

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号
特許第5958905号
(P5958905)

(45) 発行日 平成28年8月2日 (2016. 8. 2)

(24) 登録日 平成28年7月1日 (2016. 7. 1)

(51) Int. Cl.

F I

AO 1 N 43/653 (2006. 01)

AO 1 P 21/00 (2006. 01)

AO 1 N 43/653

AO 1 P 21/00

G

請求項の数 8 (全 45 頁)

(21) 出願番号	特願2012-223936 (P2012-223936)	(73) 特許権者	306024148
(22) 出願日	平成24年10月9日 (2012. 10. 9)		公立大学法人秋田県立大学
(65) 公開番号	特開2013-100266 (P2013-100266A)		秋田県秋田市下新城中野字街道端西2 4 1
(43) 公開日	平成25年5月23日 (2013. 5. 23)		− 4 3 8
審査請求日	平成27年1月8日 (2015. 1. 8)	(74) 代理人	100107870
(31) 優先権主張番号	特願2011-230776 (P2011-230776)		弁理士 野村 健一
(32) 優先日	平成23年10月20日 (2011. 10. 20)	(74) 代理人	100098121
(33) 優先権主張国	日本国 (JP)		弁理士 間山 世津子
		(72) 発明者	王 敬銘
			秋田県秋田市下新城中野字街道端西2 4 1
			− 4 3 8 公立大学法人秋田県立大学内
		(72) 発明者	山田 和弘
			秋田県秋田市下新城中野字街道端西2 4 1
			− 4 3 8 公立大学法人秋田県立大学内

最終頁に続く

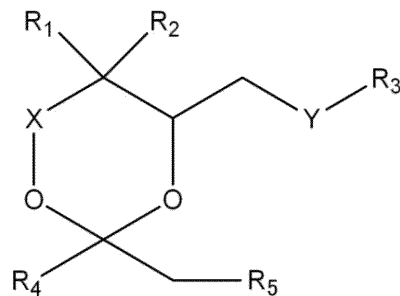
(54) 【発明の名称】 植物成長調節剤

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記の式 (I) :

【化 1】



(I)

(式中、 R_1 及び R_2 は水素原子を示し、 R_3 はフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、2,5-ジクロロフェニル基、2-フルオロフェニル基、2-エトキシフェニル基、2-メトキシフェニル基、2-プロピオキシフェニル基、又は2-アリルオキシフェニル基を示し、 R_4 はフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、3,4-ジクロロフェニル基、2,4-ジクロロフェニル基、3,4-ジフルオロフェニル基、2,4-ジフルオロフェニル

基、4-ブロモフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、4-メチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-ヒドロキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメチルフェニル基、3-クロロ-4-トリフルオロメチルフェニル基、4-ブロモ-2-クロロフェニル基、又はビフェニル基を示し、 R_5 は1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル基を示し、Xは単結合を示し、Yは酸素原子を示す。）で表される化合物又はその塩を有効成分として含む植物成長調節剤。

【請求項2】

R_1 及び R_2 が水素原子であり、 R_3 が2-クロロフェニル基であり、 R_4 が4-クロロフェニル基であり、 R_5 が1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル基であり、Xが単結合であり、Yが酸素原子である請求項1に記載の植物成長調節剤。

10

【請求項3】

R_1 及び R_2 が水素原子であり、 R_3 が2,5-ジクロロフェニル基であり、 R_4 が4-クロロフェニル基であり、 R_5 が1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル基であり、Xが単結合であり、Yが酸素原子である請求項1に記載の植物成長調節剤。

【請求項4】

R_1 及び R_2 が水素原子であり、 R_3 が2-エトキシフェニル基であり、 R_4 が4-クロロフェニル基であり、 R_5 が1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル基であり、Xが単結合であり、Yが酸素原子である請求項1に記載の植物成長調節剤。

【請求項5】

R_1 及び R_2 が水素原子であり、 R_3 が2-プロピオキシフェニル基であり、 R_4 が4-クロロフェニル基であり、 R_5 が1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル基であり、Xが単結合であり、Yが酸素原子である請求項1に記載の植物成長調節剤。

20

【請求項6】

R_1 及び R_2 が水素原子であり、 R_3 が2-アリルオキシフェニル基であり、 R_4 が4-クロロフェニル基であり、 R_5 が1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル基であり、Xが単結合であり、Yが酸素原子である請求項1に記載の植物成長調節剤。

【請求項7】

植物成長調節が、植物の矮化、開花時期の調節、直立葉の誘導、又は生殖制御による雑草防除である請求項1乃至6のいずれか一項に記載の植物成長調節剤。

【請求項8】

請求項1乃至7のいずれか一項に記載の植物成長調節剤を植物に作用させる植物の成長調節方法。

30

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明はブラシノステロイド生合成阻害作用を有する化合物を含む植物成長調節剤に関するものである。

【背景技術】

【0002】

ブラシノステロイドは、近年、分子遺伝学と生合成研究が結びつくことにより新しい種類の植物ホルモンとして認識されるようになった (Yokota, Trends in Plant Sci. 2, 137-143, 1997)。ブラシノステロイドの化学が確立されて以来、それら同族体の生物活性が広く研究されており、茎の伸長、花粉管の生長、葉の屈曲、葉の開放、根の抑制、プロトンポンプの活性化 (Mandava, Annu. Rev. Plant Physiol. Plant Mol. Biol. 39, pp.23-52, 1988)、エチレン生産の促進 (Schlagnhauser et al., Physiol. Plant, 61, pp.555-558, 1984)、導管要素の分化 (Iwasaki et al., Plant Cell Physiol. 32, pp.1007-1014, 1991; Yamamoto et al., Plant Cell Physiol. 38, pp.980-983, 1997)、植物のバイオマス生産増加 (Sakamoto et al., Nature Biotech. 24, pp105-109, 2005)、細胞伸長 (Azipiroz et al., Plant Cell, 10, pp.219-230, 1998)、植物ストレス応答機能発現 (Nakashita, H., et al, Plant J., 33, pp.887-898, 2003)を含む注目すべき植物生長反応が

40

50

示されている。

【0003】

また、ブラシノステロイドの生合成に関する広範囲の研究から、その生理作用のメカニズム及び調節が解明され始めている (Clouse, Plant J. 10, pp.1-8, 1996; Fujioka et al., Physiol. Plant, 100, pp.710-715, 1997)。現在のところ、40個以上のブラシノステロイドが同定されているが、C28-ブラシノステロイドのほとんどはごく一般的な植物ステロールであり、側鎖の炭素骨格がブラシノライドと同じであるカンペステロールから生合成されると考えられている。

【0004】

特有の矮小化を示すシロイヌナズナ変異体が幾つか単離されており、dwarf1 (dwf1: Fe Idman et al., Science, 243, pp.1351-1354, 1989; dim: Takahashi et al., Genes Dev., 9, pp.97-107, 1995; cbb1: Kauschmann et al., Plant J., 9, pp.701-703, 1996)、構造的な光形態形成及び矮小化 (cpd; Szekeres et al., Cell, 85, pp.171-182, 1997)、並びに脱黄化 (det2: Li et al., Science, 272, pp.398-401, 1996; Fujioka et al., Plant Cell, 9, pp.1951-1962, 1997)が知られている。これらはブラシノステロイド生合成経路に欠損を有している。また、エンドウマメのdwarf変異体が決定されており、ブラシノステロイド欠損体であることが報告された (Nomura et al., Plant Physiol., 113, pp.31-37, 1997)。これらの例では、ブラシノライドを使用すると変異体の重度の矮小化が打ち消されることが知られている。これらの知見はブラシノステロイドが植物の生長及び発達に必要な不可欠な役割を持つことを示唆しているが、ブラシノライドの生理学的重要性を解明するには変異体解析よりも生合成阻害剤を含む別の有効な道具が求められている。

【0005】

一般に、内生生物活性物質の作用機構研究法で見られるようにその物質の生合成の特異的阻害剤は内因性物質の生理機能を知る上で非常に有効である。ブラシノステロイド生合成の特異的阻害剤は、ブラシノステロイドの機能を理解するための新たな手段を提供することが期待される。これまでにブラシノステロイド生合成を阻害する物質は幾つか知られている (特許文献1、特許文献2、特許文献3、特許文献4)。

【0006】

一方、下記の式(1)に包含される化合物のうち、 R_1 及び R_2 が水素原子であり、 R_3 がフェニル基であり、 R_4 が2,4-ジクロロフェニル基であり、 R_5 が1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル基であり、Xが単結合であり、Yが酸素原子である化合物は殺菌作用を示す物質として報告されていた (特許文献5)。しかしながら、この化合物の植物成長調節作用は従来知られていない。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0007】

【特許文献1】特許公開2000-53657号公報

【特許文献2】特許公開2001-247412号公報

【特許文献3】特許公開2001-247413号公報

【特許文献4】特許公開2001-247553号公報

【特許文献5】米国特許第4338327号明細書

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0008】

本発明の課題は、ブラシノステロイド生合成の特異的阻害剤を提供することにある。

【課題を解決するための手段】

【0009】

生合成酵素遺伝子を欠損した変異体がシロイヌナズナでいくつか知られており、その形態的变化はブラシノステロイド生合成欠損に特有であるところから、本発明者らはブラシノステロイド生合成の特異的阻害剤を見出すべく、ブラシノステロイド生合成酵素欠損株

に特有な形態変化を惹起する化合物を鋭意探索した。その結果、1-[4-(2-エトキシフェノキシメチル)-2-(4-クロロフェニル-[1,3]ジオキラン-2-イルメチル)-1H-[1,2,4]トリアゾール化合物などが所望の阻害作用を有していることを見出した。

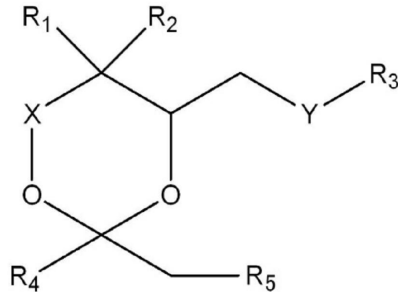
【0010】

即ち、本発明は、以下の(1)~(8)を提供する。

(1) 下記の式(I)：

【0011】

【化1】



10

(I)

【0012】

(式中、 R_1 及び R_2 はそれぞれ独立に水素原子又は低級アルキル基を示し、 R_3 は置換基を有することもあるフェニル基又はナフチル基を示し、 R_4 は置換基を有することもあるフェニル基又はナフチル基を示し、 R_5 は窒素原子を含むヘテロアリール基を示し、Xは単結合又は $-\text{CH}_2-$ を示し、Yは酸素原子、硫黄原子、NH又は $-\text{CH}_2-$ を示す。)で表される化合物又はその塩を有効成分として含む植物成長調節剤。

20

(2) R_1 及び R_2 が水素原子であり、 R_3 が2-クロロフェニル基であり、 R_4 が4-クロロフェニル基であり、 R_5 が1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル基であり、Xが単結合であり、Yが酸素原子である(1)に記載の植物成長調節剤。

(3) R_1 及び R_2 が水素原子であり、 R_3 が2,5-ジクロロフェニル基であり、 R_4 が4-クロロフェニル基であり、 R_5 が1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル基であり、Xが単結合であり、Yが酸素原子である(1)に記載の植物成長調節剤。

30

(4) R_1 及び R_2 が水素原子であり、 R_3 が2-エトキシフェニル基であり、 R_4 が4-クロロフェニル基であり、 R_5 が1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル基であり、Xが単結合であり、Yが酸素原子である(1)に記載の植物成長調節剤。

(5) R_1 及び R_2 が水素原子であり、 R_3 が2-プロピオキシフェニル基であり、 R_4 が4-クロロフェニル基であり、 R_5 が1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル基であり、Xが単結合であり、Yが酸素原子である(1)に記載の植物成長調節剤。

(6) R_1 及び R_2 が水素原子であり、 R_3 が2-アリルオキシフェニル基であり、 R_4 が4-クロロフェニル基であり、 R_5 が1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル基であり、Xが単結合であり、Yが酸素原子である(1)に記載の植物成長調節剤。

(7) 植物成長調節が、植物の矮化、開花時期の調節、直立葉の誘導、又は生殖制御による雑草防除である(1)乃至(6)のいずれかに記載の植物成長調節剤。

40

(8) (1)乃至(7)のいずれか一項に記載の植物成長調節剤を植物に作用させる植物の成長調節方法。

【発明の効果】

【0013】

本発明の植物成長調節剤の有効成分である式(I)の化合物又はその塩は、ブラシノステロイド生合成の特異的阻害作用を有しており、例えば、植物の伸長抑制、植物バイオマス生産増加、花粉成長抑制、花の鮮度保持、植物の抗ストレス剤、雑草防除、植物の老化抑制、根の肥大化などの植物成長調節剤として用いることができる。

【図面の簡単な説明】

50

【 0 0 1 4 】

【図 1】化合物7bのブラシノステロイド生合成阻害作用をブラシナゾール (Brz) の作用と比較して示した図である。

【図 2】化合物7bの開花時期調節作用を示した図である。

【図 3】化合物7bの成長調節作用を示した図である。

【図 4】化合物7bのイネに対する成長調節作用 (直立葉の誘導) を示した図である。

【図 5】化合物7bのイネに対する成長調節作用 (茎の矮化) を示した図である。

【図 6】化合物7qの芝草 (ペंकロス) に対する成長調節作用を示した図である。

【図 7】化合物7qの芝草 (ペंकロス) に対する成長調節作用 (成長抑制) を示した図である。左から順に、コントロール、30g ai/haの化合物7q処理、100 g ai/haの化合物7q処理、プリオマックス処理を示す。

10

【発明を実施するための形態】

【 0 0 1 5 】

以下、本発明を詳細に説明する。

【 0 0 1 6 】

上記式(1)において、 R_1 、 R_2 が示す低級アルキル基としては、炭素数 1 個 ~ 6 個程度の直鎖又は分枝鎖のアルキル基を用いることができる (低級アルキル部分を有するアルコキシ基などのアルキル部分についても同様である。)。例えば、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル基、*n*-ブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基などを挙げることができる。

20

【 0 0 1 7 】

R_1 及び R_2 は、ともに水素原子である場合が好ましい。

【 0 0 1 8 】

R_3 が示すナフチル基としては、1-ナフチル基、2-ナフチル基を挙げることができる。

【 0 0 1 9 】

R_3 が示すフェニル基又はナフチル基が置換基を有する場合には、その置換基の種類、個数、又は結合位置は特に限定されない。例えば、1 個ないし 3 個、好ましくは 1 個又は 2 個程度の置換基を有していることが好ましく、2 個以上の置換基を有する場合には、それらは同一でも異なってもよい。

【 0 0 2 0 】

30

R_3 が示すフェニル基又はナフチル基上の置換基としては、例えば、ハロゲン原子 (フッ素原子、塩素原子、臭素原子、又はヨウ素原子のいずれでもよい)、低級アルキル基 (メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル基、*n*-ブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基、2-メチルブチル基、3-メチルブチル基など)、低級アルケニル基 (ビニル基、1-プロペニル基、アリル基 (2-プロペニル基)、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、3-メチル-2-ブテニル基など)、低級シクロアルキル基 (シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基など)、ハロゲン化低級アルキル基 (トリフルオロメチル基など)、低級アルコキシ基 (メトキシ基、エトキシ基、*n*-プロピオキシ基、イソプロピオキシ基、*n*-ブトキシ基、*sec*-ブトキシ基、*tert*-ブトキシ基、2-メチルブトキシ基、3-メチルブトキシ基など)、低級アルケニルオキシ基 (ビニルオキシ基、1-プロペニルオキシ基、アリルオキシ基、1-ブテニルオキシ基、2-ブテニルオキシ基、3-ブテニルオキシ基、3-メチル-2-ブテニルオキシ基)、低級シクロアルキルオキシ基 (シクロプロピオキシ基、シクロブトキシ基、シクロペンチルオキシ基などなど)、アミノ基、モノ若しくはジアルキルアミノ基、カルボキシ基、アルコキシカルボニル基 (エトキシカルボニル基など)、アルカノイル基 (アセチル基など)、アロイル基 (ベンゾイル基など)、アラルキル基 (ベンジル基など)、アリール基 (フェニル基など)、ヘテロアリール基 (ピリジル基など)、ヘテロ環基 (ピロリジニル基など)、水酸基、ニトロ基、シアノ基などを挙げることができるが、これらに限定されることはない。フェニル基上の置換基として、低級アルキル基、ハロゲン原子、ハロゲン化低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、水酸基が好ましく、塩素原子、プロピオキ

40

50

シ基、アリルオキシ基がより好ましい。

【0021】

R₃が示す置換フェニル基としては、例えば、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2,3-ジクロロフェニル基、2,4-ジクロロフェニル基、2,5-ジクロロフェニル基、2,6-ジクロロフェニル基、3,4-ジクロロフェニル基、3,5-ジクロロフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2,3-ジフルオロフェニル基、2,4-ジフルオロフェニル基、2,5-ジフルオロフェニル基、2,6-ジフルオロフェニル基、3,4-ジフルオロフェニル基、3,5-ジフルオロフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、2-エトキシフェニル基、2-メトキシフェニル基、2-メチルフェニル基、2-プロピオキシフェニル基、2-アリルオキシフェニル基、2-ブトキシフェニル基、2-(3-ブテニルオキシ)フェニル基、2-イソブトキシフェニル基、2-tert-ブトキシフェニル基、2-シクロペンチルオキシフェニル基、2-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)フェニル基、2-(3-メチルブトキシ)フェニル基、ピフェニル-2-イル基、ピフェニル-4-イル基、2-アリルフェニル基、2-ベンジルフェニル基などを挙げることができる。これらのうち、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、2,5-ジクロロフェニル基、2-フルオロフェニル基、2-エトキシフェニル基、2-メトキシフェニル基、2-プロピオキシフェニル基、2-アリルオキシフェニル基が好ましく、2-クロロフェニル基、2,5-ジクロロフェニル基、2-エトキシフェニル基、2-プロピオキシフェニル基、2-アリルオキシフェニル基がより好ましい。

10

【0022】

R₄が示すフェニル基又はナフチル基が置換基を有する場合には、その置換基の種類、個数、又は結合位置は特に限定されない。例えば、1個ないし3個、好ましくは1個又は2個程度の置換基を有していることが好ましく、2個以上の置換基を有する場合には、それらは同一でも異なってもよい。

20

【0023】

R₄が示すフェニル基又はナフチル基上の置換基としては、例えば、ハロゲン原子(フッ素原子、塩素原子、臭素原子、又はヨウ素原子のいずれでもよい)、低級アルキル基(メチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、2-メチルブチル基、3-メチルブチル基など)、低級アルケニル基(ビニル基、1-プロペニル基、アリル基(2-プロペニル基)、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、3-メチル-2-ブテニル基など)、低級シクロアルキル基(シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基など)、ハロゲン化低級アルキル基(トリフルオロメチル基など)、低級アルコキシ基(メトキシ基、エトキシ基、n-プロピオキシ基、イソプロピオキシ基、n-ブトキシ基、sec-ブトキシ基、tert-ブトキシ基、2-メチルブトキシ基、3-メチルブトキシ基など)、低級アルケニルオキシ基(ビニルオキシ基、1-プロペニルオキシ基、アリルオキシ基、1-ブテニルオキシ基、2-ブテニルオキシ基、3-ブテニルオキシ基、3-メチル-2-ブテニルオキシ基)、低級シクロアルキルオキシ基(シクロプロピオキシ基、シクロブトキシ基、シクロペンチルオキシ基など)、アミノ基、モノ若しくはジアルキルアミノ基、カルボキシ基、アルコキシカルボニル基(エトキシカルボニル基など)、アルカノイル基(アセチル基など)、アロイル基(ベンゾイル基など)、アラルキル基(ベンジル基など)、アリール基(フェニル基など)、ヘテロアリール基(ピリジル基など)、ヘテロ環基(ピロリジニル基など)、水酸基、ニトロ基、シアノ基などを挙げることができるが、これらに限定されることはない。フェニル基又はナフチル基上の置換基として、低級アルキル基、ハロゲン原子、ハロゲン化低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、水酸基が好ましく、ハロゲン原子又はハロゲン化低級アルキル基がより好ましい。

30

40

【0024】

R₄が示すナフチル基としては、1-ナフチル基、2-ナフチル基を挙げることができる。

【0025】

R₄が示す置換フェニル基としては、例えば、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基

50

、4-クロロフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、3,4-ジクロロフェニル基、2,4-ジクロロフェニル基、3,4-ジフルオロフェニル基、2,4-ジフルオロフェニル基、4-ブromoフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、4-メチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-ヒドロキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメチルフェニル基、3-クロロ-4-トリフルオロメチルフェニル基、4-ブromo-2-クロロフェニル基、ピフェニル基などを挙げることができる。これらのうち、4-クロロフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-ブromoフェニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメチルフェニル基が好ましい。

【0026】

10

R₅が示す窒素原子を含むヘテロアリール基としては、1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル基、1H-イミダゾール-1-イル基、4H-1,2,4-トリアゾール-4-イル基、1H-ピラゾール-1-イル基などを挙げることができる。これらのうち、1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル基が好ましい。

【0027】

Xは単結合であることが好ましい。なお、「単結合」とは、式(1)においてXに隣接する酸素原子と炭素原子が直接結合していることをいう。

【0028】

Yは酸素原子であることが好ましい。

【0029】

20

上記式(1)で表される化合物は1個又は2以上の不斉炭素を有する場合がある。不斉炭素に基づく純粋な形態の光学活性体又はジアステレオ異性体のほか、任意の異性体混合物（例えば、2以上のジアステレオ異性体の混合物）又はラセミ体などはいずれも本発明の植物成長調節剤の有効成分として利用できる。また、式(1)で表される化合物は酸付加塩を形成することができ、置換基の種類に応じて酸付加塩を形成することもある。塩の種類は特に限定されず、塩酸、硫酸などの鉱酸類との塩、p-トルエンスルホン酸、メタンスルホン酸、酒石酸などの有機酸類との塩、ナトリウム塩、カリウム塩、カルシウム塩などの金属塩、アンモニウム塩、トリエチルアミンなどの有機アミンとの塩、グリシンなどのアミノ酸との塩を挙げることができる。

【0030】

30

式(1)で表される化合物の具体例を以下の表に示すが、本発明の植物成長調節剤に利用可能な化合物はこれらに限定されることはない。

【0031】

【表 1】

	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	X	Y
I-1	H	H	phenyl	4-chlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-2	H	H	2-chlorophenyl	4-chlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-3	H	H	3-chlorophenyl	4-chlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-4	H	H	4-chlorophenyl	4-chlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-5	H	H	2, 3-dichlorophenyl	4-chlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-6	H	H	2, 4-dichlorophenyl	4-chlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-7	H	H	2, 5-dichlorophenyl	4-chlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-8	H	H	2, 6-dichlorophenyl	4-chlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-9	H	H	3, 4-dichlorophenyl	4-chlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-10	H	H	3, 5-dichlorophenyl	4-chlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-11	H	H	2-fluorophenyl	4-chlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-12	H	H	2-trifluoromethoxyphenyl	4-chlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-13	H	H	2-ethoxyphenyl	4-chlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-14	H	H	2-methoxyphenyl	4-chlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-15	H	H	2-methylphenyl	4-chlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-16	H	H	phenyl	phenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-17	H	H	2-chlorophenyl	phenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-18	H	H	3-chlorophenyl	phenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-19	H	H	4-chlorophenyl	phenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-20	H	H	2, 3-dichlorophenyl	phenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-21	H	H	2, 4-dichlorophenyl	phenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-22	H	H	2, 5-dichlorophenyl	phenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-23	H	H	2, 6-dichlorophenyl	phenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-24	H	H	3, 4-dichlorophenyl	phenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-25	H	H	3, 5-dichlorophenyl	phenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-26	H	H	2-fluorophenyl	phenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-27	H	H	2-trifluoromethoxyphenyl	phenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-28	H	H	2-ethoxyphenyl	phenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-29	H	H	2-methoxyphenyl	phenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-30	H	H	2-methylphenyl	phenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-31	H	H	phenyl	4-methylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-32	H	H	2-chlorophenyl	4-methylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-33	H	H	3-chlorophenyl	4-methylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-34	H	H	4-chlorophenyl	4-methylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-35	H	H	2, 3-dichlorophenyl	4-methylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-36	H	H	2, 4-dichlorophenyl	4-methylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-37	H	H	2, 5-dichlorophenyl	4-methylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-38	H	H	2, 6-dichlorophenyl	4-methylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-39	H	H	3, 4-dichlorophenyl	4-methylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-40	H	H	3, 5-dichlorophenyl	4-methylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-41	H	H	2-fluorophenyl	4-methylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-42	H	H	2-trifluoromethoxyphenyl	4-methylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-43	H	H	2-ethoxyphenyl	4-methylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-44	H	H	2-methoxyphenyl	4-methylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-45	H	H	2-methylphenyl	4-methylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-46	H	H	phenyl	biphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-47	H	H	2-chlorophenyl	biphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-48	H	H	3-chlorophenyl	biphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-49	H	H	4-chlorophenyl	biphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-50	H	H	2, 3-dichlorophenyl	biphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-51	H	H	2, 4-dichlorophenyl	biphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-52	H	H	2, 5-dichlorophenyl	biphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-53	H	H	2, 6-dichlorophenyl	biphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-54	H	H	3, 4-dichlorophenyl	biphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-55	H	H	3, 5-dichlorophenyl	biphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-56	H	H	2-fluorophenyl	biphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-57	H	H	2-trifluoromethoxyphenyl	biphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-58	H	H	2-ethoxyphenyl	biphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-59	H	H	2-methoxyphenyl	biphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-60	H	H	2-methylphenyl	biphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-61	H	H	phenyl	4-trifluoromethylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-62	H	H	2-chlorophenyl	4-trifluoromethylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-63	H	H	3-chlorophenyl	4-trifluoromethylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-64	H	H	4-chlorophenyl	4-trifluoromethylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-65	H	H	2, 3-dichlorophenyl	4-trifluoromethylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0

10

20

30

【表 2】

	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	X	Y
I-66	H	H	2, 4-dichlorophenyl	4-trifluoromethylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-67	H	H	2, 5-dichlorophenyl	4-trifluoromethylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-68	H	H	2, 6-dichlorophenyl	4-trifluoromethylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-69	H	H	3, 4-dichlorophenyl	4-trifluoromethylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-70	H	H	3, 5-dichlorophenyl	4-trifluoromethylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-71	H	H	2-fluorophenyl	4-trifluoromethylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-72	H	H	2-trifluoromethoxyphenyl	4-trifluoromethylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-73	H	H	2-ethoxyphenyl	4-trifluoromethylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-74	H	H	2-methoxyphenyl	4-trifluoromethylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-75	H	H	2-methylphenyl	4-trifluoromethylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-76	H	H	phenyl	2, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-77	H	H	2-chlorophenyl	2, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-78	H	H	3-chlorophenyl	2, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-79	H	H	4-chlorophenyl	2, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-80	H	H	2, 3-dichlorophenyl	2, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-81	H	H	2, 4-dichlorophenyl	2, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-82	H	H	2, 5-dichlorophenyl	2, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-83	H	H	2, 6-dichlorophenyl	2, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-84	H	H	3, 4-dichlorophenyl	2, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-85	H	H	3, 5-dichlorophenyl	2, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-86	H	H	2-fluorophenyl	2, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-87	H	H	2-trifluoromethoxyphenyl	2, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-88	H	H	2-ethoxyphenyl	2, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-89	H	H	2-methoxyphenyl	2, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-90	H	H	2-methylphenyl	2, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-91	H	H	phenyl	3, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-92	H	H	2-chlorophenyl	3, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-93	H	H	3-chlorophenyl	3, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-94	H	H	4-chlorophenyl	3, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-95	H	H	2, 3-dichlorophenyl	3, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-96	H	H	2, 4-dichlorophenyl	3, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-97	H	H	2, 5-dichlorophenyl	3, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-98	H	H	2, 6-dichlorophenyl	3, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-99	H	H	3, 4-dichlorophenyl	3, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-100	H	H	3, 5-dichlorophenyl	3, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-101	H	H	2-fluorophenyl	3, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-102	H	H	2-trifluoromethoxyphenyl	3, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-103	H	H	2-ethoxyphenyl	3, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-104	H	H	2-methoxyphenyl	3, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-105	H	H	2-methylphenyl	3, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-106	H	H	phenyl	naphthalen-2-yl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-107	H	H	2-chlorophenyl	naphthalen-2-yl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-108	H	H	3-chlorophenyl	naphthalen-2-yl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-109	H	H	4-chlorophenyl	naphthalen-2-yl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-110	H	H	2, 3-dichlorophenyl	naphthalen-2-yl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-111	H	H	2, 4-dichlorophenyl	naphthalen-2-yl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-112	H	H	2, 5-dichlorophenyl	naphthalen-2-yl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-113	H	H	2, 6-dichlorophenyl	naphthalen-2-yl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-114	H	H	3, 4-dichlorophenyl	naphthalen-2-yl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-115	H	H	3, 5-dichlorophenyl	naphthalen-2-yl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-116	H	H	2-fluorophenyl	naphthalen-2-yl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-117	H	H	2-trifluoromethoxyphenyl	naphthalen-2-yl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-118	H	H	2-ethoxyphenyl	naphthalen-2-yl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-119	H	H	2-methoxyphenyl	naphthalen-2-yl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-120	H	H	2-methylphenyl	naphthalen-2-yl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0

10

20

30

【表 3】

	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	X	Y
I-121	H	H	phenyl	4-fluorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-122	H	H	2-chlorophenyl	4-fluorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-123	H	H	3-chlorophenyl	4-fluorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-124	H	H	4-chlorophenyl	4-fluorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-125	H	H	2,3-dichlorophenyl	4-fluorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-126	H	H	2,4-dichlorophenyl	4-fluorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-127	H	H	2,5-dichlorophenyl	4-fluorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-128	H	H	2,6-dichlorophenyl	4-fluorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-129	H	H	3,4-dichlorophenyl	4-fluorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-130	H	H	3,5-dichlorophenyl	4-fluorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-131	H	H	2-fluorophenyl	4-fluorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-132	H	H	2-trifluoromethoxyphenyl	4-fluorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-133	H	H	2-ethoxyphenyl	4-fluorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-134	H	H	2-methoxyphenyl	4-fluorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-135	H	H	2-methylphenyl	4-chlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-136	H	H	2-propoxyphenyl	4-chlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-137	H	H	2-allyloxyphenyl	4-chlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-138	H	H	2-butoxyphenyl	4-chlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-139	H	H	2-(3-butenyloxy)phenyl	4-chlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-140	H	H	2-i-butoxyphenyl	4-chlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-141	H	H	2-t-butoxyphenyl	4-chlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-142	H	H	2-cyclopentyloxyphenyl	4-chlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-143	H	H	2-(3-methyl-2-butenyloxy)phenyl	4-chlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-144	H	H	2-(3-methylbutoxy)phenyl	4-chlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-145	H	H	biphenyl-2-yl	4-chlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-146	H	H	biphenyl-4-yl	4-chlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-147	H	H	1-naphthyl	4-chlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-148	H	H	2-naphthyl	4-chlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-149	H	H	2-allylphenyl	4-chlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-150	H	H	2-benzylphenyl	4-chlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-151	H	H	2-propoxyphenyl	phenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-152	H	H	2-allyloxyphenyl	phenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-153	H	H	2-butoxyphenyl	phenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-154	H	H	2-(3-butenyloxy)phenyl	phenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-155	H	H	2-i-butoxyphenyl	phenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-156	H	H	2-t-butoxyphenyl	phenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-157	H	H	2-cyclopentyloxyphenyl	phenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-158	H	H	2-(3-methyl-2-butenyloxy)phenyl	phenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-159	H	H	2-(3-methylbutoxy)phenyl	phenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-160	H	H	biphenyl-2-yl	phenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-161	H	H	biphenyl-4-yl	phenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-162	H	H	1-naphthyl	phenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-163	H	H	2-naphthyl	phenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-164	H	H	2-allylphenyl	phenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-165	H	H	2-benzylphenyl	phenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-166	H	H	2-propoxyphenyl	4-methylphenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-167	H	H	2-allyloxyphenyl	4-methylphenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-168	H	H	2-butoxyphenyl	4-methylphenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-169	H	H	2-(3-butenyloxy)phenyl	4-methylphenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-170	H	H	2-i-butoxyphenyl	4-methylphenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-171	H	H	2-t-butoxyphenyl	4-methylphenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-172	H	H	2-cyclopentyloxyphenyl	4-methylphenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-173	H	H	2-(3-methyl-2-butenyloxy)phenyl	4-methylphenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-174	H	H	2-(3-methylbutoxy)phenyl	4-methylphenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-175	H	H	biphenyl-2-yl	4-methylphenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-176	H	H	biphenyl-4-yl	4-methylphenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-177	H	H	1-naphthyl	4-methylphenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-178	H	H	2-naphthyl	4-methylphenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-179	H	H	2-allylphenyl	4-methylphenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-180	H	H	2-benzylphenyl	4-methylphenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0

10

20

30

【表 4】

	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	X	Y
I-181	H	H	2-propoxyphenyl	biphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-182	H	H	2-allyloxyphenyl	biphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-183	H	H	2-butoxyphenyl	biphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-184	H	H	2-(3-butenyloxy)phenyl	biphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-185	H	H	2-i-butoxyphenyl	biphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-186	H	H	2-t-butoxyphenyl	biphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-187	H	H	2-cyclopentyloxyphenyl	biphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-188	H	H	2-(3-methyl-2-butenyloxy)phenyl	biphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-189	H	H	2-(3-methylbutoxy)phenyl	biphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-190	H	H	biphenyl-2-yl	biphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-191	H	H	biphenyl-4-yl	biphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-192	H	H	1-naphthyl	biphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-193	H	H	2-naphthyl	biphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-194	H	H	2-allylphenyl	biphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-195	H	H	2-benzylphenyl	biphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-196	H	H	2-propoxyphenyl	4-trifluoromethylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-197	H	H	2-allyloxyphenyl	4-trifluoromethylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-198	H	H	2-butoxyphenyl	4-trifluoromethylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-199	H	H	2-(3-butenyloxy)phenyl	4-trifluoromethylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-200	H	H	2-i-butoxyphenyl	4-trifluoromethylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-201	H	H	2-t-butoxyphenyl	4-trifluoromethylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-202	H	H	2-cyclopentyloxyphenyl	4-trifluoromethylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-203	H	H	2-(3-methyl-2-butenyloxy)phenyl	4-trifluoromethylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-204	H	H	2-(3-methylbutoxy)phenyl	4-trifluoromethylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-205	H	H	biphenyl-2-yl	4-trifluoromethylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-206	H	H	biphenyl-4-yl	4-trifluoromethylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-207	H	H	1-naphthyl	4-trifluoromethylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-208	H	H	2-naphthyl	4-trifluoromethylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-209	H	H	2-allylphenyl	4-trifluoromethylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-210	H	H	2-benzylphenyl	4-trifluoromethylphenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-211	H	H	2-propoxyphenyl	2, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-212	H	H	2-allyloxyphenyl	2, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-213	H	H	2-butoxyphenyl	2, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-214	H	H	2-(3-butenyloxy)phenyl	2, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-215	H	H	2-i-butoxyphenyl	2, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-216	H	H	2-t-butoxyphenyl	2, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-217	H	H	2-cyclopentyloxyphenyl	2, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-218	H	H	2-(3-methyl-2-butenyloxy)phenyl	2, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-219	H	H	2-(3-methylbutoxy)phenyl	2, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-220	H	H	biphenyl-2-yl	2, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-221	H	H	biphenyl-4-yl	2, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-222	H	H	1-naphthyl	2, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-223	H	H	2-naphthyl	2, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-224	H	H	2-allylphenyl	2, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0
I-225	H	H	2-benzylphenyl	2, 4-dichlorophenyl	1H-1, 2, 4-triazol-1-yl	単結合	0

10

20

【 0 0 3 5 】

【表 5】

	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	X	Y
I-226	H	H	2-propoxyphenyl	3,4-dichlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-227	H	H	2-allyloxyphenyl	3,4-dichlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-228	H	H	2-butoxyphenyl	3,4-dichlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-229	H	H	2-(3-butenyloxy)phenyl	3,4-dichlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-230	H	H	2-i-butoxyphenyl	3,4-dichlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-231	H	H	2-t-butoxyphenyl	3,4-dichlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-232	H	H	2-cyclopentyloxyphenyl	3,4-dichlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-233	H	H	2-(3-methyl-2-butenyloxy)phenyl	3,4-dichlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-234	H	H	2-(3-methylbutoxy)phenyl	3,4-dichlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-235	H	H	biphenyl-2-yl	3,4-dichlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-236	H	H	biphenyl-4-yl	3,4-dichlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-237	H	H	1-naphthyl	3,4-dichlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-238	H	H	2-naphthyl	3,4-dichlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-239	H	H	2-allylphenyl	3,4-dichlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-240	H	H	2-benzylphenyl	3,4-dichlorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-241	H	H	2-propoxyphenyl	naphthalen-2-yl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-242	H	H	2-allyloxyphenyl	naphthalen-2-yl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-243	H	H	2-butoxyphenyl	naphthalen-2-yl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-244	H	H	2-(3-butenyloxy)phenyl	naphthalen-2-yl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-245	H	H	2-i-butoxyphenyl	naphthalen-2-yl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-246	H	H	2-t-butoxyphenyl	naphthalen-2-yl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-247	H	H	2-cyclopentyloxyphenyl	naphthalen-2-yl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-248	H	H	2-(3-methyl-2-butenyloxy)phenyl	naphthalen-2-yl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-249	H	H	2-(3-methylbutoxy)phenyl	naphthalen-2-yl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-250	H	H	biphenyl-2-yl	naphthalen-2-yl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-251	H	H	biphenyl-4-yl	naphthalen-2-yl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-252	H	H	1-naphthyl	naphthalen-2-yl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-253	H	H	2-naphthyl	naphthalen-2-yl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-254	H	H	2-allylphenyl	naphthalen-2-yl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-255	H	H	2-benzylphenyl	naphthalen-2-yl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-256	H	H	2-propoxyphenyl	4-fluorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-257	H	H	2-allyloxyphenyl	4-fluorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-258	H	H	2-butoxyphenyl	4-fluorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-259	H	H	2-(3-butenyloxy)phenyl	4-fluorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-260	H	H	2-i-butoxyphenyl	4-fluorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-261	H	H	2-t-butoxyphenyl	4-fluorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-262	H	H	2-cyclopentyloxyphenyl	4-fluorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-263	H	H	2-(3-methyl-2-butenyloxy)phenyl	4-fluorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-264	H	H	2-(3-methylbutoxy)phenyl	4-fluorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-265	H	H	biphenyl-2-yl	4-fluorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-266	H	H	biphenyl-4-yl	4-fluorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-267	H	H	1-naphthyl	4-fluorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-268	H	H	2-naphthyl	4-fluorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-269	H	H	2-allylphenyl	4-fluorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0
I-270	H	H	2-benzylphenyl	4-fluorophenyl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	単結合	0

10

20

【0036】

上記化合物のうちで、好ましい化合物としてI-1（化合物7a）、I-2（化合物7b）、I-3（化合物7c）、I-4（化合物7d）、I-5（化合物7e）、I-6（化合物7f）、I-7（化合物7g）、I-8（化合物7h）、I-9（化合物7i）、I-10（化合物7j）、I-11（化合物7k）、I-12（化合物7l）、I-13（化合物7m）、I-14（化合物7n）、I-15（化合物7o）、I-136（化合物7p）、I-137（化合物7q）を挙げることができ、より好ましい化合物としてI-2、I-7、I-13、I-136、I-137を挙げることができる。

30

【0037】

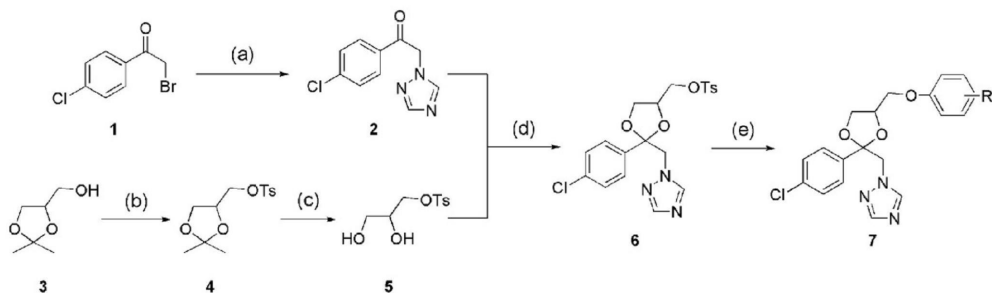
上記式(1)で表される化合物は、公知の文献（例えば、Tetrahedron Asymmetry, 14, pp. 3487-3493, 2003）に記載された方法に従って、あるいはその記述を参照しつつそれらの方法に適宜に改変や修飾を加えた方法に従って合成することができる。例えば、上記式(1)においてR₁及びR₂が水素原子であり、R₃が置換基Rを有するフェニル基であり、R₄が4-クロロフェニル基であり、R₅が1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル基であり、Xが単結合であり、Yが酸素原子である化合物は、以下のScheme 1に従って合成することができる。

40

【0038】

【化 2】

Scheme 1



Reagents and conditions: (a) 1,2,4-triazole, triethylamine, DMF, -10°C, 1 h, r.t., 3 h; (b) TsCl, pyridine, 0°C, acetone; (c) HCl, Reflux, 6 h; (d) 3 equiv. TFOH, toluene, r.t., 60 h; and (e) phenol, KOH, DMF, 50°C, 12 h.

【 0 0 3 9 】

本発明の植物成長調節剤の有効成分である上記式(1)の化合物又はその塩は、ブラシノステロイド生合成に対して特異的な阻害作用を有している。本明細書において用いられる「植物成長調節」という用語は、例えば、植物の矮化（伸長抑制）、開花時期の調節、直立葉の誘導（及びそれに伴う光合成効率の向上、バイオマス増加作用）、花粉成長抑制、花の鮮度保持、植物の抗ストレス剤（熱、乾燥、寒さなど）、生殖制御による雑草防除、植物の老化抑制、根の肥大化などを含めて、最も広義に解釈する必要がある。例えば、植物成長矮化剤、植物成長抑制剤、除草剤などは、本発明の植物成長調節剤の典型的な例であるが、本発明の植物成長調節剤はこれらに限定されることはない。

【 0 0 4 0 】

本発明の植物成長調節剤は、例えば、当業界で周知の製剤用添加物を用いて、農薬用組成物として調製することができる。農薬用組成物の形態は特に限定されず、当業界で利用可能な形態であればいかなる形態を採用してもよい。例えば、乳剤、液剤、油剤、水溶剤、水和剤、フロアブル、粉剤、微粒剤、粒剤、エアゾール、くん蒸剤、又はペースト剤などの形態の組成物を用いることができる。農薬用組成物の製造方法も特に限定されず、当業者に利用可能な方法を適宜採用することができる。本発明の植物成長調節剤の有効成分としては、上記式(1)で表される化合物またはその塩の2種以上を組み合わせてもよい。また、殺虫剤、殺菌剤、殺虫殺菌剤、除草剤などの他の農薬の有効成分を配合してもよい。本発明の植物成長調節剤の適用方法及び適用量は、適用目的、剤型、適用場所などの条件に応じて当業者が適宜選択可能である。好適な適用量は、1ha当り有効成分量で0.1～1000g程度である。

【 0 0 4 1 】

本発明の植物成長調節剤の適用対象となる植物は、ブラシノステロイドを生合成する植物であれば特に限定されない。適用対象となる植物の具体例としては、シロイヌナズナ、トマト、キュウリなどの双子葉植物、イネ、小麦、大麦、トウモロコシなどの単子葉植物などを挙げることができるが、これらに限定されない。

【実施例】

【 0 0 4 2 】

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

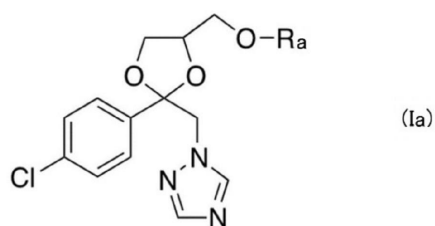
【 0 0 4 3 】

〔実施例1〕 シロイヌナズナの下胚軸の伸長阻害

下記の式(1a)で表される化合物(7a-z、7aa-7ad)、式(1b)で表される化合物(8a-h)、及び式(1c)で表される化合物(9a-c)を用いて、暗黒下で生育させたシロイヌナズナの下胚軸の伸長阻害作用を検討した。

【 0 0 4 4 】

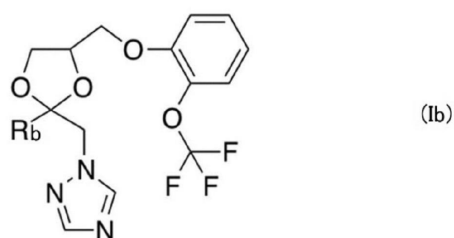
【 化 3 】



10

【 0 0 4 5 】

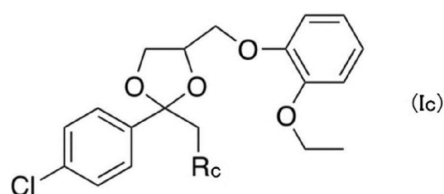
【 化 4 】



20

【 0 0 4 6 】

【 化 5 】










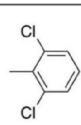

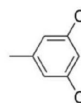

【 0 0 4 7 】

30

購入したシロイヌナズナ種子の表面を1% NaOCl溶液で20分間滅菌し、滅菌蒸留水で5回洗浄した。この種子を1% アガロース固形培地(アグリポット(Agripot、Kirin Brew Co., Tokyo)中に0.5×Murashige and Skoog塩、1.5%シュクロースを含む)に蒔いた。植物を22℃のグローブチャンバー中で、暗条件で成長させた。化合物7bを用いた場合のシロイヌナズナの下胚軸長を図1に示す。また、各化合物の構造と50%阻害濃度(IC₅₀)を表6～10に示す。なお、IC₅₀は、無処理のシロイヌナズナの胚軸の長さを0%阻害とし、シロイヌナズナの胚軸の長さが0mmを100%阻害として算出した。また、データは15-20の幼植物から集め、実験は再現性を確立するため少なくとも二回行った。

【 0 0 4 8 】

【表 6】

化合物	-Ra	シロイヌナズナ下胚軸の伸長阻害 (IC_{50} , μM)
7a		0.41 ± 0.13
7b		0.13 ± 0.02
7c		0.11 ± 0.04
7d		0.32 ± 0.10
7e		0.51 ± 0.08
7f		0.36 ± 0.10
7g		0.14 ± 0.05
7h		0.17 ± 0.09
7i		0.39 ± 0.05
7j		0.71 ± 0.09
7k		0.14 ± 0.06

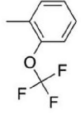



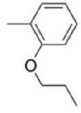
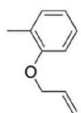
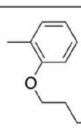
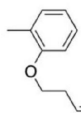
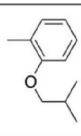
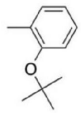
【 0 0 4 9 】

10

20

30

【表 7】

化合物	-Ra	シロイヌナズナ下胚軸の伸長阻害 (IC_{50} , μM)
7l		0.17 ± 0.03
7m		0.10 ± 0.03
7n		0.14 ± 0.05
7o		0.17 ± 0.04
7p		0.06 ± 0.01
7q		0.05 ± 0.01
7r		0.28 ± 0.01
7s		0.13 ± 0.02
7t		0.23 ± 0.04
7u		0.32 ± 0.02

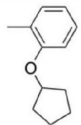
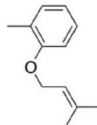
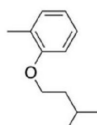
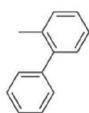
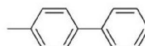

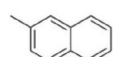
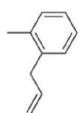
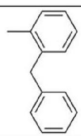
【 0 0 5 0 】

10

20

30

【表 8】

化合物	-Ra	シロイヌナズナ下胚軸の伸長阻害 (IC_{50} , μM)
7v		0.19 ± 0.02
7w		0.33 ± 0.06
7x		0.85 ± 0.03
7y		0.48 ± 0.10
7z		0.42 ± 0.08
7aa		0.71 ± 0.09
7ab		0.41 ± 0.08
7ac		0.21 ± 0.05
7ad		2.40 ± 0.22
Brz	-	0.73 ± 0.13


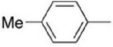
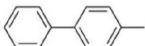
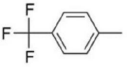
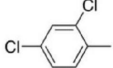
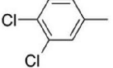
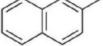

【 0 0 5 1 】

10

20

30

【表 9】




化合物	-Rb	シロイヌナズナ下胚軸の伸長阻害 (IC_{50} , μM)
8a		0.46 ± 0.04
8b		0.26 ± 0.05
8c		>10
8d		0.73 ± 0.06
8e		0.19 ± 0.05
8f		2.40 ± 0.22
8g		2.63 ± 0.39
8h		0.21 ± 0.01

10

20

【0052】

【表 10】

化合物	-Rc	シロイヌナズナ下胚軸の伸長阻害 (IC_{50} , μM)
9a		0.74 ± 0.08
9b		11.20 ± 2.68
9c		11.83 ± 4.84

30

【0053】

図1及び表6～10に示すように、式(1a)、式(1b)、及び式(1c)で表される化合物は、既知のブラシノステロイド生合成阻害物質であるブラシナゾール(Brz)よりも高い阻害効果を示した。特に化合物7m、7p、及び7qの阻害効果が高かった。

40







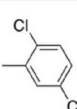
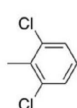

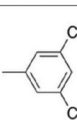

【0054】

〔実施例2〕 ブラシノライドによる阻害剤処理に起因する植物下胚軸伸長阻害の抑制

試験化合物がブラシノステロイド生合成阻害剤であるか否かは、ブラシノステロイドの活性本体と考えられているブラシノライドの添加により、その阻害効果が抑制されるか否かで調べることができる。そこで、前記した式(1a)、式(1b)、及び式(1c)で表される化合物の阻害効果に対するブラシノライドの抑制作用を調べた(表11～15)。

【0055】

【表 1 1】

化合物	-Ra	試験化合物で処理していないシロイヌナズナ下胚軸の 長さに対する相対値 (%)		
		試験化合物	試験化合物 +BL (10 nM)	試験化合物 +GA (1 μM)
Control	—	100	116 ± 5	110 ± 5
7a		50 ± 3	111 ± 7	53 ± 5
7b		30 ± 4	104 ± 9	33 ± 3
7c		36 ± 7	72 ± 8	46 ± 5
7d		53 ± 3	90 ± 9	58 ± 4
7e		44 ± 5	72 ± 9	57 ± 4
7f		58 ± 6	87 ± 11	62 ± 5
7g		32 ± 5	102 ± 12	38 ± 4
7h		43 ± 5	100 ± 8	56 ± 4
7i		58 ± 6	81 ± 13	63 ± 6
7j		78 ± 5	96 ± 6	85 ± 4
7k		29 ± 4	96 ± 6	34 ± 5

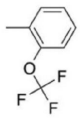








【 0 0 5 6 】

10

20

30

【表 1 2】

化合物	-Ra	試験化合物で処理していないシロイヌナズナ下胚軸の 長さに対する相対値 (%)		
		試験化合物	試験化合物 +BL (10 nM)	試験化合物 +GA (1 μ M)
7l		20 \pm 3	83 \pm 5	26 \pm 4
7m		22 \pm 4	93 \pm 5	22 \pm 3
7n		25 \pm 5	92 \pm 4	34 \pm 5
7o		28 \pm 4	95 \pm 5	32 \pm 4
7p		21 \pm 2	111 \pm 5	26 \pm 2
7q		26 \pm 2	106 \pm 8	25 \pm 2
7r		29 \pm 2	114 \pm 6	42 \pm 5
7s		25 \pm 2	118 \pm 3	26 \pm 3
7t		34 \pm 3	114 \pm 9	36 \pm 5

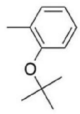
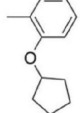
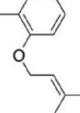
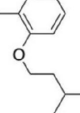
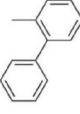



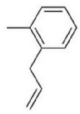
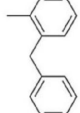
【 0 0 5 7 】

10

20


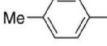
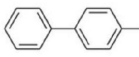
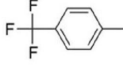
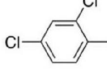
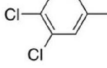
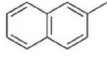
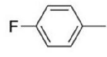
30

【表 1 3】

化合物	-Ra	試験化合物で処理していないシロイヌナズナ下胚軸の 長さに対する相対値 (%)		
		試験化合物	試験化合物 +BL (10 nM)	試験化合物 +GA (1 μM)
7u		36 ± 7	120 ± 6	53 ± 5
7v		25 ± 3	124 ± 6	39 ± 4
7w		29 ± 3	113 ± 5	40 ± 6
7x		29 ± 3	120 ± 7	88 ± 8
7y		53 ± 7	101 ± 8	71 ± 9
7z		54 ± 9	98 ± 7	72 ± 9
7aa		62 ± 7	93 ± 10	74 ± 8
7ab		44 ± 7	92 ± 7	60 ± 9
7ac		34 ± 3	95 ± 8	51 ± 5
7ad		n. d.	n. d.	n. d.
Brz	—	56 ± 3	63 ± 6	62 ± 2




【 0 0 5 8 】

【表 1 4】

化合物	-Rb	試験化合物で処理していないシロイヌナズナ下胚軸の長さに対する相対値 (%)		
		試験化合物	試験化合物 + BL (10 nM)	試験化合物 + GA (1 μM)
Control	—	100	114 ± 8	104 ± 5
8a		46 ± 3	100 ± 4	48 ± 4
8b		38 ± 3	95 ± 5	44 ± 4
8c		n. d.	n. d.	n. d.
8d		57 ± 1	103 ± 5	52 ± 3
8e		21 ± 2	104 ± 3	32 ± 4
8f		n. d.	n. d.	n. d.
8g		n. d.	n. d.	n. d.
8h		33 ± 3	101 ± 5	40 ± 3

【 0 0 5 9 】

【表 1 5】

化合物	-Rc	試験化合物で処理していないシロイヌナズナ下胚軸の長さに対する相対値 (%)		
		試験化合物	試験化合物 + BL (10 nM)	試験化合物 + GA (1 μM)
Control	—	100	110 ± 8	107 ± 6
9a		75 ± 6	101 ± 8	77 ± 6
9b		n. d.	n. d.	n. d.
9c		n. d.	n. d.	n. d.

【 0 0 6 0 】

表 1 1 ~ 1 5 に示すように、シロイヌナズナ下胚軸伸長阻害効果は、ブラシノライド (BL) の添加により抑制されたが、ジベレリン (GA) の添加によっては抑制されなかった。この結果により、式 (1a)、式 (1b)、及び式 (1c) で表される化合物がブラシノステロイド合成を特異的に阻害していることが確認された。

10

20

30

40

50

【 0 0 6 1 】

〔実施例 3〕 シロイヌナズナの開花時期の調節

シロイヌナズナの種子を、10 cm平方のプラスチックポットに入れ、標準的な鉢植え用ミックス(1:1 v/v プロミックス:ペロー砂土)に播き、光照射条件(2000ルクス)16時間、暗条件8時間の周期で、22 のグロースチャンバー中で生育させた。4葉期になるシロイヌナズナに4~400 g ai/haの薬量で均一噴霧することにより薬剤処理を行った。その後、植物の生育を経時的に測定した。化合物7bで処理したシロイヌナズナの外観を図2に示す。また、化合物7bで処理したシロイヌナズナの口ゼットの直径の経時的变化を図3に示す。

【 0 0 6 2 】

図2及び図3に示すように、化合物7bで処理されたシロイヌナズナは、生育が抑制されていた。また、未処理のシロイヌナズナ(Control)では、発芽から42日目には開花していたが、化合物7bで処理されたシロイヌナズナでは開花はみられなかった。

【 0 0 6 3 】

〔実施例 4〕 イネの直立葉化

あきたこまち種子を3葉期になるまで30度で光照射条件(5000ルクス)16時間、暗条件8時間の周期で、グロースチャンバー中で生育させた後、10 cm平方の湛水プラスチックポットに移植した。基肥はN 5g/平方メートル、P 8g/平方メートル、K 10g/平方メートルで施用した。薬剤処理は4~1000 g ai/haの薬量で湛水土壌に加えることにより行った。引き続き同条件下で生育させた後、稲の葉角を測定した。化合物7bで処理したイネの外観を図4に示す。

【 0 0 6 4 】

図4に示すように、化合物7bで処理したイネの葉はほぼ直立していた。

【 0 0 6 5 】

〔実施例 5〕 稲の矮化

比重1.13で塩水選したあきたこまち種子を湛水苗代で中苗になるまで育て、実施年の平成23年5月17日に移植した。栽植様式は、一株一本植えの正方形植えで、栽植密度は、平方メートル当たりの60株とした。基肥はN 5g/平方メートル、P 8g/平方メートル、K 10g/平方メートルで施用し、同年7月18日に追肥としてN 6g/平方メートル、K 5g/平方メートルを施用した。薬剤処理として、同年7月21日に4~1000 g ai/haの薬量で稲に噴霧した。その後、植物の生育を経時的に測定し、8月20日の稲の外観を図5に示した。

【 0 0 6 6 】

図5に示すように、化合物7bで処理したイネの茎の成長は抑制された。

【 0 0 6 7 】

〔実施例 6〕 ゴルフ場芝草成長の抑制

市販されたペンクロスの苗を3センチまで生育させた段階で、化合物7qを30~100 g ai/haの薬量で芝草に噴霧した。その後、植物の生育を経時的に測定した。芝草の成長の経時变化を図6に示す。図に示されたように、無処理区では、時間経過に伴い芝草の成長が観測され、約2カ月経過した時点で芝草は約8.5 cmに伸長した。ジベレリン生合成阻害型薬剤であるプリモマックス処理区では、芝草の長さは約4.5 cmであった。一方、7q処理区では、約4.2 cmであることが明らかとなった。また、芝草の外観を図7に示した。図7に示されたように、芝草の成長は抑制された。

【 0 0 6 8 】

〔合成例 1〕 1-[2-(4-クロロフェニル)-4-(フェノキシメチル)-1,3-ジオキソラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール (化合物7a)の合成

【 0 0 6 9 】

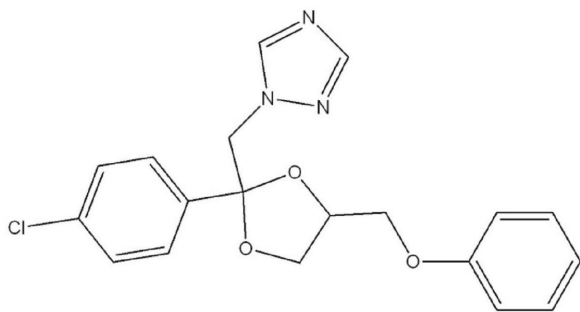
10

20

30

40

【化 6】



10

【0070】

化合物 7a はトルエン-4-スルホン酸 2-(4-クロロフェニル)-2-1H-[1,2,4]トリアゾール-1-イルメチル-[1,3]ジオキサラン-4-イルメチル エステル(トシレート 6)とフェノールを反応させることにより調製した(Scheme 1参照)。トシレート 6 は、以下の方法に従い、調製した。

【0071】

50 ml ナスフラスコに 0.88 g の 1-(4-クロロフェニル)-2-1H-[1,2,4]トリアゾール-1-イルエタノン (2) を (4 mmol) 入れ、トルエン (10 ml) を加えた。そこに 1 g のトルエン-4-スルホン酸 2,3-ジヒドロキシプロピルエステル (5) (4 mmol) と TfOH (1.5 ml) を加え、窒素雰囲気下で 71 時間、室温で反応させた。反応終了後、反応混合物に 5.8% 炭酸水素ナトリウム水溶液 (30 ml) を加えて中和した (pH=7)。得られた混合物を酢酸エチル (30 ml × 3) で液々分配し、有機層を集めて飽和食塩水 (30 ml) で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を減圧留去した。目的化合物のトルエンスルホン酸塩の結晶を得るために濃縮した残存物と 750 mg の p-トルエンスルホン酸 (3.9 mmol) をそれぞれ 10 ml の酢酸エチルに溶かし、混合して 30 分攪拌した。結晶を形成した後、吸引濾過し、アセトニトリルを用いて再結晶を行なうことにより目的化合物トルエン-4-スルホン酸 2-(4-クロロフェニル)-2-1H-[1,2,4]トリアゾール-1-イルメチル-[1,3]ジオキサラン-4-イルメチル エステル (6) が得られた (収率 50.4%)。¹H NMR (CD₃OD) 2.48 (s, 3H), 3.58 (dd, J=5.9, 9.7 Hz, 1H), 3.72 (dd, J=5.9, 9.7 Hz, 1H), 3.78-3.84 (m, 2H), 4.21-4.27 (m, 2H), 7.35 (s, 4H), 7.39 (d, J=8.3 Hz, 2H), 7.79 (d, J=8.3 Hz, 2H), 7.87 (s, 1H), 8.22 (s, 1H)

20

30

【0072】

化合物 7a は、以下の方法に従い、調製した。dry DMF (5 mL) 中のトシレート 6 (485 mg, 0.78 mmol) 及びフェノール (70 mg, 0.72 mmol) に、水酸化カリウム (160 mg, 2.8 mmol) を加え、反応混合液を 50 で一晩加熱した。室温まで冷やした後、反応混合液を水 (20 mL) と EtOAc (20 mL) で希釈し、有機相を分離した。水相を EtOAc (3 × 20 mL) で抽出した。すべての有機層を組み合わせ、鹼水 (20 mL) で洗浄し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濾過し、濃縮し、シリカゲルフラッシュクロマトグラフィー (EtOAc/hexanes = 1:1) で精製し、目的の化合物 7a を得た (178.8 mg, 収率 74.6%)。mp 113.3-113.8。 ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 3.51 (dd, J = 5.9, 9.9 Hz, 1H), 3.73 (dd, J = 4.9, 9.7 Hz, 1H), 3.78 (dd, J = 5.1, 8.4 Hz, 1H), 3.83-3.86 (m, 1H), 4.28-4.33 (m, 1H), 4.48 (s, 2H), 6.77 (d, J = 7.7 Hz, 2H), 6.91 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.21-7.25 (m, 2H), 7.31-7.33 (m, 2H), 7.39-7.41 (m, 2H), 7.89 (s, 1H), 8.30 (s, 1H). HRMS-ESI calcd for C₁₉H₁₈ClN₃O₃Na [M+Na]⁺ 394.0928, found 394.0891.

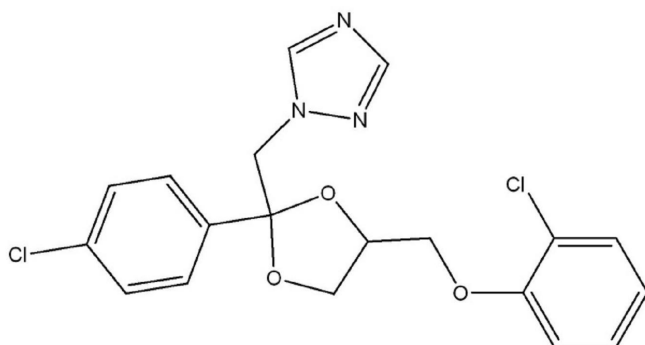
40

【0073】

〔合成例 2〕 1-[[4-[(2-クロロフェノキシ)メチル]-2-(4-クロロフェニル)-1,3-ジオキサラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール(化合物 7b)の合成

【0074】

【化 7】



10

【 0 0 7 5 】

フェノールの代わりに2-クロロフェノールを用い、合成例 1 と同様の方法で目的の化合物7bを得た(収率 24.3%)。mp 117.6-119.3 . ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) 3.87-3.92 (m, 1H), 3.94-9.98 (m, 2H), 4.41-4.47 (m, 1H), 4.50-4.58 (m, 2H), 6.82-6.84 (m, 1H), 6.91-6.95 (m, 1H), 7.20-7.24 (m, 1H), 7.33-7.38 (m, 3H), 7.42-7.45 (m, 2H), 7.90 (s, 1H), 8.17 (s, 1H). HRMS-ESI calcd for $\text{C}_{19}\text{H}_{17}\text{Cl}_2\text{N}_3\text{O}_3\text{Na}$ $[\text{M}+\text{Na}]^+$ 428.0539, found 428.0496.

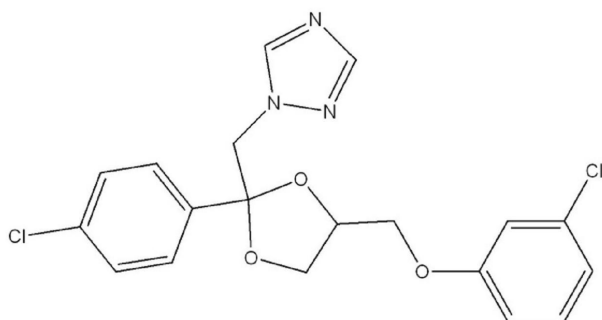
【 0 0 7 6 】

〔合成例 3〕 1-[[4-[(3-クロロフェノキシ)メチル]-2-(4-クロロフェニル)-1,3-ジオキソラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール(7c)の合成

20

【 0 0 7 7 】

【化 8】



30

【 0 0 7 8 】

フェノールの代わりに3-クロロフェノールを用い、合成例 1 と同様の方法で目的の化合物7cを得た(収率 72.4%)。mp 120.4-121.2 . ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) 3.65 (dd, $J = 5.3, 10$ Hz, 1H), 3.77 (dd, $J = 4.8, 9.9$ Hz, 1H), 3.84 (dd, $J = 5.5, 8.4$ Hz, 1H), 3.90-3.95 (m, 1H), 4.33-4.39 (m, 1H), 4.58 (s, 2H), 6.74-6.76 (m, 1H), 6.82-6.84 (m, 1H), 6.95-6.97 (m, 1H), 7.21-7.23 (m, 1H), 7.37-7.40 (m, 2H), 7.44-7.48 (m, 2H), 8.03 (s, 1H), 8.61 (s, 1H). HRMS-ESI calcd for $\text{C}_{19}\text{H}_{17}\text{Cl}_2\text{N}_3\text{O}_3\text{Na}$ $[\text{M}+\text{Na}]^+$ 428.0539, found 428.0496.

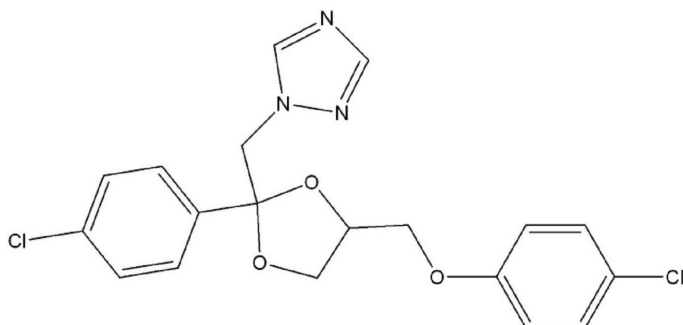
40

【 0 0 7 9 】

〔合成例 4〕 1-[[4-[(4-クロロフェノキシ)メチル]-2-(4-クロロフェニル)-1,3-ジオキソラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール(7d)の合成

【 0 0 8 0 】

【化 9】



10

【 0 0 8 1】

フェノールの代わりに4-クロロフェノールを用い、合成例 1 と同様の方法で目的の化合物7dを得た(収率 69.0%)。mp 92.4-94.2 . ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) 3.54 (dd, $J = 5.5, 9.9$ Hz, 1H), 3.72 (dd, $J = 4.8, 9.5$ Hz, 1H), 3.83 (dd, $J = 4.9, 8.2$ Hz, 1H), 3.89-3.92 (m, 1H), 4.33-4.39 (m, 1H), 4.55 (s, 2H), 6.77 (d, $J = 8.8$ Hz, 2H), 7.24 (d, $J = 8.8$ Hz, 2H), 7.39 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.47 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.97 (s, 1H), 8.40 (s, 1H). HRMS-ESI calcd for $\text{C}_{19}\text{H}_{17}\text{Cl}_2\text{N}_3\text{O}_3\text{Na}$ $[\text{M}+\text{Na}]^+$ 428.0539, found 428.0499.

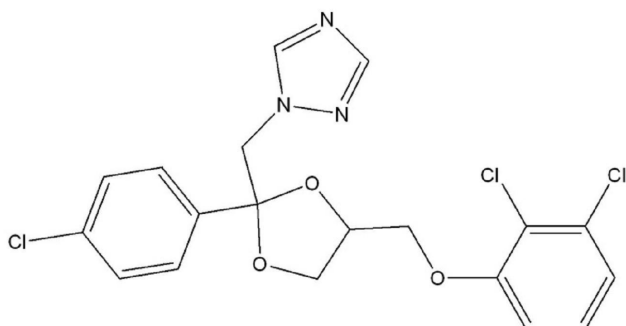
【 0 0 8 2】

〔合成例 5〕 1-[[4-[(2,3-ジクロロフェノキシ)メチル]-2-(4-クロロフェニル)-1,3-ジ
オキソラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール(化合物7e)の合成

20

【 0 0 8 3】

【化 1 0】



30

【 0 0 8 4】

フェノールの代わりに2,3-ジクロロフェノールを用い、合成例 1 と同様の方法で目的の化合物7eを得た(収率 15.1%)。mp 129.8-13.2 . ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) 3.42-3.46 (m, 1H), 3.83-3.87 (m, 1H), 3.93-3.95 (m, 2H), 4.42-4.47 (m, 1H), 4.50-4.58 (m, 2H), 6.72-6.74 (m, 1H), 7.11-7.16 (m, 2H), 7.18-7.39 (m, 2H), 7.43-7.46 (m, 2H), 7.91 (s, 1H), 8.17 (s, 1H). HRMS-ESI calcd for $\text{C}_{19}\text{H}_{16}\text{Cl}_3\text{N}_3\text{O}_3\text{Na}$ $[\text{M}+\text{Na}]^+$ 462.0149, found 462.0105.

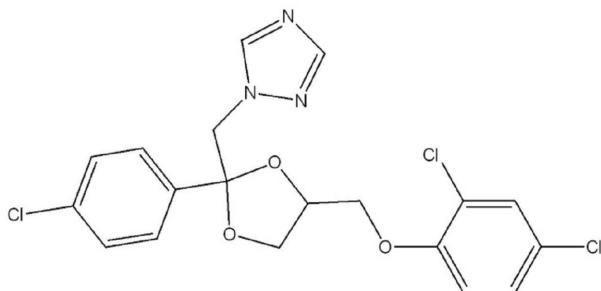
【 0 0 8 5】

〔合成例 6〕 1-[[4-[(2,4-ジクロロフェノキシ)メチル]-2-(4-クロロフェニル)-1,3-ジ
オキソラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール(化合物7f)の合成

40

【 0 0 8 6】

【化 1 1】



10

【 0 0 8 7】

フェノールの代わりに2,4-ジクロロフェノールを用い、合成例 1 と同様の方法で目的の化合物7fを得た(収率 32.2%)。mp 122.1-124.8 . ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) 3.44 (dd, $J = 6.6, 9.5$ Hz, 1H), 3.82 (dd, $J = 4.6, 9.7$ Hz, 1H), 3.92-3.94 (m, 2H), 4.41-4.44 (m, 1H), 4.53-4.54 (m, 2H), 6.75 (d, $J = 8.8$ Hz, 1H), 7.18-7.22 (m, 1H), 7.35-7.38 (m, 3H), 7.43-7.45 (m, 2H), 7.90 (s, 1H), 8.16 (s, 1H). HRMS-ESI calcd for $\text{C}_{19}\text{H}_{16}\text{Cl}_3\text{N}_3\text{O}_3\text{Na}$ $[\text{M}+\text{Na}]^+$ 462.0149, found 462.0106.

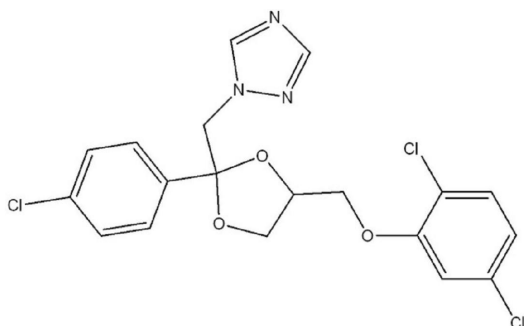
【 0 0 8 8】

〔合成例 7〕 1-[[4-[(2,5-ジクロロフェノキシ)メチル]-2-(4-クロロフェニル)-1,3-ジオキソラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール (化合物7g)

20

【 0 0 8 9】

【化 1 2】



30

【 0 0 9 0】

フェノールの代わりに2,5-ジクロロフェノールを用い、合成例 1 と同様の方法で目的の化合物7gを得た(収率 33.4%)。mp 167.0-168.3 . ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) 3.76-3.88 (m, 4H), 4.36-4.39 (m, 1H), 4.52 (s, 2H), 6.86 (dd, $J = 2.2, 8.4$ Hz, 1H), 6.98 (d, $J = 2.2$ Hz, 1H), 7.24-7.27 (m, 3H), 7.31-7.33 (m, 2H), 7.58 (s, 1H), 8.13 (s, 1H). HRMS-ESI calcd for $\text{C}_{19}\text{H}_{16}\text{Cl}_3\text{N}_3\text{O}_3\text{Na}$ $[\text{M}+\text{Na}]^+$ 462.0149, found 462.0106.

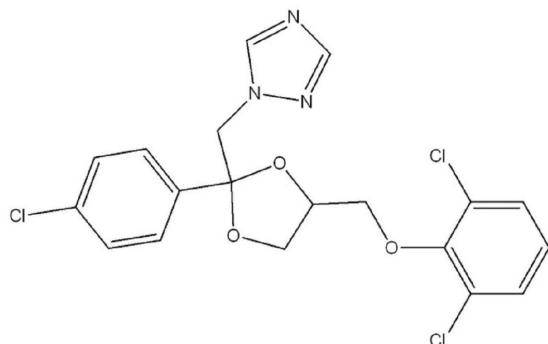
【 0 0 9 1】

〔合成例 8〕 1-[[4-[(2,6-ジクロロフェノキシ)メチル]-2-(4-クロロフェニル)-1,3-ジオキソラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール (化合物7h)

40

【 0 0 9 2】

【化 1 3】



10

【 0 0 9 3 】

フェノールの代わりに2,6-ジクロロフェノールを用い、合成例 1 と同様の方法で目的の化合物7hを得た(収率 33.1%)。mp 102.7-104.8 . ^1H NMR (400 MHz, CD_3OD) 3.65 (dd, $J = 5.9, 9.9$ Hz, 1H), 3.84-3.89 (m, 2H), 4.38 (s, 1H), 4.52 (s, 2H), 7.05-7.09 (m, 1H), 7.29-7.34 (m, 4H), 7.37-7.39 (m, 2H), 7.61 (s, 1H), 8.17 (s, 1H). HRMS-ESI calcd for $\text{C}_{19}\text{H}_{16}\text{Cl}_3\text{N}_3\text{O}_3\text{Na}$ $[\text{M}+\text{Na}]^+$ 462.0149, found 462.0106.

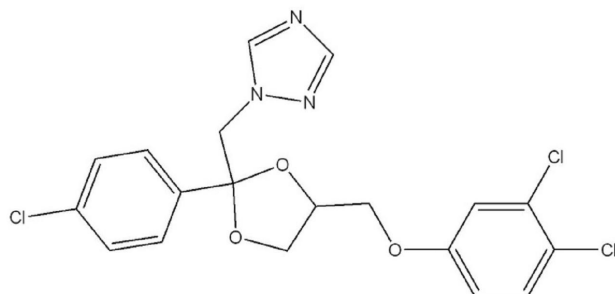
【 0 0 9 4 】

〔合成例 9〕 1-[[4-[(3,4-ジクロロフェノキシ)メチル]-2-(4-クロロフェニル)-1,3-ジオキソラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール (化合物7i)

【 0 0 9 5 】

20

【化 1 4】



【 0 0 9 6 】

30

フェノールの代わりに3,4-ジクロロフェノールを用い、合成例 1 と同様の方法で目的の化合物7iを得た(収率 23.8%)。mp 112.2-113.6 . ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) 3.47 (dd, $J = 5.9, 9.5$ Hz, 1H), 3.69 (dd, $J = 5.1, 9.5$ Hz, 1H), 3.79 (dd, $J = 4.8, 8.4$ Hz, 1H), 3.89 (dd, $J = 6.6, 8.4$ Hz, 1H), 4.32-4.37 (m, 1H), 4.52 (s, 2H), 6.69 (dd, $J = 2.9, 8.8$ Hz, 1H), 6.93 (d, $J = 2.9$ Hz, 1H), 7.33 (d, $J = 8.8$ Hz, 1H), 7.38-7.40 (m, 2H), 7.45-7.49 (m, 2H), 7.92 (s, 1H), 8.18 (s, 1H). HRMS-ESI calcd for $\text{C}_{19}\text{H}_{16}\text{Cl}_3\text{N}_3\text{O}_3\text{Na}$ $[\text{M}+\text{Na}]^+$ 462.0149, found 462.0104.

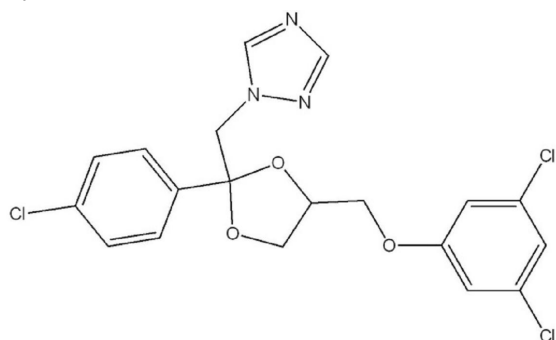
【 0 0 9 7 】

〔合成例 10〕 1-[[4-[(3,5-ジクロロフェノキシ)メチル]-2-(4-クロロフェニル)-1,3-ジオキソラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール (化合物7j)

40

【 0 0 9 8 】

【化 1 5】



10

【 0 0 9 9 】

フェノールの代わりに3,5-ジクロロフェノールを用い、合成例 1 と同様の方法で目的の化合物7jを得た(収率 28.9%)。mp 109.4-112.1 . ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) 3.49 (dd, $J = 5.9, 8.8$ Hz, 1H), 3.71 (dd, $J = 5.3, 9.3$ Hz, 1H), 3.78 (dd, $J = 4.9, 8.6$ Hz, 1H), 3.88-3.92 (m, 1H), 4.32-4.36 (m, 1H), 4.52 (s, 2H), 6.74-6.75 (m, 2H), 6.98-7.00 (m, 1H), 7.39 (d, $J = 8.8$ Hz, 2H), 7.46 (d, $J = 8.8$ Hz, 2H), 7.93 (s, 1H), 8.18 (s, 1H). HRMS-ESI calcd for $\text{C}_{19}\text{H}_{16}\text{Cl}_3\text{N}_3\text{O}_3\text{Na}$ $[\text{M}+\text{Na}]^+$ 462.0149, found 462.0104.

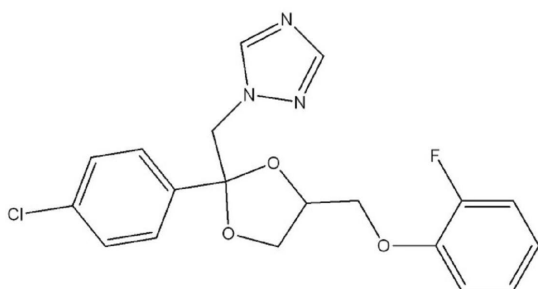
【 0 1 0 0 】

〔合成例 1 1〕 1-[[4-[(2-フルオロフェノキシ)メチル]-2-(4-クロロフェニル)-1,3-ジ
オキソラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール (化合物7k)

20

【 0 1 0 1 】

【化 1 6】



30

【 0 1 0 2 】

フェノールの代わりに2-フルオロフェノールを用い、合成例 1 と同様の方法で目的の化合物7kを得た(収率 48.5%)。mp 97.8-99.7 . ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) 3.51-3.55 (m, 1H), 3.83-3.94 (m, 3H), 4.40-4.44 (m, 1H), 4.53 (s, 2H), 6.86-6.96 (m, 2H), 7.05-7.10 (m, 2H), 7.36-7.39 (m, 2H), 7.43-7.47 (m, 2H), 7.91 (s, 1H), 8.18 (s, 1H). HRMS-ESI calcd for $\text{C}_{19}\text{H}_{17}\text{ClFN}_3\text{O}_3\text{Na}$ $[\text{M}+\text{Na}]^+$ 412.0834, found 412.0795.

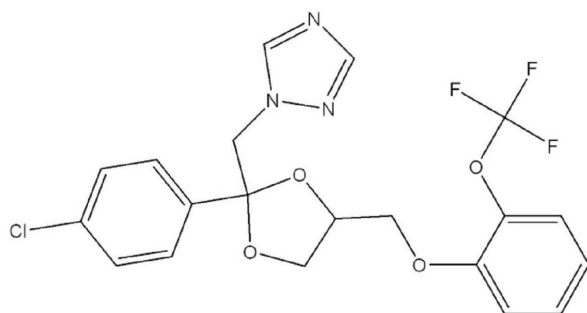
【 0 1 0 3 】

〔合成例 1 2〕 1-[[4-[(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)メチル]-2-(4-クロロフェ
ニル)-1,3-ジオキソラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール (化合物7l)

40

【 0 1 0 4 】

【化 17】



10

【 0 1 0 5 】

フェノールの代わりに2-トリフルオロメトキシフェノールを用い、合成例 1 と同様の方法で目的の化合物7lを得た (収率 58.2%)。mp 79.5-81.6 . ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3)

3.40-3.44 (m, 1H), 3.86-3.94 (m, 3H), 4.38-4.44 (m, 1H), 4.48-4.57 (m, 2H), 6.87-6.89 (m, 1H), 6.96-7.00 (m, 1H), 7.21-7.28 (m, 2H), 7.36-7.39 (m, 2H), 7.43-7.46 (m, 2H), 7.92 (s, 1H), 8.17 (s, 1H). HRMS-ESI calcd for $\text{C}_{20}\text{H}_{17}\text{ClF}_3\text{N}_3\text{O}_4\text{Na}$ [$\text{M}+\text{Na}$] $^+$ 478.0751, found 478.0705.

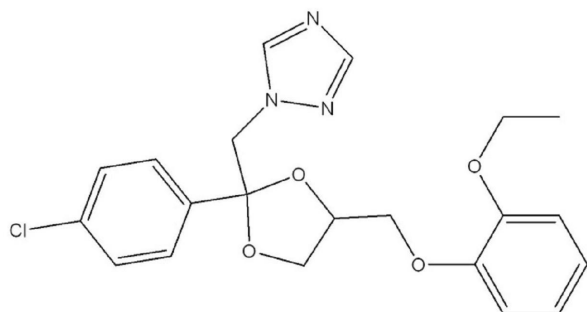
【 0 1 0 6 】

〔合成例 13〕 1-[[4-[(2-エトキシフェノキシ)メチル]-2-(4-クロロフェニル)-1,3-ジ
オキソラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール (化合物7m)

20

【 0 1 0 7 】

【化 18】



30

【 0 1 0 8 】

フェノールの代わりに2-エトキシフェノールを用い、合成例 1 と同様の方法で目的の化合物7mを得た (収率 51.8%)。mp 104.6-105.9 . ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) 1.37 (t, $J = 7.0$ Hz, 3H), 3.60-3.64 (m, 1H), 3.90-4.06 (m, 5H), 4.43-4.45 (m, 1H), 4.52-4.62 (m, 2H), 6.85-6.96 (m, 4H), 7.34-7.49 (m, 2H), 7.40-7.43 (m, 2H), 7.87 (s, 1H), 8.18 (s, 1H). HRMS-ESI calcd for $\text{C}_{21}\text{H}_{22}\text{ClN}_3\text{O}_4\text{Na}$ [$\text{M}+\text{Na}$] $^+$ 438.1191, found 438.1149.

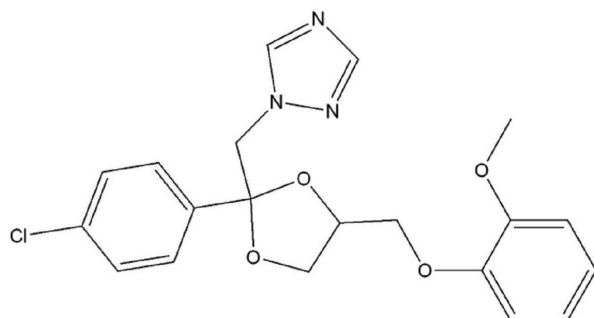
【 0 1 0 9 】

〔合成例 14〕 1-[[4-[(2-メトキシフェノキシ)メチル]-2-(4-クロロフェニル)-1,3-ジ
オキソラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール (化合物7n)

40

【 0 1 1 0 】

【化 19】



10

【0111】

フェノールの代わりに2-メトキシフェノールを用い、合成例1と同様の方法で目的の化合物7nを得た(収率52.9%)。mp 121.9-124.1. ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) 3.54-3.58 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.86-3.95 (m, 3H), 4.43-4.46 (m, 1H), 4.54 (s, 2H), 6.82-6.98 (m, 4H), 7.35-7.37 (m, 2H), 7.41-7.45 (m, 2H), 7.89 (s, 1H), 8.19 (s, 1H). HRMS-ESI calcd for $\text{C}_{20}\text{H}_{20}\text{ClN}_3\text{O}_4\text{Na}$ $[\text{M}+\text{Na}]^+$ 424.1034, found 424.0992.

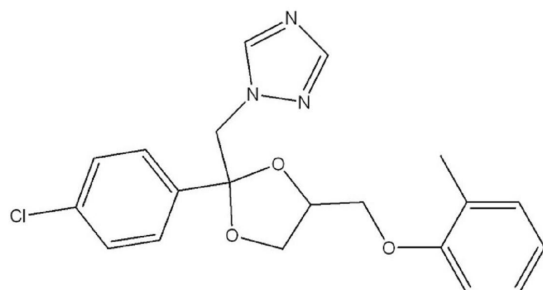
【0112】

〔合成例15〕 1-[[4-[(2-メチルフェノキシ)メチル]-2-(4-クロロフェニル)-1,3-ジオキソラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール(化合物7o)

【0113】

20

【化 20】



【0114】

30

フェノールの代わりに2-メチルフェノールを用い、合成例1と同様の方法で目的の化合物7oを得た(収率69.3%)。mp 112.6-114.5. ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) 3.46 (m, 1H), 3.85-3.94 (m, 3H), 4.37-4.41 (m, 1H), 4.52 (s, 2H), 6.70-6.72 (m, 1H), 6.86-6.90 (m, 1H), 7.11-7.17 (m, 2H), 7.36-7.39 (m, 2H), 7.43-7.46 (m, 2H), 7.91 (s, 1H), 8.16 (s, 1H). HRMS-ESI calcd for $\text{C}_{20}\text{H}_{20}\text{ClN}_3\text{O}_3\text{Na}$ $[\text{M}+\text{Na}]^+$ 408.1085, found 408.1051.

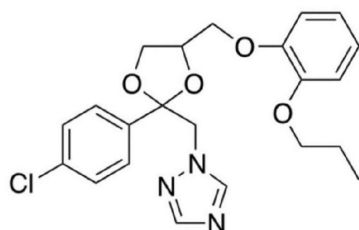
【0115】

〔合成例16〕 1-[[4-[(2-プロピオキシフェノキシ)メチル]-2-(4-クロロフェニル)-1,3-ジオキソラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール(化合物7p)

【0116】

40

【化 21】



【0117】

フェノールの代わりに2-プロピオキシフェノールを用い、合成例1と同様の方法で目的

50

の化合物7pを得た(収率 20.0%)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) : 1.00 (t, J=7.3 Hz, 3 H), 1.74-1.80 (m, 2H), 3.61(dd, J=6.6, 9.9 Hz, 1H), 3.90-3.96 (m, 5H), 4.41-4.44 (m, 1H), 4.51-4.60 (m, 2H), 6.84-6.98 (m, 4H), 7.34-7.42 (m, 4H), 7.87 (s, 1H), 8.17 (s, 1H)). The HRMS-ESI calculated for C₂₂H₂₄ClN₃O₄Na [M+Na]⁺ was 452.1348, with 452.1352 found experimentally.

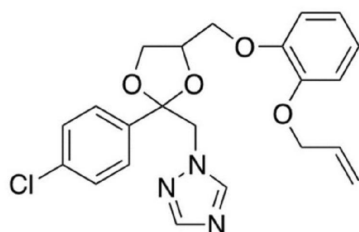
【 0 1 1 8 】

〔合成例 1 7〕 1-[[4-[(2-アリルオキシフェノキシ)メチル]-2-(4-クロロフェニル)-1,3-ジオキサラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール(化合物7q)

【 0 1 1 9 】

【化 2 2】

10



【 0 1 2 0 】

フェノールの代わりに2-アリルオキシフェノールを用い、合成例 1 と同様の方法で目的の化合物7qを得た(収率 13.4%)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) : 3.69 (dd, 1H, J=6.2, 9.9 Hz, 1H), 3.90-3.99 (m, 3H), 3.97-3.99 (m, 2H), 4.42-4.48 (m, 1H), 4.53-4.64 (m, 4H), 5.22-5.24 (m, 1H), 5.34-5.38 (m, 1H), 5.95-6.05 (m, 1H), 6.84-6.98 (m, 4H), 7.34-7.41 (m, 4H), 7.93 (s, 1H), 8.29 (s, 1H). The HRMS-ESI calculated for C₂₂H₂₂ClN₃O₄Na [M+Na]⁺ was 450.1191, with 450.1195 found experimentally.

20

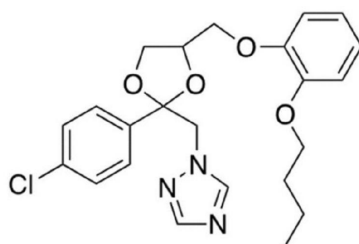
【 0 1 2 1 】

〔合成例 1 8〕 1-[[4-[(2-ブトキシフェノキシ)メチル]-2-(4-クロロフェニル)-1,3-ジオキサラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール(化合物7r)

【 0 1 2 2 】

【化 2 3】

30



【 0 1 2 3 】

フェノールの代わりに2-ブトキシフェノールを用い、合成例 1 と同様の方法で目的の化合物7rを得た(収率 40.4%)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) : 0.93 (t, J=7.5 Hz, 3H), 1.39-1.48 (m, 2H), 1.65-1.73 (m, 2H), 3.75 (dd, J=5.7, 10.1 Hz, 1H), 3.90-4.04 (m, 5H), 4.42-4.47 (m, 1H), 4.54-4.70 (m, 2H), 6.84-6.98 (m, 4H), 7.33-7.40 (m, 4H), 7.95 (s, 1H), 8.42 (s, 1H). The HRMS-ESI calculated for C₂₃H₂₆ClN₃O₄Na [M+Na]⁺ was 466.1504, with 466.1509 found experimentally.

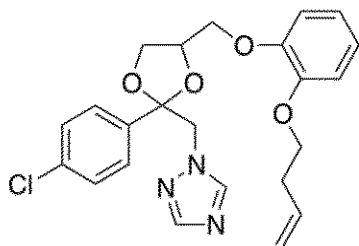
40

【 0 1 2 4 】

〔合成例 1 9〕 1-[[4-[(2-(3-ブテニルオキシ)フェノキシ)メチル]-2-(4-クロロフェニル)-1,3-ジオキサラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール(化合物7s)

【 0 1 2 5 】

【化 2 4】



【 0 1 2 6】

10

フェノールの代わりに2-(3-ブテニルオキシ)フェノールを用い、合成例 1 と同様の方法で目的の化合物7sを得た(収率 45.3%)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) : 2.49(q, J=6.5 Hz, 2H), 3.90 (d, J=4.0 Hz, 2H), 4.00-4.13 (m, 4H), 4.45-4.48 (m, 1H), 4.58-4.76 (m, 2H), 5.05-5.16 (m, 2H), 5.81-5.91 (m, 1H), 6.87-7.01 (m, 4H), 7.35-7.41 (m, 4H), 8.04 (s, 1H), 8.71 (s, 1H). The HRMS-ESI calculated for C₂₃H₂₄ClN₃O₄Na [M+Na]⁺ was 464.1348, with 464.1351 found experimentally.

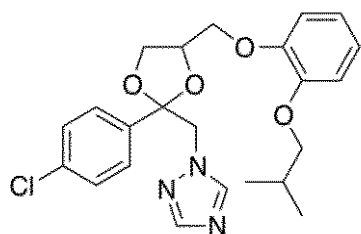
【 0 1 2 7】

〔合成例 2 0〕 1-[[4-[(2-イソブトキシフェノキシ)メチル]-2-(4-クロロフェニル)-1,3-ジオキソラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール(化合物7t)

【 0 1 2 8】

20

【化 2 5】



【 0 1 2 9】

30

フェノールの代わりに2-イソブトキシフェノールを用い、合成例 1 と同様の方法で目的の化合物7tを得た(収率 37.2%)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) : 1.00 (dd, J=4.6, 6.6 Hz, 6H), 2.00-2.10 (m, 1H), 3.66 (dd, J=6.3, 10.0 Hz, 1H), 3.72 (d, J=6.6 Hz, 2H), 3.92-3.97 (m, 3H), 4.39-4.44 (m, 1H), 4.51-4.60 (m, 2H), 6.84-7.00 (m, 4H), 7.33-7.36 (m, 2H), 7.39-7.42 (m, 2H), 7.89 (s, 1H), 8.23 (s, 1H). The HRMS-ESI calculated for C₂₃H₂₆ClN₃O₄Na [M+Na]⁺ was 466.1504, with 466.1509 found experimentally.

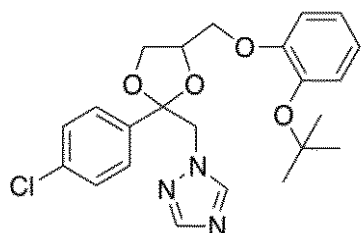
【 0 1 3 0】

〔合成例 2 1〕 1-[[4-[(2-ターシャールブトキシフェノキシ)メチル]-2-(4-クロロフェニル)-1,3-ジオキソラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール(化合物7u)

40

【 0 1 3 1】

【化 2 6】



【 0 1 3 2】

50

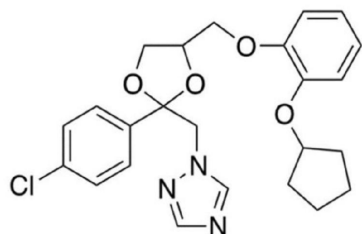
フェノールの代わりに2-ターシャールブトキシフェノールを用い、合成例1と同様の方法で目的の化合物7uを得た(収率 14.5%)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) : 1.32 (s, 9H), 3.60 (dd, J=6.4, 9.7 Hz, 1H), 3.86-3.97 (m, 3H), 4.39-4.41 (m, 1H), 4.51-4.61 (m, 2H), 6.82-7.06 (m, 4H), 7.35-7.43 (m, 4H), 7.97 (s, 1H), 8.32 (s, 1H). The HRMS-ESI calculated for C₂₃H₂₆ClN₃O₄Na [M+Na]⁺ was 466.1504, with 466.1509 found experimentally.

【0133】

〔合成例22〕 1-[[4-[(2-シクロペンチルオキシフェノキシ)メチル]-2-(4-クロロフェニル)-1,3-ジオキソラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール(化合物7v)

【0134】

【化27】



【0135】

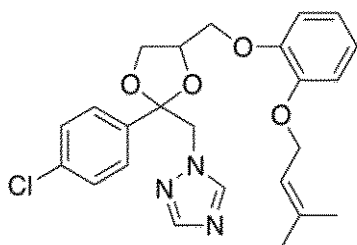
フェノールの代わりに2-シクロペンチルオキシフェノールを用い、合成例1と同様の方法で目的の化合物7vを得た(収率 57.5%)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) : 1.56-1.89 (m, 8H), 3.78 (dd, J=5.7, 10.1 Hz, 1H), 3.90-3.93 (m, 1H), 3.99-4.07 (m, 2H), 4.42-4.47 (m, 1H), 4.55-4.77 (m, 3H), 6.88-6.98 (m, 4H), 7.34-7.40 (m, 4H), 7.97 (s, 1H), 8.45 (s, 1H). The HRMS-ESI calculated for C₂₄H₂₆ClN₃O₄Na [M+Na]⁺ was 478.1504, with 478.1510 found experimentally.

【0136】

〔合成例23〕 1-[[4-[(2-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)フェノキシ)メチル]-2-(4-クロロフェニル)-1,3-ジオキソラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール(化合物7w)

【0137】

【化28】



【0138】

フェノールの代わりに2-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)フェノールを用い、合成例1と同様の方法で目的の化合物7wを得た(収率 47.9%)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) : 1.67 (s, 3H), 1.71 (s, 3H), 3.68-3.73 (m, 1H), 3.92-4.00 (m, 3H), 4.42-4.65 (m, 5H), 5.38-5.41 (m, 1H), 6.85-6.95 (m, 4H), 7.32-7.39 (m, 4H), 7.88 (s, 1H), 8.25 (s, 1H). The HRMS-ESI calculated for C₂₄H₂₆ClN₃O₄Na [M+Na]⁺ was 478.1504, with 478.1510 found experimentally.

【0139】

〔合成例24〕 1-[[4-[(2-(3-メチルブトキシ)フェノキシ)メチル]-2-(4-クロロフェニル)-1,3-ジオキソラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール(化合物7x)

【0140】

10

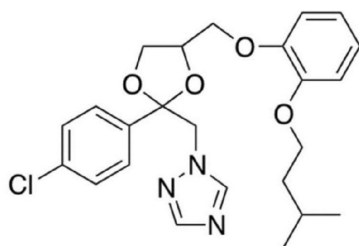
20

30

40

50

【化 2 9】



【 0 1 4 1】

10

フェノールの代わりに2-(3-メチルシブトキシ)フェノールを用い、合成例 1 と同様の方法で目的の化合物7xを得た(収率 37.2%)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) : 0.92 (d, J=3.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J=3.3 Hz, 3H), 1.54-1.65 (m, 2H), 1.73-1.80 (m, 1H), 3.84 (dd, J= 3.8, 10.1 Hz, 1H), 3.91-3.95 (m, 1H), 3.98-4.09 (m, 4H), 4.44-4.50 (m, 1H), 4.57-4.76 (m, 2H), 6.86-7.00 (m, 4H), 7.35-7.40 (m, 4H), 8.01 (s, 1H), 8.60 (s, 1H). The HRMS-ESI calculated for C₂₄H₂₈ClN₃O₄Na [M+Na]⁺ was 480.1661, with 480.1665 found experimentally.

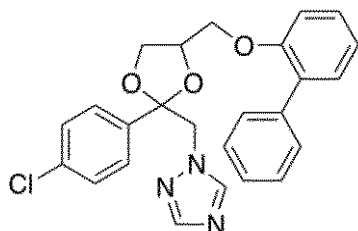
【 0 1 4 2】

〔合成例 2 5〕 1-[4-[(ビフェニル 2-イルオキシメチル)]-2-(4-クロロフェニル)-1,3-ジオキソラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール(化合物7y)

20

【 0 1 4 3】

【化 3 0】



30

【 0 1 4 4】

フェノールの代わりに2-フェニルフェノールを用い、合成例 1 と同様の方法で目的の化合物7yを得た(収率 7.3%)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) : 3.57-3.61 (m, 1H), 3.72-3.75 (m, 1H), 3.80-3.83 (m, 1H), 3.88-3.92 (m, 1H), 4.25-4.28 (m, 1H), 4.34 (s, 2H), 6.91 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.06-7.10 (m, 1H), 7.23-7.38 (m, 9H), 7.44-7.47 (m, 2H), 7.86 (s, 1H), 8.08 (s, 1H). The HRMS-ESI calculated for C₂₅H₂₂ClN₃O₃Na [M+Na]⁺ was 470.1242, with 470.1250 found experimentally.

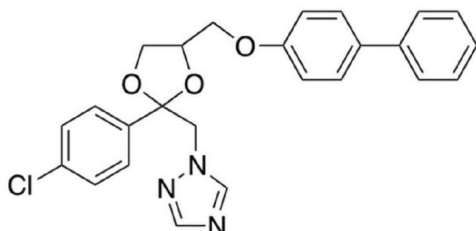
【 0 1 4 5】

〔合成例 2 6〕 1-[4-[(ビフェニル-4-イルオキシメチル)]-2-(4-クロロフェニル)-1,3-ジオキソラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール(化合物7z)

40

【 0 1 4 6】

【化 3 1】



【 0 1 4 7】

50

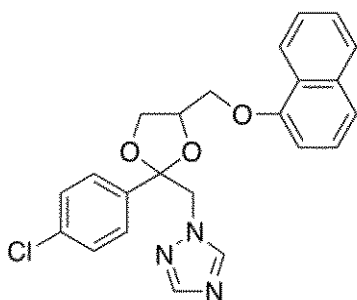
フェノールの代わりに4-フェニルフェノールを用い、合成例1と同様の方法で目的の化合物7zを得た(収率 20.8%)。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) : 3.56 (dd, $J=6.2, 9.8$ Hz, 1H), 3.82-3.86 (m, 2H), 3.90-3.94 (m, 1H), 4.36-4.41 (m, 1H), 4.53 (s, 2H), 6.89-6.92 (m, 2H), 7.29-7.33 (m, 1H), 7.37-7.44 (m, 4H), 7.46-7.56 (m, 6H), 7.92 (s, 1H), 8.21 (s, 1H). The HRMS-ESI calculated for $\text{C}_{25}\text{H}_{22}\text{ClN}_3\text{O}_3\text{Na}$ $[\text{M}+\text{Na}]^+$ was 470.1242, with 470.1249 found experimentally.

【0148】

〔合成例27〕 1-[2-(4-クロロフェニル)-4-(ナフタレン-1-イルオキシメチル)-[1,3]-ジオキソラン-2-イルメチル]-1H-[1,2,4]-トリアゾール(化合物7aa)

【0149】

【化32】



【0150】

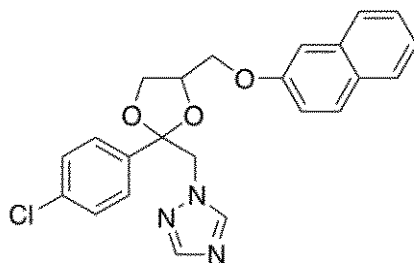
フェノールの代わりに1-ナフトールを用い、合成例1と同様の方法で目的の化合物7aを得た(収率 13.9%)。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) : 3.76 (dd, $J=6.2, 9.6$ Hz, 1H), 3.98-4.06 (m, 3H), 4.51-4.57 (m, 3H), 6.73-6.75 (m, 1H), 7.36-7.42 (m, 3H), 7.45-7.52 (m, 5H), 7.78-7.82 (m, 1H), 7.94 (s, 1H), 8.11-8.13 (m, 1H), 8.31 (s, 1H). The HRMS-ESI calculated for $\text{C}_{23}\text{H}_{20}\text{ClN}_3\text{O}_3\text{Na}$ $[\text{M}+\text{Na}]^+$ was 444.1085, with 444.1091 found experimentally.

【0151】

〔合成例28〕 1-[2-(4-クロロフェニル)-4-(ナフタレン-2-イルオキシメチル)-[1,3]-ジオキソラン-2-イルメチル]-1H-[1,2,4]-トリアゾール(化合物7ab)

【0152】

【化33】



【0153】

フェノールの代わりに2-ナフトールを用い、合成例1と同様の方法で目的の化合物7bを得た(収率 42.5%)。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) : 3.72 (dd, $J=5.8, 10.0$ Hz, 1H), 3.85-3.97 (m, 3H), 4.42-4.45 (m, 1H), 4.56 (s, 2H), 7.05 (d, $J=2.5$ Hz, 1H), 7.12 (dd, $J=2.5, 9.0$ Hz, 1H), 7.33-7.41 (m, 3H), 7.43-7.50 (m, 3H), 7.74-7.78 (m, 3H), 7.95 (s, 1H), 8.31 (s, 1H). The HRMS-ESI calculated for $\text{C}_{23}\text{H}_{20}\text{ClN}_3\text{O}_3\text{Na}$ $[\text{M}+\text{Na}]^+$ was 444.1085, with 444.1092 found experimentally.

【0154】

10

20

30

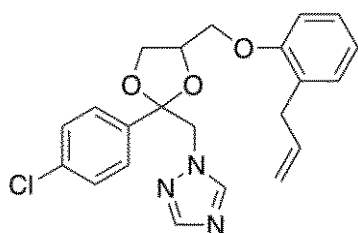
40

50

【合成例 29】 1-[4-(2-アリルフェノキシメチル)-2-(4-クロロフェニル)-[1,3]-ジオキソラン-2-イルメチル]-1H-[1,2,4]-トリアゾール(化合物7ac)

【0155】

【化34】



10

【0156】

フェノールの代わりに2-アリルフェノールを用い、合成例1と同様の方法で目的の化合物7acを得た(収率45.7%)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) : 3.31 (d, J=6.7 Hz, 2H), 3.50 (dd, J=6.7, 9.8 Hz, 1H), 3.85-3.96 (m, 3H), 4.37-4.40 (m, 1H), 4.53 (s, 2H), 4.96-5.02 (m, 2H), 5.87-5.97 (m, 1H), 6.74 (d, J=6.7 Hz, 1H), 6.91-6.95 (m, 1H), 7.12-7.22 (m, 1H), 7.36-7.39 (m, 2H), 7.42-7.45 (m, 2H), 7.93 (s, 1H), 8.24 (s, 1H). The HRMS-ESI calculated for C₂₂H₂₂ClN₃O₃Na [M+Na]⁺ was 434.1242, with 434.1248 found experimentally.

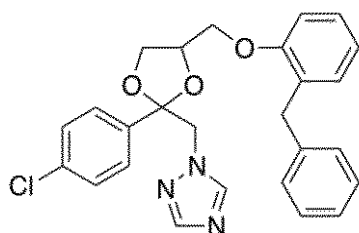
20

【0157】

【合成例 30】 1-[4-(2-ベンジルフェノキシメチル)-2-(4-クロロフェニル)-[1,3]-ジオキソラン-2-イルメチル]-1H-[1,2,4]-トリアゾール(化合物7ad)

【0158】

【化35】



30

【0159】

フェノールの代わりに2-ベンジルフェノールを用い、合成例1と同様の方法で目的の化合物7adを得た(収率42.4%)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) : 3.40 (dd, J=6.9, 9.4 Hz, 1H), 3.56-3.59 (m, 1H), 3.71-3.81 (m, 2H), 3.87-3.96 (m, 2H), 4.23-4.29 (m, 1H), 4.45 (d, J=3.7 Hz, 2H), 6.73 (d, J=8.0 Hz, 1H), 6.91-6.95 (m, 1H), 7.10-7.15 (m, 4H), 7.19-7.23 (m, 3H), 7.35-7.42 (m, 4H), 7.91 (s, 1H), 8.10 (s, 1H). The HRMS-ESI calculated for C₂₆H₂₄ClN₃O₃Na [M+Na]⁺ was 484.1398, with 484.1404 found experimentally.

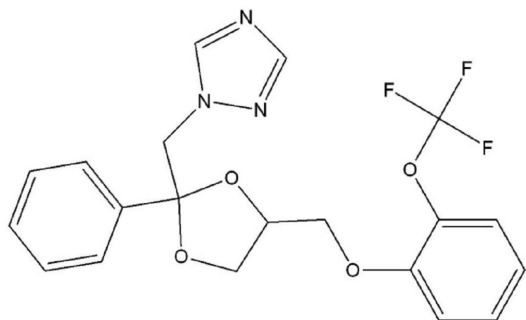
40

【0160】

【合成例 31】 1-[4-[(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)メチル]-2-フェニル-1,3-ジオキソラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール(化合物8a)

【0161】

【化 3 6】



10

【 0 1 6 2】

化合物8aは、2-トリフルロフェノールとトルエン-4-スルホン酸 2-フェニル-2-1H-[1,2,4]トリアゾール-1-イルメチル-[1,3]ジオキソラン-4-イルメチル エステル (トシレート6a) とを反応させることにより調製した。トシレート6aは、以下の方法に従い、調製した。

【 0 1 6 3】

500 ml容の三口フラスコにDMF (12 ml) を加え、氷冷しながら8.14 gのトリアゾール (0.12 mol) を溶かした。そこに5.9 gのトリエチルアミン (0.06 mol) 一滴ずつ加えて30分撹拌した後に12 gの2-プルモ-アセトフェノン (0.06 mol) を葉さじで少しずつ撹拌しながら加えて17時間反応させた。反応終了後、反応混合物に酢酸エチル500 mlを加えて30分氷冷した。析出した結晶を吸引濾過により除き、ろ液を蒸留水 (200 ml × 3) で液々分配後、その水層を酢酸エチル (200 ml × 3) で液々分配した。有機層を集めて飽和食塩水 (30 ml) で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた後、溶媒を減圧留去した。濃縮した残存物を酢酸エチル：メタノール (1：1) の溶液20 mlに溶かし、カラムベッド体積200 ml (高さ10 cm) のシリカゲルカラムを用いて酢酸エチル：メタノール (1：1) により目的化合物を溶出した。溶媒を減圧留去し、酢酸エチルとヘキサンを用いて再結晶した。目的化合物1-フェニル-2-1H-[1,2,4]トリアゾール-1-イル-エタノン (2a) が得られた。次いで、2aとトルエン-4-スルホン酸 2,3-ジヒドロキシプロピル エステルとの反応により、合成例1のトシレート6の合成法に準じて、トシレート6aを調製した。得られたトシレート6aと2-トリフルロフェノールから、合成例1の方法に従い、化合物8aを調製した (収率：58.9%)。 3.34-3.38(m, 1H), 3.86-3.95(m, 3H), 4.40-4.44(m, 1H), 4.51-4.60(m, 2H), 6.87-6.89(m, 1H), 6.95-7.00(m, 1H), 7.21-7.28(m, 2H), 7.40-7.44(m, 3H), 7.51-7.54(m, 2H), 7.93(s, 1H), 8.17(s, 1H)

20

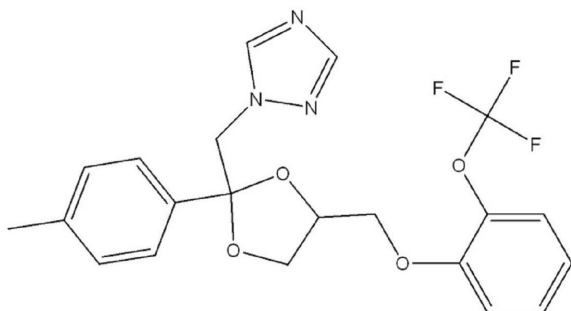
30

【 0 1 6 4】

〔合成例32〕 1-[4-[(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)メチル]-2-(4-メチルフェニル)-1,3-ジオキソラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール (化合物8b)

【 0 1 6 5】

【化 3 7】



40

【 0 1 6 6】

トルエン-4-スルホン酸 2-フェニル-2-1H-[1,2,4]トリアゾール-1-イルメチル-[1,3]ジオキソラン-4-イルメチル エステルの代わりにトルエン-4-スルホン酸 2-(4-メチルフェ

50

ニル)-2-1H-[1,2,4]トリアゾール-1-イルメチル-[1,3]ジオキソラン-4-イルメチル エステルを用い、合成例 3 1 と同様の方法で目的の化合物8bを得た(収率:69.6%)。 2.37(s, 3H), 3.33-3.37(m, 1H), 3.84-3.94(m, 3H), 4.37-4.43(m, 1H), 4.49-4.57(m, 2H), 6.86-6.89(m, 1H), 6.95-6.99(m, 1H), 7.20-7.28(m, 4H), 7.38-7.41(m, 2H), 7.93(s, 1H), 8.16(s, 1H)

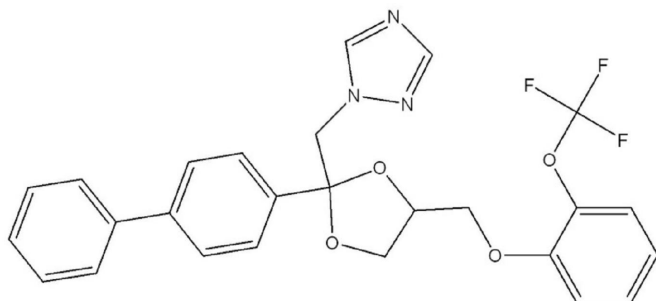
【0167】

〔合成例 3 3〕 1-[2-ビフェニル-4-イル-4-(2-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)-[1,3]ジオキソラン-2-イルメチル]-1H-[1,2,4]トリアゾール (化合物8c)

【0168】

【化 3 8】

10



【0169】

20

トルエン-4-スルホン酸 2-フェニル-2-1H-[1,2,4]トリアゾール-1-イルメチル-[1,3]ジオキソラン-4-イルメチル エステルの代わりにトルエン-4-スルホン酸 2-ビフェニル-4-イル-2-1H-[1,2,4]トリアゾール- 1-イルメチル-[1,3]ジオキソラン-4-イルメチル エステルを用い、合成例 3 1 と同様の方法で目的の化合物8cを得た(収率:30.6%)。 3.35-3.40(m, 1H), 3.87-3.91(m, 2H), 3.96-4.00(m, 1H), 4.44-4.48(m, 1H), 4.55-4.64(m, 2H), 6.88-6.91(m, 1H), 6.96-7.00(m, 1H), 7.21-7.29(m, 2H), 7.36-7.40(m, 1H), 7.45-7.48(m, 2H), 7.58-7.64(m, 6H), 7.95(s, 1H), 8.21(s, 1H)

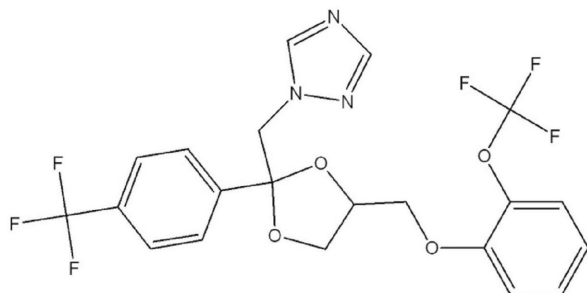
【0170】

〔合成例 3 4〕 1-[4-[(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)メチル]-2-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,3-ジオキソラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール (化合物8d)

30

【0171】

【化 3 9】



40

【0172】

トルエン-4-スルホン酸 2-フェニル-2-1H-[1,2,4]トリアゾール-1-イルメチル-[1,3]ジオキソラン-4-イルメチル エステルの代わりにトルエン-4-スルホン酸 2-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-1H-[1,2,4]トリアゾール-1-イルメチル-[1,3]ジオキソラン-4-イルメチル エステルを用い、合成例 1 6 と同様の方法で目的の化合物8dを得た(収率:28.2%)。 3.43-3.48(m, 1H), 3.83-3.93(m, 3H), 4.41-4.45(m, 1H), 4.51-4.60(m, 2H), 6.88-6.90(m, 1H), 6.97-7.02(m, 1H), 7.22-7.29(m, 2H), 7.63-7.68(m, 4H), 7.92(s, 1H), 8.19(s, 1H)

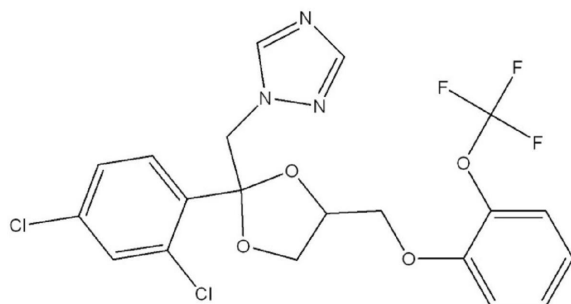
【0173】

50

【合成例 35】 1-[4-[(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)メチル]-2-(2,4-ジクロロフェニル)-1,3-ジオキソラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール (化合物8e)

【0174】

【化40】



10

【0175】

トルエン-4-スルホン酸 2-フェニル-2-1H-[1,2,4]トリアゾール-1-イルメチル-[1,3]ジオキソラン-4-イルメチル エステルの代わりにトルエン-4-スルホン酸 2-(2,4-ジクロロフェニル)-2-1H-[1,2,4]トリアゾール-1-イルメチル-[1,3]ジオキソラン-4-イルメチル エステルを用い、合成例 31 と同様の方法で目的の化合物8eを得た(収率: 43.6%)。 3.42-3.46(m, 1H), 3.82-3.98(m, 3H), 4.40-4.46(m, 1H), 4.75-4.88(m, 2H), 6.88-6.90(m, 1H), 6.96-7.02(m, 1H), 7.22-7.29(m, 3H), 7.47-7.55(m, 2H), 7.90(s, 1H), 8.19(s, 1H)

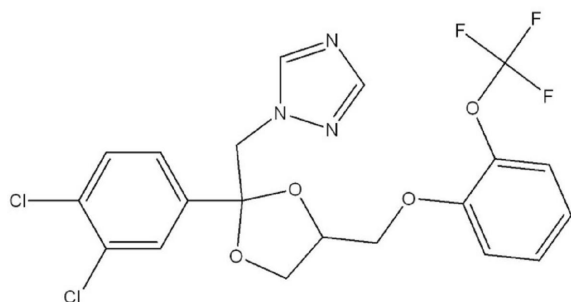
20

【0176】

【合成例 36】 1-[4-[(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1,3-ジオキソラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾール (化合物8f)

【0177】

【化41】



30

【0178】

トルエン-4-スルホン酸 2-フェニル-2-1H-[1,2,4]トリアゾール-1-イルメチル-[1,3]ジオキソラン-4-イルメチル エステルの代わりにトルエン-4-スルホン酸 2-(3,4-ジクロロフェニル)-2-1H-[1,2,4]トリアゾール-1-イルメチル-[1,3]ジオキソラン-4-イルメチル エステルを用い、合成例 31 と同様の方法で目的の化合物8fを得た(収率: 42.7%)。 3.43-3.47(m, 1H), 3.86-3.96(m, 3H), 4.40-4.46(m, 1H), 4.48-4.57(m, 2H), 6.87-6.90(m, 1H), 6.97-7.01(m, 1H), 7.22-7.33(m, 3H), 7.46-7.48(m, 1H), 7.60-7.61(m, 1H), 7.92(s, 1H), 8.18(s, 1H)

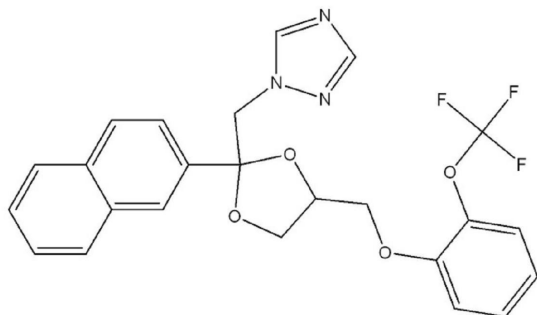
40

【0179】

【合成例 37】 1-[2-ナフタレン-2-イル-4-(2-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)-[1,3]ジオキソラン-2-イルメチル]-1H-[1,2,4]トリアゾール(化合物8g)

【0180】

【化 4 2】



10

【 0 1 8 1 】

トルエン-4-スルホン酸 2-フェニル-2-1H-[1,2,4]トリアゾール-1-イルメチル-[1,3]ジオキサラン-4-イルメチル エステルの代わりにトルエン-4-スルホン酸 2-ナフタレン-2-イル-2-1H-[1,2,4] トリアゾール-1-イルメチル-[1,3]ジオキサラン-4-イルメチル エステルを用い、合成例 3 1 と同様の方法で目的の化合物8gを得た(収率:42.6%)。 3.39-3.43(m, 1H), 3.88-3.99(m, 3H), 4.47-4.48(m, 1H), 4.59-4.68(m, 2H), 6.89-7.02(m, 2H), 7.21-7.28(m, 2H), 7.51-7.61(m, 3H), 7.85-8.02(m, 5H), 8.21(s, 1H)

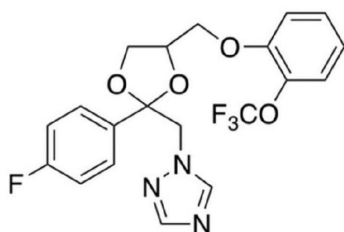
【 0 1 8 2 】

〔合成例 38〕 1-[2-(4-フルオロフェニル)-4-(2-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)-[1,3]-ジオキソラン-2-イルメチル]-1H-[1,2,4]-トリアゾール(化合物8h)

20

【 0 1 8 3 】

【化 4 3】



30

【 0 1 8 4 】

トルエン-4-スルホン酸 2-フェニル-2-1H-[1,2,4]トリアゾール-1-イルメチル-[1,3]ジオキソラン-4-イルメチル エステルの代わりにトルエン-4-スルホン酸 2-(4-フルオロフェニル)-2-1H-[1,2,4]トリアゾール-1-イルメチル-[1,3]ジオキソラン-4-イルメチル エステルを用い、合成例 3 1 と同様の方法で目的の化合物8hを得た(収率:31.6%)。mp. = 60.8-62.5 。 ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) : 3.40(dd, J=7.1, 9.3 Hz, 1H), 3.86-3.94(m, 3H), 4.39-4.43(m, 1H), 4.53(d, J=5.1 Hz, 2H), 6.87-6.89(m, 1H), 6.96-7.05(m, 1H), 7.06-7.10(m, 2H), 7.21-7.28(m, 2H), 7.46-7.50(m, 2H), 7.91(s, 1H), 8.16(s, 1H). The HRMS-ESI calculated for C₂₀H₁₇F₄N₃O₄Na [M+Na]⁺ was 462.1047, with 462.0999 found experimentally.

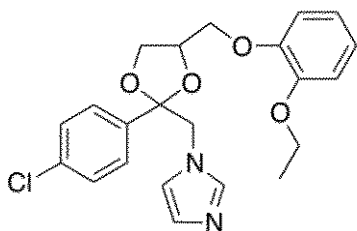
40

【 0 1 8 5 】

〔合成例 39〕 1-[2-(4-クロロフェニル)-4-(2-エトキシフェノキシメチル)-[1,3]-ジ
オキソラン-2-イルメチル]-1H-イミダゾール(化合物9a)

【 0 1 8 6 】

【化 4 4】



【 0 1 8 7】

10

1-(4-クロロフェニル)-2-1H-[1,2,4]トリアゾール-1-イルエタノンの代わりに、1-(4-クロロフェニル)-2-イミダゾール-1-イルエタノンを用い、また、フェノールの代わりに2-エトキシフェノールを用い、合成例 1 と同様の方法で目的の化合物9aを得た(収率：16.6%)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) : 1.38 (t, J=7.0 Hz, 3H), 3.52 (dd, J=6.5, 10.0 Hz, 1H), 3.84-3.93 (m, 3H), 4.00-4.06 (m, 2H), 4.14-4.25 (m, 2H), 4.38-4.44 (m, 1H), 6.83-6.97 (m, 6H), 7.29-7.42 (m, 5H). The HRMS-ESI calculated for C₂₂H₂₃ClN₂O₄Na [M+Na]⁺ was 437.1239, with 437.1238 found experimentally.

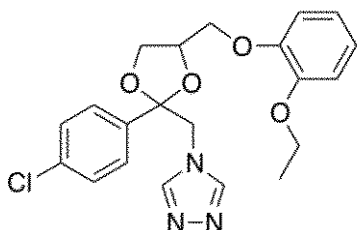
【 0 1 8 8】

〔合成例 4 0〕 1-[2-(4-クロロフェニル)-4-(2-エトキシフェノキシメチル)-[1,3]-ジオキソラン-2-イルメチル]-4H-[1,2,4]-トリアゾール(化合物 9 b)

20

【 0 1 8 9】

【化 4 5】



30

【 0 1 9 0】

1-(4-クロロフェニル)-2-1H-[1,2,4]トリアゾール-1-イルエタノンの代わりに、1-(4-クロロフェニル)-2-4H-[1,2,4]トリアゾール-1-イルエタノンを用い、また、フェノールの代わりに2-エトキシフェノールを用い、合成例 1 と同様の方法で目的の化合物9bを得た(収率：16.9%)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) : 1.37 (t, J=8.5 Hz, 3H), 3.66 (dd, J=6.0, 10.1 Hz, 1H), 3.87-3.92 (m, 2H), 3.96-4.06 (m, 3H), 4.23-4.38 (m, 2H), 4.41-4.47 (m, 1H), 6.85-6.98 (m, 4H), 7.35-7.40 (m, 4H), 8.10 (s, 2H).

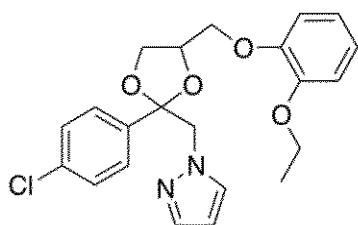
【 0 1 9 1】

〔合成例 4 1〕 1-[2-(4-クロロフェニル)-4-(2-エトキシフェノキシメチル)-[1,3]-ジオキソラン-2-イルメチル]-1H-ピラゾール(化合物9c)

40

【 0 1 9 2】

【化 4 6】



50

【 0 1 9 3 】

1-(4-クロロフェニル)-2-1H-[1,2,4]トリアゾール-1-イルエタノンの代わりに、1-(4-クロロフェニル)-2-ピラゾール-1-イルエタノンを用い、また、フェノールの代わりに2-エトキシフェノールを用い、合成例 1 と同様の方法で目的の化合物9cを得た(収率：69.9%)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) : 1.34 (t, J=7.0 Hz, 3H), 3.71-3.79 (m, 2H), 3.88-4.02 (m, 4H), 4.23-4.29 (m, 1H), 4.41 (s, 2H), 6.25 (t, J=2.1 Hz, 1H), 6.76-6.93 (m, 4H), 7.27-7.30 (m, 2H), 7.39-7.42 (m, 2H), 7.46-7.50 (m, 2H)。

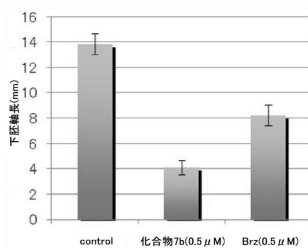
【産業上の利用可能性】

【 0 1 9 4 】

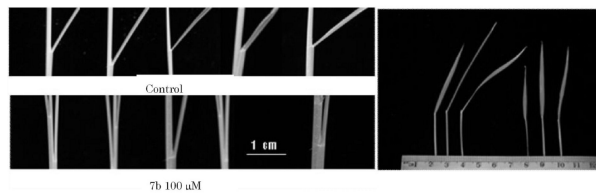
本発明の植物成長調節剤は、植物の伸長抑制、植物バイオマス生産増加、花粉成長抑制、花の鮮度保持、植物の抗ストレス剤、雑草防除、植物の老化抑制、根の肥大化などに有用なので、農業分野において利用可能である。

10

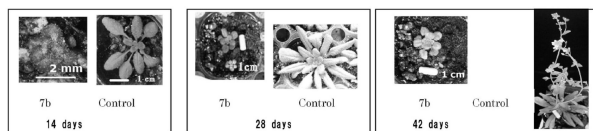
【 図 1 】



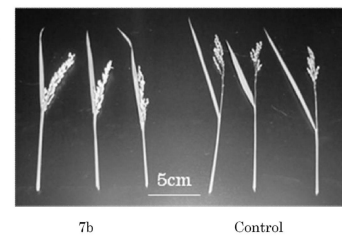
【 図 4 】



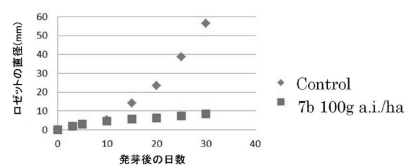
【 図 2 】



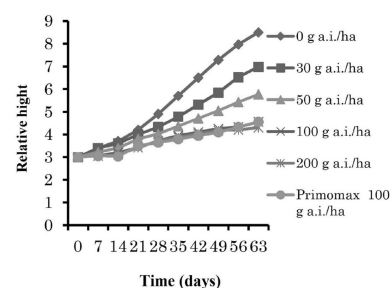
【 図 5 】



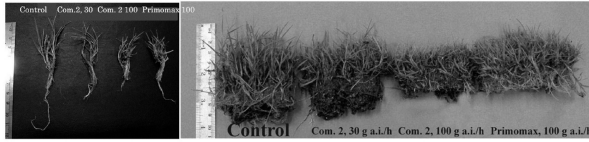
【 図 3 】



【 図 6 】



【 7 】



フロントページの続き

審査官 村守 宏文

(56)参考文献 特開 2 0 0 1 - 2 4 7 4 1 3 (J P , A)

特開昭 5 2 - 0 4 6 0 7 5 (J P , A)

特開昭 5 8 - 1 2 8 3 8 3 (J P , A)

特開昭 5 1 - 0 7 5 0 7 3 (J P , A)

特開昭 5 5 - 0 6 9 5 7 9 (J P , A)

特開昭 6 2 - 1 3 5 4 6 6 (J P , A)

特開昭 5 8 - 0 2 3 6 8 7 (J P , A)

特表 2 0 0 4 - 5 2 9 9 4 2 (J P , A)

特開昭 5 8 - 2 0 6 5 8 4 (J P , A)

特開平 0 1 - 0 4 7 7 8 3 (J P , A)

特開昭 6 3 - 0 9 3 7 8 0 (J P , A)

特開昭 6 2 - 2 8 9 5 7 6 (J P , A)

特開昭 5 7 - 1 2 2 0 8 3 (J P , A)

国際公開第 2 0 1 1 / 1 3 6 2 8 5 (W O , A 1)

Lin, Shi-qing et al. , Synthesis and antifungal activities of 1-[2-(2,4-dichlorophenyl)-4-alkoxymethyl-1,3-dioxolan-2-yl]methyl-1,2,4-triazoles , Jingxi Huagong , 2 0 0 5 年 , vol.22 no.11 , pp.862-865, 870

(58)調査した分野(Int.Cl. , D B 名)

A 0 1 N 2 5 / 0 0 - 6 5 / 4 8

C A p l u s / R E G I S T R Y (S T N)