ハイドロフルオレン誘導体のイネとタイヌビエ幼苗の 生育におよぼす影響

奥田四朗, 讃井 蕃, 故田原 昭*

(科研化学株式会社, *理化学研究所)

昭和 51 年 11 月 11 日 受理

Effects of Some Hydrofluorene Derivatives on the Growth of Rice and Barnyard Grass Seedlings (Study on Biological Activities of Dehydroabietic Acid Derivatives on Plants Part II)

By Shiro OKUDA, Shigeru SANAI and the late Akira TAHARA**
*Kaken Chemical Co., Ltd., Bunkyo-ku, Tokyo ; **The Institute of
Physical and Chemical Research, Wako-shi, Saitama-ken, Japan*

Effects of 23 hydrofluorene derivatives on the growth of rice and barnyard grass seedlings were investigated as follows.

1. Most of these compounds remarkably stimulated the root growth of the seedlings, but they were not so effective on shoot growth.
2. Some compounds showed an inhibitory activity on the growth of barnyard grass, though they promoted the root growth of rice.
3. Positive correlation between the relative activities of these compounds in the growth of root and shoot of barnyard grass was observed ($r=0.714$).
4. One of the four stereo isomers of diacids showed a strong inhibitory activity on the growth of barnyard grass. Interestingly, the compound (No.8) possesses the same stereo conformation as that of diacids-typed gibberellins. (Received November 11, 1976)

緒 言

われわれは、松脂の主成分である *l*-アビエチン酸より誘導された化合物の構造が、ジベレリン類の基本構造に近いことに着目し、ジベレリン様生理活性を含む植物生理活性を有する化合物を見出すことを目的として、種々の試験を行ってきた。まず、前報⁽¹⁾において、114種類のハイドロフルオレン系およびハイドロフェナントレン系化合物のイネ幼苗におけるジベレリンとの相互作用を調べ、普通種のイネ(品種:金南風)の endogenous growth を抑制することなく、わい性種のイネ(品種:短銀坊主)に与えられた GA₃ 誘起性の伸長作用を阻害する化合物 1 種と、両方の伸長作用を阻害する化合物 2 種の存在を明らかにした。本報では、1,2,3,5-tetrahydro-4,10-dimethyl hydrofluorene (以下、ハイドロ

フルオレンと称する)の誘導体 23 種のイネおよびタイヌビエ幼苗の生育におよぼす影響を報告する。

ハイドロフルオレン

実験材料および方法

1. 供試化合物 本実験に用いた化合物は、Table I に示した。これらはすべて故田原らが合成したもので、ガラスホモジナイザーで均一にけん濁させて用いた。
2. 供試植物 用いたイネ (*Oryza sativa* L.) の品種は、金南風である。タイヌビエ (*Echinochloa crus-galli* var. *frumentaceus*) は、埼玉県鴻巣市で採取した。

Table I. Hydrofluorene Derivatives Tested

Fundamental structure	Compds. No.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
	1	H	α -H		
	2	H	β -H		
	3	H	β -OH		
	4	H	β -OAc		
	5	H	O		
	6	Me	O		
	7	Me	$\sim$ OH, H		
	8	H	α -H		
	9	H	β -H		
		R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
	10	COOH	COOH	H	H
	11	COOH	COOH	OH	H
	12	COOH	COOH	OMe	H
	13	COOMe	COOMe	NH ₂	H
	14	COOMe	COOMe	NH ₂	NH ₂
	15	COOMe	COOH	H	H
	16	COOMe	COOH	NH ₂	H
	17	COOMe	COOCH ₂ ·CH ₂ OH	H	H
	18	COOMe	COOCH ₂ ·CH ₂ OH	OH	H
	19	COOMe	COOCH ₂ ·CH ₂ OH	NH ₂	H
	20	CH ₂ OH	CH ₂ OH	H	H
	21				
	22				
	23				

3. 実験方法

1) イネ幼苗検定法: 均一に催芽したイネの種子を, 供試化合物の 100 ppm 液が 1ml 入った管瓶 (長さ 6 cm, 内径 2.5 cm) に入れ, 口をポリエチレンフィルムでおおい, 約 3000 lux, 30°C に保ち, 1週間後に草たけと最長根長を測定した。

2) タイヌビエ幼苗検定法: 均一に催芽したタイヌビエの種子を, 供試化合物の 100 ppm 液が 5ml 入った直径 9 cm のシャーレに入れ, 約 3000 lux, 30°C に保ち, 1週間後に草たけと最長根長を測定した。

Table II. Effect of Some Hydrofluorene Derivatives on Rice and Barnyard Grass

Compd. No.	Relative activities			
	Rice		Barnyard grass	
	shoot	root	shoot	root
1	86 ^{a)}	171	112	106
2	79	177	108	125
3	97	141	104	93
4	—	—	96	135
5	84	122	80	48
6	84	170	80	116
7	93	171	53	47
8	80	169	51	0
9	101	121	105	130
10	94	159	110	126
11	98	139	100	166
12	91	128	110	126
13	103	184	73	100
14	93	157	45	37
15	105	158	78	42
16	112	167	94	54
17	91	159	61	44
18	94	174	81	103
19	93	203	61	72
20	107	135	53	42
21	79	176	107	109
22	99	94	52	42
23	100	113	115	214

^{a)} The relative activities are expressed as the percentage of the respective controls (100: shoot length of rice: 51.8 mm, barnyard grass: 56.4 mm, and root length of rice: 30.4 mm, barnyard grass: 30.6 mm).

実験結果および考察

それぞれの測定値を対照区に対する百分率で表わし, 草たけと根長の関係を Table II および Fig. 1 に, 植物間の草たけおよび根長の関係を Fig. 2 および 3 に示した。

これらによって明らかなように, イネ幼苗に対するハイドロフルオレン系化合物の作用は, 草たけに対しては一般的に弱く, かつ, やや抑制的であった。それに反して, 根に対してはほとんどの化合物が伸長を促進し, 対照区の 1.7 倍以上の伸長を示した化合物が 8 種類 (No. 1, 2, 6, 7, 13, 18, 19 および 21) 見出された (Table II)。

一方, タイヌビエに対しては, イネの場合よりも作用が強かったが, 草たけを対照区の 20% 以上伸長させた化合物はなく, 逆に抑制するものが多かった。根に対してはさらに強く作用し, 100% の伸長抑制を示すもの (No.

Fig. 1. Correlation between Shoot and Root Lengths of Rice and Barnyard Grass.
See the footnote of Table II.

Fig. 3. Correlation between Root Length of Rice and Barnyard Grass.
See the footnote of Table II.

Fig. 2. Correlation between Shoot Length of Rice and Barnyard Grass.
See the footnote of Table II.

3) まで存在した。特に草たけと根長をともに 20% 以上抑制した 7 種の化合物 (No. 7, 8, 14, 15, 17, 19 および 20) は、いずれもイネ幼苗の根の伸長を促進し、興味ある種間選択性を示した (Fig. 2 および 3)。

自然の一定環境条件下における植物の生育初期における相対生長率は常に一定であるとする Blackman⁽²⁾ の説は、数種類の植物において例証^(3,4)されているが、イネについても森⁽⁵⁾、東条⁽⁶⁾の詳しい報告がある。また人為的な薬物処理条件下における研究も、最近、山田ら^(7,8)によって行なわれたものでは、2つの化合物群に対する数種の植物の草たけと根長の inhibitory index が高い

相関を示したとしている。本実験においても、タイヌビエ幼苗の場合には、彼らと同様の結果が得られたが ($r=0.714$)、イネの場合には相関がなかった。また、山田ら^(7,8)は、inhibitory index が、それぞれイネとタイヌビエ間で相関性がなかったと述べたが、本実験でも相関を示さなかった (Fig. 2 および 3)。

化学構造と生理活性について

化合物の性質が、その立体構造の微細な部分の変化によって著しく変わることはよく知られているが^(9,10)、本報における化学構造の変化と生理活性の変動を挙げると、次のとおりである。

タイヌビエの根の抑制作用の減少または伸長への変換および伸長作用の増大を示した例は、

- 1) C_4 -カルボン酸 (No. 5) のメチルエステル (No. 6) への変化
- 2) ジオール体 (No. 20) よりジカルボン酸 (No. 10) への変化
- 3) C_{12} -アミノ、ハーフエステル (No. 16) からジエステル (No. 13) への変化

に見られ、反対にタイヌビエの根の伸長作用の減少、または抑制への変換、および抑制作用の増大を示した化学構造の変化の例は、

- 1) ジカルボン酸 (No. 10) からハーフエステル (No. 15) への変化

2) ジカルボン酸 (No. 9) から C 環が飽和されたジカルボン酸 (No. 22) への変化

3) 6-オキソ化合物 (No. 6) から還元体 (No. 7) への変化

に見られた (Table I および II).

また, 化合物の立体構造が生理活性に与える影響も大きく^(9,10), この分野における例として, 古くはオーキシンの構造と活性の研究⁽¹¹⁾や, 最近の β -フェノキシアクリレート誘導体のヒエ幼苗に対する立体化学的解析⁽¹²⁾が見られるが, 本実験においても, ジカルボン酸の 4 個の立体異性体 (No. 1, 2, 8 および 9) のタイヌビエ幼苗に対する生理活性の差に, それが見られる. すなわち A/B 核間配位がシスのジカルボン酸 (No. 1 と 2) および A/B トランス配位の No. 9 は活性が弱く, かつ, 差が少ないのに対して, A/B 環の立体構造および 4, 6 位のカルボキシル基の立体配位に関して, すべてのジカルボン酸型ジベレリンと同じ立体配位を持つ, A/B トランス配位で 5-H/6-H トランス型のジカルボン酸 (No. 8) だけが強い抑制的生理作用を示したことは興味深い.

要 約

ハイドロフルオレン系化合物 23 種のイネおよびタイヌビエ幼苗に対する作用を調べた.

1) これらの化合物のイネおよびタイヌビエ幼苗の草たけの伸長に関する効果は, がいして弱かったが, 根の伸長に対しては強く, ほとんどの化合物が伸長を促した.

2) タイヌビエの草たけと根の伸長を阻害し, イネの根の伸長を促進させる, いわゆる種間選択的作用のある化合物数種を見出した.

3) タイヌビエの草たけと根長の関係には, 正の相関が認められた ($r=0.714$).

4) 化学構造の変化に伴う生理活性の変異について検討し, 特に 4 個のジカルボン酸の立体異性体のうち, ジベレリンと同じ立体配位を持つ化合物 (No. 8) のみが, タイヌビエに対して, 強い伸長抑制作用を示すことを見出した.

- (1) S. Okuda, S. Sanai, Y. Kimura, S. Tamura and the late A. Tahara: *Agric. Biol. Chem.*, **40**, 1327 (1976).
- (2) V. H. Blackman: *Ann. Bot.*, **33**, 353 (1919).
- (3) W. H. Pearsall: *ibid.*, **41**, 550 (1927).
- (4) T. W. Turner: *Am. J. Bot.*, **9**, 415 (1922).
- (5) 森 敏夫: 日作記, **29**, 70 (1960).
- (6) 東条健二: 作物学論集, **1935**, 751.
- (7) O. Yamada, S. Ishida, F. Futatsuya, K. Ito, H. Yamamoto, and K. Munakata: *Agric. Biol. Chem.*, **38**, 1235 (1974).
- (8) *idem*: *ibid.*, **38**, 2017 (1974).
- (9) アリエンス (木村正康, 高柳一成訳): 分子薬理学, 朝倉書店, 1967, p. 125, 214.
- (10) A. コルコワス (山田多喜男訳): ドラッグデザイン, 広川書店, 1972, p. 75.
- (11) M. S. Smith, R. L. Wain and F. Wightman: *App. Biol.*, **39**, 295 (1952).
- (12) A. Fujinami and A. Mine: *Agric. Biol. Chem.*, **34**, 1157 (1970).