]



(式(III)中、 R^1 と R^2 は、結合して五～六員環のいずれかの環を形成していてもよく、前記環はベンゼン環、又は非置換若しくはメチル基で置換されていてもよいシクロアルケニル環であり、あるいはそれぞれ独立して水素原子、メチル基、エチル基、又は $C_3 \sim C_6$ の直鎖状若しくは分枝状の低級アルキル基を表し、 $R^{3'}$ は、水素原子、水酸基、アセトキシ基より選択され、 $R^{4'}$ は、水素原子である。ただし、本発明において、上記一般式(III)で表される化合物のうち、 R^1 と R^2 が結合してベンゼン環を構成する場合は、 $R^{3'}$ 及び $R^{4'}$ が共に水素原子である場合を除く。)

[0019] 本発明において、以下の一般式(IV)又は一般式(V)で表すことができる。本発明において、一般式(IV)で表される立体構造式からなる化合物は、種子発芽阻害物質であり、一般式(V)で表される立体構造式からなる化合物は、種子発芽刺激活性物質である。

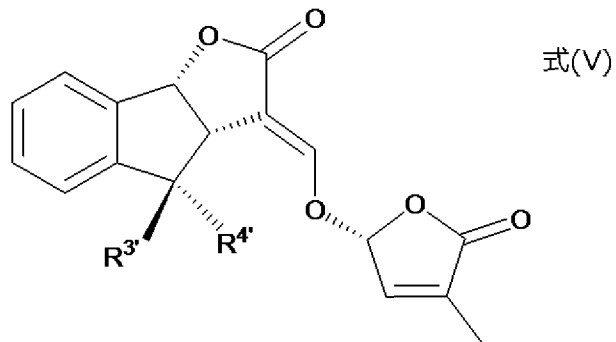
[化4]



(式(IV)中、 $R^{3''}$ は、水素原子であり、 $R^{4''}$ は、水酸基、若しくはアセトキシ基

である。)

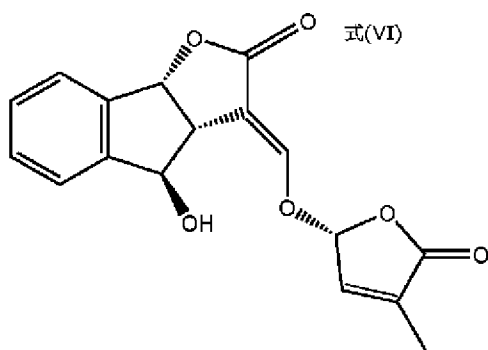
[化5]



(式(V)中、 $R^{3'}$ は、水酸基、若しくはアセトキシ基であり、 $R^{4'}$ は、水素原子である。)

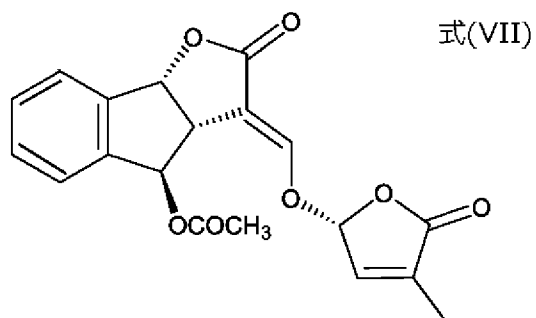
[0020] 本発明において、一般式(III)又は(V)で示される種子発芽刺激活性物質の具体例として、以下の式(VI)～式(IX)に示す立体構造からなる化合物が例示される。

[0021] [化6]



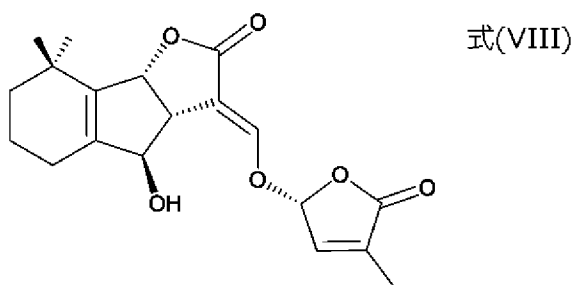
(3aR, 4R, 8bR, 2' R) -3-[[(E)-(2', 5' -dihydro-4' -methyl-5' -oxo-2' -furan-2-yl)oxy]methylene]-3, 3a, 4, 8b-tetrahydro-4-hydroxy-2H-indeno[1, 2-b]furan-2-one

[化7]



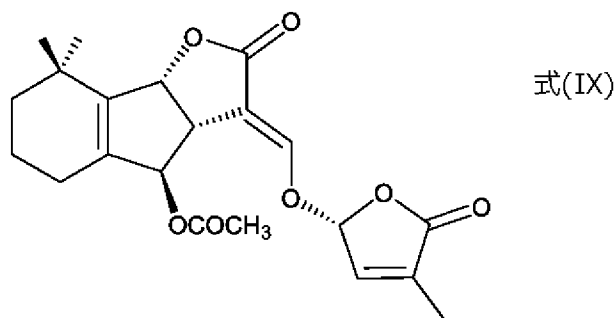
(3aR, 4R, 8bR, 2' R)-4-acetoxy-3-{[(E)-(2', 5' -dihydro-4' -methyl-5' -oxo-2' -furanlyl)oxy]methylene}-3, 3a, 4, 8b-tetrahydro-2H-indeno[1, 2-b]furan-2-one

[化8]



(3aR, 4R, 8bR, 2' R)-3-{[(E)-(2', 5' -dihydro-4' -methyl-5' -oxo-2' -furanlyl)oxy]methylene}-3, 3a, 4, 5, 6, 7, 8, 8b-octahydro-4-hydroxy-8, 8-dimethyl-2H-Indeno[1, 2-b]furan-2-one

[化9]

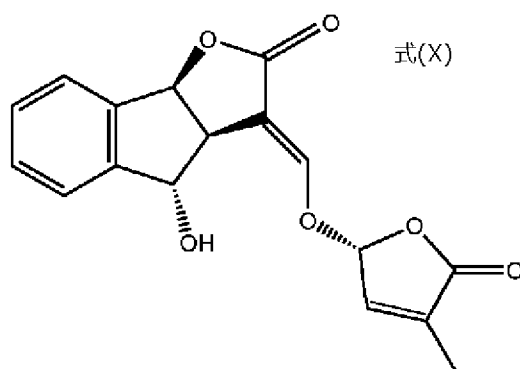


(3aR, 4R, 8bR, 2' R)-4-acetoxy-3-{[(E)-(2', 5' -dihydro-4' -methyl-5' -oxo-2' -

-furanyl)oxy]methylene}-3, 3a, 4, 5, 6, 7, 8, 8b-octahydro-8, 8-dimethyl-2H-indeno[1, 2-b]furan-2-one

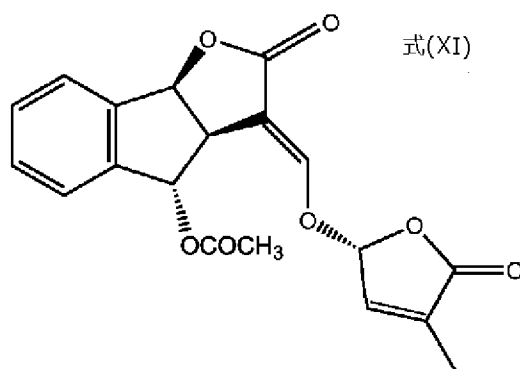
[0022] 本発明において、一般式(II)又は(IV)で示される種子発芽阻害物質の具体例として、以下の式(X)～式(XIV)に示す立体構造からなる化合物が例示される。

[化10]



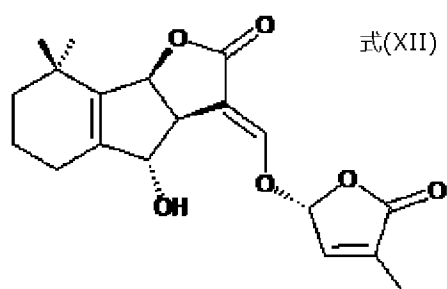
(3a*S*, 4*S*, 8b*S*, 2' *R*)-3-{[(*E*)-(2', 5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furanyl)oxy]methylene}-3, 3a, 4, 8b-tetrahydro-4-hydroxy-2H-indeno[1, 2-b]furan-2-one

[化11]



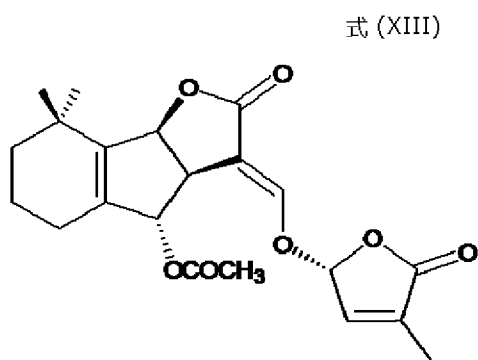
(3a*S*, 4*S*, 8b*S*, 2' *R*)-4-acetoxy-3-{[(*E*)-(2', 5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furanyl)oxy]methylene}-3, 3a, 4, 8b-tetrahydro-2H-indeno[1, 2-b]furan-2-one

[化12]



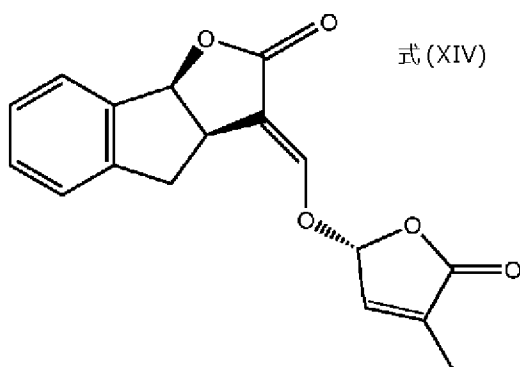
(3a*S*, 4*S*, 8*bS*, 2' *R*)-3-{[(*E*)-(2', 5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furanyl)oxy]methylene}-3, 3a, 4, 5, 6, 7, 8, 8*b*-octahydro-4-hydroxy-8, 8-dimethyl-2*H*-Indeno[1, 2-*b*]furan-2-one

[化13]



(3a*S*, 4*S*, 8*bS*, 2' *R*)-4-acetoxy-3-{[(*E*)-(2', 5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furanyl)oxy]methylene}-3, 3a, 4, 5, 6, 7, 8, 8*b*-octahydro-8, 8-dimethyl-2*H*-Indeno[1, 2-*b*]furan-2-one

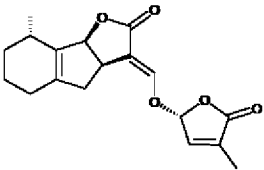
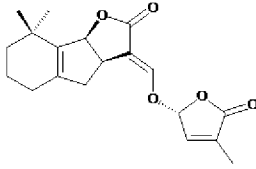
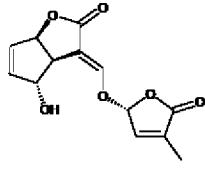
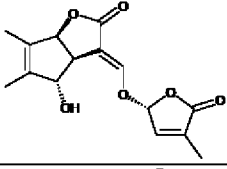
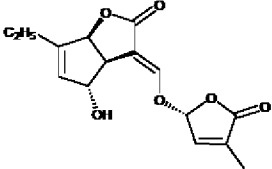
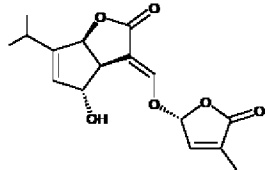
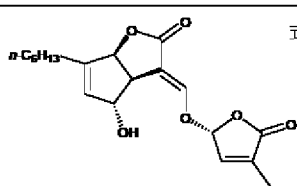
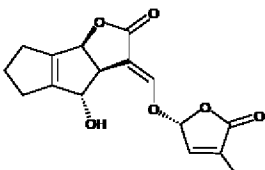
[化14]



(3aR, 8bS, 2' R)-3-{[(E)-(2', 5' -dihydro-4' -methyl-5' -oxo-2' -furan-2-yl)oxy]methylene}-3, 3a, 4, 8b-tetrahydro-2H-indeno[1, 2-b]furan-2-one

[0023] 本発明において、一般式(II)又は(IV)で示される種子発芽阻害物質の更なる具体例として、表 1 に示す以下の式(XV)～式(XXII)に示す立体構造からなる化合物が例示される。

[表1]

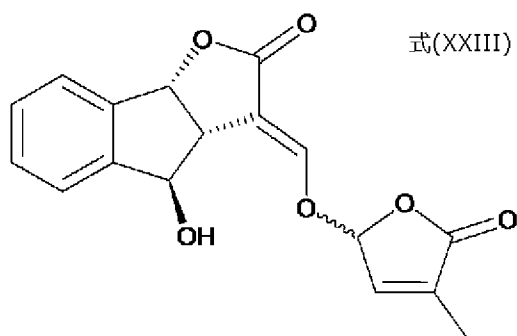
構造式	化合物名
 式(XV)	(3aR,8S,8bS,2'R)-3-{[(E)-(2',5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furyl)oxy]methylene}-3,3a,4,5,6,7,8,8b-octahydro-8-methyl-2H-Indeno[1,2-b]furan-2-one
 式(XVI)	(3aR,8bS,2'R)-3-{[(E)-(2',5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furyl)oxy]methylene}-3,3a,4,5,6,7,8,8b-octahydro-8,8-dimethyl-2H-Indeno[1,2-b]furan-2-one
 式(XVII)	(3aR,4R,6R,2'R)-3-{[(E)-(2',5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furyl)oxy]methylene}-3,3a,4,6a-tetrahydro-4-hydroxy-2H-cyclopenta[b]furan-2-one
 式(XVIII)	(3aR,4S,6S,2'R)-3-{[(E)-(2',5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furyl)oxy]methylene}-3,3a,4,6a-tetrahydro-4-hydroxy-5,6-dimethyl-2H-cyclopenta[b]furan-2-one
 式(XIX)	(3aR,4R,6S,2'R)-6-ethyl-3-{[(E)-(2',5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furyl)oxy]methylene}-3,3a,4,6a-tetrahydro-4-hydroxy-2H-cyclopenta[b]furan-2-one
 式(XX)	(3aR,4R,6S,2'R)-3-{[(E)-(2',5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furyl)oxy]methylene}-3,3a,4,6a-tetrahydro-4-hydroxy-6-isopropyl-2H-cyclopenta[b]furan-2-one
 式(XXI)	(3aR,4R,6S,2'R)-3-{[(E)-(2',5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furyl)oxy]methylene}-6-hexyl-3,3a,4,6a-tetrahydro-4-hydroxy-2H-cyclopenta[b]furan-2-one
 式(XXII)	(3aR,4S,7bS,2'R)-3-{[(E)-(2',5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furyl)oxy]methylene}-3a,4,5,6,7,7b-hexahydro-4-hydroxy-3H-pentaleno[1,2-b]furan-2-one

[0024] 本明細書において、種子発芽阻害物質は、根寄生植物に対して種子発芽刺

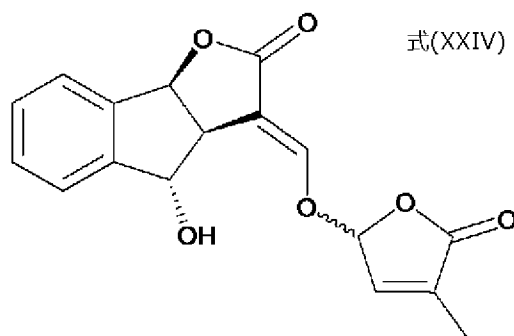
激活性物質による発芽を阻害しうる活性を有する物質をいう。ここにおいて、種子発芽刺激活性物質は、人為的に添加されるものであってもよいが、例えば宿主植物から分泌される種子発芽刺激物質であってよい。この場合における種子発芽刺激活性物質としては、自体公知のものであってもよく、例えばストリゴール、ソルゴラクトン、アレクトール、オロバンコール、ジャスモン酸、ブラシノライド、ブラシノステロイド（カステステロン等）、ククルビン酸、ジヒドロソルゴレオン、コチレニン、フシコクシン、GR-7、GR-24、ナイメヘン-1などが挙げられる。本発明の種子発芽阻害物質は、宿主植物から分泌される種子発芽刺激物質の存在下で、根寄生植物の発芽を阻害しうることから、宿主植物の発芽には影響を及ぼさずに、根寄生植物の発芽のみ阻害しうる。

[0025] 本発明物質の根寄生植物発芽調節剤、次の方法により製造することができる。以下の式(XXIII)の光学活性ジアステレオマー混合物及び同様に式(XXIV)の混合物は、例えば、非特許文献4（H. Takikawa, H. Imaishi, A. Tanaka, S. Jikumaru, M. Fujiwara, M. Sasaki, *Tetrahedron: Asymmetry*, 2010, 21, 1166-1168）に記載の方法により製造することができる。式(XXIII)又は式(XXIV)で表される光学活性ジアステレオマー混合物を、カラムクロマトグラフィーにより分離、精製して、式(VI)に示す化合物A(a)又は式(X)に示す化合物A(b)を得ることができる。

[化23]



[化24]



[0026] 本発明は、上記いずれかに示される根寄生植物発芽調節剤を含む「根寄生植物防除剤」にも及ぶ。本発明の根寄生植物防除剤の剤形としては、一般に根寄生植物防除剤に慣用されている剤形にしたものであればよく、特に限定されない。このようなものとしては、例えば粉剤、微粒剤、顆粒剤、乳剤、水和剤、懸濁剤、ドライフロアブル、フロアブル、水性液剤、油剤、燻煙剤、エアゾール剤、マイクロカプセル剤などが挙げられる。根寄生植物防除剤の製剤化に際して用いられる担体などの賦形剤、界面活性剤、固着剤、分散剤、安定剤などの添加剤については、一般に根寄生植物防除剤に慣用されているものの中から適宜選択することができる。

[0027] 担体としては、固体担体、液体担体、ガス状担体のいずれも用いることができる。この固体担体の例としては、粘土類（例えば、カオリナイト、酸性白土、ケイソウ土、合成含水酸化ケイ素、ベントナイト）、タルク類、その他の無機鉱物（例えば、炭酸カルシウム、石英粉末、活性炭、水和シリカ）、化学肥料（例えば、硫安、塩安、磷安、尿素）、有機物（例えば、サトウキビ、樹皮末、タバコ茎末）等の微粉末あるいは粒状物を挙げることができる。液体担体の例としては、水、アルコール類（例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール）、ケトン類（例えば、アセトン、メチルエチルケトン）、炭化水素類（例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン、シクロヘキサン、メチルナフタレン）、エステル類（例えば酢酸エチル、酢酸ブチル）、エーテル類（例えば、ジオキサン、ジイソプロピルエーテル）、酸アミド類（例えば、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド）などを挙げ

ることができる。

[0028] 界面活性剤としては、例えば、アルキル硫酸エステル類、アルキルスルホン酸塩、アルキルアリールスルホン酸塩、アルキルアリールエーテル類及びそのポリオキシエチレン化物、ポリエチレングリコールエーテル類、多価アルコールエステル類、糖アルコール誘導体などを挙げることができる。

[0029] 固着剤や分散剤としては、例えば、カゼイン、ゼラチン、多糖類（例えば、でんぷん、アラビアゴム、セルロース誘導体）、リグニン誘導体、ベントナイト、糖類、合成水溶性高分子（例えば、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、ポリアクリル酸類）などを挙げることができる。

[0030] 安定剤としてはPAP（酸性リン酸イソプロピル）、BHT（2，6 - ジ - t - ブチル - 4 - メチルフェノール）、植物油、鉱物油、脂肪酸、又はそのエステル類を挙げることができる。ただし、製剤に用いられる原料としては、従来公知の原料であれば、これらに限定されるものではない。

[0031] 本発明は、根寄生植物発芽調節剤を用いることを特徴とする、根寄生植物の防除方法にも及ぶ。根寄生植物は寄生を確立した後で宿主植物からの養分に依存するだけでなく、生活環の初期の段階において、すでに宿主植物と密接に関係している。すなわち、根寄生植物の種子は適当な温湿度条件下で休眠から醒めた後、宿主植物等の根から分泌される種子発芽刺激活性物質を感受して発芽する。本発明の根寄生植物の防除方法として、本発明の根寄生植物発芽調節剤のうち「種子発芽阻害物質」を、根寄生植物の種子に直接作用させることで、根寄生植物を防除することができる。

[0032] 一方、宿主植物を播種する前の畑に、根寄生植物の種子に対して種子発芽刺激活性物質を散布し、土壌中の根寄生植物種子を強制的に発芽させることで、宿主植物からの養分が供給されない状態にしておき、枯死させる方法が挙げられる。この場合には、本発明の根寄生植物発芽調節剤のうち、特に「種子発芽刺激活性物質」を利用することができる。

[0033] 本発明の根寄生植物発芽調節剤を含む根寄生植物防除剤を上記用途に供するには、この根寄生植物発芽調節剤を含む水性剤や粉剤等を、共生地域又は

栽培地域に所定濃度で散布するか、あるいは噴霧することによって達成される。また、あらかじめ栽培地域の土壌中に浸透させておいてもよい。

実施例

[0034] 本発明の理解を深めるために、以下の製造例及び試験例により更に具体的に本発明を説明するが、本発明はこれらに限定されるものではないことは明らかである。

[0035] (製造例 1) 化合物A(a) (式(VI) : (3aR, 4R, 8bR, 2' R)-3-{[(E)-(2', 5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furanyl)oxy]methylene}-3, 3a, 4, 8b-tetrahydro-4-hydroxy-2H-indeno[1, 2-b]furan-2-one)) の製造

[0036] 非特許文献 4 の方法に従い製造された左旋性を有する光学活性三環性ラクトン(-)-(3aR, 4R, 8bR,)-4-hydroxy-3, 3a, 4, 8b-tetrahydro-4-hydroxy-2H-indeno[1, 2-b]furan-2-one (101 mg, 0.532 mmol)を、非特許文献 5 (E. M. Mungus, et al., Journal of Agricultural Food Chemistry, 1992, 40, 1230-1235)に記載の方法により、光学活性ジアステレオマー混合物 (A+epi-A, 53 mg, 32%)へと変換した。

得られた光学活性ジアステレオマー混合物 (A+epi-A) を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=2/1) で精製し、溶出順序がより速い化合物 epi-A (27 mg) 及び溶出順序がより遅い化合物A (24 mg) をそれぞれ得た。

[0037] 化合物epi-A(a) : mp. 68 - 69 °C. $[\alpha]_D^{27}$ -264 (c 0.902, CHCl₃). ¹H-NMR (CDCl₃, 300 MHz) δ 2.04 (br s, 3H, 4'-Me), 3.81 (ddd, J = 1.8, 2.7, 7.5 Hz, 1H, 3a-H), 5.32 (br s, 1H, 4-H), 6.08 (d, J = 7.5 Hz, 1H, 8b-H), 6.24 (t, J = 1.5 Hz, 1H, 2'-H), 7.00 (t, J = 1.5 Hz, 1H, 3'-H), 7.42-7.54 (m, 5H, 5-, 6-, 7-, 8- and 9-H). ¹³C-NMR (CDCl₃, 75 MHz) δ 10.7, 50.4, 79.6, 84.2, 100.5, 110.1, 125.6, 126.5, 130.0, 130.7, 136.2, 139.1, 140.9, 143.9, 151.8, 170.1, 170.9.

[0038] 化合物A(a) : mp. 65 - 66 °C. $[\alpha]_D^{27}$ -154 (c 1.10, CHCl₃). ¹H-NMR (CDCl₃, 300 MHz) δ 2.05 (br s, 3H, 4'-Me), 3.80-3.84 ((ddd, J = 1.8, 2.7, 7.5

Hz, 1H, 3a-H), 5.32 (br s, 1H, 4-H), 6.10 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H, 8b-H), 6.22 (t, $J = 1.5$ Hz, 1H, 2'-H), 7.00 (t, $J = 1.5$ Hz, 1H, 3'-H), 7.41–7.56 (m, 5H, 5-, 6-, 7-, 8- and 9-H). ^{13}C -NMR (CDCl_3 , 75 MHz) δ 10.8, 50.4, 79.6, 84.1, 100.7, 110.1, 125.6, 126.6, 130.2, 130.8, 136.1, 139.2, 140.9, 143.8, 152.0, 170.1, 170.7.

[0039] (製造例2) 化合物A(b) (式(X): (3aS, 4S, 8bS, 2'R)-3-{[(E)-(2', 5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furan-2-yl)oxy]methylene}-3, 3a, 4, 8b-tetrahydro-4-hydroxy-2H-indeno[1, 2-b]furan-2-one)) の製造

[0040] 製造例1に示す非特許文献4の方法に従い製造された右旋性を有する三環性ラクトン(+)-(3aS, 4S, 8bS,)-4-hydroxy-3, 3a, 4, 8b-tetrahydro-4-hydroxy-2H-indeno[1, 2-b]furan-2-one (119 mg, 0.620 mmol)を、同様に非特許文献5に記載の方法により、混合物(A(b) + epi-A(b), 55 mg, 28%)へと変換した。得られた混合物(A(b) + epi-A(b))を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=2/1)で精製し、溶出順序がより速い化合物A(b) (23 mg)及び溶出順序がより遅い化合物epi-A(b) (9.0 mg)をそれぞれ得た。また、ジアステレオマー混合物 (33 mg)を回収した。

化合物A(b): mp. 64–65 °C. $[\alpha]_D^{27} +267$ (c 0.804, CHCl_3).

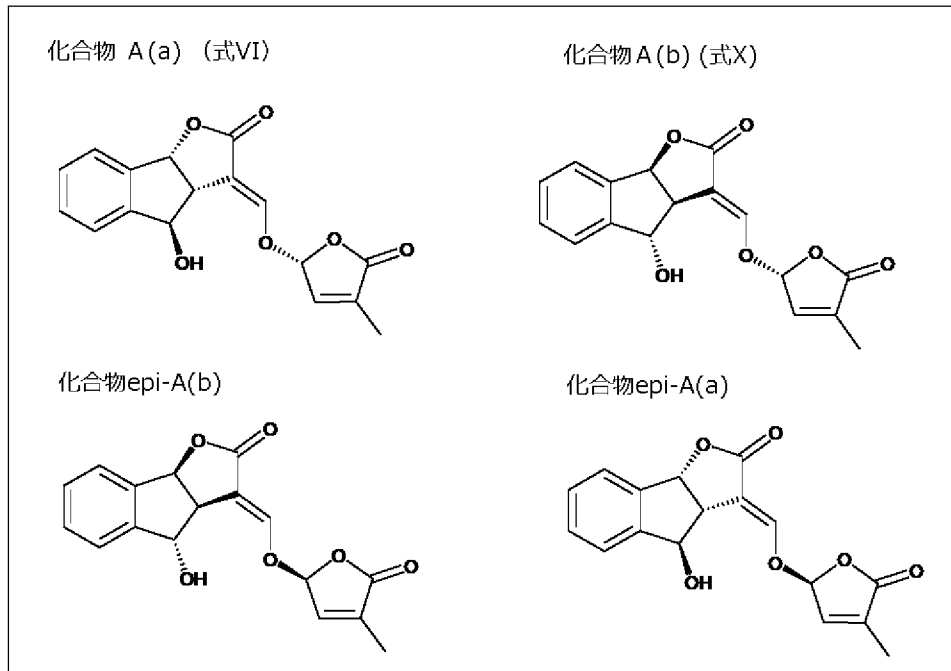
化合物epi-A(b): mp. 78–80 °C. $[\alpha]_D^{27} +177$ (c 0.290, CHCl_3).

[0041] (試験例1) 種子発芽試験 (1)

製造例1及び2で製造した各試験化合物10 μmol を秤量し、アセトン2 mlに溶かした。これらを蒸留水を用いて、各々0.1 μM 、10 μM に希釈した。次に、シャーレにろ紙を敷き、ろ紙上にコンディショニングしたストライガの種子をのせ、希釈した各試験化合物を種子に対して20 μl ずつ処理した。湿度を維持するために、水滴が流れ出さない程度に湿らせたろ紙を四つ折にしてシャーレ中央に入れた。シャーレにパラフィルムを捲いて、シャーレをアルミホイルで包み、30°Cでインキュベートした。48時間後、発芽した種子の数を数え、発芽率(%)を測定した。発芽率(%)は、全種子数に対する発芽した種子数(発芽した種子数/全種子数)により算出した。試験した化合物(ラセミ

体 (A(b) + epi-A(a))、ラセミ体 (A(a)+ epi-A(b)) 及び4つの光学異性体 (A(a)、A(b)、epi-A(a)及びepi-A(b)) の *S. gesnerioides* に対する発芽刺激活性試験結果を表2に示した。上記の結果、式(VI)に示す化合物A(a)に高い種子発芽刺激活性が認められた。

[0042] [化25]



[0043] [表2]

	発芽率 (%)					
	ラセミ体 A(b)+epi-A(a)	ラセミ体 A(a)+epi-A(b)	A(a)	A(b)	epi-A(b)	epi-A(a)
0.1 μ M	0	2.04	8.70	0	0	0.67
10 μ M	0	0.72	19.04	0.37	0.69	2.29

[0044] (試験例2) 種子発芽試験 (2)

試験例1と同手法により式(VI)に示す化合物A(a)と式(X)に示す化合物A(b)の等量混合溶液を調製し、希釈した各試験化合物を種子に対して20 μ lずつ処理した。その結果、種子発芽刺激活性物質である化合物A(a)による種子発芽誘導は、化合物A(b)によって阻害された(表3)。従って、化合物A(b)は種子発芽阻害物質であることが確認された。

[0045]

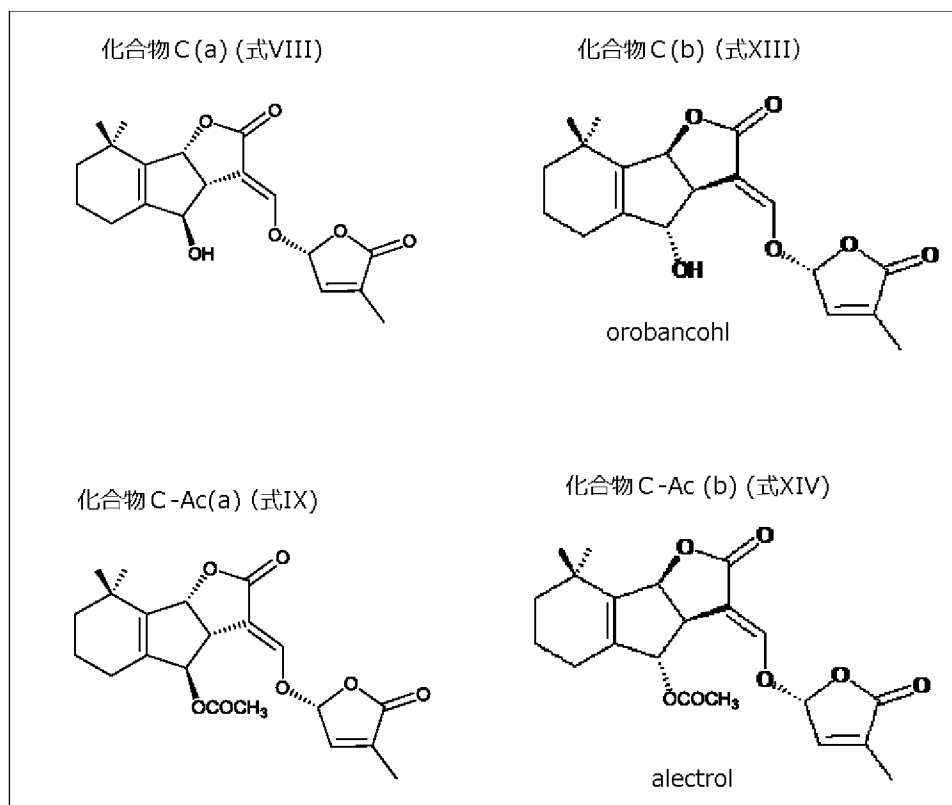
[表3]

	発芽率 (%)	
	A(a)+A(b)	A(a)
0.1 μ M	0	8.70
10 μ M	2.30	19.04

[0046] (試験例3) 種子発芽試験 (3)

試験例2の化合物A(a)の代わりにS. gesnerioidesの宿主植物であるササゲの水耕液を用いた。このササゲ水耕液には、本発明の種子発芽刺激活性作用を示す化合物である、式(VIII)及び式(IX)に示す物質が含まれている。なお、式(VIII)及び式(IX)に示す化合物及びその活性は、本発明において、初めて確認されたものである。

[化26]



式(VIII)に示す化合物は、(3aR, 4R, 8bR, 2' R)-3-{[(E)-(2', 5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furan-1-yloxy)methylene]-3, 3a, 4, 5, 6, 7, 8, 8b-octahydro-4-hydroxy-8, 8-dimethyl-2H-Indeno[1, 2-b]furan-2-oneであり、式(IX)に示す

化合物は、(3aR, 4R, 8bR, 2' R)-4-acetoxy-3-{[(E)-(2', 5' -dihydro-4' -methyl-5' -oxo-2' -furanlyloxy)methylene]-3, 3a, 4, 5, 6, 7, 8, 8b-octahydro-8, 8-dimethyl-2H-Indeno[1, 2-b]furan-2-one}である。

[0047] その結果、ササゲ水耕液による種子発芽誘導は、化合物A(b)によって阻害された(表4)。このことから、化合物A(b)は種子発芽阻害物質であることが確認された。

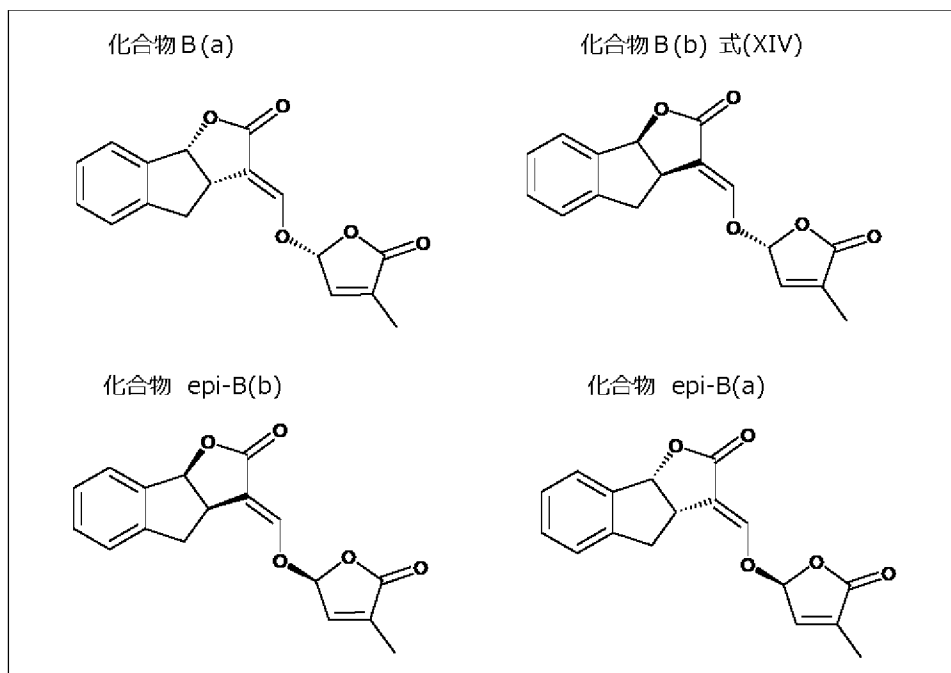
[表4]

化合物A(b)の濃度 (μM)	発芽率 (%)
0	38.0
0.1	7.47
10	0.63

[0048] (試験例4) 種子発芽試験(4)

試験例3の化合物A(b)の代わりに式(XIV)に示す化合物B(b)を用いた。本試験例においても、ササゲの水耕液を用いた。このササゲ水耕液には、本発明の種子発芽刺激活性作用を示す化合物である、式(VIII)及び式(IX)に示す物質が含まれている。

[0049] [化27]



[0050] その結果、ササゲ水耕液による種子発芽誘導は、化合物B(b)によって阻害された（表5）。このことから、化合物B(b)は種子発芽阻害物質であることが確認された。

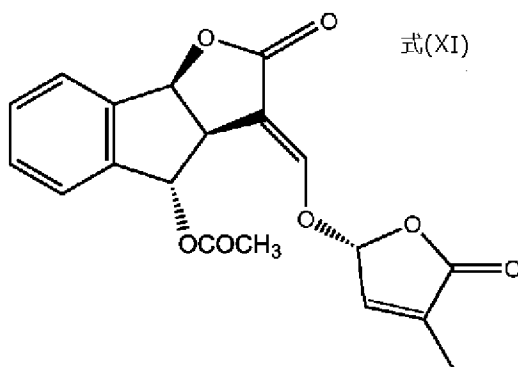
[表5]

化合物B(b)の濃度(μM)	発芽率(%)
0	33.46
0.1	2.26
10	0

[0051] （試験例5）種子発芽試験（5）

試験例3の化合物A(b)の代わりに式(XI)に示す化合物A-Ac(b)を用いた。本試験例においても、ササゲの水耕液を用いた。このササゲ水耕液には、本発明の種子発芽刺激活性作用を示す化合物である、式(VIII)及び式(IX)に示す物質が含まれている。

[化11]



[0052] その結果、ササゲ水耕液による種子発芽誘導は、化合物A-Ac(b)によって阻害された（表6）。このことから、化合物A-Ac(b)は種子発芽阻害物質であることが確認された。

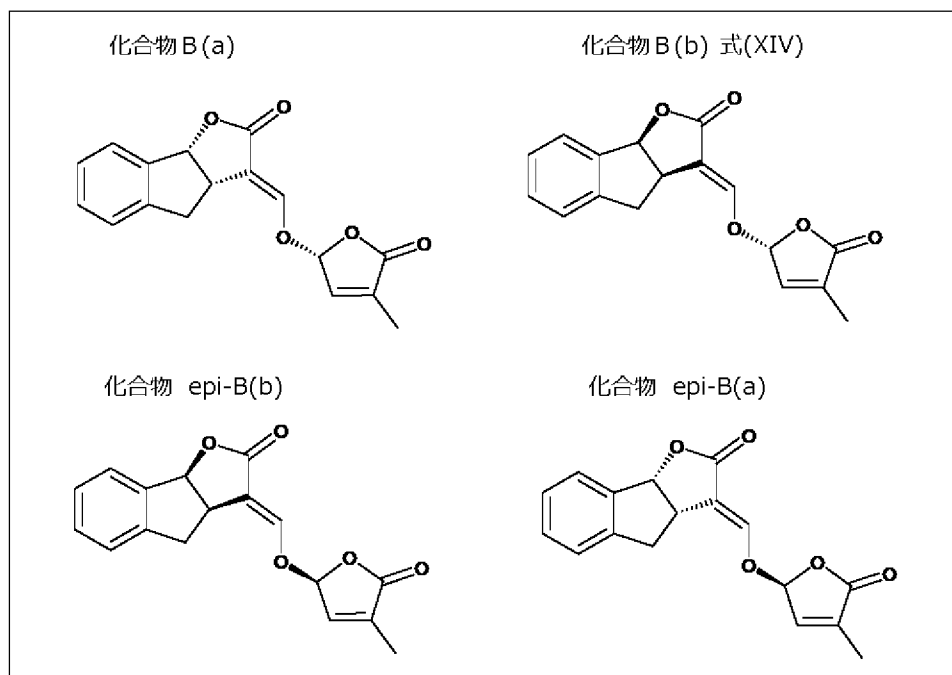
[表6]

化合物A-Ac(b)の濃度(μM)	発芽率(%)
0	35.82
0.1	0.31
10	0.31

[0053] (比較例) 種子発芽試験 (6)

本比較例では、以下に示す化合物B(a), epi-B(a), B(b)及びepi-B(b)のいずれかを含むGR-24のラセミ体及び4つの光学異性体 (非特許文献6 : J. W. J. F. Thuring, et al, Journal of Agricultural and Food Chemistry, 1997, 45, 2278-2283) について、S. gesnerioidesに対する種子発芽刺激活性を、試験例1と同手法により確認した。

[0054] [化27]



[0055] その結果、各ラセミ体及び各々光学異性体とも、S. gesnerioidesに対して種子発芽刺激活性は全く示さなかった。

[表7]

	発芽率 (%)					
	ラセミ体 B(a)+epi-B(b)	ラセミ体 epi-B(a)+B(b)	B(a)	B(b)	epi-B(b)	epi-B(a)
0.1 μ M	0	0	0	0	0	0
10 μ M	0.47	0.84	0.69	0	0.95	0.31

産業上の利用可能性

[0056] 以上詳述したように、本発明の根寄生植物発芽調節剤によると、同じ化学

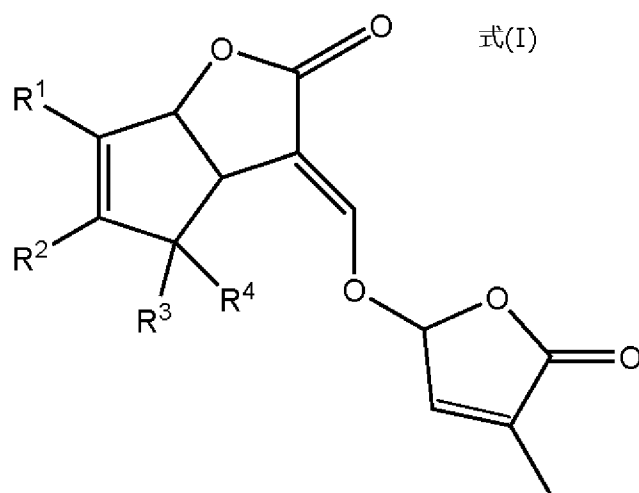
式で示される化合物であっても、立体構造の違いにより根寄生植物に対して種子発芽刺激活性作用又は種子発芽阻害作用を有する。土壤等に、本発明の根寄生植物発芽調節剤のうち種子発芽刺激活性物質を用いて処理することで、宿主植物が存在しない場合に宿主植物から根寄生植物に対する栄養が供給されない状態で種子を発芽させ、根寄生植物を枯死させることができる。これにより、根寄生植物を防除することができる。また、土壤等に、本発明の根寄生植物発芽調節剤のうち種子発芽阻害物質を用いて処理することで、根寄生植物の発芽を阻害することができ、根寄生植物が宿主植物に寄生するのを防除することができる。

[0057] 本発明の特定の立体構造を有する化合物が、根寄生植物のうち特に*S. gesnerioides*に対して種子発芽刺激活性作用又は種子発芽阻害作用を有することを初めて見出した。これらの本発明の根寄生植物発芽調節剤を用いることにより、農業生産に及ぼしている甚大な被害を軽減化することができる。

請求の範囲

[請求項1] 下記的一般式(I)で表され、かつ特定の立体構造を有する化合物からなる根寄生植物発芽調節剤。

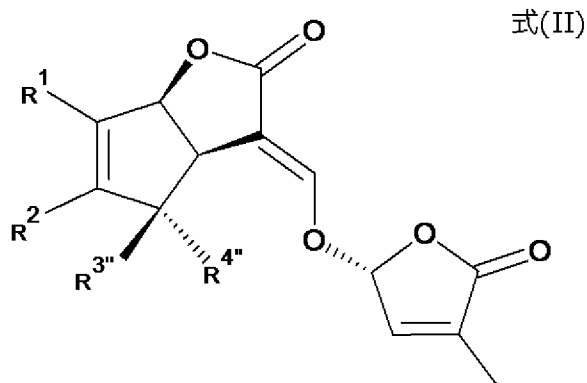
[化1]



(式(I)中、 R^1 と R^2 は、結合して五～六員環のいずれかの環を形成していてもよく、前記環はベンゼン環、又は非置換若しくはメチル基で置換されていてもよいシクロアルケニル環であり、あるいはそれぞれ独立して水素原子、メチル基、エチル基、又は $C_3 \sim C_6$ の直鎖状若しくは分枝状の低級アルキル基を表し、 R^3 は、水素原子、水酸基、アセトキシ基より選択され、 R^4 は、水素原子である。)

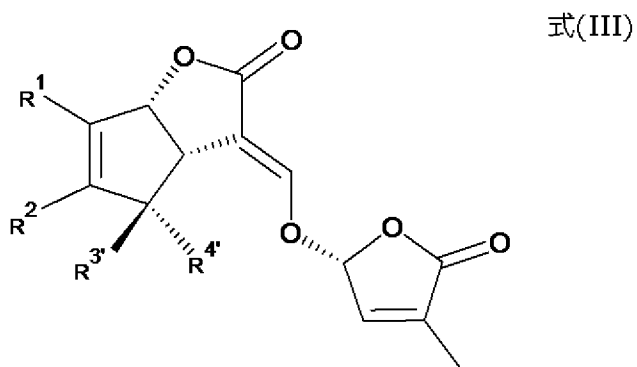
[請求項2] 特定の立体構造を有する化合物が、以下の一般式(II)又は一般式(III)で表され、一般式(II)で表される化合物が根寄生植物の種子発芽阻害物質であり、一般式(III)で表される化合物が根寄生植物の種子発芽刺激活性物質であることを特徴とする、請求項1に記載の根寄生植物発芽調節剤。

[化2]



(式(II)中、 R^1 と R^2 は、結合して五～六員環のいずれかの環を形成していてもよく、前記環はベンゼン環、又は非置換若しくはメチル基で置換されていてもよいシクロアルケニル環であり、あるいはそれぞれ独立して水素原子、メチル基、エチル基、又は $C_3 \sim C_6$ の直鎖状若しくは分枝状の低級アルキル基を表し、 R^3 は、水素原子であり、 R^4 は、水素原子、水酸基、若しくはアセトキシ基である。)

[化3]

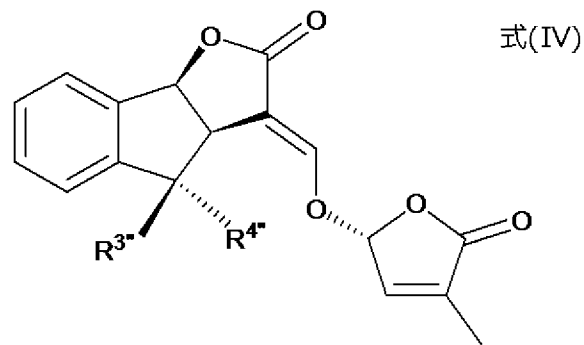


(式(III)中、 R^1 と R^2 は、結合して五～六員環のいずれかの環を形成していてもよく、前記環はベンゼン環、又は非置換若しくはメチル基で置換されていてもよいシクロアルケニル環であり、あるいはそれぞれ独立して水素原子、メチル基、エチル基、又は $C_3 \sim C_6$ の直鎖状若しくは分枝状の低級アルキル基を表し、 R^3 は、水素原子、水酸基、アセトキシ基より選択され、 R^4 は、水素原子である。ただし、上記一般式(I

II)で表される化合物のうち、 R^1 と R^2 が結合してベンゼン環を構成する場合は、 $R^{3'}$ 及び $R^{4'}$ が共に水素原子である場合を除く。)

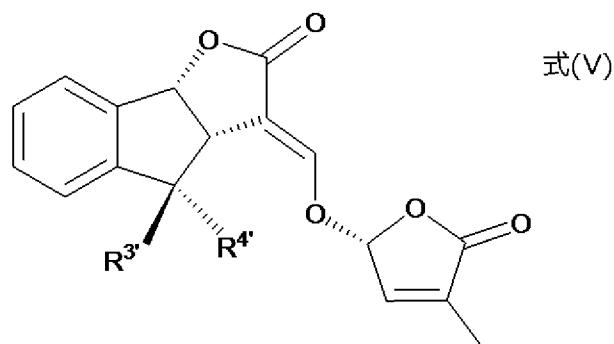
[請求項3] 特定の立体構造を有する化合物が、以下の一般式(IV)又は一般式(V)で表され、一般式(IV)で表される化合物が根寄生植物の種子発芽阻害物質であり、一般式(V)で表される化合物が根寄生植物の種子発芽刺激活性物質であることを特徴とする、請求項2に記載の根寄生植物発芽調節剤。

[化4]



(式(IV)中、 $R^{3''}$ は、水素原子であり、 $R^{4''}$ は、水素原子、水酸基、若しくはアセトキシ基である。)

[化5]

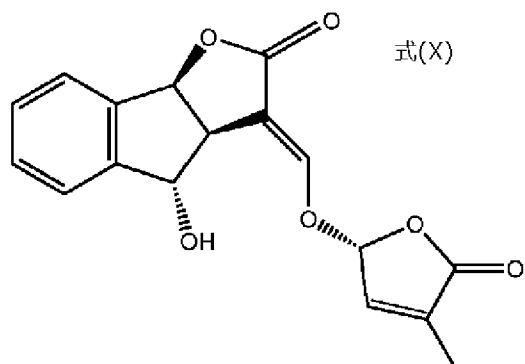


(式(V)中、 $R^{3'}$ は、水酸基、若しくはアセトキシ基であり、 $R^{4'}$ は、水素原子である。)

[請求項4] 特定の立体構造を有する化合物が、以下の式(X)～(XVI)のいずれかで表される化合物であり、根寄生植物の種子発芽阻害物質であることを

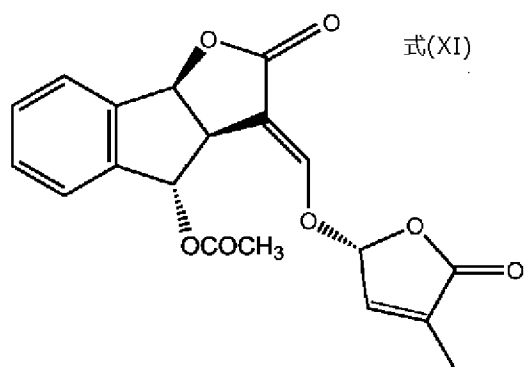
特徴とする、請求項 2 又は 3 に記載の根寄生植物発芽調節剤：

[化10]



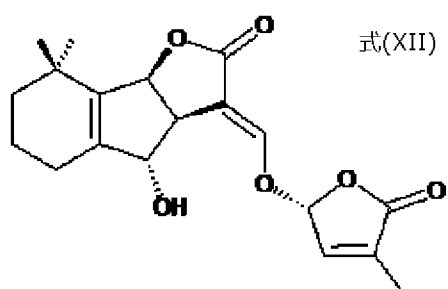
(3a*S*, 4*S*, 8b*S*, 2' *R*)-3-{[(*E*)-(2', 5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furyl)oxy]methylene}-3, 3a, 4, 8b-tetrahydro-4-hydroxy-2H-indeno[1, 2-b]furan-2-one

[化11]



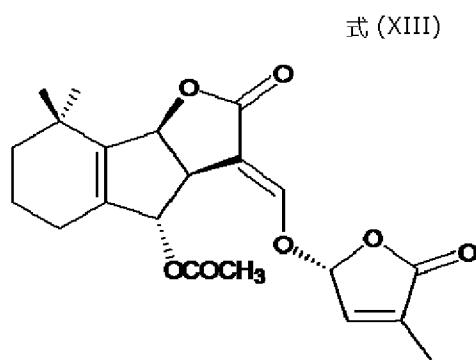
(3a*S*, 4*S*, 8b*S*, 2' *R*)-4-acetoxy-3-{[(*E*)-(2', 5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furyl)oxy]methylene}-3, 3a, 4, 8b-tetrahydro-2H-indeno[1, 2-b]furan-2-one

[化12]



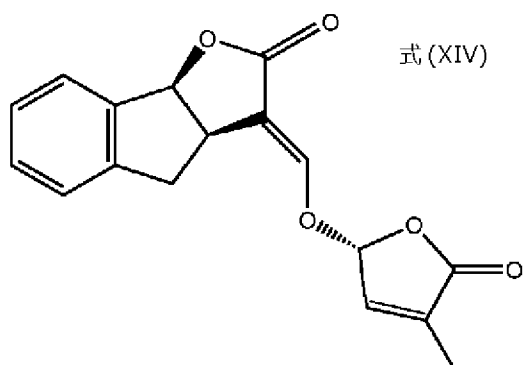
(3a*S*, 4*S*, 8b*S*, 2' *R*)-3-{[(*E*)-(2', 5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furyl)oxy]methylene}-3, 3a, 4, 5, 6, 7, 8, 8b-octahydro-4-hydroxy-8, 8-dimethyl-2*H*-Indeno[1, 2-*b*]furan-2-one

[化13]



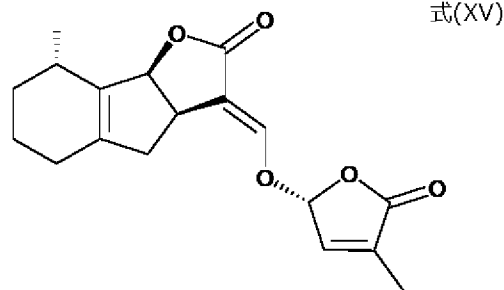
(3a*S*, 4*S*, 8b*S*, 2' *R*)-4-acetoxy-3-{[(*E*)-(2', 5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furyl)oxy]methylene}-3, 3a, 4, 5, 6, 7, 8, 8b-octahydro-8, 8-dimethyl-2*H*-Indeno[1, 2-*b*]furan-2-one

[化14]



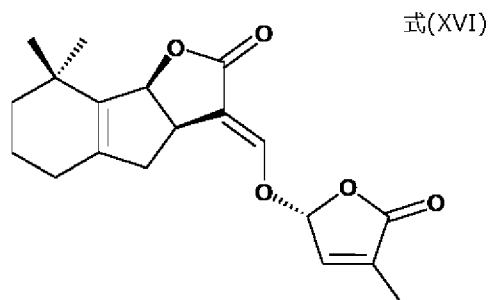
(3aR, 8bS, 2' R)-3-{[(E)-(2', 5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furan
yl)oxy]methylene}-3, 3a, 4, 8b-tetrahydro-2H-indeno[1, 2-b]furan-2
-one

[化15]



(3aR, 8S, 8bS, 2' R)-3-{[(E)-(2', 5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-fu
ranyl)oxy]methylene}-3, 3a, 4, 5, 6, 7, 8, 8b-octahydro-8-methyl-2H-I
ndeno[1, 2-b]furan-2-one

[化16]

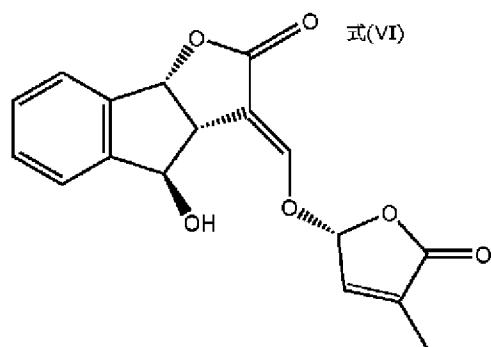


(3aR, 8bS, 2' R)-3-{[(E)-(2', 5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furan
yl)oxy]methylene}-3, 3a, 4, 5, 6, 7, 8, 8b-octahydro-8, 8-dimethyl-2H-
Indeno[1, 2-b]furan-2-one

[請求項5]

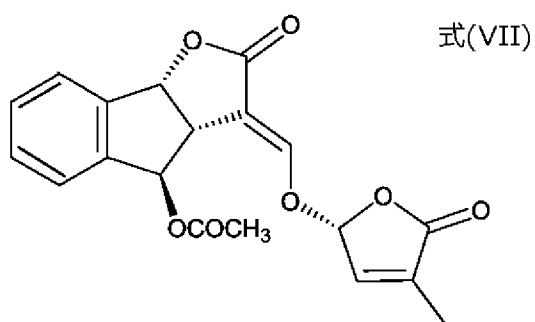
特定の立体構造を有する化合物が、以下の式(VI)～(IX)のいずれかで表される化合物であり、根寄生植物の種子発芽刺激活性物質であることを特徴とする、請求項2又は3に記載の根寄生植物発芽調節剤。

[化6]



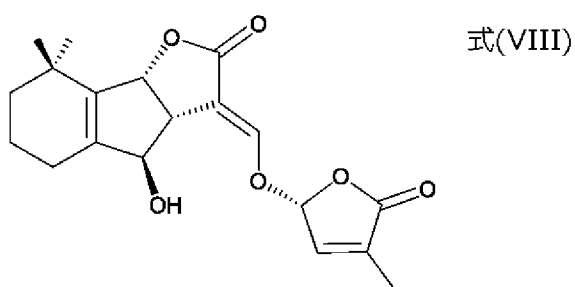
(3aR, 4R, 8bR, 2' R) -3-{[(E)-(2', 5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furyl)oxy]methylene}-3, 3a, 4, 8b-tetrahydro-4-hydroxy-2H-indeno[1, 2-b]furan-2-one

[化7]



(3aR, 4R, 8bR, 2' R)-4-acetoxy-3-{[(E)-(2', 5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furyl)oxy]methylene}-3, 3a, 4, 8b-tetrahydro-2H-indeno[1, 2-b]furan-2-one

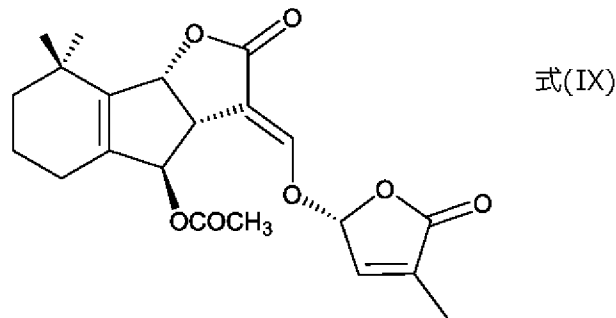
[化8]



(3aR, 4R, 8bR, 2' R)-3-{[(E)-(2', 5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-f

uranyl)oxy]methylene}-3, 3a, 4, 5, 6, 7, 8, 8b-octahydro-4-hydroxy-8, 8-dimethyl-2H-Indeno[1, 2-b]furan-2-one

[化9]



(3aR, 4R, 8bR, 2'R)-4-acetoxy-3-[(E)-(2', 5'-dihydro-4'-methyl-5'-oxo-2'-furanyl)oxy]methylene}-3, 3a, 4, 5, 6, 7, 8, 8b-octahydro-8, 8-dimethyl-2H-Indeno[1, 2-b]furan-2-one

- [請求項6] 根寄生植物が、ストライガゲスネルオイデス (*S. gesnerioides*) である、請求項1～5のいずれか1に記載の根寄生植物発芽調節剤。
- [請求項7] 請求項1～6のいずれか1に記載の根寄生植物発芽調節剤を含む根寄生植物防除剤。
- [請求項8] 請求項1～6のいずれか1に記載の根寄生植物発芽調節剤を用いることを特徴とする、根寄生植物の防除方法。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2012/060817

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

A01N43/12(2006.01)i, A01M21/04(2006.01)i, A01P21/00(2006.01)i

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

A01N43/12, A01M21/04, A01P21/00

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Jitsuyo Shinan Koho 1922-1996 Jitsuyo Shinan Toroku Koho 1996-2012

Kokai Jitsuyo Shinan Koho 1971-2012 Toroku Jitsuyo Shinan Koho 1994-2012

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAplus (STN), REGISTRY (STN), JSTplus (JDreamII), JMEDplus (JDreamII),

JST7580 (JDreamII)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	JP 2006-282513 A (Morishita Jintan Co., Ltd.), 19 October 2006 (19.10.2006), claims; paragraphs [0002], [0014], [0017], [0018] (Family: none)	1-8
X	KIM, Hyun Il et al., Structure-activity relationship of naturally occurring strigolactones in Orobanche minor seed germination stimulation, Journal of Pesticide Science, 2010, 35(3), 344-347	1-8



Further documents are listed in the continuation of Box C.



See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

27 June, 2012 (27.06.12)

Date of mailing of the international search report

10 July, 2012 (10.07.12)

Name and mailing address of the ISA/

Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2012/060817

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	THURING, Jan Willem J. F. et al., Asymmetric synthesis of all stereoisomers of the strigol analog GR24. Dependence of absolute configuration on stimulatory activity of Striga hermonthica and Orobanche crenata seed germination, Journal of Agricultural and Food Chemistry, 1997, 45(6), 2278-2283	1-8
A	AKIYAMA, Kohki et al., Structural Requirements of Strigolactones for Hyphal Branching in AM Fungi, Plant and Cell Physiology, 51(7), 2010, 1104-1117	1-8
P,X	UENO, Kotomi et al., Structural requirements of strigolactones for germination induction of Striga gesnerioides seeds, Journal of Agricultural and Food Chemistry, 59(17), 2011. 08.08, 9226-9231	1-8
P,X	UENO, Kotomi et al, Ent-2'-epi-Orobanchol and Its Acetate, As Germination Stimulants for Striga gesnerioides Seeds Isolated from Cowpea and Red Clover, Journal of Agricultural and Food Chemistry, 59(19), 2011.09.08, 10485-10490	1-3,5-8

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int.Cl. A01N43/12(2006.01)i; A01M21/04(2006.01)i, A01P21/00(2006.01)i

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int.Cl. A01N43/12, A01M21/04, A01P21/00

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

日本国実用新案公報	1922-1996年
日本国公開実用新案公報	1971-2012年
日本国実用新案登録公報	1996-2012年
日本国登録実用新案公報	1994-2012年

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAplus (STN), REGISTRY (STN), JSTPlus (JDreamII), JMEDPlus (JDreamII), JST7580 (JDreamII)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
X	JP 2006-282513 A (森下仁丹株式会社) 2006.10.19, 特許請求の範囲、段落【0002】、【0014】、【0017】、【0018】 (ファミリーなし)	1-8
X	KIM, Hyun Il et al., Structure-activity relationship of naturally occurring strigolactones in Orobanche minor seed germination stimulation, Journal of Pesticide Science, 2010, 35(3), 344-347	1-8

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)
「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

27.06.2012

国際調査報告の発送日

10.07.2012

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/J P)
郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

太田 千香子

4H

3761

電話番号 03-3581-1101 内線 3490

C (続き) 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
X	THURING, Jan Willem J. F. et al., Asymmetric synthesis of all stereoisomers of the strigol analog GR24. Dependence of absolute configuration on stimulatory activity of <i>Striga hermonthica</i> and <i>Orobanche crenata</i> seed germination, Journal of Agricultural and Food Chemistry, 1997, 45(6), 2278-2283	1-8
A	AKIYAMA, Kohki et al., Structural Requirements of Strigolactones for Hyphal Branching in AM Fungi, Plant and Cell Physiology, 51(7), 2010, 1104-1117	1-8
P, X	UENO, Kotomi et al., Structural requirements of strigolactones for germination induction of <i>Striga gesnerioides</i> seeds, Journal of Agricultural and Food Chemistry, 59(17), 2011.08.08, 9226-9231	1-8
P, X	UENO, Kotomi et al, Ent-2'-epi-Orobanchol and Its Acetate, As Germination Stimulants for <i>Striga gesnerioides</i> Seeds Isolated from Cowpea and Red Clover, Journal of Agricultural and Food Chemistry, 59(19), 2011.09.08, 10485-10490	1-3, 5-8