

(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
2023年10月12日(12.10.2023)



(10) 国際公開番号

WO 2023/195475 A1

(51) 国際特許分類:

A01N 43/08 (2006.01) *A01N 47/12* (2006.01)
A01N 43/36 (2006.01) *A01N 47/18* (2006.01)
A01N 43/38 (2006.01) *A01P 13/00* (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2023/013999

(22) 国際出願日: 2023年4月4日(04.04.2023)

(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 2022-062197 2022年4月4日(04.04.2022) JP

(71) 出願人: 味の素株式会社 (**AJINOMOTO CO., INC.**) [JP/JP]; 〒1048315 東京都中央区京橋一丁目15番1号 Tokyo (JP). カゴメ株式会社 (**KAGOME CO., LTD.**) [JP/JP]; 〒4600003 愛知県名古屋市中区錦3丁目14番15号 Aichi (JP).

(72) 発明者: 佐藤 誠一 (**SATO, Seiichi**); 〒2108681 神奈川県川崎市川崎区鈴木町1-1 味の素株式会社内 Kanagawa (JP). 武田 泰斗 (**TAKEDA, Taito**); 〒2108681 神奈川県川崎市川崎区鈴木町1-1 味の素株式会社内 Kanagawa (JP). 田原 優樹 (**TAHARA, Yuki**); 〒2108681 神奈川県川崎市川崎区鈴木町1-1 味の素株式会社内 Kanagawa (JP). 中田 健吾 (**NAKATA, Kengo**); 〒1038461 東京都中央区日本橋浜町3丁目21番1号 日本橋浜町Fタワー カゴメ株式会社内 Tokyo (JP). 伊藤 博孝 (**ITO, Hirotaka**); 〒1038461 東京都中央区日本橋浜町3丁目21番1号 日本橋浜町Fタワー カゴメ株式会社内 Tokyo (JP). 小野里 歩 (**ONOZATO, Ayumu**); 〒1038461 東京都中央区日本橋浜町3丁目21番1号 日本橋浜町Fタワー カゴメ株式会社内 Tokyo (JP). マデイラ ジョアン (**MADEIRA, Joao**); 〒1038461 東京都中央区日本橋浜町3丁目21番1号 日本橋浜町Fタワー カゴメ株式会社内 Tokyo (JP).

(74) 代理人: 弁理士法人秀和特許事務所 (**IP FIRM SHUWA**); 〒1030004 東京都中央区東日本橋三丁目4番10号 アクロポリス21ビル8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, CV, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IQ, IR, IS, IT, JM, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MU, 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, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, WS, 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, CV, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SC, 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, ME, 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))

(54) Title: METHOD FOR CONTROLLING PARASITIC PLANTS

(54) 発明の名称: 寄生植物を防除する方法

(57) Abstract: Provided is a technique, such as a technique for controlling parasitic plants, that is useful in the fields of agricultural and horticultural. Parasitic plants are controlled by using a compound capable of having the same or the opposite function as strigolactone, such as an amino acid derivative having a D ring.

(57) 要約: 寄生植物を防除する技術等の農園芸分野における有用な技術を提供する。D環を有するアミノ酸誘導体等のストリゴラクトンと同様または逆の機能を有し得る化合物を利用することにより寄生植物を防除する。



WO 2023/195475 A1

明 細 書

発明の名称：寄生植物を防除する方法

技術分野

[0001] 本発明は、寄生植物を防除する技術等の農園芸分野における有用な技術に関する。

背景技術

[0002] ストライガ (*Striga*) 属植物やハマウツボ (*Orobanche*) 属植物等のハマウツボ科 (*Orobanchaceae*) 植物、*Alectra*属植物等のゴマノハグサ科 (*Scrophulariaceae*) 植物、*Cuscuta*属植物等のヒルガオ科 (*Convolvulaceae*) 植物は、食糧生産に悪影響を与える寄生植物として世界中で問題になっている。例えば、ストライガ属植物はモロコシ、トウモロコシ、イネ等の主要な穀物に、ハマウツボ属植物はトマト、ジャガイモ、タバコ、ナス、ソラマメ等の主要な野菜に寄生し、大きな被害をもたらしている。アフリカにおけるこれら寄生植物による被害総額はおよそ 1 兆円と言われている。ストライガやハマウツボ等の種は非常に小さく、またストライガなどは一度に 10 万個程度の種子をつくるため、一度土壌が汚染されると防除は非常に困難になる。そのため、ハマウツボ科植物を防除する技術の開発が求められている。

[0003] 例えば、ストリゴラクトンまたはそれと同様の機能を有し得る化合物によりハマウツボ科植物の自殺発芽を誘導し、ハマウツボ科植物を防除する技術が知られている（特許文献 1 および非特許文献 1）。

先行技術文献

特許文献

[0004] 特許文献 1：W02012/043813

非特許文献

[0005] 非特許文献 1：Uraguchi et al., (2018) *Science*, 362, 1301–1305. A femtomolar-range suicide germination stimulant for the parasitic plant *Striga hermonthica*.

発明の概要

発明が解決しようとする課題

[0006] 本発明は、寄生植物を防除する技術等の農園芸分野における有用な技術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

[0007] 本発明者らは、上記課題を解決するために鋭意検討した結果、ストリゴラクトンと同様または逆の機能を有し得る化合物群を見出し、本発明を完成させた。

[0008] すなわち、本発明は以下の通り例示できる。

[1]

寄生植物の防除用の組成物であって、

下記成分（A）、（B）、または（C）を含有する、組成物：

（A）後述する一般式（I）で表される化合物；

（B）後述する一般式（I I）で表される化合物；

（C）アミノ酸発酵副生物。

式（I）中、

Xは、原子間結合またはオキシカルボニル基（O C（=O））を表し、

Yは、酸素原子（O）、水素原子が結合した窒素原子（NH）、またはメチル基が結合した窒素原子（NMe）を表し、

R 1は、水素原子（H）またはメチル基を表し、

R 2は、アミノ酸、アグマチン、グアニジン、後述する一般式（R 2 - 1）で表される構造、または後述する一般式（R 2 - 2）で表される構造を表す。

式（R 2 - 1）中、

nは、2～5の整数（すなわち2、3、4、または5）を表し、

式（R 2 - 1）中、R 3およびR 4は、それぞれ独立に、水素原子、またはアシル基を表す。

式（R 2 - 2）中、

a は、置換されていてもよい炭素数 1 ～ 4 のアルキレン基または置換されていてもよい炭素数 2 ～ 4 のアルケニレン基を表し、

R 5 は、水素原子 (H) または置換されていてもよい炭素数 1 ～ 4 のアルキル基を表す。

式 (11) 中、

X 1 は、原子間結合またはメチレンオキシ基 (CH_2O) を表し、

X 2 は、原子間結合またはカルボニル基 ($\text{C}(=\text{O})$) を表し、

Y は、酸素原子 (O) または水素原子が結合した窒素原子 (NH) を表し、

R 1 は、水素原子 (H) またはメチル基を表し、

R 2 は、アミノ酸、アグマチン、グアニジン、脂肪族アルコール、脂肪酸、前記一般式 (R 2 - 1) で表される構造、または前記一般式 (R 2 - 2) で表される構造を表し、

b - c は、 $\text{CH}-\text{CH}_2$ または $\text{C}=\text{CH}$ を表す。

[2]

前記寄生植物の自殺発芽の誘導または前記寄生植物の発芽の抑制により該寄生植物が防除される、前記組成物。

[3]

前記寄生植物が、ハマウツボ科 (Orobanchaceae) 植物、ゴマノハグサ科 (Scrophulariaceae) 植物、またはヒルガオ科 (Convolvulaceae) 植物である、前記組成物。

[4]

前記寄生植物が、ストライガ (Striga) 属植物、ハマウツボ (Orobanche) 属植物、フェリパンキ (Phelipanche) 属植物、アレクトラ (Alectra) 属植物、またはネナシカズラ (Cuscuta) 属植物である、前記組成物。

[5]

前記寄生植物が、Striga asiatica、Striga gesnerioides、Striga hermonthica、Striga aspera、Striga asiatica、Striga curviflora、Striga parv

iflora、*Striga angustifolia*、*Striga latericea*、*Striga aequinoctialis*、*Striga angolensis*、*Striga bilabiate*、*Striga brachycalyx*、*Striga chrsantha*、*Striga dalzielii*、*Striga elegans*、*Striga forbesii*、*Striga gastonii*、*Striga gracillima*、*Striga hallaei*、*Striga hirsuta*、*Striga jundii*、*Striga klingii*、*Striga lepidagathidis*、*Striga lutea*、*Striga macrantha*、*Striga passargei*、*Striga pinnatifida*、*Striga primuloides*、*Striga yemenica*、*Striga pubiflora*、*Orobanche ramosa*、*Orobanche minor*、*Orobanche crenata*、*Orobanche cumana*、*Orobanche foetida*、*Orobanche aegyptiaca*、*Orobanche cernua*、*Phelipanche ramosa*、*Phelipanche aegyptiaca*、*Alectra vogelii*、*Alectra picta*、*Alectra sessiliflora*、*Alectra orobanchoides*、*Alectra fluminensis*、*Cuscuta australis*、*Cuscuta campestris*、*Cuscuta chinensis*、*Cuscuta indecora*、*Cuscuta epithymum*、*Cuscuta epilinum*、*Cuscuta gronovii*、*Cuscuta planiflora*、*Cuscuta monogyna*、*Cuscuta pedicellata*、*Cuscuta palaestina*、または*Cuscuta rejlexa*である、前記組成物。

[6]

前記成分 (A) について、YはNH、R 1はメチル基である、前記組成物。

[7]

前記成分 (A) について、以下のいずれかの条件を満たす、前記組成物：

- (1) Xは原子間結合またはオキシカルボニル基、R 2はアミノ基で結合したアミノ酸、アミノ基で結合したアグマチン、またはアミノ基で結合したグアニジンである；
- (2) Xは原子間結合、R 2はカルボキシル基で結合したアミノ酸である；
- (3) Xは原子間結合、R 2は水酸基で結合したアミノ酸である；
- (4) Xは原子間結合、R 2はチオール基で結合したアミノ酸である；
- (5) Xは原子間結合、R 2はアミド基で結合したアミノ酸である；
- (6) Xは原子間結合またはオキシカルボニル基、R 2は式 (R 2 - 1) で

表される構造である；

(7) Xは原子間結合、R₂は式(R₂-2)で表される構造である。

[8]

前記成分(A)について、以下のいずれかの条件を満たす、前記組成物：

(1) Xは原子間結合、YはNH、R₁はメチル基、R₂はアミノ基で結合したアミノ酸、アミノ基で結合したアグマチン、アミノ基で結合したグアニジン、または式(R₂-1)で表される構造である；

(2) Xはオキシカルボニル基、YはNH、R₁はメチル基、R₂はカルボキシル基で結合したアミノ酸または式(R₂-2)で表される構造である。

[9]

前記成分(B)について、YはNH、b-cはCH-CH₂、R₁はHである、前記組成物。

[10]

前記成分(B)について、以下のいずれかの条件を満たす、前記組成物：

(1) X₁は原子間結合、X₂はカルボニル基、R₂はアミノ基で結合したアミノ酸、アミノ基で結合したアグマチン、またはアミノ基で結合したグアニジンである；

(2) X₁はメチレンオキシ基、X₂は原子間結合、R₂はカルボキシル基で結合したアミノ酸である；

(3) X₁は原子間結合、X₂はカルボニル基、R₂は脂肪族アルコールである；

(4) X₁はメチレンオキシ基、X₂は原子間結合、R₂は脂肪酸である；

(5) X₁は原子間結合、X₂はカルボニル基、R₂は式(R₂-1)で表される構造である；

(6) X₁はメチレンオキシ基、X₂は原子間結合、R₂は式(R₂-2)で表される構造である；

(7) X₁は原子間結合、X₂は原子間結合、R₂はアミノ基で結合したグアニジンである。

[1 1]

前記成分 (B) について、以下のいずれかの条件を満たす、前記組成物：

(1) X 1 は原子間結合、X 2 はカルボニル基、Y は NH、b - c は CH - CH₂、R 1 は H、R 2 はアミノ基で結合したアミノ酸、アミノ基で結合したアグマチン、アミノ基で結合したグアニジン、または式 (R 2 - 1) で表される構造である；

(2) X 1 はメチレンオキシ基、X 2 は原子間結合、Y は NH、b - c は CH - CH₂、R 1 は H、R 2 はカルボキシル基で結合したアミノ酸、炭素数 2 ~ 18 の脂肪酸、または式 (R 2 - 2) で表される構造である；

(3) X 1 は原子間結合、X 2 は原子間結合、Y は酸素原子 (O)、b - c は C = CH、R 1 はメチル基、R 2 はアミノ基で結合したグアニジンである。

[1 2]

前記成分 (B) が、後述する式 (化合物 4 1)、(化合物 5 0)、(化合物 5 2)、(化合物 5 4)、(化合物 5 5)、および (化合物 7 7) で表される化合物である場合は除く、前記組成物。

[1 3]

前記成分 (A) または (B) が、後述する式 (化合物 1) ~ (化合物 2 0)、(化合物 2 3)、(化合物 2 6) ~ (化合物 4 0)、(化合物 4 2) ~ (化合物 4 9)、(化合物 5 1)、(化合物 5 3)、(化合物 5 6) ~ (化合物 7 6)、(化合物 7 8) ~ (化合物 8 0)、および (化合物 8 2) ~ (化合物 9 0) で表される化合物から選択される、前記組成物。

[1 4]

前記成分 (C) が、リジン、トリプトファン、スレオニン、バリン、ロイシン、またはイソロイシンの発酵副生物である、前記組成物。

[1 5]

前記成分 (A)、(B)、または (C) を 1 0 nM ~ 1 0 mM の濃度で含有する液体の形態で使用される、前記組成物。

[1 6]

寄生植物を防除する方法であって、

下記成分 (A)、(B)、または (C) を寄生植物の種子に施用することを含む、方法：

(A) 後述する一般式 (I) で表される化合物；

(B) 後述する一般式 (I I) で表される化合物；

(C) アミノ酸発酵副生物。

式 (I) 中、

X は、原子間結合またはオキシカルボニル基 ($\text{O} \text{C} (= \text{O})$) を表し、

Y は、酸素原子 (O)、水素原子が結合した窒素原子 (NH)、またはメチル基が結合した窒素原子 (NMe) を表し、

R 1 は、水素原子 (H) またはメチル基を表し、

R 2 は、アミノ酸、アグマチン、グアニジン、後述する一般式 (R 2 - 1) で表される構造、または後述する一般式 (R 2 - 2) で表される構造を表す。

式 (R 2 - 1) 中、

n は、2 ~ 5 の整数 (すなわち 2、3、4、または 5) を表し、

式 (R 2 - 1) 中、R 3 および R 4 は、それぞれ独立に、水素原子、またはアシル基を表す。

式 (R 2 - 2) 中、

a は、置換されていてもよい炭素数 1 ~ 4 のアルキレン基または置換されていてもよい炭素数 2 ~ 4 のアルケニレン基を表し、

R 5 は、水素原子 (H) または置換されていてもよい炭素数 1 ~ 4 のアルキル基を表す。

式 (I I) 中、

X 1 は、原子間結合またはメチレンオキシ基 ($\text{C} \text{H}_2 \text{O}$) を表し、

X 2 は、原子間結合またはカルボニル基 ($\text{C} (= \text{O})$) を表し、

Y は、酸素原子 (O) または水素原子が結合した窒素原子 (NH) を表し

、

R 1 は、水素原子 (H) またはメチル基を表し、

R 2 は、アミノ酸、アグマチン、グアニジン、脂肪族アルコール、脂肪酸、前記一般式 (R 2 - 1) で表される構造、または前記一般式 (R 2 - 2) で表される構造を表し、

b - c は、 $\text{CH}-\text{CH}_2$ または $\text{C}=\text{CH}$ を表す。

[1 7]

植物体を製造する方法であって、

下記成分 (A)、(B)、または (C) を寄生植物の種子に施用することにより、前記寄生植物の自殺発芽を誘導すること；

前記施用後に前記寄生植物の寄生対象となる植物を栽培すること；および前記寄生植物の寄生対象となる植物の植物体を収穫することを含む、方法

:

(A) 後述する一般式 (I) で表される化合物；

(B) 後述する一般式 (II) で表される化合物；

(C) アミノ酸発酵副生物。

式 (I) 中、

X は、原子間結合またはオキシカルボニル基 ($\text{OC}(=\text{O})$) を表し、

Y は、酸素原子 (O)、水素原子が結合した窒素原子 (NH)、またはメチル基が結合した窒素原子 (NMe) を表し、

R 1 は、水素原子 (H) またはメチル基を表し、

R 2 は、アミノ酸、アグマチン、グアニジン、後述する一般式 (R 2 - 1) で表される構造、または後述する一般式 (R 2 - 2) で表される構造を表す。

式 (R 2 - 1) 中、

n は、2 ~ 5 の整数 (すなわち 2、3、4、または 5) を表し、

式 (R 2 - 1) 中、R 3 および R 4 は、それぞれ独立に、水素原子、またはアシル基を表す。

式 (R 2 - 2) 中、

a は、置換されていてもよい炭素数 1 ~ 4 のアルキレン基または置換されていてもよい炭素数 2 ~ 4 のアルケニレン基を表し、

R 5 は、水素原子 (H) または置換されていてもよい炭素数 1 ~ 4 のアルキル基を表す。

式 (I I) 中、

X 1 は、原子間結合またはメチレンオキシ基 (C H₂ O) を表し、

X 2 は、原子間結合またはカルボニル基 (C (=O)) を表し、

Y は、酸素原子 (O) または水素原子が結合した窒素原子 (NH) を表し、

R 1 は、水素原子 (H) またはメチル基を表し、

R 2 は、アミノ酸、アグマチン、グアニジン、脂肪族アルコール、脂肪酸、前記一般式 (R 2 - 1) で表される構造、または前記一般式 (R 2 - 2) で表される構造を表し、

b - c は、C H - C H₂ または C = C H を表す。

[1 8]

植物体を製造する方法であって、

寄生植物の寄生対象となる植物を栽培すること；

前記栽培の後期に下記成分 (A)、(B)、または (C) を寄生植物の種子に施用することにより、前記寄生植物の発芽を誘導すること；および

前記寄生植物の寄生対象となる植物の植物体を収穫することを含む、方法：

(A) 後述する一般式 (I) で表される化合物；

(B) 後述する一般式 (I I) で表される化合物；

(C) アミノ酸発酵副生物。

式 (I) 中、

X は、原子間結合またはオキシカルボニル基 (O C (=O)) を表し、

Y は、酸素原子 (O)、水素原子が結合した窒素原子 (NH)、またはメ

チル基が結合した窒素原子 (NMe) を表し、

R 1 は、水素原子 (H) またはメチル基を表し、

R 2 は、アミノ酸、アグマチン、グアニジン、後述する一般式 (R 2 - 1) で表される構造、または後述する一般式 (R 2 - 2) で表される構造を表す。

式 (R 2 - 1) 中、

n は、2 ~ 5 の整数 (すなわち 2、3、4、または 5) を表し、

式 (R 2 - 1) 中、R 3 および R 4 は、それぞれ独立に、水素原子、またはアシル基を表す。

式 (R 2 - 2) 中、

a は、置換されていてもよい炭素数 1 ~ 4 のアルキレン基または置換されていてもよい炭素数 2 ~ 4 のアルケニレン基を表し、

R 5 は、水素原子 (H) または置換されていてもよい炭素数 1 ~ 4 のアルキル基を表す。

式 (I I) 中、

X 1 は、原子間結合またはメチレンオキシ基 (CH₂O) を表し、

X 2 は、原子間結合またはカルボニル基 (C (=O)) を表し、

Y は、酸素原子 (O) または水素原子が結合した窒素原子 (NH) を表し、

R 1 は、水素原子 (H) またはメチル基を表し、

R 2 は、アミノ酸、アグマチン、グアニジン、脂肪族アルコール、脂肪酸、前記一般式 (R 2 - 1) で表される構造、または前記一般式 (R 2 - 2) で表される構造を表し、

b - c は、CH - CH₂ または C = CH を表す。

[1 9]

植物体を製造する方法であって、

寄生植物の寄生対象となる植物を栽培すること；

前記栽培中に下記成分 (A)、(B)、または (C) を寄生植物の種子に

施用することにより、寄生植物の発芽を抑制すること；および

前記寄生植物の寄生対象となる植物の植物体を収穫することを含む、方法：

- (A) 後述する一般式 (I) で表される化合物；
- (B) 後述する一般式 (I I) で表される化合物；
- (C) アミノ酸発酵副生物。

式 (I) 中、

X は、原子間結合またはオキシカルボニル基 ($\text{O} \text{C} (= \text{O})$) を表し、

Y は、酸素原子 (O)、水素原子が結合した窒素原子 (NH)、またはメチル基が結合した窒素原子 (NMe) を表し、

R 1 は、水素原子 (H) またはメチル基を表し、

R 2 は、アミノ酸、アグマチン、グアニジン、後述する一般式 (R 2 - 1) で表される構造、または後述する一般式 (R 2 - 2) で表される構造を表す。

式 (R 2 - 1) 中、

n は、2～5 の整数（すなわち 2、3、4、または 5）を表し、

式 (R 2 - 1) 中、R 3 および R 4 は、それぞれ独立に、水素原子、またはアシル基を表す。

式 (R 2 - 2) 中、

a は、置換されていてもよい炭素数 1～4 のアルキレン基または置換されていてもよい炭素数 2～4 のアルケニレン基を表し、

R 5 は、水素原子 (H) または置換されていてもよい炭素数 1～4 のアルキル基を表す。

式 (I I) 中、

X 1 は、原子間結合またはメチレンオキシ基 ($\text{C} \text{H}_2 \text{O}$) を表し、

X 2 は、原子間結合またはカルボニル基 ($\text{C} (= \text{O})$) を表し、

Y は、酸素原子 (O) または水素原子が結合した窒素原子 (NH) を表し、

、

R 1 は、水素原子 (H) またはメチル基を表し、

R 2 は、アミノ酸、アグマチン、グアニジン、脂肪族アルコール、脂肪酸、前記一般式 (R 2 - 1) で表される構造、または前記一般式 (R 2 - 2) で表される構造を表し、

b - c は、 $\text{CH}-\text{CH}_2$ または $\text{C}=\text{CH}$ を表す。

[2 0]

前記寄生植物の自殺発芽の誘導または前記寄生植物の発芽の抑制により該寄生植物が防除される、前記方法。

[2 1]

前記施用により前記寄生植物が防除される、前記方法。

[2 2]

前記寄生植物が、ハマウツボ科 (Orobanchaceae) 植物、ゴマノハグサ科 (Scrophulariaceae) 植物、またはヒルガオ科 (Convolvulaceae) 植物である、前記方法。

[2 3]

前記寄生植物が、ストライガ (Striga) 属植物、ハマウツボ (Orobanche) 属植物、フェリパンキ (Phelipanche) 属植物、アレクトラ (Alectra) 属植物、またはネナシカズラ (Cuscuta) 属植物である、前記方法。

[2 4]

前記寄生植物が、*Striga asiatica*、*Striga gesnerioides*、*Striga hermonthica*、*Striga aspera*、*Striga asiatica*、*Striga curviflora*、*Striga parviflora*、*Striga angustifolia*、*Striga latericea*、*Striga aequinoctialis*、*Striga angolensis*、*Striga bilabiate*、*Striga brachycalyx*、*Striga chrsantha*、*Striga dalzielii*、*Striga elegans*、*Striga forbesii*、*Striga gastonii*、*Striga gracillima*、*Striga hallaei*、*Striga hirsuta*、*Striga jundii*、*Striga klingii*、*Striga lepidagathidis*、*Striga lutea*、*Striga macrantha*、*Striga passargei*、*Striga pinnatifida*、*Striga primuloides*、*Striga yemenica*、*Striga pubiflora*、*Orobanche ramosa*、*Orobanche minor*、*Oro*

banche crenata, Orobanche cumana, Orobanche foetida, Orobanche aegyptiaca, Orobanche cernua, Phelipanche ramosa, Phelipanche aegyptiaca, Alectra vogelii, Alectra picta, Alectra sessiliflora, Alectra orobanchoides, Alectra fluminensis, Cuscuta australis, Cuscuta campestris, Cuscuta chinensis, Cuscuta indecora, Cuscuta epithymum, Cuscuta epilinum, Cuscuta gronovii, Cuscuta planiflora, Cuscuta monogyna, Cuscuta pedicellata, Cuscuta palaestina, またはCuscuta rejlaxaである、前記方法。

[2 5]

前記成分 (A) について、YはNH、R₁はメチル基である、前記方法。

[2 6]

前記成分 (A) について、以下のいずれかの条件を満たす、前記方法：

- (1) Xは原子間結合またはオキシカルボニル基、R₂はアミノ基で結合したアミノ酸、アミノ基で結合したアグマチン、またはアミノ基で結合したグアニジンである；
- (2) Xは原子間結合、R₂はカルボキシル基で結合したアミノ酸である；
- (3) Xは原子間結合、R₂は水酸基で結合したアミノ酸である；
- (4) Xは原子間結合、R₂はチオール基で結合したアミノ酸である；
- (5) Xは原子間結合、R₂はアミド基で結合したアミノ酸である；
- (6) Xは原子間結合またはオキシカルボニル基、R₂は式 (R₂ - 1) で表される構造である；
- (7) Xは原子間結合、R₂は式 (R₂ - 2) で表される構造である。

[2 7]

前記成分 (A) について、以下のいずれかの条件を満たす、前記方法：

- (1) Xは原子間結合、YはNH、R₁はメチル基、R₂はアミノ基で結合したアミノ酸、アミノ基で結合したアグマチン、アミノ基で結合したグアニジン、または式 (R₂ - 1) で表される構造である；
- (2) Xはオキシカルボニル基、YはNH、R₁はメチル基、R₂はカルボ

キシル基で結合したアミノ酸または式 (R 2 - 2) で表される構造である。

[2 8]

前記成分 (B) について、Y は NH、b - c は CH - CH₂、R 1 は H である、前記組成物。

[2 9]

前記成分 (B) について、以下のいずれかの条件を満たす、前記方法：

(1) X 1 は原子間結合、X 2 はカルボニル基、R 2 はアミノ基で結合したアミノ酸、アミノ基で結合したアグマチン、またはアミノ基で結合したグアニジンである；

(2) X 1 はメチレンオキシ基、X 2 は原子間結合、R 2 はカルボキシル基で結合したアミノ酸である；

(3) X 1 は原子間結合、X 2 はカルボニル基、R 2 は脂肪族アルコールである；

(4) X 1 はメチレンオキシ基、X 2 は原子間結合、R 2 は脂肪酸である；

(5) X 1 は原子間結合、X 2 はカルボニル基、R 2 は式 (R 2 - 1) で表される構造である；

(6) X 1 はメチレンオキシ基、X 2 は原子間結合、R 2 は式 (R 2 - 2) で表される構造である；

(7) X 1 は原子間結合、X 2 は原子間結合、R 2 はアミノ基で結合したグアニジンである。

[3 0]

前記成分 (B) について、以下のいずれかの条件を満たす、前記方法：

(1) X 1 は原子間結合、X 2 はカルボニル基、Y は NH、b - c は CH - CH₂、R 1 は H、R 2 はアミノ基で結合したアミノ酸、アミノ基で結合したアグマチン、または式 (R 2 - 1) で表される構造である；

(2) X 1 はメチレンオキシ基、X 2 は原子間結合、Y は NH、b - c は CH - CH₂、R 1 は H、R 2 はカルボキシル基で結合したアミノ酸、炭素数 2 ~ 18 の脂肪酸、または式 (R 2 - 2) で表される構造である；

(3) X₁は原子間結合、X₂は原子間結合、Yは酸素原子(O)、b-cはC=CH、R₁はメチル基、R₂はアミノ基で結合したグアニジンである。

[31]

前記成分(B)が、後述する式(化合物41)、(化合物50)、(化合物52)、(化合物54)、(化合物55)、および(化合物77)で表される化合物である場合は除く、前記方法。

[32]

前記成分(A)または(B)が、後述する式(化合物1)~(化合物20)、(化合物23)、(化合物26)~(化合物40)、(化合物42)~(化合物49)、(化合物51)、(化合物53)、(化合物56)~(化合物76)、(化合物78)~(化合物80)、および(化合物82)~(化合物90)で表される化合物から選択される、前記方法。

[33]

前記成分(C)が、リジン、トリプトファン、スレオニン、バリン、ロイシン、またはイソロイシンの発酵副生物である、前記方法。

[34]

前記成分(A)、(B)、または(C)が、該成分(A)、(B)、または(C)を10nM~10mMの濃度で含有する液体の形態で使用される、前記方法。

図面の簡単な説明

[0009] [図1]化合物5または合成ストリゴラクトンGR24の*Orobancha minor*に対する自殺発芽誘導による防除効果を示す図。

[図2]化合物5または合成ストリゴラクトンGR24の*Orobancha minor*に対する自殺発芽誘導による防除効果を示す図(写真)。

発明を実施するための形態

[0010] 以下、本発明を詳細に説明する。

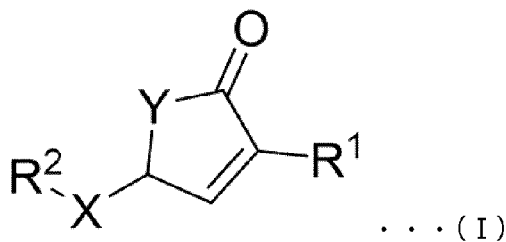
[0011] <1>有効成分

本発明において用いられる有効成分としては、下記成分（A）～（C）が挙げられる：

- （A）下記一般式（I）で表される化合物；
- （B）下記一般式（I'）で表される化合物；
- （C）アミノ酸発酵副生物。

[0012] 成分（A）は、下記一般式（I）で表される化合物である。なお、成分（A）について、「Rⁿ」と「R_n」（nは正の整数）は、互いに代替可能に用いられてよい。

[0013] [化1]



[0014] 式（I）中、右側に位置する環状構造を、「D環」ともいう。

[0015] 式（I）中、Xは、原子間結合またはオキシカルボニル基（O C（=O））を表す。なお、Xとしての「オキシカルボニル基」とは、OがD環に結合しており、C（=O）がR₂に結合しているものを意味する。

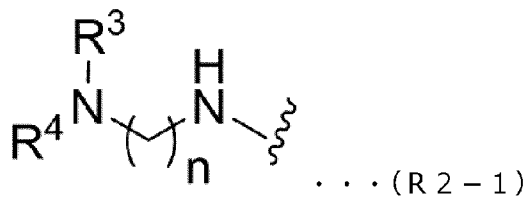
[0016] 式（I）中、Yは、酸素原子（O）、水素原子が結合した窒素原子（NH）、またはメチル基が結合した窒素原子（NMe）を表す。

[0017] 式（I）中、R₁は、水素原子（H）またはメチル基を表す。

[0018] 式（I）中、R₂は、アミノ酸、アグマチン、グアニジン、下記一般式（R₂-1）で表される構造、または下記一般式（R₂-2）で表される構造を表す。式（I）中、R₂は、特に、アミノ酸、アグマチン、下記一般式（R₂-1）で表される構造、または下記一般式（R₂-2）で表される構造であってもよい。

[0019]

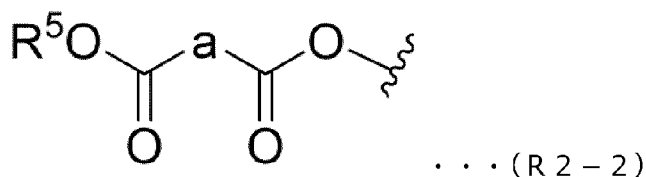
[化2]



[0020] 式 (R2-1) 中、n は、2～5 の整数（すなわち 2、3、4、または 5）を表す。

[0021] 式 (R2-1) 中、R3 および R4 は、それぞれ独立に、水素原子、またはアシル基を表す。

[0022] [化3]



[0023] 式 (R2-2) 中、a は、置換されていてもよい炭素数 1～4 のアルキレン基または置換されていてもよい炭素数 2～4 のアルケニレン基を表す。

[0024] 式 (R2-2) 中、R5 は、水素原子 (H) または置換されていてもよい炭素数 1～4 のアルキル基を表す。式 (R2-2) 中、R5 は、特に、置換されていてもよい炭素数 1～4 のアルキル基であってもよい。

[0025] 特記しない限り、成分 (A) について、X、Y、n、および R1～R5 は、それぞれ独立に選択できる。

[0026] 「置換されていてもよい官能基」とは、置換されている官能基および置換されていない官能基の総称である。すなわち、例えば、「置換されていてもよいアルキル基」とは、置換されているアルキル基および置換されていないアルキル基の総称である。置換されている官能基を「置換官能基」、置換されていない官能基を「非置換官能基」ともいう。すなわち、例えば、置換されているアルキル基を「置換アルキル基」、置換されていないアルキル基を「非置換アルキル基」ともいう。なお、置換に言及しない「官能基」とは、特記しない限り、置換されていない官能基を意味する。すなわち、例えば、

置換に言及しない「アルキル基」とは、特記しない限り、置換されていないアルキル基を意味する。置換されていてもよい官能基における「炭素数」とは、特記しない限り、置換の有無によらず、置換されていない状態での官能基の炭素数（すなわち置換基の炭素数を含まない炭素数）を意味する。非置換官能基についての記載は、置換官能基における置換基以外の部分にも準用できる。すなわち、例えば、非置換アルキル基についての記載は、置換アルキル基における置換基以外の部分（すなわち、アルキル基部分）にも準用できる。

[0027] 「官能基が置換されている」とは、官能基を構成する水素原子の1つまたはそれ以上が置換基で置換されていることを意味する。「官能基が置換されている」ことを、「官能基が置換基を有する」ともいう。置換基で置換される水素原子の数は、例えば、1～5個、1～4個、1～3個、または1～2個であってよい。置換基で置換される水素原子の数は、具体的には、例えば、1個、2個、3個、4個、または5個であってよい。置換基で置換される水素原子の数は、官能基が有する置換基の数と読み替えてもよい。2つまたはそれ以上の水素原子が置換基で置換される場合、置換基は各水素原子について独立に選択される。置換基で置換される水素原子としては、炭素原子に結合した水素原子、窒素原子に結合した水素原子、酸素原子に結合した水素原子が挙げられる。炭素原子に結合した水素原子は、例えば、末端炭素原子に結合した水素原子であってもよく、そうでなくてもよい。「末端炭素原子」とは、炭素鎖の末端の炭素原子を意味する。末端は、炭素鎖が分岐している場合は、いずれの分岐の末端であってもよい。

[0028] aとしての置換アルキレン基または置換アルケニレン基が有する置換基としては、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、アミノ基、カルボキシル基、アミノカルボニル基、メルカプト基、置換されていてもよいアリール基、置換されていてもよいヘテロアリール基、置換されていてもよいアルコキシ基、置換されていてもよいアルキルアミノ基、置換されていてもよいアルコキシカルボニルアミノ基、置換されていてもよいアルコキシカルボニル基、置換さ

れていてもよいアルキルチオ基が挙げられる。R 5としての置換アルキル基が有する置換基としては、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、アミノ基、カルボキシル基、アミノカルボニル基、メルカプト基、置換されていてもよいアリール基、置換されていてもよいヘテロアリール基、置換されていてもよいアルコキシ基、置換されていてもよいアルキルアミノ基、置換されていてもよいアルコキシカルボニルアミノ基、置換されていてもよいアルコキシカルボニル基、置換されていてもよいアルキルチオ基が挙げられる。R 3またはR 4としてのアシル基を構成する官能基（例えば、置換アルキル基、置換シクロアルキル基、置換アルケニル基、置換アリール基、または置換アルコキシ基）が有する置換基としては、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、アミノ基、カルボキシル基、アミノカルボニル基、メルカプト基、置換されていてもよいアリール基、置換されていてもよいヘテロアリール基、置換されていてもよいアルコキシ基、置換されていてもよいアルキルアミノ基、置換されていてもよいアルコキシカルボニルアミノ基、置換されていてもよいアルコキシカルボニル基、置換されていてもよいアルキルチオ基が挙げられる。

[0029] aとしての置換アルキレン基または置換アルケニレン基における置換アリール基が有する置換基としては、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、アミノ基、カルボキシル基、アルキル基が挙げられる。aとしての置換アルキレン基または置換アルケニレン基における置換ヘテロアリール基が有する置換基としては、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、アミノ基、カルボキシル基、アルキル基が挙げられる。R 5としての置換アルキル基における置換アリール基が有する置換基としては、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、アミノ基、カルボキシル基、アルキル基が挙げられる。R 5としての置換アルキル基における置換ヘテロアリール基が有する置換基としては、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、アミノ基、カルボキシル基、アルキル基が挙げられる。R 3またはR 4としてのアシル基を構成する官能基における置換アリール基が有する置換基としては、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、アミノ基、カルボキシル基、アルキル基が挙げられる。R 3またはR 4としてのアシル基を構成する官

能基における置換ヘテロアリール基が有する置換基としては、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、アミノ基、カルボキシル基、アルキル基が挙げられる。

[0030] aとしての置換アルキレン基または置換アルケニレン基における置換アルコキシ基が有する置換基としては、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、アミノ基、カルボキシル基、アミノカルボニル基、アリール基、ヘテロアリール基が挙げられる。aとしての置換アルキレン基または置換アルケニレン基における置換アルコキシカルボニル基が有する置換基としては、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、アミノ基、カルボキシル基、アミノカルボニル基、アリール基、ヘテロアリール基が挙げられる。R⁵としての置換アルキル基における置換アルコキシ基が有する置換基としては、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、アミノ基、カルボキシル基、アミノカルボニル基、アリール基、ヘテロアリール基が挙げられる。R⁵としての置換アルキル基における置換アルコキシカルボニル基が有する置換基としては、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、アミノ基、カルボキシル基、アミノカルボニル基、アリール基、ヘテロアリール基が挙げられる。R³またはR⁴としてのアシル基を構成する官能基における置換アルコキシ基が有する置換基としては、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、アミノ基、カルボキシル基、アミノカルボニル基、アリール基、ヘテロアリール基が挙げられる。R³またはR⁴としてのアシル基を構成する官能基における置換アルコキシカルボニル基が有する置換基としては、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、アミノ基、カルボキシル基、アミノカルボニル基、アリール基、ヘテロアリール基が挙げられる。

[0031] aとしての置換アルキレン基または置換アルケニレン基における置換アルキルアミノ基が有する置換基としては、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、アミノ基、カルボキシル基、アミノカルボニル基、N-アルキル基、アリール基、ヘテロアリール基が挙げられる。aとしての置換アルキレン基または置換アルケニレン基における置換アルコキシカルボニルアミノ基が有する置換基としては、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、アミノ基、カルボキシル基、アミノカルボニル基、N-アルキル基、アリール基、ヘテロアリール基が挙

げられる。R⁵としての置換アルキル基における置換アルキルアミノ基が有する置換基としては、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、アミノ基、カルボキシル基、アミノカルボニル基、N-アルキル基、アリール基、ヘテロアリール基が挙げられる。R⁵としての置換アルキル基における置換アルコキシカルボニルアミノ基が有する置換基としては、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、アミノ基、カルボキシル基、アミノカルボニル基、N-アルキル基、アリール基、ヘテロアリール基が挙げられる。R³またはR⁴としてのアシル基を構成する官能基における置換アルキルアミノ基が有する置換基としては、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、アミノ基、カルボキシル基、アミノカルボニル基、N-アルキル基、アリール基、ヘテロアリール基が挙げられる。R³またはR⁴としてのアシル基を構成する官能基における置換アルコキシカルボニルアミノ基が有する置換基としては、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、アミノ基、カルボキシル基、アミノカルボニル基、N-アルキル基、アリール基、ヘテロアリール基が挙げられる。「N-アルキル基」とは、アミノ基の水素原子を置換するアルキル基を意味する。

[0032] ハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子が挙げられる。

[0033] アルキル基としては、炭素数1～12のアルキル基が挙げられる。アルキル基としては、特に、炭素数1～6のアルキル基が挙げられる。アルキル基として、さらに特に、炭素数1～4のアルキル基が挙げられる。アルキル基は、直鎖状であってもよく、分岐鎖状であってもよい。炭素数1～6のアルキル基としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2,3-ジメチルプロピル基、ヘキシル基が挙げられる。炭素数1～4のアルキル基としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基が挙げられる。アルキル基についての記載は、N-アルキル基にも準用できる。

- [0034] アルキレン基は、直鎖状であってもよく、分岐鎖状であってもよい。炭素数1～4のアルキレン基としては、メチレン基、エチレン基、プロピレン基、イソプロピレン基、ブチレン基、イソブチレン基、*sec*-ブチレン基、*tert*-ブチレン基が挙げられる。
- [0035] アルケニレン基は、直鎖状であってもよく、分岐鎖状であってもよい。炭素数2～4のアルケニレン基としては、エテニレン基、プロペニレン基、イソプロペニレン基、ブテニレン基、イソブテニレン基、*sec*-ブテニレン基が挙げられる。
- [0036] アリール基としては、炭素数6～14のアリール基が挙げられる。アリール基としては、特に、炭素数6～10のアリール基が挙げられる。アリール基として、具体的には、フェニル基、ナフチル基、フルオレニル基が挙げられる。
- [0037] 「ヘテロアリール基」とは、環を構成する原子として、窒素原子、酸素原子、および硫黄原子からなる群から選ばれる少なくとも1種のヘテロ原子を有するアリール基を意味する。ヘテロアリール基としては、炭素数3～14のヘテロアリール基が挙げられる。ヘテロアリール基としては、特に、炭素数4～10のヘテロアリール基が挙げられる。ヘテロアリール基として、さらに特に、炭素数4～9のヘテロアリール基が挙げられる。ヘテロアリール基として、具体的には、フラニル基、ピロリル基、オキサゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、ピラニル基、インデンニル基、チオフェニル基、ピリジニル基、インドリル基、キノリニル基が挙げられる。ヘテロアリール基としては、特に、イミダゾリル基やインドリル基が挙げられる。
- [0038] アルコキシ基としては、炭素数1～6のアルコキシ基が挙げられる。アルコキシ基としては、特に、炭素数1～4のアルコキシ基が挙げられる。アルコキシ基は、直鎖状であってもよく、分岐鎖状であってもよい。アルコキシ基として、具体的には、メトキシ基、エトキシ基、1-プロポキシ基、2-プロポキシ基、*n*-ブトキシ基、*i*-ブトキシ基、*sec*-ブトキシ基、*tert*-ブトキシ基、1-ペンチルオキシ基、2-ペンチルオキシ基、3-

ペンチルオキシ基、2-メチル-1-ブチルオキシ基、3-メチル-1-ブチルオキシ基、2-メチル-2-ブチルオキシ基、3-メチル-2-ブチルオキシ基、2,2-ジメチル-1-プロピルオキシ基、1-ヘキシルオキシ基、2-ヘキシルオキシ基、3-ヘキシルオキシ基が挙げられる。アルコキシ基としては、特に、tert-ブトキシ基が挙げられる。

[0039] 置換されていてもよいアルキル基は、アルキル基または置換アルキル基である。アルキル基については上述の通りである。置換アルキル基を構成するアルキル基および置換基については、それぞれ、上述したアルキル基およびその置換基についての記載を準用できる。例えば、置換されていてもよい炭素数1~4のアルキル基としては、特に、メチル基、エチル基、tert-ブチル基、ベンジル基が挙げられる。

[0040] 置換されていてもよいアルキレン基は、アルキレン基または置換アルキレン基である。アルキレン基については上述の通りである。置換アルキレン基を構成するアルキレン基および置換基については、それぞれ、上述したアルキレン基およびその置換基についての記載を準用できる。

[0041] 置換されていてもよいアルケニレン基は、アルケニレン基または置換アルケニレン基である。アルケニレン基については上述の通りである。置換アルケニレン基を構成するアルケニレン基および置換基については、それぞれ、上述したアルケニレン基およびその置換基についての記載を準用できる。

[0042] 置換されていてもよいアリール基は、アリール基または置換アリール基である。アリール基については上述の通りである。置換アリール基を構成するアリール基および置換基については、それぞれ、上述したアリール基およびその置換基についての記載を準用できる。

[0043] 置換アリール基として、具体的には、置換されていてもよいアルキルアリール基（すなわち、アルキルアリール基や置換アルキルアリール基）が挙げられる。アルキルアリール基または置換アルキルアリール基を構成するアルキル基、アリール基、および置換基については、それぞれ、上述したアルキル基、アリール基、およびそれらの置換基についての記載を準用できる。置

換されていてもよいアルキルアリール基として、具体的には、メチルフェニル基（2-、3-、または4-メチルフェニル基等）が挙げられる。

[0044] 置換アリール基として、具体的には、ヒドロキシフェニル基（2-、3-、または4-ヒドロキシフェニル基等）、クロロフェニル基（2-、3-、または4-クロロフェニル基等）、ジクロロフェニル基（2, 5-ジクロロフェニル基等）、フルオロフェニル基（2-、3-、または4-フルオロフェニル基等）、2, 3-ジヒドロキシインデニル基も挙げられる。

[0045] 置換されていてもよいヘテロアリール基は、ヘテロアリール基または置換ヘテロアリール基である。ヘテロアリール基については上述の通りである。置換ヘテロアリール基を構成するヘテロアリール基および置換基については、それぞれ、上述したヘテロアリール基およびその置換基についての記載を準用できる。

[0046] 置換されていてもよいアルコキシ基は、アルコキシ基または置換アルコキシ基である。アルコキシ基については上述の通りである。置換アルコキシ基を構成するアルコキシ基および置換基については、それぞれ、上述したアルコキシ基およびその置換基についての記載を準用できる。

[0047] 置換アルコキシ基として、具体的には、置換されていてもよいアリールアルコキシ基（すなわち、アリールアルコキシ基や置換アリールアルコキシ基）が挙げられる。アリールアルコキシ基または置換アリールアルコキシ基を構成するアリール基、アルコキシ基、および置換基については、それぞれ、上述したアリール基、アルコキシ基、およびそれらの置換基についての記載を準用できる。置換されていてもよいアリールアルコキシ基として、具体的には、フェニルメトキシ基が挙げられる。

[0048] 置換アルコキシ基として、具体的には、ヒドロキシアルコキシ基（ヒドロキシエトキシ基等）やトリフルオロメトキシ基も挙げられる。

[0049] 置換されていてもよいアルキルアミノ基は、アルキルアミノ基または置換アルキルアミノ基である。アルキルアミノ基を構成するアルキル基については、上述したアルキル基についての記載を準用できる。置換アルキルアミノ

基を構成するアルキル基および置換基については、上述したアルキル基およびその置換基についての記載を準用できる。例えば、上述したアルキル基の炭素数（例えば、1～12や1～6）は、置換されていてもよいアルキルアミノ基の炭素数（ただし置換基の炭素数は含まない）と読み替えてよい。置換アルキルアミノ基として、具体的には、置換されていてもよいカルボキシアルキルアミノ基（すなわちカルボキシアルキルアミノ基や置換カルボキシアルキルアミノ基）が挙げられる。置換されていてもよいカルボキシアルキルアミノ基の炭素数（ただし置換基の炭素数は含まない）は、例えば、2～13または2～7であってよい。カルボキシアルキルアミノ基として、具体的には、カルボキシメチルアミノ基や1-メチルカルボキシメチルアミノ基が挙げられる。置換カルボキシアルキルアミノ基として、具体的には、ヒドロキシル基、アミノ基、カルボキシル基、フェニル基、インドリル基、またはN-メチル基で置換されたカルボキシアルキルアミノ基が挙げられる。置換カルボキシアルキルアミノ基として、より具体的には、1-（アミノブチル）カルボキシメチルアミノ基、1-メチルカルボキシメチルアミノ基、1-（インドリルメチル）カルボキシメチルアミノ基、1-（カルボキシメチル）カルボキシメチルアミノ基、1-（1-ヒドロキシエチル）カルボキシメチルアミノ基、1-（ヒドロキシメチル）カルボキシメチルアミノ基、1-イソブチルカルボキシメチルアミノ基、1-ベンジルカルボキシメチルアミノ基、N-メチルカルボキシメチルアミノ基が挙げられる。

[0050] 置換されていてもよいアルコキシカルボニル基は、アルコキシカルボニル基または置換アルコキシカルボニル基である。アルコキシカルボニル基を構成するアルコキシ基については、上述したアルコキシ基についての記載を準用できる。置換アルコキシカルボニル基を構成するアルコキシ基および置換基については、上述したアルコキシ基およびその置換基についての記載を準用できる。置換されていてもよいアルコキシカルボニル基として、具体的には、インドリルアセチルメトキシカルボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、プロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル

基、ブトキシカルボニル基、イソブトキシカルボニル基、*sec*-ブトキシカルボニル基、*tert*-ブトキシカルボニル基（*Boc*ともいう）、フェニルメトキシカルボニル基、9-フルオレニルメチルオキシカルボニル基（*Fmoc*ともいう）、3-メチルフェニルオキシアセチル基、3-クロロフェニルメトキシカルボニル基、トリフルオロメトキシカルボニル基、2,5-ジクロロベンゾイル基、ベンジルオキシカルボニル基（*Cbz*ともいう）が挙げられる。置換されていてもよいアルコキシカルボニル基としては、特に、*tert*-ブトキシカルボニル基、9-フルオレニルメチルオキシカルボニル基、ベンジルオキシカルボニル基が挙げられる。

[0051] 置換されていてもよいアルコキシカルボニルアミノ基は、アルコキシカルボニルアミノ基または置換アルコキシカルボニルアミノ基である。アルコキシカルボニルアミノ基を構成するアルコキシ基（またはアルコキシカルボニル基）については、上述したアルコキシ基（またはアルコキシカルボニル基）についての記載を準用できる。置換アルコキシカルボニルアミノ基を構成するアルコキシ基（またはアルコキシカルボニル基）および置換基については、上述したアルコキシ基（またはアルコキシカルボニル基）およびその置換基についての記載を準用できる。置換されていてもよいアルコキシカルボニルアミノ基として、具体的には、*tert*-ブトキシカルボニルアミノ基、9-フルオレニルメチルオキシカルボニルアミノ基、ベンジルオキシカルボニルアミノ基が挙げられる。

[0052] 置換されていてもよいアルキルチオ基は、アルキルチオ基または置換アルキルチオ基である。アルキルチオ基を構成するアルキル基については、上述したアルキル基についての記載を準用できる。置換アルキルチオ基を構成するアルキル基および置換基については、上述したアルキル基およびその置換基についての記載を準用できる。置換されていてもよいアルキルチオ基として、具体的には、メチルチオ基が挙げられる。

[0053] アシル基としては、置換されていてもよいアルキルカルボニル基、置換されていてもよいシクロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいアルケ

ニルカルボニル基、置換されていてもよいアリールカルボニル基、置換されていてもよいアルコキシカルボニル基が挙げられる。置換されていてもよいアルキルカルボニル基は、アルキルカルボニル基または置換アルキルカルボニル基である。置換されていてもよいシクロアルキルカルボニル基は、シクロアルキルカルボニル基または置換シクロアルキルカルボニル基である。置換されていてもよいアルケニルカルボニル基は、アルケニルカルボニル基または置換アルケニルカルボニル基である。置換されていてもよいアリールカルボニル基は、アリールカルボニル基または置換アリールカルボニル基である。置換されていてもよいアルコキシカルボニル基は、アルコキシカルボニル基または置換アルコキシカルボニル基である。アシル基を構成する官能基（例えば、置換アルキル基、置換シクロアルキル基、置換アルケニル基、置換アリール基、または置換アルコキシ基）が有する置換基については、上述の通りである。アシル基を構成する置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアリール基、および置換されていてもよいアルコキシ基については、それぞれ、上述した置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアリール基、および置換されていてもよいアルコキシ基についての記載を準用できる。シクロアルキル基としては、炭素数3～8の環状アルキル基が挙げられる。シクロアルキル基としては、特に、炭素数4～6の環状アルキル基が挙げられる。シクロアルキル基として、具体的には、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロオクチル基が挙げられる。アルケニル基としては、炭素数2～6のアルケニル基が挙げられる。アルケニル基は、直鎖状であってもよく、分岐鎖状であってもよい。アルケニル基として、具体的には、ビニル基、アリル基、プロペニル基、ブテニル基、ブタジエニル基、ペンテニル基、ペンタジエニル基、ヘキセニル基、ヘキサジエニル基が挙げられる。アシル基としては、特に、置換されていてもよいアルキルカルボニル基や置換されていてもよいアルコキシカルボニル基が挙げられる。アシル基として、具体的には、アセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基

、バレリル基、イソバレリル基、ピバロイル基、ヘキサノイル基、アクリロイル基、メタクリロイル基、クロトノイル基、イソクロトノイル基、シクロプロパノイル基、シクロブタノイル基、シクロペンタノイル基、シクロヘキサノイル基、ベンゾイル基、上記例示した置換されていてもよいアルコキシカルボニル基が挙げられる。アシル基としては、特に、アセチル基、*tert*-ブトキシカルボニル基、9-フルオレニルメチルオキシカルボニル基、ベンジルオキシカルボニル基が挙げられる。

[0054] R²としての「アミノ酸」とは、適切な結合によりXと結合したアミノ酸を意味する。なお、式(1)における「アミノ酸とXの結合」は、Xが原子間結合である場合には「アミノ酸とD環の結合」と読み替えるものとする。

[0055] R²としてのアミノ酸としては、アミノ基で結合したアミノ酸、カルボキシル基で結合したアミノ酸、水酸基で結合したアミノ酸、チオール基で結合したアミノ酸、アミド基で結合したアミノ酸が挙げられる。

[0056] 「アミノ基で結合したアミノ酸」とは、アミノ基の窒素原子でXに結合したアミノ酸を意味する。なお、アミノ酸が2つ以上のアミノ基を有する場合、それらアミノ基のいずれがXとの結合に用いられてもよい。例えば、 α アミノ基がXとの結合に用いられてもよく、 ϵ アミノ基がXとの結合に用いられてもよい。

[0057] 「カルボキシル基で結合したアミノ酸」とは、カルボキシル基のOHの酸素原子でXに結合したアミノ酸を意味する。なお、アミノ酸が2つ以上のカルボキシル基を有する場合、それらカルボキシル基のいずれがXとの結合に用いられてもよい。例えば、 α カルボキシル基がXとの結合に用いられてもよく、他のカルボキシル基がXとの結合に用いられてもよい。

[0058] 「水酸基で結合したアミノ酸」とは、水酸基の酸素原子でXに結合したアミノ酸を意味する。

[0059] 「チオール基で結合したアミノ酸」とは、チオール基の硫黄原子でXに結合したアミノ酸を意味する。

[0060] 「アミド基で結合したアミノ酸」とは、アミド基の窒素原子でXに結合し

たアミノ酸を意味する。

[0061] アミノ酸としては、リジン、オルニチン、アルギニン、ヒスチジン、シトルリン、ジアミノブタン酸、ジアミノプロパン酸等の塩基性アミノ酸、イソロイシン、アラニン、バリン、ロイシン、グリシン等の脂肪族アミノ酸、スレオニン、セリン等のヒドロキシモノアミノカルボン酸であるアミノ酸、プロリン等の環式アミノ酸（「イミノ酸」ともいう）、フェニルアラニン、チロシン、トリプトファン等の芳香族アミノ酸、システイン、シスチン、メチオニン等の含硫アミノ酸、グルタミン酸、アスパラギン酸等の酸性アミノ酸、グルタミン、アスパラギン等の側鎖にアミド基を有するアミノ酸が挙げられる。アミノ酸としては、ノルバリン、ノルロイシン、 α -アミノ酪酸、 γ -アミノ酪酸、ヒドロキシプロリン、tert-ロイシン、サルコシンも挙げられる。アミノ酸は、そのアミノ基および／またはカルボキシル基に置換基を有していてもよく、いなくてもよい。すなわち、「アミノ酸」には、特記しない限り、そのアミノ基および／またはカルボキシル基に置換基を有するものが包含される。すなわち、アミノ酸としては、上記のようなアミノ酸のアミノ基および／またはカルボキシル基に置換基を有するものも挙げられる。アミノ酸におけるアミノ基が有する置換基としては、置換されていてもよいアルコキシカルボニル基や置換されていてもよいアルキル基が挙げられる。すなわち、アミノ酸におけるアミノ基は、例えば、置換されていてもよいアルコキシカルボニルアミノ基または置換されていてもよいアルキルアミノ基を構成していてもよい。アミノ酸におけるアミノ基が有する置換基としては、特に、tert-ブトキシカルボニル基、9-フルオレニルメチルオキシカルボニル基、ベンジルオキシカルボニル基が挙げられる。アミノ酸におけるカルボキシル基が有する置換基としては、置換されていてもよいアルキル基やアミノ基が挙げられる。すなわち、アミノ酸におけるカルボキシル基は、例えば、置換されていてもよいアルコキシカルボニル基またはアミノカルボニル基を構成していてもよい。アミノ酸におけるカルボキシル基が有する置換基としては、特に、メチル基、エチル基、tert-ブチル基、ベ

ンジル基が挙げられる。

- [0062] R²としての「アグマチン」とは、適切な結合によりXと結合したアグマチンを意味する。なお、式(1)における「アグマチンとXの結合」は、Xが原子間結合である場合には「アグマチンとD環の結合」と読み替えるものとする。
- [0063] R²としてのアグマチンとしては、アミノ基で結合したアグマチンが挙げられる。
- [0064] 「アミノ基で結合したアグマチン」とは、アミノ基の窒素原子でXに結合したアグマチンを意味する。なお、アグマチンのアミノ基のいずれがXとの結合に用いられてもよい。例えば、グアニジン部位のアミノ基がXとの結合に用いられてもよく、N-4-アミノ基がXとの結合に用いられてもよい。
- [0065] アグマチンは、そのアミノ基に置換基を有していてもよく、いなくてもよい。すなわち、「アグマチン」には、特記しない限り、そのアミノ基に置換基を有するものが包含される。アグマチンのアミノ基における置換基については、上述したアミノ酸のアミノ基における置換基についての記載を準用できる。
- [0066] R²としての「グアニジン」とは、適切な結合によりXと結合したグアニジンを意味する。なお、式(1)における「グアニジンとXの結合」は、Xが原子間結合である場合には「グアニジンとD環の結合」と読み替えるものとする。
- [0067] R²としてのグアニジンとしては、アミノ基で結合したグアニジンが挙げられる。
- [0068] 「アミノ基で結合したグアニジン」とは、アミノ基の窒素原子でXに結合したグアニジンを意味する。
- [0069] グアニジンは、そのアミノ基に置換基を有していてもよく、いなくてもよい。すなわち、「グアニジン」には、特記しない限り、そのアミノ基に置換基を有するものが包含される。グアニジンのアミノ基における置換基については、上述したアミノ酸のアミノ基における置換基についての記載を準用で

きる。また、グアニジンのアミノ基における置換基としては、置換されていてもよいアルキルカルボニル基が挙げられる。グアニジンのアミノ基における置換基としての置換されていてもよいアルキルカルボニル基については、上述したアシル基としての置換されていてもよいアルキルカルボニル基についての記載を準用できる。

[0070] 式 (R²-1) で示される構造として、具体的には、R³およびR⁴がHの場合、エチレンジアミン、プロピレンジアミン、プトレシン、カダベリンが挙げられる。式 (R²-1) で示される構造として、具体的には、R³および／またはR⁴がHでない場合、R³および／またはR⁴でアミノ基の水素原子が置換された、エチレンジアミン、プロピレンジアミン、プトレシン、カダベリンが挙げられる。

[0071] 式 (R²-2) で示される構造として、具体的には、R⁵でカルボキシル基の水素原子が置換された、マロン酸、コハク酸、グルタル酸、アジピン酸、フマル酸、マレイン酸、クエン酸が挙げられる。

[0072] 一態様において、YはNH、R¹はメチル基であってよい。

[0073] 一態様において、Xは原子間結合またはオキシカルボニル基、R²はアミノ基で結合したアミノ酸、アミノ基で結合したアグマチン、またはアミノ基で結合したグアニジンであってよい。一態様において、特に、Xは原子間結合またはオキシカルボニル基、R²はアミノ基で結合したアミノ酸またはアミノ基で結合したアグマチンであってよい。

[0074] 一態様において、Xは原子間結合、R²はカルボキシル基で結合したアミノ酸であってよい。

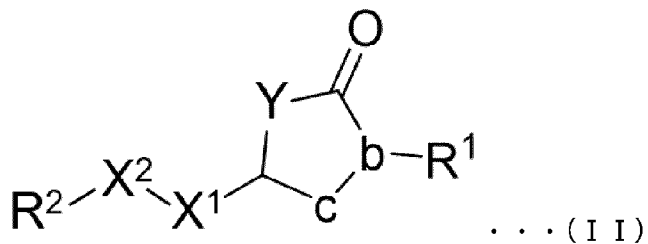
[0075] 一態様において、Xは原子間結合、R²は水酸基で結合したアミノ酸であってよい。

[0076] 一態様において、Xは原子間結合、R²はチオール基で結合したアミノ酸であってよい。

[0077] 一態様において、Xは原子間結合、R²はアミド基で結合したアミノ酸であってよい。

- [0078] 一態様において、Xは原子間結合またはオキシカルボニル基、R²は式（R² - 1）で表される構造であってよい。
- [0079] 一態様において、Xは原子間結合、R²は式（R² - 2）で表される構造であってよい。
- [0080] 一態様において、Xは原子間結合、R¹はメチル基、R²はアミノ基で結合したアミノ酸、アミノ基で結合したアグマチン、アミノ基で結合したグアニジン、または式（R² - 1）で表される構造であってよい。一態様において、特に、Xは原子間結合、R¹はメチル基、R²はアミノ基で結合したアミノ酸、アミノ基で結合したアグマチン、または式（R² - 1）で表される構造であってよい。
- [0081] 一態様において、Xはオキシカルボニル基、R¹はメチル基、R²はカルボキシル基で結合したアミノ酸または式（R² - 2）で表される構造であってよい。
- [0082] 一態様において、Xは原子間結合、YはNH、R¹はメチル基、R²はアミノ基で結合したアミノ酸、アミノ基で結合したアグマチン、アミノ基で結合したグアニジン、または式（R² - 1）で表される構造であってよい。一態様において、特に、Xは原子間結合、YはNH、R¹はメチル基、R²はアミノ基で結合したアミノ酸、アミノ基で結合したアグマチン、または式（R² - 1）で表される構造であってよい。
- [0083] 一態様において、Xはオキシカルボニル基、YはNH、R¹はメチル基、R²はカルボキシル基で結合したアミノ酸または式（R² - 2）で表される構造であってよい。
- [0084] 成分（B）は、下記一般式（I I）で表される化合物である。なお、成分（B）について、「Rⁿ」と「Rⁿ」（nは正の整数）は、互いに代替可能に用いられてよい。また、成分（B）について、「Xⁿ」と「Xⁿ」（nは正の整数）は、互いに代替可能に用いられてよい。
- [0085]

[化4]



[0086] 式 (I I) 中、右側に位置する環状構造を、「D環」ともいう。

[0087] 式 (I I) 中、X 1 は、原子間結合またはメチレンオキシ基 (CH₂O) を表す。なお、X 1 としての「メチレンオキシ基」とは、CH₂がD環に結合しており、OがX 2 に結合しているものを意味する。なお、メチレンオキシ基の「OとX 2 の結合」は、X 2 が原子間結合である場合には「OとR 2 の結合」と読み替えるものとする。

[0088] 式 (I I) 中、X 2 は、原子間結合またはカルボニル基 (C (=O)) を表す。

[0089] 式 (I I) 中、Y は、酸素原子 (O) または水素原子が結合した窒素原子 (NH) を表す。

[0090] 式 (I I) 中、R 1 は、水素原子 (H) またはメチル基を表す。

[0091] 式 (I I) 中、R 2 は、アミノ酸、アグマチン、グアニジン、脂肪族アルコール、脂肪酸、上記一般式 (R 2 - 1) で表される構造、または上記一般式 (R 2 - 2) で表される構造を表す。

[0092] 式 (I I) 中、b - c は、CH - CH₂またはC = CHを表す。

[0093] 特記しない限り、成分 (B) について、b - c、X 1、X 2、Y、n、およびR 1 ~ R 5 は、それぞれ独立に選択できる。

[0094] 式 (R 2 - 1) で表される構造および式 (R 2 - 2) で表される構造については上述の通りである。

[0095] 式 (I I) におけるR 2 としての「アミノ酸」とは、適切な結合によりX 2 と結合したアミノ酸を意味する。なお、式 (I I) における「アミノ酸とX 2 の結合」は、X 2 が原子間結合である場合には、「アミノ酸とX 1 の結合」と読み替えるものとする。また、式 (I I) における「アミノ酸とX 2

の結合」は、X 1 および X 2 が原子間結合である場合には、「アミノ酸と D 環の結合」と読み替えるものとする。式 (11) における R 2 としての「アミノ酸」については、式 (1) における R 2 としての「アミノ酸」についての記載を準用できる。

[0096] 式 (11) における R 2 としての「アグマチン」とは、適切な結合により X 2 と結合しているアグマチンを意味する。なお、式 (11) における「アグマチンと X 2 の結合」は、X 2 が原子間結合である場合には、「アグマチンと X 1 の結合」と読み替えるものとする。また、式 (11) における「アグマチンと X 2 の結合」は、X 1 および X 2 が原子間結合である場合には、「アグマチンと D 環の結合」と読み替えるものとする。式 (11) における R 2 としての「アグマチン」については、式 (1) における R 2 としての「アグマチン」についての記載を準用できる。

[0097] 式 (11) における R 2 としての「グアニジン」とは、適切な結合により X 2 と結合しているグアニジンを意味する。なお、式 (11) における「グアニジンと X 2 の結合」は、X 2 が原子間結合である場合には、「グアニジンと X 1 の結合」と読み替えるものとする。また、式 (11) における「グアニジンと X 2 の結合」は、X 1 および X 2 が原子間結合である場合には、「グアニジンと D 環の結合」と読み替えるものとする。式 (11) における R 2 としての「グアニジン」については、式 (1) における R 2 としての「グアニジン」についての記載を準用できる。

[0098] 式 (11) における R 2 としての「脂肪族アルコール」とは、水酸基の酸素原子で X 2 に結合した脂肪族アルコールを意味する。なお、式 (11) における「脂肪族アルコールと X 2 の結合」は、X 2 が原子間結合である場合には、「脂肪族アルコールと X 1 の結合」と読み替えるものとする。また、式 (11) における「脂肪族アルコールと X 2 の結合」は、X 1 および X 2 が原子間結合である場合には、「脂肪族アルコールと D 環の結合」と読み替えるものとする。

[0099] 脂肪族アルコールは、飽和脂肪族アルコールであってもよく、不飽和脂肪

族アルコールであってもよい。脂肪族アルコールは、直鎖であってもよく、分岐鎖であってもよい。脂肪族アルコールとしては、炭素数 2～26、2～22、または 2～18 の脂肪族アルコールが挙げられる。脂肪族アルコールとしては、特に、炭素数 2～18 の脂肪族アルコールが挙げられる。脂肪族アルコールとして、具体的には、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール、イソブタノール、*sec*-ブタノール、*tert*-ブタノール、ペンタノール、イソペンタノール、2,3-ジメチルプロパノール、ヘキサノール、ヘプタノール、オクタノール、ノナノール、デカノール、ウンデシルアルコール、ドデシルアルコール、トリデシルアルコール、テトラデシルアルコール、ペンタデシルアルコール、ヘキサデシルアルコール、シス-9-ヘキサデセン-1-オール、ヘプタデシルアルコール、オクタデシルアルコール、シス-9-オクタデセン-1-オール、*cis*, *cis*-9,12-オクタデカジエン-1-オール、9,12,15-オクタデカントリエン-1-オール、6,9,12-オクタデカントリエン-1-オール、ノナデシルアルコール、エイコサノール、ヘンエイコサノール、ドコサノール、テトラコサノール、ヘキサコサノールが挙げられる。

[0100] 式(11)における R²としての「脂肪酸」とは、カルボキシル基の OH の酸素原子で X²に結合した脂肪酸を意味する。なお、式(11)における「脂肪酸と X²の結合」は、X²が原子間結合である場合には、「脂肪酸と X¹の結合」と読み替えるものとする。また、式(11)における「脂肪酸と X²の結合」は、X¹および X²が原子間結合である場合には、「脂肪酸と D 環の結合」と読み替えるものとする。

[0101] 脂肪酸は、飽和脂肪酸であってもよく、不飽和脂肪酸であってもよい。脂肪酸アルコールは、直鎖であってもよく、分岐鎖であってもよい。脂肪酸としては、炭素数 2～26、2～22、または 2～18 の脂肪酸が挙げられる。脂肪酸としては、特に、炭素数 2～18 の脂肪酸が挙げられる。脂肪酸として、具体的には、酢酸、プロピオン酸、コハク酸、酪酸、吉草酸、カプロン酸、エナント酸、カプリル酸、カプリン酸、ラウリン酸、ミリスチン酸、

パルミチン酸、パルミトレイン酸、ステアリン酸、オレイン酸、リノール酸、 α -リノレン酸、 γ -リノレン酸、アラキジン酸、アラキドン酸、ベヘン酸、リグノセリン酸、ネルボン酸、セロチン酸、エイコサペンタエン酸、ドコサペンタエン酸、ドコサヘキサエン酸が挙げられる。

- [0102] 一態様において、X 1 は原子間結合、X 2 はカルボニル基であってよい。
- [0103] 一態様において、X 1 はメチレンオキシ基、X 2 は原子間結合であってよい。
- [0104] 一態様において、X 1 は原子間結合、X 2 は原子間結合であってよい。
- [0105] 一態様において、X 1 はメチレンオキシ基、X 2 はカルボニル基であってよい。
- [0106] 一態様において、Y はNH、b - c はCH - CH₂、R 1 はHであってよい。
- [0107] 一態様において、X 1 は原子間結合、X 2 はカルボニル基、Y はNH、b - c はCH - CH₂、R 1 はHであってよい。
- [0108] 一態様において、X 1 はメチレンオキシ基、X 2 は原子間結合、Y はNH、b - c はCH - CH₂、R 1 はHであってよい。
- [0109] 一態様において、X 1 は原子間結合、X 2 はカルボニル基、R 2 はアミノ基で結合したアミノ酸、アミノ基で結合したアグマチン、またはアミノ基で結合したグアニジンであってよい。一態様において、特に、X 1 は原子間結合、X 2 はカルボニル基、R 2 はアミノ基で結合したアミノ酸またはアミノ基で結合したアグマチンであってよい。
- [0110] 一態様において、X 1 はメチレンオキシ基、X 2 は原子間結合、R 2 はカルボキシル基で結合したアミノ酸であってよい。
- [0111] 一態様において、X 1 は原子間結合、X 2 はカルボニル基、R 2 は脂肪族アルコールであってよい。
- [0112] 一態様において、X 1 はメチレンオキシ基、X 2 は原子間結合、R 2 は脂肪酸であってよい。
- [0113] 一態様において、X 1 は原子間結合、X 2 はカルボニル基、R 2 は式 (R

2-1) で表される構造であってよい。

[0114] 一態様において、X1はメチレンオキシ基、X2は原子間結合、R2は式(R2-2)で表される構造であってよい。

[0115] 一態様において、X1は原子間結合、X2はカルボニル基、YはNH、b-cはCH-CH₂、R1はH、R2はアミノ基で結合したアミノ酸、アミノ基で結合したアグマチン、アミノ基で結合したグアニジン、または式(R2-1)で表される構造であってよい。一態様において、特に、X1は原子間結合、X2はカルボニル基、YはNH、b-cはCH-CH₂、R1はH、R2はアミノ基で結合したアミノ酸、アミノ基で結合したアグマチン、または式(R2-1)で表される構造であってよい。

[0116] 一態様において、X1はメチレンオキシ基、X2は原子間結合、YはNH、b-cはCH-CH₂、R1はH、R2はカルボキシル基で結合したアミノ酸、炭素数2~18の脂肪酸、または式(R2-2)で表される構造であってよい。

[0117] 一態様において、X1は原子間結合、X2は原子間結合、R2はアミノ基で結合したグアニジンであってよい。

[0118] 一態様において、X1は原子間結合、X2は原子間結合、Yは酸素原子(O)、b-cはC=CH、R1はメチル基、R2はアミノ基で結合したグアニジンであってよい。

[0119] 成分(A)のX、Y、n、およびR1~R5として、具体的には、それぞれ、後述する式(化合物1)~(化合物20)、(化合物23)、(化合物26)~(化合物37)、(化合物80)、および(化合物82)~(化合物85)で表される化合物のX、Y、n、およびR1~R5が挙げられる。すなわち、成分(A)のX、Y、n、およびR1~R5は、具体的には、例えば、それぞれ、後述する式(化合物1)~(化合物20)、(化合物23)、(化合物26)~(化合物37)、(化合物80)、および(化合物82)~(化合物85)で表される化合物のX、Y、n、およびR1~R5から選択されてよい。

[0120] 成分（B）の $b-c$ 、 $X1$ 、 $X2$ 、 Y 、 n 、および $R1 \sim R5$ として、具体的には、それぞれ、後述する式（化合物1）～（化合物20）、（化合物23）、（化合物26）～（化合物80）、および（化合物82）～（化合物90）で表される化合物の $b-c$ 、 $X1$ 、 $X2$ 、 Y 、 n 、および $R1 \sim R5$ が挙げられる。すなわち、成分（B）の $b-c$ 、 $X1$ 、 $X2$ 、 Y 、 n 、および $R1 \sim R5$ は、具体的には、例えば、それぞれ、後述する式（化合物1）～（化合物20）、（化合物23）、（化合物26）～（化合物80）、および（化合物82）～（化合物90）で表される化合物の $b-c$ 、 $X1$ 、 $X2$ 、 Y 、 n 、および $R1 \sim R5$ から選択されてよい。

[0121] 成分（A）または（B）として、具体的には、後述する式（化合物1）～（化合物20）、（化合物23）、（化合物26）～（化合物80）、および（化合物82）～（化合物90）で表される化合物が挙げられる。成分（A）または（B）としては、特に、後述する式（化合物1）～（化合物20）、（化合物23）、（化合物26）～（化合物61）、（化合物65）～（化合物80）、および（化合物83）～（化合物90）で表される化合物が挙げられる。成分（A）または（B）としては、さらに特には、後述する式（化合物1）～（化合物8）、（化合物27）～（化合物30）、（化合物38）～（化合物56）、および（化合物66）～（化合物77）で表される化合物が挙げられる。式（化合物1）～（化合物20）、（化合物23）、（化合物26）～（化合物37）、（化合物80）、および（化合物82）～（化合物85）で表される化合物は、いずれも、成分（A）または（B）の一例であり得る。式（化合物38）～（化合物79）および（化合物86）～（化合物90）で表される化合物は、いずれも、成分（B）の一例であり得る。一態様において、成分（A）からは、式（化合物85）で表される化合物が除外されてもよい。一態様において、成分（B）からは、式（化合物41）、（化合物50）、（化合物52）、（化合物54）、（化合物55）、（化合物58）、（化合物65）、（化合物77）、（化合物85）、（化合物86）、（化合物87）、および（化合物90）で表される

化合物が除外されてもよい。すなわち、一態様において、成分（Ａ）または（Ｂ）として、具体的には、式（化合物１）～（化合物２０）、（化合物２３）、（化合物２６）～（化合物４０）、（化合物４２）～（化合物４９）、（化合物５１）、（化合物５３）、（化合物５６）、（化合物５７）、（化合物５９）～（化合物６４）、（化合物６６）～（化合物７６）、（化合物７８）～（化合物８０）、（化合物８２）～（化合物８４）、（化合物８８）、および（化合物８９）で表される化合物が挙げられる。一態様において、成分（Ｂ）からは、式（化合物４１）、（化合物５０）、（化合物５２）、（化合物５４）、（化合物５５）、および（化合物７７）で表される化合物が除外されてもよい。すなわち、一態様において、成分（Ａ）または（Ｂ）として、具体的には、式（化合物１）～（化合物２０）、（化合物２３）、（化合物２６）～（化合物４０）、（化合物４２）～（化合物４９）、（化合物５１）、（化合物５３）、（化合物５６）～（化合物７６）、（化合物７８）～（化合物８０）、および（化合物８２）～（化合物９０）で表される化合物が挙げられる。

[0122] 成分（Ａ）または（Ｂ）が塩を形成し得る場合、成分（Ａ）または（Ｂ）は、フリー体として使用されてもよく、塩として使用されてもよく、それらの組み合わせとして使用されてもよい。すなわち、「成分（Ａ）」という用語は、特記しない限り、フリー体の成分（Ａ）、もしくはその塩、またはそれらの組み合わせを意味してよい。また、「成分（Ｂ）」という用語は、特記しない限り、フリー体の成分（Ｂ）、もしくはその塩、またはそれらの組み合わせを意味してよい。塩は、本発明の効果を損なわないものであれば、特に制限されない。例えば、カルボキシル基等の酸性基に対する塩としては、アンモニウム塩、ナトリウム、カリウム等のアルカリ金属との塩、カルシウム、マグネシウム等のアルカリ土類金属との塩、アルミニウム塩、亜鉛塩、トリエチルアミン、エタノールアミン、モルホリン、ピロリジン、ピペリジン、ピペラジン、ジシクロヘキシルアミン等の有機アミンとの塩、アルギニン、リジン等の塩基性アミノ酸との塩が挙げられる。また、アミノ基等の

塩基性基に対する塩としては、塩酸、硫酸、リン酸、硝酸、臭化水素酸等の無機酸との塩、蟻酸、酢酸、クエン酸、安息香酸、マレイン酸、フマル酸、酒石酸、コハク酸、タンニン酸、酪酸、ヒベンズ酸、パモ酸、エナント酸、デカン酸、テオクル酸、サリチル酸、乳酸、シュウ酸、マンデル酸、リンゴ酸、それらのハロゲン化物等の有機カルボン酸との塩、メタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸等の有機スルホン酸との塩が挙げられる。ハロゲン化物としては、ヘプタフルオロ酪酸が挙げられる。塩としては、1種の塩を用いてもよく、2種またはそれ以上の塩を組み合わせで用いてもよい。

[0123] また、成分（A）または（B）が水和物を形成し得る場合、成分（A）または（B）は、非水和物として使用されてもよく、水和物として使用されてもよく、それらの組み合わせとして使用されてもよい。すなわち、「成分（A）」という用語（例えば、「フリー体の成分（A）」や「成分（A）の塩」）は、特記しない限り、非水和物および水和物を包含してよい。また、「成分（B）」という用語（例えば、「フリー体の成分（B）」や「成分（B）の塩」）は、特記しない限り、非水和物および水和物を包含してよい。

[0124] 成分（A）または（B）は、使用時にはイオン等のいずれの形態をとっていてもよい。

[0125] 成分（A）または（B）としては、1種の物質を用いてもよく、2種またはそれ以上の物質を組み合わせで用いてもよい。成分（A）または（B）として2種またはそれ以上の成分が選択される場合、成分（A）または（B）の「量」または「濃度」とは、特記しない限り、選択された成分の総量または総濃度を意味してよい。

[0126] 成分（A）または（B）としては、市販品を用いてもよく、適宜製造して取得したものを用いてもよい。成分（A）または（B）の製造方法は特に制限されない。成分（A）または（B）は、例えば、公知の方法により製造することができる。成分（A）または（B）は、具体的には、例えば、化学合成、酵素反応、発酵法、抽出法、またはそれらの組み合わせにより製造する

ことができる。成分（A）または（B）は、所望の程度に精製されていてもよく、そうでなくてもよい。すなわち、成分（A）または（B）としては、精製品を用いてもよく、成分（A）または（B）を含有する素材を用いてもよい。成分（A）または（B）を含有する素材として、具体的には、例えば、当該成分（A）または（B）の生産能を有する微生物を培養して得られた培養液、菌体、培養上清等の発酵生産物、当該成分（A）または（B）を含有する農水畜産物、およびそれらの加工品が挙げられる。加工品としては、上記のような発酵生産物等の素材を、濃縮、希釈、乾燥、分画、抽出、精製等の処理に供したものが挙げられる。成分（A）または（B）としては、例えば、成分（A）または（B）の含有量が1%（w/w）以上、5%（w/w）以上、10%（w/w）以上、30%（w/w）以上、50%（w/w）以上、70%（w/w）以上、90%（w/w）以上、または95%（w/w）以上の素材を用いてもよい。

[0127] 成分（C）は、アミノ酸発酵副生物である。

[0128] 「アミノ酸発酵副生物」とは、アミノ酸発酵液からアミノ酸を分離した後に残る液体（「アミノ酸発酵副生液」ともいう）、その濃縮物、およびそれらの分画物の総称である。濃縮物は、例えば、液体（すなわち濃縮液）であってもよく、固体（すなわち乾固物）であってもよい。分画物は、後述するような有効成分の機能を有する画分を含む限り、特に制限されない。なお、「濃縮物の分画物」の用語は、「分画物の濃縮物」の用語と代替可能に用いられてよい。

[0129] 「アミノ酸発酵液」とは、アミノ酸を含有する培養液を意味する。

[0130] アミノ酸発酵副生物およびアミノ酸発酵液についてのアミノ酸としては、リジン、トリプトファン、スレオニン、バリン、ロイシン、イソロイシンが挙げられる。アミノ酸発酵副生物およびアミノ酸発酵液についてのアミノ酸は、いずれも、L-アミノ酸であってもよい。アミノ酸発酵液から分離されるアミノ酸は、いずれも、フリー体のアミノ酸、その塩、またはそれらの組み合わせであってもよい。

[0131] アミノ酸発酵液は、アミノ酸生産能を有する微生物を培養することにより得られる。

[0132] 「アミノ酸生産能を有する微生物」とは、培地で培養したときに、目的とするアミノ酸を生成し、分離できる程度に培地中に蓄積する能力を有する微生物を意味してよい。

[0133] 微生物としては、細菌が挙げられる。細菌としては、腸内細菌科 (Enterobacteriaceae) に属する細菌やコリネ型細菌が挙げられる。腸内細菌科に属する細菌としては、エシェリヒア・コリ (*Escherichia coli*) 等のエシェリヒア (*Escherichia*) 属細菌やパントエア・アナナティス (*Pantoea ananatis*) 等のパントエア (*Pantoea*) 属細菌が挙げられる。コリネ型細菌としては、コリネバクテリウム・グルタミカム (*Corynebacterium glutamicum*) 等のコリネバクテリウム (*Corynebacterium*) 属細菌が挙げられる。

[0134] アミノ酸生産能を有する微生物は、本来的にアミノ酸生産能を有するものであってもよく、アミノ酸生産能を有するように改変されたものであってもよい。アミノ酸生産能を有する微生物は、例えば、微生物にアミノ酸生産能を付与することにより、または、微生物のアミノ酸生産能を増強することにより、取得できる。アミノ酸生産能（具体的にはL-アミノ酸生産能）の付与または増強は、例えば、従来、アミノ酸生産菌の育種に採用されてきた方法により実施することができる（アミノ酸発酵、（株）学会出版センター、1986年5月30日初版発行、第77～100頁参照）。また、アミノ酸生産能（具体的にはL-アミノ酸生産能）を付与または増強する方法は、例えば、US2018-0282773およびW02018/030507に開示されている。

[0135] 以下、L-アミノ酸生産菌、およびL-アミノ酸生産能を付与又は増強する方法について具体的に例示する。なお、以下に例示するようなL-アミノ酸生産菌が有する性質およびL-アミノ酸生産能を付与又は増強するための改変は、いずれも、単独で用いてもよく、適宜組み合わせて用いてもよい。

[0136] <L-スレオニン生産菌>

L-スレオニン生産能を付与又は増強するための方法としては、例えば、

レースレオニン生合成系酵素から選択される1種またはそれ以上の酵素の活性が増大するように細菌を改変する方法が挙げられる。そのような酵素としては、特に制限されないが、アスパルトキナーゼIII (lysC)、アスパラギン酸セミアルデヒドデヒドロゲナーゼ (asd)、アスパルトキナーゼI (thrA)、ホモセリンキナーゼ (homoserine kinase) (thrB)、スレオニンシンターゼ (threonine synthase) (thrC)、アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ (アスパラギン酸トランスアミナーゼ) (aspC) が挙げられる。これらの酵素の中では、アスパルトキナーゼIII、アスパラギン酸セミアルデヒドデヒドロゲナーゼ、アスパルトキナーゼI、ホモセリンキナーゼ、アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ、及びスレオニンシンターゼから選択される1種またはそれ以上の酵素の活性を増強するのが好ましい。レースレオニン生合成系遺伝子は、スレオニン分解が抑制された株に導入してもよい。スレオニン分解が抑制された株としては、例えば、スレオニンデヒドロゲナーゼ活性が欠損した*E. coli* TDH6株 (特開2001-346578) が挙げられる。

[0137] レースレオニン生合成系酵素の活性は、最終産物のレースレオニンによって阻害される。従って、レースレオニン生産菌を構築するためには、レースレオニンによるフィードバック阻害を受けないようにレースレオニン生合成系遺伝子を改変するのが好ましい。上記thrA、thrB、thrC遺伝子は、スレオニンオペロンを構成しており、スレオニンオペロンは、アテニュエーター構造を形成している。スレオニンオペロンの発現は、培養液中のイソロイシン、スレオニンに阻害を受け、アテニュエーションにより抑制される。スレオニンオペロンの発現の増強は、アテニュエーション領域のリーダー配列あるいはアテニュエーターを除去することにより達成できる (Lynn, S. P., Burton, W. S., Donohue, T. J., Gould, R. M., Gumpert, R. I., and Gardner, J. F. J. *Mol. Biol.* 194:59-69 (1987); W002/26993; W02005/049808; W02003/097839)。

[0138] スレオニンオペロンの上流には固有のプロモーターが存在するが、同プロモーターを非天然のプロモーターに置換してもよい (W098/04715)。また、

スレオニン生合成関与遺伝子がラムダファージのリプレッサーおよびプロモーターの制御下で発現するようにスレオニンオペロンを構築してもよい (EP0593792B)。また、L-スレオニンによるフィードバック阻害を受けないように改変された細菌は、L-スレオニンアナログである α -amino- β -hydroxyvaleric acid (AHV) に耐性な菌株を選抜することによっても取得できる。

[0139] このようにL-スレオニンによるフィードバック阻害を受けないように改変されたスレオニンオペロンは、コピー数の上昇により、あるいは強力なプロモーターに連結されることにより、宿主内での発現量が向上しているのが好ましい。コピー数の上昇は、スレオニンオペロンを含むプラスミドを宿主に導入することにより達成できる。また、コピー数の上昇は、トランスポゾン、Muファージ等を利用して、宿主のゲノム上にスレオニンオペロンを転移させることによっても達成できる。

[0140] また、L-スレオニン生産能を付与又は増強する方法としては、宿主にL-スレオニン耐性を付与する方法やL-ホモセリン耐性を付与する方法も挙げられる。耐性の付与は、例えば、L-スレオニンに耐性を付与する遺伝子、L-ホモセリンに耐性を付与する遺伝子の発現を強化することにより達成できる。耐性を付与する遺伝子としては、rhtA遺伝子 (Res. Microbiol. 154:123-135 (2003))、rhtB遺伝子 (EP0994190A)、rhtC遺伝子 (EP1013765A)、yfiK遺伝子、yeaS遺伝子 (EP1016710A) が挙げられる。また、宿主にL-スレオニン耐性を付与する方法は、EP0994190AやW090/04636に記載の方法を参照出来る。

[0141] L-スレオニン生産菌又はそれを誘導するための親株として、具体的には、例えば、E. coli TDH-6/pVIC40 (VKPM B-3996; 米国特許第5,175,107号, 米国特許第5,705,371号)、E. coli 472T23/pYN7 (ATCC 98081; 米国特許第5,631,157号)、E. coli NRRL B-21593 (米国特許第5,939,307号)、E. coli FERM BP-3756 (米国特許第5,474,918号)、E. coli FERM BP-3519及びFERM BP-3520 (米国特許第5,376,538号)、E. coli MG442 (Gusyatiner et al., Genetika (in Russian), 14, 947-956 (1978))、E. coli VL643及びVL2055 (E

P1149911A)、ならびにE. coli VKPM B-5318 (EP0593792B) が挙げられる。

[0142] VKPM B-3996株は、TDH-6株に、プラスミドpVIC40を導入した株である。TDH-6株は、スクロース資化性であり、thrC遺伝子を欠損し、ilvA遺伝子にリーキー (leaky) 変異を有する。また、TDH-6株は、rhtA遺伝子に、高濃度のスレオニンまたはホモセリンに対する耐性を付与する変異を有する。プラスミドpVIC40は、RSF1010由来ベクターに、スレオニンによるフィードバック阻害に耐性のアスパルトキナーゼホモセリンデヒドロゲナーゼIをコードする変異型thrA遺伝子と野生型thrBC遺伝子を含むthrA*BCオペロンが挿入されたプラスミドである (米国特許第5,705,371号)。この変異型thrA遺伝子は、スレオニンによるフィードバック阻害が実質的に解除されたアスパルトキナーゼホモセリンデヒドロゲナーゼIをコードする。B-3996株は、1987年11月19日、オールユニオン・サイエンティフィック・センター・オブ・アンチビオティクス (Nagatinskaya Street 3-A, 117105 Moscow, Russia) に、受託番号RIA 1867で寄託されている。この株は、また、1987年4月7日、ルシアン・ナショナル・コレクション・オブ・インダストリアル・マイクロオルガニズムズ (VKPM) (FGUP GosNII Genetika, 1 Dorozhny proezd., 1 Moscow 117545, Russia) に、受託番号VKPM B-3996で寄託されている。

[0143] VKPM B-5318株は、イソロイシン非要求性であり、プラスミドpVIC40中のスレオニンオペロンの制御領域を温度感受性ラムダファージC1リプレッサー及びPRプロモーターにより置換したプラスミドpPRT614を保持する。VKPM B-5318は、1990年5月3日、ルシアン・ナショナル・コレクション・オブ・インダストリアル・マイクロオルガニズムズ (VKPM) (FGUP GosNII Genetika, 1 Dorozhny proezd., 1 Moscow 117545, Russia) に、受託番号VKPM B-5318で国際寄託されている。

[0144] E. coliのアスパルトキナーゼホモセリンデヒドロゲナーゼIをコードするthrA遺伝子は明らかにされている (ヌクレオチド番号337~2799, GenBank accession NC_000913.2, gi: 49175990)。thrA遺伝子は、E. coli K-12の染色体において、thrL遺伝子とthrB遺伝子との間に位置する。Escherichia coli

のホモセリンキナーゼをコードするthrB遺伝子は明らかにされている（ヌクレオチド番号2801～3733, GenBank accession NC_000913.2, gi: 49175990）。thrB遺伝子は、E. coli K-12の染色体において、thrA遺伝子とthrC遺伝子との間に位置する。E. coliのスレオニンシンターゼをコードするthrC遺伝子は明らかにされている（ヌクレオチド番号3734～5020, GenBank accession NC_000913.2, gi: 49175990）。thrC遺伝子は、E. coli K-12の染色体において、thrB遺伝子とyaaXオープンリーディングフレームとの間に位置する。また、スレオニンによるフィードバック阻害に耐性のアスパルトキナーゼホモセリンデヒドロゲナーゼIをコードする変異型thrA遺伝子と野生型thrBC遺伝子を含むthrA*BCオペロンは、スレオニン生産株E. coli VKPM B-3996に存在する周知のプラスミドpVIC40（米国特許第5,705,371号）から取得できる。

[0145] E. coliのrhtA遺伝子は、グルタミン輸送系の要素をコードするglnHPQ オペロンに近いE. coli染色体の18分に存在する。rhtA遺伝子は、ORF1（ybiF遺伝子, ヌクレオチド番号764～1651, GenBank accession number AAA218541, gi:440181）と同一であり、pexB遺伝子とompX遺伝子との間に位置する。ORF1によりコードされるタンパク質を発現するユニットは、rhtA遺伝子と呼ばれている（rht: resistant to homoserine and threonine（ホモセリン及びスレオニンに耐性））。また、高濃度のスレオニン又はホモセリンへの耐性を付与するrhtA23変異が、ATG開始コドンに対して-1位のG→A置換であることが判明している（ABSTRACTS of the 17th International Congress of Biochemistry and Molecular Biology in conjunction with Annual Meeting of the American Society for Biochemistry and Molecular Biology, San Francisco, California August 24-29, 1997, abstract No. 457, EP1013765A）。

[0146] E. coliのasd遺伝子は既に明らかにされており（ヌクレオチド番号3572511～3571408, GenBank accession NC_000913.1, gi:16131307）、その遺伝子の塩基配列に基づいて作製されたプライマーを用いるPCRにより取得できる（White, T.J. et al., Trends Genet., 5, 185 (1989)）。他の微生物のasd遺伝子も同様に得ることができる。

[0147] また、*E. coli*の*aspC*遺伝子も既に明らかにされており（ヌクレオチド番号 983742～984932, GenBank accession NC_000913.1, gi:16128895）、その遺伝子の塩基配列に基づいて作製されたプライマーを用いるPCRにより得ることができる。他の微生物の*aspC*遺伝子も同様に得ることができる。

[0148] また、*L*-スレオニン生産能を有するコリネ型細菌としては、例えば、*Corynebacterium acetoacidophilum* AJ12318 (FERM BP-1172 ; 米国特許第5,188,949号) が挙げられる。

[0149] <*L*-リジン生産菌>

L-リジン生産能を付与又は増強するための方法としては、例えば、*L*-リジン生合成系酵素から選択される1種またはそれ以上の酵素の活性が増大するように細菌を改変する方法が挙げられる。そのような酵素としては、特に制限されないが、ジヒドロジピコリン酸シンターゼ (dihydrodipicolinate synthase) (*dapA*)、アスパルトキナーゼIII (aspartokinase III) (*lysC*)、ジヒドロジピコリン酸レダクターゼ (dihydrodipicolinate reductase) (*dapB*)、ジアミノピメリン酸デカルボキシラーゼ (diaminopimelate decarboxylase) (*lysA*)、ジアミノピメリン酸デヒドロゲナーゼ (diaminopimelate dehydrogenase) (*ddh*) (米国特許第6,040,160号)、ホスホエノールピルビン酸カルボキシラーゼ (phosphoenolpyruvate carboxylase) (*ppc*)、アスパラギン酸セミアルデヒドデヒドロゲナーゼ (aspartate semialdehyde dehydrogenase) (*asd*)、アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ (aspartate aminotransferase) (アスパラギン酸トランスアミナーゼ (aspartate transaminase)) (*aspC*)、ジアミノピメリン酸エピメラーゼ (diaminopimelate epimerase) (*dapF*)、テトラヒドロジピコリン酸スクシニラーゼ (tetrahydrodipicolinate succinylase) (*dapD*)、スクシニルジアミノピメリン酸デアシラーゼ (succinyl-diaminopimelate deacylase) (*dapE*)、及びアスパルターゼ (aspartase) (*aspA*) (EP 1253195 A) が挙げられる。これらの酵素の中では、例えば、ジヒドロジピコリン酸レダクターゼ、ジアミノピメリン酸デカルボキシラーゼ、ジアミノピメリン酸デヒドロゲナーゼ、ホス

ホエノールピルビン酸カルボキシラーゼ、アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ、ジアミノピメリン酸エピメラーゼ、アスパラギン酸セミアルデヒドデヒドロゲナーゼ、テトラヒドロジピコリン酸スクシニラーゼ、及びスクシニルジアミノピメリン酸デアシラーゼから選択される1種またはそれ以上の酵素の活性を増強するのが好ましい。また、L-リジン生産菌又はそれを誘導するための親株では、エネルギー効率に関与する遺伝子(cyo) (EP 117 0376 A)、ニコチンアミドヌクレオチドトランスヒドロゲナーゼ(nicotinamide nucleotide transhydrogenase)をコードする遺伝子(pntAB) (米国特許第5,830,716号)、ybjE遺伝子(WO2005/073390)、またはこれらの組み合わせの発現レベルが増大していてもよい。アスパルトキナーゼIII(lysC)はL-リジンによるフィードバック阻害を受けるので、同酵素の活性を増強するには、L-リジンによるフィードバック阻害が解除されたアスパルトキナーゼIIIをコードする変異型lysC遺伝子を利用してもよい(米国特許第5,932,453号)。L-リジンによるフィードバック阻害が解除されたアスパルトキナーゼIIIとしては、318位のメチオニン残基がイソロイシン残基に置換される変異、323位のグリシン残基がアスパラギン酸残基に置換される変異、352位のスレオニン残基がイソロイシン残基に置換される変異の1またはそれ以上の変異を有するエシェリヒア・コリ由来のアスパルトキナーゼIIIが挙げられる(米国特許第5,661,012号、米国特許第6,040,160号)。また、ジヒドロジピコリン酸合成酵素(dapA)はL-リジンによるフィードバック阻害を受けるので、同酵素の活性を増強するには、L-リジンによるフィードバック阻害が解除されたジヒドロジピコリン酸合成酵素をコードする変異型dapA遺伝子を利用してもよい。L-リジンによるフィードバック阻害が解除されたジヒドロジピコリン酸合成酵素としては、118位のヒスチジン残基がチロシン残基に置換される変異を有するエシェリヒア・コリ由来のジヒドロジピコリン酸合成酵素が挙げられる(米国特許第6,040,160号)。

[0150] また、L-リジン生産能を付与又は増強するための方法としては、例えば、L-リジンの生合成経路から分岐してL-リジン以外の化合物を生成する

反応を触媒する酵素から選択される1種またはそれ以上の酵素の活性が低下するように細菌を改変する方法も挙げられる。そのような酵素としては、特に制限されないが、ホモセリンデヒドロゲナーゼ (homoserine dehydrogenase)、リジンデカルボキシラーゼ (lysine decarboxylase) (米国特許第5,827,698号)、及びリンゴ酸酵素 (malic enzyme) (W02005/010175) が挙げられる。

[0151] また、コリネ型細菌について、L-リジン生産能を付与又は増強するための方法としては、例えば、リジン排出系 (lysE) の活性が増大するように細菌を改変する方法が挙げられる (W097/23597)。Corynebacterium glutamicum ATCC 13032のlysE遺伝子は、NCBIデータベースにGenBank accession NC_006958 (VERSION NC_006958.1 GI:62388892) として登録されているゲノム配列中、1329712~1330413位の配列の相補配列に相当する。Corynebacterium glutamicum ATCC13032のLysEタンパク質は、GenBank accession YP_225551 (YP_225551.1 GI:62390149) として登録されている。

[0152] また、L-リジン生産菌又はそれを誘導するための親株としては、L-リジンアナログに耐性を有する変異株が挙げられる。L-リジンアナログは腸内細菌科の細菌やコリネ型細菌等の細菌の生育を阻害するが、この阻害は、L-リジンが培地に共存するときには完全にまたは部分的に解除される。L-リジンアナログとしては、特に制限されないが、オキサリジン、リジンヒドロキサメート、S-(2-アミノエチル)-L-システイン (AEC)、 γ -メチルリジン、 α -クロロカプロラクタムが挙げられる。これらのリジンアナログに対して耐性を有する変異株は、細菌を通常の人工変異処理に付すことによって得ることができる。

[0153] L-リジン生産菌又はそれを誘導するための親株として、具体的には、例えば、E. coli AJ11442 (FERM BP-1543, NRRL B-12185; 米国特許第4,346,170号) 及びE. coli VL611が挙げられる。これらの株では、アスパルトキナーゼのL-リジンによるフィードバック阻害が解除されている。

[0154] L-リジン生産菌又はそれを誘導するための親株として、具体的には、E.

coli WC196株も挙げられる。WC196株は、E. coli K-12に由来するW3110株にAEC耐性を付与することにより育種された（米国特許第5,827,698号）。WC196株は、E. coli AJ13069と命名され、1994年12月6日に、工業技術院生命工学工業技術研究所（現、独立行政法人製品評価技術基盤機構 特許生物寄託センター、郵便番号：292-0818、住所：日本国千葉県木更津市かずさ鎌足2-5-8 120号室）に受託番号FERM P-14690として寄託され、1995年9月29日にブダペスト条約に基づく国際寄託に移管され、受託番号FERM BP-5252が付与されている（米国特許第5,827,698号）。

[0155] 好ましいL-リジン生産菌として、E. coli WC196 Δ cadA Δ ldcやE. coli WC196 Δ cadA Δ ldc/pCABD2が挙げられる（WO2010/061890）。WC196 Δ cadA Δ ldcは、WC196株より、リジンデカルボキシラーゼをコードするcadA及びldcC遺伝子を破壊することにより構築した株である。WC196 Δ cadA Δ ldc/pCABD2は、WC196 Δ cadA Δ ldcに、リジン生合成系遺伝子を含むプラスミドpCABD2（米国特許第6,040,160号）を導入することにより構築した株である。WC196 Δ cadA Δ ldcは、AJ110692と命名され、2008年10月7日に、独立行政法人産業技術総合研究所 特許生物寄託センター（現、独立行政法人製品評価技術基盤機構 特許生物寄託センター、郵便番号：292-0818、住所：日本国千葉県木更津市かずさ鎌足2-5-8 120号室）に受託番号FERM BP-11027として国際寄託された。pCABD2は、L-リジンによるフィードバック阻害が解除される変異（H118Y）を有するエシェリヒア・コリ由来のジヒドロジピコリン酸合成酵素（DDPS）をコードする変異型dapA遺伝子と、L-リジンによるフィードバック阻害が解除される変異（T352I）を有するエシェリヒア・コリ由来のアスパルトキナーゼIIIをコードする変異型lysC遺伝子と、エシェリヒア・コリ由来のジヒドロジピコリン酸レダクターゼをコードするdapB遺伝子と、ブレヴィバクテリウム・ラクトファーマンタム由来ジアミノピメリン酸デヒドロゲナーゼをコードするddh遺伝子を含んでいる。

[0156] 好ましいL-リジン生産菌として、E. coli AJIK01株（NITE BP-01520）も挙げられる。AJIK01株は、E. coli AJ111046と命名され、2013年1月29日に、

独立行政法人製品評価技術基盤機構 特許微生物寄託センター（郵便番号：292-0818、住所：日本国千葉県木更津市かずさ鎌足2-5-8 122号室）に寄託され、2014年5月15日にブダペスト条約に基づく国際寄託に移管され、受託番号 NITE BP-01520が付与されている。

[0157] また、L-ロイシン生産能を有するコリネ型細菌としては、例えば、AEC耐性変異株 (*Corynebacterium glutamicum* (*Brevibacterium lactofermentum*) AJ 11082 (NRRL B-11470) 株等；特公昭56-1914、特公昭56-1915、特公昭57-14157、特公昭57-14158、特公昭57-30474、特公昭58-10075、特公昭59-4993、特公昭61-35840、特公昭62-24074、特公昭62-36673、特公平5-11958、特公平7-112437、特公平7-112438)；その生育にL-ホモセリン等のアミノ酸を必要とする変異株（特公昭48-28078、特公昭56-6499）；AECに耐性を示し、更にL-ロイシン、L-ホモセリン、L-プロリン、L-セリン、L-アルギニン、L-アラニン、L-バリン等のアミノ酸を要求する変異株（米国特許第3,708,395号，米国特許第3,825,472号）；D L- α -アミノ- ϵ -カプロラクタム、 α -アミノ- γ -グルタラム、アスパラギン酸アナログ、スルファ剤、キノイド、N-ラウロイルロイシンに耐性を示す変異株；オキザロ酢酸デカルボキシラーゼ阻害剤または呼吸系酵素阻害剤に対する耐性を示す変異株（特開昭50-53588、特開昭50-31093、特開昭52-102498、特開昭53-9394、特開昭53-86089、特開昭55-9783、特開昭55-9759、特開昭56-32995、特開昭56-39778、特公昭53-43591、特公昭53-1833）；イノシトールまたは酢酸を要求する変異株（特開昭55-9784、特開昭56-8692）；フルオロピルビン酸または34℃以上の温度に対して感受性を示す変異株（特開昭55-9783、特開昭53-86090）；エチレングリコールに耐性を示す変異株（米国特許第4,411,997号）が挙げられる。

[0158] <L-ロイシン生産菌>

L-ロイシン生産能を付与又は増強するための方法としては、例えば、L-ロイシン生合成系酵素から選択される1種またはそれ以上の酵素の活性が増大するように細菌を改変する方法が挙げられる。そのような酵素としては

、特に制限されないが、*leuABCD*オペロンの遺伝子にコードされる酵素が挙げられる。また、酵素活性の増強には、例えば、*L*-ロイシンによるフィードバック阻害が解除されたイソプロピルマレートシンターゼをコードする変異*leuA*遺伝子（米国特許第6,403,342号）が好適に利用できる。

[0159] *L*-ロイシン生産菌又はそれを誘導するための親株として、具体的には、例えば、ロイシン耐性の*E. coli*株（例えば、57株（VKPM B-7386；米国特許第6,124,121号））、 β -2-チエニルアラニン、3-ヒドロキシロイシン、4-アザロイシン、5,5,5-トリフルオロロイシン等のロイシンアナログに耐性の*E. coli*株（特公昭62-34397及び特開平8-70879）、W096/06926に記載された遺伝子工学的方法で得られた*E. coli*株、*E. coli* H-9068（特開平8-70879）等のエシェリヒア属に属する株が挙げられる。

[0160] *L*-ロイシン生産能を有するコリネ型細菌としては、例えば、2-チアゾールアラニン及び β -ヒドロキシロイシンに耐性で、且つイソロイシン及びメチオニン要求性である、*Corynebacterium glutamicum* (*Brevibacterium lactofermentum*) AJ3718 (FERM P-2516) が挙げられる。

[0161] <*L*-イソロイシン生産菌>

L-イソロイシン生産能を付与又は増強するための方法としては、例えば、*L*-イソロイシン生合成系酵素から選択される1種またはそれ以上の酵素の活性が増大するように細菌を改変する方法が挙げられる。そのような酵素としては、特に制限されないが、スレオニンデアミナーゼやアセトヒドロキシ酸シンターゼが挙げられる（特開平2-458, EP0356739A, 米国特許第5,998,178号）。

[0162] *L*-イソロイシン生産菌又はそれを誘導するための親株として、具体的には、例えば、6-ジメチルアミノプリンに耐性を有する変異株（特開平5-304969）、チアイソロイシン、イソロイシンヒドロキサメート等のイソロイシンアナログに耐性を有する変異株、イソロイシンアナログに加えてD-*L*-エチオニン及び／またはアルギニンヒドロキサメートに耐性を有する変異株（特開平5-130882号）等のエシェリヒア属細菌が挙げられる。

[0163] L-イソロイシン生産能を有するコリネ型細菌としては、例えば、分岐鎖アミノ酸排出タンパク質をコードするbrnE遺伝子を増幅したコリネ型細菌（特開2001-169788）、L-リジン生産菌とのプロトプラスト融合によりL-イソロイシン生産能を付与したコリネ型細菌（特開昭62-74293）、ホモセリンデヒドロゲナーゼを強化したコリネ型細菌（特開昭62-91193）、スレオニンハイドロキサメート耐性株（特開昭62-195293）、 α -ケトマロン耐性株（特開昭61-15695）、メチルリジン耐性株（特開昭61-15696）、*Corynebacterium glutamicum* (*Brevibacterium flavum*) AJ12149 (FERM BP-759；米国特許第4,656,135号）が挙げられる。

[0164] <L-バリン生産菌>

L-バリン生産能を付与又は増強するための方法としては、例えば、L-バリン生合成系酵素から選択される1種またはそれ以上の酵素の活性が増大するように細菌を改変する方法が挙げられる。そのような酵素としては、特に制限されないが、ilvGMEDAオペロンやilvBNCオペロンの遺伝子にコードされる酵素が挙げられる。ilvBNはアセトヒドロキシ酸シンターゼを、ilvCはイソメロリダクターゼ（W000/50624）を、それぞれコードする。なお、ilvGMEDAオペロンおよびilvBNCオペロンは、L-バリン、L-イソロイシン、および／またはL-ロイシンによる発現抑制（アテニュエーション）を受ける。よって、酵素活性の増強のためには、アテニュエーションに必要な領域を除去または改変し、生成するL-バリンによる発現抑制を解除するのが好ましい。また、ilvA遺伝子がコードするスレオニンデアミナーゼは、L-イソロイシン生合成系の律速段階であるL-スレオニンから2-ケト酪酸への脱アミノ化反応を触媒する酵素である。よって、L-バリン生産のためには、ilvA遺伝子が破壊等され、スレオニンデアミナーゼ活性が減少しているのが好ましい。

[0165] また、L-バリン生産能を付与又は増強するための方法としては、例えば、L-バリンの生合成経路から分岐してL-バリン以外の化合物を生成する反応を触媒する酵素から選択される1種またはそれ以上の酵素の活性が低下

するように細菌を改変する方法も挙げられる。そのような酵素としては、特に制限されないが、L-ロイシン合成に関与するスレオニンデヒドラターゼやD-パントテン酸合成に関与する酵素が挙げられる（W000/50624）。

[0166] L-バリン生産菌又はそれを誘導するための親株として、具体的には、例えば、ilvGMEDAオペロンを過剰発現するように改変されたE. coli株（米国特許第5,998,178号）が挙げられる。

[0167] また、L-バリン生産菌又はそれを誘導するための親株としては、アミノアシルt-RNAシンテターゼに変異を有する株（米国特許第5,658,766号）も挙げられる。そのような株としては、例えば、イソロイシンtRNAシンテターゼをコードするileS遺伝子に変異を有するE. coli VL1970が挙げられる。E. coli VL1970は、1988年6月24日、ルシアン・ナショナル・コレクション・オブ・インダストリアル・マイクロオルガニズムズ（VKPM）（FGUP GosNII Genetika, 1 Dorozhny proezd., 1 Moscow 117545, Russia）に、受託番号VKPM B-4411で寄託されている。また、L-バリン生産菌又はそれを誘導するための親株としては、生育にリボ酸を要求する、および／または、H⁺-ATPaseを欠失している変異株（W096/06926）も挙げられる。

[0168] また、L-バリン生産菌又はそれを誘導するための親株としては、アミノ酸アナログなどへの耐性を有する株も挙げられる。そのような株としては、例えば、L-イソロイシンおよびL-メチオニン要求性、ならびにD-リボース、プリンリボヌクレオシド、またはピリミジンリボヌクレオシドに耐性を有し、且つL-バリン生産能を有するコリネ型細菌株（FERM P-1841、FERM P-29）（特公昭53-025034）、ポリケトイド類に耐性を有するコリネ型細菌株（FERM P-1763、FERM P-1764）（特公平06-065314）、酢酸を唯一の炭素源とする培地でL-バリン耐性を示し、且つグルコースを唯一の炭素源とする培地でピルビン酸アナログ（フルオロピルビン酸等）に感受性を有するコリネ型細菌株（FERM BP-3006、FERM BP-3007）（特許3006929号）が挙げられる。

[0169] <L-トリプトファン生産菌>

Ｌートリプトファン生産能を付与又は増強するための方法としては、例えば、Ｌートリプトファン生合成系酵素から選択される１種またはそれ以上の酵素の活性が増大するように細菌を改変する方法が挙げられる。

[0170] Ｌートリプトファン生合成系酵素としては、特に制限されないが、芳香族アミノ酸に共通する生合成系酵素である、３－デオキシ－Ｄ－アラビノヘプツロン酸－７－リン酸シンターゼ（aroG）、３－デヒドロキネートシンターゼ（aroB）、シキミ酸デヒドロゲナーゼ（aroE）、シキミ酸キナーゼ（aroL）、５－エノールピルビルシキミ酸３－リン酸シンターゼ（aroA）、コリスミ酸シンターゼ（aroC）が挙げられる（EP763127B）。これらの酵素をコードする遺伝子の発現はチロシンリプレッサー（tyrR）によって制御されており、tyrR遺伝子を欠損させることによって、これらの酵素の活性を増強してもよい（EP763127B）。

[0171] Ｌートリプトファン生合成系酵素としては、特に制限されないが、アントラニル酸シンターゼ（trpE）、トリプトファンシンターゼ（trpAB）、及びホスホグリセリン酸デヒドロゲナーゼ（serA）も挙げられる。例えば、トリプトファンオペロンを含むDNAを導入することにより、Ｌートリプトファン生産能を付与又は増強できる。トリプトファンシンターゼは、それぞれtrpA及びtrpB遺伝子によりコードされる α 及び β サブユニットからなる。アントラニル酸シンターゼはＬートリプトファンによるフィードバック阻害を受けるので、同酵素の活性を増強するには、フィードバック阻害を解除する変異を導入した同酵素をコードする遺伝子を利用してもよい。ホスホグリセリン酸デヒドロゲナーゼはＬ－セリンによるフィードバック阻害を受けるので、同酵素の活性を増強するには、フィードバック阻害を解除する変異を導入した同酵素をコードする遺伝子を利用してもよい。さらに、マレートシンターゼ（aceB）、イソクエン酸リアーゼ（aceA）、およびイソクエン酸デヒドロゲナーゼキナーゼ／フォスファターゼ（aceK）からなるオペロン（aceオペロン）の発現を増大させることによりＬートリプトファン生産能を付与又は増強してもよい（W02005/103275）。

- [0172] レートリプトファン生産菌は、レートリプトファン以外の芳香族アミノ酸の生合成が低下するように改変されていてもよい。また、レートリプトファン生産菌は、副生物の取り込み系が増強されるように改変されていてもよい。副生物としては、レートリプトファン以外の芳香族アミノ酸が挙げられる。副生物の取り込み系をコードする遺伝子としては、例えば、*L*-フェニルアラニンの取り込み系をコードする遺伝子である *pheP* や *L*-チロシンの取り込み系をコードする遺伝子である *tyrP* が挙げられる (EP1484410)。
- [0173] レートリプトファン生産菌又はそれを誘導するための親株として、具体的には、例えば、部分的に不活化されたトリプトファニル-*t*RNAシンターゼをコードする変異型 *trpS* 遺伝子を保持する *E. coli* JP4735/pMU3028 (DSM10122) 及び JP6015/pMU91 (DSM10123) (米国特許第5,756,345号)、トリプトファンによるフィードバック阻害を受けないアントラニル酸シンターゼをコードする *trpE* アレルを有する *E. coli* SV164、セリンによるフィードバック阻害を受けないホスホグリセリン酸デヒドロゲナーゼをコードする *serA* アレル及びトリプトファンによるフィードバック阻害を受けないアントラニル酸シンターゼをコードする *trpE* アレルを有する *E. coli* SV164 (pGH5) (米国特許第6,180,373号)、トリプトファンによるフィードバック阻害を受けないアントラニル酸シンターゼをコードする *trpE* アレルを含むトリプトファンオペロンが導入された株 (特開昭57-71397, 特開昭62-244382, 米国特許第4,371,614号)、トリプトファナーゼが欠損した *E. coli* AGX17 (pGX44) (NRRL B-12263) 及び AGX6 (pGX50) *aroP* (NRRL B-12264) (米国特許第4,371,614号)、ホスホエノールピルビン酸生産能が増大した *E. coli* AGX17/pGX50, pACKG4-pps (W09708333, 米国特許第6,319,696号)、*yedA* 遺伝子または *yddG* 遺伝子にコードされるタンパク質の活性が増大したエシェリヒア属に属する株 (US2003-0148473A1 及び US2003-0157667A1) が挙げられる。
- [0174] レートリプトファン生産能を有するコリネ型細菌としては、例えば、サルファグアニジンに耐性の *Corynebacterium glutamicum* AJ12118 (FERM BP-478) (特許第1681002号)、トリプトファンオペロンが導入された株 (特開昭63

-240794)、コリネ型細菌由来のシキミ酸キナーゼをコードする遺伝子が導入された株(特許第1994749号)が挙げられる。

[0175] アミノ酸生産能を有する微生物の培養条件は、アミノ酸生産能を有する微生物が増殖でき、目的のアミノ酸が生産される限り、特に制限されない。培養は、例えば、細菌等の微生物の培養に用いられる通常のことで行うことができる。培養条件は、使用する微生物の種類等の諸条件に応じて適宜設定してよい。

[0176] アミノ酸生産能を有する微生物の培養に使用する培地は、アミノ酸生産能を有する微生物が増殖でき、目的のアミノ酸が生産される限り、特に制限されない。培地としては、例えば、細菌等の微生物の培養に用いられる通常の培地を用いることができる。培地としては、例えば、炭素源、窒素源、リン酸源、硫黄源、その他の各種有機成分や無機成分から選択される成分を必要に応じて含有する培地を用いることができる。培地成分の種類や濃度は、使用する微生物の種類等の諸条件に応じて適宜設定してよい。

[0177] 炭素源として、具体的には、グルコース、フルクトース、ガラクトース、キシロース、アラビノース、スクロース、ラクトース、セロビオース、廃糖蜜、澱粉加水分解物、バイオマス加水分解物等の糖類、酢酸、フマル酸、クエン酸、コハク酸等の有機酸類、グリセロール、粗グリセロール、エタノール等のアルコール類、脂肪酸類が挙げられる。炭素源としては、1種の炭素源を用いてもよく、2種またはそれ以上の炭素源を組み合わせ用いてもよい。

[0178] 窒素源として、具体的には、硫酸アンモニウム、塩化アンモニウム、リン酸アンモニウム等のアンモニウム塩、ペプトン、カザミノ酸、酵母エキス、麦芽エキス、肉エキス、コーンステープリカー、大豆タンパク質分解物等の有機窒素源、アンモニア、ウレアが挙げられる。窒素源としては、1種の窒素源を用いてもよく、2種またはそれ以上の窒素源を組み合わせ用いてもよい。

[0179] リン酸源として、具体的には、リン酸2水素カリウム、リン酸水素2カリ

ウム等のリン酸塩、ピロリン酸等のリン酸ポリマーが挙げられる。リン酸源としては、1種のリン酸源を用いてもよく、2種またはそれ以上のリン酸源を組み合わせ用いてもよい。

[0180] 硫黄源として、具体的には、硫酸塩、チオ硫酸塩、亜硫酸塩等の無機硫黄化合物、システイン、シスチン、グルタチオン等の含硫アミノ酸が挙げられる。硫黄源としては、1種の硫黄源を用いてもよく、2種またはそれ以上の硫黄源を組み合わせ用いてもよい。

[0181] その他の各種有機成分や無機成分として、具体的には、例えば、塩化ナトリウム、塩化カリウム等の無機塩類；鉄、マンガン、マグネシウム、カルシウム等の微量元素類；ビタミンB1、ビタミンB2、ビタミンB6、ニコチン酸、ニコチン酸アミド、ビタミンB12等のビタミン類；アミノ酸類；核酸類；これらを含むペプトン、カザミノ酸、酵母エキス、麦芽エキス、肉エキス、コーンステープリカー、大豆タンパク質分解物等の有機成分が挙げられる。その他の各種有機成分や無機成分としては、1種の成分を用いてもよく、2種またはそれ以上の成分を組み合わせ用いてもよい。

[0182] 培養は、液体培養により（すなわち液体培地で）実施してよい。培養は、例えば、好気条件で実施してよい。「好気条件」とは、液体培養の場合、液体培地中の溶存酸素濃度が、酸素膜電極による検出限界である0.33 ppm以上であることを意味し、好ましくは1.5 ppm以上であることを意味してよい。酸素濃度は、例えば、飽和酸素濃度に対して5～50%、好ましくは10%程度に制御されてもよい。好気条件での培養は、具体的には、例えば、通気培養、振盪培養、攪拌培養、またはそれらの組み合わせで実施してよい。培地のpHは、例えば、pH3～10、好ましくはpH4.0～9.5であってよい。培養中、必要に応じて培地のpHを調整することができる。培地のpHは、アンモニアガス、アンモニア水、炭酸ナトリウム、重炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、重炭酸カリウム、炭酸マグネシウム、水酸化ナトリウム、水酸化カルシウム、水酸化マグネシウム等の各種アルカリ性または酸性物質を用いて調整することができる。培養温度は、例えば、20～40℃、好ましくは25℃～37℃であってよい。

培養期間は、例えば、10時間～120時間であってよい。培養は、例えば、回分培養 (batch culture)、流加培養 (Fed-batch culture)、連続培養 (continuous culture)、またはそれらの組み合わせで実施してよい。また、培養は、前培養と本培養とに分けて実施してもよい。例えば、前培養を寒天培地等の固体培地上で実施し、本培養を液体培地で実施してもよい。培養は、例えば、培地中の炭素源が消費されるまで、あるいはアミノ酸生産能を有する微生物の活性がなくなるまで、継続してよい。

[0183] このようにしてアミノ酸生産能を有する微生物を培養することにより、培地中にアミノ酸が蓄積し、以てアミノ酸発酵液が得られる。

[0184] アミノ酸は、例えば、化合物の分離精製に用いられる公知の手法によりアミノ酸発酵液から分離することができる。そのような手法としては、イオン交換樹脂法 (Nagai, H. et al., Separation Science and Technology, 39(16), 3691-3710)、沈殿法、膜分離法 (特開平9-164323、特開平9-173792)、晶析法 (W02008/078448、W02008/078646) が挙げられる。これらの手法は、単独で、あるいは適宜組み合わせで用いることができる。また、アミノ酸が培地中に析出する場合は、アミノ酸は、例えば、遠心分離や濾過等の固液分離手段によりアミノ酸発酵液から分離することができる。

[0185] このようにしてアミノ酸をアミノ酸発酵液から分離することにより、副生物としてアミノ酸発酵副生液が得られる。

[0186] アミノ酸発酵副生液の濃縮または分画は、例えば、常法により実施できる。アミノ酸発酵副生液の濃縮手段としては、減圧濃縮、凍結乾燥、スプレードライが挙げられる。アミノ酸発酵副生液の分画手段としては、上記例示したような化合物の分離精製に用いられる手法が挙げられる。

[0187] 有効成分は、ストリゴラクトンと同様の機能を有してよい。よって、有効成分を利用することにより、例えば、ストリゴラクトンと同様の機能に基づく効果が得られてよい。言い換えると、有効成分を利用することにより、例えば、ストリゴラクトンを利用した場合と同様の効果が得られてよい。

[0188] ストリゴラクトンと同様の機能としては、寄生植物の発芽を誘導する機能

、植物の分枝を抑制する機能、菌根菌の菌糸分岐を誘導する機能が挙げられる。有効成分は、例えば、上記例示したストリゴラクトンと同様の機能から選択される１種またはそれ以上（例えば全て）の機能を有してよい。有効成分は、例えば、少なくとも、寄生植物の発芽を誘導する機能を有してよい。「寄生植物の発芽」と「寄生植物の種子の発芽」は代替可能に用いられてよい。例えば、後述する式（化合物１）～（化合物３）、（化合物５）～（化合物１４）、（化合物１６）～（化合物２０）、（化合物２３）、（化合物２６）～（化合物３５）、（化合物３７）、（化合物３８）、（化合物４０）、（化合物５３）、（化合物６０）、（化合物７２）、（化合物８３）、（化合物８８）、および（化合物８９）で表される化合物は、寄生植物の発芽を誘導する機能を有し得る。また、例えば、後述する式（化合物１）～（化合物３）、（化合物５）～（化合物８）、（化合物２７）～（化合物３０）、（化合物３８）、（化合物４０）、（化合物５３）、および（化合物７２）で表される化合物は、寄生植物の発芽を誘導する機能を有し得る。

[0189] また、有効成分は、ストリゴラクトンと異なり、例えば、寄生植物の発芽を抑制する機能を有していてもよい。例えば、後述する式（化合物４）、（化合物１５）、（化合物３６）、（化合物３９）、（化合物４２）～（化合物４９）、（化合物５１）、（化合物５６）、（化合物５７）、（化合物５９）、（化合物６１）、（化合物６３）、（化合物６６）～（化合物７１）、（化合物７３）～（化合物７６）、（化合物７８）～（化合物８０）、および（化合物８４）で表される化合物は、寄生植物の発芽を抑制する機能を有し得る。また、例えば、後述する式（化合物４）、（化合物３９）、（化合物４２）～（化合物４９）、（化合物５１）、（化合物５６）、（化合物６６）～（化合物７１）、および（化合物７３）～（化合物７６）で表される化合物は、寄生植物の発芽を抑制する機能を有し得る。

[0190] 一態様において、有効成分を利用することにより、具体的には有効成分を寄生植物の種子に施用することにより、寄生植物の発芽が誘導または抑制さ

れてよく、すなわち、寄生植物の発芽を誘導または抑制する効果が得られてよい。寄生植物の発芽を誘導する効果を、「発芽誘導効果」ともいう。寄生植物の発芽を抑制する効果を、「発芽抑制効果」ともいう。誘導される寄生植物の発芽としては、寄生植物の自殺発芽が挙げられる。「寄生植物の自殺発芽」とは、寄生植物の寄生対象となる植物が存在しない環境での寄生植物の発芽を意味してよい。寄生植物の寄生対象となる植物を、「寄生対象植物」ともいう。自殺発芽した寄生植物は、寄生対象植物に寄生できず、以て死滅してよい。また、寄生植物の発芽の抑制により、寄生植物の生育および寄生対象植物への寄生が防止されてよい。よって、寄生植物の自殺発芽の誘導により、または寄生植物の発芽の抑制により、例えば、寄生植物が防除されてよく、すなわち、寄生植物を防除する効果が得られてよい。寄生植物を防除する効果を、「寄生植物防除効果」ともいう。寄生植物防除効果は、発芽誘導効果または発芽抑制効果の一例であってよい。寄生植物の自殺発芽の誘導、寄生植物の発芽の抑制、または寄生植物の防除により、例えば、寄生対象植物の栽培成績が向上してよく、すなわち、寄生対象植物の栽培成績が向上する効果が得られてよい。寄生対象植物の栽培成績が向上する効果を、「寄生対象植物の栽培成績向上効果」ともいう。寄生対象植物の栽培成績向上効果は、発芽誘導効果、発芽抑制効果、または寄生植物防除効果の一例であってよい。寄生対象植物の栽培成績の向上としては、寄生対象植物の収量の向上、寄生対象植物の生育の向上、寄生対象植物の生存性の向上が挙げられる。寄生対象植物の栽培成績の向上としては、特に、寄生対象植物の収量の向上が挙げられる。植物の収量の向上としては、植物体の全体の収量の向上や、葉、根、果実、種子等の植物体の一部の収量の向上が挙げられる。

[0191] 寄生植物としては、根寄生植物が挙げられる。また、寄生植物としては、ストリゴラクトンにより発芽が誘導される植物が挙げられる。寄生植物として、具体的には、ハマウツボ科 (Orobanchaceae) 植物、ゴマノハグサ科 (Scrophulariaceae) 植物、ヒルガオ科 (Convolvulaceae) 植物が挙げられる。ハマウツボ科植物としては、ストライガ (Striga) 属植物、ハマウツボ (Oro

banche) 属植物、フェリパンキ (*Phelipanche*) 属植物が挙げられる。ハマウツボ科植物としては、特に、ストライガ (*Striga*) 属植物やハマウツボ (*Orobanche*) 属植物が挙げられる。ストライガ属植物としては、*Striga asiatica*、*Striga gesnerioides*、*Striga hermonthica*、*Striga aspera*、*Striga asiatica*、*Striga curviflora*、*Striga parviflora*、*Striga angustifolia*、*Striga latericea*、*Striga aequinoctialis*、*Striga angolensis*、*Striga bilabiate*、*Striga brachycalyx*、*Striga chrsantha*、*Striga dalzielii*、*Striga elegans*、*Striga forbesii*、*Striga gastonii*、*Striga gracillima*、*Striga hallaei*、*Striga hirsuta*、*Striga junodii*、*Striga klingii*、*Striga lepida gathidis*、*Striga lutea*、*Striga macrantha*、*Striga passargei*、*Striga pinnatifida*、*Striga primuloides*、*Striga yemenica*、*Striga pubiflora*が挙げられる。ハマウツボ属植物としては、*Orobanche ramosa*、*Orobanche minor*、*Orobanche crenata*、*Orobanche cumana*、*Orobanche foetida*、*Orobanche aegyptiaca*、*Orobanche cernua*が挙げられる。フェリパンキ属植物としては、*Phelipanche ramosa*や*Phelipanche aegyptiaca*が挙げられる。ゴマノハグサ科植物としては、アレクトラ (*Alectra*) 属植物が挙げられる。*Alectra*属植物としては、*Alectra vogelii*、*Alectra picta*、*Alectra sessiliflora*、*Alectra orobanchoides*、*Alectra fluminensis*が挙げられる。ヒルガオ科植物としては、ネナシカズラ (*Cuscuta*) 属植物が挙げられる。*Cuscuta*属植物としては、*Cuscuta australis*、*Cuscuta campestris*、*Cuscuta chinensis*、*Cuscuta indecora*、*Cuscuta epithymum*、*Cuscuta epilinum*、*Cuscuta gronovii*、*Cuscuta planiflora*、*Cuscuta monogyna*、*Cuscuta pedicellata*、*Cuscuta palaestina*、*Cuscuta rejllexa*が挙げられる。なお、或る寄生植物の分類が変更された場合、当該寄生植物は変更前後の分類の一方または両方に該当するものとして取り扱ってよい。ただし、或る寄生植物の分類が変更された場合、特記しない限り、当該寄生植物は変更前後の分類の両方に該当するものとして取り扱う。例えば、*Orobanche ramosa* L.は現在では*Phelipanche ramosa* (L.) Pomelとして分類されているが、特記しない限り、*Orobanche ramosa* L.

は、ハマウツボ属植物とフェリパンキ属植物の両方に該当するものとして取り扱い、また、*Orobanche ramosa*と*Phelipanche ramosa*の両方に該当するものとして取り扱う。寄生植物としては、1種の植物を対象としてもよく、2種またはそれ以上の植物を対象としてもよい。

[0192] 寄生対象植物の種類は、寄生植物の寄生対象となるものであれば、特に制限されない。寄生対象植物は、例えば、木本植物であってもよく、草本植物であってもよい。寄生対象植物としては、イネ科植物（イネ、オオムギ、コムギ、トウモロコシ、モロコシ、キビ、サトウキビ、エンバク、シバ、トウジンビエ、シコクビエ、フォニオ等）、ナス科植物（トマト、ピーマン、ナス、ジャガイモ、タバコ等）、ウリ科植物（キュウリ、メロン、カボチャ等）、マメ科植物（エンドウ、ダイズ、インゲンマメ、アルファルファ、ラッカセイ、ソラマメ、ササゲ、レンズマメ、ヒヨコマメ、クローバー、ラッカセイ、バンバラマメ等）、アブラナ科植物（ダイコン、ハクサイ、キャベツ、コマツナ、ナノハナ、チンゲンサイ、シロイヌナズナ等）、バラ科植物（イチゴ、リンゴ、ナシ、モモ等）、クワ科植物（クワ等）、アオイ科植物（ワタ等）、セリ科植物（ニンジン、パセリ、セロリ等）、ユリ科植物（ネギ、タマネギ、アスパラガス等）、キク科植物（ゴボウ、ヒマワリ、キク、シュンギク、ベニバナ、レタス等）、ヒユ科植物（テンサイ等）、ツツジ科植物（ブルーベリー、クランベリー等）、ブドウ科植物（ブドウ等）、ミカン科植物（ウンシュウミカン、レモン、ユズ等）、アカネ科植物（コーヒーノキ等）、モクセイ科植物（オリーブ等）、クスノキ科植物（アボカド等）、ウルシ科植物（マンゴー、カシューナットノキ等）、ムクロジ科植物（ライチ等）、シソ科植物（コリウス等）が挙げられる。寄生対象植物としては、1種の植物を対象としてもよく、2種またはそれ以上の植物を対象としてもよい。

[0193] 発芽誘導効果または発芽抑制効果は、例えば、寄生植物の発芽を指標として、確認することができる。すなわち、有効成分の非利用時と比較して、有効成分の利用時に寄生植物の発芽が促進されている場合に、有効成分により

寄生植物の発芽が誘導されたと判断できる。寄生植物の発芽の促進は、例えば、寄生植物の発芽率の増大または寄生植物の発芽速度の増大として測定できる。寄生植物の発芽率は、例えば、実施例に記載の手順により測定できる。また、有効成分の非利用時と比較して、有効成分の利用時に寄生植物の発芽が抑制されている場合に、有効成分により寄生植物の発芽が抑制されたと判断できる。寄生植物の発芽の抑制は、例えば、寄生植物の発芽率の低下または寄生植物の発芽速度の低下として測定できる。なお、発芽の抑制には、発芽が全く認められない場合も包含される。

[0194] また、発芽誘導効果または発芽抑制効果は、例えば、寄生植物防除効果を確認することにより、確認することもできる。寄生植物防除効果は、例えば、寄生植物の生育、生存性、または寄生を指標として、確認することができる。すなわち、有効成分の非利用時と比較して、有効成分の利用時に寄生植物の生育、生存性、または寄生が低減されている場合に、有効成分により寄生植物が防除されたと判断できる。

[0195] また、発芽誘導効果または発芽抑制効果は、例えば、寄生対象植物の栽培成績向上効果を確認することにより、確認することもできる。寄生対象植物の栽培成績向上効果は、例えば、寄生対象植物の栽培成績を指標として、確認することができる。すなわち、有効成分の非利用時と比較して、有効成分の利用時に寄生対象植物の栽培成績（例えば、収量、生育、または生存性）が向上している場合に、有効成分により寄生対象植物の栽培成績が向上したと判断できる。

[0196] また、一態様において、有効成分を利用することにより、具体的には有効成分を植物に施用することにより、植物の分枝が抑制されてよく、すなわち、植物の分枝を抑制する効果が得られてよい。植物の分枝を抑制する効果を、「分枝抑制効果」ともいう。有効成分により分枝が抑制される植物を、「栽培対象植物」ともいう。植物の分枝としては、植物の地上部の分枝が挙げられる。栽培対象植物の分枝の抑制により、例えば、栽培対象植物の栽培成績が向上してよく、すなわち、栽培対象植物の栽培成績が向上する効果が得

られてよい。栽培対象植物の栽培成績が向上する効果を、「栽培対象植物の栽培成績向上効果」ともいう。栽培対象植物の栽培成績向上効果は、分枝抑制効果の一例であってよい。栽培対象植物の栽培成績の向上としては、栽培対象植物の収量の向上、栽培対象植物の生育の向上、栽培対象植物の生存性の向上が挙げられる。栽培対象植物の栽培成績の向上としては、特に、栽培対象植物の収量の向上が挙げられる。

[0197] 栽培対象植物の種類は、有効成分により分枝が抑制されるものであれば、特に制限されない。栽培対象植物については、例えば、上述した寄生対象植物についての記載を準用できる。すなわち、例えば、栽培対象植物としては、寄生対象植物として例示した植物が挙げられる。

[0198] 分枝抑制効果は、例えば、栽培対象植物の分枝を指標として、確認することができる。すなわち、有効成分の非利用時と比較して、有効成分の利用時に栽培対象植物の分枝が抑制されている場合に、有効成分により栽培対象植物の分枝が抑制されたと判断できる。栽培対象植物の分枝の抑制は、例えば、栽培対象植物の個体あたりの枝数の低下として測定できる。

[0199] また、分枝抑制効果は、例えば、栽培対象植物の栽培成績向上効果を確認することにより、確認することもできる。栽培対象植物の栽培成績向上効果は、例えば、栽培対象植物の栽培成績を指標として、確認することができる。すなわち、有効成分の非利用時と比較して、有効成分の利用時に栽培対象植物の栽培成績（例えば、収量、生育、または生存性）が向上している場合に、有効成分により栽培対象植物の栽培成績が向上したと判断できる。

[0200] また、一態様において、有効成分を利用することにより、具体的には有効成分を菌根菌に施用することにより、菌根菌の菌糸分岐が誘導されてよく、すなわち、菌根菌の菌糸分岐を誘導する効果が得られてよい。菌根菌の菌糸分岐を誘導する効果を、「菌糸分岐誘導効果」ともいう。菌根菌の共生対象となる植物を、「共生対象植物」ともいう。菌根菌の菌糸分岐の誘導により、例えば、共生対象植物の栽培成績が向上してよく、すなわち、共生対象植物の栽培成績が向上する効果が得られてよい。共生対象植物の栽培成績が向

上する効果を、「共生対象植物の栽培成績向上効果」ともいう。共生対象植物の栽培成績向上効果は、菌糸分岐誘導効果の一例であってよい。共生対象植物の栽培成績の向上としては、共生対象植物の収量の向上、共生対象植物の生育の向上、共生対象植物の生存性の向上が挙げられる。共生対象植物の栽培成績の向上としては、特に、共生対象植物の収量の向上が挙げられる。

[0201] 菌根菌としては、アーバスキュラー菌根菌 (arbuscular mycorrhizal fungi) が挙げられる。アーバスキュラー菌根菌としては、グロムス門 (Glomeromycota) 真菌が挙げられる。

[0202] 共生対象植物の種類は、菌根菌の共生対象となるものであれば、特に制限されない。共生対象植物については、例えば、上述した寄生対象植物についての記載を準用できる。すなわち、例えば、共生対象植物としては、寄生対象植物として例示した植物が挙げられる。

[0203] 菌糸分岐誘導効果は、例えば、菌根菌の菌糸分岐を指標として、確認することができる。すなわち、有効成分の非利用時と比較して、有効成分の利用時に菌根菌の菌糸分岐が促進されている場合に、有効成分により菌根菌の菌糸分岐が誘導されたと判断できる。菌根菌の菌糸分岐の促進は、例えば、菌根菌が共生対象植物の根の近傍に達した際に観察されるような、先端が細かく分岐した形態の菌糸の生成として測定できる。

[0204] また、分枝抑制効果は、例えば、栽培対象植物の栽培成績向上効果を確認することにより、確認することもできる。栽培対象植物の栽培成績向上効果は、例えば、栽培対象植物の栽培成績を指標として、確認することができる。すなわち、有効成分の非利用時と比較して、有効成分の利用時に栽培対象植物の栽培成績（例えば、収量、生育、または生存性）が向上している場合に、有効成分により栽培対象植物の栽培成績が向上したと判断できる。

[0205] また、ストリゴラクトンと同様の機能は、有効成分とストリゴラクトン受容体の結合活性を指標として測定することができる。ストリゴラクトン受容体としては、シロイヌナズナのストリゴラクトン受容体D14 (DWARF14) タンパク質、イネのストリゴラクトン受容体D14、ストライガのストリゴラクトン

受容体HTL (HYPOSENSITIVE TO LIGHT)、オロバンキのストリゴラクトン受容体D14タンパク質、他の寄生植物のD14やHTL/KAI2 (HYPOSENSITIVE TO LIGHT/KARRIKIN INSENSITIVE2) が挙げられる。すなわち、有効成分とストリゴラクトン受容体の結合活性が認められた場合に、有効成分がストリゴラクトンと同様の機能を有する（すなわち、有効成分の利用によりストリゴラクトンと同様の機能に基づく効果が得られる）と判断できる。有効成分とストリゴラクトン受容体の結合活性は、例えば、蛍光プローブ標識化された合成ストリゴラクトンであるYoshimulactone Green(YLG)とD14との結合の有効成分による阻害を測定することにより、測定できる。Yoshimulactone Green (YLG)とD14との結合の有効成分による阻害は、例えば、実施例に記載の手順により測定できる。

[0206] <2>本発明の組成物

本発明の組成物は、有効成分（すなわち上記成分（A）、（B）、または（C））を含有する組成物である。

[0207] 本発明の組成物は、寄生植物の種子、栽培対象植物、菌根菌等の対象物に施用して利用することができる。本発明の組成物の使用態様は、「本発明の方法」において詳述する。本発明の組成物は、例えば、上記例示した効果を得るために利用することができる。

[0208] 一態様において、本発明の組成物を利用することにより、具体的には本発明の組成物を寄生植物の種子に施用することにより、寄生植物の発芽が誘導または抑制されてよい。すなわち、本発明の組成物は、例えば、寄生植物の発芽誘導用組成物または寄生植物の発芽抑制用組成物であってよい。寄生植物の発芽誘導用組成物は、例えば、寄生植物の自殺発芽誘導用組成物であってよい。寄生植物の自殺発芽の誘導により、または寄生植物の発芽の抑制により、例えば、寄生植物が防除されてよい。すなわち、本発明の組成物は、例えば、寄生植物の防除用組成物であってよい。寄生植物の防除用組成物は、寄生植物の発芽誘導用組成物または寄生植物の発芽抑制用組成物の一例であってよい。寄生植物の自殺発芽の誘導、寄生植物の発芽の抑制、または寄

生植物の防除により、例えば、寄生対象植物の栽培成績が向上してよい。よって、本発明の組成物は、例えば、寄生対象植物の栽培に利用されてよい。すなわち、本発明の組成物は、例えば、寄生対象植物の栽培成績向上用組成物等の寄生対象植物の栽培用組成物であってよい。寄生対象植物の栽培成績向上用組成物等の寄生対象植物の栽培用組成物は、寄生植物の発芽誘導用組成物、寄生植物の発芽抑制用組成物、または寄生植物の防除用組成物の一例であってよい。寄生植物の発芽誘導用組成物、寄生植物の発芽抑制用組成物、寄生植物の防除用組成物、および寄生対象植物の栽培成績向上用組成物を、それぞれ、「寄生植物の発芽誘導剤」、「寄生植物の発芽抑制剤」、「寄生植物の防除剤」、および「寄生対象植物の栽培成績向上剤」ともいう。

[0209] また、一態様において、本発明の組成物を利用することにより、具体的には本発明の組成物を栽培対象植物に施用することにより、植物の分枝が抑制されてよい。すなわち、本発明の組成物は、例えば、栽培対象植物の分枝抑制用組成物であってよい。栽培対象植物の分枝の抑制により、例えば、栽培対象植物の栽培成績が向上してよい。よって、本発明の組成物は、例えば、栽培対象植物の栽培に利用されてよい。すなわち、本発明の組成物は、例えば、栽培対象植物の栽培成績向上用組成物等の栽培対象植物の栽培用組成物であってよい。栽培対象植物の栽培成績向上用組成物等の栽培対象植物の栽培用組成物は、栽培対象植物の分枝抑制用組成物の一例であってよい。栽培対象植物の分枝抑制用組成物および栽培対象植物の栽培成績向上用組成物を、それぞれ、「栽培対象植物の分枝抑制剤」および「栽培対象植物の栽培成績向上剤」ともいう。

[0210] また、一態様において、本発明の組成物を利用することにより、具体的には本発明の組成物を菌根菌に施用することにより、菌根菌の菌糸分岐が誘導されてよい。すなわち、本発明の組成物は、例えば、菌根菌の菌糸分岐誘導用組成物であってよい。菌根菌の菌糸分岐の誘導により、例えば、共生対象植物の栽培成績が向上してよい。よって、本発明の組成物は、例えば、共生対象植物の栽培に利用されてよい。すなわち、本発明の組成物は、例えば、

共生対象植物の栽培成績向上用組成物等の共生対象植物の栽培用組成物であってよい。共生対象植物の栽培成績向上用組成物等の共生対象植物の栽培用組成物は、菌根菌の菌糸分岐誘導用組成物の一例であってよい。菌根菌の菌糸分岐誘導用組成物および共生対象植物の栽培成績向上用組成物を、それぞれ、「菌根菌の菌糸分岐誘導剤」および「共生対象植物の栽培成績向上剤」ともいう。

[0211] 上記例示したような本発明の組成物の用途は、例えば、農園芸分野において有用であり得る。よって、本発明の組成物は、例えば、農園芸分野において利用されてよい。すなわち、本発明の組成物は、例えば、農園芸用組成物であってよい。本発明の組成物は、具体的には、例えば、上記例示したような本発明の組成物の用途で用いられる、農園芸用組成物であってよい。

[0212] 本発明の組成物は、例えば、農薬として提供されてよい。また、本発明の組成物は、例えば、肥料として提供されてよい。

[0213] 本発明の組成物の組成は、本発明の組成物が有効成分を含有し、且つ、所望の効果が得られる限り、特に制限されない。本発明の組成物が含有する成分の種類や含有量は、対象物の種類、対象物の栽培方法、対象物の生育ステージ、本発明の組成物の利用目的、および本発明の組成物の利用態様等の諸条件に応じて適宜選択することができる。

[0214] 本発明の組成物は、有効成分からなるものであってもよく、有効成分以外の成分を含有していてもよい。有効成分以外の成分としては、例えば、農薬用、肥料用、医薬用等の用途に通常用いられる成分が挙げられる。そのような成分として、具体的には、例えば、賦形剤、結合剤、崩壊剤、滑沢剤、安定化剤、希釈剤、界面活性剤、展着剤、pH調整剤、水、アルコール、ビタミン、ミネラル等の添加剤が挙げられる。展着剤として、具体的には、例えば、アプローチB I™（花王（株））、ミックスパワー™（シンジェンタジャパン（株））、スカッシュ™（丸和バイオケミカル（株））が挙げられる。有効成分以外の成分としては、1種の成分を用いてもよく、2種またはそれ以上の成分を用いてもよい。本発明の組成物は、適宜、製剤化されていてよい。

本発明の組成物の剤形は特に制限されない。本発明の組成物の剤形は、本発明の組成物の利用態様等の諸条件に応じて適宜選択することができる。剤形としては、例えば、液剤、懸濁剤、散剤、錠剤、丸剤、カプセル剤、ペースト剤が挙げられる。

[0215] 本発明の組成物における有効成分の含有量は、0% (w/w) より多く、且つ、100% (w/w) 以下である。本発明の組成物における有効成分の含有量は、例えば、0.0005% (w/w) 以上、0.001% (w/w) 以上、0.002% (w/w) 以上、0.005% (w/w) 以上、0.01% (w/w) 以上、0.02% (w/w) 以上、0.05% (w/w) 以上、0.1% (w/w) 以上、0.2% (w/w) 以上、0.5% (w/w) 以上、1% (w/w) 以上、2% (w/w) 以上、5% (w/w) 以上、または10% (w/w) 以上であってもよく、100% (w/w) 以下、99.9% (w/w) 以下、70% (w/w) 以下、50% (w/w) 以下、30% (w/w) 以下、20% (w/w) 以下、15% (w/w) 以下、10% (w/w) 以下、5% (w/w) 以下、2% (w/w) 以下、1% (w/w) 以下、0.5% (w/w) 以下、0.2% (w/w) 以下、0.1% (w/w) 以下、0.05% (w/w) 以下、または0.02% (w/w) 以下であってもよく、それらの矛盾しない組み合わせであってもよい。また、本発明の組成物における有効成分の含有量は、例えば、10 nM以上、20 nM以上、50 nM以上、100 nM以上、200 nM以上、500 nM以上、1 μ M以上、2 μ M以上、5 μ M以上、10 μ M以上、20 μ M以上、50 μ M以上、100 μ M以上、または200 μ M以上であってもよく、1 M以下、500 mM以下、200 mM以下、100 mM以下、50 mM以下、20 mM以下、10 mM以下、5 mM以下、2 mM以下、または1 mM以下であってもよく、それらの矛盾しない組み合わせであってもよい。本発明の組成物が2種またはそれ以上の有効成分を含有する場合、本発明の組成物におけるそれら2種またはそれ以上の有効成分の含有量を、それぞれ独立に、あるいは合計で、上記例示した本発明の組成物における有効成分の含

有量の範囲に設定してよい（ただし、本発明の組成物におけるそれら2種またはそれ以上の有効成分の総含有量は100%（w/w）以下である）。なお、本発明の組成物が2種またはそれ以上の有効成分を含有する場合、「本発明の組成物における有効成分の含有量」とは、特記しない限り、本発明の組成物におけるそれら2種またはそれ以上の有効成分の総含有量を意味するものとする。

[0216] また、本発明の組成物における有効成分の含有量は、例えば、本発明の組成物の使用時に有効成分の濃度が所定の範囲となるように設定することができる。本発明の組成物の使用時の有効成分の濃度を「有効成分の使用濃度」または「有効成分の施用濃度」ともいう。有効成分の使用濃度は、特に、本発明の組成物が液体の形態で使用される場合の濃度であってよい。

[0217] 有効成分の使用濃度は、例えば、1 nM以上、2 nM以上、5 nM以上、10 nM以上、20 nM以上、50 nM以上、100 nM以上、200 nM以上、500 nM以上、1 μ M以上、2 μ M以上、5 μ M以上、10 μ M以上、20 μ M以上、50 μ M以上、100 μ M以上、200 μ M以上、500 μ M以上、または1 mM以上であってもよく、10 mM以下、5 mM以下、2 mM以下、1 mM以下、500 μ M以下、200 μ M以下、100 μ M以下、50 μ M以下、20 μ M以下、10 μ M以下、5 μ M以下、2 μ M以下、1 μ M以下、500 nM以下、200 nM以下、または100 nM以下であってもよく、それらの矛盾しない組み合わせであってもよい。有効成分の使用濃度は、具体的には、例えば、1 nM～10 nM、10 nM～100 nM、100 nM～1 μ M、1 μ M～10 μ M、10 μ M～100 μ M、100 μ M～1 mM、または1 mM～10 mMであってもよい。有効成分の使用濃度は、具体的には、例えば、1 nM～1 mM、10 nM～10 mM、100 nM～1 mM、100 nM～100 μ M、100 nM～10 mM、100 nM～1 mM、100 nM～100 μ M、1 μ M～10 mM、1 μ M～1 mM、1 μ M～100 μ M、10 μ M～10 mM、10 μ M～1 mM、10 μ M～100 μ M、100 μ M～10 mM、または100 μ M～1 mMであって

もよい。2種またはそれ以上の有効成分を使用する場合、それら2種またはそれ以上の有効成分の使用濃度を、それぞれ独立に、あるいは合計で、上記例示した有効成分の使用濃度の範囲に設定してよい。なお、2種またはそれ以上の有効成分を使用する場合、「有効成分の使用濃度」とは、特記しない限り、それら2種またはそれ以上の有効成分の総使用濃度を意味するものとする。

[0218] なお、有効成分の量（例えば含有量（濃度）や使用量）は、有効成分を含有する素材を用いる場合にあっては、当該素材中の有効成分そのものの量に基づいて算出されるものとする。また、有効成分の量（例えば含有量（濃度）や使用量）は、有効成分が塩または水和物を形成している場合にあっては、塩または水和物の質量を等モルのフリー体の質量に換算した値に基づいて算出されるものとする。また、有効成分の量（例えば含有量（濃度）や使用量）は、有効成分が成分（C）である場合にあっては、成分（C）の乾燥重量に基づいて算出されるものとする。

[0219] 有効成分およびその他の成分は、互いに混合されて本発明の組成物に含まれていてもよく、それぞれ別個に、あるいは、任意の組み合わせで別個に、本発明の組成物に含まれていてもよい。

[0220] <3>本発明の方法

本発明の方法は、有効成分（すなわち上記成分（A）、（B）、または（C））を寄生植物の種子、栽培対象植物、菌根菌等の対象物に施用することを含む方法である。本発明の方法は、例えば、上記例示した効果を得るために実施することができる。

[0221] 一態様において、本発明の方法を実施することにより、具体的には有効成分を寄生植物の種子に施用することにより、寄生植物の発芽が誘導または抑制されてよい。すなわち、本発明の方法は、例えば、寄生植物の発芽を誘導または抑制する方法であってよい。寄生植物の発芽を誘導する方法は、例えば、寄生植物の自殺発芽を誘導する方法であってよい。寄生植物の自殺発芽の誘導または抑制により、例えば、寄生植物が防除されてよい。すなわち、

本発明の方法は、例えば、寄生植物を防除する方法であってよい。寄生植物を防除する方法は、寄生植物の発芽を誘導または抑制する方法の一例であってよい。寄生植物の自殺発芽の誘導、寄生植物の発芽の抑制、または寄生植物の防除により、例えば、寄生対象植物の栽培成績が向上してよい。よって、本発明の方法は、例えば、寄生対象植物の栽培に利用されてよい。すなわち、本発明の方法は、例えば、寄生対象植物の栽培成績を向上させる方法等の寄生対象植物を栽培する方法であってよい。寄生対象植物の栽培成績を向上させる方法等の寄生対象植物を栽培する方法は、寄生植物の発芽を誘導する方法、寄生植物の発芽を抑制する方法、または寄生植物を防除する方法の一例であってよい。

[0222] また、一態様において、本発明の方法を実施することにより、具体的には有効成分を栽培対象植物に施用することにより、栽培対象植物の分枝が抑制されてよい。すなわち、本発明の方法は、例えば、栽培対象植物の分枝を抑制する方法であってよい。栽培対象植物の分枝の抑制により、例えば、栽培対象植物の栽培成績が向上してよい。よって、本発明の方法は、例えば、栽培対象植物の栽培に利用されてよい。すなわち、本発明の方法は、例えば、栽培対象植物の栽培成績を向上させる方法等の栽培対象植物を栽培する方法であってよい。栽培対象植物の栽培成績を向上させる方法等の栽培対象植物を栽培する方法は、栽培対象植物の分枝を抑制する方法の一例であってよい。

[0223] また、一態様において、本発明の方法を実施することにより、具体的には有効成分を菌根菌に施用することにより、菌根菌の菌糸分岐が誘導されてよい。すなわち、本発明の方法は、例えば、菌根菌の菌糸分岐を誘導する方法であってよい。菌根菌の菌糸分岐の誘導により、例えば、共生対象植物が向上してよい。よって、本発明の方法は、例えば、共生対象植物の栽培に利用されてよい。すなわち、本発明の方法は、例えば、共生対象植物の栽培成績を向上させる方法等の共生対象植物を栽培する方法であってよい。共生対象植物の栽培成績を向上させる方法等の共生対象植物を栽培する方法は、菌根

菌の菌糸分岐を誘導する方法の一例であってよい。

[0224] 有効成分は、例えば、本発明の組成物を利用して（すなわち本発明の組成物を施用することにより）、植物に施用することができる。すなわち、本発明の方法の一態様は、例えば、本発明の組成物を植物に施用することを含む方法であってよい。「有効成分を植物に施用すること」には、本発明の組成物を植物に施用することも包含される。本発明の組成物は、例えば、そのまま、あるいは適宜、水、生理食塩水、緩衝液、アルコール、DMSO等の液体で希釈、分散、または溶解し、植物に施用することができる。すなわち、本発明の組成物は、例えば、適宜、上記例示したような有効成分の使用濃度が得られるように濃度を調整し、植物に施用することができる。本発明の組成物は、特に、液体の形態で植物に施用することができる。本発明の組成物は、単独で利用してもよく、他の成分と併用してもよい。他の成分については、本発明の組成物の説明における有効成分以外の成分についての記載を準用できる。すなわち、本発明の組成物は、例えば、展着剤等の添加剤と併用してもよい。

[0225] 本発明の組成物の施用方法は、所望の効果が得られる限り、特に制限されない。本発明の組成物の施用方法は、対象物の種類、対象物の生育方法、対象物の生育ステージ、および本発明の組成物の利用目的等の諸条件に応じて適宜選択することができる。本発明の組成物は、例えば、農薬または肥料を植物の種子、植物、または菌根菌に施用する通常の方法で対象物に施用することができる。本発明の組成物は、例えば、寄生植物の種子、栽培対象植物、菌根菌等の対象物そのものに施用してもよく、対象物の生育が実施される媒体へ施用してもよく、それらの組み合わせに施用してもよい。対象物の生育が実施される媒体を、「生育媒体」または「生育系」ともいう。生育媒体は、対象物の種類や対象物の生育方法等の諸条件に応じて適宜選択することができる。対象物の生育としては、寄生植物の発芽、栽培対象植物の栽培、菌根菌の生育が挙げられる。対象物の生育方法は、特に制限されない。対象物の生育は、本発明の組成物を施用すること以外は、例えば、対象物を生育

させる通常の方法と同一の方法により実施することができる。栽培対象植物等の植物の栽培方法としては、土耕栽培、養液栽培、養液土耕栽培が挙げられる。養液栽培としては、水耕栽培や固形培地耕栽培が挙げられる。水耕栽培としては、薄膜水耕法（Nutrient Film Technique；NFT）や湛液型水耕法（Deep Flow Technique；DFT）が挙げられる。すなわち、栽培対象植物等の植物の栽培が実施される生育媒体としては、土壌、水耕培養液、固形培地が挙げられる。なお、寄生植物の発芽および菌根菌の生育等の他の対象物の生育も、例えば、栽培対象植物等の植物の栽培が実施される媒体で実施することができる。よって、寄生植物の発芽および菌根菌の生育等の他の対象物の生育が実施される媒体については、上述した栽培対象植物等の植物の栽培が実施される媒体についての記載を準用できる。すなわち、寄生植物の発芽および菌根菌の生育等の他の対象物の生育が実施される媒体としては、植物の栽培が実施される媒体として例示した媒体が挙げられる。なお、寄生植物の発芽が実施される媒体は、寄生対象植物の栽培が実施される媒体でもあり得る。また、菌根菌の生育が実施される媒体は、共生対象植物の栽培が実施される媒体でもあり得る。対象物そのものへの施用としては、対象物への散布や塗布、対象物の浸漬が挙げられる。本発明の組成物は、対象物の全体に施用してもよく、対象物の一部に施用してもよい。例えば、対象物が植物である場合、本発明の組成物は、植物体の全体に施用してもよく、植物体の一部に施用してもよい。本発明の組成物は、例えば、植物体の地上部全体に施用してもよい。植物体の一部としては、葉、茎、幹、根、果実が挙げられる。本発明の組成物を葉に施用する場合、本発明の組成物は、葉の表面および裏面の一方のみに施用されてもよく、両方に施用されてもよい。植物体への施用として、具体的には、例えば、葉面散布や根部浸漬が挙げられる。生育媒体への施用としては、生育媒体への散布、灌注、混合が挙げられる。具体的には、例えば、灌水チューブを通して、本発明の組成物を生育媒体へ施用（例えば、散布）してよい。生育媒体への施用は、有効成分が対象物に作用できる位置に到達するように実施してよい。例えば、植物の栽培が実施さ

れる媒体への施用は、有効成分が植物の根圏へ到達するように実施してよい。

[0226] 本発明の組成物の施用時期は、所望の効果が得られる限り、特に制限されない。本発明の組成物の施用時期は、対象物の種類、対象物の生育方法、対象物の生育ステージ、および本発明の組成物の利用目的等の諸条件に応じて適宜選択することができる。本発明の組成物を生育媒体へ施用する場合、生育媒体には、既に対象物が存在していてもよく、存在していなくてもよい。本発明の組成物を対象物自体に施用することにより、または、本発明の組成物を既に対象物が存在する生育媒体に施用することにより、当該対象物において所望の効果が得られてよい。また、本発明の組成物を対象物が存在しない生育媒体に施用することにより、将来的に生育媒体に存在し得る対象物において所望の効果が得られてよい。将来的に生育媒体に存在し得る対象物としては、将来的に生育媒体に外部から移送される対象物や、将来的に生育媒体中で生成する対象物が挙げられる。本発明の組成物は、1回のみ施用してもよく、2回またはそれ以上施用してもよい。本発明の組成物は、間欠的に施用してもよく、連続的に施用してもよい。

[0227] 例えば、本発明の組成物を寄生植物の発芽の誘導または抑制に利用する場合、本発明の組成物は、寄生植物の発芽前に施用してよい。

[0228] 具体的には、例えば、本発明の組成物を寄生植物の自殺発芽の誘導（例えば、自殺発芽の誘導による寄生植物の防除）に利用する場合、本発明の組成物は、寄生対象植物が生育媒体に存在しない期間に寄生植物の発芽が誘導されるように、寄生植物の発芽前に施用してよい。すなわち、例えば、本発明の組成物を寄生植物の自殺発芽の誘導（例えば、自殺発芽の誘導による寄生植物の防除）に利用する場合、本発明の組成物は、寄生植物の発芽前であって、且つ、寄生対象植物が生育媒体に存在しない時点で施用してよい。寄生対象植物が生育媒体に存在しない期間または時点としては、寄生対象植物の種子または苗を生育媒体に植え付ける前の期間または時点が挙げられる。寄生植物の自殺発芽の誘導後または寄生植物の防除後に寄生対象植物の栽培を

実施する場合、例えば、寄生植物の自殺発芽の誘導後または寄生植物の防除後に、寄生対象植物の種子または苗の植え付け、寄生対象植物の発芽、および／または寄生対象植物の生育を実施してよい。

[0229] また、具体的には、例えば、本発明の組成物を寄生植物の発芽の誘導（例えば、発芽の誘導による寄生植物の防除）に利用する場合、本発明の組成物は、寄生対象植物の生産性が寄生植物の寄生による影響を受けない期間に寄生植物の発芽が誘導されるように、寄生植物の発芽前に施用してよい。寄生対象植物の生産性が寄生植物の寄生による影響を受けない期間に寄生植物の発芽を誘導することにより、同期間に寄生植物が寄生対象植物に寄生してよい。寄生対象植物の生産性が寄生植物の寄生による影響を受けない期間としては、寄生対象植物の栽培の後期、すなわち、寄生対象植物の栽培シーズン後期が挙げられる。「寄生対象植物の生育の後期」とは、例えば、寄生対象植物が十分に生育した後の期間を意味してよい。また、「寄生対象植物の生育の後期」とは、例えば、寄生対象植物の栽培の全期間の内、50%以上、60%以上、70%以上、80%以上、90%以上、または95%以上の期間が経過した後の期間を意味してよい。「寄生対象植物の栽培の全期間」とは、寄生対象植物の種子または苗の植え付けから寄生対象植物の栽培完了（例えば、植物体の収穫）までの期間を意味してよい。この際、例えば、灌水チューブを通して、本発明の組成物を生育媒体へ施用（例えば、散布）してよい。寄生植物の発芽および寄生後、且つ寄生植物が成熟して種子を作る前に、寄生植物を生育媒体から除去してよい。寄生植物は、例えば、寄生対象植物とともに生育媒体から回収して（例えば、刈り取って）もよい。

[0230] また、具体的には、例えば、本発明の組成物を寄生植物の発芽の抑制（例えば、発芽の抑制による寄生植物の防除）に利用する場合、本発明の組成物は、寄生対象植物が生育媒体に存在する期間に寄生植物の発芽が抑制されるように、寄生植物の発芽前に施用してよい。すなわち、例えば、本発明の組成物を寄生植物の発芽の抑制（例えば、発芽の抑制による寄生植物の防除）に利用する場合、本発明の組成物は、寄生植物の発芽前であって、且つ、寄

生対象植物が生育媒体に存在しない時点または存在する時点で施用してよい。すなわち、寄生対象植物が生育媒体に存在しない時点で予め本発明の組成物を施用することで、その後の寄生対象植物が生育媒体に存在する期間に寄生植物の発芽が抑制されてよい。また、寄生対象植物が生育媒体に存在する時点で本発明の組成物を施用することで、寄生対象植物が生育媒体に存在する期間に寄生植物の発芽が抑制されてよい。本発明の組成物を寄生植物の発芽の抑制（例えば、発芽の抑制による寄生植物の防除）に利用する場合、例えば、特に、寄生対象植物が生育媒体に存在する時点で本発明の組成物を施用してよい。寄生対象植物が生育媒体に存在する期間または時点としては、寄生対象植物の発芽後の期間または時点や寄生対象植物の苗を生育媒体に植え付けた後の期間または時点が挙げられる。

[0231] 本発明の組成物を寄生植物の種子に施用することにより、または、本発明の組成物を既に寄生植物の種子が存在する生育媒体に施用することにより、当該寄生植物の発芽（例えば自殺発芽）を誘導すること、当該寄生植物の発芽を抑制すること、当該種子から発生する寄生植物を防除すること、および／または当該種子から発生する寄生植物の寄生対象となる植物の栽培成績を向上させることができてよい。また、本発明の組成物を寄生植物の種子が存在しない生育媒体に施用することにより、将来的に生育媒体に存在し得る寄生植物の発芽（例えば自殺発芽）を誘導すること、将来的に生育媒体に存在し得る寄生植物の発芽を抑制すること、当該種子から発生する寄生植物を防除すること、および／または当該種子から発生する寄生植物の寄生対象となる植物の栽培成績を向上させることができてよい。すなわち、本発明の組成物は、例えば、既に寄生植物の種子で汚染された生育媒体における寄生植物の防除に使用されてもよく、将来的に寄生植物の種子で汚染され得る生育媒体における寄生植物の防除に予防的に使用されてもよい。

[0232] 例えば、本発明の組成物を栽培対象植物の分枝の抑制に利用する場合、本発明の組成物は、栽培対象植物の分枝が進行する前に施用してよい。具体定期には、例えば、本発明の組成物を利用して栽培対象植物の分枝を所望の程

度に制限する場合、本発明の組成物は、栽培対象植物の分枝が当該所望の程度まで進行する前に施用してよい。

[0233] 例えば、本発明の組成物を菌根菌の菌糸分岐の誘導に利用する場合、本発明の組成物は、菌根菌の菌糸分岐が完了する前に施用してよい。また、例えば、本発明の組成物は、菌根菌の菌糸分岐が完了した後に施用して、菌糸分岐をさらに進行させてもよい。

[0234] 本発明の組成物の施用量は、所望の効果が得られる限り、特に制限されない。本発明の組成物の施用量は、対象物の種類、対象物の生育方法、対象物の生育ステージ、本発明の組成物の利用目的、および本発明の組成物の施用方法や施用時期等の諸条件に応じて適宜選択することができる。

[0235] 本発明の組成物の施用量は、例えば、液体の形態の本発明の組成物（例えば有効成分を上記例示したような使用濃度で含有する液体の形態の本発明の組成物）の施用量として、100L／ヘクタール以上、200L／ヘクタール以上、500L／ヘクタール以上、1000L／ヘクタール以上、1500L／ヘクタール以上、2000L／ヘクタール以上、3000L／ヘクタール以上、4000L／ヘクタール以上、5000L／ヘクタール以上、7000L／ヘクタール以上、10,000L／ヘクタール以上、30,000L／ヘクタール以上、50,000ヘクタール以上、70,000ヘクタール以上、100,000L／ヘクタール以上、150,000L／ヘクタール以上、200,000L／ヘクタール以上、300,000L／ヘクタール以上、500,000L／ヘクタール以上、または750,000L／ヘクタール以上であってもよく、1,000,000L／ヘクタール以下、750,000L／ヘクタール以下、500,000L／ヘクタール以下、300,000L／ヘクタール以下、200,000L／ヘクタール以下、150,000L／ヘクタール以下、100,000L／ヘクタール以下、70,000L／ヘクタール以下、50,000L／ヘクタール以下、30,000L／ヘクタール以下、10,000L／ヘクタール以下、9000L／ヘクタール以下、8000L／ヘクタール以下、7000L／ヘクタール

ル以下、6000L／ヘクタール以下、5000L／ヘクタール以下、4000L／ヘクタール以下、3000L／ヘクタール以下、2000L／ヘクタール以下、または1500L／ヘクタール以下であってもよく、それらの矛盾しない組み合わせであってもよい。本発明の組成物の施用量は、具体的には、例えば、液体の形態の本発明の組成物（例えば有効成分を上記例示したような使用濃度で含有する液体の形態の本発明の組成物）の施用量として、100L／ヘクタール～1500L／ヘクタール、1500L／ヘクタール～5000L／ヘクタール、5000L／ヘクタール～10,000L／ヘクタール、10,000L／ヘクタール～30,000L／ヘクタール、30,000L／ヘクタール～50,000L／ヘクタール、50,000L／ヘクタール～100,000L／ヘクタール、100,000L／ヘクタール～150,000L／ヘクタール、150,000L／ヘクタール～200,000L／ヘクタール、200,000L／ヘクタール～500,000L／ヘクタール、または500,000L／ヘクタール～10,000,000L／ヘクタールであってもよい。本発明の組成物の施用量は、具体的には、例えば、液体の形態の本発明の組成物（例えば有効成分を上記例示したような使用濃度で含有する液体の形態の本発明の組成物）の施用量として、100L／ヘクタール～1,000,000L／ヘクタール、200L／ヘクタール～1,000,000L／ヘクタール、500L／ヘクタール～1,000,000L／ヘクタール、1000L／ヘクタール～750,000L／ヘクタール、10,000L／ヘクタール～750,000L／ヘクタール、または100,000L／ヘクタール～750,000L／ヘクタールであってもよい。また、本発明の組成物の施用量は、施用面積（二次元的の要素）だけではなく、三次元的要素も考慮して設定することができる。すなわち、本発明の組成物の施用量は、例えば、本発明の組成物を施用（例えば散布）する植物の高さに応じて設定することができる。本発明の組成物の施用量は、具体的には、例えば、液体の形態の本発明の組成物（例えば有効成分を上記例示したような使用濃度で含有する液体の形態の本発明

の組成物)の施用量として、地表面～膝高の植物では1000L/ヘクタール～750,000L/ヘクタール、1000L/ヘクタール～30,000L/ヘクタール、1000L/ヘクタール～5000L/ヘクタール、または1000L/ヘクタール～1500L/ヘクタールであってもよい。本発明の組成物の施用量は、具体的には、例えば、液体の形態の本発明の組成物(例えば有効成分を上記例示したような使用濃度で含有する液体の形態の本発明の組成物)の施用量として、膝高～ヒトの背丈の植物では1500L/ヘクタール～750,000L/ヘクタール、1500L/ヘクタール～70,000L/ヘクタール、1500L/ヘクタール～10,000L/ヘクタール、または1500L/ヘクタール～3000L/ヘクタールであってもよい。本発明の組成物の施用量は、具体的には、例えば、液体の形態の本発明の組成物(例えば有効成分を上記例示したような使用濃度で含有する液体の形態の本発明の組成物)の施用量として、ヒトの背丈～2メートルの植物では3000L/ヘクタール～750,000L/ヘクタール、3000L/ヘクタール～100,000L/ヘクタール、3000L/ヘクタール～30,000L/ヘクタール、または3000L/ヘクタール～5000L/ヘクタールであってもよい。本発明の組成物の施用量は、具体的には、例えば、液体の形態の本発明の組成物(例えば有効成分を上記例示したような使用濃度で含有する液体の形態の本発明の組成物)の施用量として、2メートル以上の植物では5000L/ヘクタール～750,000L/ヘクタール、5000L/ヘクタール～150,000L/ヘクタール、5000L/ヘクタール～30,000L/ヘクタール、または5000L/ヘクタール～7000L/ヘクタールであってもよい。本発明の組成物を生育媒体に施用(例えば、地表面へ灌注)する場合、本発明の組成物の施用量は、具体的には、例えば、液体の形態の本発明の組成物(例えば有効成分を上記例示したような使用濃度で含有する液体の形態の本発明の組成物)の施用量として、250,000L/ヘクタール～750,000L/ヘクタールであってもよい。本発明の組成物は、1回のみ施用してもよく、複数回に分

けて施用してもよい。本発明の組成物は、例えば、2回以上、3回以上、5回以上、または10回以上に分けて施用してもよい。本発明の組成物を複数回に分けて施用する場合、「本発明の組成物の施用量」とは、複数回の施用による本発明の組成物の総施用量を意味する。

[0236] また、本発明の組成物の施用量は、例えば、有効成分の施用量が所定の範囲となるように設定することができる。

[0237] 有効成分の施用量は、例えば、 $1\mu\text{mol}/\text{ヘクタール}$ 以上、 $10\mu\text{mol}/\text{ヘクタール}$ 以上、 $20\mu\text{mol}/\text{ヘクタール}$ 以上、 $50\mu\text{mol}/\text{ヘクタール}$ 以上、 $100\mu\text{mol}/\text{ヘクタール}$ 以上、 $200\mu\text{mol}/\text{ヘクタール}$ 以上、 $500\mu\text{mol}/\text{ヘクタール}$ 以上、 $1\text{mmol}/\text{ヘクタール}$ 以上、 $2\text{mmol}/\text{ヘクタール}$ 以上、 $5\text{mmol}/\text{ヘクタール}$ 以上、 $10\text{mmol}/\text{ヘクタール}$ 以上、 $20\text{mmol}/\text{ヘクタール}$ 以上、 $50\text{mmol}/\text{ヘクタール}$ 以上、 $100\text{mmol}/\text{ヘクタール}$ 以上、 $200\text{mmol}/\text{ヘクタール}$ 以上、 $500\text{mmol}/\text{ヘクタール}$ 以上、 $1\text{mol}/\text{ヘクタール}$ 以上、 $2\text{mol}/\text{ヘクタール}$ 以上、 $5\text{mol}/\text{ヘクタール}$ 以上、 $10\text{mol}/\text{ヘクタール}$ 以上、 $20\text{mol}/\text{ヘクタール}$ 以上、 $50\text{mol}/\text{ヘクタール}$ 以上、 $100\text{mol}/\text{ヘクタール}$ 以上、 $300\text{mol}/\text{ヘクタール}$ 以上であってもよく、 $500\text{mol}/\text{ヘクタール}$ 以上、 $1000\text{mol}/\text{ヘクタール}$ 以上、または $1500\text{mol}/\text{ヘクタール}$ 以上であってもよく、 $2500\text{mol}/\text{ヘクタール}$ 以下、 $1500\text{mol}/\text{ヘクタール}$ 以下、 $1000\text{mol}/\text{ヘクタール}$ 以下、 $500\text{mol}/\text{ヘクタール}$ 以下、 $200\text{mol}/\text{ヘクタール}$ 以下、 $100\text{mol}/\text{ヘクタール}$ 以下、 $50\text{mol}/\text{ヘクタール}$ 以下、 $20\text{mol}/\text{ヘクタール}$ 以下、 $10\text{mol}/\text{ヘクタール}$ 以下、 $5\text{mol}/\text{ヘクタール}$ 以下、 $2\text{mol}/\text{ヘクタール}$ 以下、 $1\text{mol}/\text{ヘクタール}$ 以下、 $500\text{mmol}/\text{ヘクタール}$ 以下、 $200\text{mmol}/\text{ヘクタール}$ 以下、 $100\text{mmol}/\text{ヘクタール}$ 以下、 $50\text{mmol}/\text{ヘクタール}$ 以下、 $20\text{mmol}/\text{ヘクタール}$ 以下、 $10\text{mmol}/\text{ヘクタール}$ 以下、 $5\text{mmol}/\text{ヘクタール}$ 以下、 $2\text{mmol}/\text{ヘクタール}$ 以下、 $1\text{mmol}/\text{ヘクタール}$ 以下、 $500\mu\text{mol}$

／ヘクタール以下、 $200\mu\text{mol}$ ／ヘクタール以下、または $100\mu\text{mol}$ ／ヘクタール以下であってもよく、それらの矛盾しない組み合わせであってもよい。有効成分の施用量は、具体的には、例えば、 $1\mu\text{mol}$ ／ヘクタール～ $100\mu\text{mol}$ ／ヘクタール、 $10\mu\text{mol}$ ／ヘクタール～ 1mmol ／ヘクタール、 1mmol ／ヘクタール～ 10mmol ／ヘクタール、 10mmol ／ヘクタール～ 100mmol ／ヘクタール、 100mmol ／ヘクタール～ 1mol ／ヘクタール、 1mol ／ヘクタール～ 10mol ／ヘクタール、 10mol ／ヘクタール～ 100mol ／ヘクタール、 100mol ／ヘクタール～ 500mol ／ヘクタール、 500mol ／ヘクタール～ 1000mol ／ヘクタール、 1000mol ／ヘクタール～ 1500mol ／ヘクタール、または 1500mol ／ヘクタール～ 2500mol ／ヘクタールであってもよい。本発明の組成物を複数回に分けて施用する場合、「有効成分の施用量」とは、複数回の施用による有効成分の総施用量を意味する。

[0238] 上述したような本発明の組成物の施用態様に関する記載は、有効成分を植物に施用するその他のいずれの場合にも準用できる。すなわち、有効成分は、例えば、上記例示したような使用濃度で植物に施用されてよい。また、有効成分は、例えば、上記例示したような有効成分の施用量で植物に施用されてよい。また、有効成分は、例えば、有効成分を含有する、液体組成物等の組成物として調製され、植物に施用されてよい。有効成分を含有する組成物については、本発明の組成物の説明を準用できる。有効成分は、特に、液体の形態で植物に施用することができる。すなわち、有効成分は、具体的には、例えば、有効成分を上記例示したような使用濃度で含有する液体組成物として調製され、植物に施用されてよい。また、有効成分は、例えば、展着剤等の他の成分と併用してもよい。

[0239] なお、本発明の方法を利用して植物を栽培することにより、植物（具体的には植物体）が得られる。よって、本発明の方法の一態様は、植物（具体的には植物体）を製造する方法であってもよい。本発明の方法の一態様は、よ

り具体的には、有効成分（すなわち上記成分（A）、（B）、または（C））を寄生植物の種子、栽培対象植物、菌根菌等の対象物に施用して植物を栽培することを含む、植物（具体的には植物体）を製造する方法であってもよい。対象物と製造される植物の組み合わせは、適宜選択できる。対象物と製造される植物の組み合わせとしては、寄生植物の種子と寄生対象植物の組み合わせ、栽培対象植物と栽培対象植物の組み合わせ（これは、有効成分が施用された栽培対象植物が栽培されることを意味する）、菌根菌と共生対象植物の組み合わせが挙げられる。製造される植物の栽培方法は、特に制限されない。製造される植物の栽培は、有効成分を対象物に施用すること以外は、例えば、植物を栽培する通常の方法と同一の方法により実施することができる。植物の栽培方法については、上述した通りである。有効成分の施用と製造される植物の栽培は、例えば、有効成分の施用による所望の効果が得られるように実施してよい。例えば、製造される植物の栽培中に有効成分の施用を実施してもよく、有効成分の施用の実施後に製造される植物の栽培を実施してもよい。具体的には、例えば、寄生植物の自殺発芽の誘導後、寄生植物の発芽の抑制後、または寄生植物の防除後に寄生対象植物の栽培を実施してよい。すなわち、本発明の方法の一態様は、例えば、有効成分（すなわち上記成分（A）、（B）、または（C））を寄生植物の種子に施用することにより、寄生植物の自殺発芽を誘導し、寄生植物の発芽を抑制し、または寄生植物を防除すること；および前記施用後（具体的には、寄生植物の自殺発芽の誘導後、寄生植物の発芽の抑制後、または寄生植物の防除後）に寄生対象植物を栽培することを含む、寄生対象植物（具体的には寄生対象植物の植物体）を製造する方法であってもよい。また、本発明の方法の一態様は、例えば、寄生対象植物を栽培すること；および前記栽培中に有効成分（すなわち上記成分（A）、（B）、または（C））を寄生植物の種子に施用することにより、寄生植物の発芽を抑制することを含む、寄生対象植物（具体的には寄生対象植物の植物体）を製造する方法であってもよい。植物（具体的には植物体）は適宜収穫することができる。すなわち、本発明の方法は、さらに

、植物（具体的には植物体）を収穫することを含んでいてもよい。「収穫」は、「回収」と代替可能に用いられてよい。「植物の収穫または回収」は、「植物体の収穫または回収」と代替可能に用いられてよい。収穫される植物（具体的には植物体）は、植物体の全体であってもよく、植物体の一部であってもよい。植物体の一部としては、葉、茎、幹、根、果実が挙げられる。

[0240] <4>有効成分の使用

また、本発明は、上記例示した用途での有効成分の使用を開示する。すなわち、本発明は、例えば、寄生植物の発芽（例えば、自殺発芽）の誘導、寄生植物の発芽の抑制、寄生植物の防除、栽培対象植物の分枝の抑制、菌根菌の菌糸分岐の誘導、または植物（例えば、寄生対象植物、栽培対象植物、または共生対象植物）の栽培成績の向上のための有効成分の使用や、寄生植物の発芽（例えば、自殺発芽）の誘導、寄生植物の発芽の抑制、寄生植物の防除、栽培対象植物の分枝の抑制、菌根菌の菌糸分岐の誘導、または植物（例えば、寄生対象植物、栽培対象植物、または共生対象植物）の栽培成績の向上用の組成物の製造における有効成分の使用を開示する。

[0241] また、本発明は、上記例示した用途に用いるための有効成分を開示する。すなわち、本発明は、例えば、寄生植物の発芽（例えば、自殺発芽）の誘導、寄生植物の発芽の抑制、寄生植物の防除、栽培対象植物の分枝の抑制、菌根菌の菌糸分岐の誘導、または植物（例えば、寄生対象植物、栽培対象植物、または共生対象植物）の栽培成績の向上に用いるための有効成分や、寄生植物の発芽（例えば、自殺発芽）の誘導、寄生植物の発芽の抑制、寄生植物の防除、栽培対象植物の分枝の抑制、菌根菌の菌糸分岐の誘導、または植物（例えば、寄生対象植物、栽培対象植物、または共生対象植物）の栽培成績の向上用の組成物の製造に用いるための有効成分を開示する。

実施例

[0242] 以下、非限定的な実施例により本発明をさらに具体的に説明する。

[0243] (合成例)

以下の方法により、化合物 1 ～ 90 を得た。化合物 1 ～ 90 の構造を、そ

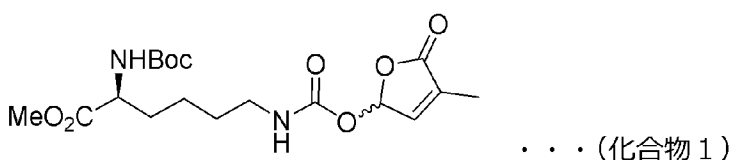
れぞれ、下記式（化合物 1）～（化合物 90）に示す。

[0244] 合成例 1

N^{α} -Boc-Lys-OMe $\cdot$ AcOH $\cdot$ nH_2O (0 $\cdot$ AcOH) (296 mg, 0.87 mmol、一水和物として) のクロロホルム溶液 (5 mL) に、ピリジン (0.2 mL) を加え、0°C にて 5 分間攪後、トリホスゲン (266 mg, 0.99 mmol) のクロロホルム溶液 (5 mL) を加え、さらに 2 時間攪拌した。反応液に 0.1N 塩酸を加えた後、クロロホルムで分配抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで脱水乾燥後、減圧により濃縮乾固した。得られた残渣を精製することなくクロロホルム (2 mL) に溶解後、5-ヒドロキシ-3-メチル-2,5-ジヒドロフラン-2-オン (115 mg, 1.01 mmol) およびトリエチルアミン (0.15 mL, 1.08 mmol) を加え、室温にて 5 時間攪拌した。反応液にクロロホルムを加え、0.1N 塩酸で分配洗浄し、有機層を無水硫酸ナトリウムで脱水乾燥した。減圧により有機層を濃縮乾固して得られた残渣を、逆相 HPLC (水-アセトニトリルによるリニアグラジエント) により精製することで化合物 1 を得た。

収率 13%; ESI MS m/z 423.1 ($M+Na$)⁺; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.09 (1H, t, $J=1.6$ Hz), 6.85 (1H, t, $J=1.6$ Hz), 4.11 (1H, dd, $J=4.8, 8.8$ Hz), 3.73 (3H, s), 3.16 (2H, t, $J=6.8$ Hz), 1.94 (3H, s), 1.79 (1H, m), 1.67 (1H, m), 1.58–1.52 (2H, m), 1.46 (11H, brs).

[0245] [化5]



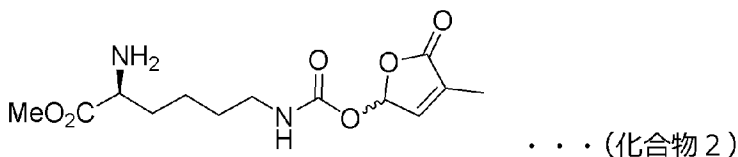
[0246] 合成例 2

化合物 1 (23 mg, 0.057 mmol) を蟻酸 (0.1 mL) に溶解後、室温にて 18 時間攪拌した。減圧により反応液を濃縮乾固することで、化合物 2 を蟻酸塩として得た。

収率 99%; ESI MS m/z 301.0 ($M+H$)⁺; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 9.26 (1H, s), 7.09 (1H, t, $J=1.6$ Hz), 6.85 (1H, t, $J=1.6$ Hz), 4.06 (1H, t, $J=6.4$

Hz), 3.86 (3H, s), 3.25–3.12 (2H, m), 1.99–1.89 (5H, m), 1.62–1.43 (4 H, m).

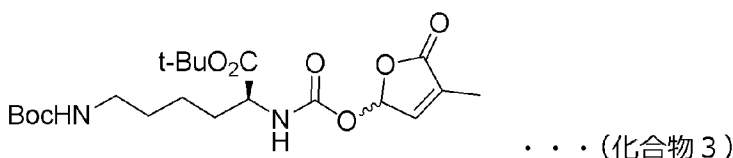
[0247] [化6]



[0248] 合成例 3

N^ε-Boc-リジンt-ブチルエステルおよび5-ヒドロキシ-3-メチル-2,5-ジヒドロフラン-2-オンを原料に、化合物 1 と同様の方法により、化合物 3 を得た。収率20%；¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.11 (1H, m), 6.85 (1H, m), 4.06 (1 H, m), 3.07–3.03 (2H, m), 1.95 (3H, d, J=0.8 Hz), 1.81 (1H, m), 1.69 (1H, m), 1.49–1.44 (22H, m)

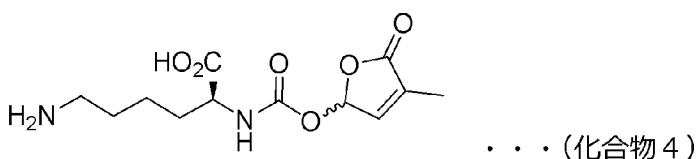
[0249] [化7]



[0250] 合成例 4

化合物 3 を原料に、化合物 2 と同様の方法により、化合物 4 を得た。収率99%；ESI MS m/z 287.0 (M+H)⁺；¹H NMR (400 MHz, D₂O) δ 7.08 (0.5H, d, J=1.6 Hz), 7.05 (0.5H, d, J=2.0 Hz), 6.76 (0.5H, t, J=1.6 Hz), 6.74 (0.5H, t, J=1.6 Hz), 3.95 (1H, m), 2.91 (2H, t, J=7.6 Hz), 1.85 (3H, s), 1.76 (1H, m), 1.68–1.58 (3H, m), 1.39–1.33 (2H, m).

[0251] [化8]



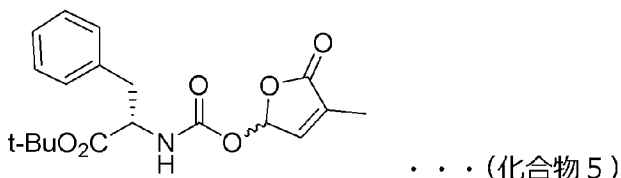
[0252] 合成例 5

CDI (カルボジイミダゾール) (80 mg, 0.49 mmol) をTHF (3 mL) に溶解

し、5-ヒドロキシ-3-メチル-2,5-ジヒドロフラン-2-オン (59 mg, 0.52 mmol) を加え、室温にて5時間攪拌した。反応液に、フェニルアラニンt-ブチルエステル塩酸塩 (125 mg, 0.49 mmol) を加えた後、氷冷下、トリエチルアミン (0.08 mL, 0.57 mmol) を加え、室温にてさらに1時間攪拌した。反応液に酢酸エチルを加えた後、0.1N塩酸で分配洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで脱水乾燥後、減圧により濃縮乾固した。残渣を逆相HPLC (0.1%ギ酸を含む水-アセトニトリル) により精製することで化合物5を得た。

収率35%; ESI MS m/z 384.1 ($M+Na$)⁺; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.33–7.22 (5H, m), 7.09 (0.5H, s), 7.05 (0.5H, s), 6.81 (0.5H, brs), 6.78 (0.5H, brs), 4.34 (1H, m), 2.96 (1H, m), 2.11 (1H, m), 1.44 (4H, s), 1.41 (5H, m).

[0253] [化9]

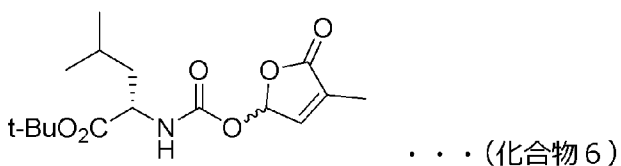


[0254] 合成例 6

ロイシンt-ブチルエステル塩酸塩および5-ヒドロキシ-3-メチル-2,5-ジヒドロフラン-2-オンを原料に、化合物5と同様の方法により、化合物6を得た。

収率21%; ESI MS m/z 350.0 ($M+Na$)⁺; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.11 (1H, m), 6.85 (1H, m), 4.12 (1H, m), 1.95 (3H, s), 1.73 (1H, m), 1.60–1.56 (2H, m), 1.49 (9H, s), 0.99–0.94 (6H, m).

[0255] [化10]

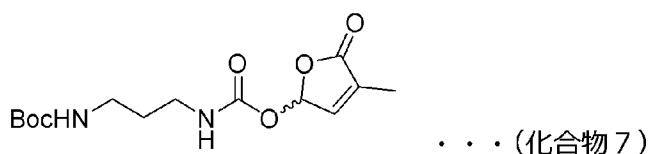


[0256] 合成例 7

モノN-Boc-プロピレンジアミンを原料に、化合物1と同様の方法により、化合物7を得た。

収率40% ; ESI MS m/z 337.1 (M+Na)⁺; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.09 (1H, t, J=1.6 Hz), 6.85 (1H, t, J=1.6 Hz), 3.19 (2H, t, J=6.8 Hz), 3.10 (2H, t, J=6.8 Hz), 1.94 (3H, s), 1.71–1.64 (2H, m), 1.45 (9H, s).

[0257] [化11]

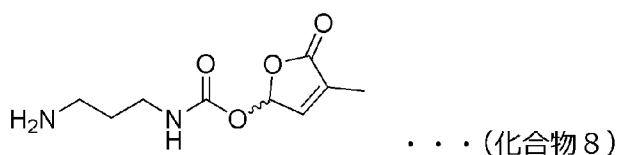


[0258] 合成例8

化合物7を原料に、化合物2と同様の方法により、化合物8を蟻酸塩として得た。

収率99% ; ESI MS m/z 215.0 (M+H)⁺; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 8.34 (1H, s), 7.10 (1H, t, J=1.6 Hz), 6.85 (1H, t, J=1.6 Hz), 3.30–3.23 (2H, m), 3.00 (2H, t, J=7.6 Hz), 1.949 (3H, s), 1.945–1.88 (2H, m).

[0259] [化12]

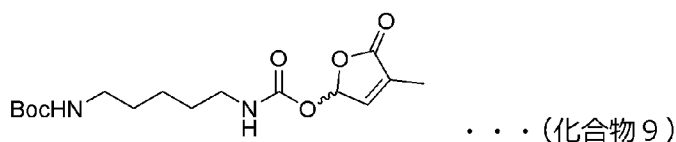


[0260] 合成例9

モノN-Boc-カダベリオンおよび5-ヒドロキシ-3-メチル-2,5-ジヒドロフラン-2-オンを原料に、化合物5と同様の方法により、化合物9を得た。

収率19% ; ESI MS m/z 365.1 (M+Na)⁺; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 6.87 (2H, m), 5.06 (1H, brs), 4.57 (1H, brs), 3.25–3.20 (2H, m), 3.14–3.09 (2H, m), 1.97 (3H, s), 1.58–1.48 (4H, m), 1.43 (9H, s), 1.39–1.33 (2H, m).

[0261] [化13]

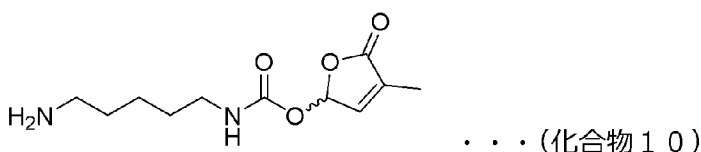


[0262] 合成例 10

化合物9を原料に、化合物2と同様の方法により、化合物10を蟻酸塩として得た。

収率99% ; ESI MS m/z 243.0 (M+H)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 8.51 (1H, s), 7.09 (1H, d, J=1.6 Hz), 6.84 (1H, t, J=1.6 Hz), 3.23–3.14 (2H, m), 2.94 (2H, t, J=7.6 Hz), 1.94 (3H, s), 1.72–1.68 (2H, m), 1.61–1.55 (2H, m), 1.48–1.42 (2H, m).

[0263] [化14]



[0264] 合成例 11

化合物9 (2.5 mg, 0.0073 mmol) をヘプタフルオロ酪酸 (0.1 mL) に溶解後、室温にて18時間攪拌した。減圧により濃縮乾固することで、化合物10をヘプタフルオロ酪酸塩として得た。

収率99% ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.09 (1H, d, J=1.6 Hz), 6.85 (1H, t, J=1.6 Hz), 3.25–3.13 (2H, m), 2.94 (2H, t, J=7.6 Hz), 1.94 (3H, s), 1.72–1.68 (2H, m), 1.61–1.56 (2H, m), 1.48–1.42 (2H, m).

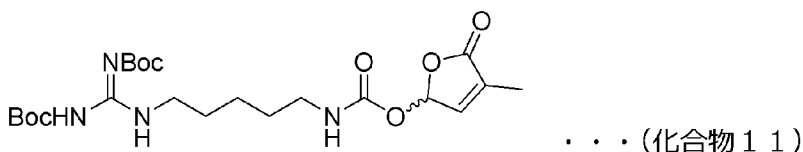
[0265] 合成例 12

化合物10 (蟻酸塩) (264 mg) のTHF溶液 (15 mL) に、トリエチルアミン (0.15 mL) を加え、室温にて5分間攪拌した。反応液に、N,N',N''-トリ-Boc-グアニジン (327 mg) を加え、室温にてさらに2日間攪拌した。減圧により反応液を濃縮後、酢酸エチルを加え、1N塩酸にて分配洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで脱水乾燥後、減圧により濃縮乾固した。得られた残渣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) にて精製することで化合物11を得た。

収率35% ; ESI MS m/z 485.3 (M+H)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.08 (1H, t, J=1.6 Hz), 6.85 (1H, t, J=1.6 Hz), 3.39–3.36 (2H, m), 3.20–3.16 (2H,

m), 1.94 (3H, s), 1.66–1.38 (24H, m).

[0266] [化15]

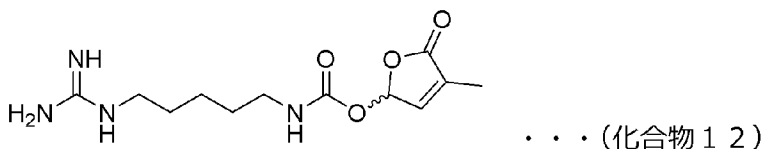


[0267] 合成例 1 3

化合物 1 1 を原料に、化合物 2 と同様の方法により、化合物 1 2 を蟻酸塩として得た。

収率99% ; ESI MS m/z 285 ($M+H$)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 8.38 (1H, s), 7.10 (1H, t, $J=1.6$ Hz), 6.84 (1H, t, $J=1.6$ Hz), 3.21–3.15 (4H, m), 1.94 (3H, s), 1.65–1.56 (4H, m), 1.46–1.40 (4H, m).

[0268] [化16]



[0269] 合成例 1 4

化合物 1 1 を原料に、化合物 9 と同様の方法により、化合物 1 2 をヘプタフルオロ酪酸塩として得た。

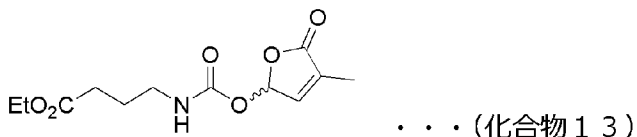
収率99% ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.09 (1H, s), 6.84 (1H, d, $J=1.6$ Hz), 3.24–3.13 (4H, m), 1.94 (3H, s), 1.66–1.55 (4H, m), 1.45–1.40 (2H, m).

[0270] 合成例 1 5

GABAエチルエステルおよび5-ヒドロキシ-3-メチル-2,5-ジヒドロフラン-2-オンを原料に、化合物 5 と同様の方法により、化合物 1 3 を得た。

収率14% ; ESI MS m/z 272.0 ($M+H$)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.09 (1H, t, $J=1.6$ Hz), 6.85 (1H, t, $J=1.6$ Hz), 4.14 (2H, q, $J=7.2$ Hz), 3.20 (2H, t, $J=7.2$ Hz), 2.38 (2H, t, $J=7.2$ Hz), 1.94 (3H, s), 1.86–1.79 (2H, m), 1.27 (3H, t, $J=7.2$ Hz).

[0271] [化17]

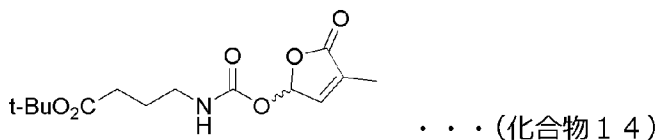


[0272] 合成例 16

GABA t-ブチルエステルおよび5-ヒドロキシ-3-メチル-2,5-ジヒドロフラン-2-オンを原料に、化合物5と同様の方法により、化合物14を合成した。

収率20%; ESI MS 322.0 (M+Na)⁺; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.09 (1H, t, J=1.6 Hz), 6.85 (1H, t, J=1.6 Hz), 3.20–3.17 (2H, m), 2.29 (2H, t, J=7.6 Hz), 1.94 (3H, s), 1.82–1.75 (2H, m), 1.47 (9H, s).

[0273] [化18]

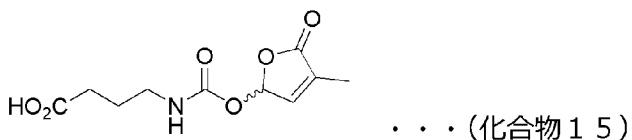


[0274] 合成例 17

化合物14を原料に、化合物2と同様の方法により、化合物15を得た。

収率73%; ESI MS 244.0 (M+H)⁺; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.09 (1H, t, J=1.6 Hz), 6.85 (1H, t, J=1.6 Hz), 3.23–3.19 (2H, m), 2.36 (2H, t, J=7.6 Hz), 1.94 (3H, s), 1.86–1.79 (2H, m).

[0275] [化19]



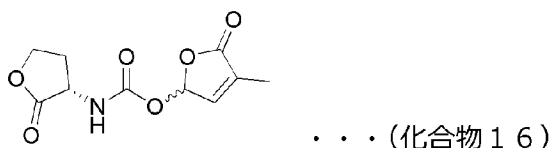
[0276] 合成例 18

L-ホモセリンラクトン塩酸塩および5-ヒドロキシ-3-メチル-2,5-ジヒドロフラン-2-オンを原料に、化合物5と同様の方法により、化合物16を得た。

収率7%; ESI MS m/z 263.9 (M+Na)⁺; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.12 (1H, m), 6.87 (1H, m), 4.52 (0.5H, m), 4.33 (1.5H, m), 4.29 (1H, m), 2.60 (1

H, m), 2.33 (1H, m), 1.95 (3H, s).

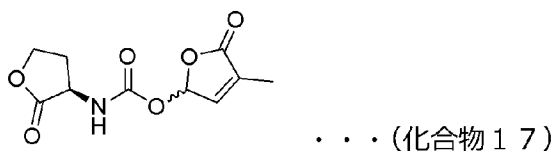
[0277] [化20]



[0278] 合成例 19

D-ホモセリンラクトン塩酸塩および5-ヒドロキシ-3-メチル-2,5-ジヒドロフラン-2-オンを原料に、化合物5と同様の方法により、化合物17を得た。
収率19%; ESI MS m/z 263.9 (M+Na)⁺; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.11 (1H, m), 6.87 (1H, m), 4.61–4.56 (1.5H, m), 4.51–4.42 (1.5H, m), 4.32 (1H, m), 2.59 (1H, m), 2.33 (1H, m), 1.95 (3H, s).

[0279] [化21]

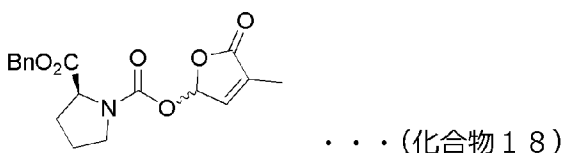


[0280] 合成例 20

プロリンベンジルエステル塩酸塩および5-ヒドロキシ-3-メチル-2,5-ジヒドロフラン-2-オンを原料に、化合物5と同様の方法により、化合物18を得た。

収率16%; ESI MS m/z 368.0 (M+Na)⁺; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.42–7.34 (4H, m), 7.12 (0.7H, t, J=1.6 Hz), 7.05 (0.3H, t, J=1.6 Hz), 6.84 (1H, m), 6.70 (0.7H, t, J=1.6 Hz), 6.48 (0.3H, t, J=1.6 Hz), 5.27–5.02 (1.7H, m), 5.03 (0.3H, d, J=11.6 Hz), 4.42 (1H, m), 3.61–3.49 (2H, m), 2.32 (1H, m), 2.07–1.86 (6H, m).

[0281] [化22]

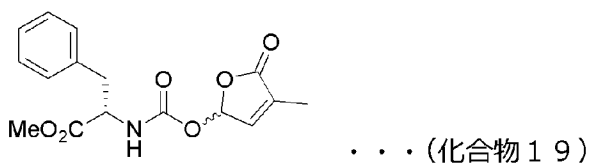


[0282] 合成例 2 1

フェニルアラニンメチルエステル塩酸塩および5-ヒドロキシ-3-メチル-2,5-ジヒドロフラン-2-オンを原料に、化合物5と同様の方法により、化合物19を得た。

収率22% ; ESI MS m/z 342.0 (M+Na)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.32–7.22 (5H, m), 7.08 (0.5H, s), 7.03 (0.5H, t, J=1.6 Hz), 6.79 (0.5H, s), 6.76 (0.5H, s), 4.48 (1H, m), 3.74 (1.5H, s), 3.72 (1.5H, s), 3.18 (1H, m), 2.97 (1H, m), 1.94 (1.5H, s), 1.93 (1.5H, s).

[0283] [化23]

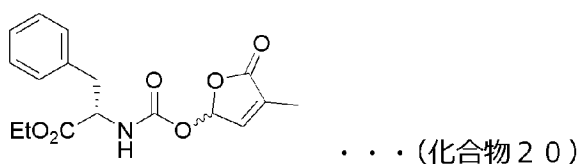


[0284] 合成例 2 2

フェニルアラニンエチルエステル塩酸塩および5-ヒドロキシ-3-メチル-2,5-ジヒドロフラン-2-オンを原料に、化合物5と同様の方法により、化合物20を得た。

収率15% ; ESI MS m/z 356.0 (M+Na)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.32–7.22 (5H, m), 7.08 (0.5H, s), 7.04 (0.5H, t, J=1.6 Hz), 6.78 (0.5H, d, J=1.2 Hz), 6.76 (0.5H, d, J=1.6 Hz), 4.45 (1H, m), 4.21–4.13 (2H, m), 3.17 (1H, m), 2.98 (1H, m), 1.94 (1.5H, s), 1.93 (1.5H, s), 1.26–1.20 (3H, m).

[0285] [化24]



[0286] 合成例 2 3

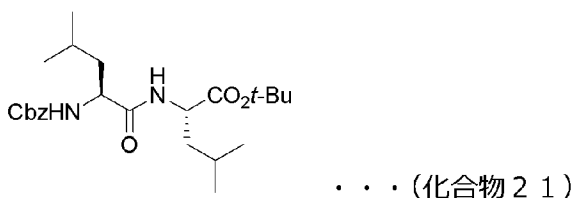
(工程1) 化合物21の合成

N-Cbz-ロイシン (259 mg, 0.95 mmol) のアセトニトリル溶液 (10 mL) に

、HOAt (132 mg, 0.97 mmol) およびWSC・HCl (190 mg, 0.99 mmol) を加え、室温にて1時間攪拌した。反応液に、ロイシンt-ブチルエステル塩酸塩 (235 mg, 1.05 mmol) およびトリエチルアミン (0.16 mL, 1.15 mmol) を加え、さらに室温にて3時間攪拌した。減圧により反応液を濃縮し、酢酸エチルを加えた後、10%クエン酸水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で順次分配洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで脱水乾燥後、減圧により濃縮乾固することで化合物21を得た。

収率93%; ESI MS m/z 457.2 ($M+Na$)⁺; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.39–7.30 (5H, m), 5.12 (1H, d, $J=12.0$ Hz), 5.09 (1H, d, $J=12.0$ Hz), 4.35 (1H, dd, $J=6.0, 8.8$ Hz), 4.22 (1H, m), 1.73 (4H, m), 1.62–1.54 (4H, m), 1.47 (9H, s), 0.99–0.91 (12H, m).

[0287] [化25]

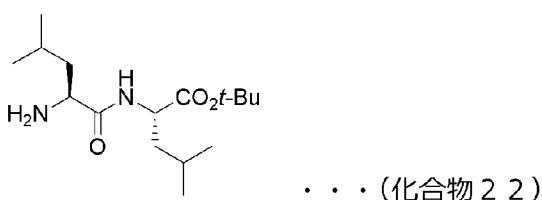


[0288] (工程2) 化合物22の合成

化合物21 (370 mg, 0.85 mmol) のエタノール溶液 (10 mL) に、5%パラジウム炭素 (54 mg) を加え、水素雰囲気下、室温にて18時間攪拌した。反応液を濾過後、得られた濾液を減圧により濃縮乾固することで、化合物22を得た。

収率88%; ESI MS m/z 301.2 ($M+H$)⁺; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 4.37 (1H, t, $J=6.8$ Hz), 3.40 (1H, dd, $J=6.0, 8.0$ Hz), 1.79–1.71 (2H, m), 1.63–1.56 (3H, m), 1.48 (9H, s), 1.39 (1H, m), 1.00–0.94 (12H, m).

[0289] [化26]

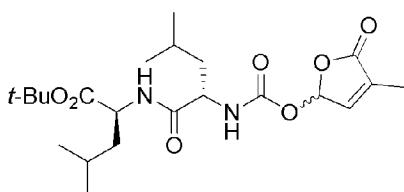


[0290] (工程3) 化合物23の合成

化合物22および5-ヒドロキシ-3-メチル-2,5-ジヒドロフラン-2-オンを原料に、化合物5と同様の方法により、化合物23を得た。

収率17% ; ESI MS m/z 463.2 ($M+Na$)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.10 (1H, m), 6.84 (1H, m), 4.34 (1H, m), 4.25 (1H, m), 1.95 (3H, s), 1.76–1.71 (2H, m), 1.64–1.58 (4H, m), 1.47 (9H, s), 1.00–0.93 (12H, m).

[0291] [化27]



... (化合物23)

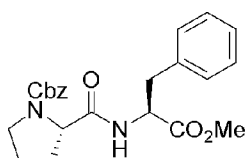
[0292] 合成例24

(工程1) 化合物24の合成

フェニルアラニンメチルエステル塩酸塩とN-Cbz-プロリンを原料に、化合物21と同様の方法により化合物24を得た。

収率94% ; ESI MS m/z 411.1 ($M+H$)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.39–7.15 (10H, m), 5.14 (2H, brs), 5.06 (1H, d, $J=12.4$ Hz), 4.99 (1H, d, $J=12.4$ Hz), 4.68 (1H, m), 4.29 (1H, m), 3.69 (1.5H, s), 3.65 (1.5H, s), 3.53–3.45 (2H, m), 3.16–3.07 (1.5H, m), 2.92 (0.5H, dd, $J=4.8, 14.0$ Hz), 2.18 (1H, m), 1.85–1.80 (3H, m).

[0293] [化28]



... (化合物24)

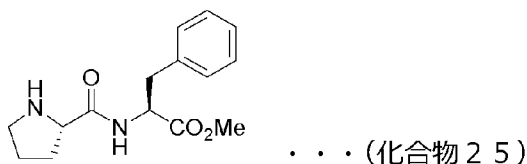
[0294] (工程2) 化合物25の合成

化合物24を原料に、化合物22と同様の方法により化合物25を得た。

収率95% ; ESI MS m/z 277.0 ($M+H$)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.31–7.18 (5H, m), 4.72 (1H, dd, $J=5.2, 8.8$ Hz), 3.74 (3H, s), 3.63 (1H, dd, $J=5$

.2, 9.2 Hz), 3.21 (1H, dd, J=5.2, 14.0 Hz), 3.02 (1H, dd, J=8.8, 14.0 Hz), 2.90–2.84 (2H, m), 2.06 (1H, m), 1.69–1.57 (3H, m).

[0295] [化29]

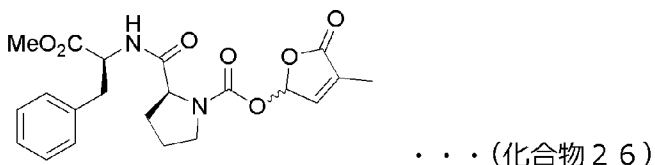


[0296] (工程 3) 化合物 2 6 の合成

化合物 2 5 および 5-ヒドロキシ-3-メチル-2,5-ジヒドロフラン-2-オンを原料に、化合物 5 と同様の方法により、化合物 2 6 を得た。

収率20% ; ESI MS m/z 417.1 (M+H)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.33–7.06 (6H, m), 7.06–6.77 (1H, m), 4.82 (0.5H, m), 4.71 (0.5H, m), 4.35 (0.5H, m), 4.25 (0.5H, m), 3.74 (1.5H, s), 3.70 (1.5H, s), 3.58–3.45 (2H, m), 3.24–2.99 (2H, m), 2.17 (1H, m), 1.97–1.72 (6H, m).

[0297] [化30]



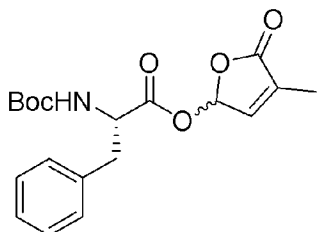
[0298] 合成例 2 5

N-Boc-フェニルアラニンおよび 5-ヒドロキシ-3-メチル-2,5-ジヒドロフラン-2-オンを原料に、化合物 2 1 と同様の方法を用いることにより、化合物 2 7 を得た。

収率88% ; ESI MS m/z 384.1 (M+Na)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.19–7.10 (4H, m), 7.03–6.95 (1H, m), 6.83–6.72 (2H, m), 4.29 (1H, m), 3.00 (1H, m), 2.86 (1H, m), 1.82 (0.6H, s), 1.81 (0.4H, s), 1.28 (9H, s).

[0299]

[化31]



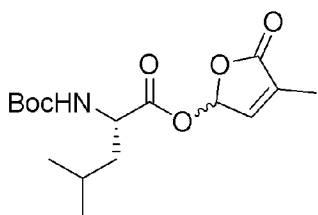
・・・(化合物 27)

[0300] 合成例 26

N-Boc-ロイシンおよび5-ヒドロキシ-3-メチル-2,5-ジヒドロフラン-2-オンを原料に、化合物 21 と同様の方法を用いることにより、化合物 28 を得た。

収率91% ; ESI MS m/z 350.1 ($M+Na$)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.03 (0.5H, t, $J=1.6$ Hz), 7.00 (0.5H, t, $J=1.6$ Hz), 6.82 (1H, t, $J=1.6$ Hz), 6.79 (0.5H, d, $J=1.6$ Hz), 4.09 (1H, m), 1.84 (3H, d, $J=1.6$ Hz), 1.62 (1H, m), 1.52–1.43 (2H, m), 1.34 (9H, s), 0.86–0.81 (6H, m).

[0301] [化32]



・・・(化合物 28)

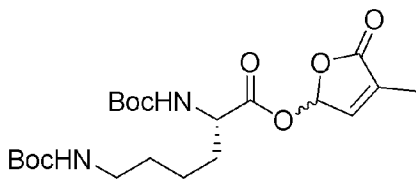
[0302] 合成例 27

N^α-, N^ε-ジBoc-リジンおよび5-ヒドロキシ-3-メチル-2,5-ジヒドロフラン-2-オンを原料に、化合物 21 と同様の方法を用いることにより、化合物 29 を得た。

収率92% ; ESI MS m/z 465.2 ($M+Na$)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 4.01 (1H, m), 2.95–2.92 (2H, m), 1.95 (3H, d, $J=0.8$ Hz), 1.87 (1H, m), 1.71 (1H, m), 1.49–1.44 (22H, m).

[0303]

[化33]



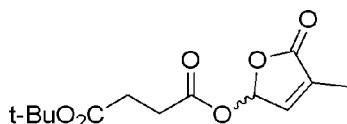
・・・(化合物 29)

[0304] 合成例 28

コハク酸モノ t -ブチルエステルおよび5-ヒドロキシ-3-メチル-2,5-ジヒドロフラン-2-オンを原料に、化合物21と同様の方法を用いることにより、化合物30を得た。

収率87%; ESI MS m/z 293.1 ($M+Na$)⁺; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.12 (1H, t, $J=1.6$ Hz), 6.92 (1H, t, $J=1.6$ Hz), 2.67–2.65 (2H, m), 2.59–2.56 (2H, m), 1.86 (3H, s), 1.46 (9H, s).

[0305] [化34]



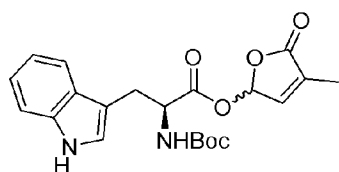
・・・(化合物 30)

[0306] 合成例 29

N-Boc-トリプトファンおよび5-ヒドロキシ-3-メチル-2,5-ジヒドロフラン-2-オンを原料に、化合物21と同様の方法を用いることにより、化合物31を得た。

収率95%; ESI MS m/z 423.1 ($M+Na$)⁺; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.41 (1H, m), 7.24 (1H, m), 7.02–6.90 (3H, m), 6.82 (0.33H, t, $J=1.6$ Hz), 6.73 (0.67H, m), 6.56 (0.67H, t, $J=1.6$ Hz), 6.32 (0.33H, d, $J=2.4$ Hz), 4.36 (1H, m), 3.18–3.02 (2H, m), 1.79 (1H, s), 1.72 (2H, s), 1.30 (3H, s), 1.28 (6H, s).

[0307] [化35]



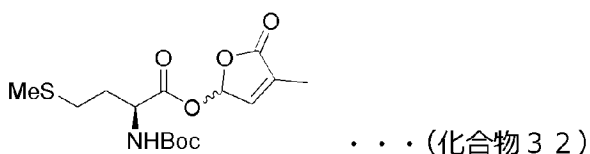
・・・(化合物 31)

[0308] 合成例 3 0

N-Boc-メチオニンおよび5-ヒドロキシ-3-メチル-2,5-ジヒドロフラン-2-オンを原料に、化合物 2 1 と同様の方法を用いることにより、化合物 3 2 を得た。

収率99%; ESI MS m/z 377.0 ($M+MeOH$)⁺; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.02 (1H, m), 6.82 (1H, t, $J=1.6$ Hz), 4.24 (0.5H, m), 4.04 (0.5H, m), 2.53–2.39 (2H, m), 2.08–1.74 (8H, m), 1.34 (9H, s).

[0309] [化36]

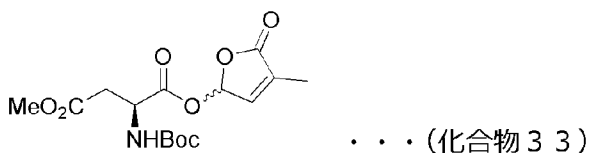


[0310] 合成例 3 1

N-Boc-アスパラギン酸 β -メチルエステルおよび5-ヒドロキシ-3-メチル-2,5-ジヒドロフラン-2-オンを原料に、化合物 2 1 と同様の方法を用いることにより、化合物 3 3 を得た。

収率87%; ESI MS m/z 366.0 ($M+Na$)⁺; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.00 (1H, m), 6.80 (1H, t, $J=1.6$ Hz), 4.47 (1H, m), 3.59 (3H, s), 2.84–2.67 (2H, m), 1.84 (3H, s), 1.34 (9H, s).

[0311] [化37]



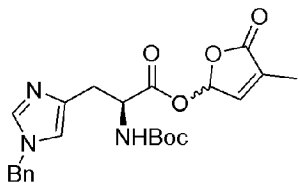
[0312] 合成例 3 2

τ -ベンジル-N α -Boc-ヒスチジンおよび5-ヒドロキシ-3-メチル-2,5-ジヒドロフラン-2-オンを原料に、化合物 2 1 と同様の方法を用いることにより、化合物 3 4 を得た。

収率21%; ESI MS m/z 442.2 ($M+H$)⁺; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.57 (0.5H, m), 7.54 (0.5H, s), 7.27–7.20 (3H, m), 7.15–7.13 (2H, m), 6.96 (0.5H,

d, $J=1.6$ Hz), 6.84–6.69 (3H, m), 5.06 (1H, s), 5.05 (1H, s), 4.30 (1H, m), 2.91–2.81 (2H, m), 1.83 (1.5H, s), 1.81 (1.5H, s), 1.292 (4.5H, s), 1.288 (4.5H, s).

[0313] [化38]



・・・(化合物 3 4)

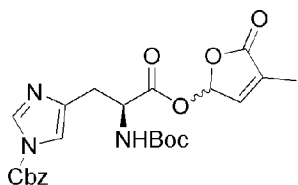
[0314] 合成例 3 3

τ -Cbz-N $^{\alpha}$ -Boc-ヒスチジンおよび5-ヒドロキシ-3-メチル-2,5-ジヒドロフラン-2-オンを原料に、化合物 2 1 と同様の方法を用いることにより、化合物 3 5 を得た。

収率68%; ESI MS m/z 486.2 ($M+H$) $^{+}$; 1H NMR (400 MHz, CD_3OD) δ

8.08 (1H, m), 7.38 (1H, m), 7.30–7.22 (5H, m), 6.96 (1H, m), 6.77 (1H, t, $J=1.6$ Hz), 5.33 (1.2H, s), 5.05 (0.8H, s), 4.36 (1H, m), 2.97–2.80 (2H, m), 1.81 (3H, s), 1.28 (5.4H, s), 1.27 (3.6H, s).

[0315] [化39]



・・・(化合物 3 5)

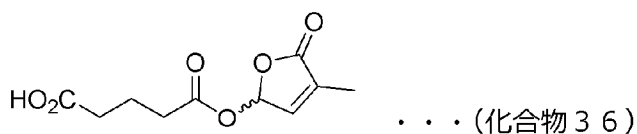
[0316] 合成例 3 4

5-ヒドロキシ-3-メチル-2,5-ジヒドロフラン-2-オン (114 mg, 1.00 mmol) および無水グルタル酸 (114 mg, 1.00 mmol) をアセトニトリル (2 mL) に溶解後、トリエチルアミン (0.15 mL, 1.08 mmol) を加え、室温にて2時間攪拌した。減圧により溶媒と過剰な試薬を乾固することで化合物 3 6 をトリエチルアミン塩として得た。

収率99%; ESI MS m/z 250.9 ($M+Na$) $^{+}$; 1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 11.36 (1H, br), 6.94 (1H, d, $J=1.6$ Hz), 6.88 (1H, t, $J=1.6$ Hz), 3.11 (2H, q, $J=7$

.2 Hz), 2.48 (2H, t, J=7.2 Hz), 2.38 (2H, t, J=7.2 Hz), 2.05–1.91 (5H, m), 1.27 (3H, t, J=7.2 Hz).

[0317] [化40]

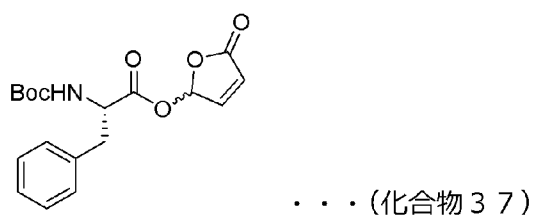


[0318] 合成例 3 5

N-Boc-フェニルアラニンおよび5-ヒドロキシ-2,5-ジヒドロフラン-2-オンを原料に、化合物 2 1 と同様の方法を用いることにより、化合物 3 7 を得た。

収率40%; ESI MS m/z 370.0 (M+Na)⁺; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.53 (0.5H, dd, J=1.2, 5.6 Hz), 7.37–7.23 (4.5H, m), 7.05 (0.5H, s), 6.99 (0.5H, t, J=1.2 Hz), 6.38 (1H, t, J=1.2 Hz), 4.42 (1H, m), 3.13 (1H, m), 2.98 (1H, m), 1.40 (9H, s).

[0319] [化41]

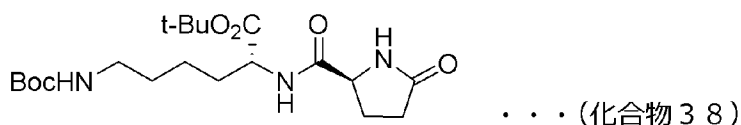


[0320] 合成例 3 6

L-ピログルタミン酸およびN^ε-Boc-リジンt-ブチルエステル塩酸塩を原料に、化合物 2 1 と同様の方法を用いることにより、化合物 3 8 を得た。

収率85%; ESI MS m/z 414.2 (M+H)⁺; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 4.28–4.24 (2H, m), 3.05 (2H, t, J=6.8 Hz), 2.54–2.27 (5H, m), 2.15 (1H, m), 1.86–1.83 (2H, m), 1.76–1.68 (2H, m), 1.49 (9H, s), 1.45 (9H, s).

[0321] [化42]

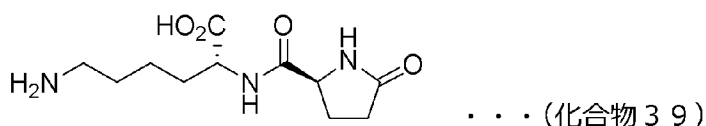


[0322] 合成例 3 7

化合物 3 8 (150 mg, 0.36 mmol) を 4N 塩酸ジオキサン溶液 (2 mL) に溶解後、室温にて 18 時間攪拌した。減圧により濃縮乾固することで、化合物 3 9 を塩酸塩として得た。

収率 99%; ^1H NMR (400 MHz, D_2O) δ 4.30–4.26 (2H, m), 2.88 (2H, t, $J=8.0$ Hz), 2.43 (1H, m), 2.33–2.28 (2H, m), 1.97 (1H, m), 1.83 (1H, m), 1.70 (1H, m), 1.61–1.54 (2H, m), 1.39–1.30 (2H, m).

[0323] [化43]

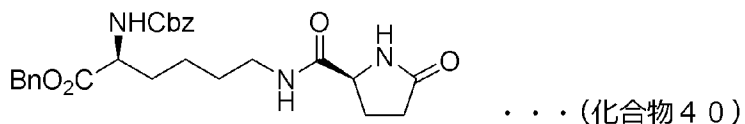


[0324] 合成例 3 8

N^α -Cbz-リジンベンジルエステルと L-ピログルタミン酸を原料に、化合物 2 1 と同様の方法により化合物 4 0 を得た。

収率 96%; ESI MS m/z 482.2 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$; ^1H NMR (400 MHz, CD_3OD) δ 7.37–7.30 (10H, m), 5.21–5.06 (4H, m), 4.23 (1H, dd, $J=4.8, 8.8$ Hz), 4.12 (1H, dd, $J=4.8, 8.8$ Hz), 3.19–3.16 (2H, m), 2.46–2.34 (2H, m), 2.27 (1H, m), 2.01 (1H, m), 1.84 (1H, m), 1.70 (1H, m), 1.57–1.47 (2H, m), 1.43–1.36 (2H, m).

[0325] [化44]



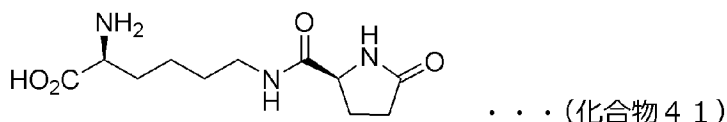
[0326] 合成例 3 9

化合物 4 0 を原料に、化合物 2 2 と同様の方法により化合物 4 1 を得た。

収率 92%; ^1H NMR (400 MHz, D_2O) δ 4.19 (1H, dd, $J=5.2, 8.8$ Hz), 3.60 (1H, t, $J=6.0$ Hz), 3.17–3.12 (2H, m), 2.49–2.30 (3H, m), 1.96 (1H, m), 1.77–1.73 (2H, m), 1.49–1.45 (2H, m), 1.32–1.28 (2H, m).

[0327]

[化45]

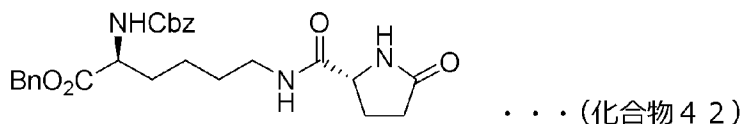


[0328] 合成例 4 0

N α -Cbz-リジンベンジルエステルおよびD-ピログルタミン酸を原料に、化合物 2 1 と同様の方法により化合物 4 2 を得た。

収率72% ; ESI MS m/z 482.2 (M+H)⁺; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.36–7.29 (10H, m), 5.20–5.06 (4H, m), 4.25 (1H, t, J=4.4 Hz), 4.12 (1H, dd, J=4.8, 8.8 Hz), 3.19–3.15 (2H, m), 2.41–2.34 (2H, m), 2.26 (1H, m), 2.01 (1H, m), 1.83 (1H, m), 1.70 (1H, m), 1.56–1.44 (2H, m), 1.42–1.34 (2H, m).

[0329] [化46]

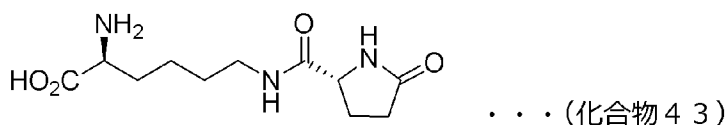


[0330] 合成例 4 1

化合物 4 2 を原料に、化合物 4 1 と同様の方法により化合物 4 3 を得た。

収率86% ; ESI MS m/z 258.1 (M+H)⁺; ¹H NMR (400 MHz, D₂O) δ 4.19 (1H, dd, J=5.2, 8.8 Hz), 3.63 (1H, dd, J=6.0, 6.4 Hz), 3.17–3.13 (2H, m), 2.47–2.30 (3H, m), 1.96 (1H, m), 1.84–1.70 (2H, m), 1.51–1.44 (2H, m), 1.38–1.23 (2H, m).

[0331] [化47]

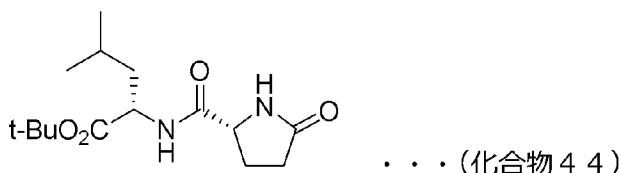


[0332] 合成例 4 2

ロイシンt-ブチルエステル塩酸塩およびD-ピログルタミン酸を原料に、化合物 2 1 と同様の方法により化合物 4 4 を得た。

収率74% ; ESI MS m/z 299.1 (M+H)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 4.35 (1H, d, J=6.4, 8.8 Hz), 4.24 (1H, dd, J=4.8, 8.4 Hz), 2.54–2.28 (3H, m), 2.09 (1H, m), 1.70 (1H, m), 1.66–1.61 (2H, m), 0.99 (3H, d, J=6.4 Hz), 0.94 (3H, d, J=6.4 Hz).

[0333] [化48]

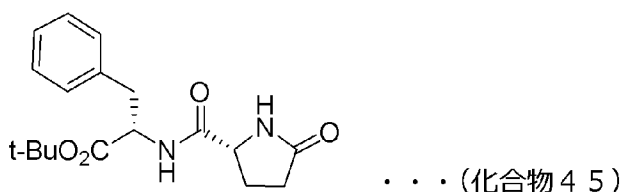


[0334] 合成例 4 3

フェニルアラニン α -tert-ブチルエステル塩酸塩およびD-ピログルタミン酸を原料に、化合物 2 1 と同様の方法により化合物 4 5 を得た。

収率89% ; ESI MS m/z 377.1 (M+HCO₂)⁻ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.33–7.22 (5H, m), 4.64 (1H, dd, J=6.0, 9.2 Hz), 4.16 (1H, dd, J=4.8, 8.4 Hz), 3.18 (1H, dd, J=6.0, 13.6 Hz), 2.97 (1H, dd, J=9.2, 13.6 Hz), 2.34–2.21 (3H, m), 1.77 (1H, m), 1.44 (9H, s).

[0335] [化49]

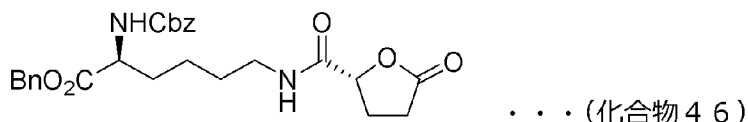


[0336] 合成例 4 4

N α -Cbz-リジンベンジルエステルベンゼンスルホン酸塩および(R)-(-)-5-オキソテトラヒドロフラン-2-カルボン酸を原料に、化合物 2 1 と同様の方法により化合物 4 6 を得た。

収率91% ; ESI MS m/z 483.2 (M+H)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.38–7.30 (10H, m), 5.20 (1H, d, J=13.4 Hz), 5.15 (1H, d, J=13.4 Hz), 5.10 (2H, s), 3.21 (2H, t, J=6.8 Hz), 2.57–2.54 (3H, m), 2.23–2.14 (2H, m), 1.85 (1H, m), 1.71 (1H, m), 1.59–1.47 (2H, m), 1.43–1.35 (2H, m).

[0337] [化50]

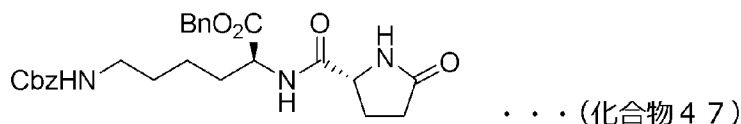


[0338] 合成例 4 5

N^ε-Cbz-リジンベンジルエステル塩酸塩およびD-ピログルタミン酸を原料に、化合物 2 1 と同様の方法により化合物 4 7 を得た。

収率64% ; ESI MS m/z 482.2 (M+H)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.41–7.30 (10H, m), 5.19 (1H, d, J=12.0 Hz), 5.16 (1H, d, J=12.0 Hz), 5.07 (2H, s), 4.45 (1H, dd, J=4.8, 9.2 Hz), 4.22 (1H, d, J=4.8, 8.8 Hz), 3.12–3.08 (2H, m), 2.47–2.20 (4H, m), 2.02 (1H, m), 1.89 (1H, m), 1.76 (1H, m), 1.52–1.46 (2H, m), 1.42–1.36 (2H, m).

[0339] [化51]

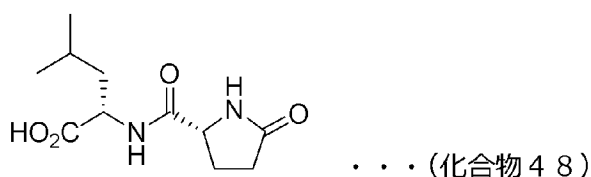


[0340] 合成例 4 6

化合物 4 4 を原料に、化合物 3 9 と同様の方法により化合物 4 8 を得た。

収率99% ; ESI MS m/z 243.1 (M+H)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 6.34 (1H, d, J=8.0 Hz), 4.48 (1H, m), 4.25 (1H, dd, J=4.8, 8.8 Hz), 2.53–2.40 (2H, m), 2.31 (1H, m), 2.10 (1H, m), 1.71–1.67 (3H, m), 1.00 (3H, d, J=6.0 Hz), 0.96 (3H, d, J=6.0 Hz).

[0341] [化52]

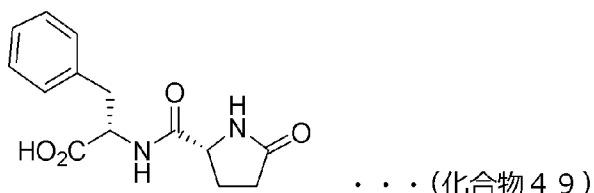


[0342] 合成例 4 7

化合物 4 5 を原料に、化合物 3 9 と同様の方法により化合物 4 9 を得た。

収率99% ; ESI MS m/z 277.1 ($M+H$)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.32–7.21 (5H, m), 4.76 (1H, dd, $J=4.8, 9.6$ Hz), 4.15 (1H, dd, $J=4.8, 8.4$ Hz), 3.30 (1H, dd, $J=4.4, 10.0$ Hz), 2.97 (1H, dd, $J=9.6, 10.0$ Hz), 3.32–2.19 (3H, m), 1.71 (1H, m).

[0343] [化53]

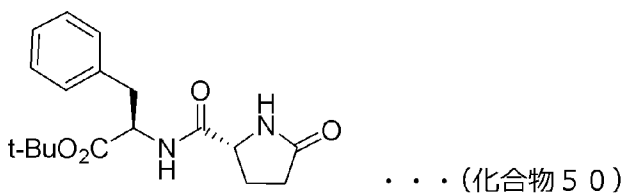


[0344] 合成例 48

D-フェニルアラニンt-ブチルエステル塩酸塩およびD-ピログルタミン酸を原料に、化合物 21 と同様の方法により化合物 50 を得た。

収率85% ; ESI MS m/z 377.1 ($M+HCO_2$)⁻ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.32–7.24 (5H, m), 4.61 (1H, dd, $J=6.0, 8.8$ Hz), 4.17 (1H, dd, $J=4.4, 8.8$ Hz), 3.17 (1H, dd, $J=6.0, 12.0$ Hz), 3.00 (1H, dd, $J=8.8, 12.0$ Hz), 2.42 (1H, m), 2.30–2.24 (2H, m), 1.96 (1H, m), 1.44 (9H, s).

[0345] [化54]



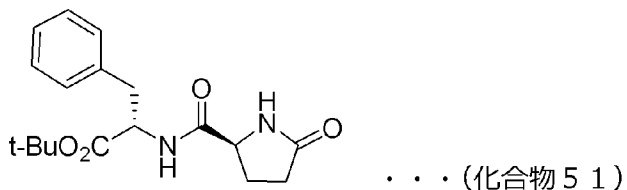
[0346] 合成例 49

フェニルアラニンt-ブチルエステル塩酸塩およびL-ピログルタミン酸を原料に、化合物 21 と同様の方法により化合物 51 を得た。

収率80% ; ESI MS m/z 377.1 ($M+HCO_2$)⁻ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.32–7.24 (5H, m), 4.61 (1H, dd, $J=6.0, 8.8$ Hz), 4.17 (1H, dd, $J=4.4, 8.4$ Hz), 3.17 (1H, dd, $J=6.0, 14.0$ Hz), 3.00 (1H, dd, $J=8.8, 14.0$ Hz), 2.42 (1H, m), 2.30–2.24 (2H, m), 1.97 (1H, m), 1.44 (9H, s).

[0347]

[化55]

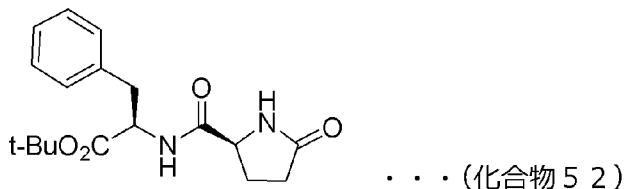


[0348] 合成例 5 0

D-フェニルアラニンt-ブチルエステル塩酸塩およびL-ピログルタミン酸を原料に、化合物 2 1 と同様の方法により化合物 5 2 を得た。

収率89% ; ESI MS m/z 377.0 ($M+HCO_2$)⁻ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.33–7.22 (5H, m), 4.64 (1H, dd, $J=6.0, 9.2$ Hz), 4.16 (1H, dd, $J=4.8, 8.4$ Hz), 3.18 (1H, dd, $J=6.0, 14.0$ Hz), 2.97 (1H, dd, $J=9.2, 14.0$ Hz), 2.34–2.21 (3H, m), 1.76 (1H, m), 1.44 (9H, s).

[0349] [化56]



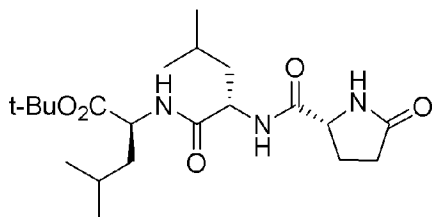
[0350] 合成例 5 1

ロイシルロイシンt-ブチルエステル塩酸塩およびD-ピログルタミン酸を原料に、化合物 2 1 と同様の方法により化合物 5 3 を得た。

収率70% ; ESI MS m/z 456.2 ($M+HCO_2$)⁻ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 4.48 (1H, dd, $J=6.8, 8.0$ Hz), 4.33 (1H, dd, $J=6.8, 8.4$ Hz), 4.24 (1H, dd, $J=4.8, 8.8$ Hz), 2.52–2.28 (3H, m), 2.06 (1H, m), 1.78–1.67 (2H, m), 1.65–1.58 (4H, m), 1.48 (9H, s), 1.00 (3H, d, $J=6.8$ Hz), 0.98 (3H, d, $J=6.8$ Hz), 0.97 (3H, d, $J=6.4$ Hz), 0.92 (3H, d, $J=6.4$ Hz).

[0351]

[化57]



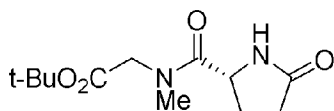
・・・(化合物53)

[0352] 合成例52

サルコシン t -ブチルエステルおよびD-ピログルタミン酸を原料に、化合物21と同様の方法により化合物54を得た。

収率17% ; ESI MS m/z 513.3 (2M+H)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 4.77 (0.7H, dd, $J=4.0, 8.8$ Hz), 4.59 (0.3H, dd, $J=4.4, 8.4$ Hz), 4.27 (0.3H, d, $J=18.4$ Hz), 4.19 (0.7H, d, $J=16.8$ Hz), 4.12 (0.7H, d, $J=18.4$ Hz), 3.90 (0.3H, d, $J=16.8$ Hz), 3.14 (2.1H, s), 2.97 (0.9H, s), 2.57 (1H, m), 2.44–2.30 (2H, m), 2.09 (1H, m), 1.52 (2.7H, s), 1.49 (6.3H, s).

[0353] [化58]



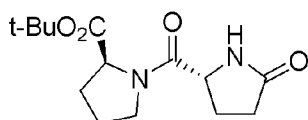
・・・(化合物54)

[0354] 合成例53

プロリン t -ブチルエステルおよびD-ピログルタミン酸を原料に、化合物21と同様の方法により化合物55を得た。

収率12% ; ESI MS m/z 565.3 (2M+H)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 4.67 (0.25H, dd, $J=2.4, 8.8$ Hz), 4.60 (0.75H, dd, $J=4.4, 8.8$ Hz), 4.40 (0.25H, t, $J=4.0$ Hz), 4.34 (0.75H, dd, $J=4.4, 8.8$ Hz), 3.76 (1H, m), 3.60 (1H, m), 2.57–2.21 (4H, m), 2.12–1.93 (4H, m), 1.52 (2.25H, s), 1.48 (6.75H, s).

[0355] [化59]



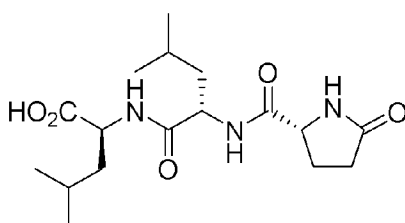
・・・(化合物55)

[0356] 合成例 5 4

化合物 5 3 を原料に、化合物 3 9 と同様の方法により化合物 5 6 を得た。

収率99% ; ESI MS m/z 356.1 (M+H)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 4.50–4.43 (2 H, m), 4.25 (1H, dd, J=4.4, 8.4 Hz), 2.52–2.28 (3H, m), 2.06 (1H, m), 1.80–1.70 (2H, m), 1.68–1.62 (4H, m), 1.00–0.93 (12H, m).

[0357] [化60]



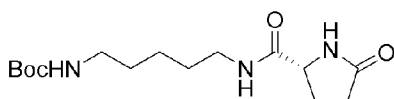
... (化合物 5 6)

[0358] 合成例 5 5

モノ N-Boc-カダベリンおよび D-ピログルタミン酸を原料に、化合物 2 1 と同様の方法により化合物 5 7 を得た。

収率27% ; ESI MS m/z 314.1 (M+H)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 4.17 (1H, m), 3.24–3.20 (2H, m), 3.06 (2H, t, J=6.8 Hz), 2.50–2.28 (3H, m), 2.07 (1H, m), 1.58–1.34 (15H, m).

[0359] [化61]



... (化合物 5 7)

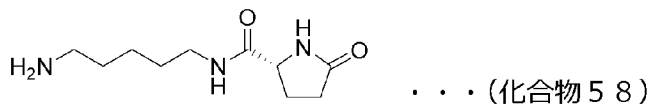
[0360] 合成例 5 6

化合物 5 7 を原料に、化合物 3 9 および同様の方法により化合物 5 8 を得た。

収率99% ; ESI MS m/z 214.0 (M+H)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 4.27 (1H, dd, J=4.8, 8.4 Hz), 3.25 (2H, t, J=6.8 Hz), 2.98–2.94 (2H, m), 2.53–2.32 (3H, m), 2.08 (1H, m), 1.74–1.70 (2H, m), 1.62–1.58 (2H, m), 1.48–1.42 (2H, m).

[0361]

[化62]

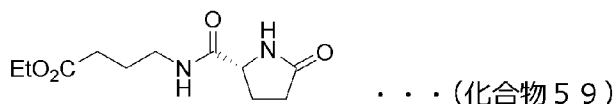


[0362] 合成例 5 7

GABAエチルエステル塩酸塩およびD-ピログルタミン酸を原料に、化合物 21 と同様の方法により化合物 59 を得た。

収率33% ; ESI MS m/z 243.0 (M+H)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 4.05–4.00 (3 H, m), 3.21–3.12 (2H, m), 2.40–2.16 (5H, m), 1.94 (1H, m), 1.75–1.68 (2H, m), 1.15 (3H, t, J=6.8 Hz).

[0363] [化63]

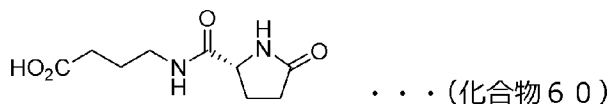


[0364] 合成例 5 8

化合物 59 (75 mg, 0.31 mmol) をエタノール (2 mL) に溶解し、1N水酸化ナトリウム水溶液 (0.5 mL) を加え、室温にて2時間攪拌した。反応液水 (3 mL) を加えた後、アンバーライトFPC3500 (H⁺) カラムに通し、水で溶出した。得られた非吸着画分を濃縮乾固することにより化合物 60 を得た。

収率90% ; ¹H NMR (400 MHz, D₂O) δ 4.20 (1H, dd, J=5.2, 9.2 Hz), 3.20–3.16 (2H, m), 2.47–2.28 (3H, m), 1.97 (1H, m), 1.76–1.69 (2H, m).

[0365] [化64]



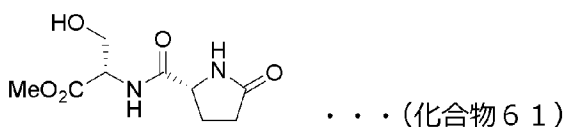
[0366] 合成例 5 9

セリンメチルエステル塩酸塩およびD-ピログルタミン酸を原料に、化合物 21 と同様の方法により化合物 61 を得た。

収率57% ; ESI MS m/z 231.0 (M+H)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 4.56 (1H, dd, J=4.0, 9.2 Hz), 4.36 (1H, dd, J=4.8, 8.8 Hz), 3.94 (1H, dd, J=5.2,

11.2 Hz), 3.85 (1H, dd, $J=4.0, 11.2$ Hz), 3.77 (3H, s), 2.54–2.36 (4H, m), 2.24–2.13 (2H, m).

[0367] [化65]

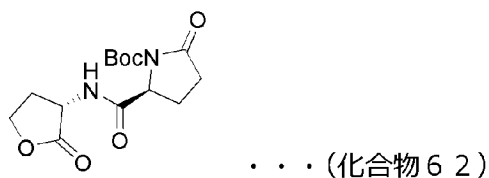


[0368] 合成例 6 0

L-ホモセリンラクトン塩酸塩およびN-Boc-L-ピログルタミン酸を原料に、化合物 2 1 と同様の方法により化合物 6 2 を得た。

収率26% ; ESI MS m/z 357.0 ($M+HCO_2^-$)⁻; 1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.54 (1H, d, $J=8.0$ Hz), 4.62 (1H, dd, $J=4.4, 9.2$ Hz), 4.41 (1H, m), 4.25 (1H, m), 2.75–2.60 (2H, m), 2.50–2.35 (3H, m), 2.17 (1H, m).

[0369] [化66]

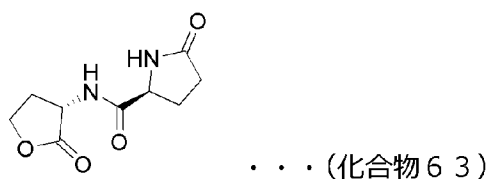


[0370] 合成例 6 1

化合物 6 2 を原料に、化合物 3 9 と同様の方法により化合物 6 3 を得た。

収率99% ; ESI MS m/z 213.0 ($M+H$)⁺; 1H NMR (400 MHz, CD_3OD) δ 4.67 (1H, dd, $J=8.8, 11.2$ Hz), 4.49 (1H, dd, $J=2.0, 8.8$ Hz), 4.45–4.25 (2H, m), 2.60–2.30 (5H, m), 2.16 (1H, m).

[0371] [化67]

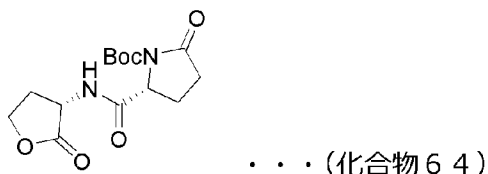


[0372] 合成例 6 2

D-ホモセリンラクトン塩酸塩およびN-Boc-L-ピログルタミン酸を原料に、化合物 2 1 と同様の方法により化合物 6 4 を得た。

収率20% ; ESI MS m/z 357.0 ($M+HCO_2^-$)⁻ ; 1H NMR (400 MHz, CD_3OD) δ 4.66–4.58 (2H, m), 4.48 (1H, m), 4.33 (1H, m), 2.67–2.56 (2H, m), 2.52–2.31 (3H, m), 2.00 (1H, m), 1.52 (9H, s).

[0373] [化68]

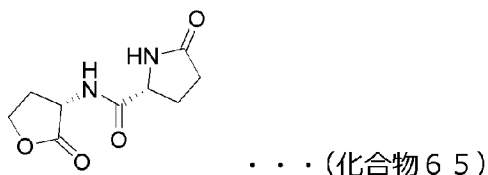


[0374] 合成例 6 3

化合物 6 4 を原料に、化合物 3 9 と同様の方法により化合物 6 5 を得た。

収率99% ; ESI MS m/z 212.9 ($M+H$)⁺ ; 1H NMR (400 MHz, CD_3OD) δ 4.55 (1H, dd, $J=8.8, 10.8$ Hz), 4.38 (1H, dd, $J=1.6, 9.2$ Hz), 4.34–4.12 (2H, m), 2.45–2.21 (5H, m), 2.01 (1H, m).

[0375] [化69]

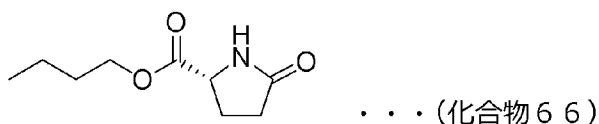


[0376] 合成例 6 4

D-ピログルタミン酸 (30 mg, 0.023 mmol) に、n-ブタノール (0.5 mL)、4N塩酸ジオキササン溶液 (0.5 mL) を加え、室温にて4日間攪拌した。減圧により溶媒と過剰な試薬を除去することで、化合物 6 6 を無色油状物質として得た。

収率99% ; ESI MS m/z 186.1 ($M+H$)⁺ ; 1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 6.70 (1H, br s), 4.25 (1H, m), 4.16 (2H, m), 2.52–2.34 (3H, m), 2.20 (1H, m), 1.66–1.60 (2H, m), 1.41–1.35 (2H, m), 0.94 (3H, t, $J=7.2$ Hz).

[0377] [化70]

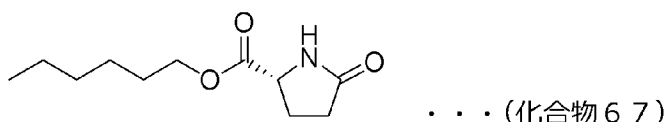


[0378] 合成例 6 5

D-ピログルタミン酸およびn-ヘキサノールを原料に、化合物 6 6 と同様の方法を用いることにより化合物 6 7 を無色油状物質として得た。

ESI MS m/z 214.1 (M+H)⁺; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 4.26 (1H, m), 4.16–4.15 (2H, m), 2.49 (1H, m), 2.42–2.36 (2H, m), 2.23 (1H, m), 1.68–1.62 (2H, m), 1.37–1.29 (6H, m), 0.90 (3H, t, J=6.8 Hz).

[0379] [化71]

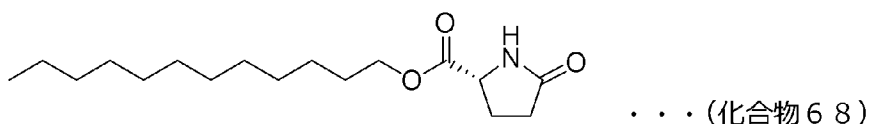


[0380] 合成例 6 6

D-ピログルタミン酸およびn-ドデカノールを原料に、化合物 6 6 と同様の方法を用いることにより化合物 6 8 を得た。

ESI MS m/z 595.5 (2M+H)⁺; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 4.30 (1H, dd, J=4.4, 8.4 Hz), 4.18 (2H, t, J=6.4 Hz), 2.57–2.29 (3H, m), 2.16 (1H, m), 1.71–1.65 (2H, m), 1.52 (1H, m), 1.37–1.22 (17H, m), 0.92 (3H, t, J=6.8 Hz).

[0381] [化72]



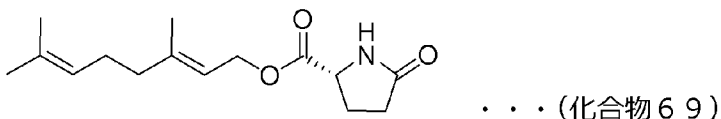
[0382] 合成例 6 7

D-ピログルタミン酸およびゲラニオール原料に、化合物 2 1 と同様の方法を用いることにより化合物 6 9 を得た。

収率78%; ESI MS m/z 266.1 (M+H)⁺; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 5.39 (1H, m), 5.11 (1H, m), 4.71 (2H, d, J=6.8 Hz), 4.29 (1H, dd, J=4.8, 8.8 Hz), 2.50 (1H, m), 2.42–2.28 (2H, m), 2.19–2.06 (5H, m), 1.75 (3H, d, J=1.6 Hz), 1.69 (3H, d, J=1.6 Hz), 1.63 (3H, d, J=1.6 Hz).

[0383]

[化73]

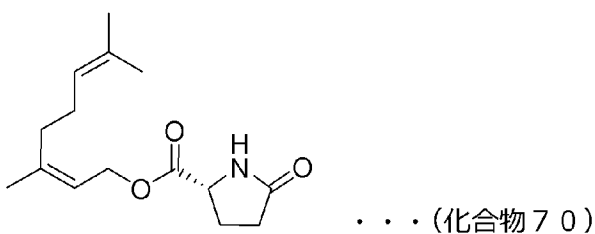


[0384] 合成例 68

ネロールおよびD-ピログルタミン酸を原料に、化合物 21 と同様の方法を用いることにより化合物 70 を得た。

収率95% ; ESI MS m/z 266.1 (M+H)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 5.39 (1H, m), 5.14 (1H, m), 4.68 (2H, dd, J=0.8, 6.8 Hz), 4.29 (1H, dd, J=4.8, 8.8 Hz), 2.50 (1H, m), 2.42–2.28 (2H, m), 2.20–2.10 (5H, m), 1.79 (3H, d, J=1.2 Hz), 1.70 (3H, d, J=1.2 Hz), 1.64 (3H, d, J=1.2 Hz).

[0385] [化74]

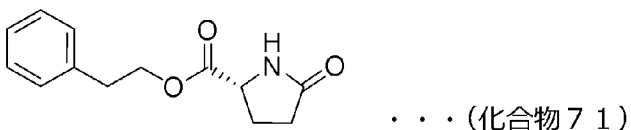


[0386] 合成例 69

フェネチルアルコールおよびD-ピログルタミン酸を原料に、化合物 21 と同様の方法を用いることにより化合物 71 を得た。

収率54% ; m/z 234.1 (M+H)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.33–7.21 (5H, m), 4.45–4.37 (2H, m), 4.25 (1H, dd, J=4.0, 8.8 Hz), 3.01–2.97 (2H, m), 2.55 (1H, m), 2.43 (1H, m), 2.28–2.24 (2H, m), 2.05–1.99 (2H, m).

[0387] [化75]



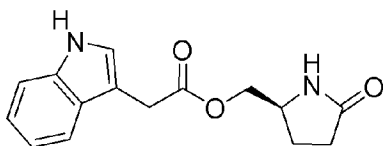
[0388] 合成例 70

インドール酢酸および(S)-ピログルタミノールを原料に、化合物 21 と同

様の方法を用いることにより化合物 7 2 を得た。

収率 : 72% ; ESI MS m/z 273.1 ($M+H$)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.42 (1H, d, $J=7.6$ Hz), 7.24 (1H, d, $J=8.4$ Hz), 7.05 (1H, s), 7.00 (1H, m), 6.92 (1H, m), 4.03 (1H, dd, $J=4.0, 11.6$ Hz), 3.89 (1H, dd, $J=2.0, 11.6$ Hz), 3.72 (1H, m), 3.69 (2H, s), 2.07–1.98 (3H, m), 1.60 (1H, m).

[0389] [化76]



... (化合物 7 2)

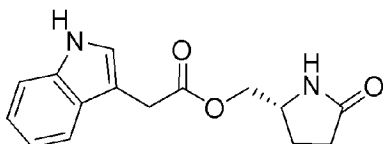
[0390] 合成例 7 1

インドール酢酸および(R)-ピログルタミノールを原料に、化合物 2 1 と同様の方法を用いることにより化合物 7 3 を得た。

収率 : 65% ; ESI MS m/z 273.1 ($M+H$)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.54 (1H, dd, $J=1.2, 8.0$ Hz), 7.36 (1H, d, $J=8.0$ Hz), 7.18 (1H, s), 7.12 (1H, m), 7.04 (1H, m), 4.16 (1H, dd, $J=4.0, 11.6$ Hz), 4.02 (1H, dd, $J=5.2, 11.6$ Hz), 3.86 (1H, m), 3.85 (2H, s), 2.20–2.11 (3H, m), 1.73 (1H, m).

.

[0391] [化77]



... (化合物 7 3)

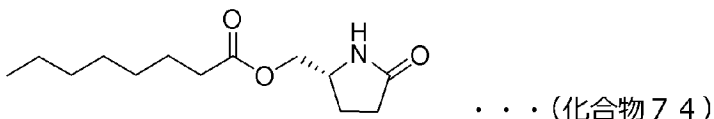
[0392] 合成例 7 2

n-オクタン酸および(R)-ピログルタミノールを原料に、化合物 2 1 と同様の方法を用いることにより化合物 7 4 を得た。

収率89% ; ESI MS m/z 242.1 ($M+H$)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 4.19 (1H, dd, $J=4.0, 11.2$ Hz), 4.03–3.92 (2H, m), 2.45–2.26 (5H, m), 1.91 (1H, m), 1.65–1.62 (2H, m), 1.37–1.31 (8H, m), 0.92 (3H, t, $J=6.8$ Hz).

[0393]

[化78]

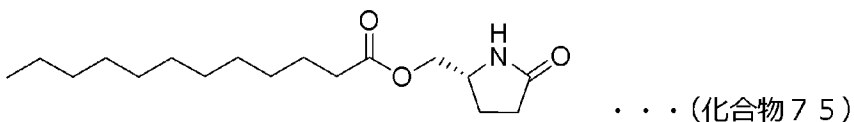


[0394] 合成例 7 3

ラウリン酸および(R)-ピログルタミノールを原料に、化合物 2 1 と同様の
方法を用いることにより化合物 7 5 を得た。

収率95% ; m/z 595.5 ($2M+H$)⁺ ; 1H NMR (400 MHz, CD_3OD) δ 4.19 (1H, dd, $J=4.0, 11.2$ Hz), 4.03–3.94 (2H, m), 2.40–2.27 (5H, m), 1.91 (1H, m), 1.65–1.62 (2H, m), 1.37–1.31 (16H, m), 0.92 (3H, t, $J=6.8$ Hz).

[0395] [化79]

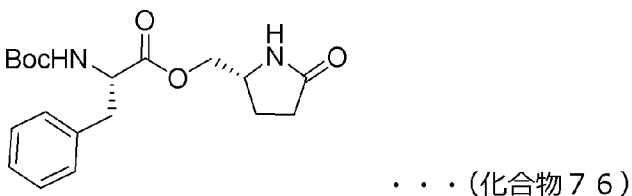


[0396] 合成例 7 4

N-Boc-フェニルアラニンおよび(R)-ピログルタミノールを原料に、化合物
2 1 と同様の方法を用いることにより化合物 7 6 を得た。

収率 : 87% ; ESI MS m/z 385.2 ($M+Na$)⁺ ; 1H NMR (400 MHz, CD_3OD) δ 7.33–7.22 (5H, m), 4.38 (1H, dd, $J=6.0, 8.8$ Hz), 4.10–4.08 (2H, m), 3.88 (1H, m), 3.12 (1H, dd, $J=6.0, 13.6$ Hz), 2.95 (1H, dd, $J=8.8, 13.6$ Hz), 2.45–2.18 (3H, m), 1.84 (1H, m), 1.41 (9H, s).

[0397] [化80]

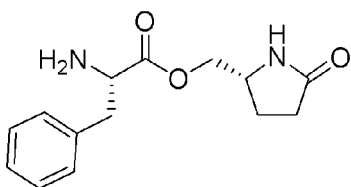


[0398] 合成例 7 5

化合物 4 2 を原料に、化合物 3 9 と同様の方法を用いることにより化合物
7 7 (塩酸塩) を得た。

収率 : 99% ; ESI MS m/z 263.1 (M+H)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.37–7.19 (5H, m), 4.43 (1H, t, J=6.8 Hz), 4.26 (1H, dd, J=3.6, 11.2 Hz), 4.06 (1H, dd, J=6.0, 11.2 Hz), 3.90 (1H, m), 3.26–3.16 (2H, m), 2.33–2.28 (2H, m), 2.24–1.76 (2H, m), .

[0399] [化81]



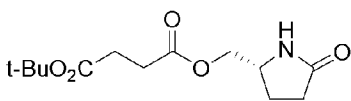
... (化合物 77)

[0400] 合成例 76

コハク酸セミ α -ブチルエステルおよび(R)-ピログルタミノールを原料に、化合物 21 と同様の方法により、化合物 78 を得た。

収率78% ; ESI MS m/z 294.1 (M+Na)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 4.17 (1H, d, J=4.0, 11.2 Hz), 4.06 (1H, dd, J=6.0, 11.2 Hz), 3.95 (1H, m), 2.64–2.54 (4H, m), 2.46–2.26 (3H, m), 1.91 (1H, m), 1.46 (9H, s).

[0401] [化82]



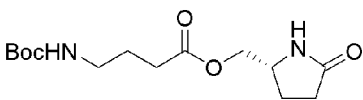
... (化合物 78)

[0402] 合成例 77

N-Boc-GABAおよび(R)-ピログルタミノールを原料に、化合物 21 と同様の方法により、化合物 79 を得た。

収率57% ; ESI MS m/z 301.0 (M+H)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 4.18 (1H, dd, J=3.6, 10.8 Hz), 4.05–3.94 (2H, m), 3.11–3.08 (2H, m), 2.43–2.29 (5H, m), 1.90 (1H, m), 1.82–1.75 (2H, m), 1.45 (9H, s).

[0403] [化83]

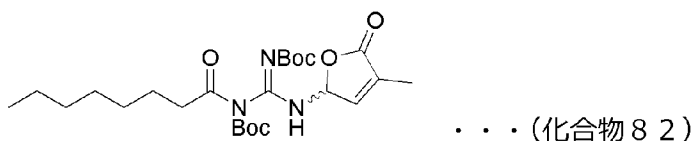


... (化合物 79)

[0404] 合成例 78

ロモ-3-メチル-2,5-ジヒドロフラン-2-オン (110 mg, 0.62 mmol) のDMF溶液 (1 mL) を加え、室温にて4時間攪拌した。反応液に酢酸エチルを加えた後、0.1N塩酸にて分配洗浄した。有機層を減圧により濃縮乾固後、セップパックシリカ (n-ヘキサン／酢酸エチル) にて精製することで化合物82を得た。収率16% ; ESI MS m/z 482.3 (M+H)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 6.19 (1H, d, J=7.6 Hz), 5.12 (1H, dd, J=7.6, 11.2 Hz), 3.08–2.94 (2H, m), 1.70–1.61 (2H, m), 1.54 (9H, s), 1.52 (9H, s), 1.50 (3H, s), 1.33–1.27 (8H, m), 0.89 (3H, t, J=6.8 Hz).

[0409] [化86]

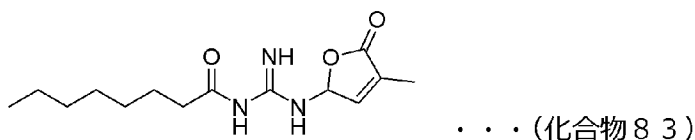


[0410] (工程3) 化合物83の合成

化合物82を原料に、化合物2と同様の方法により化合物83を得た。

収率99% ; ESI MS m/z 282.0 (M+H)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 5.38 (1H, br s), 4.67 (1H, brs), 2.82 (1H, m), 2.64 (1H, m), 2.49 (1H, m), 2.30 (1H, m), 1.66–1.61 (3H, m), 1.30–1.26 (8H, m), 0.89–0.86 (3H, m).

[0411] [化87]



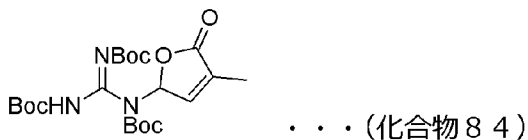
[0412] 合成例80

N, N', N''-トリ-Boc-グアニジンおよび5-ヒドロキシ-3-メチル-2,5-ジヒドロフラン-2-オンを原料に、化合物80と同様の方法により化合物84を得た。

収率87% ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 6.99 (1H, t, J=1.6 Hz), 6.05 (1H, br s), 1.91 (3H, t, J=1.6 Hz), 1.54 (18H, s), 1.46 (9H, s).

[0413]

[化88]

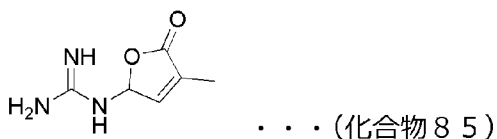


[0414] 合成例 8 1

化合物 8 4 を原料に、化合物 2 と同様の方法により、化合物 8 5 (蟻酸塩) を得た。

収率99%; ^1H NMR (400 MHz, CD_3OD) δ 8.53 (1H, s), 7.03 (1H, t, $J=1.6$ Hz), 6.46 (1H, t, $J=1.6$ Hz), 1.93 (3H, t, $J=1.6$ Hz).

[0415] [化89]

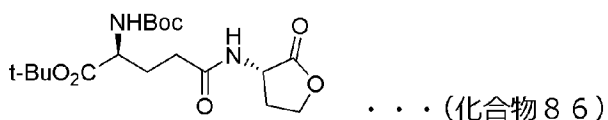


[0416] 合成例 8 2

N-Boc-グルタミン酸- γ -t-ブチルエステルおよびL-ホモセリンラクトン塩酸塩を原料に、化合物 2 1 と同様の方法により化合物 8 6 を得た。

収率83%; ESI MS m/z 409.1 ($\text{M}+\text{Na}$) $^+$; ^1H NMR (400 MHz, CD_3OD) δ 4.63 (1H, d, $J=9.2, 11.2$ Hz), 4.45 (1H, dd, $J=5.6, 8.8$ Hz), 4.33 (1H, m), 3.99 (1H, m), 2.57 (1H, m), 2.38-2.23 (3H, m), 2.11 (1H, m), 1.89 (1H, m), 1.49 (9H, s), 1.46 (9H, s).

[0417] [化90]



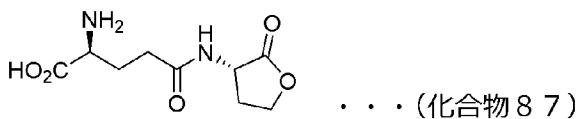
[0418] 合成例 8 3

化合物 8 6 を原料に、化合物 3 9 と同様の方法により化合物 8 7 を塩酸塩として得た。

収率99%; ESI MS m/z 230.9 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$; ^1H NMR (400 MHz, D_2O) δ 4.62 (1H, dd, $J=9.2, 10.8$ Hz), 4.51 (1H, m), 4.34 (1H, m), 4.05 (1H, t, $J=6.4$ Hz), 2

.61-2.50 (3H, m), 2.35-2.16 (3H, m).

[0419] [化91]

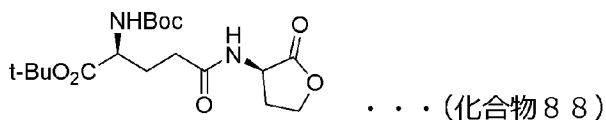


[0420] 合成例 8 4

N-Boc-グルタミン酸- γ -t-ブチルエステルおよびD-ホモセリンラクトン塩酸塩を原料に、化合物 2 1 と同様の方法により、化合物 8 8 を得た。

収率89% ; ESI MS m/z 409.1 (M+Na)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 4.60 (1H, d, J=9.6, 11.2 Hz), 4.47 (1H, m), 4.32 (1H, m), 4.00 (1H, m), 2.56 (1H, m), 2.38-2.27 (3H, m), 2.11 (1H, m), 1.91 (1H, m), 1.49 (9H, s), 1.46 (9H, s).

[0421] [化92]

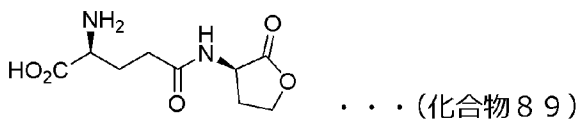


[0422] 合成例 8 5

化合物 8 8 を原料に、化合物 3 9 と同様の方法により化合物 8 9 を塩酸塩として得た。

収率99% ; ESI MS m/z 231.0 (M+H)⁺ ;
¹H NMR (400 MHz, D₂O) δ 4.58 (1H, dd, J=9.2, 11.2 Hz), 4.47 (1H, m), 4.30 (1H, m), 3.98 (1H, t, J=6.4 Hz), 2.54-2.45 (3H, m), 2.29-2.10 (3H, m).

[0423] [化93]



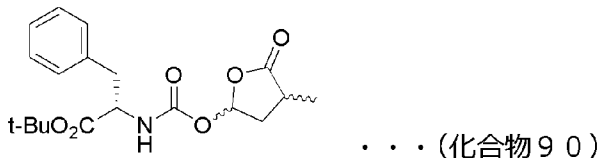
[0424] 合成例 8 6

化合物 5 を原料に、化合物 2 2 と同様の方法により化合物 9 0 を得た。

収率68% ; ESI MS m/z 386.1 (M+Na)⁺ ; ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 7.32-7.23 (

5H, m), 6.45 (1H, m), 4.33 (1H, m), 3.14–2.92 (2H, m), 2.80–2.72 (2H, m), 1.90 (1H, m), 1.48 (2H, s), 1.43 (3.5H, s), 1.41 (3.5H, s), 1.34 (2H, d, J=6.8 Hz), 1.13 (0.4H, d, J=7.2 Hz), 0.93 (0.6H, d, J=7.2 Hz).

[0425] [化94]



[0426] [実施例1] 各種化合物のシロイヌナズナストリゴラクトン受容体D14タンパク質に対する結合活性

本実施例では、化合物1～20、23、26～61、65～80、および83～90のシロイヌナズナのストリゴラクトン受容体D14タンパク質に対する結合活性を、蛍光プローブ標識化された合成ストリゴラクトンであるYoshimulactone Green (YLG) とD14との結合の阻害程度を測ることにより解析した。YLGはストリゴラクトン受容体と結合すると緑色の蛍光を発する化合物である。D14にはストリゴラクトンを加水分解する活性があり、ストリゴラクトンの代わりにYLGを結合させるとYLGのD環部位と蛍光プローブが切り離され蛍光を呈するが、ここにストリゴラクトン活性のある化合物を共存させるとYLGとD14の結合が阻害され、蛍光値が低減する。その阻害度合いを測定することでストリゴラクトン活性のある化合物の受容体への結合度を測定することができる（参考文献1：Tsuchiya et al., (2015) Science, 349, 864–868. PARASITIC PLANTS. Probing strigolactone receptors in *Striga hermonthica* with fluorescence.）。

[0427] D14受容体YLG in vitroアッセイは参考文献1を参考に実施した。Escherichia coliで発現させ精製したD14タンパク質1 μgをバッファ（100 mM HEPES, 150 mM NaCl, pH 7.0）に加え、全量100 μLの系でCOSTARの黒色96穴プレートを用いてspectraMax M2 (Molecular Devices)により測定を実施した。YLGの蛍光は480 nmで励起し、520 nmで測定した。供試する各種化合物は終濃度1

00 μM ～1000 μM になるように、YLGは終濃度が1 μM になるように、反応液に添加した。供試する各種化合物を用いて得られた阻害度合いの値について、同濃度の合成ストリゴラクトンGR24を用いて得られた阻害度合いの値を100%とした場合の相対値として算出した。

[0428] 結果を表1～6に示す。

[0429] 表中、「D14 inhibition」は、各化合物のD14への結合活性を示し、上記阻害度合いの相対値が80%以下の化合物を（+）、それ以外を（-）とした。いくつかの化合物は、YLGとD14の結合を阻害し、すなわち、D14に対する結合活性を示した。化合物10は、蟻酸塩およびヘプタフルオロ酪酸塩の両方について「D14 inhibition」が（+）であった。化合物12は、蟻酸塩およびヘプタフルオロ酪酸塩の両方について「D14 inhibition」が（+）であった。

[0430] [実施例2] 各種化合物による*Orobancha minor*の発芽誘因活性

本実施例では、化合物1～20、23、26～61、65～80、および83～90による*Orobancha minor*の発芽誘因活性を、発芽率を測定することにより解析した。*Orobancha minor*は日本に自生するシロツメクサに寄生するものの種を用いた。実験は参考文献2 (Uraguchi et al., (2018) Science, 362, 1301-1305. A femtomolar-range suicide germination stimulant for the parasitic plant *Striga hermonthica*.) に記載の方法を少し改変して実施した。*Orobancha minor*の乾燥した種子を1.5 mLチューブにボリウムとして50 μL 入れ、100 μL のクロロホルムを入れ攪拌することで種皮のワックス層を取り除いた。その後、ドラフト内で3時間以上揮発させることでクロロホルムを取り除いた。その後1%程度の次亜塩素酸ナトリウム1 mLを添加して種子滅菌し、3回滅菌水で水洗した後にシャーレに移し暗化で7日～10日22℃でインキュベートすることでコンディショニングした。その後、種子を含む液を30 μL ずつ96穴プレートに分注し、等量の化合物溶液を添加した。供試する各種化合物は終濃度100 nM～10 μM になるように添加した。処理液添加してから1週間22℃でインキュベート後に発芽率を発芽した種子の数を実体顕微

鏡下で数えることで評価した。各種化合物を用いて得られた発芽率について、同濃度の合成ストリゴラクトンGR24を用いて得られた発芽率を100%とした場合の相対値として算出した。

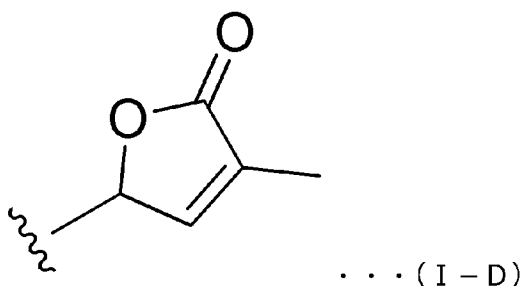
[0431] 結果を表1～6に示す。

[0432] 表中、「Germination」は、各化合物の発芽誘因活性を示し、上記発芽率の相対値が5%以上の化合物を（+）、それ以外を（-）とした。いくつかの化合物は、*Orobancha minor*の発芽誘因活性を示した。化合物10は、蟻酸塩およびヘプタフルオロ酪酸塩の両方について「Germination」が（+）であった。化合物12は、蟻酸塩およびヘプタフルオロ酪酸塩の両方について「Germination」が（+）であった。

[0433] 表中、「Function」は、各化合物の予測される機能を示す。「Germination」が（+）の化合物は発芽誘導機能を有すると判断した。また、「D14 inhibition」と「Germination」がそれぞれ（+）と（-）の化合物は発芽抑制機能を有すると判断した。

[0434] 表中、「D環部分」欄における「D環」は、下記式（I-D）で表される構造を示す。

[0435] [化95]



[0436]

[表1]

表 1

Compound No.	D環部分	結合様式	Germi-nation	D14 inhibition	Function
1	D環	カルバメート	+	+	Germination stimulant
2	D環	カルバメート	+	+	Germination stimulant
3	D環	カルバメート	+	+	Germination stimulant
4	D環	カルバメート	—	+	Germination inhibitor
5	D環	カルバメート	+	+	Germination stimulant
6	D環	カルバメート	+	+	Germination stimulant
7	D環	カルバメート	+	+	Germination stimulant
8	D環	カルバメート	+	—	Germination stimulant
9	D環	カルバメート	+	+	Germination stimulant
10	D環	カルバメート	+	+	Germination stimulant
11	D環	カルバメート	+	+	Germination stimulant
12	D環	カルバメート	+	+	Germination stimulant
13	D環	カルバメート	+	+	Germination stimulant
14	D環	カルバメート	+	+	Germination stimulant
15	D環	カルバメート	—	+	Germination inhibitor

[0437]

[表2]

表 2

Compound No.	D環部分	結合様式	Germi-nation	D14 inhibition	Function
16	D環	カルバメート	+	+	Germination stimulant
17	D環	カルバメート	+	+	Germination stimulant
18	D環	カルバメート	+	+	Germination stimulant
19	D環	カルバメート	+	+	Germination stimulant
20	D環	カルバメート	+	+	Germination stimulant
23	D環	カルバメート	+	+	Germination stimulant
26	D環	カルバメート	+	+	Germination stimulant
27	D環	エステル	+	+	Germination stimulant
28	D環	エステル	+	+	Germination stimulant
29	D環	エステル	+	+	Germination stimulant
30	D環	エステル	+	+	Germination stimulant
31	D環	エステル	+	+	Germination stimulant
32	D環	エステル	+	+	Germination stimulant
33	D環	エステル	+	+	Germination stimulant
34	D環	エステル	+	+	Germination stimulant

[0438]

[表3]

表 3

Compound No.	D環部分	結合様式	Germination	D14 inhibition	Function
35	D環	エステル	+	+	Germination stimulant
36	D環	エステル	—	+	Germination inhibitor
37	desMe-D環	エステル	+	+	Germination stimulant
38	L-PCA	アミド	+	+	Germination stimulant
39	L-PCA	アミド	—	+	Germination inhibitor
40	L-PCA	アミド	+	—	Germination stimulant
41	L-PCA	アミド	—	—	—
42	D-PCA	アミド	—	+	Germination inhibitor
43	D-PCA	アミド	—	+	Germination inhibitor
44	D-PCA	アミド	—	+	Germination inhibitor
45	D-PCA	アミド	—	+	Germination inhibitor
46	D-PCAラクトン	アミド	—	+	Germination inhibitor
47	D-PCA	アミド	—	+	Germination inhibitor
48	D-PCA	アミド	—	+	Germination inhibitor
49	D-PCA	アミド	—	+	Germination inhibitor

[0439]

[表4]

表 4

Compound No.	D環部分	結合様式	Germination	D14 inhibition	Function
50	D-PCA	アミド	—	—	—
51	L-PCA	アミド	—	+	Germination inhibitor
52	L-PCA	アミド	—	—	—
53	D-PCA	アミド	+	+	Germination stimulant
54	D-PCA	アミド	—	—	—
55	D-PCA	アミド	—	—	—
56	D-PCA	アミド	—	+	Germination inhibitor
57	D-PCA	アミド	—	+	Germination inhibitor
58	D-PCA	アミド	—	—	—
59	D-PCA	アミド	—	+	Germination inhibitor
60	D-PCA	アミド	+	—	Germination stimulant
61	D-PCA	アミド	—	+	Germination inhibitor
63	L-PCA	アミド	—	+	Germination inhibitor
65	D-PCA	アミド	—	—	—
66	D-PCA	エステル	—	+	Germination inhibitor

[0440]

[表5]

表 5

Compound No.	D環部分	結合様式	Germination	D14 inhibition	Function
67	D-PCA	エステル	—	+	Germination inhibitor
68	D-PCA	エステル	—	+	Germination inhibitor
69	D-PCA	エステル	—	+	Germination inhibitor
70	D-PCA	エステル	—	+	Germination inhibitor
71	D-PCA	エステル	—	+	Germination inhibitor
72	L-PCAOl	エステル	+	—	Germination stimulant
73	D-PCAOl	エステル	—	+	Germination inhibitor
74	D-PCAOl	エステル	—	+	Germination inhibitor
75	D-PCAOl	エステル	—	+	Germination inhibitor
76	D-PCAOl	エステル	—	+	Germination inhibitor
77	D-PCAOl	エステル	—	—	—
78	D-PCAOl	エステル	—	+	Germination inhibitor
79	D-PCAOl	エステル	—	+	Germination inhibitor
80	D環	N-グリコシド	—	+	Germination inhibitor
83	D環	Nグリコシド	+	+	Germination stimulant

[0441]

[表6]

表 6

Compound No.	D環部分	結合様式	Germination	D14 inhibition	Function
84	D環	N-グリコシド	—	+	Germination inhibitor
85	D環	N-グリコシド	—	—	—
86	L-ホモセリンラクトン	アミド	—	—	—
87	L-ホモセリンラクトン	アミド	—	—	—
88	D-ホモセリンラクトン	アミド	+	—	Germination stimulant
89	D-ホモセリンラクトン	アミド	+	—	Germination stimulant
90	還元D環	カルバメート	—	—	—

[0442] [実施例3] 化合物5または合成ストリゴラクトンGR24の0robanche minorに対する自殺発芽誘導による防除効果

本実施例では、化合物5による寄生植物防除活性を、寄生植物である0robanche minorの自殺発芽活性を測ることにより解析した。

[0443] 0robanche minorの自殺発芽試験は参考文献2 (Uraguchi et al., (2018) Science, 362, 1301-1305.) を参考に実施した。プラスチックポット（上面の直径52.5 mm、底面の直径35 mm、深さ85 mm、底面に穴が開いたもの）に0.52 Lの乾いた土（組合培土とバーミキュライトを等量混合したもの）を上面から2 cm下まで詰め、その上に5 mgの0robanche minorを混合した土を2 cmの層になるように上乘せした。ポットは底面から給水させ21℃で14日日間コンディショニングさせた。その後、土の表面から1ポットあたり120 mLの1 nMもしくは10 nM 化合物5（DMSO濃度0.0001%）、10 nM GR24（DMSO濃度0.0001%）、または0.0001% DMSOを施用し、さらに14日間インキュベートした。そしてポット当たり10粒のホワイトクローバーの種を播種し最終的に3個体まで間

引きした。栽培中は2～3日に一度底面から水やりし、1週間に1回0.1%のハイポネックス[®]（NPK = 6-10-5%）を底面から施肥し約3か月21℃、長日条件で栽培した。出現した*Orobanchе minor*の数は98日目に測定した。その後ポットを解体し根に寄生したTubercleと*Orobanchе minor*の数を測定した。

[0444] 結果を図1～2に示す。図中、「p」はDunnettの多重検定の結果を表し、「*」はDunnettの多重検定において5%水準で有意差があることを表す。図中、「○」は平均値を表す。

[0445] [実施例4] 化合物1による*Orobanchе ramosa* L.の発芽誘因活性

本実施例では、化合物1による*Orobanchе ramosa* L.の発芽誘因活性を、発芽率を測定することにより解析した。*Orobanchе ramosa* L.は、トマトに寄生する寄生植物であり、現在では*Phelipanche ramosa* (L.) Pomelとして分類されている。*Orobanchе ramosa* L.としては、ポルトガルに自生するトマトに寄生するものの種を用いた。*Orobanchе ramosa* L.の乾燥した種子を高湿度暗所、20～26℃の条件で水につけ1週間コンディショニングした。供試する化合物は、終濃度が1 μMもしくは100 nM（化合物1）または0.34 μM（GR24）になるようにペトリ皿に2 mL添加した。処理液添加してから1週間、高湿度暗所、20～26℃の条件でインキュベート後に発芽率を発芽した種子の数を実体顕微鏡下で数えることで評価した。

[0446] 結果を表7に示す。表中、「Germination」は、化合物1の発芽誘因活性を示し、上記発芽率の相対値が4%以上の場合に（+）とした。化合物1は、*Orobanchе ramosa* L.の発芽誘因活性を示した。

[0447] [表7]

表7 化合物1による*Orobanchе ramosa* L.の発芽誘因活性

Compound No.	D環部分	結合様式	Germination	Function
1	D環	カルバメート	+	Germination stimulant

産業上の利用可能性

[0448] 本発明によれば、寄生植物を防除すること等の農園芸分野における有用な

結果を得ることができる。

請求の範囲

[請求項1]

寄生植物の防除用の組成物であって、

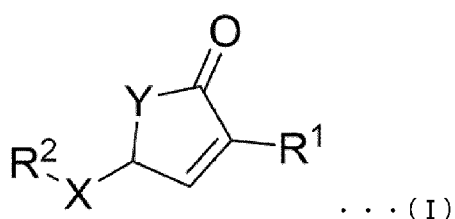
下記成分 (A)、(B)、または (C) を含有する、組成物：

(A) 下記一般式 (I) で表される化合物；

(B) 下記一般式 (I I) で表される化合物；

(C) アミノ酸発酵副生物。

[化1]



式 (I) 中、

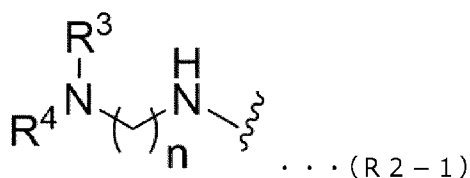
Xは、原子間結合またはオキシカルボニル基 (OC (=O)) を表し、

Yは、酸素原子 (O)、水素原子が結合した窒素原子 (NH)、またはメチル基が結合した窒素原子 (NMe) を表し、

R1は、水素原子 (H) またはメチル基を表し、

R2は、アミノ酸、アグマチン、グアニジン、下記一般式 (R2-1) で表される構造、または下記一般式 (R2-2) で表される構造を表す。

[化2]



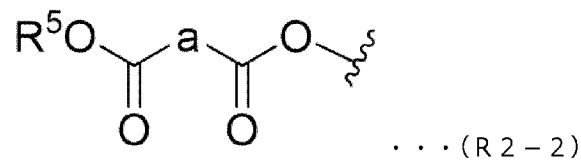
式 (R2-1) 中、

nは、2～5の整数（すなわち2、3、4、または5）を表し、

式 (R2-1) 中、R3およびR4は、それぞれ独立に、水素原子

、またはアシル基を表す。

[化3]

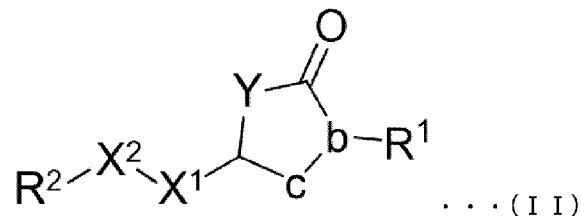


式 (R²-2) 中、

a は、置換されていてもよい炭素数 1～4 のアルキレン基または置換されていてもよい炭素数 2～4 のアルケニレン基を表し、

R⁵ は、水素原子 (H) または置換されていてもよい炭素数 1～4 のアルキル基を表す。

[化4]



式 (I I) 中、

X¹ は、原子間結合またはメチレンオキシ基 (CH₂O) を表し、

X² は、原子間結合またはカルボニル基 (C(=O)) を表し、

Y は、酸素原子 (O) または水素原子が結合した窒素原子 (NH) を表し、

R¹ は、水素原子 (H) またはメチル基を表し、

R² は、アミノ酸、アグマチン、グアニジン、脂肪族アルコール、脂肪酸、前記一般式 (R²-1) で表される構造、または前記一般式 (R²-2) で表される構造を表し、

b-c は、CH-CH₂ または C=CH を表す。

[請求項2] 前記寄生植物の自殺発芽の誘導または前記寄生植物の発芽の抑制により該寄生植物が防除される、請求項 1 に記載の組成物。

[請求項3] 前記寄生植物が、ハマウツボ科 (Orobanchaceae) 植物、ゴマノハ

グサ科 (Scrophulariaceae) 植物、またはヒルガオ科 (Convolvulaceae) 植物である、請求項 1 または 2 に記載の組成物。

[請求項4] 前記寄生植物が、ストライガ (Striga) 属植物、ハマウツボ (Orobanche) 属植物、フェリパンキ (Phelipanche) 属植物、アレクトラ (Alectra) 属植物、またはネナシカズラ (Cuscuta) 属植物である、請求項 1 ～ 3 のいずれか 1 項に記載の組成物。

[請求項5] 前記寄生植物が、*Striga asiatica*、*Striga gesnerioides*、*Striga hermonthica*、*Striga aspera*、*Striga asiatica*、*Striga curviflora*、*Striga parviflora*、*Striga angustifolia*、*Striga latericea*、*Striga aequinoctialis*、*Striga angolensis*、*Striga bilabiate*、*Striga brachycalyx*、*Striga chrsantha*、*Striga dalzielii*、*Striga elegans*、*Striga forbesii*、*Striga gastonii*、*Striga gracillima*、*Striga hallaei*、*Striga hirsuta*、*Striga junodii*、*Striga klingii*、*Striga lepidagathidis*、*Striga lutea*、*Striga macrantha*、*Striga passargei*、*Striga pinnatifida*、*Striga primuloides*、*Striga yemenica*、*Striga pubiflora*、*Orobanche ramosa*、*Orobanche minor*、*Orobanche crenata*、*Orobanche cumana*、*Orobanche foetida*、*Orobanche aegyptiaca*、*Orobanche cernua*、*Phelipanche ramosa*、*Phelipanche aegyptiaca*、*Alectra vogelii*、*Alectra picta*、*Alectra sessiliflora*、*Alectra orobanchoides*、*Alectra fluminensis*、*Cuscuta australis*、*Cuscuta campestris*、*Cuscuta chinensis*、*Cuscuta indecora*、*Cuscuta epithymum*、*Cuscuta epilinum*、*Cuscuta gronovii*、*Cuscuta planiflora*、*Cuscuta monogyna*、*Cuscuta pedicellata*、*Cuscuta palaestina*、または*Cuscuta rejlexa*である、請求項 1 ～ 4 のいずれか 1 項に記載の組成物。

[請求項6] 前記成分 (A) について、Y は NH、R 1 はメチル基である、請求項 1 ～ 5 のいずれか 1 項に記載の組成物。

[請求項7] 前記成分 (A) について、以下のいずれかの条件を満たす、請求項

1～6のいずれか1項に記載の組成物：

(1) Xは原子間結合またはオキシカルボニル基、R²はアミノ基で結合したアミノ酸、アミノ基で結合したアグマチン、またはアミノ基で結合したグアニジンである；

(2) Xは原子間結合、R²はカルボキシル基で結合したアミノ酸である；

(3) Xは原子間結合、R²は水酸基で結合したアミノ酸である；

(4) Xは原子間結合、R²はチオール基で結合したアミノ酸である；

(5) Xは原子間結合、R²はアミド基で結合したアミノ酸である；

(6) Xは原子間結合またはオキシカルボニル基、R²は式(R²-1)で表される構造である；

(7) Xは原子間結合、R²は式(R²-2)で表される構造である。

[請求項8] 前記成分(A)について、以下のいずれかの条件を満たす、請求項1～7のいずれか1項に記載の組成物：

(1) Xは原子間結合、YはNH、R¹はメチル基、R²はアミノ基で結合したアミノ酸、アミノ基で結合したアグマチン、アミノ基で結合したグアニジン、または式(R²-1)で表される構造である；

(2) Xはオキシカルボニル基、YはNH、R¹はメチル基、R²はカルボキシル基で結合したアミノ酸または式(R²-2)で表される構造である。

[請求項9] 前記成分(B)について、YはNH、b-cはCH-CH₂、R¹はHである、請求項1～8のいずれか1項に記載の組成物。

[請求項10] 前記成分(B)について、以下のいずれかの条件を満たす、請求項1～9のいずれか1項に記載の組成物：

(1) X¹は原子間結合、X²はカルボニル基、R²はアミノ基で結合したアミノ酸、アミノ基で結合したアグマチン、またはアミノ基で

結合したグアニジンである；

(2) X 1 はメチレンオキシ基、X 2 は原子間結合、R 2 はカルボキシル基で結合したアミノ酸である；

(3) X 1 は原子間結合、X 2 はカルボニル基、R 2 は脂肪族アルコールである；

(4) X 1 はメチレンオキシ基、X 2 は原子間結合、R 2 は脂肪酸である；

(5) X 1 は原子間結合、X 2 はカルボニル基、R 2 は式 (R 2 - 1) で表される構造である；

(6) X 1 はメチレンオキシ基、X 2 は原子間結合、R 2 は式 (R 2 - 2) で表される構造である；

(7) X 1 は原子間結合、X 2 は原子間結合、R 2 はアミノ基で結合したグアニジンである。

[請求項11] 前記成分 (B) について、以下のいずれかの条件を満たす、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の組成物：

(1) X 1 は原子間結合、X 2 はカルボニル基、Y は NH、b - c は CH - CH₂、R 1 は H、R 2 はアミノ基で結合したアミノ酸、アミノ基で結合したアグマチン、アミノ基で結合したグアニジン、または式 (R 2 - 1) で表される構造である；

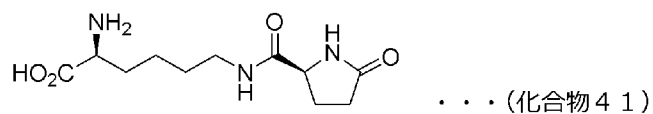
(2) X 1 はメチレンオキシ基、X 2 は原子間結合、Y は NH、b - c は CH - CH₂、R 1 は H、R 2 はカルボキシル基で結合したアミノ酸、炭素数 2 ~ 18 の脂肪酸、または式 (R 2 - 2) で表される構造である；

(3) X 1 は原子間結合、X 2 は原子間結合、Y は酸素原子 (O)、b - c は C = CH、R 1 はメチル基、R 2 はアミノ基で結合したグアニジンである。

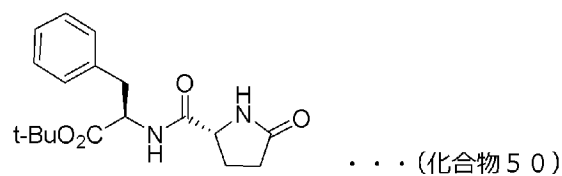
[請求項12] 前記成分 (B) が、下記式 (化合物 41)、(化合物 50)、(化合物 52)、(化合物 54)、(化合物 55)、および (化合物 77

)で表される化合物である場合は除く、請求項1～11のいずれか1項に記載の組成物。

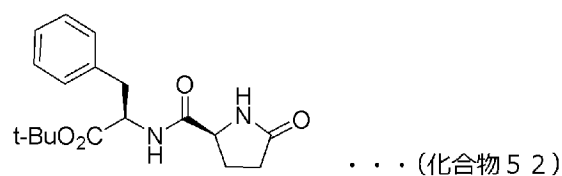
[化5]



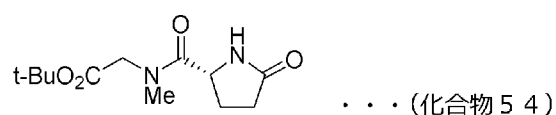
[化6]



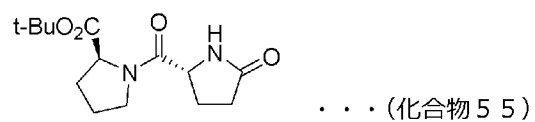
[化7]



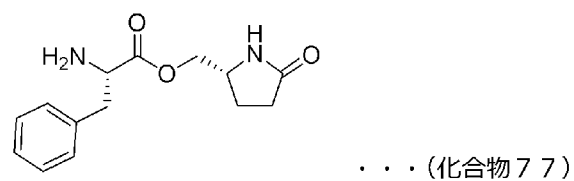
[化8]



[化9]



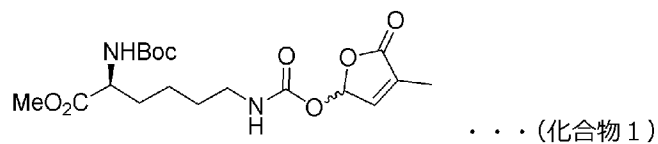
[化10]



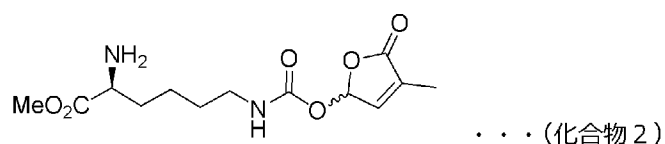
[請求項13] 前記成分 (A) または (B) が、下記式 (化合物 1) ～ (化合物 20)、(化合物 23)、(化合物 26) ～ (化合物 40)、(化合物 42) ～ (化合物 49)、(化合物 51)、(化合物 53)、(化合

物56)～(化合物76)、(化合物78)～(化合物80)、および(化合物82)～(化合物90)で表される化合物から選択される、請求項1～12のいずれか1項に記載の組成物。

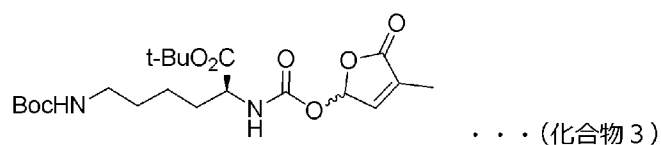
[化11]



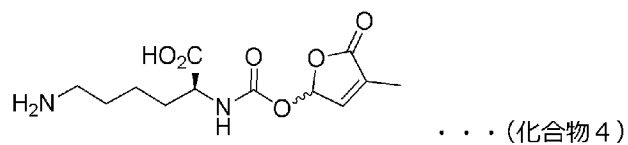
[化12]



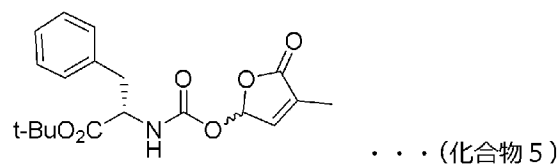
[化13]



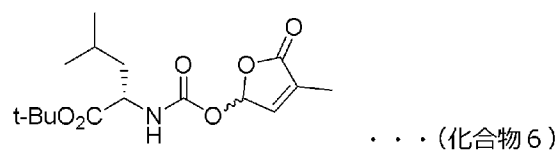
[化14]



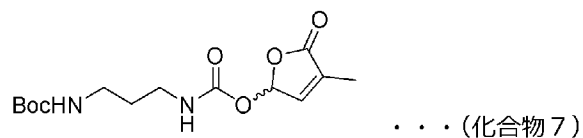
[化15]



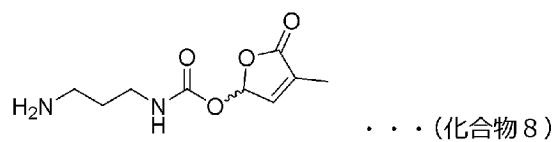
[化16]



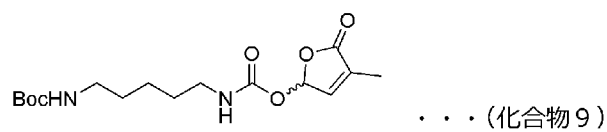
[化17]



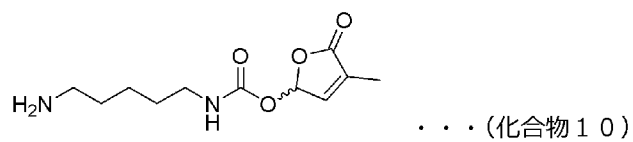
[化18]



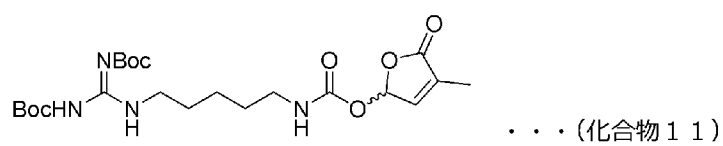
[化19]



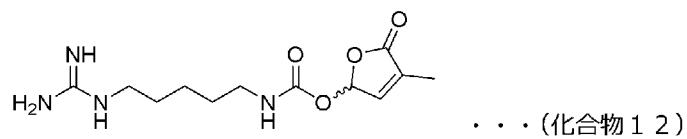
[化20]



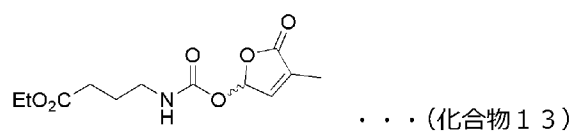
[化21]



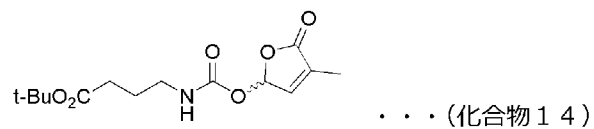
[化22]



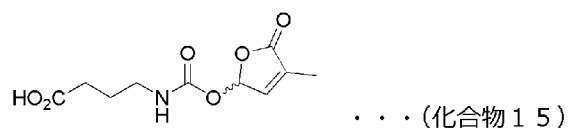
[化23]



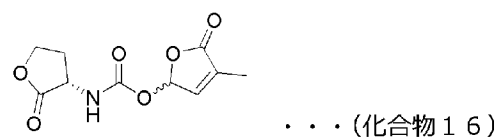
[化24]



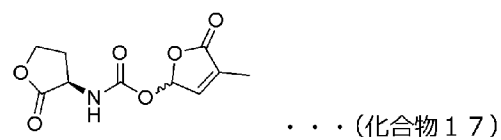
[化25]



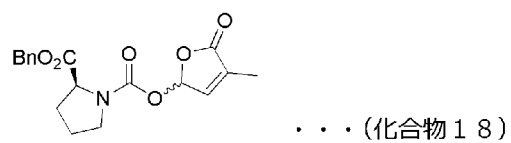
[化26]



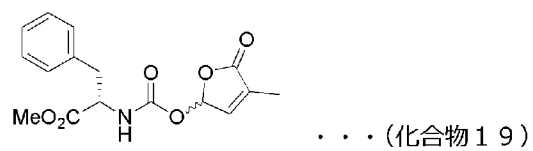
[化27]



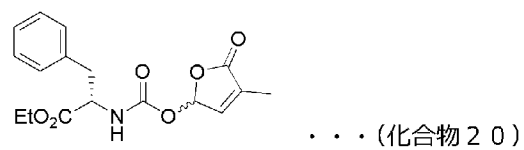
[化28]



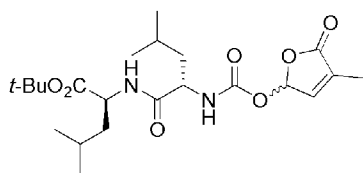
[化29]



[化30]

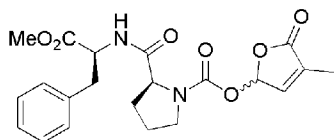


[化31]



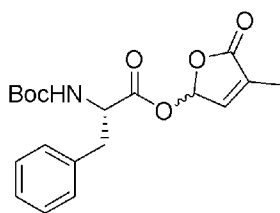
... (化合物 2 3)

[化32]



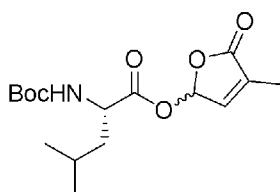
... (化合物 2 6)

[化33]



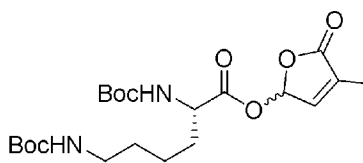
... (化合物 2 7)

[化34]



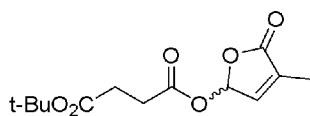
... (化合物 2 8)

[化35]



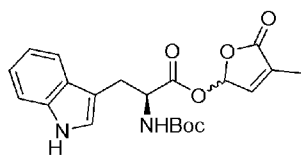
... (化合物 2 9)

[化36]



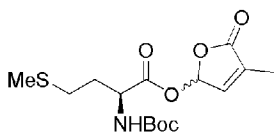
... (化合物 3 0)

[化37]



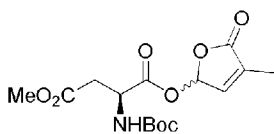
．．．(化合物 3 1)

[化38]



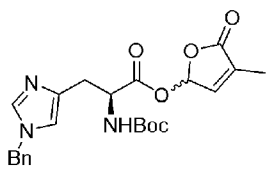
．．．(化合物 3 2)

[化39]



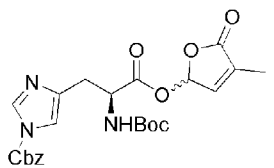
．．．(化合物 3 3)

[化40]



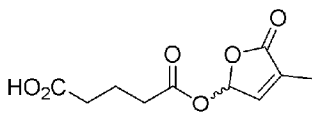
．．．(化合物 3 4)

[化41]



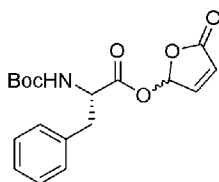
．．．(化合物 3 5)

[化42]



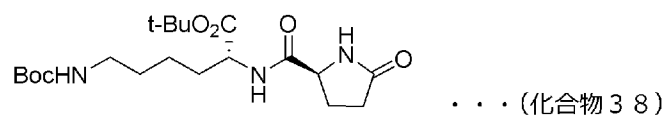
．．．(化合物 3 6)

[化43]

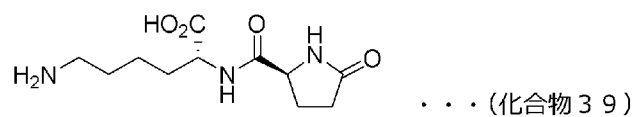


．．．(化合物 3 7)

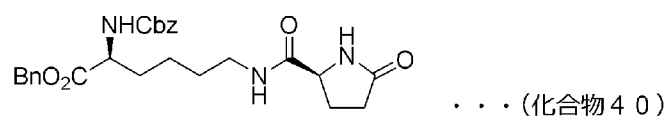
[化44]



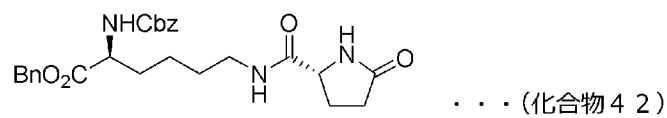
[化45]



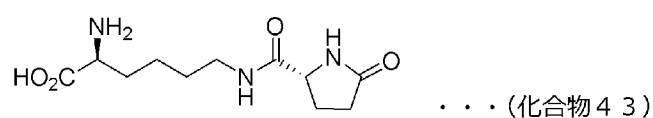
[化46]



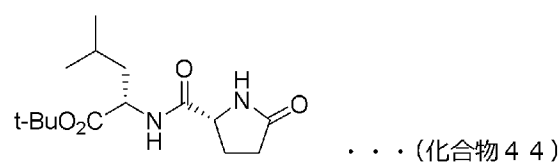
[化47]



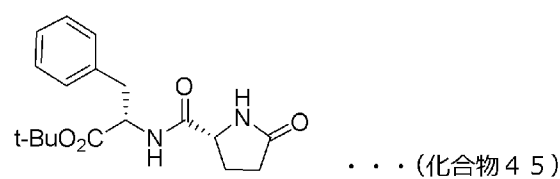
[化48]



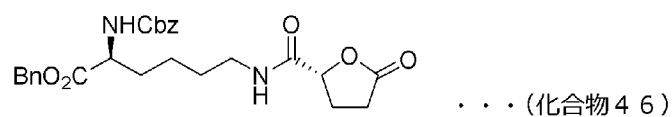
[化49]



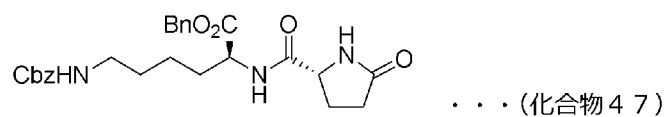
[化50]



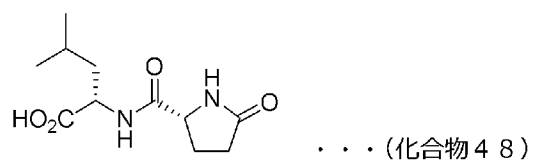
[化51]



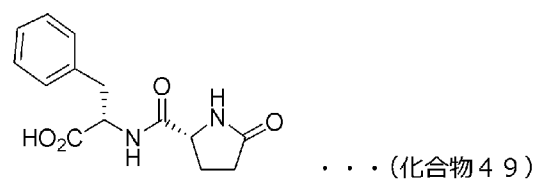
[化52]



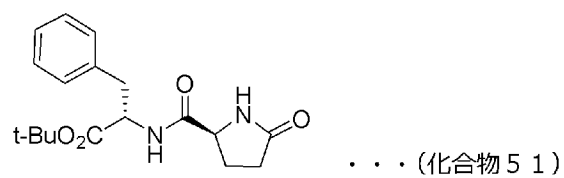
[化53]



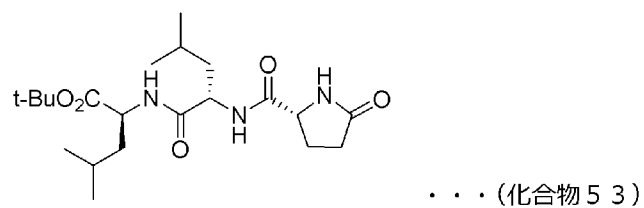
[化54]



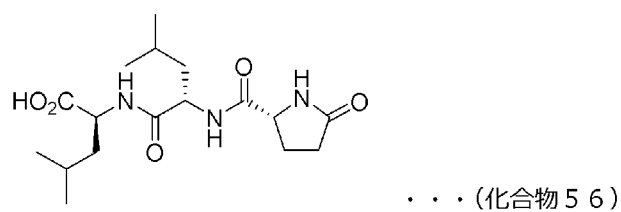
[化55]



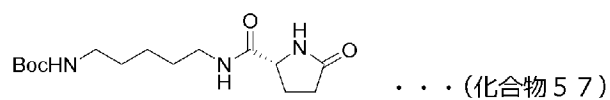
[化56]



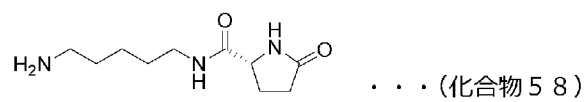
[化57]



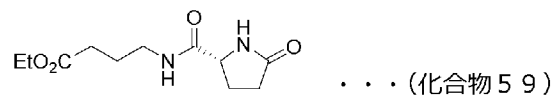
[化58]



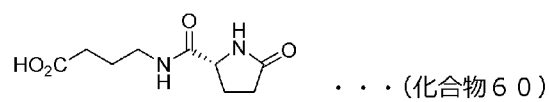
[化59]



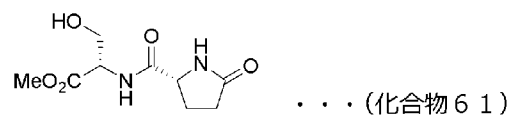
[化60]



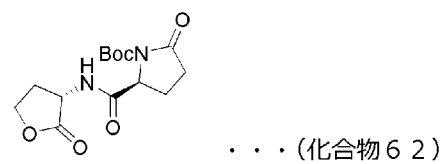
[化61]



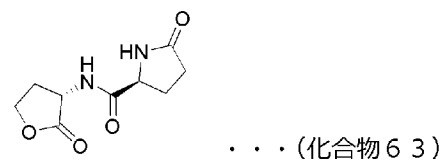
[化62]



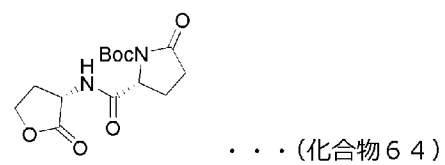
[化63]



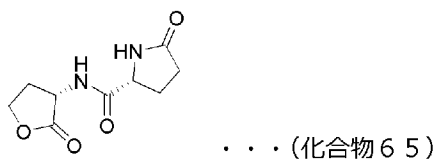
[化64]



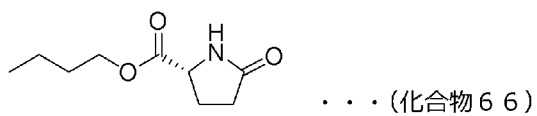
[化65]



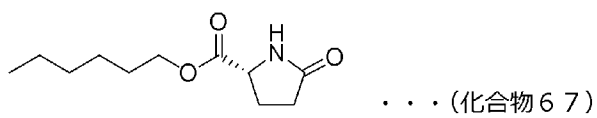
[化66]



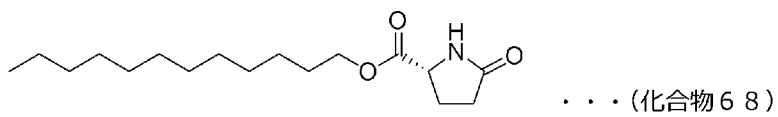
[化67]



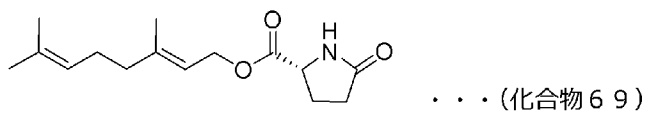
[化68]



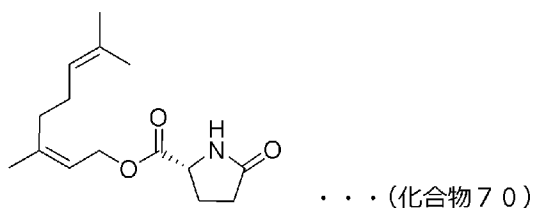
[化69]



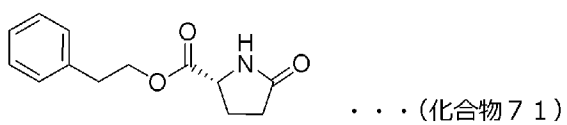
[化70]



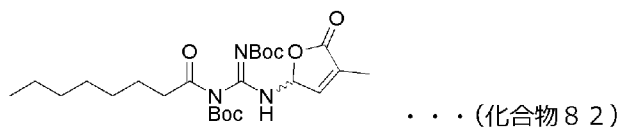
[化71]



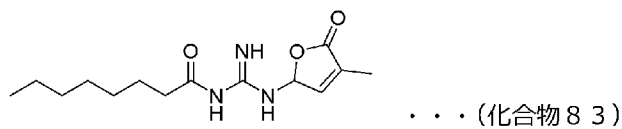
[化72]



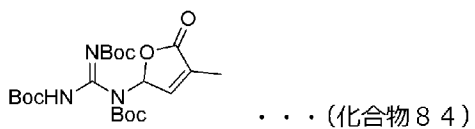
[化81]



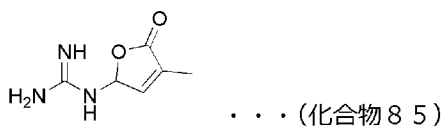
[化82]



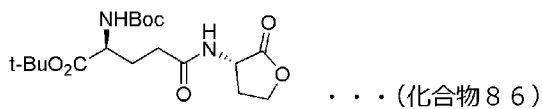
[化83]



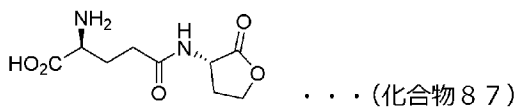
[化84]



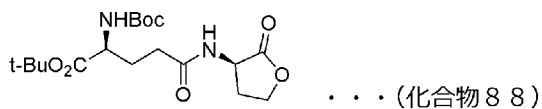
[化85]



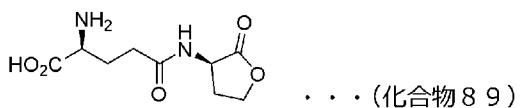
[化86]



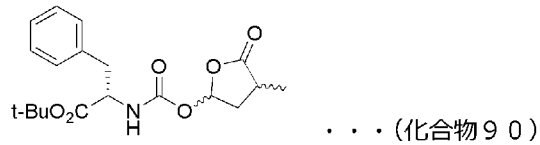
[化87]



[化88]



[化89]



[請求項14] 前記成分 (C) が、リジン、トリプトファン、スレオニン、バリン、ロイシン、またはイソロイシンの発酵副生物である、請求項1～13のいずれか1項に記載の組成物。

[請求項15] 前記成分 (A)、(B)、または (C) を10 nM～10 mMの濃度で含有する液体の形態で使用される、請求項1～14のいずれか1項に記載の組成物。

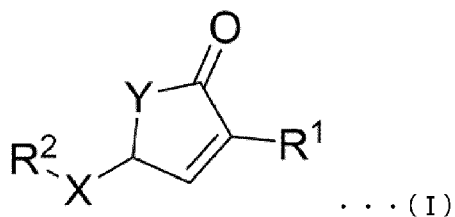
[請求項16] 寄生植物を防除する方法であって、
下記成分 (A)、(B)、または (C) を寄生植物の種子に施用することを含む、方法：

(A) 下記一般式 (I) で表される化合物；

(B) 下記一般式 (I) で表される化合物；

(C) アミノ酸発酵副生物。

[化90]



式 (I) 中、

Xは、原子間結合またはオキシカルボニル基 (OC (=O)) を表し、

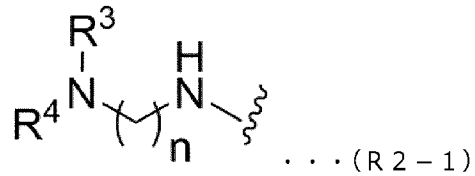
Yは、酸素原子 (O)、水素原子が結合した窒素原子 (NH)、またはメチル基が結合した窒素原子 (NMe) を表し、

R1は、水素原子 (H) またはメチル基を表し、

R2は、アミノ酸、アグマチン、グアニジン、下記一般式 (R2-

1) で表される構造、または下記一般式 (R 2 - 2) で表される構造を表す。

[化91]

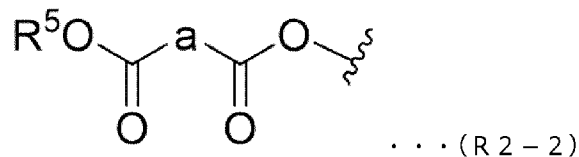


式 (R 2 - 1) 中、

n は、2 ～ 5 の整数 (すなわち 2、3、4、または 5) を表し、

式 (R 2 - 1) 中、R 3 および R 4 は、それぞれ独立に、水素原子、またはアシル基を表す。

[化92]

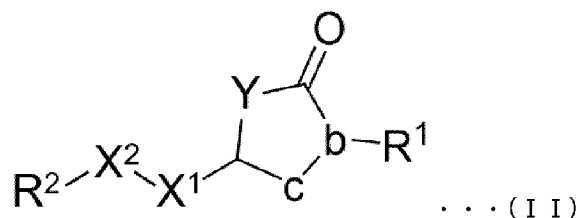


式 (R 2 - 2) 中、

a は、置換されていてもよい炭素数 1 ～ 4 のアルキレン基または置換されていてもよい炭素数 2 ～ 4 のアルケニレン基を表し、

R 5 は、水素原子 (H) または置換されていてもよい炭素数 1 ～ 4 のアルキル基を表す。

[化93]



式 (I I) 中、

X 1 は、原子間結合またはメチレンオキシ基 (CH₂O) を表し、

X 2 は、原子間結合またはカルボニル基 (C (=O)) を表し、

Y は、酸素原子 (O) または水素原子が結合した窒素原子 (NH)

を表し、

R 1 は、水素原子 (H) またはメチル基を表し、

R 2 は、アミノ酸、アグマチン、グアニジン、脂肪族アルコール、
脂肪酸、前記一般式 (R 2 - 1) で表される構造、または前記一般式
(R 2 - 2) で表される構造を表し、

b - c は、CH - CH₂ または C = CH を表す。

[請求項17]

植物体を製造する方法であって、

下記成分 (A)、(B)、または (C) を寄生植物の種子に施用す
ることにより、前記寄生植物の自殺発芽を誘導すること；

前記施用後に前記寄生植物の寄生対象となる植物を栽培すること；
および

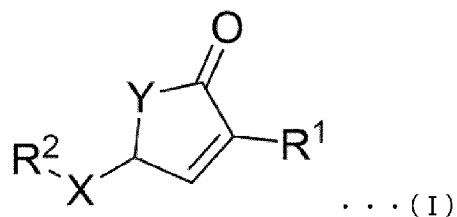
前記寄生植物の寄生対象となる植物の植物体を収穫することを含む
、方法：

(A) 下記一般式 (I) で表される化合物；

(B) 下記一般式 (I I) で表される化合物；

(C) アミノ酸発酵副生物。

[化94]



式 (I) 中、

X は、原子間結合またはオキシカルボニル基 (OC (=O)) を表
し、

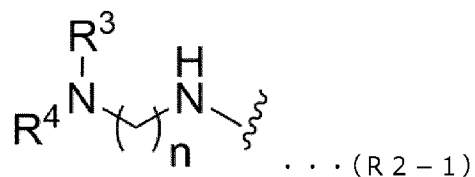
Y は、酸素原子 (O)、水素原子が結合した窒素原子 (NH)、ま
たはメチル基が結合した窒素原子 (NMe) を表し、

R 1 は、水素原子 (H) またはメチル基を表し、

R 2 は、アミノ酸、アグマチン、グアニジン、下記一般式 (R 2 -

1) で表される構造、または下記一般式 (R 2 - 2) で表される構造を表す。

[化95]

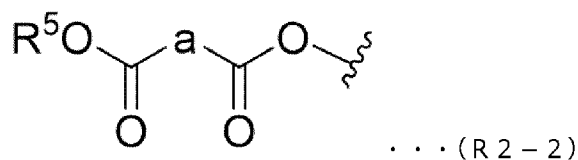


式 (R 2 - 1) 中、

n は、2 ～ 5 の整数 (すなわち 2、3、4、または 5) を表し、

式 (R 2 - 1) 中、R 3 および R 4 は、それぞれ独立に、水素原子、またはアシル基を表す。

[化96]

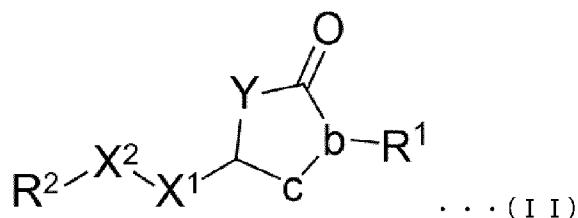


式 (R 2 - 2) 中、

a は、置換されていてもよい炭素数 1 ～ 4 のアルキレン基または置換されていてもよい炭素数 2 ～ 4 のアルケニレン基を表し、

R 5 は、水素原子 (H) または置換されていてもよい炭素数 1 ～ 4 のアルキル基を表す。

[化97]



式 (I I) 中、

X 1 は、原子間結合またはメチレンオキシ基 (CH₂O) を表し、

X 2 は、原子間結合またはカルボニル基 (C (=O)) を表し、

Y は、酸素原子 (O) または水素原子が結合した窒素原子 (NH)

を表し、

R¹ は、水素原子 (H) またはメチル基を表し、

R² は、アミノ酸、アグマチン、グアニジン、脂肪族アルコール、
脂肪酸、前記一般式 (R² - 1) で表される構造、または前記一般式
(R² - 2) で表される構造を表し、

b - c は、CH - CH₂ または C = CH を表す。

[請求項18]

植物体を製造する方法であって、

寄生植物の寄生対象となる植物を栽培すること；

前記栽培の後期に下記成分 (A)、(B)、または (C) を寄生植物の種子に施用することにより、前記寄生植物の発芽を誘導すること；および

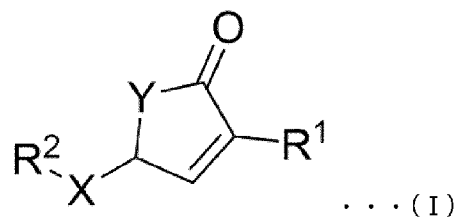
前記寄生植物の寄生対象となる植物の植物体を収穫することを含む、方法；

(A) 下記一般式 (I) で表される化合物；

(B) 下記一般式 (I I) で表される化合物；

(C) アミノ酸発酵副生物。

[化98]



式 (I) 中、

X は、原子間結合またはオキシカルボニル基 (OC (=O)) を表し、

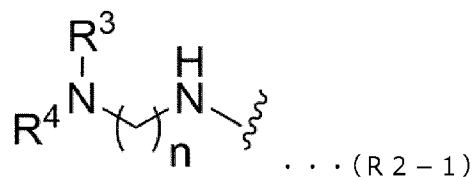
Y は、酸素原子 (O)、水素原子が結合した窒素原子 (NH)、またはメチル基が結合した窒素原子 (NMe) を表し、

R¹ は、水素原子 (H) またはメチル基を表し、

R² は、アミノ酸、アグマチン、グアニジン、下記一般式 (R² -

1) で表される構造、または下記一般式 (R 2 - 2) で表される構造を表す。

[化99]

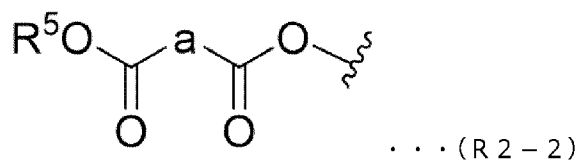


式 (R 2 - 1) 中、

n は、2 ～ 5 の整数 (すなわち 2、3、4、または 5) を表し、

式 (R 2 - 1) 中、R 3 および R 4 は、それぞれ独立に、水素原子、またはアシル基を表す。

[化100]

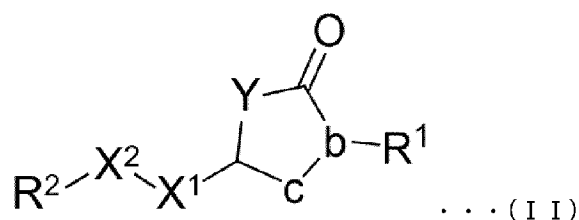


式 (R 2 - 2) 中、

a は、置換されていてもよい炭素数 1 ～ 4 のアルキレン基または置換されていてもよい炭素数 2 ～ 4 のアルケニレン基を表し、

R 5 は、水素原子 (H) または置換されていてもよい炭素数 1 ～ 4 のアルキル基を表す。

[化101]



式 (I I) 中、

X 1 は、原子間結合またはメチレンオキシ基 (C H 2 O) を表し、

X 2 は、原子間結合またはカルボニル基 (C (=O)) を表し、

Y は、酸素原子 (O) または水素原子が結合した窒素原子 (NH)

を表し、

R¹ は、水素原子 (H) またはメチル基を表し、

R² は、アミノ酸、アグマチン、グアニジン、脂肪族アルコール、
脂肪酸、前記一般式 (R² - 1) で表される構造、または前記一般式
(R² - 2) で表される構造を表し、

b - c は、CH - CH₂ または C = CH を表す。

[請求項19]

植物体を製造する方法であって、

寄生植物の寄生対象となる植物を栽培すること；

前記栽培中に下記成分 (A)、(B)、または (C) を寄生植物の
種子に施用することにより、寄生植物の発芽を抑制すること；および

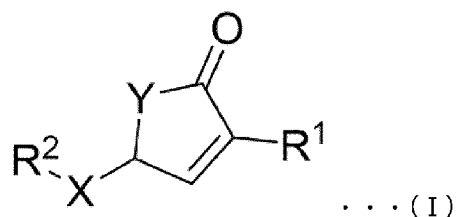
前記寄生植物の寄生対象となる植物の植物体を収穫することを含む
、方法：

(A) 下記一般式 (I) で表される化合物；

(B) 下記一般式 (I I) で表される化合物；

(C) アミノ酸発酵副生物。

[化102]



式 (I) 中、

X は、原子間結合またはオキシカルボニル基 (OC (=O)) を表
し、

Y は、酸素原子 (O)、水素原子が結合した窒素原子 (NH)、ま
たはメチル基が結合した窒素原子 (NMe) を表し、

R¹ は、水素原子 (H) またはメチル基を表し、

R² は、アミノ酸、アグマチン、グアニジン、下記一般式 (R² -
1) で表される構造、または下記一般式 (R² - 2) で表される構造

R 1 は、水素原子 (H) またはメチル基を表し、

R 2 は、アミノ酸、アグマチン、グアニジン、脂肪族アルコール、脂肪酸、前記一般式 (R 2 - 1) で表される構造、または前記一般式 (R 2 - 2) で表される構造を表し、

b - c は、 $\text{CH}-\text{CH}_2$ または $\text{C}=\text{CH}$ を表す。

[請求項20] 前記寄生植物の自殺発芽の誘導または前記寄生植物の発芽の抑制により該寄生植物が防除される、請求項 16 に記載の方法。

[請求項21] 前記施用により前記寄生植物が防除される、請求項 17 ~ 19 のいずれか 1 項に記載の方法。

[請求項22] 前記寄生植物が、ハマウツボ科 (Orobanchaceae) 植物、ゴマノハグサ科 (Scrophulariaceae) 植物、またはヒルガオ科 (Convolvulaceae) 植物である、請求項 16 ~ 21 のいずれか 1 項に記載の方法。

[請求項23] 前記寄生植物が、ストライガ (Striga) 属植物、ハマウツボ (Orobanche) 属植物、フェリパンキ (Phelipanche) 属植物、アレクトラ (Alectra) 属植物、またはネナシカズラ (Cuscuta) 属植物である、請求項 16 ~ 22 のいずれか 1 項に記載の方法。

[請求項24] 前記寄生植物が、*Striga asiatica*、*Striga gesnerioides*、*Striga hermonthica*、*Striga aspera*、*Striga asiatica*、*Striga curviflora*、*Striga parviflora*、*Striga angustifolia*、*Striga latericea*、*Striga aequinoctialis*、*Striga angolensis*、*Striga bilabiate*、*Striga brachycalyx*、*Striga chrsantha*、*Striga dalzielii*、*Striga elegans*、*Striga forbesii*、*Striga gastonii*、*Striga gracillima*、*Striga hallaei*、*Striga hirsuta*、*Striga junodii*、*Striga klingii*、*Striga lepidagathidis*、*Striga lutea*、*Striga macrantha*、*Striga passargei*、*Striga pinnatifida*、*Striga primuloides*、*Striga yemenica*、*Striga pubiflora*、*Orobanche ramosa*、*Orobanche minor*、*Orobanche crenata*、*Orobanche cumana*、*Orobanche foetida*、*Orobanche aegyptiaca*、*Orobanche cernua*、*Phelipanche ramosa*、*Phelipanche*

aegyptiaca、Alectra vogelii、Alectra picta、Alectra sessiliflora、Alectra orobanchoides、Alectra fluminensis、Cuscuta australis、Cuscuta campestris、Cuscuta chinensis、Cuscuta indecora、Cuscuta epithymum、Cuscuta epilinum、Cuscuta gronovii、Cuscuta planiflora、Cuscuta monogyna、Cuscuta pedicellata、Cuscuta palaestina、またはCuscuta rejlexaである、請求項16～23のいずれか1項に記載の方法。

[請求項25] 前記成分(A)について、YはNH、R1はメチル基である、請求項16～24のいずれか1項に記載の方法。

[請求項26] 前記成分(A)について、以下のいずれかの条件を満たす、請求項16～25のいずれか1項に記載の方法：

(1) Xは原子間結合またはオキシカルボニル基、R2はアミノ基で結合したアミノ酸、アミノ基で結合したアグマチン、またはアミノ基で結合したグアニジンである；

(2) Xは原子間結合、R2はカルボキシル基で結合したアミノ酸である；

(3) Xは原子間結合、R2は水酸基で結合したアミノ酸である；

(4) Xは原子間結合、R2はチオール基で結合したアミノ酸である；

(5) Xは原子間結合、R2はアミド基で結合したアミノ酸である；

(6) Xは原子間結合またはオキシカルボニル基、R2は式(R2-1)で表される構造である；

(7) Xは原子間結合、R2は式(R2-2)で表される構造である。

[請求項27] 前記成分(A)について、以下のいずれかの条件を満たす、請求項16～26のいずれか1項に記載の方法：

(1) Xは原子間結合、YはNH、R1はメチル基、R2はアミノ基で結合したアミノ酸、アミノ基で結合したアグマチン、アミノ基で結

合したグアニジン、または式 (R²-1) で表される構造である；

(2) Xはオキシカルボニル基、YはNH、R¹はメチル基、R²はカルボキシル基で結合したアミノ酸または式 (R²-2) で表される構造である。

[請求項28] 前記成分 (B) について、YはNH、b-cはCH-CH₂、R¹はHである、請求項16~27のいずれか1項に記載の組成物。

[請求項29] 前記成分 (B) について、以下のいずれかの条件を満たす、請求項16~28のいずれか1項に記載の方法：

(1) X¹は原子間結合、X²はカルボニル基、R²はアミノ基で結合したアミノ酸、アミノ基で結合したアグマチン、またはアミノ基で結合したグアニジンである；

(2) X¹はメチレンオキシ基、X²は原子間結合、R²はカルボキシル基で結合したアミノ酸である；

(3) X¹は原子間結合、X²はカルボニル基、R²は脂肪族アルコールである；

(4) X¹はメチレンオキシ基、X²は原子間結合、R²は脂肪酸である；

(5) X¹は原子間結合、X²はカルボニル基、R²は式 (R²-1) で表される構造である；

(6) X¹はメチレンオキシ基、X²は原子間結合、R²は式 (R²-2) で表される構造である；

(7) X¹は原子間結合、X²は原子間結合、R²はアミノ基で結合したグアニジンである。

[請求項30] 前記成分 (B) について、以下のいずれかの条件を満たす、請求項16~29のいずれか1項に記載の方法：

(1) X¹は原子間結合、X²はカルボニル基、YはNH、b-cはCH-CH₂、R¹はH、R²はアミノ基で結合したアミノ酸、アミノ基で結合したアグマチン、または式 (R²-1) で表される構造で

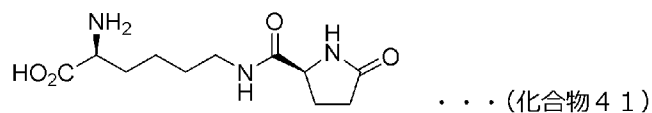
ある；

(2) X1はメチレンオキシ基、X2は原子間結合、YはNH、b-cはCH-CH₂、R1はH、R2はカルボキシル基で結合したアミノ酸、炭素数2～18の脂肪酸、または式(R2-2)で表される構造である；

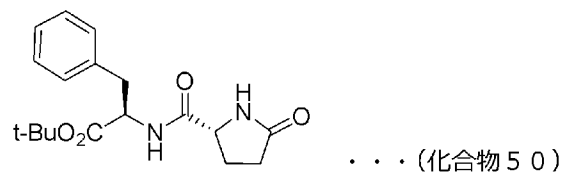
(3) X1は原子間結合、X2は原子間結合、Yは酸素原子(O)、b-cはC=CH、R1はメチル基、R2はアミノ基で結合したグアニジンである。

[請求項31] 前記成分(B)が、下記式(化合物41)、(化合物50)、(化合物52)、(化合物54)、(化合物55)、および(化合物77)で表される化合物である場合は除く、請求項16～30のいずれか1項に記載の方法。

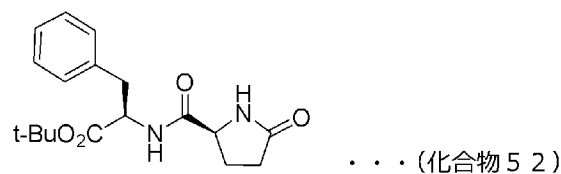
[化106]



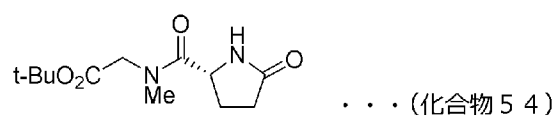
[化107]



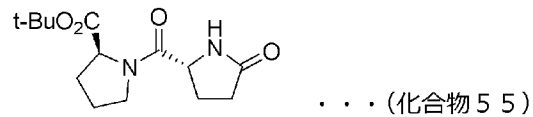
[化108]



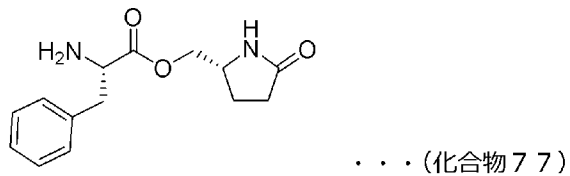
[化109]



[化110]



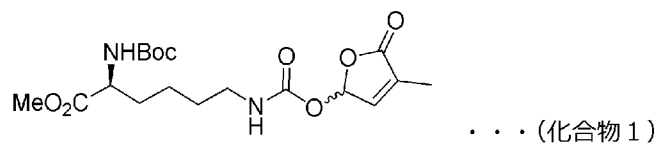
[化111]



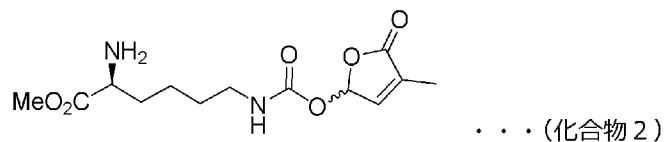
[請求項32]

前記成分 (A) または (B) が、下記式 (化合物 1) ~ (化合物 20)、(化合物 23)、(化合物 26) ~ (化合物 40)、(化合物 42) ~ (化合物 49)、(化合物 51)、(化合物 53)、(化合物 56) ~ (化合物 76)、(化合物 78) ~ (化合物 80)、および (化合物 82) ~ (化合物 90) で表される化合物から選択される、請求項 16 ~ 31 のいずれか 1 項に記載の方法。

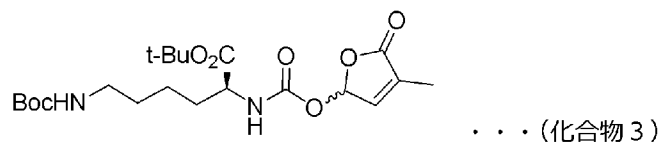
[化112]



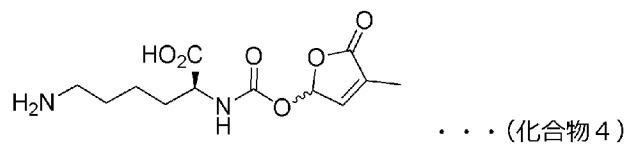
[化113]



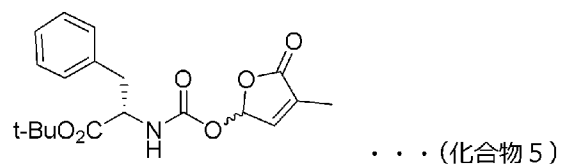
[化114]



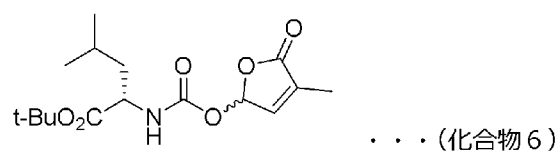
[化115]



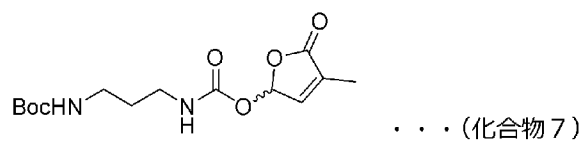
[化116]



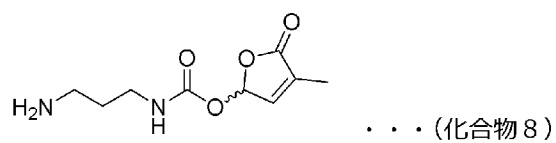
[化117]



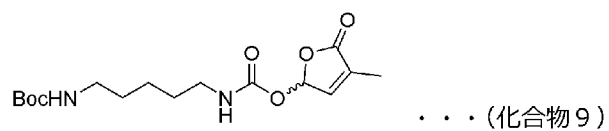
[化118]



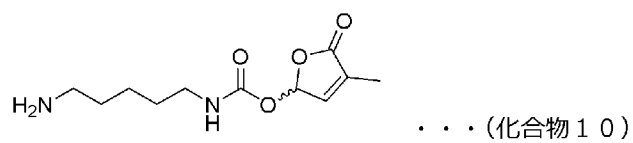
[化119]



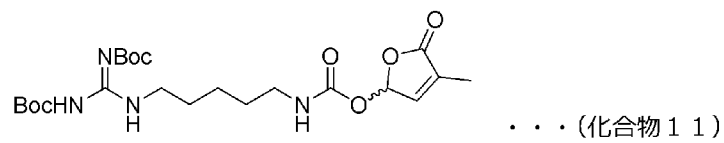
[化120]



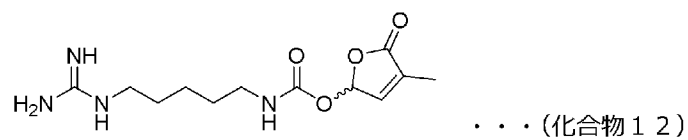
[化121]



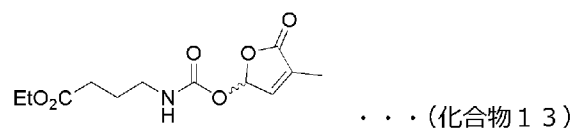
[化122]



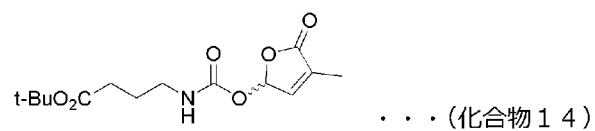
[化123]



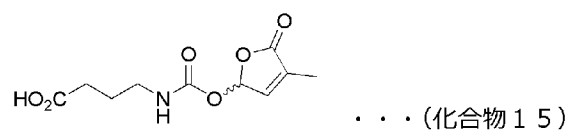
[化124]



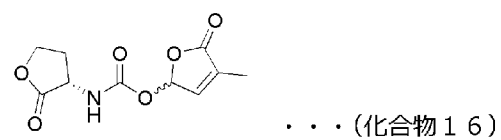
[化125]



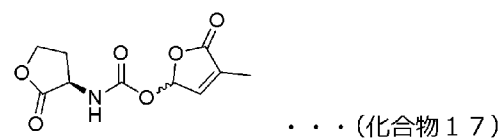
[化126]



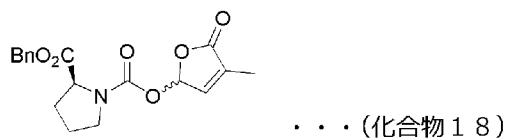
[化127]



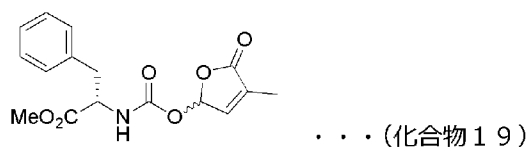
[化128]



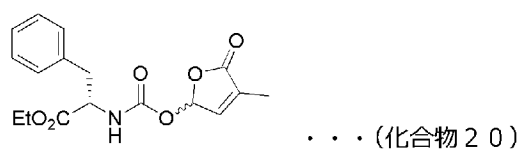
[化129]



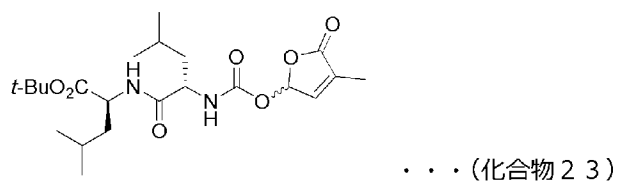
[化130]



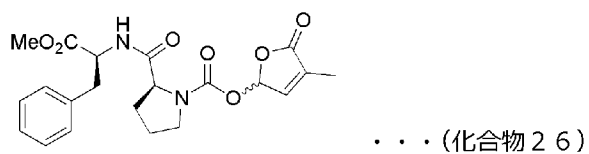
[化131]



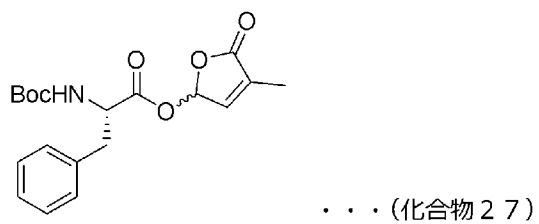
[化132]



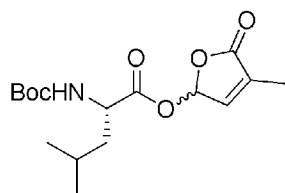
[化133]



[化134]

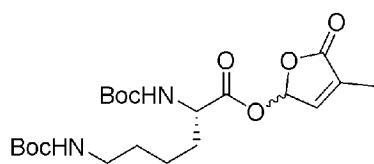


[化135]



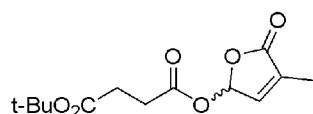
. . . (化合物 28)

[化136]



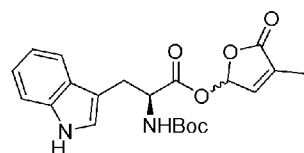
. . . (化合物 29)

[化137]



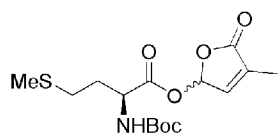
. . . (化合物 30)

[化138]



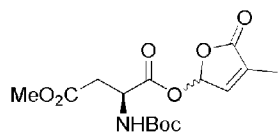
. . . (化合物 31)

[化139]



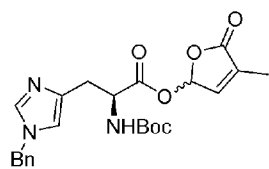
. . . (化合物 32)

[化140]



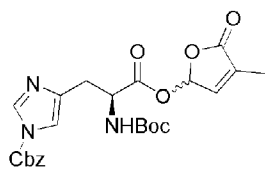
. . . (化合物 33)

[化141]



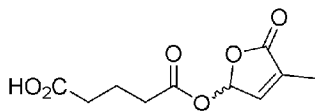
. . . (化合物 34)

[化142]



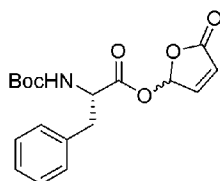
. . . (化合物 3 5)

[化143]



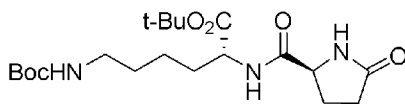
. . . (化合物 3 6)

[化144]



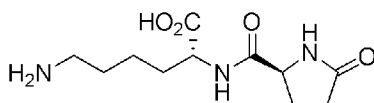
. . . (化合物 3 7)

[化145]



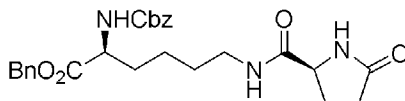
. . . (化合物 3 8)

[化146]



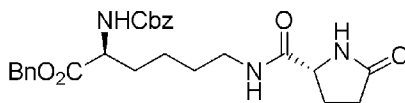
. . . (化合物 3 9)

[化147]



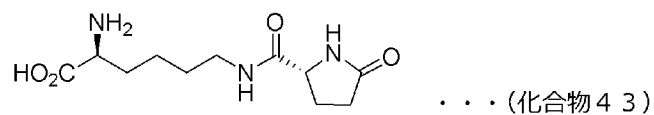
. . . (化合物 4 0)

[化148]

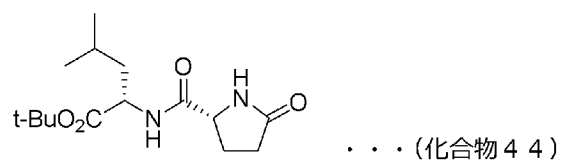


. . . (化合物 4 2)

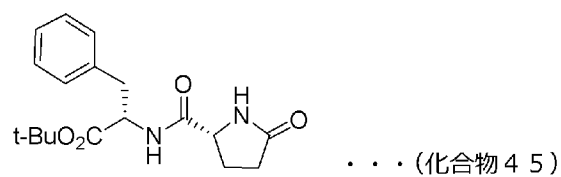
[化149]



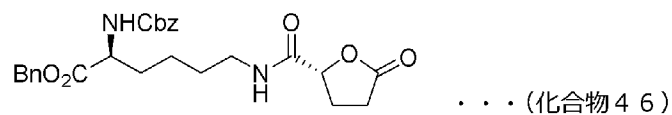
[化150]



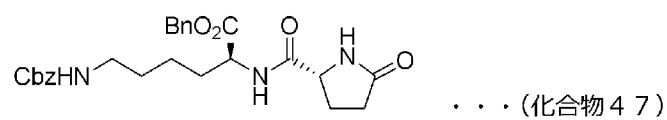
[化151]



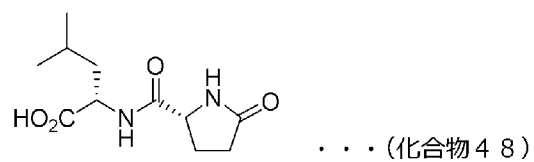
[化152]



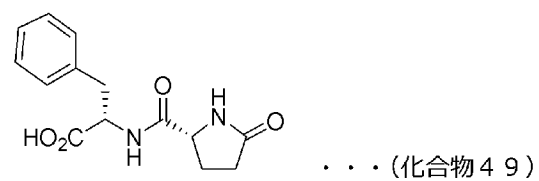
[化153]



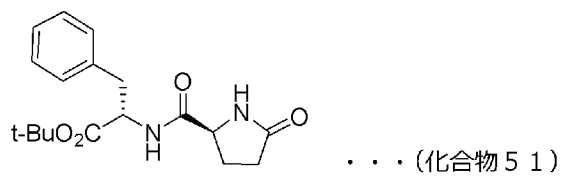
[化154]



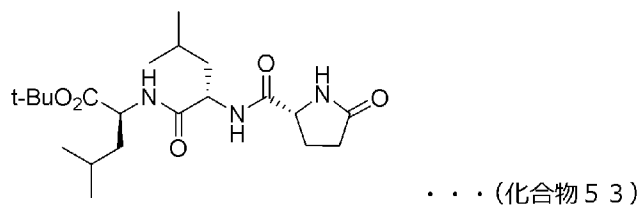
[化155]



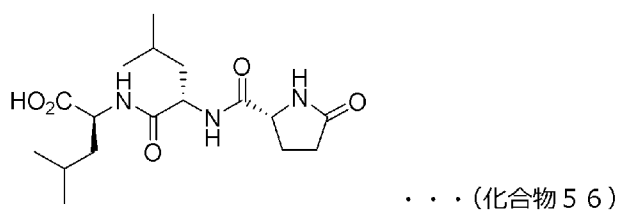
[化156]



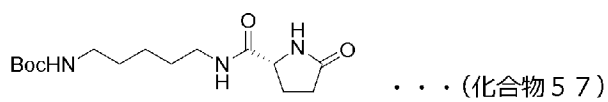
[化157]



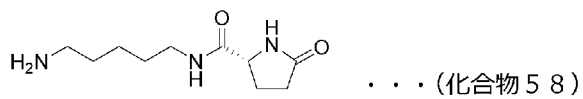
[化158]



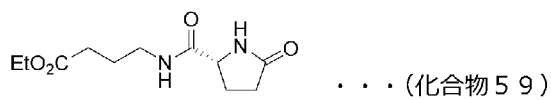
[化159]



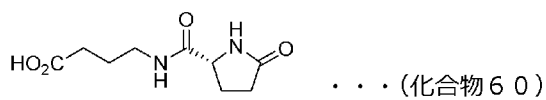
[化160]



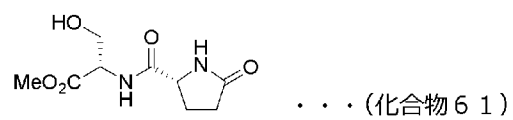
[化161]



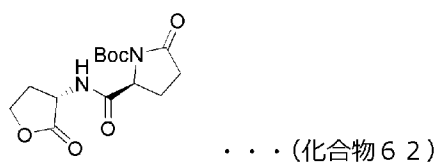
[化162]



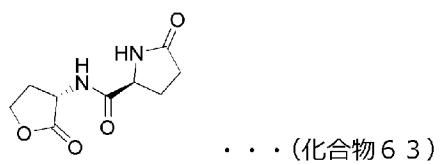
[化163]



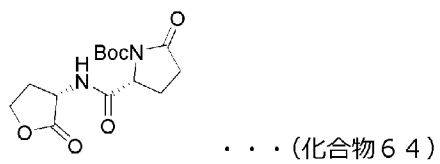
[化164]



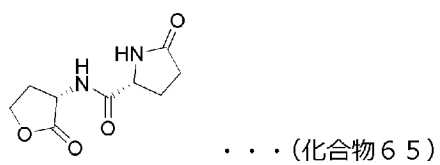
[化165]



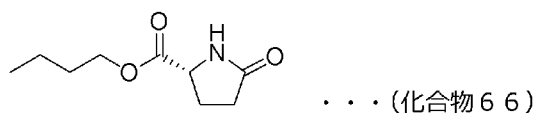
[化166]



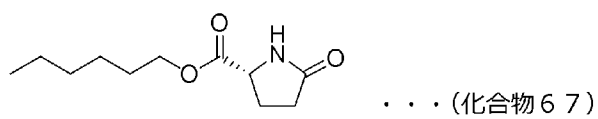
[化167]



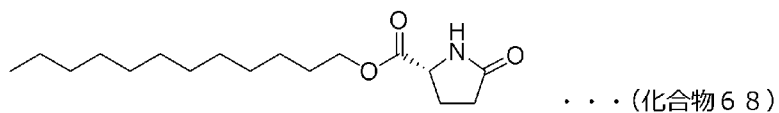
[化168]



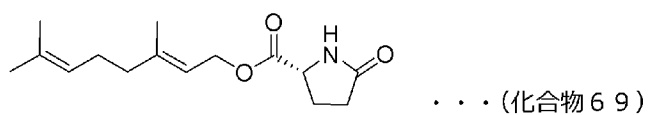
[化169]



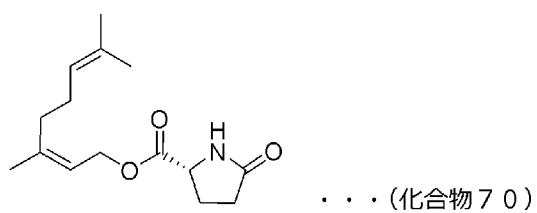
[化170]



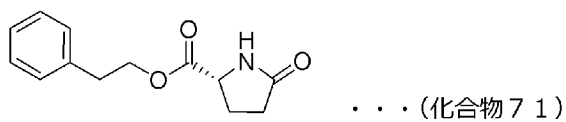
[化171]



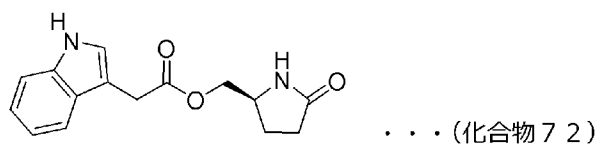
[化172]



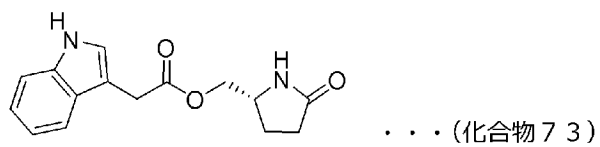
[化173]



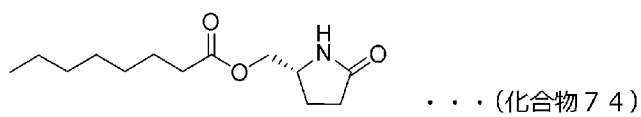
[化174]



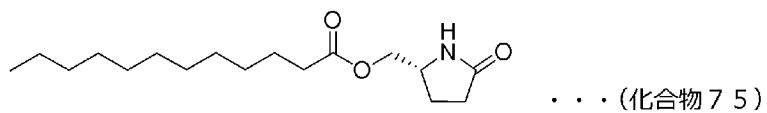
[化175]



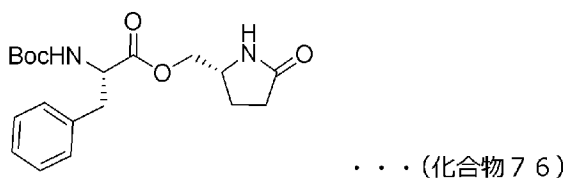
[化176]



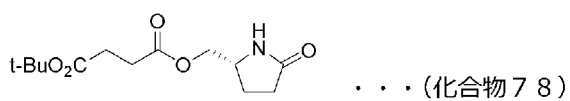
[化177]



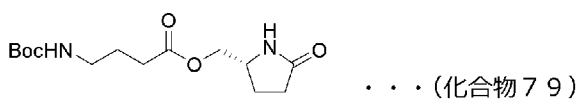
[化178]



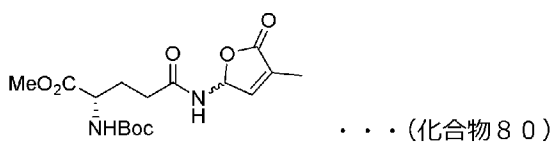
[化179]



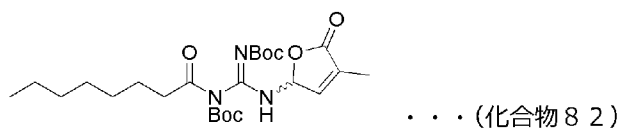
[化180]



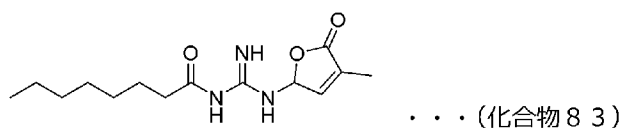
[化181]



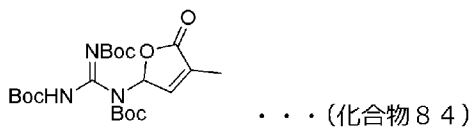
[化182]



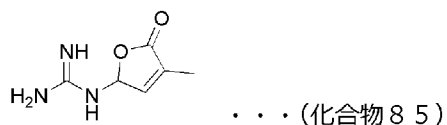
[化183]



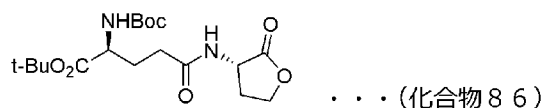
[化184]



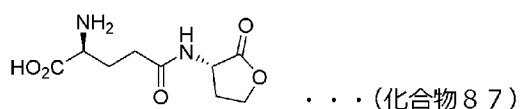
[化185]



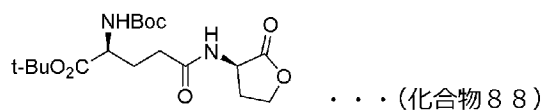
[化186]



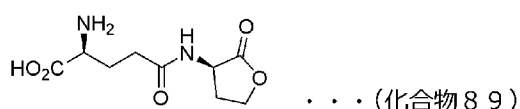
[化187]



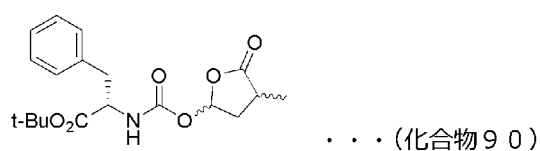
[化188]



[化189]



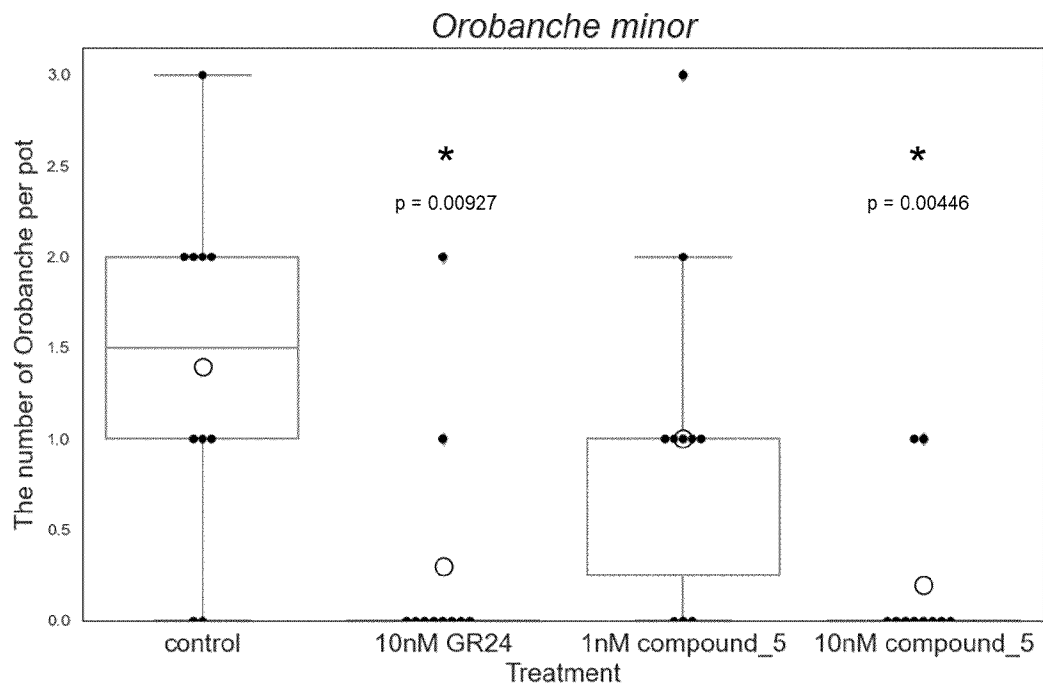
[化190]



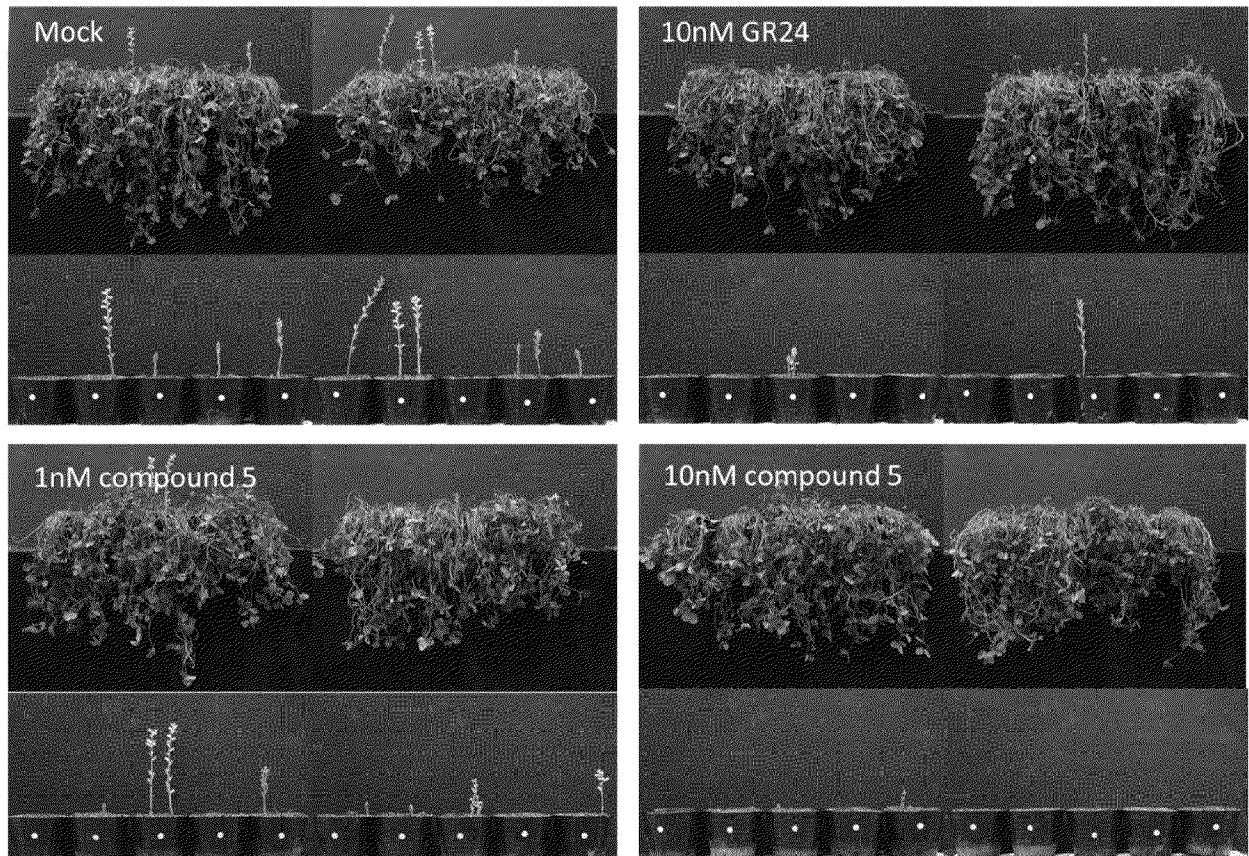
[請求項33] 前記成分 (C) が、リジン、トリプトファン、スレオニン、バリン、ロイシン、またはイソロイシンの発酵副生物である、請求項 16～32 のいずれか 1 項に記載の方法。

[請求項34] 前記成分 (A)、(B)、または (C) が、該成分 (A)、(B)、または (C) を 10 nM～10 mM の濃度で含有する液体の形態で使用される、請求項 16～33 のいずれか 1 項に記載の方法。

[図1]



[図2]



INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2023/013999

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER <i>A01N 43/08</i> (2006.01)i; <i>A01N 43/36</i> (2006.01)i; <i>A01N 43/38</i> (2006.01)i; <i>A01N 47/12</i> (2006.01)i; <i>A01N 47/18</i> (2006.01)i; <i>A01P 13/00</i> (2006.01)i FI: A01N43/08 H; A01P13/00; A01N47/18 101Z; A01N47/12 101; A01N43/36 C; A01N47/12 102; A01N43/38 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) A01N43/08; A01N43/36; A01N43/38; A01N47/12; A01N47/18; A01P13/00 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 1971-2023 Registered utility model specifications of Japan 1996-2023 Published registered utility model applications of Japan 1994-2023 Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) CAPLUS/REGISTRY (STN)																	
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT <table border="1" style="width: 100%; border-collapse: collapse;"> <thead> <tr> <th style="width: 10%;">Category*</th> <th style="width: 70%;">Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages</th> <th style="width: 20%;">Relevant to claim No.</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td style="text-align: center; vertical-align: top;">X A</td> <td>WO 2013/140946 A1 (NATIONAL UNIVERSITY CORPORATION KOBE UNIVERSITY) 26 September 2013 (2013-09-26) claims, paragraphs [0003]-[0004], [0006], examples</td> <td style="vertical-align: top;">1-8, 12, 14-16, 19-27, 31, 33-34 9-11, 13, 17- 18, 28-30, 32</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center; vertical-align: top;">X A</td> <td>CN 112979593 A (ZHEJIANG A&F UNIVERSITY) 18 June 2021 (2021-06-18) claims, examples</td> <td style="vertical-align: top;">1-8, 12, 14-18, 20-27, 31, 33-34 9-11, 13, 19, 28-30, 32</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center; vertical-align: top;">X A</td> <td>CN 112970759 A (ZHEJIANG A&F UNIVERSITY) 18 June 2021 (2021-06-18) claims, examples</td> <td style="vertical-align: top;">1-8, 12, 14-18, 20-27, 31, 33-34 9-11, 13, 19, 28-30, 32</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center; vertical-align: top;">X A</td> <td>WO 2012/043813 A1 (RIKEN) 05 April 2012 (2012-04-05) claims, examples</td> <td style="vertical-align: top;">1-8, 12, 14-18, 20-27, 31, 33-34 9-11, 13, 19, 28-30, 32</td> </tr> </tbody> </table>			Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.	X A	WO 2013/140946 A1 (NATIONAL UNIVERSITY CORPORATION KOBE UNIVERSITY) 26 September 2013 (2013-09-26) claims, paragraphs [0003]-[0004], [0006], examples	1-8, 12, 14-16, 19-27, 31, 33-34 9-11, 13, 17- 18, 28-30, 32	X A	CN 112979593 A (ZHEJIANG A&F UNIVERSITY) 18 June 2021 (2021-06-18) claims, examples	1-8, 12, 14-18, 20-27, 31, 33-34 9-11, 13, 19, 28-30, 32	X A	CN 112970759 A (ZHEJIANG A&F UNIVERSITY) 18 June 2021 (2021-06-18) claims, examples	1-8, 12, 14-18, 20-27, 31, 33-34 9-11, 13, 19, 28-30, 32	X A	WO 2012/043813 A1 (RIKEN) 05 April 2012 (2012-04-05) claims, examples	1-8, 12, 14-18, 20-27, 31, 33-34 9-11, 13, 19, 28-30, 32
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.															
X A	WO 2013/140946 A1 (NATIONAL UNIVERSITY CORPORATION KOBE UNIVERSITY) 26 September 2013 (2013-09-26) claims, paragraphs [0003]-[0004], [0006], examples	1-8, 12, 14-16, 19-27, 31, 33-34 9-11, 13, 17- 18, 28-30, 32															
X A	CN 112979593 A (ZHEJIANG A&F UNIVERSITY) 18 June 2021 (2021-06-18) claims, examples	1-8, 12, 14-18, 20-27, 31, 33-34 9-11, 13, 19, 28-30, 32															
X A	CN 112970759 A (ZHEJIANG A&F UNIVERSITY) 18 June 2021 (2021-06-18) claims, examples	1-8, 12, 14-18, 20-27, 31, 33-34 9-11, 13, 19, 28-30, 32															
X A	WO 2012/043813 A1 (RIKEN) 05 April 2012 (2012-04-05) claims, examples	1-8, 12, 14-18, 20-27, 31, 33-34 9-11, 13, 19, 28-30, 32															
☒ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☒ See patent family annex.																	
<table style="width: 100%;"> <tr> <td style="width: 50%; vertical-align: top;"> * 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 </td> <td style="width: 50%; vertical-align: top;"> “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 </td> </tr> </table>			* 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													
* 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 25 May 2023		Date of mailing of the international search report 27 June 2023															
Name and mailing address of the ISA/JP Japan Patent Office (ISA/JP) 3-4-3 Kasumigaseki, Chiyoda-ku, Tokyo 100-8915 Japan		Authorized officer Telephone No.															

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2023/013999**C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT**

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WIGCHERT, S. C. et al. A Critical Account on the Inception of Striga Seed Germination. Journal of Agricultural and Food Chemistry. 1999, vol. 47, no. 4, pp. 1320-1325 abstract, fig. 2, p. 1322, left column, lines 4-32	1-8, 12, 14-18, 20-27, 31, 33-34
A		9-11, 13, 19, 28-30, 32
A	CN 113072544 A (ZHEJIANG A&F UNIVERSITY) 06 July 2021 (2021-07-06) entire text, all drawings	1-34
A	WO 2011/125714 A1 (NATIONAL UNIVERSITY CORPORATION KOBE UNIVERSITY) 13 October 2011 (2011-10-13) entire text, all drawings	1-34

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.

PCT/JP2023/013999

Patent document cited in search report			Publication date (day/month/year)	Patent family member(s)	Publication date (day/month/year)
WO	2013/140946	A1	26 September 2013	(Family: none)	
CN	112979593	A	18 June 2021	(Family: none)	
CN	112970759	A	18 June 2021	(Family: none)	
WO	2012/043813	A1	05 April 2012	EP 2623502 A1 claims, examples	
CN	113072544	A	06 July 2021	(Family: none)	
WO	2011/125714	A1	13 October 2011	US 2013/0085068 A1 entire text, all drawings EP 2562171 A1 AU 2011237227 A1 CN 102906079 A AP 3222 A ES 2528936 T3	

A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（IPC）） A01N 43/08(2006.01)i; A01N 43/36(2006.01)i; A01N 43/38(2006.01)i; A01N 47/12(2006.01)i; A01N 47/18(2006.01)i; A01P 13/00(2006.01)i FI: A01N43/08 H; A01P13/00; A01N47/18 101Z; A01N47/12 101; A01N43/36 C; A01N47/12 102; A01N43/38																	
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）） A01N43/08; A01N43/36; A01N43/38; A01N47/12; A01N47/18; A01P13/00 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 <table border="0"> <tr> <td>日本国実用新案公報</td> <td>1922-1996年</td> </tr> <tr> <td>日本国公開実用新案公報</td> <td>1971-2023年</td> </tr> <tr> <td>日本国実用新案登録公報</td> <td>1996-2023年</td> </tr> <tr> <td>日本国登録実用新案公報</td> <td>1994-2023年</td> </tr> </table> 国際調査で利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/REGISTRY (STN)			日本国実用新案公報	1922-1996年	日本国公開実用新案公報	1971-2023年	日本国実用新案登録公報	1996-2023年	日本国登録実用新案公報	1994-2023年							
日本国実用新案公報	1922-1996年																
日本国公開実用新案公報	1971-2023年																
日本国実用新案登録公報	1996-2023年																
日本国登録実用新案公報	1994-2023年																
C. 関連すると認められる文献 <table border="1"> <thead> <tr> <th>引用文献の カテゴリー*</th> <th>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</th> <th>関連する 請求項の番号</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>X A</td> <td>WO 2013/140946 A1 (国立大学法人 神戸大学) 26.09.2013 (2013-09-26) 請求の範囲、段落0003-0004、0006、実施例</td> <td>1-8, 12, 14-16, 19-27, 31, 33-34 9-11, 13, 17- 18, 28-30, 32</td> </tr> <tr> <td>X A</td> <td>CN 112979593 A (ZHEJIANG A&F UNIVERSITY) 18.06.2021 (2021-06-18) 特許請求の範囲、実施例</td> <td>1-8, 12, 14-18, 20-27, 31, 33-34 9-11, 13, 19, 28-30, 32</td> </tr> <tr> <td>X A</td> <td>CN 112970759 A (ZHEJIANG A&F UNIVERSITY) 18.06.2021 (2021-06-18) 特許請求の範囲、実施例</td> <td>1-8, 12, 14-18, 20-27, 31, 33-34 9-11, 13, 19, 28-30, 32</td> </tr> <tr> <td>X A</td> <td>WO 2012/043813 A1 (独立行政法人理化学研究所) 05.04.2012 (2012-04-05) 請求の範囲、実施例</td> <td>1-8, 12, 14-18, 20-27, 31, 33-34 9-11, 13, 19, 28-30, 32</td> </tr> </tbody> </table>			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	WO 2013/140946 A1 (国立大学法人 神戸大学) 26.09.2013 (2013-09-26) 請求の範囲、段落0003-0004、0006、実施例	1-8, 12, 14-16, 19-27, 31, 33-34 9-11, 13, 17- 18, 28-30, 32	X A	CN 112979593 A (ZHEJIANG A&F UNIVERSITY) 18.06.2021 (2021-06-18) 特許請求の範囲、実施例	1-8, 12, 14-18, 20-27, 31, 33-34 9-11, 13, 19, 28-30, 32	X A	CN 112970759 A (ZHEJIANG A&F UNIVERSITY) 18.06.2021 (2021-06-18) 特許請求の範囲、実施例	1-8, 12, 14-18, 20-27, 31, 33-34 9-11, 13, 19, 28-30, 32	X A	WO 2012/043813 A1 (独立行政法人理化学研究所) 05.04.2012 (2012-04-05) 請求の範囲、実施例	1-8, 12, 14-18, 20-27, 31, 33-34 9-11, 13, 19, 28-30, 32
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	WO 2013/140946 A1 (国立大学法人 神戸大学) 26.09.2013 (2013-09-26) 請求の範囲、段落0003-0004、0006、実施例	1-8, 12, 14-16, 19-27, 31, 33-34 9-11, 13, 17- 18, 28-30, 32															
X A	CN 112979593 A (ZHEJIANG A&F UNIVERSITY) 18.06.2021 (2021-06-18) 特許請求の範囲、実施例	1-8, 12, 14-18, 20-27, 31, 33-34 9-11, 13, 19, 28-30, 32															
X A	CN 112970759 A (ZHEJIANG A&F UNIVERSITY) 18.06.2021 (2021-06-18) 特許請求の範囲、実施例	1-8, 12, 14-18, 20-27, 31, 33-34 9-11, 13, 19, 28-30, 32															
X A	WO 2012/043813 A1 (独立行政法人理化学研究所) 05.04.2012 (2012-04-05) 請求の範囲、実施例	1-8, 12, 14-18, 20-27, 31, 33-34 9-11, 13, 19, 28-30, 32															
☒ 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、一般的技术水準を示すもの “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抵触するものではなく、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 25.05.2023		国際調査報告の発送日 27.06.2023															
名称及びあて先 日本国特許庁(ISA/JP) 〒100-8915 日本国 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号		権限のある職員（特許庁審査官） 奥谷 暢子 4H 6118 電話番号 03-3581-1101 内線 3443															

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	WIGCHERT, S.C. et al., A Critical Account on the Inception of Striga Seed Germination, Journal of Agricultural and Food Chemistry, 1999, Vol.47, No.4, p.1320-1325 Abstract, Figure 2, 1322頁左欄4-32行目	1-8, 12, 14-18, 20-27, 31, 33-34 9-11, 13, 19, 28-30, 32
A	CN 113072544 A (ZHEJIANG A&F UNIVERSITY) 06.07.2021 (2021 - 07 - 06) 全文、全図	1-34
A	WO 2011/125714 A1 (国立大学法人神戸大学) 13.10.2011 (2011 - 10 - 13) 全文、全図	1-34

国際調査報告
 パテントファミリーに関する情報

国際出願番号

PCT/JP2023/013999

引用文献			公表日	パテントファミリー文献	公表日
WO	2013/140946	A1	26.09.2013	(ファミリーなし)	
CN	112979593	A	18.06.2021	(ファミリーなし)	
CN	112970759	A	18.06.2021	(ファミリーなし)	
WO	2012/043813	A1	05.04.2012	EP 2623502 A1	
				Claims, Examples	
CN	113072544	A	06.07.2021	(ファミリーなし)	
WO	2011/125714	A1	13.10.2011	US 2013/0085068 A1	
				全文、全図	
				EP 2562171 A1	
				AU 2011237227 A1	
				CN 102906079 A	
				AP 3222 A	
				ES 2528936 T3	