

幼若ホルモン様活性を有するピリダジノン誘導体

日産化学工業株式会社生物科学研究所 三宅 敏 郎

はじめに

昆虫の幼若ホルモン (JH) の構造決定以来, 化学合成された幼若ホルモン様活性物質 (Juvenoid) を新しいタイプの害虫防除剤として利用しようという試みが精力的に行われてきたことは, 周知のとおりである。今日に至るまでの成果として, メソプレン, フェノキシカーブ, ピリプロキシフェン, などの有力な化合物が発見され, かつ実際の害虫防除場面で利用されてきた。ただし, 屋外で生息し幼虫が主たる加害態である“農業害虫”については, 変態阻害作用及び殺卵作用といった JH 様活性のみで十分な防除を行うことは困難であると, 一般には考えられているようである。ところが, 過去になされた応用研究を整理してみると, すべての農業害虫において一様に Juvenoid による防除が成立しないわけではない。そしてその効力の差は, 供試された化合物の基礎的活性の差というよりむしろ, 対象とする害虫の発生生態, 加害様式に大きく依存していることが示唆されるのである。すなわち Juvenoid による密度コントロールが有効に働き, 被害が回避される可能性があるのは, (1) 一個体当たりの加害力が小さく一世代の発育期間が短い。その結果, 経済的な被害を与えるのに数世代にわたる増殖が必要であること, (2) 外部寄生者であること, (3) 定着性であること, (4) 収穫物を直接加害しないこと, (5) 野外個体群の発育ステージが比較的同期していること, といった諸条件を満たした害虫を対象とした場合である。もちろんこの場合でも, 供試する化合物が野外で不安定であれば効果は上がらない。作用の発現時期が変態期, 及び卵期に限定される Juvenoid の効果を個体群全体に発現させるために要求される残効性は, 速効的殺虫剤の場合に比べてはるかに長いからである。つまり, Juvenoid を用いた防除は, 上述したような特定の加害生態を備えた害虫種に対して高い基礎活性を有する Juvenoid が存在し, かつ, その化合物が野外において長期の残効性を備えている場合にのみ, 期待されるものといえるであろう。

本稿では, こうした条件をおおむね満足した農業害虫用 Juvenoid の一例として, 3(2H)ピリダジノン誘導体を

取り上げ, そのトビイロウンカに対する防除効果について紹介したい。

幼若ホルモン様活性を備えたピリダジノン誘導体

筆者らの研究グループでは, 1980 年代初めより新農薬の発見を目的として, いわゆる“ピリダジノン誘導体”の探索研究を行ってきた(図-1)。その過程において合成された化合物 [1] では, 速効的な殺虫活性は全く認められなかったものの, 半翅目昆虫の一種であるツマグロヨコバイの変態をごく微量で阻害するという, JH 様の作用を有することが発見された。そこで, この化合物 [1] を出発化合物として JH 様活性の探索研究を行ったところ, このピリダジノン誘導体のなかに, NC-170, NC-184 を代表とする一群の JH 様活性化化合物を見いだした。詳細な探索研究の経緯やその作用性などについては, 三宅・小倉 (1992), 及び MIYAKE et al. (1988, 1991, 1992) を参照されたい。

このうち NC-170 はウンカ・ヨコバイ類にのみ特異的に JH 様活性を示す, きわめて選択的な Juvenoid である。また NC-184 は, それとは対照的にワイドスペクトラムな Juvenoid であり, 現在までに調べられただけでも 12 目にわたる幅広い昆虫群に対し JH 様活性を發揮

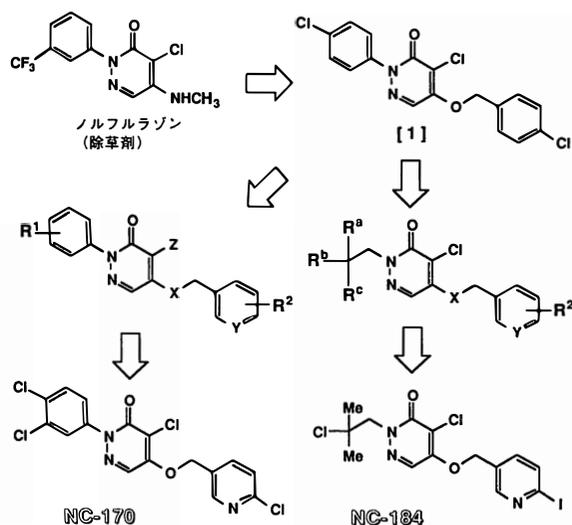


図-1 ピリダジノン誘導体における JH 様活性の探索

することが判明している。しかしいずれにしても、これらピリダジノン誘導体の JH 様活性で特に注目しなければならない点は、重要な稲作害虫であるウンカ・ヨコバイ類に対しきわめて微量でその作用を発現するという点である。過去、こうした JH 様の活性スペクトラムを持った化合物群は知られていない。そこで、この活性に着目し、主として防除剤としての観点からウンカ・ヨコバイ類の加害様式とそれに対する Juvenoid 活性の効果について考察、検討した。

トビイロウンカの発生生態

前述したように、Juvenoid の防除効果を決定する最も重要なポイントは、単なる基礎的な活性の強弱ではなく、対象害虫の発生生態と加害様式である。トビイロウンカは、よく知られているように毎年決まった時期に東南アジアや中国大陸から飛来し、その飛来個体を起源として日本国内で一年限りの増殖を行うといった特殊な発生生態を持つ害虫である。KUNO (1979) を参考にしてその生きた特徴を概観してみると次のようになる。

まず、本種の飛来は普通、梅雨期から初夏にかけて観察されるが、その後の被害をもたらす増殖源となるほどの大きな飛来は、せいぜい 1～2 回である。この飛来の決定には梅雨前線の停滞位置とジェット気流との関係が重要な役割を果たしていると考えられている。このように増殖の開始時期が限定されることによって、その後 3 世代にわたる国内での発生パターンが非常に予測しやすいものとなっている。また同時に、野外個体群のステージが比較的 đồng調していることにもつながっている。一方、本種の場合、飛来する個体数そのものはきわめて少なく、飛来個体群自体によって、あるいは 1 世代程度の増殖によって被害をもたらされることはない。しかし、その著しく高い増殖力により、第三世代では稲を枯死させるほどの密度にまで増加することもまれではない。さらに、坪枯れの形成過程から理解されるように、初期（第一世代）には短翅型の割合が高く、非常に定着性が高い。むしろ、本種は外部寄生者であり、かつ収穫物である稲穂を直接加害することはない。

このように考えてみると、トビイロウンカは処理のタイミングさえ適切であれば、Juvenoid による緩やかな密度コントロールによっても、十分に被害を回避できるタイプの害虫であるといえる。さらに発生の予測が容易であることから、個体群密度が被害をもたらすほどまで高まる以前に、正確な処理タイミングを設定できることも、Juvenoid の対象害虫として適している。ただ、1 世代の発育に要する期間は 1 か月弱と、それほど短くはないこ

とから、実際の防除場面では、前述した“化合物の野外での残効性”が重要な要因となるものと予想される。

ピリダジノン誘導体のトビイロウンカに対する防除効力

幼若ホルモンは、変態の制御の他、性成熟、休眠、相変異など、昆虫における様々な発育生理にかかわるホルモンである。したがって、外部からの Juvenoid の投与は、こうした多くの場面において生理的バランスをかく乱することが予想されるが、実際の防除場面での防除効果に関与するのは、主として変態阻害作用と殺卵作用、及びそれらの残効性である。

NC-184 を例にとってみると、そのトビイロウンカに対する基礎活性はいずれの場合もきわめて高く（表-1）、また、その稲体上での残効性は長期にわたる。図-2 に示すとおり 100 ppm の NC-184 を幼穂形成期の稲に散布処理した場合は、70 日以上の変態阻害活性、また約 20 日間の殺卵活性が維持されている。これは、野外におけるトビイロウンカの 1 世代の発育期間を十分にカバーできる残効性であり、仮に圃場に均一に化合物が処理されたとすれば、その後の増殖を強く抑圧することが期待できるものと考えられる。

続いて、適切な散布のタイミングについて検討した。Juvenoid の有する変態阻害活性を最大限有効に発揮させることを考えると、一般には、散布時の害虫個体群のステージが中齢幼虫期であることが望ましい。トビイロウンカの場合では、第一世代及び第二世代の中齢幼虫期がそれに相当する。そこで実際の水田で、単一の飛来を想定した放虫によるモデル試験を行った。図-3 に示すよ

表-1 NC-184 のトビイロウンカに対する JH 様活性 (莖葉散布法)

薬剤名	濃度 (PPm)	変態阻害率 (%)	ふ化阻害率 (%)
NC-184	100	100	100
	10	100	100
	1	100	100
	0.1	100	36.3
フェノキシカーブ	100	100	0
	10	24.2	0
	1	0	0
メソプレン	100	0	0
	10	0	0
	1	0	0

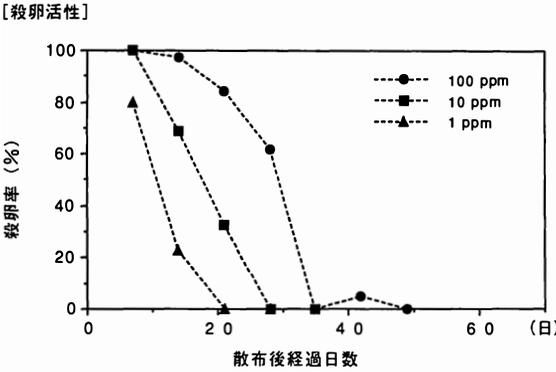
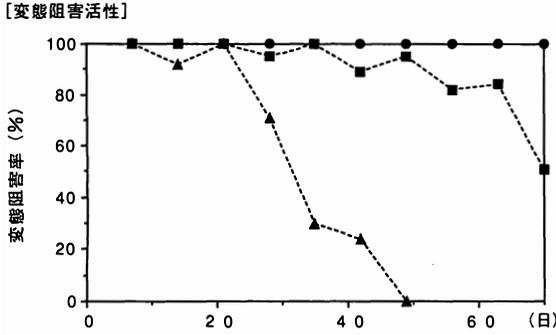


図-2 NC-184のトビウモンカに対する残効性

うに、7月初めに水田に雌成虫を放虫したところ、10月上旬までに3世代にわたる増殖を繰り返す、無処理区では部分的に稲が黄化、枯死する被害が出現した。このような条件下で個体群のステージが第一世代の幼虫期と考えられる7月18日にNC-184を処理した。その結果、第二世代、第三世代の密度は、著しく抑制された。一方、第二世代幼虫期と思われる8月15日の処理では、密度抑制効果の発現は遅く、全体としての防除効果は十分ではなかった。この原因が、個体群の密度がある程度まで上昇してしまっていたこと、また第一世代に比べてステージの均一性が低下し、作用の発現にばらつきが出てしまったこと、などにあることは明らかである。このように、Juvenoidによる防除効力を最大にするためには、できるだけJuvenoidの作用性にとって有利な散布のタイミングを設定することが必須条件である。そして、西日本におけるトビウモンカ防除の場合、それはおおむね7月後半と推定される。

以上のような知見をもとにして、実際の飛来個体を対象として行った防除試験結果の一例を図-4に示した。同年のトビウモンカの飛来は7月上旬に最大のピークがあったが、その後、10月上旬には第三世代の密度が著しく高まり、坪枯れが発生した。このような中で、NC-184の処理区においては第三世代の密度が強く抑制され、被

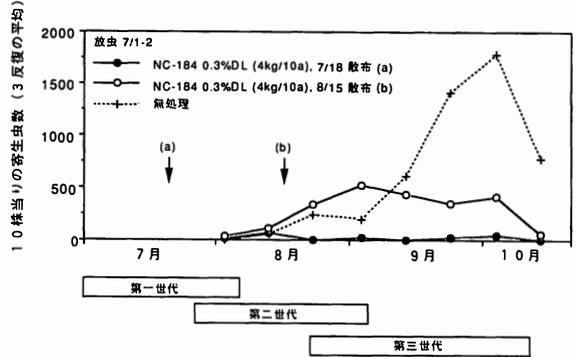


図-3 雌成虫放虫によるモデル試験 (埼玉県白岡町)

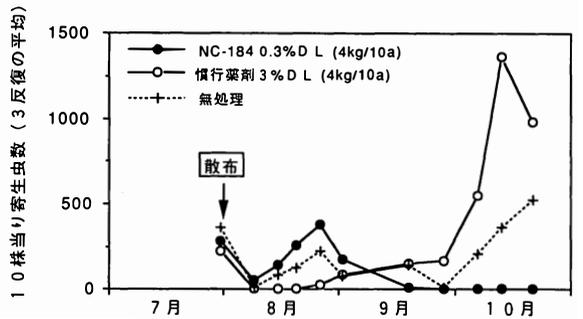


図-4 圃場試験結果 (鹿児島県国分市)

害も全く認められなかった。この結果は、一般に複数回の薬剤散布が必要とされる慣行防除に対して、NC-184では7月下旬の一回散布で長期的な密度抑制効果が得られる可能性を示唆している。また、日本植物防疫協会を通じて西日本各地の試験場で行われた圃場試験においてもほぼ同様の効果が確認されている。しかし一方で、第二世代に対する防除効果は甘い。これは、モデル試験の場合とは異なり、圃場での個体群のステージが均一でないことが、その主たる原因と考えられるが、今後、さらに適切な処理時期の設定や速効的殺虫剤との混用なども含めて検討を加えてゆく必要があると思われる。

おわりに

Juvenoidをはじめとする昆虫生育制御剤の研究は、1970年代初めから特に精力的に行われるようになったが、その背景には、まず昆虫生理、生化学研究の進展を基礎として新たな作用性を有する非神経毒殺虫剤の研究が注目されるようになったということがある。しかし、単にそれだけではなく、(1)人間を含めた哺乳類に対する更に高度な安全性が要求されるようになった、(2)生態系、及びそのすべての構成者に対する影響を最小限に

抑えるために、高度な選択性が要求されるようになった、(3) 環境中への化学物質の投下量を極力抑えるために、高活性化化合物が要求されるようになってきた、といった農薬の安全性に対する社会的関心の高まりがあったことも忘れてはならない。すなわち、昆虫成育制御剤研究の高まりは、そうした社会的要求に対する農薬科学サイドからの解答の一つであったともいえる。当然ながら、新農薬の開発に課せられたこうした命題は現在でも変わることはなく、むしろ、今後来るべき総合害虫管理の体系下における殺虫剤を考えた場合、これら昆虫成育制御剤の重要性は更に増してゆくものと想像される。

Juvenoid に関して言うなら、過去、膨大な数の化合物が合成され、その JH 様活性がスクリーニングされてきたにもかかわらず、現在までのところ有効な農業害虫用 Juvenoid が商品化されるに至っていない。その背景には、Juvenoid の備える特殊な作用性もさることながら、

真にターゲットになりうる、適切な昆虫を用いたスクリーニングがなされてこなかった、ということもその一因であったように想像される。昆虫類において特異的な進化を遂げたホルモンである JH は、昆虫成育制御という観点から見れば、現在においても魅力的なターゲットの一つであろう。今後、各々の農業害虫の生理生態学における知見に基づいた合理的なスクリーニングが準備されるなら、新たな Juvenoid が出現し、その優れた特徴を発揮することも十分に期待されるものと考えられる。

引用文献

- 1) KUNO, E. (1979) : Brown Planthopper : Treat to Rice Production in Asia, IRRI, Los Banos, pp. 231~240.
- 2) 三宅敏郎・小倉友幸 (1992) 農薬誌 17, 231~240.
- 3) MIYAKE, T. et al. (1988) : Proc. 1988 Br. Crop Prot. Conf. Pest & Disease, pp. 535~542.
- 4) MIYAKE, T. et al. (1991) : J. Pesticide Sci., 16, 441~448.
- 5) MIYAKE, T. et al. (1992) : ibid, 17, 75~82.

本会発行図書

農林有害動物・昆虫名鑑

日本応用動物昆虫学会 編

定価 3,399 円 送料 380 円 A5判 本文 379 ページ 並製

日本応用動物昆虫学会の創立30周年記念出版として刊行されたもので、害虫名の指針として広く利用されてきた、前版「農林害虫名鑑」を全面的に改訂した名鑑である。新たに哺乳類・鳥類が加わり、収録種数も、2,450種と大幅に増補され、一層充実した内容となっている。全体の構成は前版と同様に、第1部—有害動物・昆虫分類表、第2部—作物別有害動物・昆虫名、第3部—学名・英名索引となっている。簡明、便利、かつ信頼して使える有害動物・昆虫名鑑であり、植物防疫関係者にとって必携の書である。

新しい「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。
- ⑥ 表紙がビニールクロスになり丈夫になった。

改訂定価 1部 720 円 送料 360 円

ご希望の方は現金・振替で直接本会へお申込み下さい。

