

(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
2018年9月7日(07.09.2018)



(10) 国際公開番号

WO 2018/159835 A1

(51) 国際特許分類:

A01N 47/38 (2006.01) C07D 401/12 (2006.01)
A01P 21/00 (2006.01) C07D 403/06 (2006.01)
C07D 249/04 (2006.01) C07D 413/12 (2006.01)
C07D 401/06 (2006.01) C07D 417/12 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2018/008121

(22) 国際出願日: 2018年3月2日(02.03.2018)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

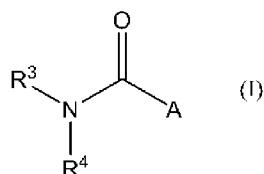
(30) 優先権データ:
特願 2017-040881 2017年3月3日(03.03.2017) JP

(71) 出願人: 国立大学法人東京大学 (THE UNIVERSITY OF TOKYO) [JP/JP]; 〒1138654 東京都文京区本郷七丁目3番1号 Tokyo (JP).

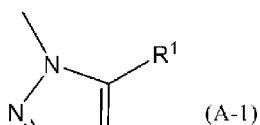
(72) 発明者: 浅見 忠男(ASAMI Tadao); 〒1138654 東京都文京区本郷七丁目3番1号 国立大学法人東京大学内 Tokyo (JP). 中村 英光(NAKAMURA Hidemitsu); 〒1138654 東京都文京区本郷七丁目3番1号 国立大学法人東京大学内 Tokyo (JP). 喜久里 貢(KIKUZATO Ko); 〒1138654 東京都文京区本郷七丁目3番1号 国立大学法人東京大学内 Tokyo (JP). フー ウェンチエン(HU Wenqian); 〒1138654 東京都文京区本郷七丁目3番1号 国立大学法人東京大学内 Tokyo (JP).

(54) Title: STRIGOLACTONE RECEPTOR INHIBITOR, AGRICULTURAL COMPOSITION AND USE THEREOF, STRIGA SEED GERMINATION INHIBITOR, AND TRIAZOLE UREA COMPOUND

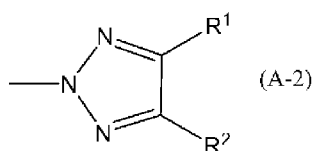
(54) 発明の名称: ストリゴラクトン受容体阻害剤、農業用組成物及びそれらの使用、ストライガ種子の発芽抑制剤、並びにトリアゾールウレア化合物



(I)



(A-1)



(A-2)

(57) Abstract: The present invention provides a strigolactone receptor inhibitor for plants, which contains, as effective component, at least one triazole urea compound represented by formula (I); an agricultural composition; a method for using this agricultural composition as, for example, a branching enhancer for plants; a Striga seed germination inhibitor that contains the triazole urea compound; and a novel triazole urea compound that is useful as a strigolactone receptor inhibitor for plants. In the formula, A represents a group represented by (A-1) or (A-2). R¹ and R² represent a hydrogen atom and so forth. R³ and R⁴ represent a hydrogen atom, an alkyl group having 1 to 20 carbons, a cycloalkyl group having 3 to 20 carbons, or an aryl group having 6 to 20 carbons and so forth. In addition, R³ and R⁴ may together form a ring.

(57) 要約: 本発明は、下記式 (I) で示されるトリアゾールウレア化合物の少なくとも一種を有効成分として含有する、植物のストリゴラクトン受容体阻害剤、農業用組成物、該農業用組成物を植物の枝分かれ増加剤等として使用する方法、前記トリアゾールウレア化合物含有するストライガ種子の発芽抑制剤、及び、植物のストリゴラクトン受容体阻害剤として有用な、新規トリアゾールウレア化合物である。式中、Aは下記 (A-1) 又は (A-2) で示される基を表す。R¹、R²は水素原子等を表す。R³、R⁴は、水素原子、炭素数1～20のアルキル基、炭素数3～20のシクロアルキル基、又は炭素数6～20のアリール基等を表す。また、R³、R⁴は一緒になって環を形成していてもよい。



(74) 代理人: 大石 治 仁 (OHISHI Haruhito);
〒1010047 東京都千代田区内神田 2 丁目 5
番 3 号 兎谷ビル 1 階 Tokyo (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, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, 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, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, 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), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告 (条約第21条(3))

明 細 書

発明の名称：

ストリゴラクトン受容体阻害剤、農業用組成物及びそれらの使用、ストライガ種子の発芽抑制剤、並びにトリアゾールウレア化合物

技術分野

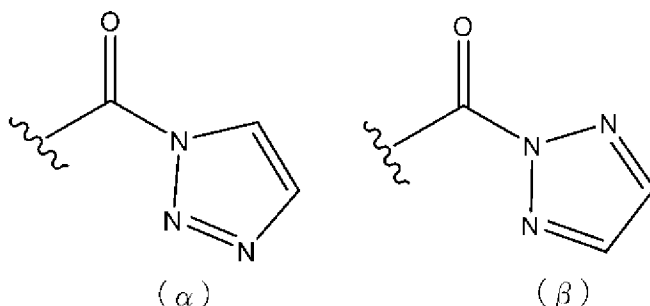
[0001] 本発明は、トリアゾールウレア化合物を有効成分とする植物のストリゴラクトン受容体阻害剤、前記トリアゾールウレア化合物を含有する農業用組成物、該農業用組成物を植物の枝分かれ増加剤等として使用する方法、前記トリアゾールウレア化合物を含有するストライガ種子の発芽抑制剤、及び、新規トリアゾールウレア化合物に関する。

背景技術

[0002] ストリゴラクトンは、アフリカで農作物に深刻な被害をもたらす魔女の雑草と呼ばれる根寄生雑草ストライガの種子発芽促進物質として知られている。近年においては、枝分かれ抑制作用等の多様な活性を持つ植物ホルモンであることも知られるようになった。そのため、ストリゴラクトンの受容体の構造及びそのシグナル伝達機構の解明は、植物の生長制御等の点において重要な課題となっている（非特許文献1）。

[0003] 本発明に関連して、非特許文献2には、下記式（ α ）、（ β ）で示される部分構造を有するトリアゾールウレア化合物が、動物のセリンヒドラーゼの阻害物質であることが記載されている。

[0004] [化1]



[0005] しかしながら、この文献には、これらの化合物が、植物のストリゴラクト

ン受容体の阻害物質であることは記載されていない。また、植物のストリゴラクトン受容体はセリンヒドラーゼ活性を有するタンパク質ではあることは知られているが、そのセリンヒドラーゼ活性がストリゴラクトン受容シグナル伝達に必須であるかどうかは解明されておらず、セリンヒドラーゼ活性阻害物質がストリゴラクトン受容を阻害するかどうかは従来知見からは明白ではない。

先行技術文献

非特許文献

[0006] 非特許文献1：化学と生物、Vol. 53, No. 3, 2015

非特許文献2：Nature Chemical Biology, Vol. 7, July 2011

発明の概要

発明が解決しようとする課題

[0007] 本発明は、特定の構造を有するトリアゾールウレア化合物を有効成分とする植物のストリゴラクトン受容体阻害剤、前記トリアゾールウレア化合物を含有する農業用組成物、該農業用組成物を植物の枝分かれ増加剤等として使用する方法、前記トリアゾールウレア化合物を含有するストライガ種子の発芽抑制剤、及び、植物のストリゴラクトン受容体阻害剤等として有用な、新規トリアゾールウレア化合物を提供することを目的とする。

課題を解決するための手段

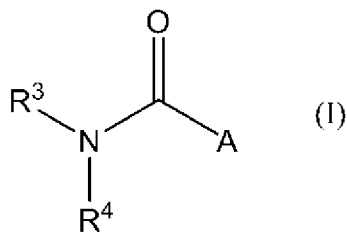
[0008] 本発明者らは、ストリゴラクトンの受容体の構造及びそのシグナル伝達機構を研究する中で、後述する式(1)で示されるトリアゾールウレア化合物は、強いストリゴラクトンアンタゴニスト活性を示すこと、ストライガ種子の発芽抑制作用を有すること、式(1)で示されるトリアゾールウレア化合物をイネd17変異体（イネのストリゴラクトン生合成変異体）に投与すると、顕著な分げつ回復を示すこと、及び、前記式(1)で示されるトリアゾールウレア化合物を含む水耕液を用いて、野生型イネ（品種名：日本晴）を

成育させると、分げつが促進されることを見出し、本発明を完成するに至った。

[0009] かくして本発明によれば、下記（１）、（２）の植物のストリゴラクトン受容体阻害剤、（３）、（４）の農業用組成物、（５）、（６）の使用する方法、（７）のストライガ種子の発芽抑制剤、及び、（８）のトリアゾールウレア化合物が提供される。

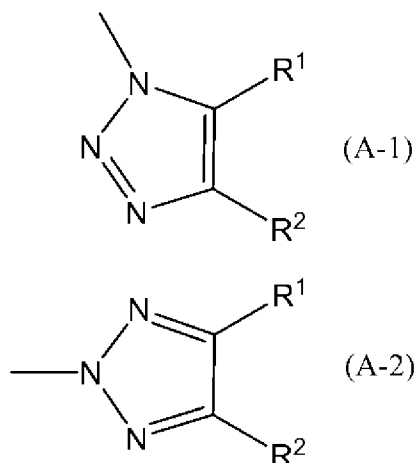
[0010] （１）下記式（１）で示されるトリアゾールウレア化合物の少なくとも一種を有効成分として含有する、植物のストリゴラクトン受容体阻害剤。

[0011] [化2]



[0012] [式中、Aは、下記（A－１）又は（A－２）で示される基を表す。

[0013] [化3]



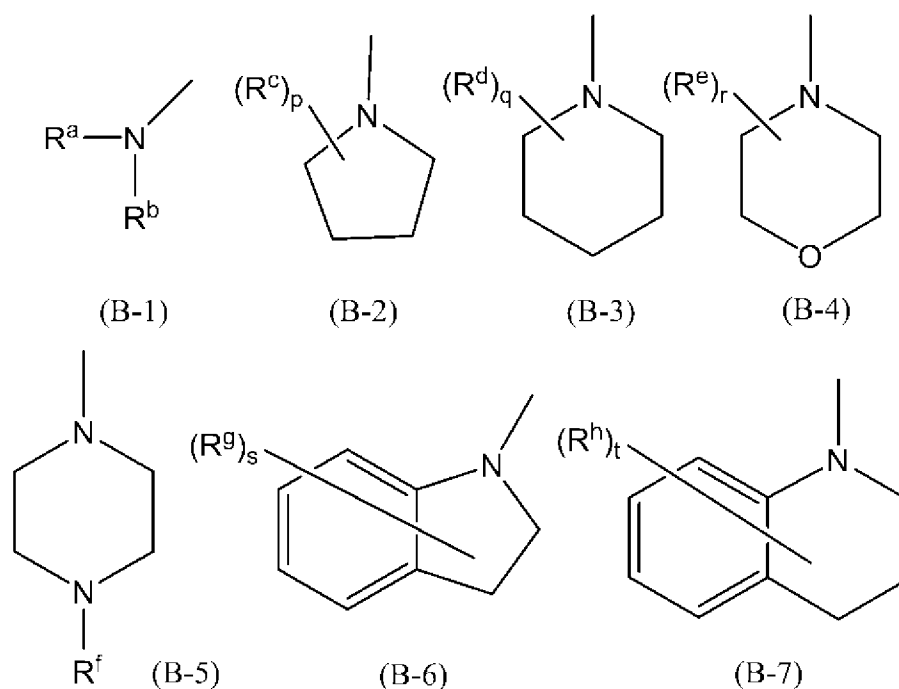
[0014] （式中、 R^1 、 R^2 は、それぞれ独立して、水素原子、置換基を有していてもよい炭素数１～２０のアルキル基、又は、置換基を有していてもよい炭素数６～２０のアリール基を表す。）

[0015] R^3 、 R^4 は、それぞれ独立して、水素原子、置換基を有していてもよい炭素数１～２０のアルキル基、置換基を有していてもよい炭素数３～２０のシク

ロアルキル基、又は置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基を表す（但し、 R^3 、 R^4 がともに水素原子である場合を除く。）。また、 R^3 、 R^4 は一緒になって環を形成していてもよく、該環は任意の位置に置換基を有していてもよい。]

(2) 前記式(1)中、 $-N(R^3)(R^4)$ で示される基が、下記(B-1)～(B-7)で示されるいずれかの基である、(1)に記載の植物のストリゴラクトン受容体阻害剤。

[0016] [化4]



[0017] (式中、 R^a 、 R^b はそれぞれ独立して、置換基を有していてもよい炭素数1～20のアルキル基、又は置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基を表す。

R^c 、 R^d 、 R^e 、 R^g 、 R^h はそれぞれ独立して、ニトロ基、シアノ基、ハロゲン原子、炭素数1～6のアルキル基、炭素数1～6のハロアルキル基、炭素数3～20のシクロアルキル基、炭素数1～6のアルコキシ基、アミノ基、モノ置換アミノ基、ジ置換アミノ基、炭素数1～6のアルキルチオ基、炭素数1～6のアルキルスルフェニル基、炭素数1～6のアルキルスルホニル基、炭素数2～10のアルコキシカルボニル基、炭素数2～10のアルキルカ

ルボニル基又は置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基を表す。

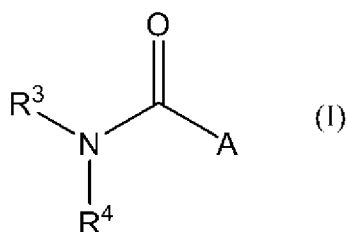
R^fは、水素原子、置換基を有していてもよい炭素数1～20のアルキル基、置換基を有していてもよい炭素数3～20のシクロアルキル基、置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基、置換基を有していてもよい複素環基、又は炭素数2～20のアシル基を表す。

p、q、r、s、tはそれぞれ独立して、0～4の整数を表す。）

[0018] 上記式（B-2）の結合手「-」（環を構成する炭素原子から延びる結合手。以下にて同じ。）は、置換基R^eが、ピロリジン環の任意の結合可能な位置で置換していてもよいことを表す。上記式（B-3）の結合手「-」は、置換基R^dが、ピペリジン環の任意の結合可能な位置で置換していてもよいことを表す。上記式（B-4）の結合手「-」は、置換基R^eが、モルホリン環の任意の結合可能な位置で置換していてもよいことを表す。（B-6）の結合手「-」は、置換基R^gが、インドリン環の任意の結合可能な位置で置換していてもよいことを表す。（B-7）の結合手「-」は、置換基R^hが、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環の任意の結合可能な位置で置換していてもよいことを表す。以下にて同じである。

[0019] （3）下記式（I）で示されるトリアゾールウレア化合物の少なくとも一種及び農学的に許容可能な配合補助剤を含む農業用組成物。

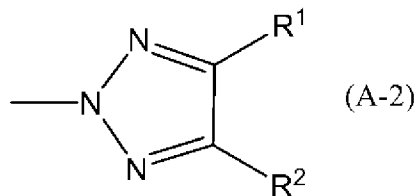
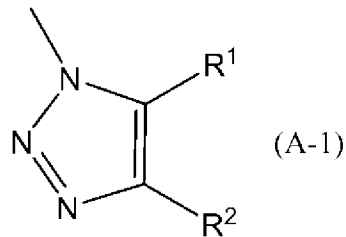
[0020] [化5]



[0021] [式中、Aは、下記（A-1）又は（A-2）で示される基を表す。

[0022]

[化6]



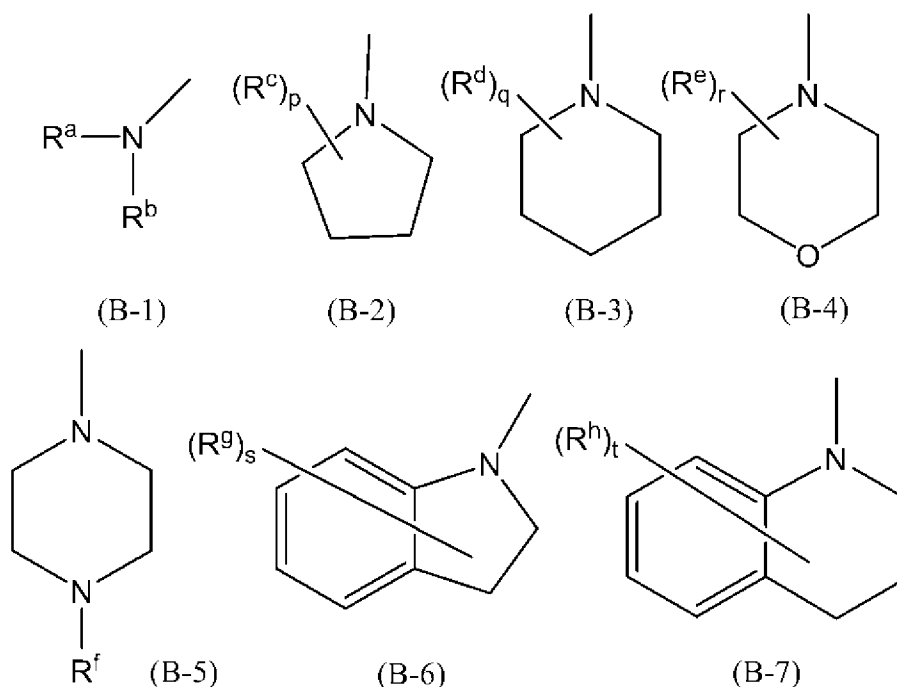
[0023] (式中、 R^1 、 R^2 は、それぞれ独立して、水素原子、置換基を有していてもよい炭素数1～20のアルキル基、又は置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基を表す。)

[0024] R^3 、 R^4 は、それぞれ独立して、水素原子、置換基を有していてもよい炭素数1～20のアルキル基、置換基を有していてもよい炭素数3～20のシクロアルキル基、又は置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基を表す(但し、 R^3 、 R^4 がともに水素原子である場合を除く。)。また、 R^3 、 R^4 は一緒になって環を形成していてもよく、該環は任意の位置に置換基を有していてもよい。]

(4) 前記式(1)中、 $-N(R^3)(R^4)$ で示される基が、下記(B-1)～(B-7)で示されるいずれかの基である、(3)に記載の農業用組成物。

[0025]

[化7]



[0026] (式中、 R^a 、 R^b はそれぞれ独立して、置換基を有していてもよい炭素数1～20のアルキル基、又は置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基を表す。

R^c 、 R^d 、 R^e 、 R^g 、 R^h はそれぞれ独立して、ニトロ基、シアノ基、ハロゲン原子、炭素数1～6のアルキル基、炭素数1～6のハロアルキル基、炭素数3～20のシクロアルキル基、炭素数1～6のアルコキシ基、アミノ基、モノ置換アミノ基、ジ置換アミノ基、炭素数1～6のアルキルチオ基、炭素数1～6のアルキルスルフェニル基、炭素数1～6のアルキルスルホニル基、炭素数2～10のアルコキシカルボニル基、炭素数2～10のアルキルカルボニル基又は置換基を有していてもよいアリール基を表す。

R^f は、水素原子、置換基を有していてもよい炭素数1～20のアルキル基、置換基を有していてもよい炭素数3～20のシクロアルキル基、置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基、置換基を有していてもよい複素環基、又は炭素数2～20のアシル基を表す。

p 、 q 、 r 、 s 、 t はそれぞれ独立して、0～4の整数を表す。)

(5) 前記(1)若しくは(2)に記載のストリゴラクトン受容体阻害剤、

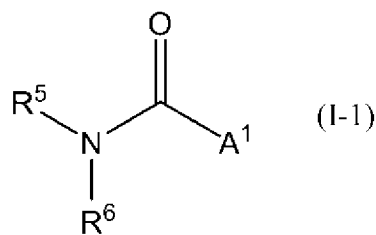
又は（４）に記載の農業用組成物を、植物の枝分かれ増加剤として使用する方法。

（６）前記（１）若しくは（２）に記載のストリゴラクトン受容体阻害剤、又は（４）に記載の農業用組成物を、イネ科植物の分げつ促進剤として使用する方法。

（７）前記式（１）で示されるトリアゾールウレア化合物の少なくとも一種を有効成分として含有する、ストライガ種子の発芽抑制剤。

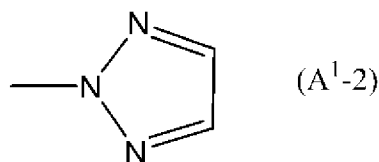
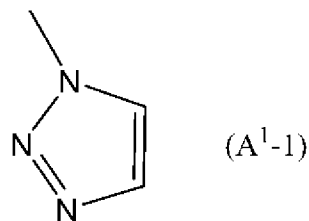
（８）下記式（１－１）で示されるトリアゾールウレア化合物。

[0027] [化8]



[0028] [式中、A¹は、下記（A¹－１）又は（A¹－２）で示される基を表す。

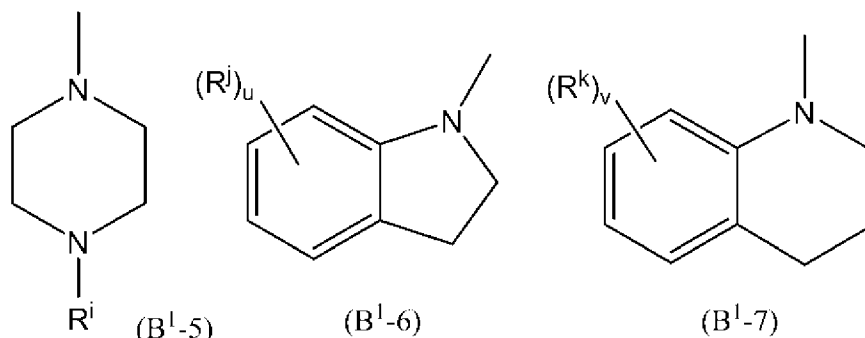
[0029] [化9]



[0030] $-\text{N}(\text{R}^7)(\text{R}^8)$ で示される基は、以下の（B¹－５）、（B¹－６）又は（B¹－７）で示される基を表す。

[0031]

[化10]



[0032] (式中、 R^i は、水素原子、置換基を有していてもよい炭素数1～20のアルキル基、置換基を有していてもよい炭素数3～20のシクロアルキル基、置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基、又は置換基を有していてもよい複素環基を表す。

R^j 、 R^k はそれぞれ独立して、ニトロ基、シアノ基、ハロゲン原子、炭素数1～6のアルキル基、炭素数1～6のハロアルキル基、炭素数3～20のシクロアルキル基、炭素数1～6のアルコキシ基、アミノ基、モノ置換アミノ基、ジ置換アミノ基、炭素数1～6のアルキルチオ基、炭素数1～6のアルキルスルフェニル基、炭素数1～6のアルキルスルホニル基、炭素数2～10のアルコキシカルボニル基、炭素数2～10のアルキルカルボニル基又は置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基を表す。

u 、 v はそれぞれ独立して、0～4の整数を表す。)

上記式(B^1-6)の結合手「 $-$ 」は、置換基 R^j が、インドリン環の任意の結合可能な位置で置換していてもよいことを表す。 (B^1-7) の結合手「 $-$ 」は、置換基 R^k が、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環の任意の結合可能な位置で置換していてもよいことを表す。以下にて同じである。

図面の簡単な説明

[0033] [図1]図1は、本発明のストリゴラクトン受容体阻害剤の、イネの枝分かれ形質への効果を示す模式図である。

[図2]図2は、イネd17変異株を用いたストリゴラクトン受容体阻害剤の評価試験結果である。

[図3]図3は、イネ d 1 7 変異株を用いたストリゴラクトン受容体阻害剤の評価試験結果である。

[図4]図4は、発芽から7日目の野生型イネ（品種：日本晴）を、 $10\mu\text{M}$ の化合物25を含む水耕液で生育させたイネの第1分げつ、及び、第2分げつの長さを測定した結果を表したグラフである。

[図5]図5（a）は、発芽から二週間経過後の野生型イネの写真図であり、図5（b）は、発芽から7日経過後に、 $10\mu\text{M}$ の化合物25を含む水耕液で生育させたイネの写真図である。

発明を実施するための形態

[0034] 以下、本発明を詳細に説明する。

なお、本明細書においては、置換基を有していてもよい炭素数1～20のアルキル基、置換基を有していてもよい炭素数3～20のシクロアルキル基、置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基の炭素数には、置換基の炭素数は含めないものとする。

また、「置換基を有していてもよい」とは、「無置換」又は「置換基を有する」を意味する。

[0035] 1) 植物のストリゴラクトン受容体阻害剤

本発明の植物のストリゴラクトン受容体阻害剤は、前記式（1）で示されるトリアゾールウレア化合物の少なくとも一種を有効成分として含有することを特徴とする。

[0036] [式（1）で示されるトリアゾールウレア化合物]

前記式（1）中、Aは、前記式（A-1）又は（A-2）で示される基を表す。

前記式（A-1）、（A-2）において、 R^1 、 R^2 は、それぞれ独立して、水素原子、置換基を有していてもよい炭素数1～20のアルキル基、又は置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基を表す。）

[0037] R^1 、 R^2 の、置換基を有していてもよい炭素数1～20のアルキル基の炭素数1～20のアルキル基は、直鎖状構造を有するものであっても、分岐状

構造を有するものであってもよい。例えば、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、*n*-ブチル基、イソブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基、*n*-ペンチル基、*n*-ヘキシル基、*n*-ヘプチル基、*n*-オクチル基、*n*-ノニル基、*n*-デシル基、*n*-ウンデシル基、*n*-ドデシル基等が挙げられる。

[0038] R^1 、 R^2 の、置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基の炭素数6～20のアリール基としては、フェニル基、1-ナフチル基、2-ナフチル基等が挙げられる。

[0039] R^1 、 R^2 の、置換基を有していてもよい炭素数1～20のアルキル基の置換基としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子等のハロゲン原子；メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基等の炭素数1～6のアルコキシ基；フェノキシ基、1-ナフチルオキシ基、2-ナフチルオキシ基等の、炭素数6～20のアリールオキシ基；フェニル基、4-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、2-フルオロフェニル基、4-クロロフェニル基、4-メチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、4-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、2-メトキシフェニル基、1-ナフチル基、2-ナフチル基等の置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基；シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基等の炭素数3～20のシクロアルキル基；等が挙げられる。

[0040] R^1 、 R^2 の、置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基の置換基としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子等のハロゲン原子；メチル基、エチル基、プロピル基等の炭素数1～6のアルキル基；メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基等の炭素数1～6のアルコキシ基；フェノキシ基、1-ナフチルオキシ基、2-ナフチルオキシ基等の、炭素数6～20のアリールオキシ基；フェニル基、4-クロロフェニル基、2-クロロフェニル基、2,4-ジクロロフェニル基、4-メチルフェニル基、2-メチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-メトキシフェニル基、4-

トリフルオロメトキシフェニル基、2-メトキシフェニル基、2,4-ジメトキシフェニル基、4-シアノフェニル基、4-ニトロフェニル基、4-メチルチオフェニル基、1-ナフチル基、2-ナフチル基等の、置換基を有していてもよい炭素数6~20のアリール基；シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基等の、炭素数3~20のシクロアルキル基；等が挙げられる。

[0041] 本発明においては、 R^1 、 R^2 は、少なくとも一方が水素原子であることが好ましく、ともに水素原子であるのがより好ましい。

[0042] R^3 、 R^4 は、それぞれ独立して、水素原子、置換基を有していてもよい炭素数1~20のアルキル基、置換基を有していてもよい炭素数3~20のシクロアルキル基、又は、置換基を有していてもよい炭素数6~20のアリール基を表す。

但し、 R^3 、 R^4 がともに水素原子である場合は除かれる。

[0043] R^3 、 R^4 の置換基を有していてもよい炭素数1~20のアルキル基としては、前記 R^1 、 R^2 の置換基を有していてもよい炭素数1~20のアルキル基の炭素数1~20のアルキル基として例示したものと同様のものが挙げられる。

R^3 、 R^4 の置換基を有していてもよい炭素数3~20のシクロアルキル基の炭素数3~20のシクロアルキル基としては、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロオクチル基等が挙げられる。

R^3 、 R^4 の置換基を有していてもよい炭素数6~20のアリール基としては、前記 R^1 、 R^2 の置換基を有していてもよい炭素数6~20のアリール基として例示したものと同様のものが挙げられる。

R^3 、 R^4 の置換基を有していてもよい炭素数1~20のアルキル基の置換基としては、前記 R^1 、 R^2 の置換基を有していてもよい炭素数1~20のアルキル基の置換基として例示したものと同様のものが挙げられる。

R^3 、 R^4 の、置換基を有していてもよい炭素数3~20のシクロアルキル基の置換基としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子等のハロゲン原子；

メチル基、エチル基、プロピル基等の炭素数 1～6 のアルキル基；トリフルオロメチル基等の炭素数 1～6 のハロアルキル基；メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基等の炭素数 1～6 のアルコキシ基；フェノキシ基、1-ナフチルオキシ基、2-ナフチルオキシ基等の、炭素数 6～20 のアリールオキシ基；フェニル基、4-クロロフェニル基、4-メチルフェニル基、2-メトキシフェニル基、1-ナフチル基、2-ナフチル基等の、置換基を有していてもよい炭素数 6～20 のアリール基；等が挙げられる。

R³、R⁴の、置換基を有していてもよい炭素数 6～20 のアリール基の置換基としては、前記 R¹、R²の、置換基を有していてもよい炭素数 6～20 のアリール基の置換基として例示したものと同様のものが挙げられる。

[0044] また、R³、R⁴は一緒になって、環〔式：—N(R³)(R⁴)で示される基）の窒素原子を含む含窒素ヘテロ環〕を形成していてもよい。

本発明においては、前記式（I）で示されるトリアゾールウレア化合物が、前記式（I）中、式：—N(R³)(R⁴)で示される基が、前記（B-1）～（B-7）のいずれかであるものが好ましい。

[0045] 上記式（B-1）中、R^a、R^bはそれぞれ独立して、置換基を有していてもよい炭素数 1～20 のアルキル基、又は置換基を有していてもよい炭素数 6～20 のアリール基を表す。

R^a、R^bの置換基を有していてもよい炭素数 1～20 のアルキル基としては、前記 R¹、R²の置換基を有していてもよい炭素数 1～20 のアルキル基と同様のものが挙げられる。また、R^a、R^bの置換基を有していてもよい炭素数 6～20 のアリール基としては、前記 R¹、R²の置換基を有していてもよい炭素数 6～20 のアリール基と同様のものが挙げられる。

[0046] 前記式（B-2）、（B-3）、（B-4）、（B-5）、（B-6）及び（B-7）中、R^c、R^d、R^e、R^g、R^hはそれぞれ独立して、ニトロ基；シアノ基；フッ素原子、塩素原子、臭素原子等のハロゲン原子；メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基等の炭素数 1～6 のアルキル基；トリフルオロメチル基等の炭素数 1～6 のハロアルキル基；シクロプロピル基

、シクロペンチル基、シクロヘキシル基等の炭素数3～20のシクロアルキル基；メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基等の炭素数1～6のアルコキシ基；アミノ基；メチルアミノ基、フェニルアミノ基、アセチルアミノ基等のモノ置換アミノ基；ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、フェニルメチルアミノ基、アセチルメチルアミノ基等のジ置換アミノ基；メチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基等の炭素数1～6のアルキルチオ基；メチルスルフェニル基、エチルスルフェニル基、プロピルスルフェニル基等の炭素数1～6のアルキルスルフェニル基；メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、プロピルスルホニル基等の炭素数1～6のアルキルスルホニル基；メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基等の炭素数2～10のアルコキシカルボニル基；アセチル基、プロピオニル基等の炭素数2～10のアルキルカルボニル基；又は、フェニル基、4-クロロフェニル基、4-メチルフェニル基、2-メトキシフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基。1-ナフチル基、2-ナフチル基等の置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基；を表す。

[0047] これらの中でも、 R^c 、 R^d 、 R^e 、 R^g 、 R^h としては、ニトロ基、シアノ基、ハロゲン原子、炭素数1～6のアルキル基、炭素数1～6のハロアルキル基、炭素数1～6のアルコキシ基、及び、置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基が好ましい。

[0048] R^f は、水素原子、置換基を有していてもよい炭素数1～20のアルキル基、置換基を有していてもよい炭素数3～20のシクロアルキル基、置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基、置換基を有していてもよい複素環基、又は炭素数2～20のアシル基を表す。

R^f の、置換基を有していてもよい炭素数1～20のアルキル基の炭素数1～20のアルキル基、及び置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基の炭素数6～20のアリール基の具体例としては、前記 R^1 、 R^2 の、置換基を有していてもよい炭素数1～20のアルキル基の炭素数1～20のアルキル基、及び置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基の

炭素数 6 ～ 20 のアリール基の具体例として列記したものと同様のものが挙げられる。

R^fの、置換基を有していてもよい炭素数 3 ～ 20 のシクロアルキル基の炭素数 3 ～ 20 のシクロアルキル基の具体例としては、前記 R³、R⁴の置換基を有していてもよい炭素数 3 ～ 20 のシクロアルキル基の炭素数 3 ～ 20 のシクロアルキル基の具体例として列記したものと同様のものが挙げられる。

[0049] また、R^fの、置換基を有していてもよい複素環基の複素環基としては、特に限定されない、例えば、2-フリル、3-フリル、オキサゾール-2-イル、オキサゾール-4-イル、オキサゾール-5-イル、イソオキサゾール-3-イル、イソオキサゾール-4-イル、イソオキサゾール-5-イル、1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル、1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イル、1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル、チアゾール-2-イル、チアゾール-4-イル、チアゾール-5-イル、イソチアゾール-3-イル、イソチアゾール-4-イル、イソチアゾール-5-イル、1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル、1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル、1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル、イミダゾール-2-イル、イミダゾール-4-イル、2-チエニル、3-チエニル、ピラゾール-3-イル、ピラゾール-4-イル、1, 2, 4-トリアゾール-3-イル、テトラゾール-5-イル、4, 5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イル、4, 5-ジヒドロイソオキサゾール-4-イル、4, 5-ジヒドロイソオキサゾール-5-イル等の5員環複素環基；2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、ピリダジン-3-イル、ピラジン-2-イル、トリアジン-2-イル等の6員環複素環基；ベンゾチアゾール-2-イル、ベンゾオキサゾール-2-イル、ベンゾチアゾール-7-イル、ベンゾイソチアゾール-3-イル、ベンゾフラザン-4-イル、ベンゾオキサジアゾール-4-イル等の縮合環複素環基；等が挙げられる。

[0050] R^fの炭素数 2 ～ 20 のアシル基としては、アセチル基、プロピオニル基等の炭素数 2 ～ 20 のアルキルカルボニル基；ベンゾイル基等の炭素数 6 ～ 2

Oのアリールカルボニル基；等が挙げられる。

[0051] 前記R^fの置換基を有していてもよい炭素数1～20のアルキル基の置換基としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子等のハロゲン原子；メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基等の炭素数1～6のアルコキシ基；フェノキシ基、1-ナフチルオキシ基、2-ナフチルオキシ基等の、炭素数6～20のアリールオキシ基；フェニル基、4-フルオロメチルフェニル基、3-フルオロフェニル基、2-フルオロフェニル基、4-クロロフェニル基、4-メチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、4-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、2-メトキシフェニル基、1-ナフチル基、2-ナフチル基等の置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基；シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基等の炭素数3～20のシクロアルキル基；等が挙げられる。

[0052] 前記R^fの、置換基を有していてもよい炭素数3～20のシクロアルキル基、置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基、及び、置換基を有していてもよい複素環基の置換基としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子等のハロゲン原子；メチル基、エチル基、イソプロピル基等の炭素数1～6のアルキル基；メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基等の炭素数1～6のアルコキシ基；フェノキシ基、1-ナフチルオキシ基、2-ナフチルオキシ基等の、炭素数6～20のアリールオキシ基；フェニル基、4-クロロフェニル基、4-メチルフェニル基、2-メトキシフェニル基、1-ナフチル基、2-ナフチル基等の置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基；シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基等の炭素数3～20のシクロアルキル基；等が挙げられる。

[0053] これらの中でも、R^fとしては、置換基を有していてもよい炭素数1～20のアルキル基、置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基、又は、置換基を有していてもよい複素環基が好ましい。

[0054] p、q、r、s、tはそれぞれ独立して、0～4の整数を表し、それぞれ

独立して、0又は1であるのが好ましい。

[0055] 前記式(1)で示されるトリアゾールウレア化合物の具体例としては、次のものが挙げられるが、これらに限定されるものではない。

1-(ジメチルアミノカルボニル)-1,2,3-トリアゾール、1-(ジエチルアミノカルボニル)-1,2,3-トリアゾール、1-(ジプロピルアミノカルボニル)-1,2,3-トリアゾール、1-(ジイソプロピルアミノカルボニル)-1,2,3-トリアゾール、1-(ジブチルアミノカルボニル)-1,2,3-トリアゾール、1-(ジペンチルアミノカルボニル)-1,2,3-トリアゾール、1-(ベンジルメチルアミノカルボニル)-1,2,3-トリアゾール、1-(メチルフェニルアミノカルボニル)-1,2,3-トリアゾール、

2-(ジメチルアミノカルボニル)-1,2,3-トリアゾール、2-(ジエチルアミノカルボニル)-1,2,3-トリアゾール、2-(ジプロピルアミノカルボニル)-1,2,3-トリアゾール、2-(ジイソプロピルアミノカルボニル)-1,2,3-トリアゾール、2-(ジブチルアミノカルボニル)-1,2,3-トリアゾール、2-(ジペンチルアミノカルボニル)-1,2,3-トリアゾール、2-(ベンジルメチルアミノカルボニル)-1,2,3-トリアゾール、2-(メチルフェニルアミノカルボニル)-1,2,3-トリアゾール、等の、前記式(1)中、 $-N(R^3)(R^4)$ で示される基が、前記式(B-1)で示される基である化合物；

[0056] 1-(ピロリジン-1'-イル)カルボニル-1,2,3-トリアゾール、1-(2-メチルピロリジン-1'-イル)カルボニル-1,2,3-トリアゾール、1-(3-メチルピロリジン-1'-イル)カルボニル-1,2,3-トリアゾール、1-(2,5-ジメチルピロリジン-1'-イル)カルボニル-1,2,3-トリアゾール、1-(3,4-ジメチルピロリジン-1'-イル)カルボニル-1,2,3-トリアゾール、1-(3-フェニルピロリジン-1'-イル)カルボニル-1,2,3-トリアゾール、2-(ピロリジン-1'-イル)カルボニル-1,2,3-トリアゾール、

2- (2-メチルピロリジン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2- (3-メチルピロリジン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2- (2, 5-ジメチルピロリジン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2- (3, 4-ジメチルピロリジン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2- (3-フェニルピロリジン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール等の、前記式 (I) 中、-N (R³) (R⁴) で示される基が、前記式 (B-2) で示される基である化合物；

[0057] 1- (ピペリジン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、1- (2-メチルピペリジン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、1- (3-メチルピペリジン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、1- (2, 5-ジメチルピペリジン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、1- (3, 4-ジメチルピペリジン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、1- (4-フェニルピペリジン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2- (ピペリジン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2- (2-メチルピペリジン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2- (3-メチルピペリジン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2- (2, 5-ジメチルピペリジン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2- (3, 4-ジメチルピペリジン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2- (4-フェニルピペリジン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール等の、前記式 (I) 中、-N (R³) (R⁴) で示される基が、前記式 (B-3) で示される基である化合物；

[0058] 1- (モルホリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、1- (2-メチルモルホリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、1- (3-メチルモルホリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、1- (2, 5-ジメチルモルホリン-1'-イル)カ

ルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、1-(3, 4-ジメチルモルホリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、1-(3-フェニルモルホリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
 2-(モルホリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
 2-(2-メチルモルホリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2-(3-メチルモルホリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2-(2, 5-ジメチルモルホリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2-(3, 4-ジメチルモルホリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、1-(3'-フェニルモルホリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2-(3'-フェニルモルホリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール等の、前記式(1)中、 $-N(R^3)(R^4)$ で示される基が、前記式(B-4)で示される基である化合物；

- [0059] 1-(ピペラジン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
 1-(4'-メチルピペラジン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、1-(4'-ベンジルピペラジン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
 1-(4'-*t*-ブチルピペラジン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
 1-(4'-ジフェニルメチルピペラジン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
 1-[4'-(4"-トリフルオロメチルベンジル)ピペラジン-1'-イル]カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
 1-[4'-(4"-フルオロベンジル)ピペラジン-1'-イル]カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
 1-[4'-(3"-メトキシベンジル)ピペラジン-1'-イル]カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
 1-[4'-(2"-クロロベンジル)ピペラジン-1'-イル]カルボニ

ル-1, 2, 3-トリアゾール、

1-[4'-(オキサゾール-2"-イル)ピペラジン-1'-イル]カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

1-[4'-(チアゾール-2"-イル)ピペラジン-1'-イル]カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

1-[4'-(ベンゾオキサゾール-2"-イル)ピペラジン-1'-イル]
カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

1-[4'-(ベンゾチアゾール-2"-イル)ピペラジン-1'-イル]
カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

1-[4'-(5"-クロロベンゾチアゾール-2"-イル)ピペラジン-1'-イル]
カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

1-[4'-(1", 2"-ベンゾチイソアゾール-3"-イル)ピペラジン-1'-イル]
カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

1-(4'-フェニルピペラジン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

1-[4'-(4"-クロロフェニル)ピペラジン-1'-イル]カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

1-[4'-(3"-クロロフェニル)ピペラジン-1'-イル]カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

1-[4'-(2"-クロロフェニル)ピペラジン-1'-イル]カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

1-[4'-(4"-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1'-イル]
カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

1-[4'-(3"-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1'-イル]
カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

1-[4'-(2"-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1'-イル]
カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

1-[4'-(4"-ニトロフェニル)ピペラジン-1'-イル]カルボニル

－ 1, 2, 3－トリアゾール、

1－[4'－(3''－ニトロフェニル) ピペラジン－1'－イル]カルボニル

－ 1, 2, 3－トリアゾール、

1－[4'－(2''－ニトロフェニル) ピペラジン－1'－イル]カルボニル

－ 1, 2, 3－トリアゾール、

1－[4'－(4''－シアノフェニル) ピペラジン－1'－イル]カルボニル

－ 1, 2, 3－トリアゾール、

1－[4'－(3''－シアノフェニル) ピペラジン－1'－イル]カルボニル

－ 1, 2, 3－トリアゾール、

1－[4'－(2''－シアノフェニル) ピペラジン－1'－イル]カルボニル

－ 1, 2, 3－トリアゾール、

1－[4'－(ベンゾイルピペラジン)－1'－イル]カルボニル－ 1, 2,
3－トリアゾール、

1－[4'－(アセチルピペラジン)－1'－イル]カルボニル－ 1, 2,
3－トリアゾール、

1－[4'－(2'', 4''－ジクロロフェニル) ピペラジン－1'－イル]
カルボニル－ 1, 2, 3－トリアゾール、

1－[4'－(ピリジン－2''－イル) ピペラジン－1'－イル]カルボニル
－ 1, 2, 3－トリアゾール、

1－[4'－(ピリジン－3''－イル) ピペラジン－1'－イル]カルボニル
－ 1, 2, 3－トリアゾール、

1－[4'－(ピリジン－4''－イル) ピペラジン－1'－イル]カルボニル
－ 1, 2, 3－トリアゾール、

1－[4'－(4''－トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン－1'－イル]
カルボニル－ 1, 2, 3－トリアゾール、

1－[4'－(3''－トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン－1'－イル]
カルボニル－ 1, 2, 3－トリアゾール、

1－[4'－(2''－トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン－1'－イル

ル] カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

1- [4'- (4"-メトキシフェニル) ピペラジン-1'-イル] カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

1- [4'- (3"-メトキシフェニル) ピペラジン-1'-イル] カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

1- [4'- (2"-メトキシフェニル) ピペラジン-1'-イル] カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

1- [4'- (2", 4"-ジメトキシフェニル) ピペラジン-1'-イル]
] カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

1- [4'- (3", 5"-ジメトキシフェニル) ピペラジン-1'-イル]
] カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

1- [4'- (2", 6"-メトキシフェニル) ピペラジン-1'-イル]
カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

1- (4'-シクロヘキシルピペラジン-1'-イル) カルボニル-1, 2,
, 3-トリアゾール、

1- [(4'-シクロペンチルピペラジン) -1'-イル] カルボニル-1,
2, 3-トリアゾール、

[0060] 2- (ピペラジン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
2- (4'-メチルピペラジン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリ
アゾール、2- (4'-ベンジルピペラジン-1'-イル) カルボニル-
1, 2, 3-トリアゾール、

2- (4'-tert-ブチルピペラジン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-
トリアゾール、

2- (4'-ジフェニルメチルピペラジン-1'-イル) カルボニル-1,
2, 3-トリアゾール、

2- [4'- (4"-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-1'-イ
ル] カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

2- [4'- (4"-フルオロベンジル) ピペラジン-1'-イル] カルボ

ニル-1, 2, 3-トリアゾール、
2-[4'-(3"-メトキシベンジル)ピペラジン-1'-イル]カルボ
ニル-1, 2, 3-トリアゾール、
2-[4'-(4"-クロロベンジル)ピペラジン-1'-イル]カルボ
ニル-1, 2, 3-トリアゾール、
2-[4'-(3"-クロロベンジル)ピペラジン-1'-イル]カルボ
ニル-1, 2, 3-トリアゾール、
2-[4'-(2"-クロロベンジル)ピペラジン-1'-イル]カルボ
ニル-1, 2, 3-トリアゾール、
1-[4'-(4"-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1'-
イル]カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
1-[4'-(3"-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1'-
イル]カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
1-[4'-(2"-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1'-
イル]カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
2-(4'-ベンゾイルピペラジン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-
トリアゾール、
2-(4'-アセチルピペラジン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-
トリアゾール、
2-[4'-(オキサゾール-2"-イル)ピペラジン-1'-イル]カル
ボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
2-[4'-(チアゾール-2"-イル)ピペラジン-1'-イル]カルボ
ニル-1, 2, 3-トリアゾール、
2-[4'-(ベンゾオキサゾール-2"-イル)ピペラジン-1'-イル
]カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
2-[4'-(ベンゾチアゾール-2"-イル)ピペラジン-1'-イル]
カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
2-[4'-(5"-クロロベンゾチアゾール-2"-イル)ピペラジン-

1' -イル] カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
2-[4'-(1'', 2''-ベンゾイソアゾール-3''-イル) ピペラジン-1' -イル] カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
2-(4'-フェニルピペラジン-1' -イル) カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
2-[4'-(4''-クロロフェニル) ピペラジン-1' -イル]カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
2-[4'-(3''-クロロフェニル) ピペラジン-1' -イル]カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
2-[4'-(2''-クロロフェニル) ピペラジン-1' -イル] カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
2-[4'-(4''-ニトロフェニル) ピペラジン-1' -イル] カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
2-[4'-(3''-ニトロフェニル) ピペラジン-1' -イル] カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
2-[4'-(2''-ニトロフェニル) ピペラジン-1' -イル] カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
2-[4'-(4''-シアノフェニル) ピペラジン-1' -イル] カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
2-[4'-(3''-シアノフェニル) ピペラジン-1' -イル] カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
2-[4'-(2''-シアノフェニル) ピペラジン-1' -イル] カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
2-[4'-(2'', 4''-ジクロロフェニル) ピペラジン-1' -イル] カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
2-[4'-(ピリジン-2''-イル) ピペラジン-1' -イル] カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
2-[4'-(ピリジン-3''-イル) ピペラジン-1' -イル] カルボニル-

ルー 1, 2, 3-トリアゾール、
 2- [4' - (ピリジン-4'' -イル) ピペラジン-1' -イル] カルボニ
 ルー 1, 2, 3-トリアゾール、
 2- [4' - (4'' -トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1' -イ
 ル] カルボニルー 1, 2, 3-トリアゾール、
 2- [4' - (3'' -トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1' -イ
 ル] カルボニルー 1, 2, 3-トリアゾール、
 2- [4' - (2'' -トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1' -イ
 ル] カルボニルー 1, 2, 3-トリアゾール、
 2- [4' - (4'' -メトキシフェニル) ピペラジン-1' -イル] カルボ
 ニルー 1, 2, 3-トリアゾール、
 2- [4' - (3'' -メトキシフェニル) ピペラジン-1' -イル] カルボ
 ニルー 1, 2, 3-トリアゾール、
 2- [4' - (2'' -メトキシフェニル) ピペラジン-1' -イル] カルボ
 ニルー 1, 2, 3-トリアゾール、
 2- [4' - (2'', 4'' -ジメトキシフェニル) ピペラジン-1' -イル
] カルボニルー 1, 2, 3-トリアゾール、
 2- [4' - (3'', 5'' -ジメトキシフェニル) ピペラジン-1' -イル
] カルボニルー 1, 2, 3-トリアゾール、
 2- [4' - (2'', 6'' -ジメトキシフェニル) ピペラジン-1' -イル
] カルボニルー 1, 2, 3-トリアゾール、
 2- [(4' -シクロヘキシルピペラジン) -1' -イル] カルボニルー 1
 , 2, 3-トリアゾール、
 2- [(4' -シクロペンチルピペラジン) -1' -イル] カルボニルー 1
 , 2, 3-トリアゾール、等の、前記式 (I) 中、-N (R³) (R⁴) で示
 される基が、前記式 (B-5) で示される基である化合物；

[0061] 1- (インドリン-1' -イル) カルボニルー 1, 2, 3-トリアゾール、
 1- (4-メチルインドリン-1' -イル) カルボニルー 1, 2, 3-トリ

アゾール、1-(5-メチルインドリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、1-(5-tert-ブチルインドリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、1-(2, 4-ジメチルインドリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、1-(5-フェニルインドリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

2-(インドリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2-(4-メチルインドリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2-(5-メチルインドリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2-(5-tert-ブチルインドリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2-(2, 4-ジメチルインドリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2-(5-フェニルインドリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

1-(4-フルオロインドリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

1-(5-フルオロインドリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

1-(6-フルオロインドリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

1-(7-フルオロインドリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

1-(4-クロロインドリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

1-(5-クロロインドリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

1-(6-クロロインドリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

1-(7-クロロインドリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

1- (4-ブロモインドリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリ
アゾール、

1- (5-ブロモインドリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリ
アゾール、

1- (6-ブロモインドリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリ
アゾール、

1- (7-ブロモインドリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリ
アゾール、

1- (4-トリフルオロメチルインドリン-1'-イル) カルボニル-1,
2, 3-トリアゾール、1- (5-トリフルオロメチルインドリン-1'-
イル) カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、1- (6-トリフルオロメ
チルインドリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、1
- (7-トリフルオロメチルインドリン-1'-イル) カルボニル-1, 2
, 3-トリアゾール、

2- (4-フルオロインドリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリ
アゾール、

2- (5-フルオロインドリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリ
アゾール、

2- (6-フルオロインドリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリ
アゾール、

2- (7-フルオロインドリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリ
アゾール、

2- (4-クロロインドリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリ
アゾール、

2- (5-クロロインドリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリ
アゾール、

2- (6-クロロインドリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリ
アゾール、

2- (7-クロロインドリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

2- (4-ブromoインドリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

2- (5-ブromoインドリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

2- (6-ブromoインドリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

2- (7-ブromoインドリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

2- (4-トリフルオロメチルインドリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2- (5-トリフルオロメチルインドリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2- (6-トリフルオロメチルインドリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2- (7-トリフルオロメチルインドリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール等の、前記式 (I) 中、-N (R³) (R⁴) で示される基が、前記式 (B-6) で示される基である化合物；

[0062] 1- (1', 2', 3', 4'-テトラヒドロキノリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、1- (4'-メチル-1', 2', 3', 4'-テトラヒドロキノリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2- (4'-ベンジル-1', 2', 3', 4'-テトラヒドロキノリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、1- (4'-t-ブチル-1', 2', 3', 4'-テトラヒドロキノリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、1- (7'-メチル-1', 2', 3', 4'-テトラヒドロキノリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、1- (7'-ベンジル-1', 2', 3', 4'-テトラヒドロキノリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、1- (7'-t-ブチル-1', 2', 3', 4'-テトラヒドロ

キノリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、1-(7'-フェニル-1', 2', 3', 4'-テトラヒドロキノリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2-(5'-メチル-1', 2', 3', 4'-テトラヒドロキノリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、1-(6'-t-ブチル-1', 2', 3', 4'-テトラヒドロキノリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

2-(1', 2', 3', 4'-テトラヒドロキノリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2-(4'-メチル-1', 2', 3', 4'-テトラヒドロキノリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2-(4'-ベンジル-1', 2', 3', 4'-テトラヒドロキノリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2-(4'-t-ブチル-1', 2', 3', 4'-テトラヒドロキノリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2-(7'-メチル-1', 2', 3', 4'-テトラヒドロキノリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2-(7'-ベンジル-1', 2', 3', 4'-テトラヒドロキノリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2-(7'-t-ブチル-1', 2', 3', 4'-テトラヒドロキノリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2-(7'-フェニル-1', 2', 3', 4'-テトラヒドロキノリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2-(5'-メチル-1', 2', 3', 4'-テトラヒドロキノリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、2-(6'-t-ブチル-1', 2', 3', 4'-テトラヒドロキノリン-1'-イル)カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール等の、前記式(1)中、-N(R³)(R⁴)で示される基が、前記式(B-7)で示される基である化合物；等が挙げられる。

[0063] これらの中でも、優れたストリゴラクトン受容体阻害活性を有する観点から、前記式(1)中、-N(R³)(R⁴)で示される基が、前記式(B-1

）、（B-2）、（B-3）、（B-4）、（B-5）及び（B-6）で示される基である化合物が好ましく、前記式（I）中、 $-N(R^3)(R^4)$ で示される基が、（i）前記式（B-1）で示される基であって、 R^3 、 R^4 が、置換基を有していてもよい、炭素数1～6のアルキル基である化合物、（ii）式（B-2）で示される基である化合物、（iii）式（B-4）で示される基である化合物、（iv）式（B-5）で示される基である化合物、及び（v）式（B-6）で示される基である化合物がより好ましく、前記式（I）中、 $-N(R^3)(R^4)$ で示される基が、前記式（B-6）で示される基である化合物が更に好ましい。

[0064] これらの中でも、下記の化合物が特に好ましい。

- 1-（ジエチルアミノカルボニル）-1, 2, 3-トリアゾール、
- 2-（ジエチルアミノカルボニル）-1, 2, 3-トリアゾール、
- 1-（モルホリン-1'-イル）カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール
- 2-（モルホリン-1'-イル）カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール
- 1-（メチルフェニルアミノカルボニル）-1, 2, 3-トリアゾール、
- 2-（メチルフェニルアミノカルボニル）-1, 2, 3-トリアゾール、
- 1-（1', 2', 3', 4'-テトラヒドロキノリン-1'-イル）カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
- 2-（1', 2', 3', 4'-テトラヒドロキノリン-1'-イル）カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
- 1-（ピロリジン-1'-イル）カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
- 2-（ピロリジン-1'-イル）カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
- 1-（インドリン-1'-イル）カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
- 2-（インドリン-1'-イル）カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
- 1-（4-フルオロインドリン-1'-イル）カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
- 2-（4-フルオロインドリン-1'-イル）カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

- 1 - (5-フルオロインドリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
- 2 - (5-フルオロインドリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
- 1 - (6-フルオロインドリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
- 2 - (6-フルオロインドリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
- 1 - (7-フルオロインドリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
- 2 - (7-フルオロインドリン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
- 2 - (4'-フェニルピペラジン-1'-イル) カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
- 1 - [4' - (2''-クロロフェニル) ピペラジン-1'-イル] カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
- 2 - [4' - (2''-フェニル) ピペラジン-1'-イル] カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
- 1 - [4' - (2''-メトキシフェニル) ピペラジン-1'-イル] カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
- 2 - [4' - (2''-メトキシフェニル) ピペラジン-1'-イル] カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
- 1 - (4'-ジフェニルメチル) ピペラジン-1'-イル] カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
- 2 - (4'-ジフェニルメチル) ピペラジン-1'-イル] カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、
- 1 - [4' - (2'', 4''-ジメトキシフェニル) ピペラジン-1'-イル] カルボニル-1, 2, 3-トリアゾール、

2 - [4' - (2'', 4'' - ジメトキシフェニル) ピペラジン - 1' - イル]
カルボニル - 1, 2, 3 - トリアゾール、
1 - (4' - ベンジルピペラジン - 1' - イル) カルボニル - 1, 2, 3 -
トリアゾール、
2 - (4' - ベンジルピペラジン - 1' - イル) カルボニル - 1, 2, 3 -
トリアゾール、
1 - [4' - (4'' - トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン - 1' - イル]
カルボニル - 1, 2, 3 - トリアゾール、
2 - [4' - (4'' - トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン - 1' - イル]
カルボニル - 1, 2, 3 - トリアゾール、
1 - [4' - (4'' - メチルベンジル) ピペラジン - 1' - イル] カルボニル - 1, 2, 3 -
トリアゾール、
2 - [4' - (4'' - メチルベンジル) ピペラジン - 1' - イル] カルボニル - 1, 2, 3 -
トリアゾール、
1 - [4' - (4'' - フルオロベンジル) ピペラジン - 1' - イル] カルボニル - 1, 2, 3 -
トリアゾール、
2 - [4' - (4'' - フルオロベンジル) ピペラジン - 1' - イル] カルボニル - 1, 2, 3 -
トリアゾール、
1 - [(ベンゾチアゾール - 2' - イル) ピペラジン - 1' - イル] カルボニル - 1, 2, 3 -
トリアゾール、
2 - [(ベンゾチアゾール - 2' - イル) ピペラジン - 1' - イル] カルボニル - 1, 2, 3 -
トリアゾール、
1 - [4' - (2'' - トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン - 1' - イル]
カルボニル - 1, 2, 3 - トリアゾール、
2 - [4' - (2'' - トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン - 1' - イル]
カルボニル - 1, 2, 3 - トリアゾール。

[0065] また、上記式 (1) で示される化合物は酸付加塩を形成することができ、置換基の種類に応じて酸付加塩を形成し得る。塩の種類は特に限定されず、

塩酸、硫酸などの鉱酸類との塩；p-トルエンスルホン酸、メタンスルホン酸、酒石酸などの有機酸類との塩；ナトリウム塩、カリウム塩、カルシウム塩などの金属塩；アンモニウム塩、トリエチルアミンなどの有機アミンとの塩；グリシンなどのアミノ酸との塩；等が挙げられる。さらに、上記式（1）で示される化合物又はその塩は水和物又は溶媒和物として存在することもある。これらの物質を本発明の阻害剤の有効成分として用いてもよい。

[0066] 前記式（1）で示されるトリアゾールウレア化合物のうち、前記式（1-1）で示されるトリアゾールウレア化合物は新規化合物である。

式（1-1）の（B¹-5）中、Rⁱは、水素原子、置換基を有していてもよい炭素数1～20のアルキル基、置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基、又は、置換基を有していてもよい複素環基を表す。

前記Rⁱの、置換基を有していてもよい炭素数1～20のアルキル基、置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基、又は、置換基を有していてもよい複素環基の具体例としては、前記R^fの、置換基を有していてもよい炭素数1～20のアルキル基、置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基、又は、置換基を有していてもよい複素環基の具体例として列記したものと同様のものが挙げられる。

[0067] 前記R^j、R^kはそれぞれ独立して、ニトロ基、シアノ基、ハロゲン原子、炭素数1～6のアルキル基、炭素数3～20のシクロアルキル基、炭素数1～6のアルコキシ基、アミノ基、モノ置換アミノ基、ジ置換アミノ基、炭素数1～6のアルキルチオ基、炭素数1～6のアルキルスルフェニル基、炭素数1～6のアルキルスルホニル基、炭素数2～10のアルコキシカルボニル基、炭素数2～10のアルキルカルボニル基又は置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基を表す。

前記R^j、R^kの、炭素数1～6のアルキル基、炭素数3～20のシクロアルキル基、炭素数1～6のアルコキシ基、モノ置換アミノ基、ジ置換アミノ基、炭素数1～6のアルキルチオ基、炭素数1～6のアルキルスルフェニル基、炭素数1～6のアルキルスルホニル基、炭素数2～10のアルコキシカ

ルボニル基、炭素数 2～10 のアルキルカルボニル基又は置換基を有していてもよい炭素数 6～20 のアリール基の具体例としては、前記 R^f、R^g の、炭素数 1～6 のアルキル基、炭素数 3～20 のシクロアルキル基、炭素数 1～6 のアルコキシ基、モノ置換アミノ基、ジ置換アミノ基、炭素数 1～6 のアルキルチオ基、炭素数 1～6 のアルキルスルフェニル基、炭素数 1～6 のアルキルスルホニル基、炭素数 2～10 のアルコキシカルボニル基、炭素数 2～10 のアルキルカルボニル基又は置換基を有していてもよい炭素数 6～20 のアリール基の具体例として列記したものと同様のものが挙げられる。

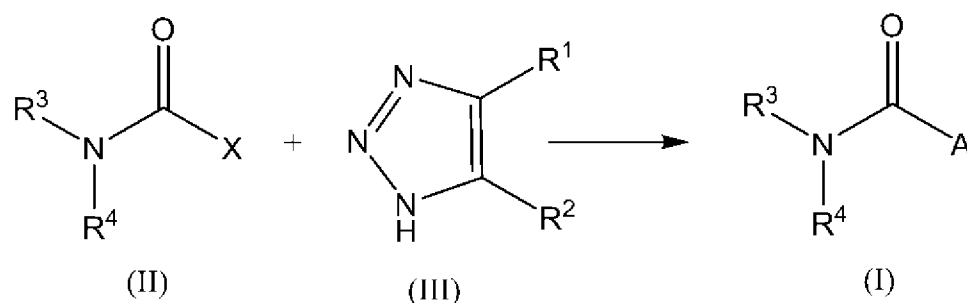
u、v はそれぞれ独立して、0～4 の整数を表し、それぞれ独立して、0 又は 1 であるのが好ましい。

前記式 (I-1) で示される化合物の多くは、優れたストリゴラクトン受容体阻害活性を有する。

[0068] [式 (I) で示されるトリアゾールウレア化合物の製造方法]

式 (I) で示されるトリアゾール化合物は、従来公知の方法により製造することができる。例えば、下記に示すように、式 (II) で示されるカルバモイルハライド化合物と、式 (III) で示されるトリアゾール化合物とを反応させることにより、目的とする式 (I) で示されるトリアゾールウレア化合物を得ることができる。

[0069] [化11]



[0070] 上記式中、X は、塩素原子、臭素原子等のハロゲン原子を表す。R¹、R²、R³、R⁴ 及び A は、前記と同じ意味を表す。

[0071] 上記反応を実施する方法としては、例えば、(a) 式 (II) で示されるカルバモイルハライド化合物と式 (III) で示されるトリアゾール化合物

の有機溶媒溶液に、所定量の塩基を添加し、全容を所定温度で攪拌する方法、(b)式(111)で示されるトリアゾール化合物と塩基の有機溶媒溶液に、所定量の、式(11)で示されるカルバモイルハライド又は式(11)で示されるカルバモリルハライドの有機溶媒溶液を添加し、全容を所定温度で攪拌する方法などが挙げられる。

[0072] 用いる有機溶媒としては、式(11)で示されるカルバモイルハライド、及び式(111)で示されるトリアゾール化合物を溶解し、反応に不活性な有機溶媒であれば、特に限定されない。例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、1,3-ジメトキシエタンなどのエーテル系溶媒；N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセタミド、N-メチルピロリドン等のアミド系溶媒；ジクロロメタン、クロロホルム、テトラクロロメタン、1,2-ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素系溶媒；アセトニトリル、メタクリロニトリル等のニトリル系溶媒；ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素系溶媒；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン等の炭化水素系溶媒；等が挙げられる。これらは、一種単独で、あるいは二種以上を組み合わせ用いることができる。

[0073] 用いる塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の金属水酸化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の金属炭酸塩；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の金属炭酸水素塩；水素化ナトリウム、水素化カリウム等の金属水素化物；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムメトキシド、カリウムエトキシド、マグネシウムエトキシド等の金属アルコキシド；トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン、ジアザビシクロウンデセン等の有機塩基；等が挙げられる。これらは、一種単独で、あるいは二種以上を組み合わせ用いることができる。

[0074] 式(11)で示されるカルバモイルハライド化合物の使用量は、式(111)で示されるトリアゾール化合物1モルに対して、通常0.5～5倍モル

、好ましくは、1.0～2倍モルである。

塩基の使用量は、式(11)で示されるカルバモイルハライド化合物1モルに対し、通常、0.5～3倍モル、好ましくは1.0～2倍モルである。

反応は、-10℃から用いる溶媒の沸点までの温度範囲で円滑に進行する。

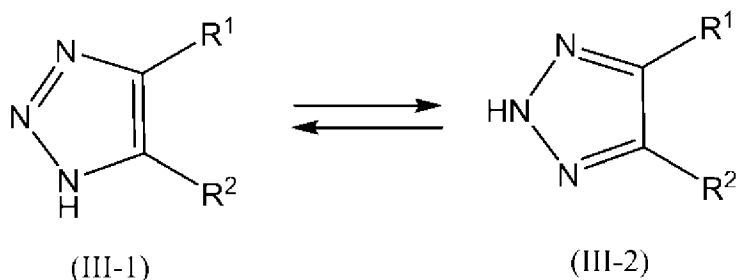
反応時間は、通常、数分から数時間である。

反応終了後は、有機化学における通常の後処理操作により、目的物を単離することができる。

[0075] 上記反応により、目的物である式(1)で示されるトリアゾールウレア化合物は、通常、式(1)中、Aが前記(A-1)で示される基である化合物と、前記(A-2)で示される基である化合物との混合物として得られる。

[0076] 前記式(111)で示されるトリアゾール化合物は、下記(111-1)で示される化合物と(111-2)で示される化合物の互変異生体の混合物として存在する。

[0077] [化12]



[0078] (式中、R¹、R²は前記と同じ意味を表す。)

このため、式(111-1)の状態では反応すれば、目的物である式(1)で示されるトリアゾールウレア化合物として、前記式(1)中、Aが前記(A-1)で示される基である化合物が得られ、式(111-2)の状態では反応すれば、前記式(1)中、Aが前記(A-2)で示される基である化合物が得られる。結果として、Aが前記(A-1)で示される基である化合物と、前記(A-2)で示される基である化合物との混合物が得られる。

[0079] 前記式(1)中、Aが前記(A-1)で示される基である化合物と、前記

(A-2)で示される基である化合物は、カラムクロマトグラフィー等の公知の分離精製手段により、容易に分離することができる。

また、本発明においては、前記式(1)中、Aが前記(A-1)で示される基である化合物、前記式(1)中、Aが、前記(A-2)で示される基である化合物、前記式(1)中、Aが前記(A-1)で示される基である化合物と、前記(A-2)で示される基である化合物の混合物のいずれも、本発明のストリゴラクトン受容体阻害剤として用いることができる。

[0080] 本発明のストリゴラクトン受容体阻害剤は、受容体DWARF14(D14)のストリゴラクトンの加水分解活性中心のアミノ酸残基に不可逆的に共有結合するため、植物体に本発明のストリゴラクトン受容体阻害剤を施すと、不可逆的にストリゴラクトンシグナル伝達が阻害されることが考えられる。

[0081] 2) 農業用組成物

本発明の農業用組成物は、前記式(1)で示されるトリアゾールウレア化合物の少なくとも一種、及び農学的に許容可能な配合補助剤を含むものである。

[0082] 本発明の農業用組成物に用いる農学的に許容可能な配合補助剤は、農学的に許容可能なものであれば、特に限定されない。例えば、界面活性剤、結合剤、増粘剤等が挙げられる。

例えば、アルキル硫酸エステル塩、アルキルアリールスルホン酸塩、ジアルキルスルホコハク酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテルリン酸エステル塩、リグニンスルホン酸塩、ナフタレンスルホネートホルムアルデヒド重縮合物等の陰イオン界面活性剤及びポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンアルキルポリオキシプロピレンブロックコポリマー、ソルビタン脂肪酸エステル等の非イオン界面活性剤などの界面活性剤；

デキストリン、カルボキシメチルセルロースのナトリウム塩、ポリカルボン酸系高分子化合物、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアルコール、リグニンスルホン酸ナトリウム、リグニンスルホン酸カルシウム、ポリアクリル

酸ナトリウム、アラビアガム、アルギン酸ナトリウム、マンニトール、ソルビトール、ベントナイト系鉱物質、ポリアクリル酸とその誘導体、カルボキシメチルセルロースのナトリウム塩、ホワイトカーボン、天然の糖類誘導体（例えば、キサンタンガム、グアーガム等）等の結合剤又は増粘剤；等が挙げられる。

これらの界面活性剤、結合剤、増粘剤は一種単独で、或いは二種以上を組み合わせて用いることができる。

配合補助剤の使用量は、組成物全体に対して通常0.1～50重量%、好ましくは約0.1～25重量%の割合である。

[0083] 本発明の農業用組成物は、例えば、前記式（1）で示されるトリアゾールウレア化合物の少なくとも一種、配合補助剤、及び、必要により、液体担体、固体担体、ガス担体、界面活性剤等を混合して、水和剤、顆粒水和剤、フロアブル剤、粒剤、ドライフロアブル剤、乳剤、水性液剤、油剤、くん煙剤、エアゾール剤、マイクロカプセル剤等に製剤化して用いられる。

これらの製剤中における前記式（1）で示されるトリアゾールウレア化合物の含有量は、重量比で通常0.1～99%、好ましくは0.2～90%である。

[0084] 用いる液体担体としては、例えば、水、アルコール類（例えば、メタノール、エタノール、1-プロパノール、2-プロパノール、エチレングリコール等）、ケトン類（例えば、アセトン、メチルエチルケトン等）、エーテル類（例えば、ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールモノメチルエーテル、ジエチレングリコールモノメチルエーテル、プロピレングリコールモノメチルエーテル等）、脂肪族炭化水素類（例えば、ヘキサン、オクタン、シクロヘキサン、灯油、燃料油、機械油等）、芳香族炭化水素類（例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、メチルナフタレン等）、ハロゲン化炭化水素類（例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等）、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、N-メチルピロリドン等）、エステル類（例えば、酢酸エチ

ル、酢酸ブチル、脂肪酸グリセリンエステル等)、ニトリル類(例えば、アセトニトリル、プロピオニトリル等)等が挙げられる。

これらの液体担体は一種単独で、あるいは二種以上を組み合わせる用いることができる。

[0085] 用いる固体担体としては、植物性粉末(例えば、大豆粉、タバコ粉、小麦粉、木粉等)、鉱物性粉末(例えば、カオリン、ベントナイト、酸性白土、クレイ等のクレイ類、滑石粉、ロウ石粉等のタルク類、珪藻土、雲母粉等のシリカ類等)、アルミナ、硫黄粉末、活性炭、糖類(例えば、乳糖、ブドウ糖等)、無機塩類(例えば、炭酸カルシウム、重炭酸ナトリウム等)、ガラス中空体(天然のガラス質を焼成加工してその中に気泡を内包させたもの)等が挙げられる。

これらの固体担体は一種単独で、あるいは二種以上を組み合わせる用いることができる。

液体担体又は固体担体の使用量は、製剤全体に対して通常1～99重量%、好ましくは約10～99重量%の割合である。

[0086] また、本発明の農業用組成物は、他の殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、除草剤、植物生長調節剤、肥料又は土壌改良剤と混合して、又は混合せずに同時に用いることもできる。

[0087] 本発明のストリゴラクトン受容体阻害剤又は農業用組成物は、植物の枝分かれ増加剤として使用することができる。

従来、ストリゴラクトンは、植物の枝分かれを制御する植物ホルモンであり、植物の枝分かれ抑制活性を有することが知られている。本発明のストリゴラクトン受容体阻害剤又は農業用組成物は、ストリゴラクトンの活性を阻害する作用を有する。本発明のストリゴラクトン受容体阻害剤又は農業用組成物を植物体に施すと、不可逆的にストリゴラクトンシグナル伝達が阻害され、結果として、植物の枝分かれが増加する。従って、本発明のストリゴラクトン受容体阻害剤又は農業用組成物は、植物の枝分かれ増加剤として使用することができる。

[0088] 特に、本発明のストリゴラクトン受容体阻害剤又は農業用組成物をイネ科植物に施すと、イネ科植物の分げつが促進される。

従って、本発明のストリゴラクトン受容体阻害剤又は農業用組成物は、イネ科植物の分げつ促進剤として好ましく使用することができる。

分げつが促進されれば、イネの収穫量の増加が見込まれる。

[0089] 本明細書において「分げつ」の用語は、イネ科作物において根に近い茎の関節から側枝が発生して成長することを意味するが、この用語をいかなる意味においても限定的に解釈してはならず、最も広義に解釈しなければならない。従って、本発明の阻害剤をイネやサトウキビ等に適用することにより、枝分かれによるバイオマス増加を達成することもできる。

[0090] また、本発明のストリゴラクトン受容体阻害剤又は農業用組成物は、開花植物においては枝分かれを増加させることにより花数を増加させることができるので、農園芸用の花数増加剤として適用することが可能である。適用対象である開花植物は特に限定されず、イネや果樹などの農作物のほか、チューリップやバラなどの園芸植物など任意の開花植物に適用することもできる。

[0091] 本発明のストリゴラクトン受容体阻害剤又は農業用組成物は、植物の枝分かれ増加剤として使用することができる植物としては、特に限定されない。

例えば、トウモロコシ、イネ、コムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク、ソルガム、ワタ、ダイズ、ピーナッツ、ソバ、テンサイ、ナタネ、ヒマワリ、サトウキビ、タバコ等、野菜；ナス科野菜（ナス、トマト、ピーマン、トウガラシ、ジャガイモ等）、ウリ科野菜（キュウリ、カボチャ、ズッキーニ、スイカ、メロン等）、アブラナ科野菜（ダイコン、カブ、セイヨウワサビ、コールラビ、ハクサイ、キャベツ、カラシナ、ブロッコリー、カリフラワー等）、キク科野菜（ゴボウ、シュンギク、アーティチョーク、レタス等）、ユリ科野菜（ネギ、タマネギ、ニンニク、アスパラガス）、セリ科野菜（ニンジン、パセリ、セロリ、アメリカボウフウ等）、アカザ科野菜（ホウレンソウ、フダンソウ等）、シソ科野菜（シソ、ミント、バジル等）、イチゴ

、サツマイモ、ヤマノイモ、サトイモ等の農作物；花卉；観葉植物；仁果類（リンゴ、セイヨウナシ、ニホンナシ、カリン、マルメロ等）、核果類（モモ、スモモ、ネクタリン、ウメ、オウトウ、アンズ、プルーン等）、カンキツ類（ウンシュウミカン、オレンジ、レモン、ライム、グレープフルーツ等）、堅果類（クリ、クルミ、ハシバミ、アーモンド、ピスタチオ、カシューナッツ、マカダミアナッツ等）、液果類（ブルーベリー、クランベリー、ブラックベリー、ラズベリー等）、ブドウ、カキ、オリーブ、ビワ、バナナ、コーヒー、ナツメヤシ、ココヤシ等の果樹；チャ、クワ、花木、街路樹（トネリコ、カバノキ、ハナミズキ、ユーカリ、イチヨウ、ライラック、カエデ、カシ、ポプラ、ハナズオウ、フウ、プラタナス、ケヤキ、クロベ、モミノキ、ツガ、ネズ、マツ、トウヒ、イチイ）等の果樹以外の樹；等が挙げられる。

[0092] また、「作物」には、ストリゴラクトンの生合成遺伝子が欠損した突然変異体や、イソキサフルトール等のH P P D阻害剤、イマゼタピル、チフェンスルフロンメチル等のA L S阻害剤、E P S P合成酵素阻害剤、グルタミン合成酵素阻害剤、ブロモキシニル等の除草剤に対する耐性が、古典的な育種法、もしくは遺伝子組換え技術により付与された作物；遺伝子組換え技術を用いて、例えば、バチルス属で知られている選択的毒素等を合成する事が可能となった作物；遺伝子組換え技術を用いて、選択的な作用を有する抗病原性物質を産生する能力を付与された作物；等も含まれる。

[0093] 3) ストライガ種子の発芽抑制剤

前記式(1)で示されるトリアゾールウレア化合物は、ストライガ種子の発芽抑制作用を有する。従って、前記式(1)で示されるトリアゾールウレア化合物は、ストライガ種子の発芽抑制剤の有効成分として有用である。

[0094] ストライガ(*Striga*, 英名: *witchweed*または*witches weed*)は、アフリカ、アジア、オーストラリアの熱帯および亜熱帯区域に分布する一年生の半寄生植物である。ストライガには多くの種があり、種数は40種以上といわれている。 ストライガとしては、特に制限さ

れず、公知のストライガが挙げられる。例えば、*Striga hermonthica*、*Striga gesnerioides*、*Striga asiatica*、*Striga aequinoctialis*、*Striga angolensis*、*Striga angustifolia*、*Striga aspera*、*Striga bilabiata*、*Striga brachycalyx*、*Striga chrysantha*、*Striga dalzielii*、*Striga elegans*、*Striga forbesii*、*Striga gastonii*、*Striga gracillima*、*Striga hallaei*、*Striga hirsuta*、*Striga junodii*、*Striga klingii*、*Striga latericea*、*Striga lepidagathidis*、*Striga lutea*、*Striga macrantha*、*Striga passargei*、*Striga pinnatifida*、*Striga primuloides*、*Striga pubiflora*、*Striga yemenica*等が挙げられる。

ストライガは、トウモロコシ、キビ、モロコシ、サトウキビ、コメ、マメ類等に寄生する。ストライガに寄生された宿主は、生育不良、しおれ、クロロシスのような干ばつ、養分欠乏、および維束管の障害のような病状を呈する。宿主の根から分泌される物質にはストリゴラクトンが含まれており、その物質がストライガの種子を発芽させるのを促進するシグナル伝達分子とされている。

[0095] 上述のように、前記式(1)で示されるトリアゾールウレア化合物は、ストリゴラクトン受容体阻害作用を有するものであり、ストライガ種子の発芽抑制作用をも有する。

前記式(1)で示されるトリアゾールウレア化合物(又は、前記式(1)で示されるトリアゾールウレア化合物を有効成分として含有する組成物)をストライガ種子の発芽抑制剤として使用する方法としては、上記有効成分と

ストライガ種子とが接触できる態様である限り特に限定されない。例えば、ストライガ種子を含む土壌に、本発明の剤を散布、滴下、塗布、混合等する態様が挙げられる。より具体的には、前記式（１）で示されるトリアゾールウレア化合物又は前記組成物を、ストライガ種子を含む土壌に、散布、滴下、塗布、混合等する態様が挙げられる。

[0096] 前記式（１）で示されるトリアゾールウレア化合物とともに、ストリゴラクトン類縁体（ストリゴラクトンのアゴニスト）を共投与した場合であっても、優れたストライガ種子の発芽抑制効果が得られる。

[0097] 本発明の剤の剤形は、農学的に許容される剤形である限り特に限定されない。例えば、液剤、固形剤、粉剤、顆粒剤、粒剤、水和剤、フロアブル剤、乳剤、ペースト剤、分散剤等が挙げられる。

[0098] 本発明の発芽抑制剤は、有効成分（前記式（１）で表される化合物、又はその塩、水和物若しくは溶媒和物）のみからなるものでもよいが、これらに加えて、剤形、施用態様等に応じて種々の添加剤を含んでいてもよい。本発明の剤中の有効成分の含有割合は、特に限定されない。具体的には、０．０００１～１００重量％、好ましくは０．０１～５０重量％程度が例示される。

[0099] 添加剤は、農学的に許容される添加剤である限り特に限定されない。例えば、担体、界面活性剤、増粘剤、増量剤、結合剤、ビタミン類、酸化防止剤、ｐＨ調整剤、揮散抑制剤、色素等が挙げられる。

本発明の発芽抑制剤の使用量は、ストライガ種子の発芽を抑制できる量であれば特に限定されないが、通常、１０a当たり、５kg～２０kg程度である。

実施例

[0100] 次に本発明について製造例、製剤例、試験例等の実施例によりさらに具体的に説明するが、本発明はこれらの例のみに限定されるものではない。

[0101] （１）トリアゾールウレア化合物（１）の合成

１－（ピロリジン－１’－イル）カルボニル－１，２，３－トリアゾール

(KOK1007-N1異性体)、および2-(ピロリジン-1'-イル)カルボニル-1,2,3-トリアゾール(化合物5-N1、N2異性体の製造)

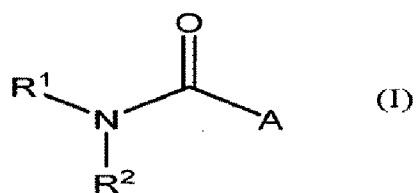
1H-1,2,3-トリアゾール(62mg)、1-ピロリジンカルボニルクロリド(100mg)、4-(ジメチルアミノ)ピリジン(触媒量)をテトラヒドロフラン/トリエチルアミン混合液(5:1、1.5mL)に溶解し、40℃で6時間攪拌した。溶媒を減圧留去後、濃縮液をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン:酢酸エチル(体積比)=3:1から2:1)で精製し表題化合物のN1異性体(68mg、白色固体)及びN2異性体(36mg、白色固体)を得た。

[0102] 同様にして、以下の化合物も合成した。得られたトリアゾールウレア化合物の物性値を以下に示す。なお、N1異性体とは前記式(1)において、Aが(A-1)で示される基である化合物を、N2異性体とは、前記式(1)において、Aが(A-2)で示される基である化合物を意味する。

[0103]

[表1]

第1表-1



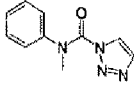
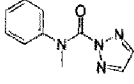
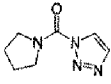
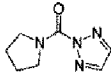
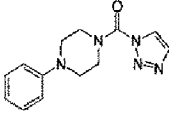
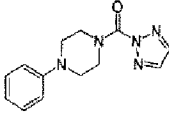
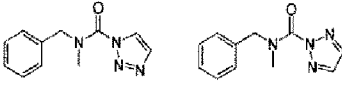
¹H NMR化学シフト値を以下の表に示す。なお、NMRは、特記なき限り、重クロロホルムを用いて測定した。
(以下にて同じ。)

化合物No.	構造式	¹ H-NMR
化合物1 N1異性体		$\delta = 7.80$ (1H, s), 7.73 (1H, s), 3.59 (4H, s), 1.33 (6H, m).
化合物1 N2異性体		$\delta = 7.80$ (2H, s), 3.81 – 3.29 (4H, m), 1.29 (6H, t, $J = 7.1$ Hz).
化合物2 N1異性体		$\delta = 7.60$ (1H, d, $J = 0.7$ Hz), 7.57 (1H, d, $J = 0.7$ Hz), 7.38 – 7.16 (10H, m).
化合物2 N2異性体		$\delta = 7.52$ (2H, s), 7.57 (1H, d, $J = 0.7$ Hz), 7.31 – 7.07 (10H, m).
化合物3 N1異性体		$\delta = 7.84$ (1H, s), 7.75 (1H, s), 4.02 – 3.80 (8H, m).
化合物3 N2異性体		$\delta = 7.83$ (2H, s), 4.06 – 3.65 (8H, m).

[0104]

[表2]

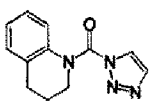
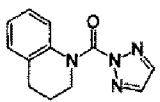
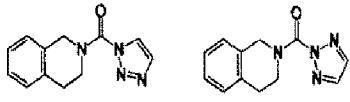
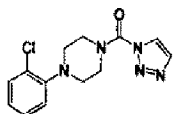
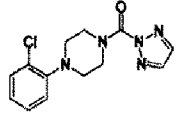
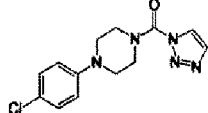
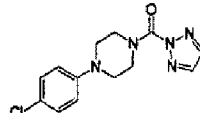
第1表-2

化合物No.	構造式	¹ H-NMR
化合物4 N1異性体		δ = 7.53–7.47 (4H, m), 7.28–6.99 (3H, m), 3.50 (3H, s).
化合物4 N2異性体		δ = 7.58 (2H, s), 7.33–7.17 (3H, m), 7.10–7.04 (2H, m), 3.58 (3H, s).
化合物5 N1異性体		δ = 7.82 (1H, d, J = 0.9 Hz), 7.72 (1H, d, J = 0.9 Hz), 3.76 (4H, m), 2.05–1.90 (4H, m).
化合物5 N2異性体		δ = 7.74 (2H, s), 3.82 (2H, m), 3.67 (2H, m), 2.01–1.84 (4H, m).
化合物6 N1異性体		δ = 8.21 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.75 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.35–7.29 (2H, m), 6.99–6.90 (3H, m), 4.20–3.85 (4H, m), 3.40–3.27 (4H, m).
化合物6 N2異性体		δ = 7.84 (2H, s), 7.34–7.25 (3H, m), 6.98–6.89 (3H, m), 3.92 (4H, m), 3.31 (4H, m).
化合物7 N1N2異性体 混合物		N1異性体 δ = 8.23 (1H, s), 7.74 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.45–7.25 (5H, m), 4.79 (2H, s), 3.26 (3H, s). N2異性体 7.82 (2H, s), 7.45–7.25 (5H, m), 4.74 (2H, s), 3.07 (3H, s).

[0105]

[表3]

第1表-3

化合物8 N1異性体		δ = 8.12 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.72 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.24-6.92 (4H, m), 4.02 (2H, t, J = 6.3 Hz), 2.90 (2H, t, J = 6.8 Hz), 2.19-2.05 (2H, m).
化合物8 N2異性体		δ = 7.73 (2H, s), 7.19 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.06 (1H, td, J = 7.7, 1.4 Hz), 6.96 (1H, td, J = 7.7, 1.4 Hz), 6.63 (1H, d, J = 7.7 Hz), 3.94 (2H, t, J = 6.6 Hz), 2.89 (2H, t, J = 6.8 Hz), 2.19-2.04 (2H, m).
化合物9 N1、N2異性体 混合物		N1異性体 δ = 8.22 (1H, s), 7.75 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.30-7.14 (4H, m), 4.99-4.83 (2H, m), 4.19-3.70 (2H, m), 3.21-3.00 (2H, m). N2異性体 δ = 7.86 (2H, s), 7.30-7.13 (4H, m), 5.23-5.00 (2H, m), 4.19-3.70 (2H, m), 3.21-3.00 (2H, m).
化合物10 N1異性体		δ = 8.21 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.75 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.44-7.36 (1H, m), 7.30-7.21 (1H, m), 7.09-6.99 (2H, m), 4.23-3.88 (4H, m), 3.28-3.13 (4H, m).
化合物10 N2異性体		δ = 7.84 (2H, s), 7.42-7.36 (1H, m), 7.29-7.21 (1H, m), 7.07-6.98 (2H, m), 4.06-3.81 (4H, m), 3.28-3.07 (4H, m).
化合物11 N1異性体		δ = 8.21 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.75 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.31-7.19 (2H, m), 6.92-6.82 (2H, m), 4.25-3.75 (4H, m), 3.37-3.21 (4H, m).
化合物11 N2異性体		δ = 7.85 (2H, s), 7.29-7.20 (2H, m), 6.91-6.82 (2H, m), 3.99-3.84 (4H, m), 3.35-3.19 (4H, m).

[0106]

[表4]

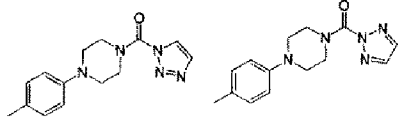
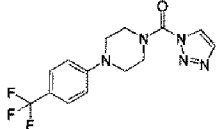
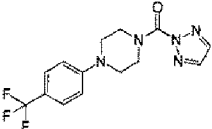
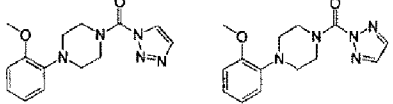
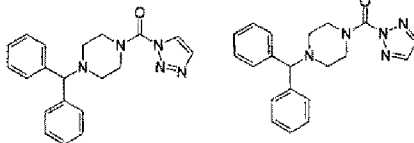
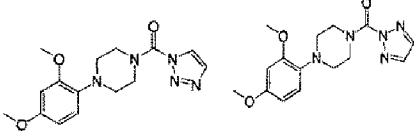
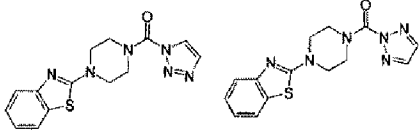
第1表-4

化合物12 N1異性体		δ = 8.25–8.19 (2H, m), 7.75 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.58–7.48 (1H, m), 6.74–6.64 (2H, m), 4.19–3.84 (4H, m), 3.82–3.64 (4H, m).
化合物12 N2異性体		δ = 8.24–8.19 (1H, m), 7.85 (2H, s), 7.58–7.48 (1H, m), 6.74–6.64 (2H, m), 3.95–3.82 (4H, m), 3.76–3.65 (4H, m).
化合物13 N1異性体		δ = 8.21 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.75 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.41 (1H, d, J = 2.5 Hz), 7.23 (1H, dd, J = 8.6, 2.5 Hz), 6.98 (1H, d, J = 8.6 Hz), 4.22–3.88 (4H, m), 3.23–3.09 (4H, m).
化合物13 N2異性体		δ = 7.84 (2H, s), 7.40 (1H, d, J = 2.3 Hz), 7.22 (1H, dd, J = 8.6, 2.3 Hz), 6.97 (1H, d, J = 8.6 Hz), 4.07–3.82 (4H, m), 3.26–3.05 (4H, m).
化合物14 N1、N2異性体混合物		N1異性体 δ = 8.24 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.22–8.12 (2H, m), 7.77 (1H, d, J = 1.3 Hz), 6.92–6.82 (2H, m), 4.32–3.91 (4H, m), 3.69–3.53 (4H, m). N2異性体 δ = 8.22–8.12 (2H, m), 7.87 (2H, s), 6.92–6.82 (2H, m), 4.32–3.91 (4H, m), 3.69–3.53 (4H, m).
化合物15 N1、N2異性体混合物		N1異性体 δ = 8.23 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.76 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.59–7.51 (2H, m), 6.94–6.87 (2H, m), 4.30–3.88 (4H, m), 3.59–3.43 (4H, m). N2異性体 δ = 7.86 (2H, s), 7.59–7.51 (2H, m), 6.94–6.87 (2H, m), 4.30–3.88 (4H, m), 3.59–3.43 (4H, m).
化合物16 N1、N2異性体混合物		N1異性体 δ = 8.17 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.73 (1H, d, J = 1.3 Hz), 4.01–3.61 (4H, m), 2.81–2.59 (4H, m), 2.43–2.25 (2H, m), 1.93–1.75 (4H, m), 1.70–1.56 (1H, m), 1.36–0.99 (4H, m). N2異性体 δ = 7.82 (2H, s), 4.01–3.61 (4H, m), 2.81–2.59 (4H, m), 2.43–2.25 (2H, m), 1.93–1.75 (4H, m), 1.70–1.56 (1H, m), 1.36–0.99 (4H, m).

[0107]

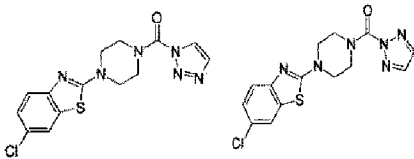
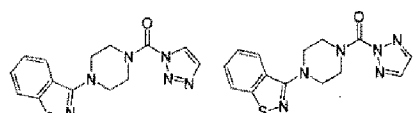
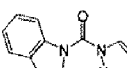
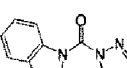
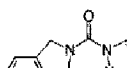
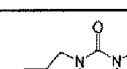
[表5]

第1表-5

化合物17 N1、N2異性体 混合物		N1異性体 δ = 8.20 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.74 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.15–7.06 (2H, m), 6.90–6.82 (2H, m), 4.22–3.80 (4H, m), 3.35–3.16 (4H, m), 2.29 (3H, s). N2異性体 δ = 7.84 (1H, s), 7.15–7.06 (2H, m), 6.90–6.82 (2H, m), 4.22–3.80 (4H, m), 3.35–3.16 (4H, m), 2.29 (3H, s).
化合物18 N1異性体		δ = 8.22 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.76 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.53 (2H, d, J = 8.2 Hz), 6.96 (2H, d, J = 8.6 Hz), 4.28–3.85 (4H, m), 3.52–3.34 (4H, m).
化合物18 N2異性体		δ = 7.86 (2H, s), 7.53 (2H, d, J = 8.2 Hz), 6.96 (2H, d, J = 8.6 Hz), 3.99–3.90 (4H, m), 3.49–3.36 (4H, m).
化合物19 N1、N2異性体 混合物		N1異性体 δ = 8.22 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.76 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.12–7.01 (1H, m), 6.99–6.87 (3H, m), 4.24–3.91 (4H, m), 3.89 (3H, s), 3.29–3.12 (4H, m). N2異性体 δ = 7.85 (2H, s), 7.12–7.01 (1H, m), 6.99–6.87 (3H, m), 4.24–3.91 (4H, m), 3.89 (3H, s), 3.29–3.12 (4H, m).
化合物20 N1、N2異性体 混合物		N1異性体 δ = 8.14 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.69 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.45–7.38 (4H, m), 7.33–7.15 (6H, m), 4.30 (1H, s), 4.07–3.60 (4H, m), 2.66–2.42 (4H, m). N2異性体 δ = 7.77 (2H, s), 7.45–7.38 (4H, m), 7.33–7.15 (6H, m), 4.29 (1H, s), 4.07–3.60 (4H, m), 2.66–2.42 (4H, m).
化合物21 N1、N2異性体 混合物		N1異性体 δ = 8.20 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.75 (1H, d, J = 1.3 Hz), 6.90–6.84 (1H, m), 6.53–6.49 (1H, m), 6.48–6.41 (1H, m), 4.22–3.88 (4H, m), 3.87 (3H, s), 3.79 (3H, s), 3.21–3.05 (4H, m). N2異性体 δ = 7.84 (2H, s), 6.90–6.84 (1H, m), 6.53–6.49 (1H, m), 6.48–6.41 (1H, m), 4.22–3.88 (4H, m), 3.86 (3H, s), 3.79 (3H, s), 3.21–3.05 (4H, m).
化合物22 N1、N2異性体 混合物		N1異性体 δ = 8.23 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.77 (3H, d, J = 1.3 Hz), 7.67–7.58 (2H, m), 7.38–7.29 (1H, m), 7.17–7.08 (1H, m), 4.24–3.75 (8H, m). N2異性体 δ = 7.87 (2H, s), 7.67–7.58 (2H, m), 7.38–7.29 (1H, m), 7.17–7.08 (1H, m), 4.24–3.75 (8H, m).

[表6]

第1表-6

化合物23 N1、N2異性体 混合物		N1異性体 δ = 8.23 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.77 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.62–7.58 (1H, m), 7.49 (1H, dd, J = 8.4, 2.5 Hz), 7.32–7.25 (1H, m), 4.25–3.87 (4H, m), 3.87–3.73 (4H, m). N2異性体 δ = 7.87 (2H, s), 7.62–7.58 (1H, m), 7.49 (1H, dd, J = 8.4, 2.5 Hz), 7.32–7.25 (1H, m), 4.25–3.87 (4H, m), 3.87–3.73 (4H, m).
化合物24 N1、N2異性体 混合物		N1異性体 δ = 8.22 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.93–7.88 (1H, m), 7.87–7.82 (1H, m), 7.75 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.54–7.46 (1H, m), 7.43–7.35 (1H, m), 4.30–3.89 (4H, m), 3.79–3.58 (4H, m). N2異性体 δ = 7.93–7.88 (1H, m), 7.87–7.82 (3H, m), 7.54–7.46 (1H, m), 7.43–7.35 (1H, m), 4.30–3.89 (4H, m), 3.79–3.58 (4H, m).
化合物25 N1異性体		δ = 8.36 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.11 (1H, br s), 7.78 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.35–7.27 (2H, m), 7.20–7.12 (1H, m), 4.67 (2H, t, J = 8.4 Hz), 3.27 (2H, t, J = 8.4 Hz).
化合物25 N2異性体		δ = 8.05 (1H, br s), 7.87 (1H, s), 7.36–7.23 (2H, m), 7.16–7.08 (1H, m), 4.47 (2H, t, J = 8.4 Hz), 3.22 (2H, t, J = 8.4 Hz).
化合物26 N1異性体		δ = 8.40 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.78 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.39–7.28 (5H, m), 5.48 (2H, s), 5.12 (2H, s).
化合物26 N2異性体		δ = 7.89 (2H, s), 7.40–7.27 (4H, m), 5.32 (2H, s), 5.14 (2H, s).

[0109]

[表7]

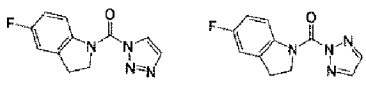
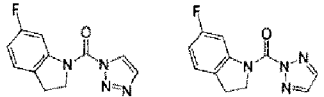
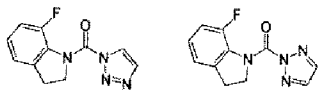
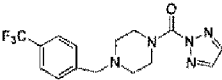
第1表-7

化合物27 N1、N2異性体 混合物		N1異性体 δ = 8.21 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.75 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.67 (1H, d, J = 7.9 Hz), 7.56 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.37 (1H, d, J = 7.9 Hz), 7.30 (1H, t, J = 7.9 Hz), 4.21–3.80 (4H, m), 3.20–2.98 (4H, m). N2異性体 δ = 7.85 (2H, s), 7.67 (1H, d, J = 7.9 Hz), 7.56 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.37 (1H, d, J = 7.9 Hz), 7.30 (1H, t, J = 7.9 Hz), 4.21–3.80 (4H, m), 3.20–2.98 (4H, m).
化合物28 N1、N2異性体 混合物		N1異性体 δ = 8.22 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.76 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.23 (1H, d, J = 3.6 Hz), 6.65 (1H, d, J = 3.6 Hz), 4.23–3.83 (4H, m), 3.76–3.60 (4H, m). N2異性体 δ = 7.86 (2H, s), 7.23 (1H, d, J = 3.5 Hz), 6.66 (1H, d, J = 3.5 Hz), 3.96–3.87 (4H, m), 3.71–3.62 (4H, m).
化合物29 N1、N2異性体 混合物		DMSO-d6 N1異性体 δ = 8.61 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.56 (1H, d, J = 9.0 Hz), 7.96 (1H, d, J = 1.3 Hz), 6.61 (1H, d, J = 9.0 Hz), 4.46–4.20 (4H, m), 4.06–3.89 (4H, m). N2異性体 δ = 8.55 (1H, d, J = 8.9 Hz), 8.19 (2H, s), 6.61 (1H, d, J = 9.2 Hz), 4.46–4.20 (4H, m), 4.06–3.89 (4H, m).
化合物30 N1異性体		δ = 7.95 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.49 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.37–7.28 (3H, m), 7.16–7.07 (2H, m), 4.96–4.79 (1H, m), 1.30 (6H, d, J = 6.9 Hz).
化合物30 N2異性体		δ = 7.49 (2H, s), 7.31–7.21 (3H, m), 7.13–7.04 (2H, m), 4.92–4.75 (1H, m), 1.31 (6H, d, J = 6.9 Hz).
化合物31 N1異性体		δ = 8.17 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.74 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.21–7.12 (2H, m), 6.97–6.89 (2H, m), 4.71–4.58 (1H, m), 4.13–3.77 (4H, m), 2.21–1.91 (4H, m).
化合物31 N2異性体		δ = 7.82 (2H, s), 7.20–7.12 (2H, m), 6.97–6.89 (2H, m), 4.71–4.58 (1H, m), 4.13–3.59 (4H, m), 2.20–1.90 (4H, m).
化合物32 N1、N2異性体 混合物		N1異性体 δ = 8.20 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.74 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.49–7.40 (5H, m), 4.12–3.49 (8H, m). N2異性体 δ = 7.84 (2H, s), 7.49–7.40 (5H, m), 4.12–3.49 (8H, m).

[0110]

[表8]

第1表-8

化合物33 N1、N2異性体		N1異性体 8.37 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.14-8.02 (1H, m), 7.78 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.10-6.92 (2H, m), 4.71 (2H, t, J = 8.3 Hz), 3.26 (2H, t, J = 8.3 Hz). N2異性体 8.17-7.96 (1H, m), 7.88 (2H, s), 7.03-6.91 (2H, m), 4.51 (2H, t, J = 8.4 Hz), 3.21 (2H, t, J = 8.4 Hz).
化合物34 N1、N2異性体		N1異性体 8.37 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.98-7.81 (1H, m), 7.78 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.23-7.18 (1H, m), 6.86 (1H, td, J = 8.5, 2.5 Hz), 4.74 (2H, J = 8.4 Hz), 3.23 (2H, t, J = 8.4 Hz). N2異性体 7.89 (2H, s), 7.87-7.68 (1H, m), 7.23-7.12 (1H, m), 6.83 (1H, td, J = 8.5, 2.4 Hz), 4.55 (2H, t, J = 8.4 Hz), 3.19 (2H, t, J = 8.4 Hz).
化合物35 N1、N2異性体		N1異性体 8.31 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.76 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.19-6.91 (3H, m), 4.47 (2H, t, J = 7.8 Hz), 3.22 (2H, t, J = 7.8 Hz). N2異性体 7.87 (2H, s), 7.17-7.02 (2H, m), 7.02-6.86 (1H, m), 4.34 (2H, t, J = 7.8 Hz), 3.21 (2H, t, J = 7.8 Hz).
化合物36 N2異性体		N2異性体 7.82 (2H, s), 7.59 (2H, d, J = 8.0 Hz), 7.47 (2H, d, J = 8.0 Hz), 3.92-3.65 (4H, m), 3.61 (2H, s), 2.72-2.45 (4H, m).

[0111] (3) 酵母ツーハイブリッド法 (Y2H: Yeast Two Hybrid System) を用いたD14機能評価試験

上記で合成したトリアゾールウレア化合物を用いて、酵母ツーハイブリッド法 (Y2H) を用いたD14機能評価試験を行った。

Y2Hは、酵母GAL4などの分離可能なDNA結合および転写活性化ドメインをもつ転写アクチベーターを利用することにより、特異的なタンパク質X:タンパク質Y間相互作用を検出するシステムである。このシステムでは転写アクチベーターのDNA結合ドメインにタンパク質Xを、転写活性化ドメインにタンパク質Y連結させてあり、タンパク質Xとタンパク質Yが相互作用すればDNA結合ドメインと転写活性化ドメインが並列することになり、転写アクチベーターが作動可能になる。

またこのシステムで用いる酵母ゲノム中では転写アクチベーター応答配列とレポーター遺伝子が連結させてあり、転写アクチベーターが応答配列に結合しレポーター遺伝子が発現すると、酵母がある種のアミノ酸欠乏条件下で生育

可能になったり、特定の酵素の発現が誘導されたりするように設計されている。その生育や酵素活性を観察することでタンパク質X：タンパク質Y間相互作用を検出できる。

[0112] 本試験では、転写アクチベーターGAL4のDNA結合ドメインにD14を、転写活性化ドメインにストリゴラクトン存在下でD14と結合することが知られるD53（SLシグナル抑制因子である蛋白質）やSLR1（ジベレリンシグナル伝達の抑制因子であるDELLAタンパク質）を連結させた。この酵母をストリゴラクトン存在下で生育させるとレポーター遺伝子の転写が活性化され、ヒスチジン、アデニン欠乏培地でも生育可能となる。ストリゴラクトンと化合物を同時に投与したときにヒスチジン、アデニン欠乏培地で生育するかどうかを調べることで、化合物のアンタゴニスト活性を評価した。

その結果、化合物1（化合物番号は第1表の記載に対応する。以下にて同じ）、化合物3、化合物5、化合物6、化合物7、化合物8、化合物10、化合物12、化合物19、化合物20、化合物21、化合物22、化合物24、化合物25、化合物27は、強いストリゴラクトンアンタゴニスト活性を示した。

[0113] （4）ストリゴラクトン阻害剤の稲の枝分かれ形質の効果確認試験

イネd17変異体は、ストリゴラクトンを内生できず枝分かれを制御できないイネの変異株である（図1（a））。

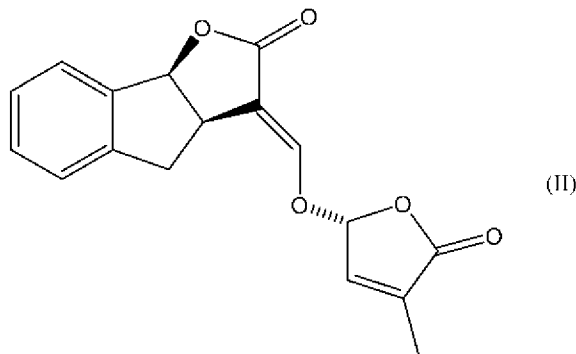
このd17変異体に、GR24のようなストリゴラクトン類縁体（下記式（I1））を処理すると多分げつ形質は制圧され、通常の枝分かれ数に戻る（図1（b））。

ストリゴラクトン類縁体GR24（下記式（I1））とともに、上記（3）の評価試験により強いストリゴラクトンアンタゴニスト活性を示した化合物を処理すると、分げつ形質は回復せず、多分げつのまま変化しないことが予想される（図1（c））。

上記で合成した化合物がこの予想通りの効果を示すかどうかを調べるため

に以下の試験を行った。

[0114] [化13]



[0115] (5) イネ d 1 7 変異株を用いた S L 受容体阻害剤の評価試験 (1)

イネ種子 (シオカリ) に滅菌溶液 I (2.5 重量%次亜塩素酸ナトリウム水溶液、0.01% Tween-20) を加え、室温にて15分間震盪した。滅菌溶液 I を捨て、滅菌溶液 II (2.5 重量%次亜塩素酸ナトリウム水溶液) を加え、室温 (25℃) にて15分間震盪した。クリーンベンチ内にて滅菌溶液 II を捨て、滅菌 水で種子を5回洗浄し、暗所、25℃にて2日間静置した。2日後、イネ水耕用寒天培地に発芽種子を移植し、明期16時間、暗期8時間、25℃で6日間静置した。容量12 mL の褐色バイアル瓶に化合物含有イネ水耕用培地を12 mL 加え、寒天培地よりイネを移植し、明期16時間、暗期8時間、25℃で7日間静置した。途中、4日目にイネ水耕用培地を5 mL ずつ補充した。

7日間静置後に第一分げつと第二分げつ及び草丈の長さを測定した。

図2にその結果を示す。縦軸は、それぞれ草丈あるいは分げつの長さを示し、横軸は投与した化合物の種類を示す。なお、図2中、1002は化合物1、1004は化合物3、1007は化合物5、1042は化合物6、1053は化合物10、1055は化合物12、1057は化合物13、1074は化合物19にそれぞれ対応する。

GR24処理は1 μM、トリアゾールウレア化合物は5 μM処理した。化合物5以外は分げつの伸長の回復が見られた。

[0116] (6) イネ d 1 7 変異株を用いた S L 受容体阻害剤の評価試験 (2)

図2と同様の試験を他の化合物に関しても行った。結果を図3に示す。図2と同様に縦軸は、それぞれ草丈あるいは分げつの長さを示し、横軸は投与した化合物の種類を示す。図3中、1042は化合物6、1075は化合物20、1093は化合物24、1094は化合物25にそれぞれ対応する。GR24処理は0.1 μ M、トリアゾールウレア化合物は0.5 μ M処理した。図2の試験で分げつ伸長の回復が見られなかった化合物5を改変して設計した化合物25は用いた化合物の中で最もよく分げつ伸長を回復していた。

[0117] (7) 化合物25処理による野生型イネ日本晴れの分げつの促進効果確認試験

野生型イネ（品種：日本晴）を図2、図3の試験と同様に水耕液で生育させ、発芽から7日目に10 μ Mの化合物25を添加しさらに7日間生育させた。化合物25処理による分げつの促進が観察された。結果を図4に示す。縦軸は分げつの長さ、横軸は投与したKOK1094の処理濃度を示す。また、通常の水耕栽培による発芽から二週間の野生型イネの生育状態を図5（左側）に、10 μ Mの化合物25を添加した水耕液で生育させた野生型イネの生育状態を図5（右側）にそれぞれ示す。

[0118] (9) ストライガ種子の発芽抑制試験

30℃で一週間前処理したストライガ（*Striga hermonthica*）の種子に、GR24またはGR24と化合物25の共投与を行った。GR24処理は0.1 μ M、化合物25処理は50 μ Mあるいは100 μ Mで行った。第2表にその結果を示す。

[0119] [表9]

第2表

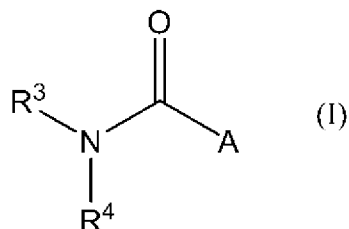
No.	化合物25の濃度 (μ M)	GR24の濃度 (μ M)	ストライガ種子の発芽率 (%)
1	0	0	3.17
3	0	0.1	30.92
4	50	0.1	2.03
5	100	0.1	3.13

[0120] 第2表より、化合物25は、優れたストライガ種子の発芽抑制作用を示すことがわかる。ストリゴラクトンのアゴニストであるGR24を0.1 μ M投与した場合には、ストライガ種子の発芽が促進されるが（No. 2）、化合物25を共投与することで、ストライガ種子の発芽抑制効果が得られる（No. 3、4）。

請求の範囲

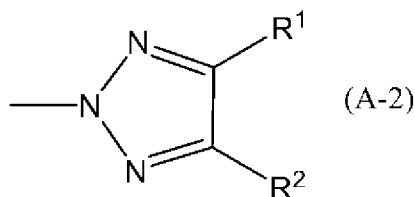
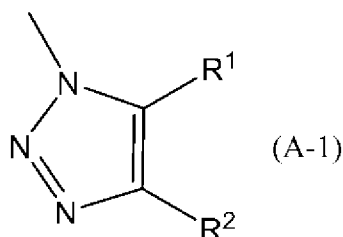
〔請求項1〕 下記式（I）で示されるトリアゾールウレア化合物の少なくとも一種を有効成分として含有することを特徴とする、植物のストリゴラクトン受容体阻害剤。

〔化1〕



〔式中、Aは、下記（A-1）又は（A-2）で示される基を表す。〕

〔化2〕

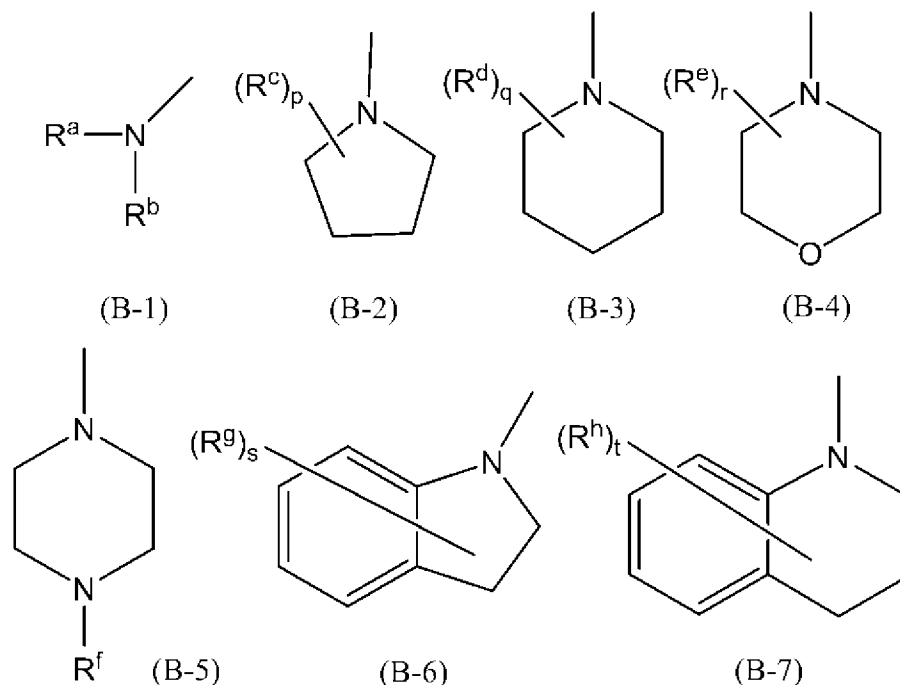


（式中、R¹、R²は、それぞれ独立して、水素原子、置換基を有していてもよい炭素数1～20のアルキル基、又は置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基を表す。）

R³、R⁴は、それぞれ独立して、水素原子、置換基を有していてもよい炭素数1～20のアルキル基、置換基を有していてもよい炭素数3～20のシクロアルキル基、又は置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基を表す（但し、R³、R⁴がともに水素原子である場合を除く。）。また、R³、R⁴は一緒になって環を形成していてもよく、該環は任意の位置に置換基を有していてもよい。〕

[請求項2] 前記式 (1) 中、 $-N(R^3)(R^4)$ で示される基が、下記 (B-1) ~ (B-7) で示されるいずれかの基である、請求項 1 に記載の植物のストリゴラクトン受容体阻害剤。

[化3]



(式中、 R^a 、 R^b はそれぞれ独立して、置換基を有していてもよい炭素数 1 ~ 20 のアルキル基、又は置換基を有していてもよい炭素数 6 ~ 20 のアリール基を表す。

R^c 、 R^d 、 R^e 、 R^g 、 R^h はそれぞれ独立して、ニトロ基、シアノ基、ハロゲン原子、炭素数 1 ~ 6 のアルキル基、炭素数 1 ~ 6 のハロアルキル基、炭素数 3 ~ 20 のシクロアルキル基、炭素数 1 ~ 6 のアルコキシ基、アミノ基、モノ置換アミノ基、ジ置換アミノ基、炭素数 1 ~ 6 のアルキルチオ基、炭素数 1 ~ 6 のアルキルスルフェニル基、炭素数 1 ~ 6 のアルキルスルホニル基、炭素数 2 ~ 10 のアルコキシカルボニル基、炭素数 2 ~ 10 のアルキルカルボニル基又は置換基を有していてもよいアリール基を表す。

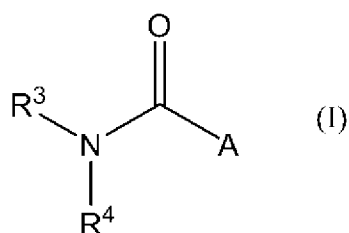
R^f は、水素原子、置換基を有していてもよい炭素数 1 ~ 20 のアルキル基、置換基を有していてもよい炭素数 3 ~ 20 のシクロアルキル

基、置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基、置換基を有していてもよい複素環基、又は炭素数2～20のアシル基を表す。

p、q、r、s、tはそれぞれ独立して、0～4の整数を表す。）

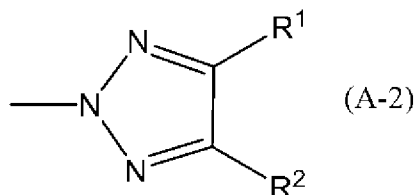
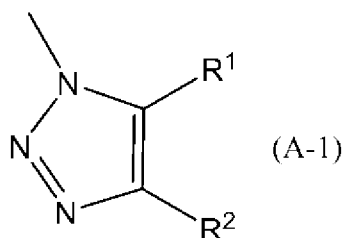
[請求項3] 下記式(1)で示されるトリアゾールウレア化合物の少なくとも一種、及び農学的に許容可能な配合補助剤を含む農業用組成物。

[化4]



〔式中、Aは、下記(A-1)又は(A-2)で示される基を表す。〕

[化5]



(式中、R¹、R²は、それぞれ独立して、水素原子、置換基を有していてもよい炭素数1～20のアルキル基、又は置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基を表す。)

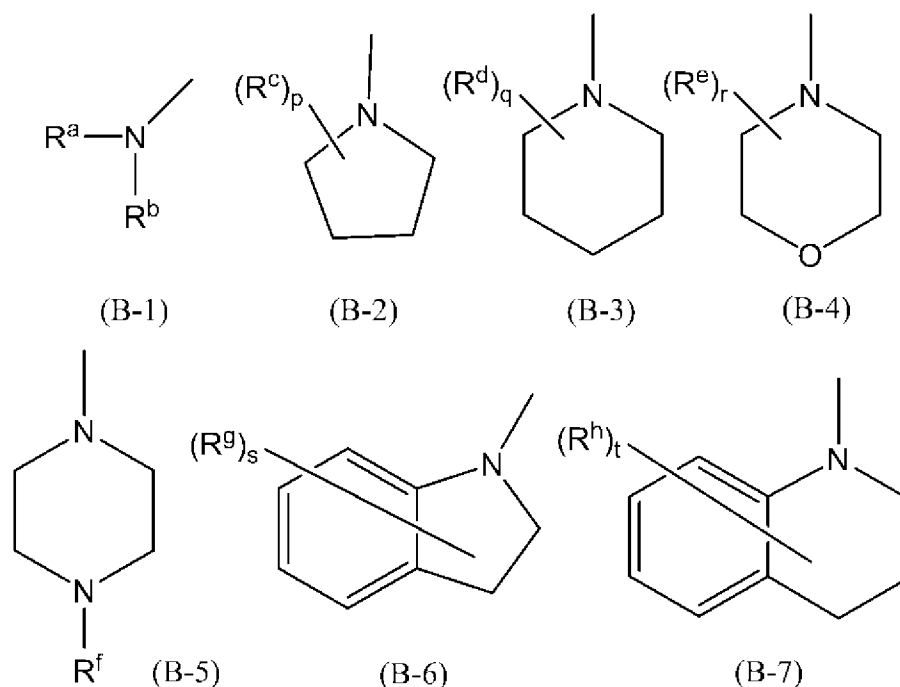
R³、R⁴は、それぞれ独立して、水素原子、置換基を有していてもよい炭素数1～20のアルキル基、置換基を有していてもよい炭素数3～20のシクロアルキル基、又は置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基を表す(但し、R³、R⁴がともに水素原子で

ある場合を除く。)。また、 R^3 、 R^4 は一緒になって環を形成していてもよく、該環は任意の位置に置換基を有していてもよい。]

[請求項4]

前記式(1)中、 $-N(R^3)(R^4)$ で示される基が、下記(B-1)～(B-7)で示されるいずれかの基である、請求項3に記載の農業用組成物。

[化6]



(式中、 R^a 、 R^b はそれぞれ独立して、置換基を有していてもよい炭素数1～20のアルキル基、又は置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基を表す。

R^c 、 R^d 、 R^e 、 R^g 、 R^h はそれぞれ独立して、ニトロ基、シアノ基、ハロゲン原子、炭素数1～6のアルキル基、炭素数1～6のハロアルキル基、炭素数3～20のシクロアルキル基、炭素数1～6のアルコキシ基、アミノ基、モノ置換アミノ基、ジ置換アミノ基、炭素数1～6のアルキルチオ基、炭素数1～6のアルキルスルフェニル基、炭素数1～6のアルキルスルホニル基、炭素数2～10のアルコシカルボニル基、炭素数2～10のアルキルカルボニル基、又は置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基を表す。

R^fは、水素原子、置換基を有していてもよい炭素数1～20のアルキル基、置換基を有していてもよい炭素数3～20のシクロアルキル基、置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基、置換基を有していてもよい複素環基、又は炭素数2～20のアシル基を表す。

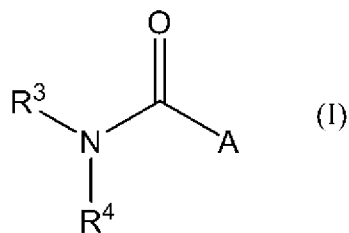
p、q、r、s、tはそれぞれ独立して、0～4の整数を表す。）

[請求項5] 請求項1若しくは2に記載のストリゴラクトン受容体阻害剤、又は、請求項3若しくは4に記載の農業用組成物を、植物の枝分かれ増加剤として使用する方法。

[請求項6] 請求項1若しくは2に記載のストリゴラクトン受容体阻害剤、又は、請求項3若しくは4に記載の農業用組成物を、イネ科植物の分げつ促進剤として使用する方法。

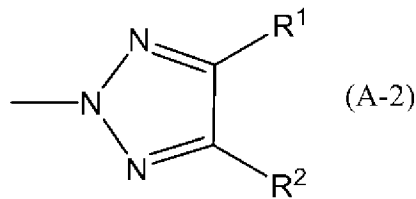
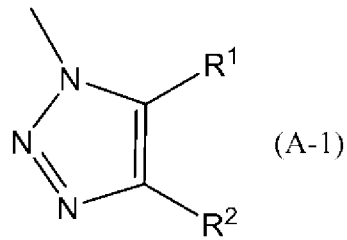
[請求項7] 下記式（I）で示されるトリアゾールウレア化合物の少なくとも一種を有効成分として含有することを特徴とする、ストライガ種子の発芽抑制剤。

[化7]



〔式中、Aは、下記（A-1）又は（A-2）で示される基を表す。〕

[化8]



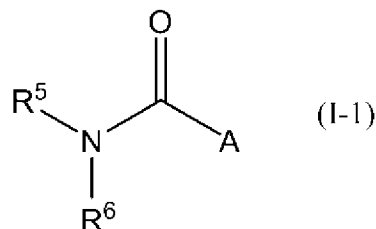
(式中、 R^1 、 R^2 は、それぞれ独立して、水素原子、置換基を有していてもよい炭素数1～20のアルキル基、又は置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基を表す。)

R^3 、 R^4 は、それぞれ独立して、水素原子、置換基を有していてもよい炭素数1～20のアルキル基、置換基を有していてもよい炭素数3～20のシクロアルキル基、又は置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基を表す(但し、 R^3 、 R^4 がともに水素原子である場合を除く。)。また、 R^3 、 R^4 は一緒になって環を形成していてもよく、該環は任意の位置に置換基を有していてもよい。]

[請求項8]

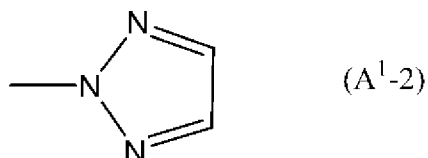
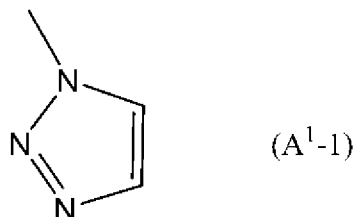
下記式(1-1)で示されるトリアゾールウレア化合物。

[化9]



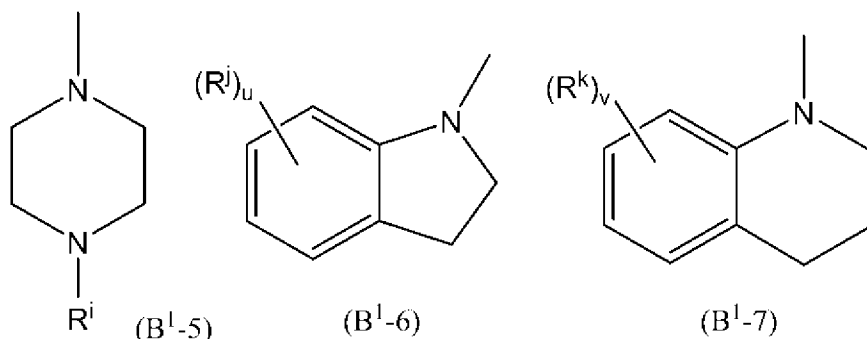
〔式中、Aは、下記(A¹-1)又は(A¹-2)で示される基を表す。〕

[化10]



—N(R⁵)(R⁶)で示される基は、下記(B¹-5)、(B¹-6)又は(B¹-7)で示される基を表す。

[化11]



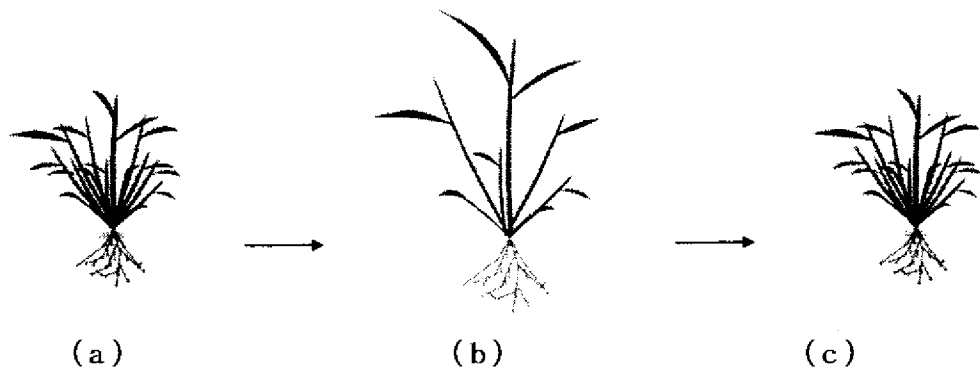
(式中、Rⁱは、水素原子、置換基を有していてもよい炭素数1～20のアルキル基、置換基を有していてもよい炭素数3～20のシクロアルキル基、置換基を有していてもよい炭素数6～20のアリール基、又は置換基を有していてもよい複素環基を表す。

R^j、R^kはそれぞれ独立して、ニトロ基、シアノ基、ハロゲン原子、炭素数1～6のアルキル基、炭素数1～6のハロアルキル基、炭素数3～20のシクロアルキル基、炭素数1～6のアルコキシ基、アミノ基、モノ置換アミノ基、ジ置換アミノ基、炭素数1～6のアルキルチオ基、炭素数1～6のアルキルスルフェニル基、炭素数1～6のアルキルスルホニル基、炭素数2～10のアルコキシカルボニル基、炭素数2～10のアルキルカルボニル基又は置換基を有していてもよい

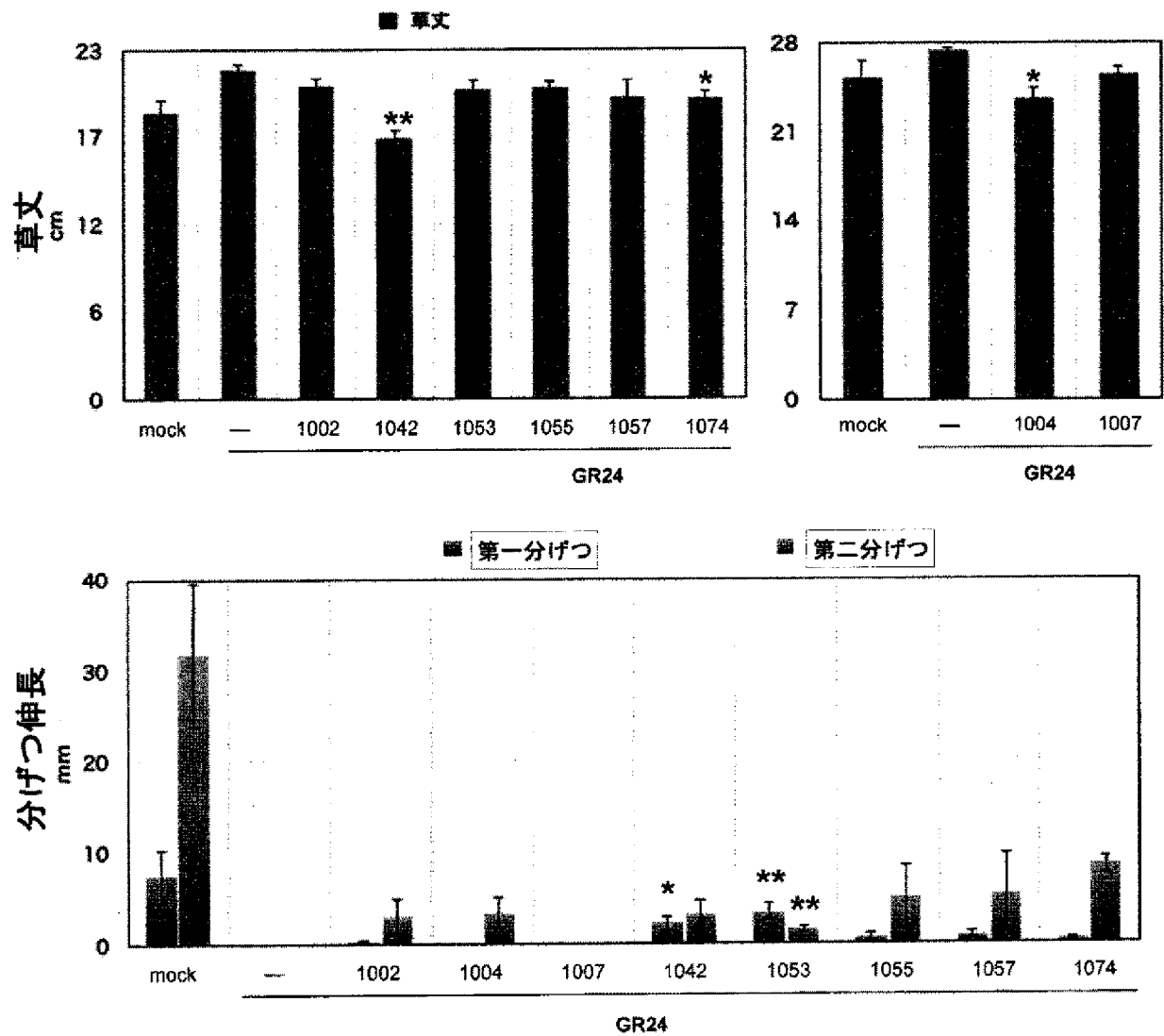
炭素数 6 ～ 20 のアリール基を表す。

u、v はそれぞれ独立して、0 ～ 4 の整数を表す。)

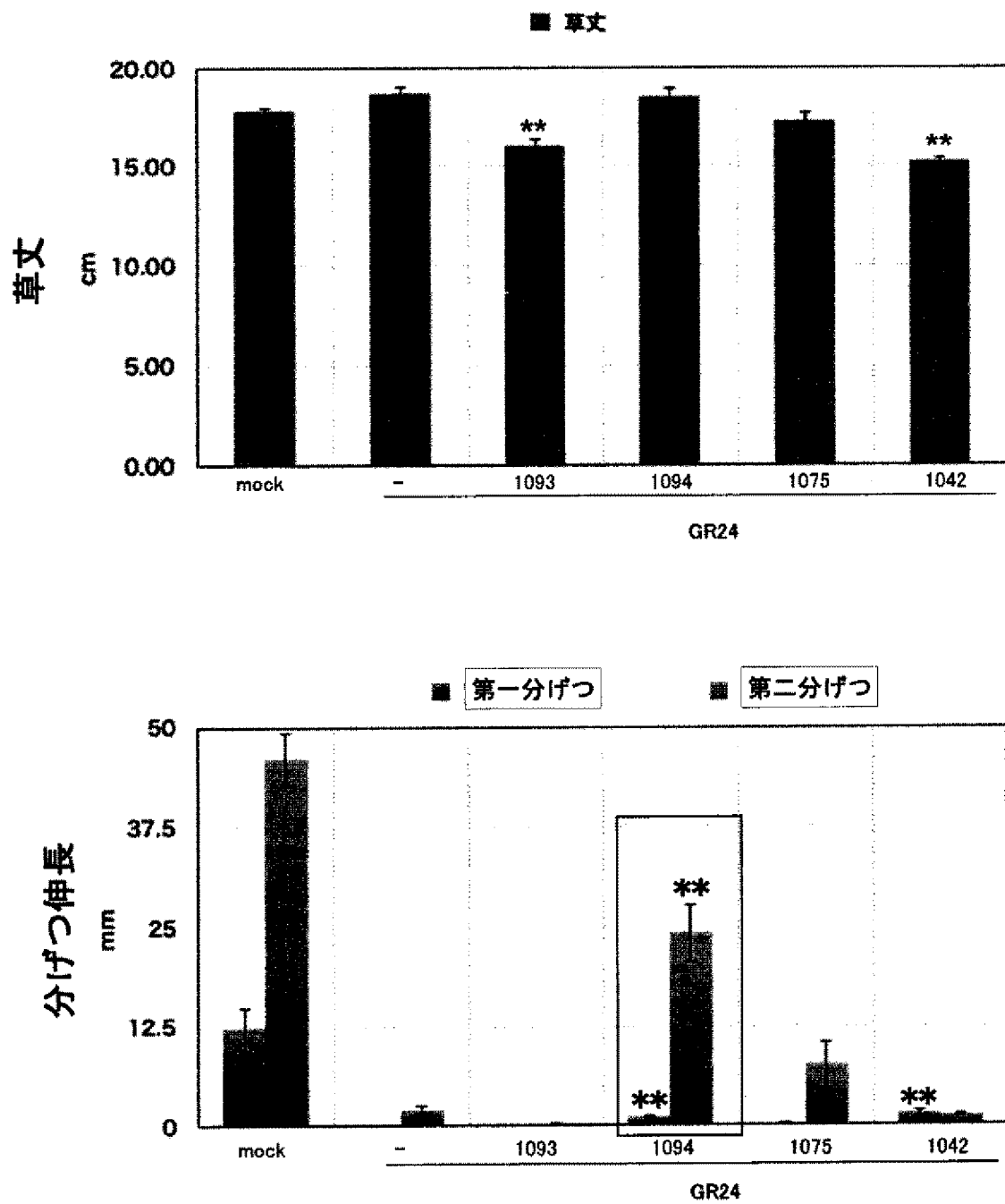
[図1]



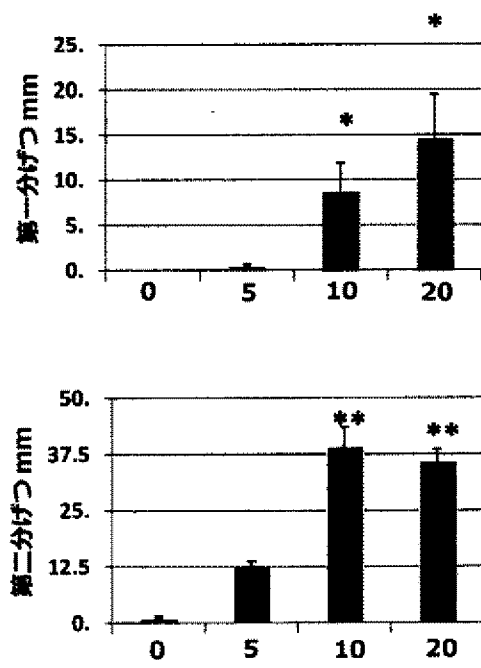
[図2]



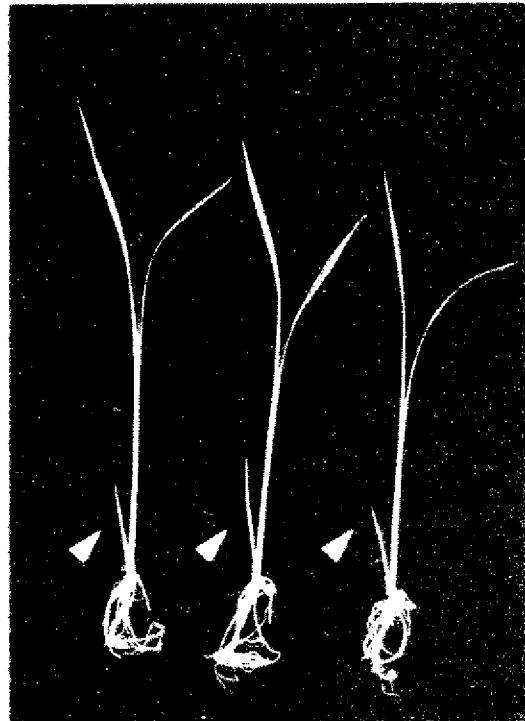
[図3]



[図4]



[図5]



INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2018/008121

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl. A01N47/38 (2006.01) i, A01P21/00 (2006.01) i, C07D249/04 (2006.01) i,
C07D401/06 (2006.01) i, C07D401/12 (2006.01) i, C07D403/06 (2006.01) i,
C07D413/12 (2006.01) i, C07D417/12 (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)

Int.Cl. A01N47/38, A01P21/00, C07D249/04, C07D401/06, C07D401/12,
C07D403/06, C07D413/12, C07D417/12

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

Published examined utility model applications of Japan	1922-1996
Published unexamined utility model applications of Japan	1971-2018
Registered utility model specifications of Japan	1996-2018
Published registered utility model applications of Japan	1994-2018

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

JSTPlus/JMEDPlus/JST7580 (JDreamIII), CAPLUS/REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X A	JP 6-49041 A (MITSUBISHI YUKA KABUSHIKI KAISHA) 22 February 1994, claims, compound no. 1-86 in paragraph [0015] (Family: none)	3-4 1-2, 5-8
X A	JP 2-85282 A (UBE INDUSTRIES, LTD.) 26 March 1990, claims, page 3, compound 10 in table 1 (Family: none)	3-4 1-2, 5-8
X A	US 2014/0018318 A1 (THE SCIPPS RESEARCH INSTITUTE) 16 January 2014, compound AA 26-4(11) in fig. 3 & WO 2012/138877 A1 & EP 2712291 A1	8 1-7
X A	WO 2006/124874 A2 (KALYPSYS, INC.) 23 November 2006, page 59, compounds in line 17 (Family: none)	8 1-7

☐ 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

"I" 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
26 April 2018 (26.04.2018)

Date of mailing of the international search report
15 May 2018 (15.05.2018)

Name and mailing address of the ISA/
Japan Patent Office
3-4-3, Kasumigaseki, Chiyoda-ku,
Tokyo 100-8915, Japan

Authorized officer

Telephone No.

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int.Cl. A01N47/38(2006.01)i, A01P21/00(2006.01)i, C07D249/04(2006.01)i, C07D401/06(2006.01)i,
C07D401/12(2006.01)i, C07D403/06(2006.01)i, C07D413/12(2006.01)i, C07D417/12(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. A01N47/38, A01P21/00, C07D249/04, C07D401/06, C07D401/12, C07D403/06, C07D413/12, C07D417/12

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	1971-2018年
日本国実用新案登録公報	1996-2018年
日本国登録実用新案公報	1994-2018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)

JSTPlus/JMEDPlus/JST7580 (JDreamIII), Cplus/REGISTRY (STN)

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 A	JP 6-49041 A (三菱油化株式会社) 1994. 02. 22, 特許請求の範囲、段落【0015】の化合物No. 1~86 (ファミリーなし)	3-4 1-2, 5-8
X A	JP 2-85282 A (宇部興産株式会社) 1990. 03. 26, 特許請求の範囲、第3頁の第1表の化合物10 (ファミリーなし)	3-4 1-2, 5-8

☑ 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

26. 04. 2018

国際調査報告の発送日

15. 05. 2018

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)

齋藤 光介

電話番号 03-3581-1101 内線 3492

4 P

5577

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 A	US 2014/0018318 A1 (THE SCIPPS RESEARCH I NSTITUTE) 2014.01.16, FIG. 3の化合物AA26-4 (11) & WO 2012/138877 A1 & EP 2712291 A1	8 1-7
X A	WO 2006/124874 A2 (KALYPSYS, INC.) 2006.11.23, 第59頁第17行の化合物 (ファミリーなし)	8 1-7