

二不斉中心シアノ置換シクロプロパン系ピレスロイド全4種のキラル合成および立体構造活性相関

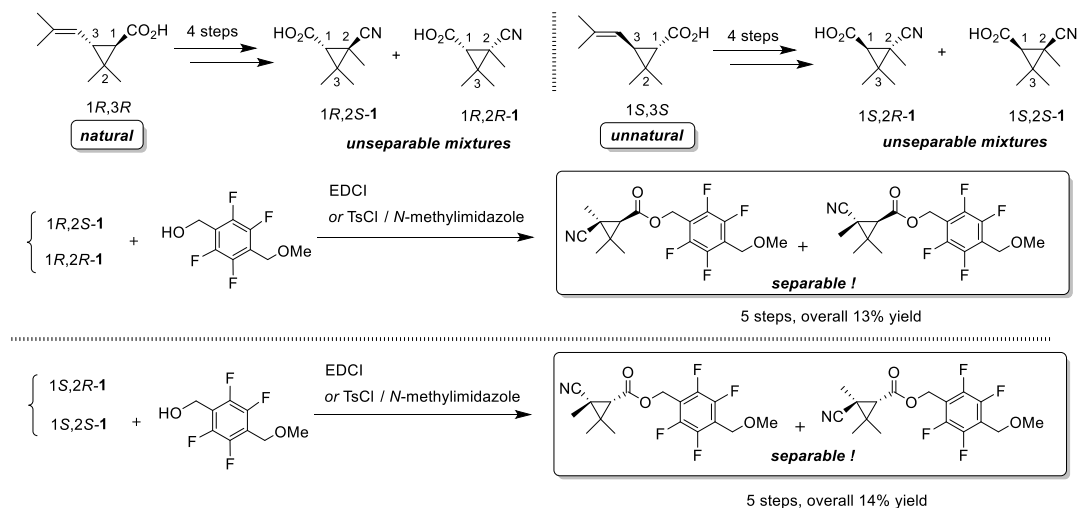
(関学大院理工) ○青柳侑沙・森山瑞希・松尾憲忠・田辺 陽

Chiral synthesis of cyano-substituted cyclopropane-type pyrethroid with two asymmetric centers and its insecticidal stereostructure-activity relationship, ○Yusa Aoyagi, Mizuki Moriama, Noritada Matsuo, Yoo Tanabe

Consistent with our longstanding studies on cyclopropane transformation chemistry, together with cyclopropane pyrethroid chemistry bearing two or three chiral centers, we present here chiral synthesis of a novel cyano-substituted cyclopropane synthetic pyrethroid and its insecticidal stereostructure activity relationship (SAR). Racemates of the present compound were already reported to exhibit high insecticidal activity. Based on the background, we envisage a chiral synthesis of all four enantiomers to investigate the SAR.

Keywords : Pyrethroid., chiral synthesis, stereostructure-activity relationship

当研究室では、シクロプロパンの特性を活かした各種合成研究¹⁾の一環として、二・三不斉ピレスロイド殺虫剤の立体構造活性相関の研究を行っている²⁾。その展開として、二不斉中心シアノ置換シクロプロパン系ピレスロイド全4種のキラル合成を行った。アルコール側は SumiOne® (虫コナーズの原料) の型である。すでにラセミ体で最高級の殺虫活性を有しているため³⁾、その立体構造活性相関に興味を持たれる。合成は既知の光学活性菊酸の両異性体からの誘導化で行った。そのため絶対配置はほぼ確定している。現在、殺虫活性試験を行っている。なお、エステル化は当研究室の方法⁴⁾を利用しているが、常法である EDCI より高速・高収率である。



1) *J. Org. Chem.* **2020**, *85*, 2984-2999. References cited therein.

2) a) *J. Chem. Soc., Perkin Trans I* **1996**, *1*, 1243-1249. b) *Bioorg. Med. Chem.* **2001**, *9*, 33-39. c) *Molecules* **2019**, *24*, 1023-1041.

3) Matsuo, N.; Mae, M. *Jpn. Kokai Tokkyo Koho* P2010-24212A, **2010**.

4) *Adv. Synth. Catal.* **2003**, *345*, 1209-1214.