

令和4年2月3日	発表者 権 来悟
【Journal】 <i>J. Agric. Food Chem.</i> <b>2022</b> , <i>70</i> , 1019-1028	
【Title】 New Synthetic Method and Insecticidal Activities of Novel Imidazopyridine Mesoionic Derivatives Containing an Ester Group	
【Affiliation & Authors】 State Key Laboratory Breeding Base of Green Pesticide and Agricultural Bioengineering, Key Laboratory of Green Pesticide and Agricultural Bioengineering, Ministry of Education, Guizhou University Zhengjun Liu, Runjiang Song, Desheng Zhang, Rong Wu, Ting Liu, Zhengxue Wu, Baoan Song	
【Abstract】 従来の殺虫剤に対する害虫の耐性化が進み、食品の品質や安全性への要求が高まる中、高効率で新しい作用機序を持ち、非標的生物や環境に対して安全な新しい殺虫剤の開発が急務となっている。メソイオン系殺虫剤は、ユニークな構造、強力な殺虫活性、新規の作用機序、非標的生物への低毒性、環境への配慮などから、世界各国の研究開発において注目されている。近年、ピリドピリミジンメソイオン化合物の殺虫活性の最適化について多くの研究が行われている。 そこで筆者らは、ピリドピリミジンメソイオン環に着目し、新たな誘導体の合成を試みたが、その過程で3位にヨウ素を付加したところ、予想外に新規の骨格形成反応でイミダゾピリジンメソイオン化合物が得られた。筆者らは発見した新しい合成法を用いて、エステル基を有する一連のイミダゾピリジンメソイオン化合物43種を設計・合成した。イミダゾピリジンメソイオン環の1位、3位のエステル、4位、5位、6位、7位に様々な置換基を導入した。合成した化合物の殺虫活性評価の結果、多くの化合物はマメアブラムシ <i>Aphis craccivora</i> に対して有意な殺虫活性を示し、一部はウンカ <i>Sogatella furcifera</i> に対して中程度の殺虫活性を示した。中でも、いくつかの化合物は、 <i>A. craccivora</i> に対して $LC_{50} = 4.5 \mu\text{g/mL}$ 以下と強力な殺虫活性を示し、既存の殺虫剤である pymetrozine ( $LC_{50} = 6.19 \mu\text{g/mL}$ ) や triflumezopyrim ( $LC_{50} = 4.68 \mu\text{g/mL}$ ) よりも強活性であった。また、イミダゾピリジンメソイオン骨格の1位に (2-chlorothiazol-5-yl)methyl、3位のエステルに 4-fluorophenyl を有する化合物 <b>C9</b> の <i>A. craccivora</i> に対する $LC_{50}$ 値は、triflumezopyrim の5.9倍の $0.8 \mu\text{g/mL}$ であった。さらに、プロテオミクスおよび分子ドッキングの結果から、化合物 <b>C9</b> は triflumezopyrim と同様に <i>A. craccivora</i> の神経系に影響を与え、ニコチン性アセチルコリン受容体に作用する可能性が示唆された。 エステル基を有する新規イミダゾピリジンメソイオン化合物の新たな合成法は、反応条件が温和で、腐食が少なく、基質範囲が広いという利点を有していた。また、合成したイミダゾピリジンメソイオン化合物の多くが <i>A. craccivora</i> に対する強力な殺虫活性を示したことから、イミダゾピリジンメソイオン化合物は、新規メソイオン性殺虫剤としての開発が期待できる。	