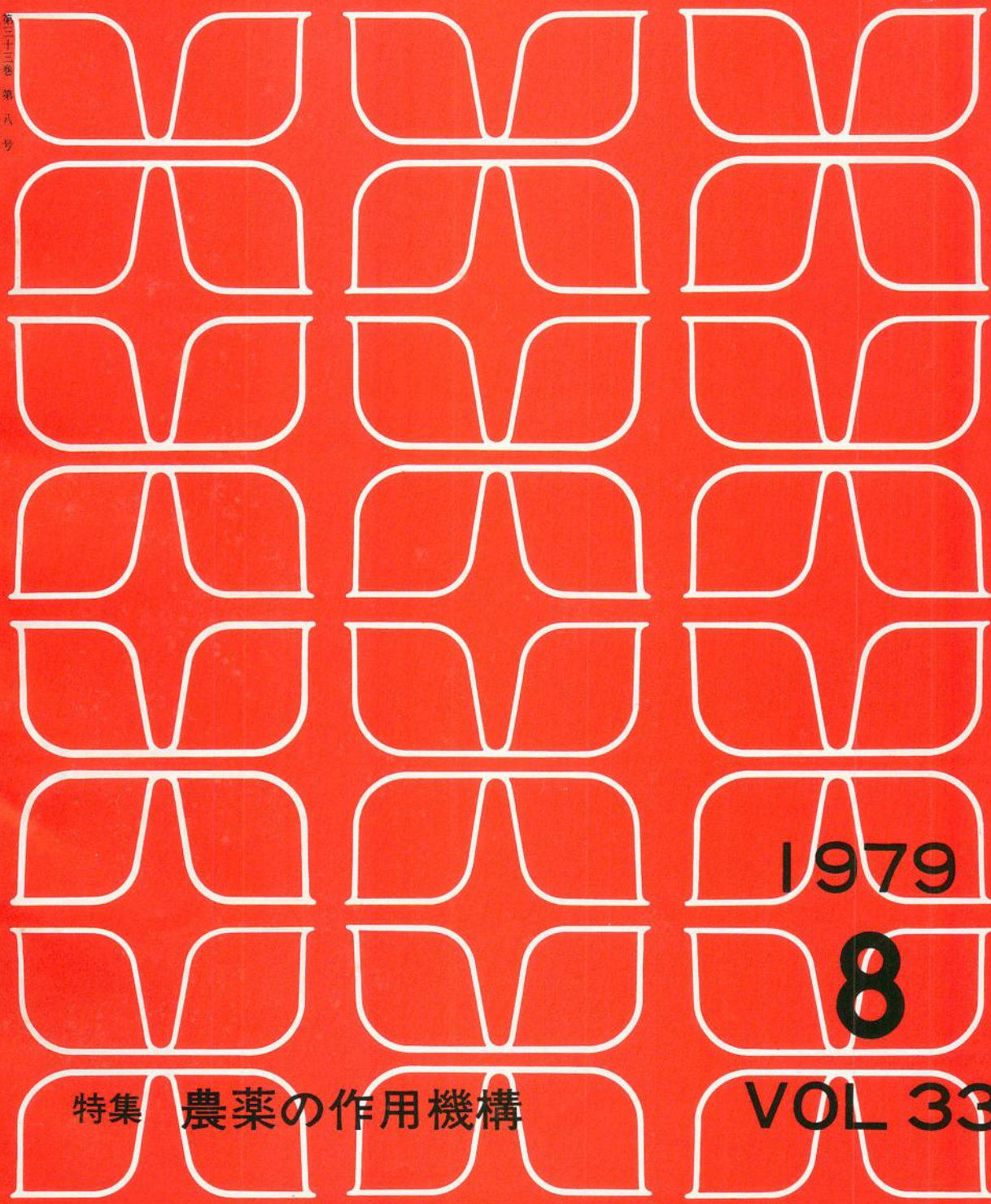


# 植物防疫

昭和五十四年八月二十五日  
昭和五十四年九月九日  
第三行刷  
第三種郵便物認可



1979

8

VOL 33

特集 農薬の作用機構

黒点病、斑点落葉病防除に

# パルノックス



大内新興化学工業株式会社  
〒103 東京都中央区日本橋小舟町1-3-7



## 共立草刈機 てがーる



軽い・安い・使いやすい



お求めやすい奥様価格  
¥28,800  
(東京店頭渡し価格)

カメムシの防除に畦畔の草刈りを……

# 草を刈る楽しさがいっぱい

豊かな農林業をめざす……



株式会社 共立

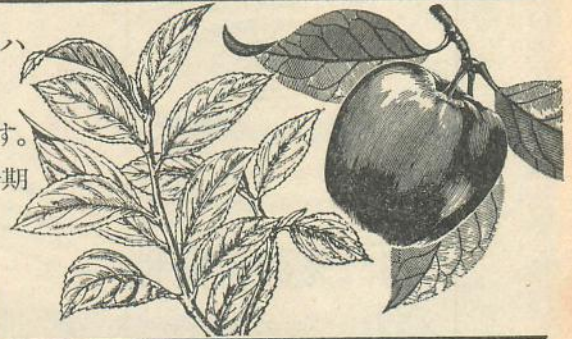


共立エコ物産株式会社  
〒160 東京都新宿区西新宿1-11-3 (新宿Kビル) ☎03-343-3231 (代表)

茶・りんごのハダニ防除に

## マイトサイジン®B乳剤

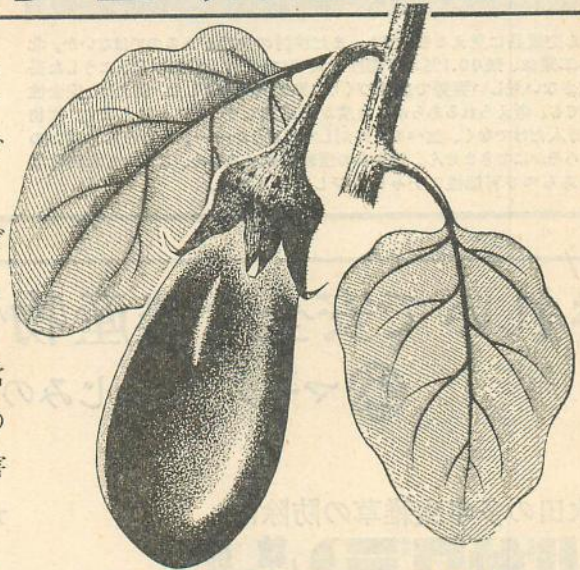
- 茶・りんご・菊・カーネーションのハダニ類に的確な効果を発揮します。
- 各種薬剤に抵抗性のハダニにも有効です。
- 茶の開葉期やりんごの落花直後の時期にも葉害の心配なく使用できます。



新しい剤型のくん煙剤

## 中ダイアジノンくん煙顆粒

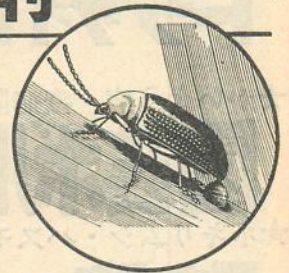
- ダイアジノンを独自の剤型にし、ビニールハウス栽培のなすのアブラムシ防除用殺虫くん煙剤です。
- マッチで点火具に火をつけるだけで手間がかからず誰れにでも簡単に使うことができます。
- 薬剤散布にくらべて労力が非常に少なくてすみ、またハウスの湿度が上昇しませんので、病害発生を助長させません。

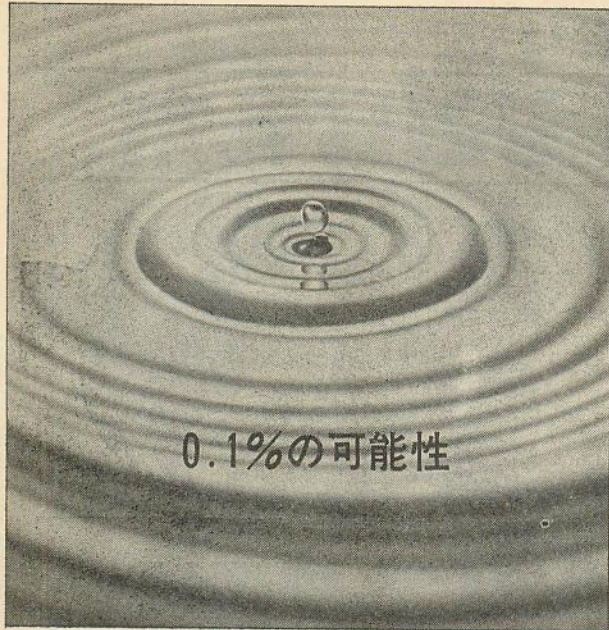


抵抗性ツマグロ防除に・イネドロオイムシ防除に

## 中バツサジノン粒剤

- りん剤およびカーバメート剤が効きにくくなったツマグロヨコバイにもよく効きます。
- 粒剤ですのでドリフト(薬剤の舞い上り)の心配が少なく効きめが長つづきます。
- 本田施用により、イネドロオイムシにすぐれた効きめがあります。





0.1%の可能性

いっけん完成品に見えるものでも、まだ検討の余地があるのではないかと。北興化学工業は、残り0.1%の可能性を大切にします。創業以来、こうした妥協を許さない厳しい姿勢で農業づくりに取組んできました。例えば、安全性についても、考えられるあらゆる角度から厳密なチェックを加えます。作物や、使う人だけでなく、食べる人に対してはどうか……。もちろん、効力の面はおろそかにできません。皆さまの信頼に応えるため、こんごも北興化学工業はあらゆる可能性にチャレンジしていきます。

## いもち病の 予防と治療に！

強力な防除効果とすぐれた安全性

**カスラフサイド®**  
粉剤・水和剤・ゾル

いもち病の省力防除に効きめのなが〜い  
ホクコー

**オリゼメート®粒剤**



取扱い


農協 / 経済連 / 全農



北興化学工業株式会社

〒103 東京都中央区日本橋本石町4-2  
支店：札幌・東京・名古屋・大阪・福岡

## きれいで安全な農産物作りのために！

 マークでおなじみのサンケイ農薬

★水田の多年生雑草の防除に

**バサグラン** 粒剤  
水和剤

★果樹園・桑園の害虫防除に

穿孔性害虫に卓効を示す

**トラサイド** 乳剤

★かいよう病・疫病防除に

**園芸ボルドー**

★ネキリムシ・ハスモンヨトウの防除に

**デナボン5%ベイト**



★ナメクジ・カタツムリ類の防除に

**ナメトックス**

★線虫防除に

**ネマホルン**

**EDB油剤30**

**ネマエイト**

**サンケイ化学株式会社**

東京 (03)294-6981 大阪 (06) 473-2010  
福岡 (092)771-8988 鹿児島 (0992) 54-1161

特集：農薬の作用機構

抗生物質剤の作用機構	黄 耿堂	1
イネ病害防除剤の作用機構	上杉 康彦	8
野菜病害防除剤の作用機構	手塚 信夫	14
殺虫剤の選択毒性	宍戸 孝	21
ピレスロイド系殺虫剤の化学構造と作用性	藤田 義雄	28
ツマグロヨコバイのカーバメート系殺虫剤に対する抵抗性の機構	高橋 洋治	36
除草剤の選択殺草性	百武 博	43
新しく登録された農薬 (54.6.1~6.30)		52
中央だより	人事消息	50 49
新刊紹介		35

緑ゆたかな自然環境を…

## 「確かさ」で選ぶ……バイエルの農薬



●いもち病・穂枯れを防いでうまい米を作る

® **ヒノザン**

●カメムシ・メイチュウなど稲作害虫に

® **バイジット**

●アブラムシ・ウンカなど吸汁性害虫を省力防除する

® **タイシストン**

●ドロオイ・ハモグリ・ミズウムシなどに

® **ガンサイド**

●各種作物のアブラムシに

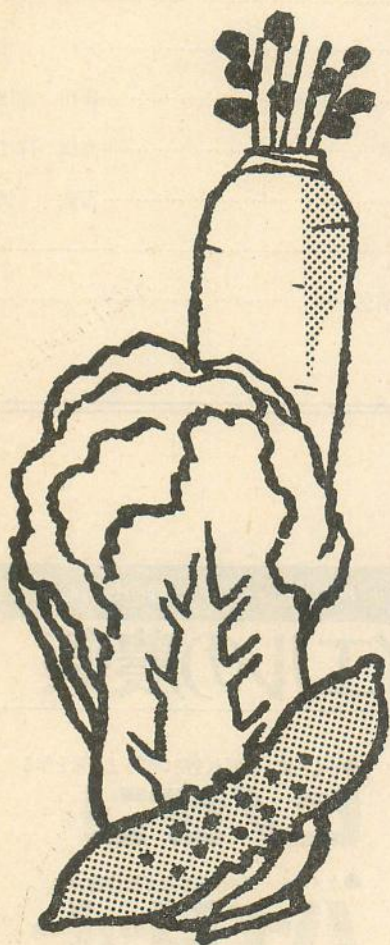
® **エストックス**

日本特殊農薬製造株式会社

東京都中央区日本橋室町 2 - 8 番 103



# 武田の野菜農薬



●キャベツ・はくさいのコナガ防除に

**パダン**<sup>®</sup> 水溶剤

●園芸作物害虫の基幹防除に

**武田オルトラン**<sup>®</sup> 水和剤  
粒剤

●キャベツのハスモンヨトウに

**ランネード**<sup>\*</sup> 水和剤  
「タケダ」

●速効性のアブラムシ防除剤

**武田ピリマー**<sup>\*</sup> 水和剤

●新しい園芸作物殺虫剤

**武田アクテリック**<sup>\*</sup> 乳剤

●園芸作物病害の基幹防除に

**武田ダゴニール**<sup>®</sup>

●園芸作物の病害に

デュボン **ベンレート**<sup>®</sup> 水和剤

●メロン・きゅうりのうどんこ病防除に

**武田ミルカーブ**<sup>\*</sup> 液剤

●畑の雑草防除に

**トリアサイド**<sup>®</sup> 乳剤

# 抗生物質剤の作用機構

理化学研究所 <sup>こう</sup>黄 <sup>けい</sup>耿 <sup>どう</sup>堂

## はじめに

殺菌剤の作用機構に関する研究は、新しい殺菌剤の開発と生化学の進歩に伴い、農業用殺菌剤の研究に従事する者の注目を浴びてきた。1960年、ブラストサイジンSが実用化された時を境に、重金属を含む有機化合物殺菌剤の時代から抗生物質殺菌剤あるいは重金属を含まない有機化合物殺菌剤の時代に入った。一般に、重金属を含む殺菌剤は含有する重金属が殺菌作用の主要要素で、これが生体内のSH化合物と結合して、呼吸系をはじめとして、エネルギー代謝系に作用することが知られている。一方、抗生物質をはじめとする重金属を含まない殺菌剤では生体内成分の生合成に作用し、殊に、抗生物質はタンパク合成系に作用するものが多い。近年、人工培地上では抗菌力を示さないが、作物体上で著しい防除効果を発揮する薬剤の登場が目立ってきた。抗生物質にも、ペリダマイシンのように、人工培地上ではわずかに菌糸の分岐異常が見られる程度で、はっきりした抗菌力を示さないものも現れてきた。したがって、従来の生化学的技法だけでは、薬剤の作用機構を解明することが難しくなってきたように思われる。

しかしながら、薬剤の作用機構の研究とは、単に、薬剤が単純な反応系で、供試菌の代謝に及ぼす影響を調べ、その作用点を見つげるだけでなく、むしろ、これらの生化学的知見と作物体上で示す薬剤の病害防除作用を結び付ける研究がより重要であると思われる。昨今、農業用抗生物質の作用機構については多くの優れた総説がある。本文ではできるだけこれらとの重複を避け、生体上における病害防除作用の機構を重点において述べてみたいと思う。

抗生物質の作用機構を理解するに当たって、まず、その特徴と種類について総括的に考えてみたいと思う。その特徴として以下の数点があげられる。

① 抗生物質の定義から考えて、殺菌剤に限られるのは当然であるが、殺虫性や殺草性を持ったものもある。しかしながら、これらは殺菌剤として実用化することは難しい。

② 実用化されている抗生物質剤のほとんどは塩基性水溶性のものである。

③ 実用化されている抗生物質剤のほとんどは生体成

分の合成系に作用し、殊に、タンパク合成系を阻害するものが多い。この点については医薬用のものも同様である。

④ 対象病害に対する特異性が高い。その反面、耐性菌が出現しやすい。

⑤ 低濃度で著しい効果を示す。この点については、生産コストが合成化合物に比して高価であり、主要病害に有効で、なおかつ使用濃度が100 ppm以下でないことと実用化が難しいことに原因していると思われる。

次に、現在までに明らかにされた農業用抗生物質の作用点を表に示す。

農業用抗生物質の作用点

抗生物質名	作用点
1 抗かび性抗生物質 ブラストサイジンS カスガマイシン シクロヘキシミド  ポリオキシン ペリダマイシン  グリゼオフルビン	タンパク合成系 タンパク合成系 {タンパク合成系 核酸合成系 キチン合成系 イノシトール合成に関連した代謝系 細胞分裂
2 抗細菌性抗生物質 ストレプトマイシン  テトラサイクリン系化合物 ノボピオン  セロサイジン	タンパク合成系 そのほか幾つかの代謝に影響する タンパク合成系  Mg <sup>++</sup> を必要とする各種代謝 DNA合成阻害、TCA回路

農業用抗生物質剤は、上記のようにそのほとんどは抗かび性物質で、抗細菌性物質は医薬から適用されたものがほとんどである。そのほか、テトラサイクリン系化合物はマイコプラズマによる病気に対しても有効性が認められ、ブラストサイジンSは抗ウイルス性が認められた。更に、唯一の除草性抗生物質 Anisomycin 及びその誘導体や殺ダニ性抗生物質テトラナクチン、ミルベマイシンなどが誕生し、抗生物質の定義が大幅に改められようとしている。

## I 植物細菌病防除に用いられている抗生物質の作用機構

植物細菌病防除に抗生物質を利用する試みは、戦後間

もなく 1950 年代に、多くの医薬用抗生物質を用いて欧米諸国で始められ、盛んに行われてきた。しかしながら、動物と異なる植物の特殊な器官と組織及びその病原、発病過程、病巣などの違いから、多くの場合、適用拡大は難しく、わずか数種の抗生物質が適用されたにすぎない。その中で、現在でも広く使用されているものは、ストレプトマイシンだけである。

その間、幾つかの農業用抗細菌性抗生物質が開発され、一時的に実用されたが、その後姿を消している。

そこで、これら使用されたことのある抗細菌性抗生物質の作用機構を検討し、新抗生物質開発の参考に供したいと思う。

### 1 ストレプトマイシン

本抗生物質は、ペニシリンに次いで古いものであり、グラム陽性、陰性両細菌に対して抗菌性を示すものとして有名である。植物の病害防除には 1954 年ごろから、ナシの火傷病、モモの穿孔病などにアメリカで用いられ、我が国では、イネ白葉枯病、カンキツかいよう病などに用いられている。室内での抗菌力は各種植物病原細菌に及んでいるが、使用濃度を若干高めると植物に葉害を生ずる。例えば、イネ体上では葉片の黄化や不稔を生ずる。

この物質の作用機構については、動物の病原細菌を用いて、長年多くの研究者によって行われてきた。その結果、タンパク合成系、RNA 合成系、DNA 合成系、脂質合成系などに対する阻害、呼吸系の阻害、RNA の分解、DNA の結合、膜機能に対する影響などが数多く報告されている。DUBIN ら (1963) によれば、タンパク合成系、核酸合成系、細胞膜の機能に対する作用が本抗生物質の重要な作用点とされているが<sup>1)</sup>、その後報告された多くの研究結果から、タンパク合成系に対する阻害作用が最も有力と思われる。そこで、1948 年ごろ適応酵素の形成阻害が認められて以来行われた多数の報告から、ストレプトマイシンのタンパク合成系に対する作用を要約すると次のとおりである。

生体細胞におけるタンパク合成系を大きく分けると、①ペプチド合成の開始、②ペプチド鎖の伸長、③ペプチド合成の終了の 3 段階になる。

本抗生物質は、これらの過程の中で第 1 段階に作用するものと考えられている。これまで報告された主な作用として①合成開始複合体機能 (initiation complex function) の阻害とその安定性を損なう<sup>2)</sup>。②70S リボゾームの安定性が失われる<sup>3)</sup>。③translation 時の阻害では、ペプチジル t RNA 複合体が崩壊する<sup>4)</sup>。④コードの誤読 (Codon misreading) を誘発する<sup>5)</sup>。⑤第 3 段階のペプ

チド合成の終了時の阻害では、解離因子 (release factor) の機能を阻害する<sup>6)</sup>、などがある。

しかしながら、これらの作用機構から植物体上における発病抑制機構や葉害の発生機構を説明することは極めて困難であり、その解明は今後の重要な課題として残されている。

本抗生物質は、医薬用、農業用を問わず、耐性菌の出現しやすい点でも、かなり有名である。農業用では、1950 年初期から、ほ場においてイネ白葉枯病菌、ハクサイ軟腐病などのストマイ耐性菌株が検出されている。現在では、ほとんどの植物細菌病の病株から検出され、植物細菌病防除の問題に拍車をかけている。

植物病原細菌を用いての耐性機構の研究は少なく、ほとんどの場合、枯草菌、大腸菌などを材料として実験が進められてきた。その結果、耐性菌のリボゾームは本剤との親和性が感受性株と比べて著しく低く、作用を受けないところに、その耐性の原因が存在していると考えられている<sup>7)</sup>。

### 2 クロラムフェニコール

本抗生物質は細菌、リケッチアなどに対して広い抗菌スペクトルを有している。一時、イネ白葉枯病防除に使用されたが、その効果と葉害に問題があり、現在では、塩基性塩化銅との混合剤として果樹、野菜類の細菌病防除に使用されている。

作用機構については、ストレプトマイシンと同様、適応酵素の形成阻害から、1951 年ごろには、既にタンパク合成を阻害することが推定されている。その後、VAZQUEZ ら (1967) によって、その作用は、70S リボゾームの 50S サブユニットとの結合によることが明らかにされた<sup>8)</sup>。<sup>14</sup>C-クロラムフェニコールを用いた実験でこのリボゾームとの結合モル比は 1 : 1 であることも分かった<sup>9)</sup>。更に、BALLESTA ら (1971) によれば、リボゾームとの結合は、特異的に  $\beta$ -core で行われる<sup>10)</sup>。一般に、50S サブユニットと結合する阻害剤はペプチド転移反応を阻害すると言われ、VOGEL ら (1971) によれば、上記の結合は、ペプチド転移酵素活性に対する阻害作用と相関がある<sup>11)</sup>。

### 3 テトラサイクリン系抗生物質

本抗生物質は広い生物活性を有するもので、前述のストレプトマイシンとの混用で耐性菌防止に使われている。医薬用としては、一般に、細菌、PLT 群微生物などによる疾患の治療に使用されている。石家ら (1967) は、マイコプラズマ様微生物によるクワ萎縮病に、本系抗生物質を根部浸漬したところ、新葉の病徴は消失するが、その抑制効果は短く、施用を中止すると再び発病す



ることを報告した<sup>12)</sup>。一般に、テトラサイクリン系抗生物質は優れた抗菌性を持っているが、紫外線に対して極めて不安定であることから、は場では日光によって容易に分解され、その活性は植物体上で容易に消失するものと思われる。

本抗生物質の作用機構については、前両者と同様、その研究の発端は、適応酵素の形成阻害にある。

CONNAMACHER ら(1965)によれば、本抗生物質は 70S リボゾームの 30S サブユニットと特異的に結合することが報告されている<sup>13)</sup>。更に、GOTTESMAN (1967)によれば、テトラサイクリンはペプチジル tRNA の A 部位への結合を阻害し<sup>14)</sup>、同様に、SAYKAR (1968) は、アミノアシル tRNA の A 部位への結合を阻害することを報告した<sup>15)</sup>。

#### 4 ノボビオシン

本抗生物質はグラム陽性菌に卓効を示し、一部のグラム陰性菌にも有効である。脇本ら (1967) はトマトの幼苗をノボビオシン 100 ppm 水溶液中に浸漬することによって、かいよう病の発生を防止できることを認めた<sup>16)</sup>。

本抗生物質はナトリウム塩の形態では水溶性が、2, 3 価の金属イオン、亜鉛、アルミニウム、マンガン、鉄などと結合して不溶性の塩になる。

本抗生物質は多くの代謝系に対して作用する。例えば、呼吸系、電子伝達系、AT Pase 活性、RNA, DNA の合成などが報告された。これらの代謝系に共通する点は、代謝の過程において、適量の  $Mg^{++}$  イオンが必須なことである。このことは、本抗生物質が  $Mg^{++}$  イオンと容易に複合体を形成することを意味し、上記の阻害様式を裏付けるものである。

#### 5 セロサイジン

本抗生物質は農業用抗細菌性物質として開発された第 1 号のものである。イネ白葉枯病に対して卓効を示したが、葉害を生じやすいため、現在はほとんど使用されていない。

沖本ら (1963) によれば、本抗生物質はシステインやグルタチオンによってその抗菌性が拮抗され、NAD を必要とする脱水素酵素、特に  $\alpha$ -ケトグルタル酸からサクシニル CoA への経路を生育最低抑制濃度 10 ppm で特異的に阻害する<sup>17)</sup>。最近、この拮抗現象について、米山ら (1978) が詳細に調べた結果、2 段階にわたってシステイン 2 分子がセロサイジン 1 分子と結合することが明らかになった<sup>18)</sup>。これらの研究とは別に田中ら (1968) は枯草菌 168 株 (Thym-, Indol-) の菌体で  $^3H$ -チミンの DNA 分画への取り込みが、セロサイジン 10 ppm によって著しく抑制されると報告している<sup>19)</sup>。DNA 合成

に対する作用について、米山らは、デオキシ化、リン酸化、DNA との結合及び DNA ポリメラーゼのいずれの段階に対しても影響が認められないと述べている。

## II 抗かび性抗生物質の作用機構

農業用殺菌剤は医薬と異なり、抗かび性薬剤を主体として研究が進んできた。これは植物においてはかびによる病気の数が大半を占め、生体上での防除効果の検出が細菌病やウイルス病に対するものより容易に行われるからである。しかしながら、作用機構を生化学的な面から追及するために糸状菌を用いて行うことは、実験系として単細胞系を用いるよりやや難しい。殊に無細胞系においては確立されたものは少ない。したがって、多くの場合、タンパク合成系や核酸合成系については、大腸菌系を用いて行った実験が多いことをあらかじめお断りしておきたい。現在、幾つかの抗かび性抗生物質が使用されている。すなわち、1951 年に BRIAN らがグリゼオフルビンを植物病害の防除に用いて以来、シクロヘキシミド、プラストサイジン S、カスガマイシン、ポリオキシン、バリダマイシンなどがある。目下開発中のものには、ミルディオマイシンなどがあるが、これらの作用機構については、まだ明らかではない。前述のとおり、抗生物質にはタンパク合成阻害剤が多い。本項でもタンパク合成阻害剤から、説明していきたい。

### 1 プラストサイジン S

本抗生物質は 1960 年ごろに、農業用抗生物質の第 1 号として開発されたもので、室内試験に限り広い抗菌スペクトルを持っている。生体上ではイネいもち病に対して特異的に防除効果を有し、殊に他の薬剤に比して、治療効果が高いことが特徴的である。室内試験の結果から、菌糸の伸長阻害が有機水銀剤 PMA に比べてはるかに高いことが優れた治療効果の原因である。その他、タバコモザイク病、イネ縞葉枯病、動物の腫瘍に対して抑制効果が認められている。

イネいもち病菌 (*Pyricularia oryzae*) の代謝に及ぼす影響について、見里らは解糖系、コハク酸脱水素系、電子伝達系及び酸化的リン酸化を含む一連の呼吸系、<sup>32</sup>P ラベルリン酸の RNA, DNA への取り込みなどを抑制しないが、1 ppm 以下の濃度で、<sup>14</sup>C-グルタミン酸<sup>20)</sup>、<sup>14</sup>C-アミノ酸<sup>21)</sup> のタンパクへの取り込みを著しく阻害することを明らかにした。また、イネいもち病菌の無細胞系におけるタンパク合成をも著しく抑制し、その作用点がタンパク合成系のアミノアシル tRNA からペプチドが形成される過程にあることを明らかにした<sup>21)</sup>。更にプラストサイジン S 処理に伴う主な阻害現象として、イ

ネいもち病菌、酵母 (*Saccharomyces cerevisiae*) のプラストサイジンS処理細胞では、著しくRNAの異常蓄積が認められ、本抗生物質が80Sリボゾームと結合して、全般的にRNAのturnoverに影響することも推測された<sup>22)</sup>。その他、高濃度処理で、イネ体に黄褐色の葉斑が認められることから、クロロフィル含量が明らかに低下していることが認められた<sup>23)</sup>。筆者らはクロレラ細胞 (*Chlorella Pyrenoidosa* CHICH) を用いて調べた結果、プラストサイジンS処理細胞は、細胞分裂は行われるが、分裂した四つの細胞の分離が行われない現象を認めた<sup>24)</sup>。

山口らが *E. Coli* 及び *B. megaterium* の無細胞系で調べた結果、プラストサイジンSは70Sリボゾームの50Sサブユニットと結合し、ペプチジル-tRNAがP部位からA部位への転移を抑制することが認められた<sup>25)</sup>。のちに、COUSOGEORGIOPOULOS<sup>26)</sup> や YUKIOKA ら<sup>27)</sup> は本抗生物質がペプチジル転移酵素に作用することを認めた。

## 2 カスガマイシン

本抗生物質はプラストサイジンSと同様、塩基性水溶性物質である。20ppmでは場におけるイネいもち病の発生をほとんど100%近く抑えることができる。しかしながら、近年連続使用によって耐性菌が発生し、問題になっている。室内における普通の培養条件下では、イネいもち病菌に対して一見抗菌力を示さないが、培地のpHを5以下に下げると抗菌力を発揮することが特徴的である。一般に治療効果は低い、優れた予防効果を持っていて、高濃度散布でもイネ体に葉害が認められない。

本抗生物質はアミノ配糖体抗生物質に属するもので、一般にこの一群の抗生物質、例えばストレプトマイシン・ゲンタマイシン・カナマイシンなどはタンパク合成を阻害し、コードの誤読を起こすことが特徴とされている。しかしながら、本抗生物質はコードの誤読を生じないところにほかのものと異なる点がある。しかしながら、アミノ配糖体抗生物質によるコードの誤読が供試微生物の生育を抑制する直接的な要因であるかどうかは疑問である。

田中ら (1966) はイネいもち病菌の無細胞系を用い、本抗生物質のタンパク合成系阻害を証明した<sup>28)</sup>。更に、大腸菌の無細胞系において、本抗生物質はアミノシル tRNA と mRNA 30S リボゾームサブユニットの結合を阻害し、30S開始複合体 (30S initiation complex) の形成を抑制することが認められた。この点についても、70S開始複合体 (70S initiation complex) の形成阻

害を起こすストレプトマイシンなどほかのアミノ配糖体抗生物質とは異なる。

近年、自然界において耐性菌の発生が問題になってきた。筆者らは人工培地上で得た自然淘汰耐性菌株を用いて調べた結果、その耐性機構はリボゾームの本抗生物質に対する感受性の差によるものと考えた。

## 3 シクロヘキシミド

本抗生物質はストレプトマイシン生産時の副産物としてストレプトマイシン生産菌株の培養液から発見されたものである。多くの糸状菌に対して広い抗菌スペクトルを有し、抗原虫、抗ウイルス、制ガン作用も認められている。高等植物に対して著しい葉害を示すので、農業用殺菌剤としては使用範囲が限定され、使用量はかなり少ないようである。現在ではネズミの忌避剤として使用されている。

一般に、糸状菌に対して1ppm以下で抗菌力を示し、タマネギのべと病やマツの先枯病には2~3ppmで顕著な防除効果を示す。

作用点が幾つか報告され、最も顕著に作用している部位として、タンパク合成、RNA、DNA合成が挙げられる。しかしながら、*Saccaromyces carlsbergensis* に対して、生育阻害最低濃度 (0.5~1 µg/ml) で完全にタンパク合成を抑制し、核酸合成に対する阻害は比較的低いことから、タンパク合成系に対する作用が重要視された<sup>29)</sup>。その後ウサギの網状赤血球を用いた実験から、本抗生物質はペプチジル tRNA の Acceptoh (Aminoacyl) site から Donor (Peptidyl) site への転移を阻止すること、TF-II 依存性ペプチジル tRNA の転位反応、deacylated tRNA のリボゾームからの遊離<sup>30,31)</sup>、リボゾームの分解及び再構成などを阻害することが分かった<sup>32)</sup>。更に、本抗生物質は特異的に80Sリボゾームの60Sサブユニットに作用し、ペプチド鎖の伸長における転位反応を主として阻害するものと思われる<sup>33)</sup>。

## 4 グリゼオフルビン

農業用抗生物質の中で、最も古い抗生物質である。BRIAN らは1946年ごろに処理菌の菌糸が異常に湾曲伸長することから Curling factor と名付けた。その程度が薬剤濃度と相関することから、ある程度の定量に用いられている。処理濃度を高めると、菌糸の先端が異常分岐、短縮、膨化など異常生育が認められる。更に、処理菌糸の先端が多核になり核の異常が認められる。水虫の治療剤としてよく使用されている。農業としてはウリ類のつる枯病、リンゴのモニリア病などに効果が認められている。本物質は一時キチンを細胞壁の主要成分とする糸状菌の生育を抑制し、セルロースを主成分とする糸状菌

類、例えば卵菌類に効果が低いことから、キチン合成阻害作用を有するものと推定された。しかしながら、キチンを含む菌で感受性の低いものもあり、電顕観察でははっきりした異常が認められないこと、更にボトリチス属菌やトリコファイトン属菌を用いて調べた結果、細胞成分である RNA, DNA, タンパク、脂質、キチン及び全炭水化物の含量には影響が認められないことが分かった。HUBER ら (1968) は *Botrytis cinerea* に  $^{14}\text{C}$ -グリシンや  $^{14}\text{C}$ -グルコースを取り込ませた際、本抗生物質の処理によって、DNA 分画中に放射能が増加しこれが処理時間に伴い大きくなることを認めた<sup>34)</sup>。これは DNA 合成を促進することを示すものである。1972 年 CRACKOWER によって本剤が *Alternaria nidulans* の有糸核分裂に際して紡錘体に損傷を与えることが見いだされた<sup>35)</sup>。したがって、現在では、細胞分裂に対する阻害が本抗生物質の第 1 次作用点として有力な結論と思われる。

### 5 ポリオキシン

本抗生物質には構造的に類似する 13 の有効成分 A~M が含まれている。これらは多くの植物病原菌の生育を抑制し、D, E, F 成分はイネ紋枯病菌をはじめ、イネいもち病菌、イネごま葉枯病菌などの生育を抑制する。A, B, G, H は特異的にナン黒斑病菌、カラマツ先枯病菌、トマト葉かび病菌の生育を抑制する。L 成分はリンゴの斑点落葉病に対して防除効果を示す。

一般に、胞子の発芽に対する抑制力は極めて低いが、処理菌糸の先端が 1 ppm 以上の薬液と接触すると球状に膨化し、胞子の長径の 2~3 倍にも達する。このことからヒントを得て、佐々木らはイネごま葉枯病菌を用い、 $^{14}\text{C}$ -グルコサミンの取り込みを調べた結果、キチン区分への取り込みが著しく抑制されることが判明した。これに対して、呼吸系、タンパク合成系、脂質合成系及び核酸合成系には全く影響はなかった<sup>36)</sup>。

その後、ポリオキシン添加による培養液中の変化を調べたところ、ポリオキシン感性菌ではポリオキシン処理によって UDP-N-アセチルグルコサミンが多量に蓄積することが判明した。このことから、ENDO ら (1970) は *Neurospora crassa* から得たキチン合成酵素 (chitin synthetase) が著しくポリオキシンによって阻害を受け、その阻害は UDP-N-アセチルグルコサミンと競合的であることを明らかにした<sup>37)</sup>。その後、イネいもち病菌、ナン黒斑病菌についても同様の結果が得られた。しかしながら、ポリオキシン感受性の極めて低い酵母類から得たキチン合成酵素も同様にポリオキシンによって、その活性が阻害される。これは多くの非感性菌ではポリオキ

シンの細胞内への取り込み能力が低いところに原因があると考えられた<sup>38,39)</sup>。

1971 年鳥取県で、ポリオキシン耐性のナン黒斑病菌が発生して問題になった。これらの耐性菌株を普通の感性菌株と比較してみると、明らかにキチン区分へのグルコサミンの取り込みに対する阻害及び菌体内でのポリオキシン処理による UDP-N-アセチルグルコサミンの蓄積の程度は、耐性度と相関する傾向が認められ、ポリオキシンの作用点がキチン合成系の阻害にあることを裏付けるものである。更に耐性菌株から得たキチン合成酵素のポリオキシンに対する感受性は感性菌株由来のものとは変わらず、耐性菌株における不活化酵素あるいは因子の存在も認められないこと、 $^{14}\text{C}$ -グルコサミンの細胞内への取り込みは、耐性菌株は感性菌株に比して少ないことなどから、耐性菌の耐性機構は細胞膜のポリオキシン透過性の違いによるものと考えられた<sup>40)</sup>。

三谷ら (1968) によれば、グリシルグリシンなどのようなジペプチドはポリオキシン B, D のイネ紋枯病菌に対する阻害作用と拮抗することが認められた<sup>41)</sup>。続いて、堀ら (1977) は、更に詳しく検討した結果、グリシロイシンほか幾つかのジペプチドの添加によって、ポリオキシンの菌体への取り込みが、いずれも著しく低下することを認めた。これらの拮抗作用は競合的で、両者の菌体内への取り込みは、ともに EDTA, ラウリル硫酸ナトリウム、数種の代謝阻害剤、金属イオン、pH などによって同じ影響を受けることから、両者の透過は同じ経路によるものと推定された<sup>42)</sup>。

### 6 バリダマイシン

現在、イネ紋枯病防除用抗生物質剤の一つで、優れたは場効果を示している。A と B の二つの活性成分が分離されている。植物病害防除効果は、A 成分がはるかに優れている。そのほか、活性の極めて低い微量成分で C, D, E, F が分離された。本抗生物質は、人工培地上での抗菌力は極めて低く、バリダマイシン A によって菌糸に形態学的には顕著な変化は認められないが、菌糸節間の短縮と分岐角度がやや拡大することから、一見菌叢が無処理に比べて密になったような傾向が認められた。更に、バリダマイシン処理の菌糸は病原性を失うことはもちろんであるが、菌糸の基部にバリダマイシンを処理すると、先端は植物体に対して病原性を発揮しないことが認められた。このように、人工培地上でははっきりした抗菌性を示さない本抗生物質の生化学的作用機構を調べることは極めて困難である。若江ら (1974) はバリダマイシンの化学構造中にイノシトールの構造に近い部分が含まれることから、イノシトールの代謝に注目して実験

を進めた結果、次のような現象を認めた。すなわち、*Rhizoctonia solani* の培養液中にバリダマイシンAを加えるとイノシトールの生成が著しく抑制される。更に、紋枯病菌の菌叢の縁にあらかじめ 0.1 ppm イノシトールを処理したキュウリの種子を3日間放置し、発芽率を調べた結果、バリダマイシンAによって失われた病原性はイノシトールによって回復し、その回復の度合はバリダマイシンの濃度に相関する<sup>43)</sup>。

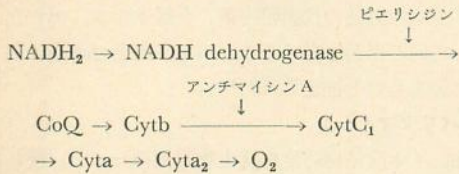
### III その他の抗生物質

#### 1 殺虫性抗生物質

現在、殺虫性を持つ抗生物質は幾つかあるがそれらは、まだ実用には至っていない。その作用機構について、簡単に述べたいと思う。

アンチマイシンAは、殺菌性物質として発見され、我が国でも Blastmycin, Antipiriculin として開発されたものである。一時イネいもち病に対して優れた防除効果を示したが魚毒が高く、実用されなかった。殺虫性や殺ダニ性は極めて高い。本抗生物質は電子伝達系阻害剤として有名であり、チトクローム b と c の間のいわゆる Slaterfactor を特異的に抑制する<sup>44,45)</sup>。

次に、ピエリシジンの作用点についてロテノンと対比して調べた結果、両者は類似して NADH 酸化酵素を特異的に抑制する。これらの作用点を下図に示す<sup>46)</sup>。



#### 2 殺草性抗生物質

緑色植物に対して薬害を生ずるものは除草剤としての可能性を持っているが、現在使用されているものにアノマイシンがある。本抗生物質は、前述のシクロヘキシミドに作用機構が類似して、タンパク合成系においてペプチド鎖伸長とペプチド合成の終了の二つの段階の過程に著しく作用することが知られている。

### おわりに

抗生物質に限らず、一般に薬剤の作用機構には、本来の阻害剤としての作用機構と防除薬剤としての作用機構の両面が含まれている。すなわち、薬剤と病原の試験管内での接触において、生化学的・形態学的に与える影響と植物体上で病原菌の発病に薬剤がどのように干渉するかである。従来、この研究は前にも述べたとおり、独立して行われてきたが、本来は終始一貫したものでなければ

ならない。また、薬剤の作用機構の研究は選択毒性を念頭に入れて行われるべきである。すなわち、形態学的に影響を受ける病原菌の系統、レース、種類などには、細胞内代謝における作用点との間に質的、量的に相関がなければならない。もちろん、このことは化学構造における相関性をも含まなければならない。このように、作用機構の研究は薬剤の病原菌、宿主その両者に対する様様な影響を求め、その中で、最も病原菌の生育を抑制し、発病を抑制する原因を知ることによって、新しい薬剤の開発、人類の経済性に合う使用法などの基礎知識として人類の福祉に寄与する学問である。今後、一層の発展を期待したい。

### 引用文献

- 1) DUBIN, D. T. et al. (1963) : Biochim. Biophys. Acta 74 : 476~489.
- 2) LUZZATTO, L. D. et al. (1968) : Proc. Natl. Acad. Sci. 60 : 873~880.
- 3) CHANG, F. N. et al. (1972) : Antimicrobiol. Agents Chemotherapy 2 : 308~319.
- 4) MODOLELL, J. et al. (1970) : Proc. Natl. Acad. Sci. 67 : 1148~1155.
- 5) DAVIS, J. et al. (1966) : J. Mol. Biol. 8 : 48~57.
- 6) CASKEY, C. T. et al. (1971) : Proc. Natl. Acad. Sci. 68 : 3163~3167.
- 7) KAJI, H. et al. (1965) : ibid. 54 : 213~218.
- 8) VAZQUEZ, D. et al. (1967) : Biochim. Biophys. Acta 142 : 155~173.
- 9) FERNANDEZ-MUNOZ, R. et al. (1971) : Eur. J. Biochem. 23 : 185~193.
- 10) BALLESTA, J. P. G. et al. (1971) : FEBS Lett. 19 : 75~78, 79~82.
- 11) VOGEL, Z. et al. (1971) : J. Mol. Biol. 60 : 339~346.
- 12) 石家達爾ら (1967) : 日植病報 33 : 267~275.
- 13) CONNAMACHER, R. H. et al. (1967) : Biochem. Biophys. Res. Comm. 20 : 98~103.
- 14) GOTTESMAN, M. (1967) : J. Biol. Chem. 242 : 5564~5571.
- 15) SARKAR, S. (1968) : Proc. Natl. Acad. Sci. 60 : 1479~1486.
- 16) 脇本 哲ら (1967) : 日植病報 33 : 112 (講要).
- 17) 沖本陽一郎ら (1963) : 同上 28 : 250~257.
- 18) YONEYAMA, K. et al. (1978) : J. Antibiotics. 31 : 1065.
- 19) TANAKA, T. et al. (1968) : Agr. Biol. Chem. 32 : 100~103.
- 20) 見里朝正ら (1961) : 日植病報 26 : 19~24, 25~30.
- 21) HUANG, K. T. et al. (1964) : J. Antibiotics, Ser. A 17 : 65~70, 71.
- 22) HASHIMOTO, K. et al. (1965) : ibid. A 18 : 77~81.

- 23) 橋本研介ら (1963) : 農化 37 : 245~250, 251~254.  
 24) 黄 耿堂ら (1969) : Radioisotopes 18 : 371~375.  
 25) YAMAGUCHI, H. et al. (1966) : J. Biochemistry (Tokyo) 60 : 632~642.  
 26) COUTSOGEPOULOS, C. (1967) : Biochemistry 6 : 1704~1711.  
 27) YUKIOKA, M. et al. (1975) : Biochim. Biophys. Acta 390 : 192~208.  
 28) TANAKA, N. et al. (1966) : J. Biochemistry (Tokyo) 60 : 429~434.  
 29) KERRIDGE, D. (1958) : J. Gen. Microbiol. 19 : 497~506.  
 30) MC KEEHAN, W. et al. (1969) : Biochem. Biophys. Res. Comm. 36 : 625~630.  
 31) OBRIG, T. G. et al. (1971) : J. Biol. Chem. 246 : 174~181.  
 32) GODCHAUX, W. et al. (1967) : J. Mol. Biol. 27 : 57~72.  
 33) Rao, S. S. et al. (1967) : Biochem. Biophys. Res. Comm. 29 : 696~704.  
 34) HUBER, F. M. et al. (1968) : Can. J. Microbiol. 14 : 111~118.  
 35) CRACKOWER, S. H. B. (1972) : ibid. 18 : 683~687.  
 36) 佐々木茂樹ら (1968) : 農化 42 : 633~638.  
 37) ENDO, A. et al. (1970) : J. Bacteriol. 104 : 189~196.  
 38) BARTNIKI-GARCIA et al. (1972) : J. Gen. Microbiol. 71 : 301~309.  
 39) KELLER, F. A. et al. (1971) : J. Biol. Chem. 246 : 160~173.  
 40) HORI, M. et al. (1974) : Agr. Biol. Chem. 38 : 691~698, 699~705.  
 41) MITANI, M. et al. (1968) : J. Antibiotics 21 : 492~496.  
 42) HORI, M. et al. (1977) J. Pesticide Sci. 2 : 139~149.  
 43) WAKAE, O. et al. (1975) : Proc. Ist International Congr. IAMS 3 : 620~627.  
 44) POTTER, W. R. et al. (1952) : J. Biol. Chem. 194 : 287~297.  
 45) 原田雄二郎ら (1959) : 日植病報 24 : 255~264.  
 46) HALL, C. et al. (1966) : Biochem. Biophys. Res. Comm. 25 : 373~377.

本会発行図書

野菜のアブラムシ

宇都宮大学農学部教授 田中正著

1,800円 送料160円

A5判 口絵カラー写真 4ページ, 本文 220ページ 上製本 カバー付き

野菜のアブラムシについて関係事項をすべてとりまとめた手引書

内容目次

- |                         |  |
|-------------------------|--|
| 第I章 概説                  | 第VII章 被害                                     |
| 第II章 形態                 | 被害の様相 口器 植物ウイルス病の媒介                          |
| 体色 体形 頭部 胸部 腹部 変異 幼虫    | 第VIII章 防除                                    |
| 分類や同定上の注意               | 農業的防除 物理的防除 殺虫剤による防除                         |
| 第III章 分類                | 第IX章 発生予察                                    |
| アブラムシ群 カサアブラムシ・フィロキセラ群  | 有翅型の飛来調査 寄主選択性の差異の利用                         |
| 第IV章 生活史                | 統計的予察法 採集と標本作製法                              |
| 生活型 寄主範囲 生活史 越冬 両性個体の出現 | 第X章 野菜のアブラムシの種類とその見分け方, 生活史, 防除              |
| 第V章 生態                  | 果菜類(マメ類など) 葉菜類(アブラナ科野菜など) 根菜類(ダイコンなど)        |
| 有翅型 両性個体の生態 個体群の変動      | 主要参考文献                                       |
| 第VI章 天敵                 | 索引(アブラムシの和名, 昆虫・動物名, 植物名, 植物ウイルス病名, 術語, 農薬名) |
| 捕食虫 寄生虫 微生物 天敵の相互関係     |  |
| 天敵利用をとり入れた総合防除          |  |

お申込みは前金(現金・振替・小為替)で本会へ

## イネ病害防除剤の作用機構

農林水産省農業技術研究所 <sup>うえ</sup>上 <sup>すぎ</sup>杉 <sup>やす</sup>康 <sup>ひこ</sup>彦

## はじめに

いうまでもなくイネは我が国で古くから最も重要な作物であるのみならず、世界的に見ても最大の作物といえる。イネの生育には特に水の必要性が高く、また、生育適温も比較的高い。そのような条件は必然的に病原菌の生育にも好適であり、したがって、その病害防除剤の必要性は世界的に認識されて研究されているのが現況である。

昭和 28 年ごろから始められた有機水銀剤散布によるいもち病防除はまさに画期的であり、当時の食糧欠乏を解決した一大要因であるが、それは単にいもち病による減産防止だけでなく、栽培の自由度を増した点で積極的な意義を持っていた。また、それはいもち病のみならず、他の病害に対しても副次的な防除効果を持っていたものと思われる。その後、非水銀系殺菌剤の開発が行われると同時に、水俣病事件などをきっかけとして水銀の環境への悪影響が認識されるようになり、非水銀剤への転換が行われた。これら非水銀剤は人畜に低毒性であり、環境への悪影響を避けていて対象病害には特効的なのであるが、ここではそれらイネ病害防除剤のうち、ブラストサイジンS、カスガマイシン、バリダマイシンなど抗生物質を除いた薬剤について、その作用の特徴やメカニズムを述べ、薬剤を使う場合の御参考に供したい。

## I いもち病防除剤

有機水銀剤が病気の進展段階、イネの生育段階などに関係なく防除効果を表す傾向が強かったのに対し、非水銀系の防除剤はこれらの条件により微妙に効果の現れ方が異なる点は特筆すべきであろう。一般に抗生物質剤のブラストサイジンSやカスガマイシンが治療的に散布したほうが効果が良く、予防効果が期待できないことと比較すれば、ここで述べる合成剤は多かれ少なかれ予防効果を持つ点は対照的である。

## 1 有機リン殺菌剤

このグループの最初のもは昭和 38 年ごろから実用された EBP(キタジン)であったが、ほとんど同時に開発された EDDP(edifenphos)をはじめ、各社競い合って開発した ESBP(イネジン)、ESTP(イネジンT)、BEBP(コーネン)、MHCP(セレジン)などが登録され

て一部実用された。現在ではジエチル体である EBP のジイソプロピル同族体の IBP と EDDP の 2 薬剤のみが使用されている。

上記の諸薬剤はすべて化学構造がチオールリン酸エステル、すなわち  $O=P-S-C$  結合、となっている点が共通であって、有機リン殺虫剤の多くのものがチオノリン酸エステル構造、すなわち  $S=P-O-C$  結合、となっているのと対照的である。したがって、このチオールリン酸エステル構造が薬理上重要な意味を持っていることは容易に想像できる。最近、チオールリン酸エステルではない有機リン殺菌剤のホスダイフェンが開発されて、カスガマイシンとの混合剤として使われたしたが、化学構造から見るとホスダイフェンの作用機構は恐らくチオールリン酸エステルとは異なっているのではないかと推定される。そのほか海外では pyrazophos のようにチオノ型の有機リン殺菌剤も開発されているが、ここでは、我が国で圧倒的に使用量の多いチオールリン酸エステル型の薬剤(以下 PTL 剤と略称する)について述べたい。

PTL 剤の一般的な作用性としては、治療的な効果も予防的な効果も併せ持っている。実験室的な試験でもち病菌の分生孢子発芽段階も良く阻害するし、寒天培地上や液体培地中での菌糸生育も良く阻害する。また、いもち病以外の病害に対する防除効果もある程度認められ、紋枯病、小粒菌核病(以上 IBP 及び EDDP)、ごま葉枯病菌による穂枯れ(EDDP)などにも効果を示す。

IBP と EDDP とは基本的な作用では共通していても、細かい点ではかなりの相違が見られる。IBP のほうが水に対する溶解度が高く(筆者の経験では 100 ppm 程度)、また、水溶液中でもかなり安定で、蒸留水中に溶解し常温に数日間放置してもほとんど分解が認められない。蒸気圧も比較的高く、ほ場では蒸気によって効果を発揮している面もあるのではないと思われる。筆者の研究室の経験でも、温室を使ったイネ苗によるいもち病防除試験で、IBP 散布イネ苗を入れた温室中に並べて置いた無散布イネ苗上のいもち病発病も抑制されがちであるので、試験には注意が必要であったほどである。以上のような IBP の性質は原体価格の比較的低廉な有利性ととも水面施用剤として好適な性質を示している。

一方、EDDP はそれに比較すると水に対する溶解度

は小さく (5 ppm 程度)、常温水溶液中数日間である程度の分解が認められる。したがって、実用上、EDDP の場合は特に乳剤を水で希釈後は直ちに散布したほうがよい。また、蒸気圧もそれほど高くないようである。菌体を薬剤溶液中に入れた場合、EDDP のほうが IBP より高率に菌体に集積する傾向があり、試験管内の試験でも低い薬量で高い抗菌活性を示す。水溶性や、水中での安定性の低いこと及び原体価格が比較的高いことから水面施用剤としては不適であるが、茎葉散布では微量散布などでも良い防除効果を示す。

PTL 剤の作用機構については多くの研究成果があるにもかかわらず、最終的な結論は得られていない。

MAEDA ら (1970) は生菌体を用い、グルコサミンからキチンへの生合成が IBP 50 ppm によって阻害されその生合成中間体の UDP-N-アセチルグルコサミンが蓄積することを観察したが、これはむしろ二次的な影響であって、細胞膜機能への影響が作用点である可能性があり、それによってキチン合成前駆体が膜外にキチンとして合成されることを妨げていると推察している。この説はオランダの DE WAARD (1972, 1974) の EDDP 及び IBP による細胞膜機能阻害の実験によって支持された。最近、MISATO ら (1977) は菌体から抽出した chitin synthetase 標品を用いた実験で、IBP 関連化合物の同酵素阻害を報告している。その  $I_{50}$  値 (50% 阻害の薬剤濃度) は IBP の場合 75 ppm で生育阻止濃度 (報告されている値は 5~30 ppm の範囲) よりやや高い程度であるが、EBP (生育阻止濃度は IBP と大差ない) の  $I_{50}$  値が 260 ppm と、かなり高い値であるので、PTL 剤の一般的な作用機構としてキチン合成の直接的な阻害は考えにくい。

最近、AKATSUKA ら (1977) はいもち病菌体のリン脂質合成系のうち、ホスファチジルエタノールアミンから S-アデノシルメチオニンによりホスファチジルコリン (レシチン) が生成する過程 (Greenberg 回路と呼んでいる) を 50 ppm IBP が 70~80% 阻害することを見いだしており、殺菌作用機構の一つとして提唱している。

一方、筆者らの研究室では、野生型 いもち病菌 (W 菌) 胞子の実験室内淘汰により PTL 剤耐性変異菌 (PTL-R 菌) を得て、これを用いて種々の実験を行っている。ある PTL 剤で淘汰して得た耐性菌はほかの PTL 剤にも耐性である。交差耐性の範囲を求めるために種々のリン化合物について試験した結果、PTL-R 菌は N-メチル-N-フェニルホスホアミド酸エステル類 (以下 PA と略称する) に対して特異的に感受性が高く、いわゆる負相関交差耐性の現象を示すことが分かっ

た。更に、PA 剤と PTL 剤の作用の関連を見るために、両剤の連合作用を調べた結果、W 菌に対しては殺菌協力作用が見られたが PTL-R 菌に対してはそれが観察されなかった。PTL-R 菌の胞子を PA 剤で淘汰すると復帰変異 (back-mutation, reversion) が起こっていると思われる菌株、すなわち W 菌と差のない菌が得られた。W 菌から PTL-R 菌への変異の際及びその復帰変異の際に、PTL, PA 両剤に耐性の菌が得られてもよいはずと思われるが、それは全く得られていないので、PTL 耐性と PA 感受性は恐らく一つの遺伝子、一つの生化学的メカニズムにより支配されていると思われる。耐性メカニズムの手掛かりをつかむために菌による薬剤代謝を追求した結果、PTL 代謝速度はごく低薬量の場合には W 菌と PTL-R 菌の間に大差が見られないが、菌体量に対する薬量を致死薬量付近にした場合には大差が見られ、W 菌のほうが PTL-R 菌より代謝が速い。両菌による PTL 代謝は主に P-S-C 結合の開裂で、生成物は殺菌力がないので解毒と見られ、この解毒が PTL 感受性の高い W 菌で大きい点はなんとも不思議な結果であって、この点からは耐性メカニズムは全く説明できない。一方、PA 代謝を調べた結果、その大部分は解毒と見られるヒドロキシル化と一部は脱メチル化であって、この場合も W 菌のほうが代謝が速い。この場合には PTL-R 菌において PA 感受性の高いメカニズムとして PA 解毒の減少が挙げられる。W 菌における PA 代謝は初濃度 60 ppm の IBP で 60~70% 阻害され、これが W 菌における PA と PTL の殺菌協力作用のメカニズムであろうと思われた (UESUGI ら, 1978 a)。また、PA 代謝酵素系が本来菌の生理に重要な役割を持っていた場合には、PTL-R 菌の耐性メカニズムは、作用点であるその酵素自体の変異 (これは PA 代謝能低下でも明らか) によると思われる。しかし、PA 代謝酵素の菌体における本来の意義はまだ明らかでないので、この PTL の殺菌メカニズムや耐性メカニズムは仮説の段階にとどまる。

PA 代謝が IBP により阻害されると同時に、程度は軽い IBP 代謝も PA により阻害され、更に、両代謝とも mfo 阻害剤のピペロニルブトキッドなどで阻害されるので、PTL が PA の mfo による代謝の阻害剤らしいことが最近分かった (UESUGI ら, 1978 b)。

これら耐性菌研究から分かった諸事実と、リン脂質生合成阻害との関連の有無はまだ不明であるが、いずれにせよ、mfo 関連の酵素系も脂質代謝と関連していることが多いので、リン脂質生合成阻害作用とも考え合わせると、PTL 剤が脂質代謝の阻害剤として作用している可

能性が高く、これが更に脂質の役割が大きい細胞膜機能の失調と関連することも考えられることである。

なお、ここで一つ付言しておきたいことは、最近ほ場で PTL 剤耐性菌が分離されているが、これらをよく調べて見ると、室内で獲得した PTL-R 菌と類似のものもあるが、大多数はそれとは異なっており、PTL 代謝能が通常菌より更に高まっているためであると思われる。この場合の耐性メカニズムは解毒の増大が挙げられるが、そのほか、上述したように PTL 代謝系そのものが PTL の作用点であるならば、作用点の変異(例えば酵素量の増大)も耐性メカニズムである可能性がある。

PTL 剤のいもち病菌に対するもう一つの作用は、菌糸細胞内のアミダーゼ阻害である(赤塚ら, 1975)。その  $I_{50}$  は IBP で約  $10^{-4}M$ (約 30 ppm), EDDP は約  $10^{-6}M$ (約 0.3 ppm) であるが、いもち病菌のアミダーゼの本来の生理的意義もまだ明らかでない。

PTL 剤は菌に対する作用のほか、高等植物や昆虫に対して特異な作用を持つことがある。除草剤 DCPA (propanil) はイネのアミダーゼによって解毒されるので、イネを殺さずに DCPA アミダーゼ活性の低い雑草を防除するが、有機リン化合物、特に PTL 型の化合物はこのアミダーゼの阻害剤であり(赤塚, 1973)、PTL 剤と DCPA を同時に散布するとイネに対して薬害を生ずるので注意しなければならない。また、最近、マラソンや PAP (phenthoate) に抵抗性のツマグロヨコバイに対して、PTL 剤を混用することによって殺虫効力が回復することが見いだされ、実用場面で応用されている。しかし、これらの組み合わせはいもち病菌に対する PTL 剤の効力を低下させることが筆者らの実験で既に分かっており(Uesugi ら, 1974)、同じ組み合わせが、殺虫作用では協力的、殺菌作用では拮抗的となっている点は興味深く、また、実用上も注意しなければならない。これらの理由はまだよく分かっていない。

## 2 イソプロチオラン

本剤の効果の特徴は効果の持続性とイネ体への浸透移行性にあると言われ、水面施用剤としての使用が多い。寒天培地上でのいもち病菌に対する最低生育阻止濃度は 15~20 ppm であるが、もっと低い濃度でも生育遅延をもたらし、イネ体への菌糸の侵入は 2 ppm でも阻止すると言われる(Araki ら, 1976)。下墜ら(1977)はメチオニンの S-メチル基のリン脂質への取り込みを本剤 5 ppm が 70% 近く阻害することを報告している。KATAGIRI ら(1977)は、*in vitro* 淘汰で本剤耐性菌を得たところ、この菌は PTL 剤にも交差耐性であって PA 剤には特異的に感受性が高く、また、実験室的に得

た PTL 耐性菌も本剤に交差耐性であった。野生型菌では本剤と PA 剤の殺菌協力作用も見られるので、本剤と PTL 剤の間には薬理上かなりの類似性が推察できる。事実、上記下墜らの観察と同様のことを赤塚らが PTL 剤について報告していることは前述のとおりである。更に、野生型菌による PA 代謝は本剤 20 ppm でほとんど完全に阻害され、IBP の場合より強いくらいであった(Uesugi ら, 1978 a)。マウス肝の p-ニトロアニソールの O-脱メチル化などの薬物代謝活性が本剤投与により低下するが、投与開始一定時間後にはその代謝活性が増大した実験結果(桜井ら, 1977)が報告されているが、薬物代謝活性の阻害と誘導とが相次いで起こる mfo 阻害剤によく見られる現象のように思われる。いもち病菌の PA 代謝(ヒドロキシル化と N-脱メチル化は mfo の反応としてよく見られる)の阻害とも考え合わせると興味深い。

本剤はウンカ類に対し生育抑制作用を示すと言われるが、その作用の詳細なメカニズムはまだ分かっていない。

## 3 有機塩素殺菌剤

昭和 41 年に開発されたいもち病剤の PCBA (プラスチック) は、殺菌力が全くないのにイネに散布すると優れたいもち病防除効果を示した。PCMN (オリゾン) や CBA (ミノコール) なども相次いで開発され、類似の作用を示した。しかし、これらを散布後、わら中に残存する代謝分解物が、堆肥や敷きわらなどを通じて二次的に野菜などに生育障害を起こすことが明らかとなり、製造中止のやむなきに至った。その後、フサライドが開発され、残留障害試験を経て、実用化されている。

これらの薬剤はいずれも予防的な効果が強く、発病してから散布では効果を発揮しない。奥ら(1968)によると PCBA のいもち病防除作用は胞子が発芽後イネ体内に侵入する段階を強く阻止することにあるという。セロファン穿孔法で調べた結果では、PCBA による人工膜穿孔阻害はいもち病菌では観察されるが、イネごま葉枯病菌やカンキツ黒腐病菌では観察されず、PCBA がいもち病菌にのみ有効である事実と一致する。このように PCBA は菌に作用して病原力を奪うと思われるが、その作用はセルロース分解酵素活性あるいは同酵素生成の阻害ではない。しかし、詳細のメカニズムは分かっていない。

PCBA からベンタクロロ安息香酸を経て生成したと思われる PCP が薄層クロマトグラフ法で発色法により検出したと報告され、PCP が病害防除作用を行うのではないかとの説も出されているが、いもち病菌にのみ効



くという選択性を説明できるデータは提出されておらず、その後、PCBAの二次的薬害問題で各所で行われたPCBA分解物のイネ体内残留調査でPCPは再確認されるには至っていないようである。

フサライドの作用はPCBAと類似していて、菌のイネ体への侵入阻止が主体である(石田ら, 1975)。なお、そのほかに、孢子発芽後の付着器形成の抑制や孢子形成の抑制も見られると言われる。

PCBAはイネ体内で酸化を受けて、ペンタクロロ安息香酸となるが、一部は還元的脱塩素化もされてテトラクロロ安息香酸になる(Ishidaら, 1969)。ペンタクロロ安息香酸は野菜などの生育に障害を起こすが、2,3,5,6-テトラクロロ安息香酸は更にその性質が強い。このような物質が前述の2次障害の原因である。フサライドの場合にはこれらほど障害が強い分解物は生成しないが、数多い分解物のうち、4,6,7-トリクロロフタリドや4,7-ジクロロフタリドはある程度薬害発現の要素を持っている。しかし、過度の散布をしない限り、十分に病害防除効果が上がる範囲で薬害の恐れはない。

#### 4 プロベナゾール

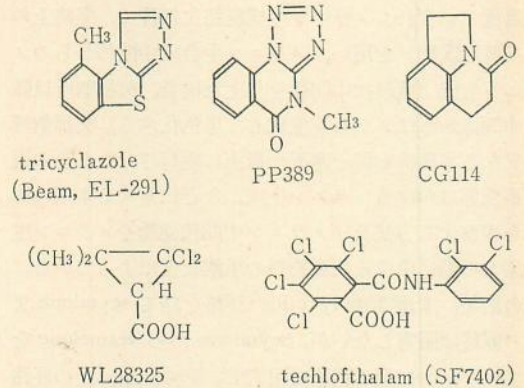
水面施用剤として予防的なイネいもち病防除効果が優れている。この薬剤も培地上での殺菌力は弱く、最低生育阻止濃度は800 ppm程度である。孢子発芽に対してはそれより強い影響があり、スライドグラス上33 ppmで約50%阻止する。また、イネ葉鞘への菌糸侵入は10 ppmで阻止し、イネ体での孢子形成も阻止する。本剤施用イネにいもち病菌を接種するとパーオキシダーゼ活性が高まり、ちょうどいもち病に対し抵抗性品種のイネが呈する反応を見せるという(Watanabeら, 1979)。これらの作用がいもち病防除作用に関連していると思われるがそれ以上に詳細なメカニズムは不明である。後述するように、本剤は細菌によって起こるイネ白葉枯病に対しても防除効果を発揮するのは大変に興味深い。

本剤はイネ体上で代謝され、サッカリン及びそのグルコシドとして残留する(Uchiyamaら, 1973)。サッカリン自体もいもち病防除効果があるが、イネ体外部から施用する限りではプロベナゾールよりは効果が低い。

#### 5 その他のいもち病防除剤

最近外国企業によるイネいもち病防除剤の開発が盛んになっている。しかもそれらが非殺菌性防除剤である点は注目すべきであろう。

Shell社によって開発されたWL 28325(右図)は元来ガソリン添加剤として合成されたものと言われるが、イネに散布しておくといもち病感染時にイネのファイトアレキシンと考えられるモミラク톤の生成量を増大す



開発段階にある非殺菌性イネ病害防除剤の化学構造

るといわれる(Cartwrightら, 1977)。

Eli Lilly社によって開発されたtricyclazole(上図)は我が国でも試験がかなり進んで実用化寸前にある。その作用機構に関する我が国の研究では、イネに抗菌物質を生成させるとの説、菌の核酸合成系を阻害するとの説(米山ら, 1978)とがあり、更に、イネ体上での孢子形成阻止効果が強いこととその孢子の病原力が弱いことから二次感染阻止効果も優れている(奈須田ら, 1978)とも言われる。

tricyclazoleは直接的な殺菌力はほとんどないが、1 ppm以下の低濃度でも菌のメラニン形成が抑制されて褐色の色素を生産することに着目して、アメリカのSISLER一派によって薬理研究が進められている。メラニンも菌のイネに対する毒素pyriculolもpolyketide経路によって生合成されると思われるので、pyriculol生産に対する本剤の影響が調べられたが、本剤によりむしろこの毒素生産は増大していたので病原性低下による防除効果は説明できなかった。その際、同じくpolyketide経路で合成されると思われるDDN(3,4-dihydro-4,8-dihydroxy-1(2H)-naphthalenone)は本剤投与で減少することも分かった(Tokousbalidesら, 1978)。DDNはいもち病菌の毒素として報告されている未同定の物質と一致する可能性があるが、いずれにせよ、本剤による菌の病原性抑制作用の有無については結論が得られていない。

最近来日したSISLERの話によると、その後彼らは、polyketideを経由してメラニン生成に至る経路がよく分かっているVerticillium dahliaeを用いて本剤の影響を追求している。本菌に対するtricyclazoleの影響はいちもち病菌の場合と同じく、メラニン生成を抑えて色素生成をもたらず。実験手法は白色ないし褐色の変異

株数株 (いずれもメラニン生成経路欠損株で、経路上の欠損個所既知) を用い、メラニン生成中間体からのメラニン生成 (菌叢に中間体を与えた場合、欠損個所以降の中間体からはメラニン生成して黒色化する)、欠損個所の異なる2菌株を同一寒天平板上に生育させたときの両菌叢境界におけるメラニン生成、などに対する本剤の影響を観察する方法及びメラニン中間代謝物やメラニン生成阻害の際に生ずる代謝物質の単離などによっている。その結果、本剤は polyketide 経路を経て scytalone までの経路は阻害しないが、scytalone から vermeline を経てメラニンに至る経路を阻害し、その結果、その経路から枝分かれした経路で 2-hydroxyjuglone (黄色色素) や flaviolin (赤色素) の生成を異常に増大するという。この実験結果といもち病防除作用との関連は未知で結論は得られていない。なお、上記類似の経路は高等植物にもあると思われるので、本剤がイネに作用して防除効果を発揮する可能性も考えられよう。

ICI 社の開発した PP 389 (11 ページの図) にも上記同様の現象があると言われ、Ciba Geigy 社の CG-114 (11 ページの図) もイネいもち病防除作用の類似性から見て、いずれも tricyclazole と同じような作用メカニズムではないかと思われる。しかし、WL 28325 には上記の現象はないと言われる。

## II 白葉枯病防除剤

イネ白葉枯病菌は主として葉身内部の導管内で増殖して病気を起こすものであるから、たとえ抗菌力の強い薬剤でも菌の生息場所に到達できないものは防除効果が期待できないと思われる。このような事情から、有機本銀剤、クロラムフェニコール、セロサイジン、フェンチアゾン、ジチオカルバミド酸ニッケル類、フェナジノキシドなど多数の薬剤が使われてきたが、特効的で抜群の防除効果を上げるものは開発されておらず、実際的にも重要病害であるのでその防除剤開発は盛んに行われている。後述するように、いもち病防除剤のプロベナゾールが本病にも有効であることが分かったほか、同じくいもち病防除剤のフサライドと関連あると思われる構造のテクロフタラム (11 ページの図) が直接殺菌力がないのに本病防除作用が強く (中神ら, 1978)、実用化に向かって試験が進んでいるのは興味深い。

### 1 ジメチルジチオカルバミド酸ニッケル

ジチオカルバミド酸塩のうち本剤 (サンケル) とプロピケル (Baykel) とが本病に有効であるが、いずれもニッケル塩であり、なぜニッケル塩のみが本病に有効であるのかは誠に不思議な謎として残されている。

予防的な効果が強く、残効性もある。

### 2 フェナジノキシド

予防的効果と治療的効果を併せ持っている。フェナジノキシド (フェナジン粉剤、同水和剤などの主成分) は還元された形のフェナジンとして菌に作用すると推定され、その作用は菌の呼吸メカニズムを阻害すると思われる。それは、本病菌のチトクローム系を通じて行われる電子伝達系路にフェナジンが側路を作ってしまうことによると思われる (渡辺ら, 1969)。

### 3 プロベナゾール

本剤はいもち病菌に対する場合と同様に、白葉枯病菌に対しても直接的な殺菌力は低いのであるが、イネに散布しておくとう白葉枯病斑拡大阻止効果を示す。育苗箱施用 (移植 1~3 日前が適当) で初期感染を防止し、更に出穂 4 週間前ごろに施用するとかなり高い防除効果があるので、いもち病との同時防除に有利である。しかしながらその作用機構についてはまだよく分かっていない。

## III 紋枯病防除剤

開発が比較的遅れていて、ヒ素剤がかなり使われているほか、IBP や EDDP などの有機リン殺菌剤も本病に効果があるのでいもち病との同時防除を主体に用いられている。最近、抗生物質のバリダマイシンが実用段階に入ったほか、試験段階のモンガード、バンタック、5201、NNF 136 など本病防除剤の開発は目ざましく、かなり特徴ある作用を持つものもありそうなので作用機構の上からも興味深い。

現在用いられているヒ素剤はいずれもメチル基とヒ素が結合した形の有機ヒ素化合物であり、無機ヒ素化合物よりも殺菌力や病害防除力が強いのは生体への浸透力が強いと思われる。これを大きく分けて、化学構造中ヒ素が金属の役割で入っているメチルヒ素塩の場合 (TUZ 剤) と、それとは逆にヒ素が酸化された形のメタンアルソン酸としてほかの金属類やアンモニウムなどとの塩を形成している場合 (ほかの有機ヒ素剤の大部分) とがある。前者の場合、メチルヒ素部分が菌体内酵素の SH 部分などと結合して殺菌作用を表すとされている。後者の場合メタンアルソン酸部分は還元されて前者のような形となって作用すると推定され、したがって直接殺菌力は一般に弱い、メタンアルソン酸を鉄塩とすることにより鉄イオンによる薬害軽減 (高坂ら, 1959) が得られる利点がある。

## IV 苗立枯病防除剤

現在実用されているハイメキサゾールは新規化学反応

の成績体として得られた新規化合物であったが、その骨格であるヒドロキシイソキサゾールはイボテンダケなどから抽出されるイボテン酸にも見いだされて興味深い。本剤はイネ苗立枯病のみならず、テンサイ苗立枯病などにも有効で、イネ紋枯病にもある程度の防除効果が見られ、土壌病害防除剤として特異な存在である。イネ紋枯病菌に対しては細胞膜機能に障害を与えることが報告されており(中西ら, 1972), キュウリつる割病菌を用いた実験では核酸合成阻害及びタンパク合成阻害が報告されている(上村ら, 1976)。試験管内での殺菌力がそれほど高くないのに実際の防除力が優れている点などを考えると、作用機構について今後の研究課題が残されているように思われる。

## V 種子殺菌剤

種もみ消毒剤としてはベノミルに TMTD を配合したベンレート T とチオファネートメチルに TMTD を配合したホーマイとが使われている。馬鹿苗病には菌の有糸細胞分裂を阻害するベノミルまたはチオファネートメチルが有効であるが、それだけではごま葉枯病菌には効果が低いので、非選択的殺菌力の強い TMTD を配合してある。

## おわりに

10 年余りにわたって使われた有機水銀剤から非水銀剤へ転換してから既に 10 年以上経過した。その間に優れた薬剤が開発されており、現在試験段階の候補薬剤にも特徴ある作用を持つものが少なくない。これらを上手に使いこなすためにも、作物、薬剤、病原菌の 3 者間のかかり合いを知っておくことは重要なことと思われる。特に、イネ病害防除剤の中には“殺菌剤”とは呼べないような非殺菌性病害防除剤が開発されていて、その作用を理解するにはイネ菌の関連への薬剤の介入という形で考えなければならなくなっている。また逆に、薬剤の開発によって病害や病原菌の性質が一層明確に詳しく分かってくるきざしも示されている。これらのことは単に我が国のみならず、世界的に重要な課題であり、諸外国においても研究が進んでいるのが最近の状況である。

## 引用文献

- 赤塚尹巳 (1973) : 農業科学 1 : 55~64.  
 ———ら (1975) 農化大会講演要旨 : 17.  
 AKATSUKA, T. et al. (1977) : Agr. Biol. Chem. 41 : 2111~2112.  
 ARAKI, F. et al. (1976) : 日植病報 42 : 401~406.  
 CARTWRIGHT, D. et al. (1977) : Nature 267 : 511~513.  
 ISHIDA, M. et al. (1969) : Residue Rev. 25 : 139~148.  
 石田正臣ら (1975) : 農業科学 3 : 10~26.  
 KATAGIRI, M. et al. (1977) : Phytopathology 67 : 1415~1417.  
 KAMIMURA, S. et al. (1976) : 日植病報 42 : 242~252.  
 高坂津爾ら (1959) : 同上 24 : 15.  
 MAEDA, T. et al. (1970) : Agr. Biol. Chem. 34 : 700~709.  
 MISATO, T. et al. (1977) : Antifungal Compounds, Vol. 2, ed. by M. R. SIEGEL and H. D. SISLER, Marcell Dekker Inc. N. Y. : 277~300.  
 中神和人ら (1978) : 日植病報 44 : 400.  
 中西逸朗ら (1972) : 同上 38 : 204.  
 奈須田和彦ら (1978) : 同上 44 : 403.  
 奥 八郎ら (1968) : 同上 34 : 250~254.  
 桜井 潔ら (1977) : 農業学会大会講演要旨 : 223.  
 下墮正宏ら (1977) : 同上 : 113.  
 TOKOUBALIDES, M. C. et al. (1978) : Pestic Biochem. Physiol. 8 : 26~32.  
 Uchiyama, M. et al. (1973) : Agr. Biol. Chem. 37 : 737~745.  
 UESUGI, Y. et al. (1974) : 日植病報 40 : 252~260.  
 ——— et al. (1978 a) : Pestic. Biochem. Physiol. 9 : 247~254.  
 ——— et al. (1978 b) : Agr. Biol. Chem. 42 : 2181~2183.  
 WAARD, M. A. DE (1972) : Neth. J. Pl. Path. 78 : 186~188.  
 ——— (1974) : Mededelingen Landbougeschool Wageningen 74 (14) : 45~50.  
 渡辺哲郎ら (1969) : 日植病報 35 : 208~217.  
 WATANABE, T. et al. (1979) : J. Pestic. Sci. 4 : 53~59.  
 米山勝美ら (1978) : 日植病報 44 : 403.

# 野菜病害防除剤の作用機構

農林水産省野菜試験場 て  
手 づか  
塚 のぶ  
信 お  
夫

## はじめに

果樹、野菜、花きなど園芸作物の病害に対する防除剤には共通した殺菌剤が使用されている。これらの殺菌剤の種類を作用機構の面から大別すると、ATP を生成させるエネルギー代謝に作用する呼吸阻害剤とタンパク質、核酸、脂質などの合成を阻害する生合成阻害剤がある。銅剤をはじめ古くから使用されている薬剤の多くは呼吸阻害剤であり、あらゆる生物に共通する作用点を有するため非選択性殺菌剤であった。しかし、近年生合成阻害剤の開発が進められ、選択性を示す殺菌剤が多くなっている。中でも治療効果を期待して浸透性のある薬剤の開発が要求されている。そこで現在園芸作物の病害に登録のある薬剤及び開発試験中で実用が期待されている殺菌剤のうち、作用機構がかなり明らかなものについて述べる。農薬全般については既に福永<sup>14)</sup>、鈴木<sup>14)</sup>、Sijpesteijn<sup>14)</sup> などによる詳しい解説があるのでそれを参照されたい。

## I 銅 剤

銅化合物が強い殺菌作用を持つことは古くから知られている。盗難防止に硫酸銅と石灰乳を付けたブドウがたまたまべと病の被害を免れたことが 1882 年発見され、これが端緒となって現在のボルドー液が生まれた。その後、銅剤は殺菌剤として広く使用されるようになった。

生物に対する重金属化合物の毒性は、金属イオンの硫化物の難解離性、水に対する難溶性の程度とよく一致しており、その毒性は生物の-SH との反応によるためである。重金属の硫化物の難解離性の順に並べると  $Hg > Ag > Cu > Pb > Cd > Zn > Fe$  である。これによると銅剤は水銀、銀に次いで生物に対する毒性が一般に強いことになる。

### 1 無機銅剤

無機銅剤にはボルドー液のほかに銅製剤として塩基性硫酸銅、塩基性塩化銅、水酸化第二銅及び塩基性リン酸硫酸銅の製剤がある。ボルドー液は硫酸銅と生石灰の混合液であり、有効成分は塩基性硫酸銅カルシウム  $CuSO_4 \cdot xCu(OH)_2 \cdot yCa(OH)_2 \cdot zH_2O$  である。銅剤は水に不溶性の形で作物上にあつて、雨露などによって徐々に銅イオンを放出し、病原体に浸透して細胞内の-SH 化合物

に作用する。銅剤は治療効果はないが、病原菌の感染を阻止し作物の保護効果を有する。トマト疫病、キュウリ斑点細菌病をはじめ果樹、花きの病害防除に広く使用されている。

### 2 有機銅剤

8-キノリノール銅を有効成分とする、オキシン銅剤 (oxine-copper) がある。銅イオンとオキシン (8-ヒドロキシキノリン) とがキレート結合した化合物である。作用点は銅イオンであるので無機銅と同じであるが、硫酸銅に少量の 8-キノリノールを加えると、銅イオンの菌糸体内への浸透が促進されることから、8-キノリノールが膜の内部にあつて、銅イオンの外部から内部への運搬役をしていると考えられた<sup>47)</sup>。無機銅に比べると薬害が少なく、ウリ類のべと病、トマト疫病など多くの野菜、果樹及び花きの病害防除に使用されている。

このほかイチゴうどんこ病などの防除に使用されている DBEDC 剤があるが、本剤は作物体内への浸透性があると考えられている。

## II 硫 黄 剤

硫黄が殺菌剤として使用されたのは極めて古く、石灰硫黄合剤が使用されたのは 1851 年のことである。

### 1 無機硫黄剤

無機硫黄剤として水和硫黄剤、石灰硫黄合剤 (CaSx) などがあり、硫黄として殺菌効果がある。無機硫黄剤はうどんこ病、さび病などの病原菌に対する殺菌作用だけでなく、ハダニやカイガラムシに対する殺虫作用も持っている。作用機構としては、①硫黄が直接体内の代謝を阻害する。②亜硫酸ガスなどの酸化物が生じて作用する。③還元生成物である硫化水素が作用するなどの説がある。Tweedy ら<sup>49)</sup> は *Monilinia fruticola* の菌体を磨砕し透析したものにおいて、 $NADH_2$  の酸化とチトクロム C の還元が硫黄によって阻害されることを示した。そして硫化水素は反応生成物であり、硫黄が直接作用していると考えた。一方、生成した硫化水素が電子伝達系に作用すると言う説では、 $ADP \rightarrow ATP$  の過程が阻害されて ADP や無機リン酸が集積すると考えられている。野菜のうどんこ病などや果樹病害防除に使用されている。

### 2 ジチオカーバメート剤 (dithiocarbamate)

ジチオカーバメート剤には、①エチレンビスジチオカ

ーバメート剤 (ジネブ, マンネブ, マンゼブ, アンバム, ポリカーバメートなど), ②プロピレンビスジチオカーバメート剤 (プロピネブなど), ③ジメチルジチオカーバメート剤 (チウラム, ジラムなど) がある。これら有機硫黄化合物はいずれも病原菌の—SH に作用し, 呼吸阻害剤として働くと考えられている。野菜, 果樹, 花きの非常に多くの病害防除に使用されている。

#### (1) ジネブ剤 (zineb)

エチレンビスジチオカルバミン酸ナトリウム (ナバム) を改良してその亜鉛塩としたもので, 残効が長く, 葉害も軽減された。作用機構は病原菌体内の重金属酵素をキレートして, 金属欠乏症を起こすとされている。また,  $-N=C=S$  の形となり酵素—SH を阻害すると考えられている。比較的遅効性であるが残効は長い保護殺菌剤である。ウリ類べと病, トマト疫病をはじめ多くの野菜病害, 果樹, 花き病害に使用されている。

ジネブの亜鉛をマンガンに置換した化合物がマンネブ (maneb) である。その性質はジネブに類似しているが, 殺菌力はジネブより強い。

#### (2) マンゼブ剤 (mancozeb)

マンネブに水溶性の亜鉛を反応させたもので, 亜鉛イオン配位マンガニーズエチレンビスジチオカーバメートの形をした化合物である。生物活性はマンネブとジネブの間で, 殺菌効果はマンネブと同程度でジネブより強いが, 葉害はマンネブより軽減している。ジネブとともにウリ類べと病, トマト疫病など多くの野菜, 果樹, 花き病害に適用されている。

#### (3) アンバム剤 (amobam)

ジネブの亜鉛をアンモニウムに置換した化合物である。ジネブより水溶性が高く, 浸透性が高いので直接殺菌力が強い。散布したとき茎葉, 果実などを汚染することがないのが長所である。

#### (4) ポリカーバメート剤 (polycarbamate)

ジネブ及びマンネブの有効成分は巨大分子を作っているが, これを低分子量にしたものであり, 殺菌力はジネブより強く, ジネブと同様に広く使用されている。

#### (5) プロピネブ剤 (propineb)

ジネブのエチレンがプロピレンに置換されている化合物であり, 作用機構もジネブと類似していると考えられている。スイカ炭そ病などの防除に使用されている。

#### (6) チウラム剤 (thiram, TMTD)

本剤の主成分 bis(dimethyldithiocarbamoyl) disulfide は低濃度でイオンとして, 高濃度では分子として作用するので, 薬量反応曲線に二つのピークができる。チウラムの作用点は複数であると考えられており, その一つは

金属酵素である。すなわち, その攻撃される金属を添加すると阻害が回避されることから推察される。一方, グリセルアルデヒド-3-リン酸デヒドロゲナーゼがチウラムによって阻害されるが, システイン, グルタチオンの添加で回復し, また, 6-ホスホグルコン酸デヒドロゲナーゼも本剤によって阻害されるが, システインの添加によって回復する。*Neurospora sitophila* では酢酸からクエン酸の生成が本剤によって強く阻害される。これらのことから, 本剤の重要な作用点の一つに—SH 阻害があると考えられている。本剤はイネの種子消毒に主として使用されてきたが, ニンジン黒葉枯病などにも適用された。

### III 有機塩素剤

#### TPN 剤 (chlorothalonil)

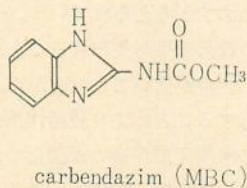
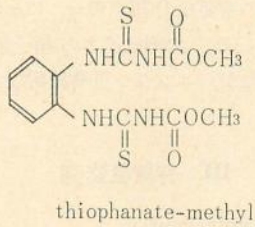
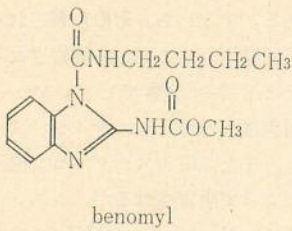
本剤はニトリル基 ( $-CN$ ) が毒性を持ち, —SH に作用して殺菌効果を示すと考えられている。—SH 化合物を添加するとその殺菌効果が失われること, 本剤を処理した菌糸の—SH 含量が低いことなどから, 本剤が細胞内の—SH と反応することにより殺菌作用があると考えられる<sup>49)</sup>。一般に保護作用が強い殺菌剤で, 紫外線に対しても安定であり, 残効性, 耐雨性もある。ウリ類のべと病, トマト疫病をはじめ幅広い抗菌スペクトルを持ち, 野菜, 果樹及び花きの多くの病害防除に使用されている。

### IV ベンズイミダゾール系殺菌剤

#### 1 ベノミル剤 (benomyl)

ベノミルはチアベンダゾール, フリダゾールなどとともにベンズイミダゾール系化合物の浸透性殺菌剤として知られ<sup>50)</sup>, その抗菌スペクトルは非常に広い<sup>9)</sup>。

ベノミルは作物に散布されると加水分解されて MBC (methyl benzimidazole carbamate) になる<sup>51)</sup>。MBC 1 ppm の濃度で *Neurospora crassa* の分生胞子発芽における発芽管の伸長を阻害した。また, そのときタンパク質及び RNA の合成は阻害されないが, DNA 合成は3~4 時間後から阻害され, 8 時間後には 85% 阻害された。*Ustilago maydis* の小生子に対しても, 処理後 1 時間で 50%, 3 時間で 95% の DNA 合成が阻害されたが, RNA 及びタンパク質の合成阻害は遅れる。これらの結果, MBC は DNA 合成または核分裂あるいは細胞分裂のような DNA 合成に密接に関連した過程を阻害すると考えられた<sup>6)</sup>。また, アデニン, グアニンと構造的に類似しているため, プリンを添加すると *Fusarium oxysporum* に対するベノミルの阻害が軽減される<sup>1)</sup>。ベ



第1図 ベンズイミダゾール系殺菌剤

ノミルと MBC は多くの菌に対してほぼ同程度の阻害効果を示すが、*Sacharomyces pastorianus* に対してはベノミルのほうが毒性が強いことから、初期においては両薬剤は異なった作用をするらしい<sup>16)</sup>。ベノミルを葉面に散布して3時間後、葉上に残る薬剤の50%はベノミルそのものであることから、葉面にベノミルのままで残り、MBCになったものが内部へ浸透して殺菌作用をすることを考えられた。

その後、DAVIDSE (1973) は *Aspergillus nidulans* の発芽管の有糸分裂がコルヒチンの場合と同様 MBC によって阻害され、クロマチンの異常が生ずることを観察した<sup>7)</sup>。更に、*Botrytis cinerea* の菌糸及びタマネギの根の先端の有糸分裂がベノミル及び MBC によって阻害されることが示された<sup>37)</sup>。MBC を処理すると、娘核は完全に分離せず、2個の核を持った細胞が生じ、2個以上の仁を持った核も生じた。また、クロモソームは完全に分離せず、クロマチンは不規則な形になった。すなわち、ベノミル及び MBC は菌糸ならびに植物細胞の有糸分裂を阻害することが明らかになり、その作用は MBC が紡錘体を構成するタンパク質と結合する結果現れることが認められた<sup>9)</sup>。

## 2 チオファネートメチル剤 (thiophanate-methyl)

チオファネートメチルもベノミルと同様に浸透性殺菌剤であり、インゲンなどの作物体内で MBC に加水分解される<sup>42,43)</sup>。また、*Pellicularia sasakii* 及び *Alternaria mali* に与えた場合の主な代謝産物は MBC であった<sup>51)</sup>。本剤は多くの糸状菌に効果を示し<sup>21)</sup>。その性質はベノミルと同様であり作用機構も同じであると考えられている。

ベノミル及びチオファネートメチルはほぼ同じ病害に適用され、多くの野菜の灰色かび病、菌核病、うどんこ病、炭そ病をはじめ *Fusarium* による土壌病害の防除に至るまで広く使用されている。また、果樹病害防除にも広く使用されている。

最近、*Botrytis cinerea*、*Venturia nashicola* などでベノミルとチオファネートメチルの両薬剤に対する耐性菌が出現しているが<sup>3,23,45,50)</sup>、両薬剤、MBC、チアベンダゾールなどの間に交差耐性を示すことも、これらのベンズイミダゾール系化合物が同一作用点を持っていることを支持している。

## V 抗生物質剤

抗生物質については本号で黄氏により詳述されているのでここでは省略し、野菜病害に広く使用されているポリオキシン剤についてのみ若干述べる。

ポリオキシン (polyoxins) は現在 A から M まで 13 成分が単離され、生物活性を示さない C と I を除く各成分はそれぞれ病原菌に対して選択的に作用する。B 及び L 成分は各種うどんこ病、黒斑病に強い効果を示し、菌糸の先端及び胞子の発芽管に作用して特異的な膨潤を起こさせる<sup>10,38)</sup>。本剤 5 ppm で <sup>14</sup>C-UDP-N-アセチルグルコサミンの細胞壁分画への取り込みを強く阻害し、本剤は細胞壁中のキチン合成系に作用して、キチン合成酵素を阻害すると考えられている<sup>20)</sup>。野菜ではキュウリ、トマト、イチゴの灰色かび病、うどんこ病、トマトの葉かび病などに広く適用され、果樹及び花き病害の防除にも多く使用されている。

このほかの野菜に適用される抗生物質として、トマト葉かび病に適用のあるカサガマイシン (キャプタンとの混合剤)、ハクサイ軟腐病防除剤としてのストレプトマイシン、トマトかいよう病にノボピオン (採種用のみ適用) などがある。

## VI 土壌殺菌剤

### 1 臭化メチル剤 (methyl bromide)

臭化メチル (CH<sub>3</sub>Br) は土壌くん蒸剤として殺菌作用だけでなく殺虫作用もある。ほとんどの土壌病害に使用

され、低温の時にも効果があり、土壤中の TMV や CGMMV を不活化する効果がある<sup>22)</sup>。

## 2 クロロピクリン剤 (chloropicrin)

水に難溶性であり、土壤中に注入されるとガスとなり、菌に接触して殺菌効果を表す。ガスは空気より重く下方によく拡散する。本剤の作用機構は—SH との反応により呼吸を阻害するもので、病原菌のみならず線虫などあらゆる生物に非選択的に作用する。硝酸化成菌は長く抑制されるが、硫酸環元菌、ハクサイなどの軟腐病菌などは速やかに復活する。

## 3 PCNB 剤 (quintozene)

アブラナ科野菜の根こぶ病, *Rhizoctonia* による苗立枯病に対して有効である。その作用は静菌的である。

## 4 エクロメゾール剤 (echlomezol)

本剤は *Phytophthora* 及び *Pythium* による土壤病害に有効で、キュウリ疫病に適用されているが、その作用機構は明らかにされていない。作物の生育中にも使用でき、取り扱いが容易なことが長所である。

# VII その他の合成殺菌剤

## 1 キャプタン剤 (captan)

キャプタンの毒性基は—SCCl<sub>3</sub>とされており、これが生体の—SH と直接結合して酵素などを不活性化しますが、または—SH と反応して生成するチオホスゲン (Cl—CS—Cl) が更に—SH と結合して毒性を表すと考えられている。すなわち、LUKENS らはキャプタンとシステインとの反応を調べ、*in vitro* でチオホスゲンが生成し、システインはシスチンに酸化されることを認めている<sup>31)</sup>。キャプタンによる *Saccharomyces pastorianus* の阻害はキャプタンの3倍量のシステインを添加することにより回復することや、多くのSH 酵素の活性がキャプタンにより阻害されることなども、キャプタンが直接あるいは間接的に病原菌のSH 基阻害剤として作用することを示している。また、ラット肝のミトコンドリアに対してキャプタンは酸化のリン酸化と NADPH<sub>2</sub> の酸化を阻害し、ミトコンドリアを膨張させることから、本剤はミトコンドリアの膜に作用することも考えられる<sup>35)</sup>。多くの野菜の苗立枯病、炭そ病をはじめ果樹病害の防除にも広く使用されている。

## 2 ダイホルタン剤 (captafol)

本剤による *Saccharomyces pastorianus* の生育阻害はシステイン、グルタチオン、チオウレア誘導体の添加で回復し、キャプタンと同様にダイホルタンの作用点は病原菌のSH の阻害であると考えられている<sup>32)</sup>。トマト疫病、ウリ類の炭そ病をはじめ多くの野菜病害や果樹病害

の防除に使用されている。

## 3 キノキサリン系剤 (quinomethionate)

野菜の各種うどんこ病に予防効果だけでなく治療効果もあるが、作用機構については明らかでない。ハダニに対しても殺虫効果があり、広く使われている。

## 4 トリアジン剤 (anilazine)

本剤は細胞構成要素のアミノ基と結合して、その生理機能を失わせるといわれている。野菜の灰色かび病、ウリ類の炭そ病などの防除に使用されている。

## 5 スルフェン酸系剤 (dichlofluanid)

チオアルキル基が毒性を示し、病原菌体内のSH 基やNH<sub>2</sub> 基などと結合して毒性を表すものと考えられている。野菜の灰色かび病、苗立枯病、トマト疫病などの防除に広く使用され、ハダニの卵を殺す効果もある。灰色かび病菌の胞子発芽阻止力は強い。

## 6 CNA 剤 (dicloran)

キュウリ、レタスの菌核病に対して予防効果だけでなく治療効果もあり使用されている。胞子発芽阻害よりはむしろ菌糸伸長を強く阻害する。

## 7 塩化ベンザルコニウム剤 (benzalkonium chloride)

第4級アンモニウム塩の1種で陽イオンが病原菌中のほかの必須イオンを追い出して、酵素系を混乱させると言われている。イチゴうどんこ病防除に広く使われている。

## 8 ジチアノン剤 (dithianon)

ニトリル基(—CN)を毒性基とし、病原菌体内の酵素タンパク質のSH 基に作用すると考えられている。SH 化合物の添加で毒性は回復される。キュウリ炭そ病、トマト疫病などの防除に使われ、銅剤との混合剤も広く使われている。

## 9 ジメチリモール剤 (dimethirimol)

ウリ類及びゴムギなどのうどんこ病にのみ特効のある浸透性殺菌剤である<sup>11)</sup>。*in vitro* で *Erysiphe graminis* の胞子発芽を5 ppm で阻害し、50 ppm で発芽は完全に阻止された。しかし、50 ppm でも *Venturia*, *Puccinia*, *Botrytis* 及び *Phytophthora* の胞子または遊走子はほとんど阻害されない<sup>2)</sup>。ジメチリモール 10 ppm に 100 ppm のリボフラビンまたは葉酸を添加すると、*Erysiphe graminis* の *in vitro* での胞子発芽は回復し、*in vivo* でも同様であった。この結果、本剤は菌の幾つかの代謝過程と直接拮抗するものと考えられた。野菜ではキュウリ及びメロンのうどんこ病に適用され、浸透性があるので、葉面散布のほかには土壌灌注も有効である。

# VIII 自然物殺菌剤

大豆レンチンは1種のリン脂質で、ダイズのほか、人

体、卵黄、植物種子などいろいろなものに含まれている物質であり、いわば自然物農薬である<sup>33)</sup>。キュウリ及びナスのうどんこ病に適用されているが、イチゴ、メロン、ピーマンのうどんこ病、キュウリの炭そ病、べと病、トマト疫病のほかにイネいもち病にも効果があることが明らかにされた<sup>34)</sup>。激発した場合の防除効果はやや劣るが、本剤の安全性は極めて高く、収穫時直前まで散布可能であるので、特に施設園芸には適した農薬と考えられる。作用機構についてはまだ不明であるが、キュウリ葉上のうどんこ病菌の菌糸は伸長が止まり、分生子梗が形成されても分生子が離脱しなくなることが認められている。

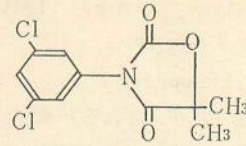
## IX 開発中の殺菌剤

### 1 N-3-ピリジリイミドチオカーボネート誘導体

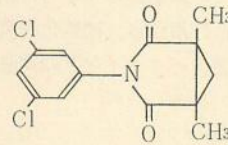
(S-1358, デンマート)

本剤はキュウリなどのうどんこ病菌に対して著しい防除効果があり、*Sphaerotheca fuliginea* の孢子発芽は阻害しないが、発芽管の伸長を抑制し、発芽管先端を膨化させる<sup>25)</sup>。*Monilinia fructigena* に本剤の 10 μM を処理すると、菌糸が著しく分枝し、膨化するが、呼吸、核酸合成、タンパク質合成、グルコースとグルコサミンの細胞壁への取り込み及びステロール以外の脂質合成はすべて正常であった。しかし、ステロールの主成分であるエルゴステロールへ <sup>14</sup>C-酢酸の取り込まれる過程が阻害され、4,4-ジメチルステロールが蓄積した<sup>24)</sup>。4 α-メチルステロールは徐々に蓄積するが、4,4-ジメチルステロールは急速に蓄積することから、ラノステロールからエルゴステロールへの過程において、脱メチル化反応を阻害すると考えられた<sup>26)</sup>。また、*Saccharomyces cerevisiae* の無細胞抽出液における <sup>14</sup>C-メバロン酸の取り込み実験で、ラノステロールから 4-デスメチルステロールへの変換過程が阻害されることが認められ、本剤はエルゴステロール生合成の過程で、C-14 位の脱メチル化反応を選択的に阻害すると結論された<sup>27)</sup>。

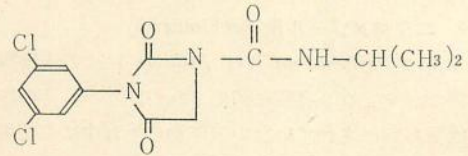
バラうどんこ病などに有効なトリホリン (triforine)、トリアリモール (triarimol)、トリアジメホン (triadimefon) などとも S-1358 と同様にエルゴステロール生合成を阻害する。*Cladosporium cucumerinum* のトリアリモール耐性変異株がトリホリン、S-1358 との間に交差耐性があり<sup>30, 40)</sup>、トリアジメホン耐性菌がトリアリモール、トリホリンに対しても耐性であったことから<sup>4, 29)</sup>、これらの薬剤が共通の作用点を持つことが支持され、また、すべてうどんこ病に対して有効な浸透性殺菌剤であることも共通している。



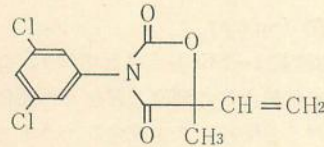
dichlozoline (Sclex)



procymidone (Sumilex)



iprodone (Rovral)



vinchlozolin (Ronilan)

第2図 環状 N-(3,5-ジクロロフェニル)イミド系殺菌剤

### 2 環状 N-(3,5-ジクロロフェニル)イミド系殺菌剤

ジクロゾリン (dichlozoline, スクレックス)、プロサイミドン (procymidone, スミレックス)、アイプロデオン (iprodone, ロブラール)、ビンクロゾリン (vinchlozolin, ロニラン) がある。ジクロゾリンは製造中止になっているが、ほかの3剤は開発中でありいずれも野菜の灰色かび病、菌核病に卓効を示している<sup>36)</sup>。

プロサイミドンはキュウリの根及び葉からの浸透移行性が高かった<sup>16, 17)</sup>。また、本剤は *Botrytis cinerea* の分生子及び菌糸細胞を破裂させるが、プロトプラストに処理すると形態的に安定であり、浸透圧ショック後、位相差顕微鏡下で観察すると、細胞壁様の構造物を再生した。そこで、本剤は細胞膜や細胞壁に直接作用したり、その合成を阻害するのではなく、細胞破裂は二次的な結果であると推察された<sup>18)</sup>。本剤は *B. cinerea* の呼吸及び脂質合成を阻害しないが、タンパク質、RNA 及び DNA 量の増加を阻害し、その程度は菌体乾重の抑制と



一致した。また、 $^3\text{H}$ -ウリジンの酸可溶性及び不溶性分画への取り込みを強く阻害し、本剤が細胞膜の透過機能や細胞壁合成に影響を及ぼしていると考えられている<sup>19)</sup>。

Fritz ら (1977) によると、アイプロデオン及びビンクロゾリンが *Botrytis cinerea* 菌体の RNA 及び DNA への  $^{14}\text{C}$ -ウリジンの取り込みを強く阻害することから、その作用機構として DNA 合成の阻害が関与していると考えられ、更に遊離の脂肪酸が集積することから、脂質合成の異常による可能性も示唆された<sup>13)</sup>。

これら4種の殺菌剤は構造的にも類似し、いずれも *Botrytis*, *Sclerotinia* に対して顕著な阻止効果を示す点は共通しているが、その抗菌スペクトルが薬剤により多少異なる点もあるので、異なった作用点もあると考えられる。一方、これらの薬剤に対する耐性菌 (*Botrytis cinerea*) がいずれも交差耐性を示すことから<sup>28,30,46)</sup>、これらの4薬剤は同一の作用点を持つものと考えられる。また、同耐性菌が CNA 及び PCNB との間に交差耐性を示すことは、それらの構造と作用点の類似性がうかがえて興味深い。

## おわりに

新しい殺菌剤が開発される場合、病害防除剤として効果及び安全性が確認されてから、その薬剤の作用機構が研究されるのが通常であり、広く使用されている薬剤の中にもまだ作用点が明確でないものも多い。一つの薬剤の作用点は一つだけとは限らず、多くの作用点を有する可能性も高い。生物と薬剤との関係は複雑であり、防除効果のみならず安全性の点からも、使用されているすべての薬剤の作用機構が明らかにされることが望まれる。

また、近年薬剤耐性菌が出現し大きな問題となっており、浸透性でしかも作用点の狭い選択的薬剤に耐性菌が出現しやすいと考えられているが、耐性菌の出現機構やどのような種類の薬剤に耐性菌が出現するのかなど不明な点が多く、今後に残された課題である。

## 引用文献

- 1) BARTELS-SCHOOLEY, J. and B. H. MACNEILL (1971) : *Phytopathology* 61 : 816~819.
- 2) BENT, K. J. (1970) : *Ann. appl. Biol.* 66 : 103~113.
- 3) BOLLEN, G. J. and G. SCHOLTEN (1971) : *Neth. J. Plant Pathol.* 77 : 83~90.
- 4) BUCHENAUER, H. (1977) : *Pestic. Biochem. Physiol.* 7 : 309~320.
- 5) CLEMONS, G. P. and H. D. SISLER (1969) : *Phytopathology* 59 : 705~706.
- 6) ——— (1971) : *Pestic. Biochem. Physiol.* 1 : 32~43.
- 7) DAVIDSE, L. C. (1973) : *ibid.* 3 : 317~325.
- 8) ——— (1975) : *Microtubules and microtubule inhibitors* (ed. by M. BORGERS and M. DE BRABANDER). North-Holland Publishing Company, Amsterdam, p. 483.
- 9) EDGINGTON, L. V. et al. (1971) : *Phytopathology* 61 : 42~44.
- 10) 江口 潤ら (1966) : *日植病報* 32 : 99~100.
- 11) ELIAS, R. S. et al. (1968) : *Nature* 219 : 1160.
- 12) ERWIN, D. C. et al. (1968) : *Phytopathology* 58 : 528~529.
- 13) FRITZ, R. et al. (1977) : *Phytopath. Z.* 90 : 152~163.
- 14) 福永一夫 (1976) : *農業ハンドブック 日本植物防疫協会*.
- 15) HAMMERSCHLAG, R. S. and H. D. SISLER (1972) : *Pestic. Biochem. Physiol.* 3 : 42~54.
- 16) HISADA, Y. et al. (1976a) : *J. Pestic. Sci.* 1 : 145~149.
- 17) ——— et al. (1976b) : *ibid.* 1 : 201~206.
- 18) ——— and Y. KAWASE (1977) : *Ann. Phytopath. Soc. Japan* 43 : 151~158.
- 19) ——— et al. (1978) : *ibid.* 44 : 509~518.
- 20) HORI, M. et al. (1974) : *Agr. Biol. Chem.* 38 : 691~698.
- 21) 細辻豊二ら (1970) : *日植病報* 36 : 197.
- 22) 井上忠男ら (1967) : *農学研究* 51 : 199~207.
- 23) 石井英夫・山口 昭 (1976) : *日植病報* 42 : 373.
- 24) KATO, T. et al. (1974) : *Agr. Biol. Chem.* 38 : 2377~2384.
- 25) ——— et al. (1975a) : *Ann. Phytopath. Soc. Japan* 41 : 1~8.
- 26) ——— et al. (1975b) : *Agr. Biol. Chem.* 39 : 169~174.
- 27) ——— et al. (1976) : *ibid.* 40 : 2379~2388.
- 28) 古谷真二 (1978) : *日植病報* 45 : 105.
- 29) LEROUX, P. and M. GREDT (1976) : *Phytopath. Z.* 86 : 276~279.
- 30) ——— et al. (1977) : *ibid.* 89 : 347~358.
- 31) LUKENS, R. J. and H. D. SISLER (1958) : *Phytopathology* 48 : 235~244.
- 32) ——— (1962) : *ibid.* 52 : 740.
- 33) 見里朝正 (1975) : *農業及園芸* 50 : 603~608.
- 34) MISATO, T. et al. (1975) : *Ann. Phytopath. Soc. Japan* 41 : 73~76.
- 35) NELSON, B. D. (1971) : *Biochem. Pharmacol.* 20 : 737~742.
- 36) 西 泰道 (1978) : *植物防疫* 32 : 81~82.
- 37) RICHMOND, D. V. and A. PHILLIPS (1975) : *Pestic. Biochem. Physiol.* 5 : 367~379.
- 38) 佐々木茂樹ら (1968) : *農化* 42 : 633~638.

- 39) SHERALD, J. L. et al. (1973) : Pestic. Sci. 4 : 719~727.
- 40) ——— and H. D. SISLER (1975) : Pestic. Biochem. Physiol. 5 : 477~488.
- 41) SijPESTEIJN, A. S. (1977) : Systemic fungicides (ed. R. W. MARSH) p. 131. Longman.
- 42) SOEDA, Y. et al. (1972a) : Agr. Biol. Chem. 36 : 817~823.
- 43) ——— et al. (1972b) : ibid. 36 : 931~936.
- 44) 鈴木直治 (1976) : 農薬の生理作用. 南江堂.
- 45) 手塚信夫・木曾 皓 (1975) : 日植病報 41 : 303~304.
- 46) ———・西 泰道 (1978) : 同上 45 : 105.
- 47) 豊田 栄 (1965) : 農技研報告 C18 : 59~134.
- 48) TWEEDY, B. G. and N. TURNER (1966) : Contrib. Boyce Thompson Inst. 23 : 255~264.
- 49) VINGENT, P. G. and H. D. SISLER (1968) : Physiol. Plant 21 : 1249~1256.
- 50) 山本 磐 (1975) : 植物防疫 29 : 194~196.
- 51) YASUDA, Y. et al. (1973) : Ann. Phytopath. Soc. Japan 39 : 49~52.

### 本会発行図書

## 農薬用語辞典

農薬用語辞典編集委員会 編

B 6 判 100 ページ 1,200 円 送料 120 円

農薬関係用語 575 用語をよみ方, 用語, 英訳, 解説, 慣用語の順に収録。他に英語索引, 農薬の製剤形態及び使用形態, 固形剤の粒度, 液剤散布の種類, 人畜毒性の分類, 魚毒性の分類, 農薬の残留基準の設定方法, 農薬希釈液中の有効成分濃度表, 主な常用単位換算表, 濃度単位記号, 我が国で使用されている農薬成分の一覧表, 農薬関係機関・団体などの名称の英名を付録とした必携書。講習会のテキスト, 海外出張者の手引に好適。

お申込みは前金 (現金・振替・小為替) で本会へ

### 本会発行新刊図書

## イネミズゾウムシの生態と防除

農林水産省農蚕園芸局植物防疫課 監修

700 円 送料 120 円

A 5 判 口絵カラー写真 8 ページ, 本文 19 ページ

イネミズゾウムシの卵, 幼虫, 蛹, 成虫, 根部を食害している幼虫, 根に付着している土藪, 田植え直後及び田植え1か月前後の被害, 幼虫による被害, 被害水田全景, 幼虫による被害株と健全株, 雑草 (ヒエ) への加害, 飛しょう (葉先に集まった成虫及び飛び立つ前), イネミズゾウムシ・イネハモグリバエ及びイネドロオウムシによる食痕のカラー写真 17 枚を 8 ページにまとめ, 本文では形態及び生態等, 発生状況及び被害状況, 調査方法, 防除, 我が国への侵入を解説し, 参考文献及び資料を 19 ページにまとめた書

## 殺虫剤の選択毒性

農林水産省農業技術研究所 ししど たかし  
 穴 戸 孝

## はじめに

選択毒性とは互いに近接した2種の生物のうち一方には害を与えないで他方に損傷を与えることであると ALBERT (1951) によって定義されている。今日では、選択毒性は生理活性物質あるいは毒物が薬剤として利用されるに当たって具備すべき必須条件の一つに数えられている。戦後に開発された殺虫剤の多くは最初強力な殺虫性という面だけに重点が置かれていたが、漸次選択毒性の概念が取り込まれ、哺乳動物に対し毒性が低く、しかも昆虫に対し強い殺虫性を保持した選択性殺虫剤の開発と、その理論的基礎として選択毒性機構の解明に研究の方向が向けられていった。そして現在では害虫以外の非標的生物に対する影響を少なくするために、更に高度の選択性を持った殺虫剤が要求されるに至っている。

生物に対する毒作用は毒物との接触、皮膚透過性、代謝（活性化と解毒）、蓄積、排泄、作用点との相互作用の諸過程を通して発現し、これら一連の毒作用過程が生物種によって変化する場合に、生物相互間に選択毒性として現れる。特に浸透移行性、代謝、作用点感受性の差異が選択性を支配する3大要因とされている。また、最近では昆虫ホルモンアンバランス剤（メソプレン）や表皮形成阻害剤（ディミリン）といった昆虫特有の機能を攻撃個所とする新しい薬剤が登場してきた。これら殺虫剤は標的が昆虫にのみ存在するため、他生物との間に高い選択性を示す。

選択毒性の度合は2種の生物間の  $LD_{50}$  の比、すなわち、選択性係数（例えば、哺乳動物  $LD_{50}$ /昆虫  $LD_{50}$ ）で表される。ラットとイエバエの比較ではパラチオンやエンドリンの係数は2~4でほとんど選択性を示さないが、低毒性殺虫剤と呼ばれるものほどこの値は高く、フェントロチオンやジメトエートでは250~500、パーメスリン、レスメスリンなどのピレスロイドは2,000以上で、近年開発されたものほどこの値は高い傾向を示している。また、標的の特異性のメソプレンは1,730,000以上で急性毒性面からは事実上無害と言えよう。

本稿では選択毒性機構を物理的要因、生化学的要因、標的の特異性の三つに大別し、それぞれの事例について紹介してみたい。

## I 物理的要因

## 1 皮膚透過性

有機合成殺虫剤は一般に親油性で、昆虫、哺乳動物に対する皮膚透過性は比較的高いが、薬剤の種類、生物種によって体内への透過性に差異が見られる。通常、塗布毒性と注射毒性あるいは経口毒性との違いが皮膚透過性の難易のおおよその目安となる。

第1表は、各種動物に塗布法と注射法により処理した殺虫剤の  $LD_{50}$  値と両処理法による致死量を比較（透過性係数として表される）したものである（HOLLINGWORTH, 1976）。一般に経皮あるいはトピカル法は体内浸入に時間を要するため、注射法に比し、 $LD_{50}$  値は大きくなると考えられるが、薬剤が急速な皮膚透過性を持つならば透過性係数は1に接近する。DDT の透過性係数はラットではかなり大きく、ワモンゴキブリでは小さいことから、後者への皮膚透過性はラットに比しかなり早いと考えられる。また、マラソンはワモンゴキブリとチャパネゴキブリに注射した場合にその殺虫性に差がほとんど見られないが、トピカル法では  $LD_{50}$  に約8倍の開きを生ずる。この選択性はチャパネゴキブリでは薬剤の皮膚透過が遅く、この間に解毒代謝系が有効に働くためと考えられている。また、ハチミツガ幼虫は各種殺虫剤に対し感受性が低い傾向を示すが、これは  $^{14}C$ -標識殺虫剤での実験から、他の鱗翅目幼虫に比し、皮膚への透過速度が遅いことに一因があると指摘されている（菅谷ら, 1979）。

## 2 神経膜透過性

## (1) イオン関門

多くの殺虫剤は神経の興奮伝導を阻害する。したがっ

第1表 経皮法及び注射法により処理された殺虫剤の毒性 (HOLLINGWORTH, 1976)

	$LD_{50}$ (mg/kg)		透過性係数 (T/I)
	経皮(T)	注射(I)	
DDT			
ラット	3,000	100~200	15~30
ワモンゴキブリ	10	5~8	1.3~2
マラソン			
チャパネゴキブリ	120	8.0	15.0
ワモンゴキブリ	16	7.2	2.2

て、神経膜透過性の難易はその毒性に大きく影響すると考えられている。一般に昆虫神経はイオン閥門を持つため、神経膜への透過性は親油性薬物では容易であるが、イオン性あるいは極性の高い薬物では著しく低下する。一方、哺乳動物ではこの閥門がないため、イオン性あるいは親油性薬物はともに通過すると言われている。例えば第4級窒素原子を持つカーバメート化合物プロスティグミンは哺乳動物に強い毒性 (マウス  $LD_{50}$  0.4 mg/kg, 腹腔内注射) を示すが、昆虫に対しては殺虫性は極めて低い (バッタ  $LD_{50}$  1,200 mg/kg, 注射) (O'BRIEN and FISHER, 1968)。イオン性カーバメートは哺乳動物と昆虫のアセチルコリンエステラーゼ (AChE) に対し強い阻害活性 ( $I_{50}$ ,  $10^{-7}$ ~ $10^{-8}$ M) を示すにもかかわらず、摘出された昆虫の中枢神経線維に高濃度 ( $10^{-4}$ M) で作用させても、そのシナプス伝達は全く妨害を受けない (METCALF ら, 1968)。

また、最近哺乳動物の中枢興奮薬として知られているピクロトキシニンとビベロニルプトキシンドとともにイェバエにトピカル処理した場合、殺虫性 ( $LD_{50}$  6.5  $\mu$ g/頭) を示すことが報告された (MILLER ら, 1979)。この薬は神経節被膜を除去した昆虫中枢神経に対して、カルボフランよりもはるかに強く作用する。

昆虫神経膜の透過性という点から見ると、ピクロトキシニンのみならずその他極性の高い各種神経薬物の物理性の改善はより高い殺虫性が期待でき、今後昆虫神経毒物の分子設計に当たって、この点が大きなねらいの一つとなろう。

#### (2) シュラーダンの選択毒性

シュラーダンは第2表に示したように、哺乳動物に毒性が高く、また、アブラムシ、カメムシ、ツマグロヨコバイなどの昆虫にも高い殺虫性を示すが、ニカメイガ幼虫、ワモンゴキブリ、イェバエにはほとんど効力を示さない。昆虫間にみられるこのシュラーダンの選択毒性について斎藤 (1961) は神経膜透過性が重要な因子であることを明らかにした。すなわち、 $^{32}$ P-シュラーダンをを用

第2表 シュラーダンの毒性  
(斎藤, 1961; O'BRIEN ら, 1953)

動 物	$LD_{50}$ $\mu$ g/g (トピカル)
ニカメイガ幼虫	>26,000
ワモンゴキブリ	2,100
イェバエ	1,900
ツマグロヨコバイ	160
クモヘリカメムシ	23
willow aphid	22
ネズミ	8 (腹腔内注射)

いた一連の実験から、感受性・非感受性昆虫の間に、活性化、解毒、排泄、皮膚透過性や AChE の感受性などについて相関性は認められなかったが、感受性昆虫の中枢神経組織には非感受性昆虫のそれに比し、シュラーダンとその活性体が集積することが見いだされた。更に双方の昆虫神経節を電子顕微鏡で観察した結果、二層よりなる神経節被膜は感受性昆虫では極めて薄いのに対し、非感受性昆虫では厚い強固な構造を持っていることが認められた。これらの結果からシュラーダンの選択毒性は神経節被膜の透過性が主要な原因であると結論されている。

最近の研究では、神経節内部に物質が拡散する場合には被膜内側の神経周膜が閥門に相当する機能を持つとされている。今後昆虫種による神経周膜の構造の差やこの膜に対する薬物透過性についての研究が望まれる。

## II 生化学的要因

### 1 作用点

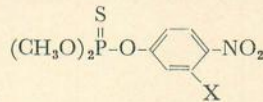
殺虫剤が昆虫のどの生体機能に作用するかという点から見ると、その作用部位は神経系、エネルギー生成系、合成系、生長調節系の四つに大別できる。現在では、これら殺虫剤の作用機作、作用点の性質についてかなりの部分が詳細に解明されている。その結果作用点と殺虫剤の相互作用の強さは化学構造のみならず生物種によってもかなり異なることが見いだされており、この薬剤に対する感受性の差異が生物間の選択性を支配している例がしばしば明らかにされている。また、阻害を受ける個所を迂回できる側路 (バイパス) の存在が選択毒性に関与する場合もある。

#### (1) メタ置換メチルパラチオンの選択毒性

メチルパラチオンのアリアル基に種々の置換基を導入し、選択性殺虫剤を創製する試みは古くから行われてきた。その代表的なものの一つはメタ位にメチル基を導入したフェニトロチオンであろう。これ以外に塩素原子、トリフルオロメチル基などによるメタ置換メチルパラチオン殺虫剤は大きな選択的作用を示す (第3表)。HOLLINGWORTH ら (1967)、METCALF ら (1973) は酵素の動力学的手法によりこの選択毒性は作用点 AChE に対するメタ置換基の親和性の差に基づくことを明らかにした。

第4表はイェバエ頭部及びウシ赤血球の AChE に対するメチルパラオクソンとフェニトロオクソンの阻害反応における各種の動力学的定数を比較したものである。この表から明らかのように、メチルパラオクソンに

第3表 メタ置換メチルパラチオンの選択毒性 (HOLLINGWORTH et al., 1967 ; METGALF et al., 1973)



X	殺虫剤	LD <sub>50</sub>		選択性係数 (M/F)
		マウス (M) mg/kg	イエバエ (F) μg/g	
H	メチルパラチオン	23	1.2	19
CH <sub>3</sub>	フェニトロチオン	2,200	4.5	488
Cl	クロルチオン	>1,500	10.6	>141
CF <sub>3</sub>	フルオロチオン	>2,000	3.1	>645

第4表 イエバエ頭部及びウシ赤血球の AChE 阻害反応に及ぼすメタ置換基の選択的効果 (HOLLINGWORTH et al., 1967)

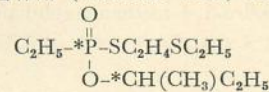
殺虫剤 (P=O型)	K <sub>a</sub> (×10 <sup>-5</sup> M)		k <sub>p</sub> (min <sup>-1</sup> )		k <sub>i</sub> (×10 <sup>5</sup> M <sup>-1</sup> min <sup>-1</sup> )	
	イエバエ	赤血球	イエバエ	赤血球	イエバエ	赤血球
メチルパラオクソン	3.7	1.3	10.6	6.6	2.9	5.2
フェニトロオクソン	1.1	6.7	8.3	5.0	7.6	0.73

*m*-CH<sub>3</sub> 基が導入されると阻害定数  $k_1^*$  は両 AChE 間に約 10 倍の開きを生ずる。この内容を解析してみると、リン酸化速度定数  $k_p^*$  は *m*-CH<sub>3</sub> 基導入により両酵素ともわずかな変化しか認められないが、親和性を示す平衡定数  $K_a^*$  を比較すると、イエバエ酵素では水素原子からメチル基への変化は親和性が 3.4 倍も増加 ( $K_a$  の減少) するのに対し、赤血球酵素では逆に 1/5 程度低下 ( $K_a$  の増大) している。同様なことが *m*-Cl 原子、*m*-CF<sub>3</sub> 基でも明らかにされており、特に後者ではこの親和性の差が最も著しく現れる。以上のようにメタ置換基による両生物間の選択毒性は一部 AChE 分子に対する親和性の生物学的な差に起因していると言える。

#### (2) 有機リン光学異性体と選択毒性

酵素が不整原子を有する化合物と作用する際に立体特異性を示すことはよく知られている。AChE と有機リン阻害剤との反応においてもこの立体特異性を示すことが近年 OHKAWA ら (1976) と WUSTNER ら (1973) の一連の研究によって明らかにされた。demeton の類縁体 *O*-2-butyl *S*-2-(ethylthio) ethyl ethylphosphono-

第5表 有機リン光学異性体による AChE の選択的阻害作用 (WUSTNER et al., 1973)

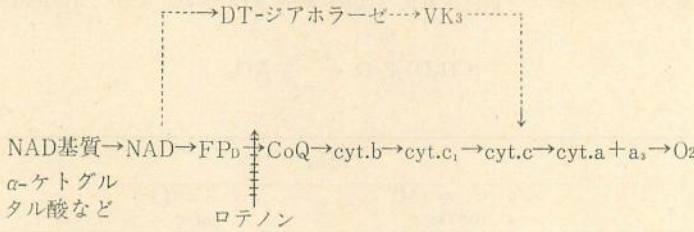


No.	立体配置		イエバエ $k_1$ (×10 <sup>3</sup> M <sup>-1</sup> min <sup>-1</sup> )	ウシ赤血球 $k_1$ (×10 <sup>3</sup> M <sup>-1</sup> min <sup>-1</sup> )
	α-C	*P		
a	ラセミ体		969	31.8
	+	-	1,710	65.3
b	+	+	1.3	0.6
c	-	-	1,690	54.5
d	-	+	6.6	1.4

thioate は 2-ブチル炭素とリン原子の二つの不整中心をもっている。四つの光学活性体は AChE の阻害に対し立体特異性を示し、また、種の異なる AChE に対し選択的阻害作用を持つことが判明した (第5表)。立体特異性は不整炭素原子より不整リン原子において著しく強く現れ、(-)-リン異性体 (a と c) は (+)-リン異性体 (b と d) より阻害度が高い。例えば、イエバエ AChE に対する鏡像異性体 b と c の阻害定数  $k_1$  はそれぞれ  $1.3 \times 10^3 \text{M}^{-1} \text{min}^{-1}$  と  $1.69 \times 10^3 \text{M}^{-1} \text{min}^{-1}$  で、その阻害度に 1,250 倍もの差が見られる。また、ウシ赤血球 AChE に比し、イエバエ AChE は感受性が大である。特に、(-)-リン異性体の選択的阻害度は高く、両酵素間で  $k_1$  に 26~31 倍の開きがでてくる。

有機リン光学異性体は AChE 分子だけでなく、生体代謝、生物活性、哺乳動物に対する毒性などにおいても

\*  $K_1$  はリン分子と AChE 分子との 2 分子反応速度定数 (阻害定数) で、 $k_1 = k_p / K_a$  の関係がある。 $k_1$  の大きいものほど優れた阻害剤で、通常の有機リン殺虫剤 (P=O 型) は  $10^4 \sim 10^7 \text{M}^{-1} \text{min}^{-1}$  の範囲に入る。また、AChE をリン酸化する反応速度定数  $k_p$  は大きいほど、酵素に対する親和性を示す平衡定数  $K_a$  は小さいほど優れた阻害剤を意味する。



第1図 ミトコンドリアの電子伝達系と DT-ジアホラーゼ-ビタミンK<sub>3</sub> 側路 (FUKAMI et al., 1970)

第6表 殺虫剤代謝に関与する酵素の分布 (WALKER, 1975 ; HOLLINGWORTH, 1976)

肝臓	酵素 基質	MFO (エポキシダーゼ)	アリールエステラーゼ		エポキシド ヒドラーゼ	グルタチオンS-アルキ ルトランスフェラーゼ
		アルドリン*1	メチルパラオクソン*2	パラオクソン*2	HEOM*3	メチルパラオクソン*4
ラット		300	93	212	1.8	364
ウサギ		340	46	149	14.5	—
ハト		73	24	0	0.0016	70
グリーンサンフィッシュ		6(マス)	7	5	—	10
イエバエ(全虫体)		41	0	0	11.6	1.8~5.6

\*1 pmol ディルドリン/mg タンパク/min

\*2 nmol パラニトロフェノール/g 肝臓/min

\*3 μg ジオール/mg タンパク/min; HEOM : 1, 2, 3, 4, 9, 9-hexachloro-6, 7-epoxy-1, 4, 4a, 5, 6, 7, 8, 8a-octahydro-1, 4-methanonaphthalene

\*4 nmol メチルグルタチオン/g 肝臓/min

立体特異性の存在することが示されている。今後、有機リン光学異性体は選択毒性の立場からも極めて有望な分野と思われる。

(3) ロテノンの選択毒性

植物源殺虫剤であるロテノンの選択毒性は深見ら(1970)の一連の研究によって明らかにされた。その要因として哺乳動物における酸化的な解毒代謝能が昆虫に比し著しく高いことと、哺乳動物はロテノンによる呼吸系の阻害箇所を迂回しうるバイパスを持っている点が挙げられている。

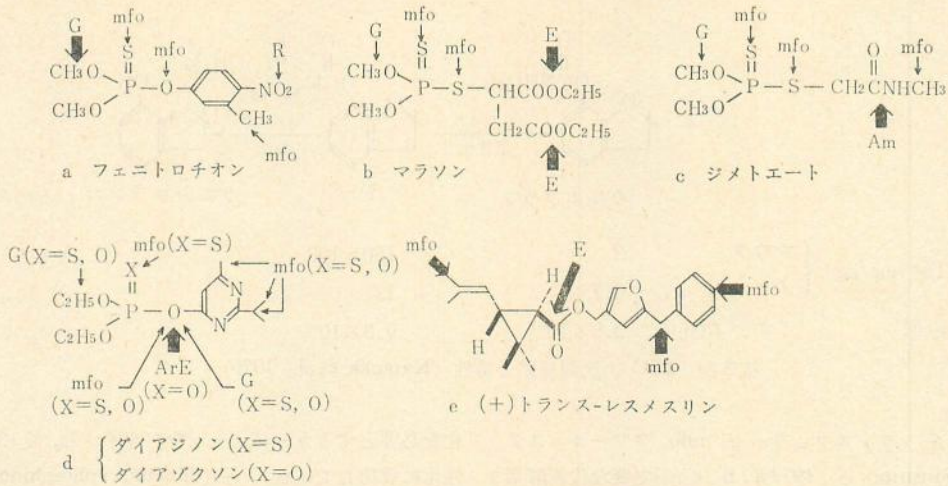
第1図はミトコンドリア呼吸系のNADを介する電子伝達系を示したものである。エネルギー生成機構は昆虫も哺乳動物も基本的に同じであり、この電子伝達系と共役して化学的エネルギーATPが生成する。ロテノンはフラボプロテインD(FpD)とコエンザイムQ(CoQ)の間で電子の流れを止め、同時にATPの生成も阻害する。しかし、哺乳動物ではDT-ジアホラーゼ-ビタミンK<sub>3</sub>を経由するバイパスが存在し、主経路がロテノンによって阻害されても、一部この系を通じて電子の移動とATPの生成が行われると考えられている。一方、昆虫ではこの側路がほとんど働かないため、より少ない薬量で昆虫の呼吸系は阻害を受けることになる。

2 代謝

作用点感受性以外に選択毒性に関与するもう一つの生化学的な主因子としては代謝が挙げられよう。体内に浸した殺虫剤は作用点に到達するまでに活性化と解毒代謝を受ける。代謝系は生体における殺虫剤の有効作用濃度を大きく支配していることから、生物種における代謝酵素の質的なあるいは量的な違いは毒性発現に大きく影響する。

(1) 代謝酵素と選択毒性

昆虫とほかの動物における殺虫剤代謝の基本様式はほぼ同じで、その主な変化は酸化、還元、加水分解、抱合である。第6表は殺虫剤代謝に関与する代表的な酵素の各種動物における *in vitro* 活性を比較したものである(HOLLINGWORTH, 1976)。ミクロゾーム酸化酵素系(mfo)は殺虫剤代謝の中で最も主要な位置を占め、水酸化、エポキシ化、硫黄の酸化などを行う。パラチオンのパラオクソンへの変換もこの酵素によるもので、解毒以外にしばしばこのような活性化反応が見いだされている。エポキシ化によるアルドリンからディルドリン生成の例から分かるように、一般に酸化活性は哺乳動物において著しく高い。また、P=O型のリン酸エステルの加水分解を行うアリールエステラーゼと、有機リン殺虫剤



第2図 低毒性殺虫剤の代謝部位と関与酵素

Am: アミダーゼ, ArE: アリールエステラーゼ, E: エステラーゼ, G: グルタチオン S-トランスフェラーゼ, mfo: ミクロゾーム酸化酵素系, R: ニトロレダクターゼ, →変換部位, ⇨ 選択的変換部位

や  $\gamma$ -BHC の解毒に関与するグルタチオン S-トランスフェラーゼは、基質によりその活性の度合は異なるが、一般に生物進化の程度の高い動物ほど高活性を示す。加水分解酵素の 1 種エポキシドヒドラーゼはイェバエでかなりの活性がある。このように種によって代謝酵素は分布、活性に大きな差があることから、殺虫剤代謝の差異が生物間の選択毒性発現に大きく影響していることは容易に推察できよう。

① グルタチオン S-トランスフェラーゼ

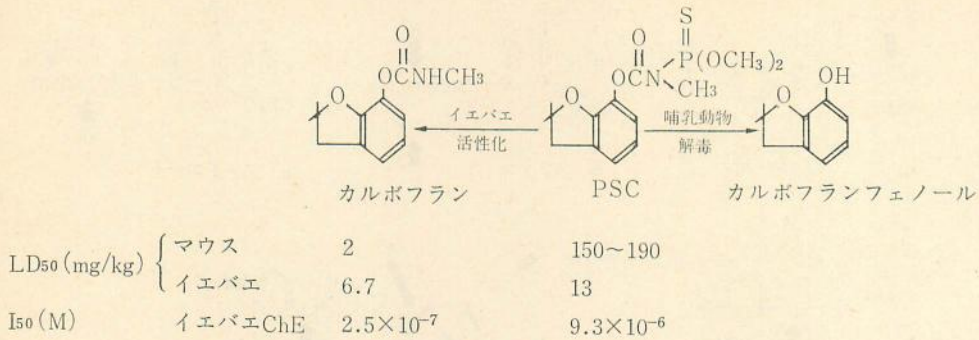
パラチオン型の有機リン殺虫剤は一般にアルキル基がメチル基の場合エチル基に比し、哺乳動物に対し低毒性である。また、メチル系殺虫剤は比較的高い殺虫性を保持しており、したがって昆虫と哺乳動物間に高い選択性を生ずる。この系統の殺虫剤はリン酸エステル結合の開裂により解毒されるが、その代謝経路はアルキル構造と生物種によって異なってくる。哺乳動物に投与されたメチル系殺虫剤は P-O-メチル結合の開裂による脱メチル分解を受けやすく、一般に低毒性のものほどこの率は高くなる。エチル系では大部分が P-O-フェニル結合の分解、すなわちアリール開裂である。昆虫は両系統の薬剤とも脱アリール分解がかなりの部分を占める。例えばフェニトロチオンを投与されたマウスはその 83% が脱メチル化による分解物であるのに対し、イェバエによるアルキル開裂は全代謝物の 28% に過ぎない (HOLLINGWORTH ら, 1967) (第 2 図 a)。脱メチル分解に関与する酵素は筆者ら (SHISHIDO and FUKAMI, 1963; FUKAMI

and SHISHIDO, 1966) によって見いだされ、今日ではグルタチオン S-トランスフェラーゼの 1 種として知られている。一般に哺乳動物ではこの活性は高く、昆虫では比較的低い。また、この酵素はアルキル基の中でメチル基に選択的に作用する性質を持っていることなどから、トランスフェラーゼの生物分布の差と基質特異性の違いがメチル系有機リン剤の選択毒性や低毒性の代謝的要因であると考えられている (穴戸・深見, 1978)。

② 加水分解酵素及び酸化酵素

低毒性の有機リン殺虫剤マラソンは哺乳動物においてカルボキシエステル結合の開裂したマラソンモノアシドへの分解が主要な代謝経路である (第 2 図 b)。この分解に関与するカルボキシルエステラーゼは哺乳動物の各組織に広く分布し、昆虫に比べ高い活性を持つことから、この酵素の分布量の違いがマラソンの選択毒性を支配していると考えられている。同様にジメトエートの場合も哺乳動物によって攻撃されやすい選択性基アミド結合を有し、アミダーゼ活性の低い昆虫との間で大きな毒性の差となって現れる (O'BRIEN, 1961) (第 2 図 c)。

KRUEGER ら (1960) は低毒性の有機リン殺虫剤ダイアジノンのマウスとワモンゴキブリにおける代謝を比較し、その活性毒物体ダイアゾクソンがワモンゴキブリ虫体にマウスの 12 倍も集積することを見だし、オクソン代謝の差がダイアジノンの選択毒性に関係あることを指摘した。ダイアジノンとダイアゾクソンの代謝を行う酵素は筆者らによって明らかにされた。すなわち、グル



第3図 PSC の代謝経路と毒性 (KRIEGER et al., 1976)

タチオン *S*-トランスフェラーゼ, mfo, アリールエステラーゼ (SHISHIDO ら, 1972 a, b, c) が主要な代謝酵素である (第2図d)。この中でダイアゾクソンを加水分解するアリールエステラーゼは Ca<sup>2+</sup> により活性化され、哺乳動物の組織では活性が高く、特に基質の中でダイアゾクソンに対し極めて高い活性を示すなどの特徴を持っている。一方、昆虫ではこの種の酵素は見いだせないことから、哺乳動物のアリールエステラーゼはダイアジノン代謝における選択性酵素としての役割を果たしていると考えられる (宍戸・深見, 1978)。

近年開発されたピレスロイド系殺虫剤は安定性において優れ、哺乳動物に低毒性 [(+)トランス-レスメスリンのマウスに対する LD<sub>50</sub>, 8,000 mg/kg] で、高い殺虫性 [(+)トランス-レスメスリンのイェバエに対する LD<sub>50</sub>, 0.4 mg/kg] を示すものが多い。ピレスロイドは酸化あるいは加水分解を受け解毒されるが、分子内のエステル部位、酸部位の構造や、立体異性体により攻撃される位置や代謝速度が異なってくる。(+)トランス-レスメスリンの場合は第2図eに示した個所で酸化と加水分解を受けることが明らかにされている。哺乳動物と昆虫はほぼ類似の代謝経路をたどるが、mfo 活性、エステラーゼ活性ははるかに哺乳動物が高く、この解毒代謝の大小がピレスロイドの選択毒性を支配していると考えられている (CASIDA ら, 1975/76)。

(2) カルバミル基の修飾による選択毒性

カーバメート殺虫剤はカルボフランのようにかなり哺乳動物に毒性の強いものが多い。これは P=S 型有機リン剤のように活性化を必要とせず、直接に AChE を阻害するために、解毒代謝系が有効に作用する機会因子あるいは遅延因子を欠くことに一因がある。

FUKUTO (1977) はカーバメートの活性グループ CH<sub>3</sub>NHCO-の *N*-水素原子を種々の保護基で置換し、生物活性の発現には保護基の除去を必要とする、すなわち活性

化を必要とするカーバメートをデザインし、その選択毒性に成功している。N-(dimethoxyphosphinoyl) carbofuran (PSC) は元のカルボフランに比べマウスに対する毒性が著しく軽減化される。しかも、昆虫に対する殺虫性にはあまり変化はない。この PSC の選択毒性は両生物の代謝経路の違いに基づくことが明らかにされた。第3図に示したように、マウスによる PSC の攻撃箇所はカルバミン酸エステル部位で、carbofuran phenol, 3-ketocarbofuran phenol, 3-hydroxycarbofuran phenol などの加水分解物がほとんどを占める。一方、イェバエでは N-P 結合が開裂し、主要代謝物としてカルボフランを生じ、フェノール性代謝物はほとんど生成しない。カルボフランはもとの PSC よりも殺虫性と AChE 阻害度が高いことから明らかに活性化反応である (KRIEGER ら, 1976)。

また、ゼクトランに *N*-アセチル基 (MISKU ら, 1969) を、カルボフランに *N*-arylsulfonyl 基 (BLACK ら, 1973) を導入した場合も著しい選択性が現れる。この場合も PSC と同様に、昆虫では *N*-置換基の離脱による活性化反応が、哺乳動物では脱エステル化によるフェノール体への解毒代謝がそれぞれ優先して起こる。

III 標的特異性

昆虫ホルモンの生理・生化学の進展に伴い、これらの知見を基に新たな殺虫剤が開発利用されつつある。現在昆虫生長制御剤と呼ばれているもので、2, 3のものが実用の域に達している。これらの殺虫剤は今まで述べてきた物理的、化学的因子が介入することにより生ずる選択毒性剤とは基本的に異なり、作用点は昆虫のみに存在することから、昆虫に特異的に作用するが、標的を持たない人畜その他生物に与える影響は少ないという特徴を持っている。

メソプレンは幼若ホルモンと類似構造を持ち、ホルモ



ンバランスを崩すことにより致死作用を表す。カヤハエの幼虫防除に使用されている。哺乳動物に対する毒性は低く、ラットの LD<sub>50</sub> は >34,600 mg/kg で、イエバエでは 0.02 mg/kg である。しかし、この薬剤の変態阻害効果は主に昆虫の終令幼虫期に限られること、致死までにかかなりの長時間を要すること、適用害虫の範囲が比較的狭いことなどの短所を持っている。

ディミリンはフェニルベンゾイル尿素系の化合物で、昆虫表皮形成阻害剤とも呼ばれ、鱗翅目、双翅目幼虫に卓効を示す。マウスに対する経口毒性は 4,640 mg/kg で、急性毒性はかなり低い。昆虫表皮の主成分であるキチンの生合成阻害が作用点である。幼虫は新しい表皮の形成がうまく行われなため、脱皮時に死亡する。キチン生合成系は哺乳動物に存在しないため哺乳動物との間に高い選択毒性効果が現れる。この殺虫剤は食毒としてのみ有効であることから、対象害虫は限られている。また、効力発現までに日時を要することから、化学的に比較的安定な構造が必要となってくる。この点、薬剤の残留、環境面での動態に十分注意を払う必要がある。

### おわりに

以上、様々の要因に基づく殺虫剤の選択毒性の事例を説明してきたが、新しい選択性殺虫剤の分子設計を行うための基礎的な知見として、選択毒性機構の解明は今後もますます重要視されるであろう。主に物理的要因と生化学的要因を付加することにより開発利用されてきた従来の選択性殺虫剤の流れに加えて、標的特異性に基づく殺虫剤のデザインが、昆虫生理学・生化学・生態化学の進展を基盤として、今後幅広く行われるようになる。その標的として、昆虫特有の神経伝達機構やエネルギー代謝系の阻害、抗ホルモンとホルモン産生阻害、表皮形

成に関与する各種酵素の阻害などが挙げられる。

### 主な引用文献

- CASIDA, J. E. et al. (1975/76) : Arch. Environ. Contami. Toxicol. 3 : 491~499.
- FUKAMI, J. and T. SHISHIDO (1966) : J. Econ. Entomol. 53 : 1338~1346.
- FUKAMI, J. et al. (1970) : In "Biochemical Toxicology of Insecticides" (ed. R. D. O'BRIEN and I. YAMAMOTO) pp. 159~178.
- FUKUTO, T. R. (1977) : J. Pesticide Sci. 2 : 541~548.
- HOLLINGWORTH, R. M. et al. (1967) : J. Agric. Food Chem. 15 : 235~249.
- (1976) : In "Insecticide Biochemistry and Physiology" (ed. C. F. WILKINSON) pp. 431~506.
- KRIEGER, R. I. et al. (1976) : Pestic. Biochem. Physiol. 6 : 1~9.
- KRUEGER, H. R. et al. (1960) : J. Agric. Food Chem. 53 : 25~31.
- MILLER, T. A. et al. (1979) : Pestic. Biochem. Physiol. 10 : 128~136.
- O'BRIEN, R. D. (1961) : In "Advances in Pest Control Research" (ed. R. L. METCALF) vol. IV, pp. 75~116.
- and R. W. FISHER (1958) : J. Econ. Entomol. 51 : 169~175.
- 齊藤哲夫 (1961) : 名古屋大学農学部害虫学教室特別報告, 第1号, pp. 1~53.
- SHISHIDO, T. and J. FUKAMI (1963) : Botyu-Kagaku 28 : 69~76.
- et al. (1972 a, b, c) : Pestic. Biochem. Physiol. 2 : 27~61.
- 穴戸 孝・深見順一 (1978) : 農技研報C 32 : 1~83.
- WUSTNER, D. A. et al. (1973) : J. Agric. Food Chem. 21 : 756~761.

## 「植物防疫」専用合本ファイル

本誌名金文字入・美麗装幀

本誌B5判12冊1年分が簡単にご自分で製本できる。

- ①貴方の書棚を飾る美しい外観。 ②穴もあけず糊も使わず合本ができる。  
③冊誌を傷めず保存できる。 ④中のいずれでも取外しが簡単にできる。  
⑤製本費がはぶける。

頒価 1部 400円 送料 200円

御希望の方は現金・振替・小為替で直接本会へお申込み下さい。



## ピレスロイド系殺虫剤の化学構造と作用性

住友化学工業株式会社 藤 田 義 雄

## はじめに

天然ピレトリンの化学的研究は、山本ら、STAUDINGERらによって開始され、LA FORGE ら、GODIN らによって完成された。これと並行し、殺虫作用あるいは薬理作用も、古くから研究対象として多面的に取り扱われてきた。合成ピレスロイドも、アレスリンの発明以来化学、生物学両面からたゆみない研究が続けられ今日に至っている。

1970年代に入って創出された合成ピレスロイドの幾つかが、有機塩素系あるいは有機リン系殺虫剤の使用によって提起された、毒性、残留性、薬剤抵抗性などの問題への一つの回答となりうる事が判明し、農業分野での広範な適用が期待されることから、近年特に関心が高まっている。こうした事情を背景として、ピレスロイドに関する国際的シンポジウムはここ毎年のように開催され、また、専門紙上に発表される論文も極めて多く、それらを基にした優れた総説も、少なからず公にされている<sup>1,2,3,4,5,6</sup>。筆者はここで農業として見たピレスロイド系殺虫剤に焦点を合わせ、なるべく今日の話題を中心で紹介することとした。

## I ピレスロイドの化学

## 1 天然ピレトリンの殺虫成分と性質

ピレトリンはシロバナムシヨケギクの花に含有される殺虫成分の総称で、化学的には第1図に示した6化合物が同定されている。いずれも、シクロプロパンカルボン酸とシクロペンテノロンを基本骨格としたエステルで、酸成分の C<sub>1</sub> と C<sub>3</sub> とアルコール側の C<sub>4</sub> は不斉炭素で、絶対配置はそれぞれ R, R (菊酸側 (+) トランス体), S である。親油性が大きく、水にほとんど溶けず、常温常圧下でほとんど揮散しない。また、化学的安定性に乏しく、自然条件下では容易に分解が進むが、ピペロニルブトキサイドあるいはアルキルフェノール系酸化防止剤の添加は、それをある程度抑制する。

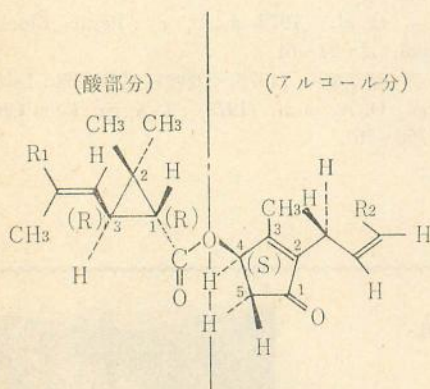
## 2 合成ピレスロイドの化学構造と性質

合成ピレスロイドの創成研究は 30 余年の歴史を持っており、その過程で試みられた構造修飾例をここで枚挙するのは困難である。その中から、現在実用されているもの及びそれらと構造上関係の深いものを選び、系統的に配列し第2図に示した。また、これらのうち主だったものの性質と毒性を第1表に示した。

典型的な天然物のアナログであるアレスリン、菊酸構造に共通点を残したテトラメスリン、レスメトリン、フェントリンが家庭用殺虫剤の場面でピレトリンに徐々に置き換わる一方で、合成ピレスロイド研究は更にピレトリンの基本骨格を脱却する方向をたどり、結果としてピレトリンになかった強力な殺虫力と安定性の大幅な増大をもたらした。その最も顕著な例はフェンパレートを含む、フェニル- $\alpha$ -イソ酪酸 (以下 CPI 酸と略す) エステル系化合物で、ここにはピレトリンの基本骨格はもはや存在しない。しかるに、フェンパレートを含ま CPI 酸エステルには、立体化学的側面あるいは後述する生物学的特性面で、他のピレスロイドと共通するところが多くあり、そうした観点からこれらも一般に合成ピレスロイドの一種として扱われる。

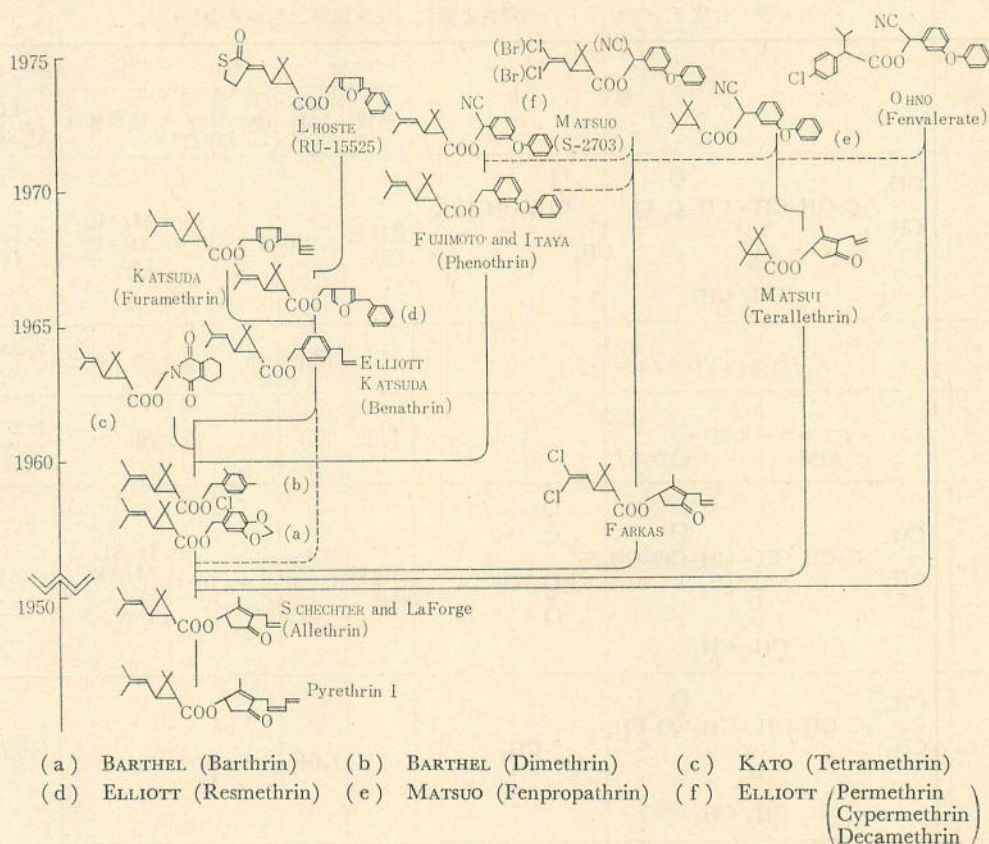
3 合成ピレスロイドの異性体<sup>2,8)</sup>

通常の工業的な方法によって得られる合成ピレスロイドは、様々な異性体の混合物である。アレスリンは菊酸側構造にシス、トランス異性と、それぞれに (±) 光学異性があり、アレスロン (アルコール) 側にも (±)



酸部分 (名)	アルコール部分	成分名
R <sub>1</sub> : -CH <sub>3</sub> (第一菊酸, 菊酸)	R <sub>2</sub> : -CH=CH <sub>2</sub>	ピレトリン-I
〃	: -CH <sub>3</sub>	シネリン-I
〃	: -CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	ジャスモリン-I
R <sub>1</sub> : -COOCH <sub>3</sub> (ピレトリン酸)	R <sub>2</sub> : -CH=CH <sub>2</sub>	ピレトリン-II
〃	: -CH <sub>3</sub>	シネリン-II
〃	: -CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	ジャスモリン-II

第1図 天然ピレトリン成分の名称と構造



第2図 合成ピレスロイド発展系統図

光学異性体が存在するので、工業品は合計8種の異性体の混合物である。テトラメスリン、レスメトリン、フラメトリン、フェノトリンはアルコール側構造に不斉炭素を持たない菊酸エステルで、酸構造に由来する(±)シス、トランス計4種の異性体を含み、テラレスリンは酸側に異性がないアレスロロンエステルで、アルコール構造による(±)光学2異性体から成る。パーメスリンの酸側(ジハロビニル-ジメチルシクロプロパンカルボン酸(以下DV酸と略す))の配置は菊酸と同じで、シス、トランス異性とそれぞれに(±)光学異性がある。S-2703はアルコール側(α-シアノフェノキシベンジルアルコール(以下CYNHと略す))に、絶対配置でS及びRの2光学異性があり、酸側との組み合わせで8種の異性体から成る。同じく、サイパーメスリンは8種の、フェンプロパスリンは2種の異性体からそれぞれ成っている。フェンバレレートは酸側構造には、絶対配置でS及びRとなる光学異性がある。したがってフェンバレレートはアルコール側との組み合わせで、合計4種の異性体から成る。

上に述べた各異性体は、一般の化学的挙動は類似しているが、生物に対する活性は大きく異なる。特に光学異性の場合、混合物の示す活性は一方の異性体にもっぱら依存したかたちで現れる。活性の高い異性体を取り出して用いれば、応分の殺虫性能増大が期待されるが、一方で製造コストも上昇する。合成ピレスロイド系殺虫剤を工業化する段階では、殺虫力、毒性、薬害性、環境への影響及び製造技術上の得失を総合的に判断して混合物、活性体のいずれかが採択される。現在、アレスリン、レスメトリン、フラメトリン、衛生害虫用フェノトリン、デカメスリン\*及びRu-15525の工業原体は活性異性体である。

## II ピレスロイドの作用性

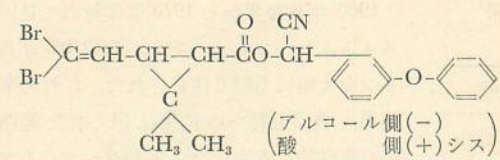
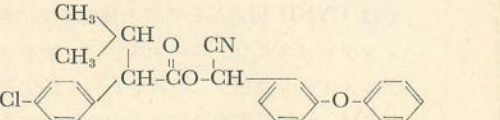
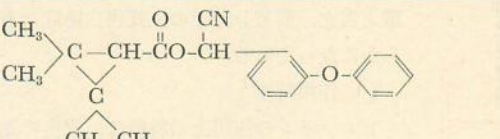
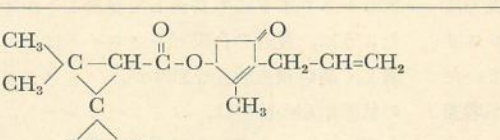
### 1 ビレトリンの作用<sup>9,10)</sup>

ビレトリンを構成する6成分の中で殺虫作用の強い

\* デカメスリンは第1表記載の平面構造化合物のアルコール側S、酸側(+)シス(1R, 3R)異性体の一般名。

第1表 合成ピレスロイドの物理性と毒性 (住友化学工業株式会社)

名称	化学構造	物理性			急性毒性 <sup>b)</sup> ラット経口 LD <sub>50</sub> (mg/kg)	
		外観	比重 (d <sub>4</sub> <sup>25</sup> )	蒸気圧 (mmHg/ 20°C)		溶解性 <sup>a)</sup>
アレスリン		黄褐色油状	1.010	4.2×10 <sup>-5</sup>	M/AL, AR, C I/W	2,430/雄 720/雌
(d)-アレ スリン	同上 (酸側(+))シス/トランス)	同上	同上	同上	同上	2,200/雄 520/雌
[(+)]ロン d]-アレ スリン	同上 (アルコール側(+)) (酸側(+))シス/トランス)	同上	同上	同上	同上	1,290/雄 430/雌
テトラメ スリン		白色結 晶状	1.110	2.4×10 <sup>-6</sup>	H/AL, M/AR, C I/W	>5,000/ 雄, 雌
レスメト リン		同上	1.040	3.5×10 <sup>-6</sup>	同上	>5,000/ 雄, 雌
(d)-レス メトリン	同上 (酸側(+))シス/トランス)	無色透 明油状	1.045	同上	M/AL, AR, C I/W	450/雄 680/雌
(d)-フラ メトリン		黄褐色 油状	1.025	1.3×10 <sup>-4</sup>	同上	10,000/ 雄, 雌
(d)-フェ ノトリン		無色透 明油状	1.061	1.0×10 <sup>-6</sup>	M/AL, AR, C I/W	>10,000/ 雄, 雌
パーメス リン		黄褐色 油状	1.214	5.5×10 <sup>-7</sup>	同上	430/雄 470/雌
サイバー メスリン		黄褐色 油状	1.226	8.0×10 <sup>-7</sup>	同上	490/雄 470/雌

デカメスリン		白色結晶状	—	$2.6 \times 10^{-7}$	同	上	129/雌 139/雌
フェンバレレート		黄褐色油状	1.175	$2.4 \times 10^{-7}$	同	上	451/雄, 雌
フェンプロバスリン		白色結晶状	1.153	$5.5 \times 10^{-6}$	同	上	54/雌 49/雌
テラレスリン		黄褐色油状	1.014	$2.3 \times 10^{-4}$	同	上	224/雌 174/雌

- a) 溶解度 M : >35%, S : 35~5%, H : <5%, I : <0.05%, AL : 脂肪族炭化水素, AR : 芳香族炭化水素, C : 塩素化炭化水素, W : 水  
b) デカメスリン毒性値は Procida 社 (仏) 資料による。

は、ピレトリン I と II で、ピレトリン I には速効性と致死作用があり、ピレトリン II はより速効的であるが致死性の劣ることが知られている。ピレトリン全体として見た作用上の特徴は次のように整理される。

① 中毒した虫が短時間で仰転落下 (ノックダウン)、麻痺症状を呈する。

② 中毒虫はノックダウンまたは麻痺状態を継続し、しだいに死んでいくが、一部の虫は途中で蘇生する。

③ ビベロニルプトキサイドなどの協力剤を併用すると殺虫力が顕著に増強される。

④ 接触毒としてもっばら作用し、食毒あるいは、ガス効果は微弱である。

⑤ 中毒虫はノックダウンに至る以前に、けいれんあるいは一種の興奮症状を呈し、潜伏個所から飛び出す (flush out), 寄生植物上から逃避 (escape), 食害停止 (feeding deterrent) などの行動を示す。

⑥ 高温より低温で高い活性を示す。

⑦ 双翅目, 鱗翅目, あるいは半翅目, 直翅目の一部に強力に作用するが, どちらかと言えば狭スペクトル殺虫成分である。他動物との関係を見ると, 哺乳動物, 鳥類に低毒である一方, 魚類には比較的毒性が高い<sup>3,6)</sup>。

⑧ 植物体への浸透, 移行作用はほとんど無い。

⑨ 残効性にはなはだ乏しく, 特に日光の直射するほ

場条件では散布直後の効果も室内実験値に比べるとかなり低い。

以上の作用をもたらすメカニズムは生理学的あるいは生化学的にかなり究明されている。

ピレトリンによるノックダウン, 麻痺症状は, 中枢及び末梢神経系の伝導攪乱に由来すると解釈され, 作用点はシナプス, 神経線維のいずれか, あるいは両方と考えられている。神経系の伝導攪乱は, 神経一筋接合部あるいは神経線維細胞膜のイオンポンプ機能を抑制する結果生ずると推定されているが<sup>7)</sup>, この過程に関係の深い ATP ase に対するピレトリンの阻害作用については昆虫を用いた研究例が少ない<sup>11)</sup>。また, 作用部位へピレトリンが到達する時間がノックダウン速度に, その過程での代謝解毒の程度が致死あるいは蘇生にそれぞれ関係付けられている。ピレトリンは昆虫体内で主に酸化的代謝を受けて毒性が低下するが, この酸化反応を触媒する mixed function oxidase の阻害剤であるビベロニルプトキサイド配合によって殺虫力が大幅に向上することは, 致死原因に関する上述の推論の有力なよりどころとなる。

## 2 合成ピレスロイドの作用

既に述べた合成ピレスロイドの化学構造上の様々な変化に伴って, 作用性の面にも多くの進展があった<sup>2,9)</sup>。

第2表 各種ピレスロイドのノックダウン効果  
(住友化学工業株式会社)

対象虫効力 薬剤名	ノックダウン効力相対有効度	
	イエバエ成虫	アカイエカ成虫
アレスリン	0.4	0.4
(d)-アレスリン	1.1	0.8
テラレスリン	0.4	0.8
フタルスリン	1.5	1.2
レスメトリン	0.2	0.2
d-レスメトリン	0.4	0.4
(d)-フラメトリン	1.2	0.8
(d)-フェノトリン	<0.2	<0.2
パーメスリン	<0.2	<0.2
サイパーメスリン	<0.2	<0.2
ピレトリン	1.0	1.0

これらを主作用と見られるノックダウン効果と殺虫力について比較したのが第2表及び第3表である。アレスリンはピレトリンに近いノックダウン効果を持っていたが、テトラメスリン、フラメトリンでは更に性能が増強した。ちなみに、当今の市販家庭用殺虫剤にはノックダウン性能付与の目的でピレトリンと上記3種のいずれかが、もっぱら配合されている。Ru-15525は一連のエタノール系研究の中から見いだされ、極端な低濃度配合でも高いノックダウン性能を維持する点が注目された。また、テラレスリンのアカイエカに対するノックダウン性能は、d-アレスリンと同等であるが、菊酸エステルに比べ蒸気圧が高いので、蚊取線香、電気蚊取などの実用剤型ではより高く評価される。このほか、DV酸エステルの中にも前述したものを上回る活性のものが見いだされている。

1960年代後半から1970年代初めに見いだされた、レスメトリン、フェノトリン、S-2703は殺虫力でピレトリンを大幅に上回り注目された。これら菊酸エステルは結局、農業分野への応用は限られた範囲にとどまったが、化学的に安定なフェノキシベンジルアルコールあるいはCYNH構造がその後の修飾研究の参考とされ、フェンプロバスリン、パーメスリン、サイパーメスリン、デカメスリン及びフェンバレレートが生み出された。これらは、鱗翅目害虫に特に強力に作用する点が共通の特徴と言え、農業分野での主要害虫防除に有用なことが明らかになっている。

## (1)作用特性

ピレトリンの作用上の特徴は、程度の差はあっても合成ピレスロイドにも共通して見ることができる。前述したように、最近の合成ピレスロイドはピレトリンに比べ著しく高い殺虫活性を示すが、ノックダウン症状及びその状態からの蘇生は、フェンバレレート、パーメスリンなどによって中毒した昆虫でも観察され、接触毒として主に作用し<sup>12)</sup>、高温より低温で効果が高く現れることなども知られている<sup>13)</sup>。また、殺虫スペクトル上の共通点も多く、双翅目、鱗翅目昆虫には特に高い活性を示す。なお、フェンバレレートがミツバチや、寄生蜂の一種(*Camponotus sonorensis*)、クサカゲロウの一種(*Chrysopa carvea*) (後2者はいずれも *Heliothis zea* の天敵として知られる)に低毒である点は<sup>14)</sup>作用上の特異点として基礎的のみならず、応用面からも注目される。更に、ピレトリンの副次作用としてあげた flush-out 効果は、パーメスリン、フェンバレレートで、ゴキブリ類などに対し

第3表 各種ピレスロイド系化合物の殺虫力 (住友化学工業株式会社)

対象虫効力 薬剤	殺虫力相対有効度					
	イエバエ <sup>a)</sup>	ツマグロヨコバイ <sup>b)</sup>	ハスモンヨトウ <sup>b)</sup>	コナガ <sup>b)</sup>	ニカメイガ <sup>b)</sup>	ミカンハダニ <sup>c)</sup>
レスメトリン	35.5	—	0.2	7.0	<0.1	—
フェノトリン	11.0	2.0	4.0	5.0	<0.1	<0.1
パーメスリン	18.2	5.0	10.0	59.0	3.0	0.1
サイパーメスリン	36.0	35.0	25.0	57.0	—	1.0
フェンバレレート	13.2	14.0	24.0	49.0	5.0	1.0
フェンプロバスリン	13.2	13.0	40.0	30.0	4.0	3.0
ピレトリン	1.0	—	0.6	<0.1	<0.1	<0.1
フェニトロチオン	6.0	<0.1	<0.1	—	1.0	<0.1
ダイアジノン	5.0	3.0	<0.1	—	1.0	<0.1
M P M C	—	1.0	—	—	<0.1	<0.1
メソミル	4.0	—	1.0	1.0	≦0.1	—
ディコホル	—	—	—	—	—	1.0

a) 局所施用法 LD<sub>50</sub> 値を基とし、1.0=0.78 µg/雌。

b) 食葉散布法 散布液 LC<sub>50</sub> 値を基とし、

1.0=70 ppm/ツマグロヨコバイ(中川原系)、31 ppm/ハスモンヨトウ、500 ppm/コナガ、2 ppm/ニカメイガ。

c) ボットテスト(ミカン幼木)における防除効果を基とし、1.0=200 ppm。

顕著に観察され、feeding deterrent 活性は、フェンバレレート、パーメスリン、フェンプロバスリンなどで種類の場面で認められている<sup>8)</sup>。フェンプロバスリンを極めて低い濃度で処理したミカンの葉からハダニが逃亡することが観察されているが<sup>15)</sup>、これは、CPI 酸エステル的一种である S-5447 で報告された<sup>16)</sup> locomotor stimulant 作用と同一のものと考えられる。

フェンバレレート、パーメスリンあるいはフェンプロバスリンを施用したほ場で、特に目立って作物が青々としている、収穫物の外観の仕上がりが大変きれいだ、などと報告されることが度々あるが、ここに述べた副次作用が、ほ場の防除効果に少なからず関与し、もたらした結果と想像される。

合成ピレスロイドの構成成分である各異性体の殺虫力の大小関係は、ほとんどの化合物で詳細に調べられている<sup>2,8)</sup>。その中で、フェンバレレートの酸側S、アルコール側S配置体は他異性体に比べ殺虫力が最も大きい一方、植物に白化作用を示さないのに対し、酸側R、アルコール側R配置体は殺虫力が最小であるが、植物の白化作用は最も強いと報告されている<sup>8)</sup>。光学異性体間の選択毒性の例として注目される。

これまでに述べたいずれの合成ピレスロイドも植物体への浸透、移行作用は認められていない。これもピレトリンとの共通点である。最近の合成ピレスロイドの投薬量は有機リン剤の1/5~1/20であるが、これで十分な防除効果を発揮するために、散布むらのないことが実用上の重要な前提条件となる。

合成ピレスロイドの作用のメカニズムも、既に生理学的あるいは生化学的に種々究明されている。電気生理学的研究の成果<sup>7)</sup>によると、合成ピレスロイドは、いずれも神経の伝導抑制作用を有し、この点でもピレトリンと一致している。しかしながら、個々のピレスロイドの示す伝導抑制作用の大小関係は、それらの殺虫力あるいはノックダウン効果の大小関係とは直接結び付かない。この理由は、ピレスロイドの作用が中枢、末梢両神経にわたり、作用点がシナプス、神経線維の両方にわたり、更に、作用部位に到達する段階で種々の代謝作用を受けるなど、生体内の挙動が複雑なことに帰せられている。合成ピレスロイドの生体内代謝機構に関しては詳細な解説があるが<sup>3,6,17)</sup>、殺虫作用との関係から留意点を記す。テトラメスリン、レスメトリン、フェノトリン、パーメスリンなどの1級アルコールエステルピレスロイドは、体内代謝の初段階で、加水分解酵素の作用を主に受け、特に酸側構造がトランス体のものではその傾向が顕著なことが判明している。一方、2級アルコールエステルであ

るフェンバレレート、サイパーメスリン、フェンプロバスリン、デカメスリンの加水分解はやや緩慢で代謝、分解は主に酸化的に進む。ピレトリンの共力剤として有効なビベロニルプトキサイドは合成ピレスロイドに対し概して効果が弱く、加水分解酵素系を阻害する、NIA-16388などの有機リン酸エステルがテトラメスリンなどの致死効果を顕著に増強する。こうした事実は、上に述べた主代謝経路の相違と符合し、ピレスロイドの殺虫力発現に、体内代謝機構が大きな影響を持つことを物語っている。

## (2) 残効性

ピレトリンの農業分野での使用が、施設園芸などに限定されてきた主たる理由は、一般の農業害虫に対する殺虫力の不足と露地条件下で急速に分解することに原因する極端な残効性の低さに帰せられる。合成ピレスロイドの中でも、レスメトリン、フェノトリン、S-2703などの菊酸エステルを主要農業害虫防除場面で使用すると、残効性能の点で有機リン酸エステル系殺虫剤などに見劣りする。これに対し、フェンバレレート、フェンプロバスリン及びパーメスリンなどの非菊酸エステル系は、殺虫力の強化に合わせ残効性の大幅な増大が認められ農業用殺虫剤として特に注目されている。一例として、アメリカで過去数年にわたって実施したワタ畑での試験成績を第4表に示す。これによると合成ピレスロイド処理区は、モノクロトフォス処理区と同じ散布間隔、しかも著しく低い投薬量で、綿花収量は明瞭に上回っている。この結果施用コストの低下を合わせた経済効果で合成ピレスロイドが、上記有機リン剤に格段に勝ることは明白である。こうした事実を基に、フェンバレレート、パーメスリン、サイパーメスリン、デカメスリンは、綿産出国で実用が開始されている。また、こうした特徴は、他の農業分野からも注目され、海外では野菜、果樹などの害虫防除にも実用され始めている。我が国においても、野菜、果樹、チャなどへの適用が検討されており、第5表に示すように、低い投薬量で、害虫密度を確実に抑制する効果が確認されている。

過去に、DDT、ドリソ系有機塩素剤は、残効性の大きいことで賞用されたが、生物体あるいは環境への残留性、蓄積性の弊害が明らかとなって実用場面からの撤退を余儀なくされた。こうした事例は、残効性の大きいピレスロイド系殺虫剤を使用するうえで他山の石となる。幸い、現在は往時に比べ、こうした面の事前アセスメント体制が格段に充実しており、最近の合成ピレスロイドに関して、既に数多くの事実が明らかにされている<sup>18,19)</sup>。パーメスリン、フェンバレレートで解明された事実を抜

第4表 ワタアカミムシの防除がワタの収量に及ぼす影響の年次推移  
(Imperial Valley, California)

品名	薬劑 (投薬量/エーカー)	綿花収量 (ポンド/エーカー)				
		1974	1975	1976	1977-a <sup>1)</sup>	1977-b <sup>2)</sup>
パーメスリン	0.1	—	2,588	3,256	2,593	—
フェンバレレート	0.1	—	2,931	—	3,420	3,528
デカメスリン	0.01	—	—	3,325	—	3,170
モノクロトフォス	0.5, 0.5, 0.8	—	1,563	2,381	—	2,294
無散布	—	2,100	750	1,831	1,100	2,041
散布回数/シーズン	—	11	10	10	10	11

1) 前作: ワタ, 2) 前作: ワタ以外の作物.

第5表 カンラン生育中期害虫に対する防除効果 (北海道農試, 1976)

供試薬劑 (成分%)	使用濃度		アブラムシ数		アオムシ数		コナガ幼虫数	
	希釈倍数	成分量 (%)	散布前	6日後	散布前	6日後	散布前	6日後
パーメスリン乳劑 (20)	2,000	0.01	1,160	9	17	0	92	3
フェンバレレート乳劑 (20)	2,000	0.01	1,176	11	18	0	69	3
メソミル水和劑 (45)	1,000	0.045	1,395	71	11	2	99	55
無散布	—	—	1,470	4,920	15	122	71	212

散布量: 100 l/10 a, 調査: 試験区全株.

粹すると: ①動・植物体, 土壤, 水系モデルエコシステム中の各種水生生物, あるいは光照射条件のもとで徐々に分解, 代謝される。②生体内で生ずる分解生成物は, いずれも親化合物に比べ低毒性で, 水溶性が大きく, 比較的速やかに体外に排泄される。③生物体内, 環境への親化合物及び分解生成物の蓄積傾向は認められない。: となる。は場投薬量が既存の有機塩素剤, 有機リン剤に比べ 1/5~1/20 と大幅に少ないことと相まって, これらを害虫防除に実用するうえで残留性, 蓄積性が問題化しがたいことが明らかになった結果, アメリカ EPA は本年フェンバレレートなどのワタ用登録を許可している。

## おわりに

ピレスロイド系殺虫剤の農業分野への応用開発は1970年代後半から本格化し, 現在なおその途上にある。こうした意味でピレスロイドに関する化学的側面あるいは生物学的側面についての解明を今後の研究に待つ部分が少なくない。当該分野のスクリーニング研究に携わる立場から今後期待する方向について若干私見を述べたい。

合成ピレスロイドの発展を表した第2図には, 1975年以降の事例を記載していない。この間にも, 以前に増して多数の新規ピレスロイドが発表されているが, 公平に見て, 今までに述べたものの性能を飛躍的に凌駕したもの, あるいは際立った作用上の特徴を有するものはな

く, あえて省略した。この点から, ピレスロイドの構造修飾研究は, 次の飛躍への模索期にあると言える。最近の試み<sup>20)</sup>の中では, 多ハロゲン化, 窒素, 硫黄などの導入によるヘテロ化が注目される。一方, 作用性の面からは, 既存ピレスロイドに無い特性の獲得が研究課題になる。低魚毒性の付与は, ピレスロイドの水田適用を可能にし, 浸透移行性の付与は, アブラムシ類のように作物の新梢部を好んで加害する昆虫, あるいは作物に食入した後のシンクイムシ類の防除を容易にするであろう。また, 鞘翅目昆虫に対する活性の増強が得られれば, 近年しばしば問題とされる土壤害虫防除に一つの回答を与えることになろう。作用機構の面では中枢神経系と並行し, 末梢神経系に対するピレスロイドの作用を詳細に究明し, 併せて昆虫体表の薬物透過性あるいは昆虫体内での薬物代謝に関し, より多くの知見を積み上げることは, 分子レベルでの理解が十分でないピレスロイドの作用の全体像把握によりどこを与え, 化学構造-活性相関研究に寄与することになろう。

最後に薬劑抵抗性の問題について一言する。害虫のピレスロイド系殺虫剤に対する抵抗性は, ピレトリン時代から研究の対象にされてきており, イエバエ, アカイエカなどをピレトリンで人工淘汰して得た系統が, 最近の合成ピレスロイドにも耐性を示すとの報告もある<sup>9)</sup>。こうした事態が農業分野で今後現実化するか否かは予測しがたい。しかしながら, ピレスロイド抵抗性はいずれ将



来起こりうる問題として考え、事前にそれを回避するあるいは重大化を出来るだけ遅延させることに力を注ぐ必要がある。殺虫剤の用法、用量を適正化し、実用の際にこれを遵守することは、毒性、残留問題の回避だけでなく、抵抗性発達を抑制するうえにも意義の深いことである。

### 参考文献

- 1) 山本 出 (1973) : 農学集報 17(4) : 273~313.
- 2) 吉岡宏輔・宮本純之 (1976) : 化学と生物 14(7) : 427~434.
- 3) ———— (1976) : 同上 14(8) : 549~556.
- 4) ELLIOTT, M. (1977) : Synthetic Pyrethroids pp. 1~28.
- 5) ———— et al. (1978) : Ann. Rev. Entomol. 23 : 443~469.
- 6) MIYAMOTO, J. (1976) : Environ. Health Persp. 14 : 15~28.
- 7) 橋本敏夫 (1979) : 農業. 29~38.
- 8) NAKAYAMA, I. et al. (1979) : Advances in

- Pesticide Science 2 : 174~181.
- 9) SAWICKI, R. M. et al. (1962) : J. Sci. Food. Agric. 13 : 172~180.
- 10) ———— and E. M. THAIN (1962) : ibid. 13 : 292~297.
- 11) DESAIAH, D. et al. (1973) : Pyrethrum Post. 12 : 70~75.
- 12) HIRANO, M (1977) : 防虫科学 42(3) : 100~104.
- 13) HARRIS, C. R. and G. B. KINOSHITA (1977) : J. Econ. Entomol. 70(2) : 215~217.
- 14) PLAPP, F. W. JR and S. B. VINSON (1978) : Environ. Entomol. 7(3) : 431~434.
- 15) 真梶徳純 (1977) : 未発表.
- 16) HIRANO, M. and K. FUJIMOTO (1977) : Appl. Ent. Zool. 12(3) : 274~280.
- 17) CASIDA, J. E. et al. (1977) : Advances in Pesticide Science. 2 : 182~189.
- 18) 大川秀郎ら (1979) : 日本農業学会大会講演.
- 19) ————ら (1979) : 日本農業学会誌 (投稿中).
- 20) The Chemical Society (1979) : International Symposium. Chemistry of Pyrethroids., at Oxford.



## 新刊紹介

### 「昆虫の科学」

松本義明・高橋信孝・吉武成美 編

定価 2,600 円

A5判 224 ページ

朝倉書店 発行

(東京都新宿区新小川町2の10)

東京大学においては、教養課程にある学生に幅広い教養を身につけてもらうことを目的として「全学一般教育セミナー」が行われている。そこでは過去において2度昆虫学関係のセミナーが持たれ好評を博したとのことであるが、その講義内容を中心として、昆虫学各分野の話題を1冊にまとめ、広く大学に学ぶ若い人たちや一般社会人の教養の資に供することとした、というのが本書の「まえがき」に書かれている刊行の主旨である。

内容は末尾に紹介したが、各執筆者はそれぞれの専門分野の新知見を限られた紙数内になるべく豊富に盛り込もうとされている。その特徴の幾つかを挙げると、昆虫の変態は物質転換の面から詳述されているし、昆虫の数の章では生態学者のいう密度効果が生態的活生物質やエ

コモンの面から述べられ、昆虫の性の章では性フェロモンが専ら述べられている。昆虫の食物の章もそうであるが、昆虫の科学というよりも昆虫の化学といった感である。しかしその他では、昆虫の形態についてはその「生きざま」との関連でサッと概説された形式に面白さを感じたし、昆虫の遺伝や昆虫と微生物についても同じように短い紙数の中をいかに興味ある内容とするかに苦心されたようで、面白く読ませていただいた。昆虫と人間の病気の章は我々農業昆虫関係者の普通に接する書物では出合わない問題で、私にはよい勉強になったし、昆虫と土壌についてもよく取り上げられた。

分担執筆のため各章に多少調子の違いはあるが、全体を通じ「一般社会人の教養の資」とすることもさることながら、本書は大学の昆虫専攻学生の副教科書としても非常に価値の高いものではなからうか。

### 内容

昆虫と人間の生活 (松本義明)、昆虫の食物 (松本義明)、昆虫の変態 (永田晶男・藤条純夫)、昆虫と性 (高橋信孝)、昆虫の数 (池庄司敏明)、昆虫の遺伝 (吉武成美)、昆虫の形態 (小林正彦)、昆虫と微生物 (渡部仁)、昆虫と人間の病気 (池庄司敏明)、昆虫と植物の病気 (土居養二)、昆虫と土壌 (青木淳一)、昆虫の殺虫剤抵抗性 (正野俊夫)、昆虫と合成化学 (森 謙治)、カイコと日本 (吉武成美)

(農業技術研究所 岩田俊一)

## ツマグロヨコバイのカーバメート系殺虫剤に対する抵抗性の機構

三菱化成工業株式会社 <sup>たか</sup>高 <sup>はし</sup>橋 <sup>よう</sup>洋 <sup>じ</sup>治

## はじめに

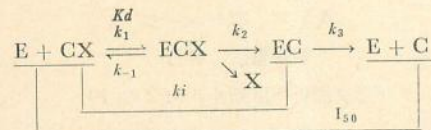
ツマグロヨコバイのカーバメート系殺虫剤（以下、カーバメートと略す）に対する抵抗性の発達は、現場での防除対策のうえで大きな問題を投げかけたことはもちろんのこと、抵抗性機構の主要因が作用点であるアセチルコリンエステラーゼ（以下、AChE と略す）のカーバメートに対する感受性の低下にあることが明らかにされた<sup>9)</sup> ことで世界の殺虫剤抵抗性研究者の興味を引くところとなった。抵抗性機構としての AChE の殺虫剤に対する感受性の低下は、ツマグロヨコバイでの報告以後、イエバエやカといった昆虫でもしばしば報告されている。長い抵抗性機構の研究の歴史の中で、近年にわかにこの問題が重要になってきた理由については明らかでないが、殺虫剤の淘汰が昆虫にとって解毒分解だけでは補いきれないほど強くかかってきたためであろうと想像する研究者もいる。しかし、ツマグロヨコバイにおけるカーバメート抵抗性の機構のように、解毒分解活性にはさほど変化がなく AChE の感受性低下が顕著な例もあり、特定の昆虫・殺虫剤種間で認められる特異的な現象とも考えられる。あるいは、昆虫を使つての酵素研究方法の進歩がこの問題をより研究対象として扱いやすくしたこと、単なる結果であるのかかもしれない。いずれにしても、殺虫剤抵抗性系統（以下、R系統と略す）と感受性系統（以下、S系統と略す）間の AChE の殺虫剤に対する感受性の差が  $I_{50}$  値で何百倍という例も珍しくなく、感受性低下の問題が抵抗性機構の研究の中で今後とも取り上げられることは間違いないであろう。もちろん、ツマグロヨコバイのカーバメート抵抗性においても、その他の抵抗性要因、例えば皮ふの透過性の低下、解毒分解活性の増大など無視できるものではない。このことを裏付ける実験結果が報告されている<sup>7)</sup>。しかし、ここでは抵抗性の機構を作用点である AChE のカーバメートに対する感受性の低下ということに焦点を絞り、話を進めることにする。

## I AChE のカーバメート低感受性の機構

昆虫において抵抗性の機構に AChE の感受性の低下が認められた最初の例は、SCHUNTNER and ROULSTON

(1968) がヒツジキンバエ (*Lucilia cuprina*) におけるダイアジノンR系統の AChE を50% 阻害するに必要な時間が S 系統に比べ長いとの報告であると言われている。しかし、はっきりした形で報告されたのは HAMA and IWATA (1971) のツマグロヨコバイにおけるカーバメート抵抗性の研究であろう。例えば、ツマグロヨコバイの S 系統での propoxur に対する AChE の  $I_{50}$  値が  $1.3 \times 10^{-5} M$  であるのに対し、R 系統のそれは 115 倍の  $1.5 \times 10^{-3} M$  であった。また、7 種類のカーバメートに対する抵抗性の程度 (S, R 系統の  $LD_{50}$  の比) と AChE のカーバメート感受性の程度 (S, R 系統の  $I_{50}$  の比) の間に高い相関があることも認めた。

AChE の阻害剤感受性を論じる時、これまで最もよく使われてきた指標は、AChE と阻害剤の全体的な反応の結果を示す  $I_{50}$  値である。カーバメート系殺虫剤は有機リン殺虫剤と同様に、AChE の阻害過程が解析でき特定の反応定数で示される。すなわち、反応速度論 (kinetics) の実験手法である。この方法により、 $I_{50}$  値で観察された感受性の差の内容、例えば阻害剤がカーバメートであれば、親和定数 ( $Kd$ )、カルバミル化定数 ( $k_2$ )、それに脱カルバミル化定数 ( $k_3$ ) を明らかにし、感受性低下の機構を論じることができる。



(式中、E は AChE、CX はカーバメート、ECX は AChE とカーバメートの複合体、EC はカルバミル化 AChE、X は脱離基を示す)

この実験手法を初めて抵抗性研究に取り入れ報告したのは TRIPATHI and O'BRIEN (1973b) であり、彼らはイエバエにおける Rabon 抵抗性の研究から、R 系統における AChE の Rabon 低感受性の機構が主に AChE の Rabon に対する親和性の低下 ( $Kd$  の増大) であると結論した。全く同様に、ツマグロヨコバイのカーバメート低感受性機構は、R 系統の AChE の N-メチルカーバメートに対する親和性の低下によるものであることが、YAMAMOTO ら (1977) により明らかにされて

第1表 殺虫剤感受性, 抵抗性両系統の AChE を殺虫剤で阻害したときの反応速度定数

定 数	イエバエ <sup>a)</sup> , Rabon		ツマグロヨコバイ <sup>b)</sup> , BPMC	
	感受性系統	抵抗性系統	感受性系統	抵抗性系統
$K_d$ (M)	$4.8 \times 10^{-8}$	$2.8 \times 10^{-5}$	$1.5 \times 10^{-6}$	$5.0 \times 10^{-4}$
$k_2$ ( $\text{min}^{-1}$ )	0.6	1.6	1.3	0.9
$k_1$ ( $M^{-1} \text{min}^{-1}$ )	$1.2 \times 10^7$	$6.0 \times 10^4$	$9.0 \times 10^5$	$1.7 \times 10^8$

<sup>a)</sup> TRIPATHI, R. K. and R. D. O'BRIEN (1973b), <sup>b)</sup> YAMAMOTO, I. et al. (1977).

第2表 殺虫剤感受性, 抵抗性両系統における AChE の基質及び殺虫剤との親和性

	イエバエ <sup>a)</sup>			ツマグロヨコバイ <sup>b)</sup>		
	感受性(S)	抵抗性(R)	R/S	感受性(S)	抵抗性(R)	R/S
アセチルチオコリン ( $K_m$ )	$9.5 \times 10^{-6}$	$3.3 \times 10^{-5}$	3.4	$5.6 \times 10^{-5}$	$1.0 \times 10^{-4}$	1.9
殺虫剤 ( $K_a$ )						
Rabon	$4.8 \times 10^{-8}$	$2.8 \times 10^{-5}$	573	$1.5 \times 10^{-6}$	$5.0 \times 10^{-4}$	346
BPMC						

<sup>a)</sup> TRIPATHI, R. K. and R. D. O'BRIEN (1973b), <sup>b)</sup> YAMAMOTO, I. et al. (1977).

いる (第1表)。

このように, イエバエ, ツマグロヨコバイのR系統における AChE の殺虫剤に対する低感受性は親和性の低下によるものであると結論されたわけであるが, 殺虫剤に対して親和性が低下した AChE の基質, acetylthiocholine (ASCh と略す) に対する親和性 ( $K_m$ ) には第2表に示すようにS系統の間に数倍の差しか認められない。AChE の殺虫剤に対する親和性が極端に低下しているにもかかわらず基質との親和性にそれほどの変化が認められないことは, AChE の殺虫剤と基質との結合部位が全く同じではないことを示唆するものであろう。

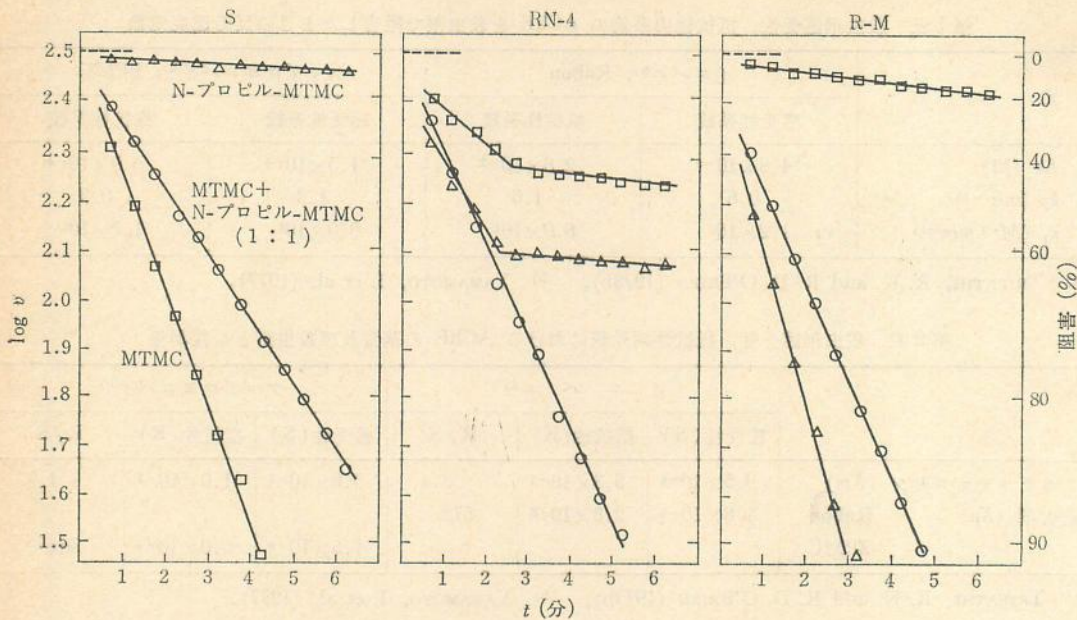
次に, R系統では ASCh より分子量の大きな propionylthiocholine (PrSCh) それに butyrylthiocholine (BuSCh) 分解活性が高いことが認められている。これに関して, HAMA (1978) は AChE 以外に butyrylcholinesterase (BuChE) の存在の可能性を示唆しているが, Sepharose 6-B カラムで分離された BuSCh 活性の高い部分は methyl *n*-butyrate をもよく分解することから, ali-esterase (non-specific esterase) との関連について今後の検討が必要であることも述べている。これとは別に, AChE の N-メチルカーバメートに対する感受性の変化は, 同時に一部 AChE の esteratic site の立体的制約が少なくなり, その結果 PrSCh, BuSCh をもよく分解すると推論できないでもない。感受性の低下した altered AChE\* が N-プロピルカーバメートでよく阻害される<sup>19)</sup>ことはこのことを裏付けているとも考えられる。

ここで次に問題としたいのは, 供試する R 系統の AChE についてである。すなわち, R 系統のすべての AChE の阻害剤感受性が同様に低感受性化しているかどうか, 言い換えれば R 系統の AChE を支配している抵抗性遺伝子がホモかヘテロかということである。多くの場合, ある R 系統の抵抗性遺伝子がホモであるとの結論は, 抵抗性の程度と薬量-死亡率回帰直線式 (以下, LD-P 直線と略す) の傾きからなされる。この判断であると, 例えばツマグロヨコバイのカーバメート抵抗性の標準系統とも言える愛媛県松前町の中川原系統はホモであるということになる。事実, 浜らは中川原系統 (N) を遺伝学的にホモ (RR) として取り扱い実験を進めてきた<sup>5,8)</sup>。しかしながら, 中川原系統の AChE のカーバメート感受性は均一でなく, カーバメートに対して感受性の異なるほぼ二つの AChE から成ること, したがって AChE を支配する遺伝子はヘテロであることが次に述べる阻害実験  $t$  と  $\log v$  の関係から明らかとなった<sup>13,14)</sup>。

## II $t$ と $\log v$

ツマグロヨコバイの AChE のカーバメート感受性を検定するとき, 阻害実験の一つである  $t$  (阻害時間) と

\* 阻害剤に対して感受性の低下した AChE を英語では altered AChE あるいは modified AChE と呼んでいる。日本語には, 定まった用語はないが変成 AChE と呼ぶ人もいる。ここでは altered AChE を使うことにする。



第1図 ツマグロヨコバイ3系統(S, RN-4, R-M)のAChEをMTMC, N-プロピル-MTMC, それに両者の1:1混合剤で阻害したときのtとlog vの関係 (阻害剤濃度はすべて  $2.4 \times 10^{-4} M$ )

第3表 ツマグロヨコバイ3系統のカーバメート系殺虫剤感受性

殺虫剤	LD <sub>50</sub> (μg/g)			抵抗性比	
	感受性	抵抗性			
	S <sup>a)</sup>	RN-4 <sup>b)</sup>	R-M <sup>c)</sup>	RN-4/S	R-M/S
MIPC	2.0	162	565	81	283
BPMC	2.6	143	358	55	138
MTMC	5.1	82	128	16	25
carbaryl	1.1	46	151	42	137

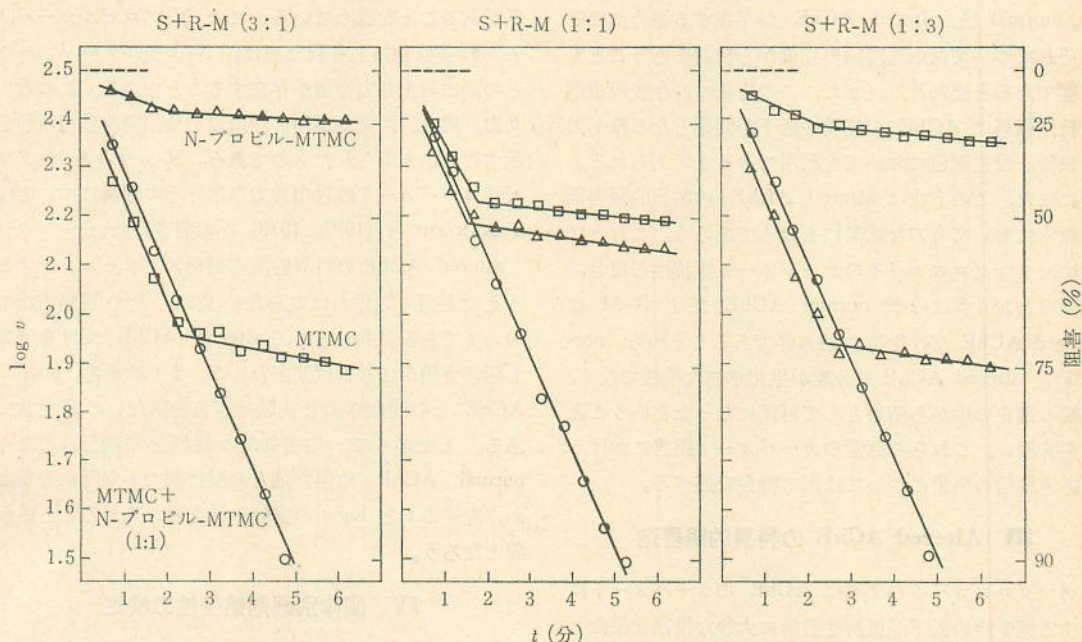
a) S : 埼玉県蕨系統

b) RN-4 : 愛媛県中川原系統

c) R-M : RN-4を親系統にMTMCで16世代室内淘汰した系統

log v (v : AChEの基質分解速度)の実験手法を導入することで, AChEのカーバメート感受性の均一性, 更には normal AChEと altered AChEが存在するときはその組成比を論じることが可能である。ツマグロヨコバイのカーバメート感受性の異なる3系統(S, RN-4, R-M)について, 阻害剤MTMC, N-プロピル-MTMC それに両者の1:1混合剤の同濃度 ( $2.4 \times 10^{-4} M$ )で阻害を行い, そのときのtとlog vの関係を示したのが第1図である。3系統(S, RN-4, R-M)の由来とカーバメート感受性は第3表に示した。MTMCで阻害した

場合, Sでは4分間で90%以上の直線的な阻害が起こり, RN-4では阻害が40%程度でそれ以上進行せずtとlog vの関係が途中で折れ曲がり, 更にR-Mでは阻害が極端に低くなる。一方, N-プロピル-MTMCでの阻害の場合, Sでは阻害が低く, RN-4では60%程度の阻害で止まり, R-MではMTMCのSでの阻害結果とほぼ同様に3分間で90%以上の直線的な阻害結果が得られた。また, 両カーバメートの1:1混合の阻害では, S, RN-4, R-Mともにtとlog vの間に直線的な阻害関係が認められた。以上の結果から, SのAChEが normal AChEより成り, これとは逆にR-MのAChEはほとんどが altered AChEより成ることが想像され, 更にMTMCが normal AChEの, N-プロピル-MTMCが altered AChEのそれぞれ特異的阻害剤であることが明らかとなった。次に, RN-4で認められた直線の折れ曲がりがこの系統に normal AChEと altered AChEの両方が存在する結果であるのかを確認するために, normal AChEだけを持つSと altered AChEだけを持つR-Mの両酵素を比を変えて混合したものについてtとlog vの関係を調べた。その結果が第2図である。SとR-Mを3:1で混ぜた酵素については, MTMCで75%, N-プロピル-MTMCで25%の点でそれぞれ阻害は止まり, 以下1:1, 1:3混合酵素においても, ほぼ理論どおりにtとlog vの関係が得



第2図 normal AChE だけを持つ S と altered AChE だけを持つ R-M の酵素を比を変えて混合した酵素について MTMC, N-プロピル-MTMC それに両者の 1:1 混合剤で阻害したときの  $t$  と  $\log v$  の関係  
(阻害剤濃度はすべて  $2.4 \times 10^{-4} M$ )

られた。また、MTMC と N-プロピル-MTMC 混合剤で阻害した場合には、S と R-M の酵素のいずれの混合比においても、ほぼ一定の直線的な  $t$  と  $\log v$  の関係が得られた。これらの結果から、RN-4 に認められた  $t$  と  $\log v$  の直線の折れ曲がりがこの系統における AChE 感受性の不均一性 (すなわち、normal AChE と altered AChE の混在) を示すものであることを確認した。また、折れ曲がる点からその AChE に占める normal と altered の構成比を論じることも可能であり、RN-4 では normal AChE と altered AChE の比が 2:3 (40% : 60%) であると結論される。

抵抗性系統 RN-4 の例で示されたように、抵抗性の程度と LD-P 直線の傾きから抵抗性遺伝子のホモ、ヘテロを論じ、AChE の薬剤感受性の均一性を推定することは非常に危険であることが分かる。ほ場で採集されるほとんどの R 系統では、その AChE のカーバメート感受性は単一でなく複数であると考えるべきである。この意味から、ある R 系統の AChE の減受性の程度を単に複数のツマグロヨコバイをホモジネートし検定する場合には、normal と altered AChE の混合酵素について結果を得ているということを理解すべきであろう。これに関連して、TRIPATHI と O'BRIEN (1973a, 1975) は、

有機リン剤抵抗性イエバエについてディスク電気泳動法で AChE の isozyme を分離し、個々の isozyme について阻害実験を試みている。彼らの結果には、いまだ混乱があり結論されないが次のように要約される。LD<sub>50</sub> の薬量で中毒させたイエバエについてその AChE を電気泳動で分離すると各 isozyme の阻害剤感受性には差が認められるが、これらの isozyme を混合して阻害の反応速度論により検討を行うと一次の関係にあり、したがって AChE の低感受性化はすべての isozyme に同程度起こっている。ここで我々は、電気泳動上で分離されるバンド (isozyme) の数は薬剤感受性とは必ずしも関係しないということに注意すべきであろう。なぜなら、感受性の異なる isozyme が電気泳動上で分離されるとは限らない。むしろこれまでの検討では AChE の阻害剤感受性の差が恐らく酵素タンパク全体としてはマイナーな変化であるためうまく分離できていないのが現状だからである。したがって、彼らの方法論では normal と altered AChE を分離し阻害実験を行うことはできない。

しかしながら、ここで述べた  $t$  と  $\log v$  の実験手法を導入すれば、ツマグロヨコバイにおいてはその AChE のカーバメート感受性の均一性を容易に知ることがで

き, normal と altered AChE が存在する場合にはそれぞれについて反応速度論の立場から検討を行うことも可能であると思われる。また, この方法は, 今後殺虫剤抵抗性機構に AChE の感受性低下が問題となるほかの害虫種, 殺虫剤種においても利用できると考えられる。更にまた, この方法は altered AChE の特異的阻害剤の探索において有力な武器にもなるであろう。これとは別に, ツマグロヨコバイのカーバメート抵抗性の場合, 前述のとおり S はほぼ normal AChE だけ R-M は altered AChE だけを持つ個体群であることから, normal と altered AChE の分離が生化学的手法でなく, 系統の確立の中から結果として可能になったということは興味深い。これらの酵素のカーバメート阻害における反応速度論の結果については別の機会で述べる。

### III Altered AChE の特異的阻害剤

ツマグロヨコバイのように AChE のカーバメートに対する感受性の低下が抵抗性機構に大きな役割を果たしている場合, 感受性の低下した AChE (altered AChE) を特異的に阻害する物質が見付かれれば, それが抵抗性対策に大きな意味を持つことは容易に想像される<sup>15)</sup>。HAMA and IWATA (1978) は, 中川原 R 系統 (有機リン剤・カーバメート剤複合抵抗性系統) のカーバメート抵抗性の主因子を戻し交配とカーバメート系殺虫剤による淘汰で宮城 S 系統へ導入した Rmc 系統の AChE について実験を進め, malaoxon, fenitrothion-oxon, それに chlorfenvinphos にはカーバメート系殺虫剤と同様感受性の低下が認められるが, diazoxon, pyridafenthion-oxon, それに propaphos が S 系統からの normal AChE より Rmc 系統からの altered AChE をより強く阻害することを報告している。しかしこの場合, propaphos の淘汰では AChE のカーバメート系殺虫剤に対する感受性の復元は認められず, この理由については, 恐らく propaphos 抵抗性は AChE 感受性以外の例えば解毒分解が抵抗性機構として働いているためであろうと推論している。

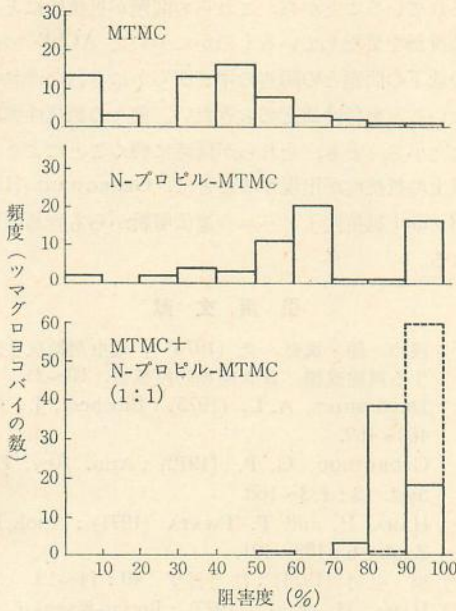
筆者らは既存カーバメート系殺虫剤の一連の構造改変の中から, N-プロピルカーバメートがツマグロヨコバイの altered AChE を normal AChE より強く阻害することを見いだした<sup>19)</sup>。更に最近の室内での淘汰実験から, AChE が N-メチルカーバメートに感受性が低下するほど N-プロピルカーバメートに感受性が高くなり, これとは逆に N-プロピルカーバメートに感受性が低下するほど N-メチルカーバメートに感受性が高くなるという結果が得られ, 両薬剤間には負相関交差抵抗性の関

係があることを認めている。この N-プロピルカーバメートの実際利用上有利な点は, N-メチルカーバメートとの間に殺虫共力作用が存在することである。この殺虫共力作用は, 両薬剤が同じ作用点で負相関交差抵抗性を示すことから得られたものである。N-メチルと N-プロピルカーバメートの殺虫共力作用とその機構については TAKAHASHI ら (1977, 1978) を参照されたい。

altered AChE の特異的阻害剤をスクリーニングするうえで注意しなければならない点は, その実験方法についてである。もちろん, altered AChE だけを分離し阻害実験ができれば問題ないが, 多くの場合, normal AChE との混合酵素で実験せざるを得ないのが現状である。したがって, 阻害効果の評価を単剤だけでなく normal AChE の阻害剤との混合剤でも同時に行うとか, 前述のと log v の実験手法を取り入れることが必要となろう。

### IV 個体別薬剤感受性の検定

昆虫の体が小さく, 1 個体の持つ AChE の量が少ないために, その阻害剤感受性の実験は複数の虫を同時にホモジネートし集団としての感受性を論じている場合がほとんどである。しかし, 実験方法をマイクロ化するなどの工夫をすることで, 個体別に感受性を検定することは必ずしも不可能なことではない。個体別感受性の検定が可能になれば, 我々はこれまでとは違った全く新しい情報を得ることができ, 特に抵抗性発達機構の解析の中で大きな意味を持つ。これに関連して, 筆者らの最近のデータを紹介する。第 1 図に示した RN-4 の結果は, ツマグロヨコバイ約 500 頭を同時にホモジネートし酵素液を得て阻害実験を行ったものである。したがって, 第 1 図だけからは, 単に感受性の個体と抵抗性の個体が混ざりあった結果か, あるいは個体が normal と altered の両 AChE を持つ結果かを判断することはできない。そこで, 個体別に t と log v の実験を行ったところ, 第 3 図に示す結果を得た。これは, 阻害 3 分後における阻害%の頻度を 60 頭の個体について示したものである。阻害剤は MTMC, N-プロピル-MTMC それに両者の 1 : 1 混剤であり, 濃度はすべて  $2.4 \times 10^{-4} M$  である。MTMC の阻害で阻害率 10% 以下という個体もかなり存在するが, 頻度が最も高いのは阻害率 30~40% 前後の個体である。N-プロピル-MTMC の阻害では 60~70% 阻害を受ける個体の頻度が最も高い。この結果から, RN-4 の集団で得られた normal と altered AChE は, normal AChE を持つ感受性の個体と altered AChE を持つ抵抗性の個体が混ざった結果というよりも, 両方

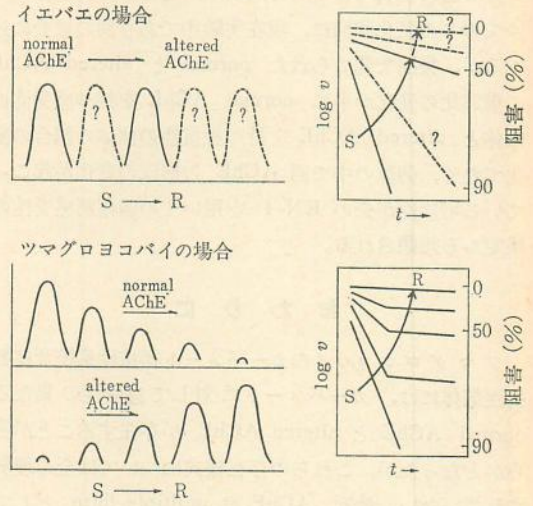


第3図 ツマグロヨコバイ抵抗性系統 RN-4からの雌成虫 60 頭について、個体ごとに MTMC、N-プロピル-MTMC、それに両者の 1:1 混合剤 (濃度はすべて  $2.4 \times 10^{-4} M$ ) で阻害し、 $t$  と  $\log v$  の関係を求めたときの阻害 3 分後の阻害度 (%) の頻度 (混剤の場合の点線は、阻害 5 分後の結果を示す)

の AChE を持つ個体が存在することによるものであることが明らかとなった。更に、normal と altered AChE の構成比が 2:3 (40%:60%) である個体の頻度が最も高いことが、集団での両 AChE の構成比と一致していることも興味深い。

### V 抵抗性の発達機構

ツマグロヨコバイのカーバメート抵抗性のように、抵抗性機構が比較的単純ではっきりしている場合には、このことが抵抗性の発達機構の解析に好材料となる。中でも、抵抗性が pre-adaptation か post-adaptation か?、系統の抵抗性レベルを決定するのは単にその集団に占める感受性個体と抵抗性個体の比なのかあるいは個体の中で勾配の一定した変化が起こりうるのか?、などの問題である。抵抗性研究が、単に感受性と抵抗性の比較研究に終わっては、抵抗性の原因を明らかにすることはできてもその発達機構を知ることはできず十分とは言えない。理想的には、室内で淘汰実験を繰り返すことにより種々の抵抗性レベルを示す系統を入手し、これらについて集団はもちろん個体レベルでその抵抗性程度、機構を



第4図 イエバエ、ツマグロヨコバイにおける殺虫剤抵抗性の発達過程における normal AChE と altered AChE の様相の模式図と、そのときの阻害剤感受性を示す  $t$  と  $\log v$  の関係 (詳細は本文を参照)

明らかにすることである。そうすることで、上記のような抵抗性における基本的な問題点に答える材料ができる。

このことに関連して、イエバエでの実験例と筆者らのツマグロヨコバイでの実験結果を併せ紹介する。これまで AChE 殺虫剤低感受性が抵抗性機構の主要因として報告されているイエバエで、TRIPATHI and O'BRIEN (1973a, 1975) と DEVONSHIRE (1975) の実験例を要約すると第4図のようになる。感受性から抵抗性への変化は、AChE の normal から altered への変化であり、R 系統では AChE のすべてが同程度低感受性化している。そして、R 系統では S 系統に比べ、 $t$  と  $\log v$  の関係が傾きが小さくなり阻害されにくくなるが直線関係にある。この場合、R 系統の抵抗性遺伝子がホモであるかどうか問題となる。ホモであると仮定すればここに至るまでの途中の R 系統ではどうなっているかが重要であり、ホモでないとするれば第4図の点線で示した抵抗性への変化傾向が想像される。一方、ツマグロヨコバイ S 系統を MTMC で淘汰していくと、集団では AChE の normal と altered の構成比の変化が起こる (第4図)。したがって、MTMC 阻害での  $t$  と  $\log v$  の関係は全体として漸次低感受性化するが、この変化は  $t$  と  $\log v$  の関係が途中で折れ曲がった状態で進行する。このように、ツマグロヨコバイのカーバメート抵抗性の発達は、normal AChE が減少し altered AChE が増加すると

いうことで説明できることが明らかとなった。個体レベルでのこの変化傾向は、現在実験中であり別の機会に述べるが、集団で認められた normal と altered AChE の構成比の変化が単に normal AChE を持つ感受性の個体と altered AChE を持つ抵抗性の個体の割合の変化でなく、個体の中で両 AChE の構成の変化が起きている可能性が先の RN-4 を用いての個体別感受性の検定から想像される。

### おわりに

ツマグロヨコバイのカーバメート抵抗性系統及び抵抗性個体には、カーバメートに対して感受性の異なる normal AChE と altered AChE が存在することが明らかとなったが、これらの存在様式については全く理解されていない。最近、AChE は multiple-form として存在していることが種々の動物、昆虫で明らかにされてきた。しかし、ツマグロヨコバイの場合、例えば I 酵素タンパク上に活性部位が複数存在するかどうかは明らかでない。したがって、normal AChE と altered AChE が I 酵素タンパク上に同時に存在するのか、全く異なった酵素として存在するのかについては今後に残された問題である。この意味から、現時点では normal AChE, altered AChE と区別するよりも、AChE の normal 阻害部位, altered 阻害部位と呼ぶのが適当であるとも言える。また、normal 阻害部位と altered 阻害部位の違いを、酵素タンパクのアミノ酸組成の差としてとらえ明らかにすることも今後の研究課題として挙げられる。

ツマグロヨコバイの有機リン殺虫剤例えば malathion に対する抵抗性の機構は、代謝実験から解毒分解あるいは malaaxon の蓄積の差などであると説明され、AChE の感受性にはそれほど差が認められていない<sup>9),10)</sup>。同じ昆虫種で、同じ作用点をもつ有機リン殺虫剤とカーバメート系殺虫剤の抵抗性機構が全く異なることの原因は何であるのか、カーバメートがそれほど代謝されにくい化合物ではないことを考えると興味深い。もっとも、このことはツマグロヨコバイ特有の性質によるものではあろうが。

ツマグロヨコバイのカーバメート系殺虫剤抵抗性の機構を作用点の感受性の低下に絞って話を進めてきたが、初めに述べたように、皮ふ透過性、解毒分解にも差が認

められていることから、これらの問題が抵抗性にどの程度の役割を果たしているものかについて AChE の感受性の低下の問題との関連の中で明らかにされなければならないことを付け加えておきたい。個々の抵抗性要因がたとえ小さくとも、それらが同時に働くことにより、想像以上の抵抗性が出現することは、GEORGHIOU (1972) の Ronnel 抵抗性イエバエの遺伝解析からも容易に類推される。

### 引用文献

- 1) 浅川 勝・風野 光 (1978) : 殺虫剤抵抗性に関する試験成績 日本植物防疫協会. 10~21.
- 2) DEVONSHIRE, A. L. (1975) : *Biochem. J.* 149 : 463~469.
- 3) GEORGHIOU, G. P. (1972) : *Ann. Rev. Ecol. Syst.* 3 : 133~168.
- 4) HAMA, H. and T. TWATA (1971) : *Appl. Ent. Zool.* 6 : 183~191.
- 5) 浜 弘司 (1974) : *防虫科学* 40 : 14~19.
- 6) HAMA, H. et al. (1977) : *Botyu-Kagaku* 42 : 188~197.
- 7) ——— (1978) : *Appl. Ent. Zool.* 13 : 324~325.
- 8) ——— and T. IWATA (1978) : *ibid.* 13 : 190~202.
- 9) IWATA, T. and H. HAMA (1971) : *J. Econ. Ent.* 65 : 643~644.
- 10) MIYATA, T. and T. SAITO (1976) : *J. Pesticide Sci.* 1 : 23~29.
- 11) SCHUNTNER, C. A. and W. T. ROULSTON (1968) : *Aust. J. Biol. Sci.* 21 : 173~176.
- 12) TAKAHASHI, Y. et al. (1977) : *J. Pesticide Sci.* 2 : 467~470.
- 13) ——— (1978) : *ibid.* 3 : 55~58.
- 14) 高橋洋治ら (1979) : 日本農薬学会第4回大会講演要旨集.
- 15) ——— (1979) : 農薬—デザインと開発指針—山本・深見編, ソフトサイエンス社, p. 663~692.
- 16) TRIPATHI, R. K. and R. D. O'BRIEN (1973a) : *Pestic. Biochem. Physiol.* 2 : 418~424.
- 17) ——— . ——— (1973b) : *ibid.* 3 : 495~498.
- 18) ——— . ——— (1975) : *Isozyme II, Physiological Function*, C. L. MARKERT (ed.) Academic Press, p. 395~408.
- 19) YAMAMOTO, I. et al. (1977) : *J. Pesticide Sci.* 2 : 463~466.



# 除草剤の選択殺草性

理化学研究所 <sup>ひやく</sup>百 <sup>たけ</sup>武 <sup>ひろし</sup>博

## はじめに

戦後、耕地における雑草防除が種々の除草剤を使って行われるようになって以来、年月の経過とともに、雑草を単に枯殺すればよいというそれまでの考え方から、作物と雑草間に差が生ずること、つまり選択殺草性の重要性が強調されるようになった。

選択殺草性とは、除草剤がある植物に対して、他の植物よりも強い影響を与えることを言い、このような性質を有する除草剤が植物群に散布された場合に、ある植物は生長を阻害されたり、または枯殺され、他の植物はほんのわずかか、または全く影響されないときに選択殺草性が生ずる。この選択殺草性は相対的なものであり、濃度または薬量に依存するものもある。除草剤の使用場面における選択殺草性は、保護されるべき立場にある作物にとって重要であると同時に、人間を含む生物に害を与えないという幅の広い見地からの選択殺草性は絶対に不可欠なものである。また、殺虫剤や殺菌剤の場合と異なることは枯殺される側の雑草も保護される側の作物も植物のカテゴリーに属している点である。このように、除草剤の選択殺草性は、雑草と作物の生長習性、形態、生理生化学的側面における作物と雑草とのごく小さな、しかし重要な差異に基礎をおいている。

除草剤の選択殺草性を解明することは、除草剤の安全使用の面からだけでなく、有効な選択性除草剤を開発していくための基礎となり、また、個々の植物が有する種特異性を見いだすうえでも有意義なことと言える。除草剤の選択殺草性については、これまでに幾つかの報告<sup>17, 12, 13, 26, 14</sup>)があり、生理生化学的側面から詳述されている。ここでは、これまでに明らかにされている選択殺草性について概括することにしたい。

## I 選択殺草性発現に関係する要因

選択殺草性の発現にはいろいろの要因が考えられるが、ここでは次のように分けて解説を試みることにする。

### 1 処理位置、処理時期の差による選択殺草性

選択殺草性は作物と雑草とが場所または時間の点で区別されているために生ずることがある。例えば、低い空間で生長している雑草は除草剤の処理を受けるが、高い

空間で生育している作物は除草剤にさらされないような方法で散布されている。土壌を介しては作用しないダイコートのような発芽前接触型除草剤の使用は、雑草の発生後、作物の出芽前に処理される時間をずらしての一例である。処理位置の例として、CNPのイネ・タイヌビエ間の選択殺草性が挙げられる。すなわち、両植物の幼根部にCNPを処理した場合には選択性が全く認められない。一方、幼芽部処理ではイネの生育は大して影響を受けないが、タイヌビエは強く阻害され、選択殺草性が認められる<sup>10</sup>)。

### 2 植物の形態・生態の差による選択殺草性

植物は単子葉、双子葉といった外部形態の差異、生長点の位置、葉の表面の性状の差異など多様性に富み、これらの差異が選択殺草性に影響する。

形態的な差異は、①除草剤の選択的な処理を可能にする。②除草剤による薬害から植物の分裂組織の部分を保護する。③散布薬液の保持と除草剤の吸収に影響する植物表面の性状の差異とかかわりを持つ。除草剤は、草丈が高くかつ生化学的に抵抗性の茎を持つ植物よりも、地表面近くに生育している雑草により多く散布され、付着することになる。

植物の分裂組織部分の位置は薬剤抵抗性に関して重要な意味を持っている。双子葉植物(広葉植物)は分裂組織が茎の先端にあり、頂端生長を行っており、新しい生長は主として頂部に起こる。頂部は除草剤の処理にさらされたままである。単子葉植物(イネ科)は側生の分裂組織または節間分裂組織から生長し、これらの分裂組織は普通は保護されている。イネ科の茎は節間が伸長し、各節は分裂組織を有する。節は葉鞘によって保護されており、休眠中は、節は地中下の冠部に存在する。多年生植物は冬期間は休眠し、この時期には土壌表面より下に存在するので、接触型の除草剤から保護されることになる。また、主として土壌表面に残る薬剤に対して深根性の植物は抵抗性を有するが、浅根性の雑草は枯殺されることになる。

BLACKMAN<sup>4</sup>)によると、広葉植物のシロガラシとヒマワリの葉は水平に配列し、水にぬれやすい性質を有する。エンドウの葉は水をはじきやすい。オオムギの葉は狭葉で、直立型の水にぬれにくい葉身である。これらの植物に同一液量の薬剤をそれぞれ散布すると、第1表に

第1表 異なる植物における散布薬液の付着量<sup>4)</sup>

植 物	生 育 ス テ ー ジ	地上部乾物重当たり付着量 (ml/g)
シロガラシ(広葉)	2 葉期, 草丈 5~7cm	2.5
ヒマワリ(広葉)	2 6	2.0
ア マ	8 5	1.1
エンドウ(ろう質葉)	2 5~7	0.4
オオムギ(狭葉直立性)	3 15~20	0.3

示すように、シロガラシとヒマワリはエンドウやオオムギより多くの薬液を保持した。このような wettability の差が、茎葉から吸収される除草剤の選択殺草性に対して、大きく寄与することになり、選択殺草性が葉の形状や構造と密接な関係があると言えよう。

DAVIES ら<sup>6)</sup> は ioxynil の選択殺草性を植物の形態面から検討している。ioxynil に対して、アブラナ科、キク科、タデ科、アカザ科などの広葉雑草は感受性が大きく、マメ科、ナデシコ科、アカネ科は中間、イネ科は抵抗性であることが知られている。ここではオオムギ、エンドウ、シロガラシの3種を比較したが、2~3葉期のシロガラシでは、展着剤加用の有無にかかわらず、単位乾物重当たりの薬剤付着量はほとんど変わらず、常に高い値を示した。その結果から ioxynil の選択性が生ずる第1の原因は、薬液付着の難易にあると考えられる。つまり、シロガラシのように水平葉を持ち、しかも容易に薬液が保持される葉質の植物は感受性が大きい。

エンドウのように水平葉ではあるが、ろう質の葉を持つ植物は、展着剤加用によって薬液の表面張力を低下させるときに感受性を増す。一方、オオムギのような直立葉で、ろう質の葉の植物は薬液が保持されにくく抵抗性が大きい。また、生長点が露出しているかどうかも ioxynil の選択殺草性に関与している重要な要因である。また、キャベツの品種間で NIP に対する抵抗性の大きいものと小さいものがあることが見いだされ、種の面からその選択性を検討した結果、その抵抗性は NIP 処理時期の葉のクチクラ層ワックスの多少に依存していることが判明した<sup>20)</sup>。

### 3 植物の生理的な差による選択殺草性

除草剤の効果発現のためには、除草剤が植物体内に吸収されなければならない。この吸収程度は葉の解剖的構造、茎、根、クチクラ、表皮、師部などの構造や化学的特長に依存する。除草剤の植物体への透過、吸収が作物と雑草間、あるいは作物間、雑草間で異なることがあり、これが選択殺草性の一因ともなっている。

barban (CBN) のコムギ(抵抗性)とエンバク(感受

性)間の選択殺草性は茎葉による薬剤の吸収速度の差に依存し、エンバクのほうがコムギよりも著しく多く吸収することが認められている<sup>15)</sup>。また、chloramben (Amiben) に対し、カボチャ (S) はキュウリ (C) より著しく抵抗性であることが知られている。そこで、カボチャの台木にキュウリ (C/S) を、キュウリの台木にカボチャ (S/C) をそれぞれ接木し、それぞれの根部を chloramben で処理すると、第2表に示すように、地上部がカボチャかキュウリかにかかわらず、その生長は根がキュウリの場合に著しく阻害されることが認められた。この結果から、接穂の chloramben 抵抗性は根に基因すると結論付けられている<sup>3)</sup>。

第2表 接木した植物体地上部の生育に及ぼす chloramben の影響<sup>3)</sup>

植 物	対 照 区 に 対 す る %	
	乾物重	草丈の増加
キュウリ (c)	5	5
カボチャ (s)	84	44
カボチャの台木にキュウリを接木 (c/s)	52	33
キュウリの台木にカボチャを接木 (s/c)	4	6

chloramben の培養液内濃度は 10 ppm

一方、<sup>14</sup>C-chloramben を根に処理すると S/C, C/C 及び接木していないキュウリでは、C/S, S/S 及び S 植物に比べ、5~6倍の chloramben が地上部に移行した。すなわち、キュウリの根は chloramben を活発に地上部に送るがカボチャでは少ないことが、両植物間の選択殺草性の原因となっている。

フェノール系除草剤 DNBP はかなりの選択性を示すことが知られており、新鮮重を 50% 減少させる施用量 (lb./acre) として、コムギ 1.87, トウモロコシ 1.50 からキャベツ 0.06, トマト 0.05 までの開きがある。この選択殺草性の原因は、葉への薬剤透過性の差によるのではなく、植物体内の ATP のレベルの差に問題があり、ATP を高濃度に保ちうる植物は抵抗性が大きくなっている<sup>20)</sup>。したがって、光合成的な ATP 形成ができない条件(暗黒下)では、この除草剤の害を受けやすいことになる。

### 4 生化学的な差による選択殺草性

吸収された薬剤の植物体内における移行、活性化反応、不活性化反応の差に基づく選択性であるが、これらの要因を理解することは、理論的な見地からだけでなく、新しい多くの選択殺草性を有する化合物を探索するうえからも重要である。また、前記の処理位置、処理時期の差による選択殺草性、植物の形態、生態の差による

選択殺草性と異なり、植物の生化学的側面が明らかにされる点からも興味深いところである。

(1) 移行の差による選択殺草性

移行型の選択性除草剤が根の分裂組織部分を殺すためには葉の細胞に浸透し、植物の維管束組織の中を移行しなければならない。したがって選択殺草性は生化学的タイプでなければならない。すなわち、雑草と作物の原形質の構成物質のある特殊性に依存している。この性質を具備し、最初にてきた化合物の中で除草剤として使用されているのが 2,4-PA (2,4-D) である。

PAC (pyrazon) はテンサイ畑の一年生広葉雑草の防除に使用されている。PAC に対する感受性程度の異なる3種の植物、感受性の大きい順にトマト>アワ>テンサイについて、PAC の吸収、移行、分解が比較されている<sup>23)</sup>。根における蓄積量及び莖葉部への移行量は、大きい順にトマト>アワ>テンサイであった。すなわち、PAC に対する抵抗力は、根からの吸収、移行量が感受性植物より小さいことと、莖葉部による不活性化反応との二つの要因から説明される。また、2,4-PA の吸収と移行はマメ、ヒマワリ、タンポポ、オオバコよりも、禾穀類やイネ科雑草でより緩やかであり、その理由として葉の節間分裂組織に一種の妨害が起こるからであると説明されている<sup>7)</sup>。

ほかの実験<sup>2)</sup>からも、2,4-PA はマメ、サトウキビの葉から容易に吸収されるが、マメのほうがより容易に移行させること、単子葉植物において移行速度が遅いことが、2,4-PA に抵抗性を示す原因の一つであると結論されている。

(2) 活性化反応の差による選択殺草性

感受性の植物体内で活性化され殺草活性を示す除草剤の例としては、MCPB と 2,4-DB がある<sup>28)</sup>。MCPB は

植物体における側鎖脂肪酸のβ酸化能による変換を利用して、殺草活性を示す除草剤である。第1図に示す直鎖構造の長い脂肪酸を植物に処理すると、植物体内でβ酸化機構により、脂肪酸のβ位炭素部分が酸化を受けて、2個ずつ減少し、低級化される。最初の炭素数によっては、β酸化を受けて MCP になり、MCP になった場合に初めて殺草活性を表す。このように、MCPB はそれ自体殺草活性がないが、植物体内で MCP に変換し殺草活性を示すことになる。これらの変換は植物の代謝能力に依存しているため、作用の速さは老化植物や低温下では低下する。選択殺草性の点から見ると、β酸化能の大きい植物は枯殺されるが、小さい植物(セロリー、クローバーなど)は枯殺されない。

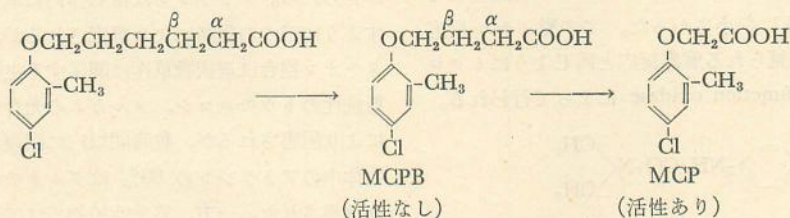
(3) 不活性化(解毒)反応の差による選択殺草性

植物による除草剤の不活性化(解毒)反応の大小により、選択殺草性が生ずる例として、加水分解、脱塩素反応、N-脱メチル反応、グルコース抱合、グルタチオン抱合などによるものがある。

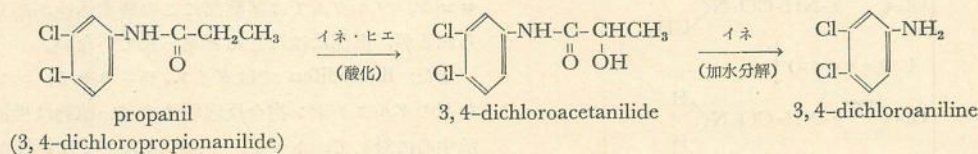
1) 加水分解

propanil (DCPA) はイネ科イネ属であるイネとヒエ間に著しい選択殺草性を示すことが知られている。その選択殺草性機構として、イネは propanil を加水分解して 3,4-ジクロロアニリンとし、殺草力のない解毒産物を生成するが、ヒエは加水分解能力がないため枯殺されることが明らかにされた。すなわち、イネに由来する arylacylamidase による propanil の加水分解がこの除草剤の選択殺草性の基礎をなしている<sup>1,11)</sup>。Yih<sup>18)</sup>は第2図に示すように、propanil がイネによって直接 3,4-dichloroaniline に加水分解されるのではなく、その間に酸化の機構が介在することを報告している。

2) 脱塩素反応



第1図 MCPB の側鎖のβ酸化による活性化

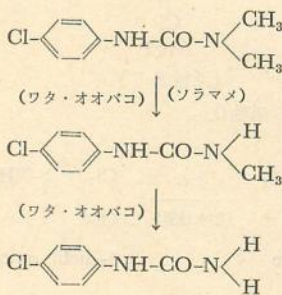


第2図 propanil のイネにおける加水分解

抵抗性のトウモロコシはシマジンやアトラジンを急速に不活性化することができる。トウモロコシは体内にこれらの薬剤に作用する化合物を含んでいるため、その構造は 2,4-dihydroxy-7-methoxy-1,4(2*H*)-benzoxazin-3(4*H*)-one (DIMBOA, benzoxazinone) であるが、トウモロコシ中では本来  $\beta$ -D-glucopyranoside の形で存在している。これが触媒となって非酵素的な加水分解を起こし、脱塩素反応により、アトラジンを殺草活性のないヒドロキシアトラジンに変換する(第5図参照)。その例として、アトラジンに対し感受性のエンバク、ダイズ、インゲン、抵抗性のジョンソングラス、モロコシ、トウモロコシ、中間のワタ、ラッカセイにおけるアトラジンの代謝が比較されている<sup>19)</sup>。アトラジンの吸収量と抵抗性との間には相関は見られないが、地上部に残存する未変化のアトラジン量は、エンバク>ダイズ>インゲン=ワタ>ラッカセイ>ジョンソングラス>モロコシ=トウモロコシの順となり、ワタを除けばその順位は抵抗性の順位と一致している。調査したすべての植物は多少アトラジンをヒドロキシアトラジンに変換させたが、ヒドロキシアトラジンの生成量は抵抗性と相関を示し、抵抗性の大きい3種の植物は抵抗性の小さいエンバクやダイズの少なくとも2倍量のヒドロキシアトラジンを生成した。

3) N-脱メチル反応

フェニル尿素系除草剤 monuron に対して、ワタ、オオバコは抵抗性を示し、トウモロコシは感受性、ソラマメはその中間である。この選択殺草性は、N-脱メチル反応による解毒の差で生ずることが判明している<sup>25)</sup>。第3図に示すように、抵抗性のワタ、オオバコで脱メチル反応が迅速に行われたのに対して、トウモロコシでは脱メチル反応が起らなかった。中間のソラマメでは脱メチル反応は1回行われたが、ワタ、オオバコに比較してその反応速度は著しく小さかった。この脱メチル反応は、動物、昆虫に見られる解毒反応と同じようにミクロゾームの mixed function oxidase によって行われる。

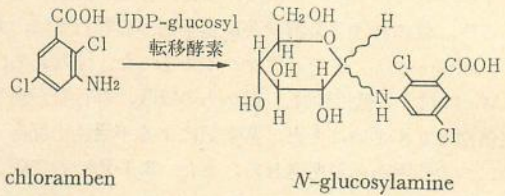


第3図 monuron の植物における代謝

4) グルコース抱合

除草剤が植物体内に取り込まれてから、そのままの形あるいは若干変換された後、植物体内の成分と結合して結合体をつくる反応があり、結合することにより除草剤は不活性化される。この抱合反応はグルコース、グルタチオンなどのペプチドやタンパク質などで行われる。

chloramben はダイズ用の除草剤で、ダイズには害作用がないが、イネ科雑草をよく抑える。ダイズでは、吸収された chloramben が UDPG などのグルコース供与体からグルコースを転移し、N-グルコシドを生じ抱合反応により解毒される(第4図)。一方、イネ科の雑草がダイズに比べて感受性を示すのは、N-グルコシドになる量が少ないためであると説明されている<sup>24)</sup>。



第4図 chloramben のグルコース抱合による解毒

5) グルタチオン抱合

S-トリアジン系除草剤アトラジンは植物体内で側鎖のN-アルキル基の酸化を受ける経路のほか、グルタチオン S-トランスフェラーゼの触媒によってグルタチオン抱合体となり解毒されることが知られている<sup>16)</sup>。また、ジフェニルエーテル系の fluorodifen はエンドウ、ダイズのグルタチオン S-トランスフェラーゼにより、エーテル結合が開裂してグルタチオン抱合体を作る<sup>22)</sup>。

既に述べたようにトウモロコシ、ソルガムはアトラジンに対して抵抗性を示し、他の植物との間に選択殺草性が見られる。アトラジンは植物体内において第5図に示すように三つの経路により解毒されるが、この中で、グルタチオン抱合は選択殺草性に関係する主要因である<sup>21)</sup>。抵抗性のトウモロコシ、ソルガムの光合成はアトラジンにより阻害されるが、数時間以内に回復する。同時に植物体中のアトラジンの80%はグルタチオン抱合体となり解毒された。一方、感受性植物ではアトラジンの解毒はほとんど見られず、光合成は回復しなかった。トウモロコシ、ソルガムでは茎葉部にこの酵素活性が高く認められるが、根部にはほとんど見られていない。

また、fluorodifen ではダイズ、ラッカセイ、エンドウなどのグルタチオン抱合反応活性の高い植物は抵抗性を示すのに対して、トマト、キュウリなどでは活性が低く感受性を示す。



解明されなければならない問題は数多いと言える。

### 引用文献

- 1) 足立明朗ら (1966) : 農業生産技術 15 : 11~14.
- 2) ASHTON, F. M. (1958) : Weeds 6 : 257~262.
- 3) BAKER, R. S. and G. F. WARREN (1962) : *ibid.* 10 : 219~224.
- 4) BLACKMAN, G. E. et al. (1958) : J. Exp. Bot. 9 : 175~205.
- 5) COLBY, S. R. et al. (1965) : Weeds 13 : 87~91.
- 6) DAVIES, P. J. et al. (1967) : Weed Res. 7 : 220~233.
- 7) GALLUP, A. H. and F. G. GUSTAFSON (1952) : Plant Physiol. 27 : 603~612.
- 8) GRESSEL, J. and L. A. SEGEL (1978) : Abstr. 4th International Congress of Pesticide Chemistry (IUPAC). IV-651.
- 9) HOFFMAN, O. L. (1962) : Weeds 10 : 322~323.
- 10) HYAKUTAKE, H. and K. ISHIZUKA (1975) : Proc. of 5th Asian-Pacific Weed Sci. Soc. Conf. p. 192.
- 11) ISHIZUKA, K. et al. (1969) : U. S.-Japan Sci. Seminar on Biochemical Approaches to Weed Control, Raleigh, N. C.
- 12) 石塚皓造 (1970) : 植物の化学調節 5 : 19~26.
- 13) ——— (1975) : 雑草研究 20 : 49~54.
- 14) ——— (1979) : 農業—デザインと開発指針— (山本 出, 深見順一編) ソフトサイエンス社 p. 752.
- 15) KOBAYASHI, K. and K. ISHIZUKA (1977) : J. Pesticide Sci. 2 : 59~65.
- 16) LAMOUREUX, G. L. et al. (1970) : J. Agr. Food Chem. 18 : 81~86.
- 17) 松中昭一 (1965) : 新農薬創製法 (山本 亮, 野口照久編) 南江堂 p. 230.
- 18) ——— (1979) : 日本農薬学会第4回大会講演要旨集 SA-4.
- 19) NEGI, N. S. et al. (1964) : Weeds 12 : 53~57.
- 20) PEREIRA, J. F. et al (1971) : Weed Sci. 19 : 647~651.
- 21) SHIMABUKURO, R. H. (1971) : "Pesticide Terminal Residues", ed. by A. S. TAHORI, p. 323, Butterworth, London.
- 22) ——— et al. (1973) : Pest. Biochem. Physiol. 3 : 483~494.
- 23) STEPHENSON, G. R. and S. K. RIES (1967) : Weed Res. 7 : 51~60.
- 24) STOLLER, E. W. (1969) : Plant Physiol. 44 : 854~860.
- 25) SWANSON, C. R. and SWANSON H. R. (1968) : Weed Sci. 16 : 137~143.
- 26) 植木邦和・松中昭一 (1977) : 雑草防除大要 p. 125. 養賢堂
- 27) ———・山末祐二 (1978) : 日本農薬学会誌 3 : 445~450.
- 28) WAIN, R. L. (1955) : J. Agr. Food Chem. 3 : 128~130.
- 29) WOJTASZEK, T (1966) : Weeds 14 : 125~129.
- 30) YIH, R. Y. et al. (1968) : Plant Physiol. 43 : 1291~1296.

## 本会発行図書

# 野そ防除必携

野鼠防除対策委員会 編

A 5判 104 ページ 900 円 送料 120 円

野そ防除に関する事項を1冊にとりまとめた講習会のテキストなどに好適な書。

### 内容目次

- 第1章防除 野そとは、防除の目的と手順、防除計画  
 第2章そ害発生調査 そ害の実態調査、そ害発生環境調査、生息調査  
 第3章駆除 殺そ駆除法、環境駆除法、忌避駆除法、駆除時期、効果判定、駆除が失敗する原因  
 第4章そ害の発生防止 そ害発生防止の手段、ネズミの減少率と復元期間  
 参考資料 野その種類と習性、ネズミの一生、ネズミの感覚、ネズミの鑑定標本とその用語、ネズミの生息数推定法、発生予察、省力試験の実例、最近の被害例、殺そ剤小史、殺そ剤のイタチに対する二次毒性試験成績、野鼠防除対策委員会、主要参考文献

お申込みは前金 (現金・振替・小為替) で本会へ

人 事 消 息

金子 藏氏(横浜生糸検査所総務部庶務課人事第2係長)は農蚕園芸局植物防疫課庶務班総務係長に  
鈴木作次氏(農蚕園芸局植物防疫課庶務班総務係長)は退職  
森 武雄氏(門司植物防疫所長)は横浜植物防疫所長に  
江口照雄氏(横浜植物防疫所業務部長)は門司植物防疫所長に  
児島司忠氏(同上部国際第1課長)は横浜植物防疫所業務部長に  
松本安生氏(同上部国際第2課長)は同上部国際第1課長に  
関塚昭明氏(名古屋植物防疫所調整指導官)は同上部国

際第2課長に  
澤田啓司氏(横浜植物防疫所長)は退職  
沢辺 守氏(食糧庁長官)は農林水産省事務次官に  
小島和義氏(農蚕園芸局審議官)は林野庁次長に  
志村 純氏(経済局国際部長)は農蚕園芸局審議官に  
藤田英一氏(食品流通局審議官)は東北農政局長に  
川嶋良一氏(農事試験場長)は農林水産技術会議事務局長に  
中川昭一郎氏(農林水産技術会議事務局研究管理官)は同上事務局研究総務官に  
上田三郎氏(同上事務局連絡調整課長)は同上に  
岸 国平氏(同上事務局研究総務官)は農事試験場長に  
北野茂夫氏(同上)は退職

本会発行新刊図書

ダイズ病害虫の手引

1,300円 送料160円

B5判 222ページ タイプオフセット印刷

水田利用再編対策で注目をあびてきたダイズの病害虫について19名の専門家により執筆・解説されたダイズ病害虫の手引書

内 容 目 次

ダイズ病害虫の特性

害虫, 病害

ダイズ病害虫種類別解説

害虫

タネバエ, ダイズネモグリバエ, ダイズクキモグリバエ, ダイズサヤタマバエ, タマナヤガ, カブラヤガ, ハスモンヨトウ, キタバコガ, ツメクサガ, ヨトウガ, ウコンノメイガ, マメヒメサヤムシガ, マメシンクイガ, シロイチモジマダラメイガ, フタスジヒメハムシ, ヒメコガネ, ダイズアブラムシ, ジャガイモヒゲナガアブラムシ, マルカメムシ, 吸実性カメムシ類, ダイズシストセン

チュウ, ネコブセンチュウ類, ネグサレセンチュウ類

病害

モザイク病, 萎縮病, ダイズわい化病, 紫斑病, 黒とう病, ダイズさび病, 菌核病, 立枯性病害, べと病, 炭そ病, 葉焼病

ダイズ病害虫地域別防除指針

北海道地域, 東北・北陸地域, 関東・東山・東海地域, 近畿・中国・四国地域, 九州地域

付 表

適用農薬一覧, 品種一覧

お申込みは前金(現金・振替・小為替)で本会へ

次 号 予 告

次9月号は下記原稿を掲載する予定です。

リゾクトニア菌によるイネの病害 鬼木 正臣  
土壌微生物によるPCPの分解と代謝 鈴木 隆之  
クワコナコバチの大量増殖とその利用 柳沼 薫  
ウンカ・ヨコバイ類の人工飼育法と栄養要求 小山 健二

ビワ園におけるニイニイゼミの生態

植松清次・小野木静夫

リンゴを加害するキンモンホソガの近似種ナナカマド

キンモンホソガ(新称) 氏家 武

性フェロモン利用によるハスモンヨトウの防除 柳沢興一郎

夏播きムギの栽培と病害虫 河合 利雄

定期購読者以外の申込みは至急前金で本会へ

頒価改訂 1部 400円 送料29円

## 中央だより

### —農林水産省—

#### ○農薬耐性菌検定事業検討会開催さる

植物防疫課は、6月27、28日の両日、農業技術研究所講堂において、農薬耐性菌検定事業検討会を昭和54年度事業実施33県の担当者、農技研、野菜試、果樹試、植物防疫課の担当者の約50名の出席のもと開催し、昭和53年度検定事業成績の検討及び昭和54年度検定事業計画の打ち合わせを行った。ここに概要を報告する。

#### 1 昭和53年度事業成績

##### (1) イネいもち病菌

岩手でカスガマイシン(KSM)耐性菌が、茨城でKSM, IBP, イソプロチオラン(IPT)耐性菌が、新潟でKSM, IBP耐性菌が、富山でKSM, IBP, IPT耐性菌が、兵庫でKSM耐性菌が検出された。

##### (2) 野菜類の灰色かび病菌

茨城でテオファネートメチル(THM), ベノミル(BEN)耐性菌が施設きゅうり、ピーマンから、群馬でBEN, THM耐性菌がきゅうりから、埼玉でTHM耐性菌が施設きゅうり、なす、トマトから、兵庫でTHM耐性菌が施設きゅうり、なす、トマト、ピーマンから、岡山でTHM耐性菌がなす、いちごから、長崎でTHM, MBC耐性菌がトマト、きゅうりから、宮崎でTHM, BEN耐性菌が施設きゅうり、トマト、いちご、かぼちゃ、ピーマンからと、調査全県で、THM, BEN耐性菌が高率に検出された。また、一部地域では中等度耐性菌も検出され、これを感性菌、耐性菌のどちらに入れるかも含め今後の農薬使用上で、他薬剤の探索、同系薬剤連用の回避も問題化した。

THMとBEN, MBCの耐性菌判定濃度に差が認められた。これはTHMのMBCに変化する速度が、BENのそれに比べ遅いことによると思われる。また、THMの植物体上での分解についての究明についても今後の課題となった。

また、ポリオキシシン(POL)耐性菌も、岡山のなす、いちご、長崎の一部のきゅうりから低率であるが検出されたが、THM, BEN耐性菌がほ場での防除効果の低下をもたらしているのに比べ問題は起こっていないが、今後、耐性菌の出現の動向に注意せねばならない。

##### (3) リンゴ黒星病菌

北海道、青森のほ場でTHM, BENの防除効果の低下が報告され、青森では耐性菌が検出された。

##### (4) リンゴ斑点落葉病菌

青森、福島、群馬でPOL耐性菌が検出された。

##### (5) ナシ黒星病菌

福島中部でBEN耐性菌が、埼玉でTHM耐性菌が検出された。

##### (6) ナシ黒斑病菌

福島、群馬でPOL耐性菌が検出された。

##### (7) モモ灰星病菌

山梨でTHM, BEN, MBC耐性菌が検出された。

##### (8) ブドウ灰色かび病菌

山梨で全検定菌がBEN, MBC耐性菌であった。兵庫でTHM耐性菌が、岡山でTHM, BEN耐性菌が検出された。

##### (9) 他の耐性菌

群馬で、ほ場での防除効果の低下が認められたストレプトマイシン耐性コンニャク腐敗病菌が確認された。鳥取ではTHM, BEN耐性スイカつる枯病菌が確認された。

以上、昭和53年度検定事業実施16県より成績の報告があった。

#### 2 昭和54年度事業計画打ち合わせ

1の昭和53年度検定事業成績及び33県より提出された昭和54年度検定事業計画書について、病原菌ごと、薬剤ごと、検定濃度・検定方法ごとについて検討を行った。その結果、できるだけ統一した方法により、昭和54年度は検定事業を実施することとし、次のような検定の目安を作成した。

##### (1) イネいもち病菌

KSM耐性菌については、平板希釈法では、0, 100ppmで、IBP耐性菌については、平板希釈法で、菌叢による方法では、0, (25), 30, 50ppmで、分生孢子による方法では、0, 15, 50ppmで検定する。

##### (2) 野菜類の灰色かび病菌

原則として、BEN, MBCを検定薬剤とし、平板希釈法により0, 10, 100ppmで検定する。

##### (3) ナシ黒星病菌

孢子発芽の際発芽管内にできる隔膜の有無により耐性菌、感性菌を判定する発芽管隔膜法により、THM, BEN耐性菌を検定する。

以上の目安を参考に、各県の事情に合わせ、ほ場での防除効果の低下をも調査し、また、生体をも用いた検定を含め検定事業を進めることとした。



本検討会では、上の事業成績検討及び事業計画打ち合わせのほか、農技研上杉室長から耐性菌とその検定方法についての講演が、また、イネいもち病菌の簡易単胞子分離法の紹介が、野菜試手塚技官より生果実を用いての農業耐性野菜類の灰色かび病菌簡易検定法の紹介が、果樹試石井技官より農業耐性ナシ黒星病菌の簡易検定法、及び富山での THM 使用中止後の耐性菌減少が見られないとの事例の紹介があり、耐性菌対策の困難さが指摘された。

最後に総合討論を行い、今後本事業を更に推し進め、耐性菌対策に取り組むこととなった。

#### ○イネミズゾウムシ防除中間検討会開催さる

去る7月27日、植物防疫課主催のイネミズゾウムシ防除中間検討会を農林水産技術会議、農技研、農政局、植物防疫所、発生各県等の関係者40名を招集し、三番町分庁舎において開催した。

主な協議事項は、昭和54年度の発生状況及び防除の実施状況と研究推進状況について協議を行ったもので、本年の発生状況では、本年新たに滋賀県に発生を見、発生県も5県となり、発生面積は、6月30日現在の調査で82,627haの水田に発生を見るに至った。防除は、各県とも順調に進められているが、三重県からの報告によると、県内の一部地域において被害の著しい地区が生じているが、原因の究明までには至っていないとのことであった。また、研究推進の状況やその成果について討議したが、中間成績のため結論は得られなかったが、乾田直播では被害は生じないが湛水により成虫の飛来があること、防除は、浅水にすると効果はないが除草剤による被害の出現との関係で工夫が必要であること。作期は一般的に遅いほうが被害は少ないと言われていたが、三重県のように特に早い所では、逆に早くしたほうが被害は少ないことから、発生ピークを回避する方法が望ましいことなど2,3の新しい知見が得られたが、被害解析や要防除水準の設定などの今後の課題もいまだ多く残されている。

#### ○昭和54年度病虫害発生予報第4号発表さる

農蚕園芸局は54年7月21日付け54農蚕第5355号昭和54年度病虫害発生予報第4号でもって、向こう約1か月間の病虫害発生動向の予想を発表した。

イネ：葉いもちちは北日本、近畿及び九州の一部でやや多その他は概して並、穂いもちちは北日本でやや多、その他は並以下。紋枯病は全般に並ないしやや多。白葉枯病は6月末から7月初めの梅雨前線豪雨で浸・冠水したところはやや多、その他は並以下。ツマグロヨコバイは北陸及び東北の一部でやや多ないし多。ニカメイ

チュウは東北、関東及び近畿の一部で局地的にやや多、その他は並以下。セジロウンカ及びトビロウンカはやや多。イネカラバエは九州の一部でやや多、その他は並以下。イネクロカメムシは近畿及び九州の一部でやや多ないし多、その他はやや少ないし少。イネツトムシ及びコブノメイガは全般的に並。アワヨトウは東北、北陸、中国及び九州の一部でやや多、その他は並以下。カメムシ類は北陸、東海以西で密度が高いところがあり、また、例年より早く本田への飛来が認められており、今後の発生推移に注意。

ジャガイモ：疫病は北日本ではやや多。

ダイズ：ハスモンヨトウは地域的に多発生となるおそれがあるので発生推移に注意。

カンキツ：そうか病は九州の一部でやや多、その他は並以下。黒点病は関東及び東海の一部でやや少ないし少。その他は並ないしやや多。かいよう病は九州及び四国の一部で並ないしやや多、その他は並以下。ヤノネカイガラムシは九州及び近畿のそれぞれ一部で少、その他は並ないしやや多。ミカンハダニは全般にやや多。

リンゴ：斑点落葉病は並ないしやや多。黒星病は北海道及び東北部で並。モモンクイガは並。コカクモンハマキは青森で多、その他は並以下。キンモンホソガは青森及び長野でやや多、その他は並以下。ハダニ類はリンゴハダニが概して並、ナミハダニが並ないしやや多。

ナシ：黒斑病は福岡でやや多、その他は並ないしやや少。黒星病は福岡でやや多、その他は並以下。コカクモンハマキは鳥取でやや多、その他は並以下、ハダニ類は全般に並ないしやや多。シンクイムシ類及びクワコナカイガラムシは並以下。

モモ：せん孔細菌病は全般にやや少ないし少。灰星病は山形でやや多、その他は並以下。黒星病及びクワシロカイガラムシは並以下。コスカシバは福島でやや多、その他は並以下。モモハモグリガは宮城及び山形でやや多、その他は並以下。ハダニ類は概して並。

ブドウ：晩腐病は山形で多、その他は並ないしやや少。うどんこ病及び褐斑病は並以下。フタテンヒメヨコバイは大阪でやや多、その他は並以下。

カキ：炭そ病は並ないしやや少、うどんこ病は近畿以西でやや多、その他は並以下。落葉病類は並ないしやや多。カキミガは愛媛でやや多、その他は並以下。フジコナカイガラムシは岐阜及び福岡でやや多、その他は並以下。

果樹全般：カメムシ類は発生量が多くなっている地方があり、今後ナシ、カキ等への飛来状況に注意。

チャ：炭そ病及びもち病はやや少ないし少。チャノコカクモンハマキは埼玉で多、三重及び熊本でやや多、その他はやや少ないし少。チャハマキは関東でやや多ないし多、その他は並以下。チャノホソガは熊本でやや多、その他は並以下。チャノミドリヒメヨコバイは埼玉で多、その他は並ないしやや多。カンザワハダニは京都でやや多、その他は並ないしやや少。

## 新しく登録された農薬 (54.6.1~6.30)

掲載は、種類名、有効成分及び含有量、商品名、登録番号(登録業者(社)名)、対象作物：病害虫：使用時期及び回数などの順。(…日…回は、収穫何日前まで何回以内散布の略)

### 『殺虫剤』

クロルピリホスメチル乳剤

クロルピリホスメチル 40%

ダウレルゲン乳剤 40

14086 (サンケイ化学), 14087 (日産化学工業), 14088 (クミアイ化学工業)

松 (生立木): マツノマダラカミキリ成虫・マツカレハ, 杉: スギハムシ

**MPP・EDB 油剤**

MPP 0.5%, EDB 2.5%

ファインケム油剤

14089 (東京ファインケミカル)

松類(伐倒木): シラホシゾウムシ・クロキボシゾウムシ・マツノマダラカミキリ・キヒロコキウムシ等の

樹幹穿孔虫

ピリダフェンチオン水和剤

ピリダフェンチオン 50%

オフナック水和剤

14090 (三井東圧化学), 14091 (トモノ農薬)

りんご: シンクイムシ類: 45日3回, なし: シンクイムシ類: 45日3回, かき: カキミガ: 45日3回

### 『その他』

展着剤

ポリオキシエチレンジニルフェニルエーテル 55%

サンフォメート

14092 (三共), 14093 (北興化学工業), 14094 (クミアイ化学工業)

適用農薬名: パラコート除草剤, メソミル水和剤

## 御 挨拶

川 村 茂

本年2月身体を悪くし、東京医科歯科大学医学部附属病院に入院・手術すること約3か月、その後4月末に退院しましたが、いまだ結果がはっきりせず通院治療を重ねております。このたび明日山理事長及び遠藤常務理事の御配慮で7月末日で出版部長を辞任し、8月1日より本会研究所内資料館に勤務することになりました。

かえりみますと、昭和29年5月に本会に就職し、32年より20余年出版事業を担当し、雑誌「植物防疫」にあっては編集委員長・編集委員及び編集幹事(現編集常任委員)の御指導のもとに合併号を作らずに月刊刊行を、刊行物にあっては執筆各位の御指導で『昆虫実験法』・『植物病理実験法』など80数冊の発行を、

また、農林省植物防疫課の記念事業として、10周年(昭和35年)に『農薬のあゆみ』、20周年(同46年)に『植物防疫この二十年』、発生予察事業20周年(同37年)に『病害虫発生予察事業二十周年記念誌』の3冊の刊行のお手伝いをして参りました。

幸いに皆様方の格別な御指導と御協力によりまして、無事その職責を果たささせていただきましたことを心から厚く御礼申し上げます。

なお、前記のように今後も資料館の仕事に携わることになりましたので、これからもよろしく御願ひ申し上げます。後任部長として津谷虫害課長が就任されましたので、私以上のご支援をお願い致し御挨拶と致します。

## 植物防疫

第33巻 昭和54年8月25日印刷  
第8号 昭和54年8月31日発行

実費400円 送料29円 1か年5,000円  
(送料共概算)

昭和54年

8月号

(毎月1回30日発行)

編集人 植物防疫編集委員会

発行人 遠藤 武雄

印刷所 株式会社 双文社印刷所  
東京都板橋区熊野町13-11

—発行所—

東京都豊島区駒込1丁目43番11号 郵便番号 170

社団法人 日本植物防疫協会

電話 東京(03)944-1561~4番  
振替 東京 1-177867番

—禁 転 載—

新発売!

増収を約束する

日曹の農薬

98% マシン油乳剤

ラビサンスプレー

- カイガラムシ類，ハダニ類の防除に，冬はもちろん夏も使えます。
- 高度精製マシン油乳剤で植物への薬害の心配が少なく展着剤としても有効です。



日本曹達株式会社

本社 東京都千代田区大手町2-2-1 〒100  
支店 大阪市東区北浜2-90 〒541  
営業所 札幌・仙台・信越・高岡・名古屋・福岡

本会発行新刊図書

## 茶樹の害虫

南川仁博・刑部 勝 共著

5,000円 送料400円

A5判 口絵カラー写真4ページ，本文322ページ 上製本 箱入り

第1編の総論で茶樹の害虫とその被害・防除上の諸問題を，第2編の各論で茶樹につく108の害虫について形態・経過習性・防除法・天敵を，第3編の農薬概説で分類・使用の歴史・殺虫剤の特性と効果・安全使用基準を解説し，巻末に動物和名・学名・薬剤名・病菌名・事項名より引ける索引を付した解説書

### 内容目次

#### 第1編 総論

- 1 茶樹の害虫とその被害
- 2 茶樹害虫防除上の諸問題

#### 第2編 各論

- 1 クダマキモドキ
- 2 ヤマトシロアリ
- 3 アザミウマ類
- 4 カメムシ類
- 5 ヨコバイ類
- 6 アオバハゴロモ
- 7 ヤマモモコナジラミ
- 8 コミカンアブラムシ
- 9 カイガラムシ類
- 10 コウモリガ
- 11 ハマキガ類

- 12 チャノホソガ
- 13 メイガ類
- 14 アミメマドガ
- 15 イラガ類
- 16 ゴマフボクトウ
- 17 ミノガ類
- 18 シャクガ類
- 19 ドクガ類
- 20 ヤガ類
- 21 ヒトリガ類
- 22 マダラカサハラハムシ
- 23 キクイムシ類
- 24 コガネムシ類
- 25 バラハキリバチ
- 26 チャノハモグリバエ

- 27 ダニ類
  - 28 土壤線虫類
  - 29 沖縄の茶樹害虫
  - 30 台湾産茶樹害虫目録
- #### 第3編 農薬概説
- 1 農薬の分類
  - 2 茶樹に対する農薬使用の歴史
  - 3 殺虫剤の特性と茶樹害虫に対する効果
  - 4 殺虫剤の一般名と商品名ならびに茶用農薬の使用制限事項(安全使用基準)
- 索引

お申込みは前金(現金・振替・小為替)で本会へ

# 穂しもち ピンヤリ

40～50日の長い持続効果を発揮。  
しかも、手まきでカンタンです。

- 散布適期幅が広く、散布にゆとりがもてます。
- すぐれた効果が長期間(約50日)持続します。
- 粉剤2～3回分に相当する効果を発揮します。
- イネや他の作物に葉害を起こす心配がありません。
- 人畜、魚介類に高い安全性があります。

## フジワン<sup>®</sup>粒剤

使用薬量：10アール<sup>2</sup>り4kg  
使用時期：出穂10～30日前 (20日前が最適)

予防と治療のダブル効果

## フジワン<sup>®</sup>乳剤 粉剤

- 他作物への葉害の心配がありません。



フジワンのシンボルマークです。

®は日本農薬の登録商標です。



日本農薬株式会社

〒103 東京都中央区日本橋1-2-5 栄太楼ビル

資料請求券

フジワン

植物防疫



は信頼のマーク



予防に優る防除なし  
果樹・そ菜病害防除の基幹薬剤

**キノブドー**® 水和剤 40

殺虫・殺ダニ 1剤で数種の剤の効力を併せ持つ

**トーラック** 乳剤

宿根草の省力防除に好評！粒状除草剤

**カソロン** 粒剤 6.7

人畜・作物・天敵・魚に安全  
理想のダニ剤

**テデオ** 乳剤 水和剤

**兼商株式会社**

東京都千代田区丸の内2-4-1

新刊

北條良夫・星川清親 共編

# 作物—その形態と機能—

上巻

A5判 上製箱入 定価 3,200円 千200円

—主 内 容—

第1編 作物の種子／第1章 作物の受精と胚発生（星川清親） 第2章 種子の発芽（高橋成人） 第3章 種子の休眠（太田保夫）

第2編 作物の花成／第1章 作物の播性と品種生態（川口敦美） 第2章 春化現象（中條博良） 第3章 作物における花成現象（菅 洋） 第4章 野菜の抽薹現象（鈴木芳夫）

第3編 作物の栄養体とその形成／第1章 作物の葉（長南信雄） 第2章 作物の茎（長南信雄） 第3章 作物の根（田中典幸） 第4章 作物におけるエージング（折谷隆志）

第4編 作物の生産過程—その1—／第1章 光合成と物質生産（梶 和一） 第2章  $C_3$ 、 $C_4$  植物と光呼吸（秋田重誠） 第3章 光合成産物の転流（山本友英） 第4章 光合成産物の供与と受容（北條良夫） 第5章 草姿、草型と光合成産物の配分（小野信一）

下巻

A5判 上製箱入 定価 2,700円 千200円

—主 内 容—

第5編 作物の生産過程—その2—／第1章 サツマイモ塊茎の肥大（国分禎二） 第2章 牧草の物質生産（梶和一） 第3章 葉菜類の結球現象（加藤 徹） 第4章 果樹の接木不親和性（仁藤伸昌）

第6編 作物の登熟／第1章 マメ類の登熟（昆野昭長） 第2章 穀粒の登熟（星川清親） 第3章 穀粒の品質（平 宏和） 第4章 登熟と多収性（松崎昭夫）

第7編 作物の生育と障害／第1章 作物の倒伏と強稈性（北條良夫） 第2章 作物の倒伏と根（宮坂 昭） 第3章 イネの冷害（佐竹徹夫） 第4章 作物の大気汚染障害（白鳥孝治）

〈お申込みは最寄りの書店、または直接本会へ〉

東京都北区西ヶ原 農業技術協会 振替 東京8-176531  
1丁目26番3号 千114 TEL (910) 3787

# ゆたかな実り＝明治の農薬

サッとひとまき

強い力がなが〜くつづく

## いもち病に！オリゼメート粒剤

野菜・かんきつ・ももの細菌性病害防除に **アグレプト** 水和剤・液剤

イネしらはがれ病防除に **フェナジン** 水和剤・粉剤

デラウェアの種なしと熟期促進に **ジベレリン明治**  
 野菜の成長促進・早出しに



明治製薬株式会社  
 東京都中央区京橋 2-4-16

昭和五十四年八月二十五日印  
 昭和五十四年九月三日発行  
 昭和二十四年八月三十日発行  
 第三十三卷第八号  
 植物防疫第三十三卷第八号  
 郵便物認可

実費四五〇円 (送料二九円)

水田の体系除草…  
 生かすも殺すも  
 パートナーしだいです。



### いい初期除草剤 を選んだら、

移植された苗が、これから養分をたっぷりとって大きく育とうとする大切な時期。それだけに初期除草剤は、ちょっとしたミスも許されません。ショウロンMはノビエ、マツバイなどのほか、各地でふえているホタルイにも卓効。確実におさえて、中期除草に上手につなぎます。

ノビエからホタルイまで

**ショウロンM** 粒剤

### いい中期除草剤 で引きつごう

ショウロンMがおさえこんだものを、それに負けない効きめで確実に引きつぐのがクミリードSM。1年草はもちろん、ますます旺盛になる中期の多年草もまるで苦しめません。——ことしも水田の除草プランは、クミカの息のあった名コンビでお立てください。

1年生雑草から多年生雑草まで

**クミリードSM** 粒剤



農協・経済連・全農

自然に学び自然を守る



クミアイ化学

■お問合せは…  
 東京都台東区池之端1-4-26