

殺ダニ剤の最近における開発動向

日本農薬株式会社総合研究所 瀬尾 明・山口 力雄

はじめに

殺ダニ剤開発の歴史は、ダニの薬剤抵抗性発達の歴史と言い換えることができるほど、一般的に、ダニの抵抗性の発達は速いことが知られている。発売後数年で抵抗性が発達した例は枚挙に暇がなく、開発試験中に抵抗性ダニが出現したために、開発を中断した例もある。このように開発リスクが大きいうえに、市場規模が全世界で約 500 億円と小さいことから、かつては積極的な新剤開発へ向けた取り組みが遅れていた分野であった。しかし一方では、抵抗性の発達が速いために有効な薬剤が少なく、常時、新剤のニーズが高い分野でもあった。

最近では、新規剤が日本の化学メーカーを中心に次々と開発されているが、これは日本国内でのハダニ防除の重要度の高さとともに、国内市場が約 100 億円とある程度の規模があるためと考えられる (図-1, 2)。

薬剤抵抗性問題から見た殺ダニ剤開発の現状については、総説に譲り (浅田, 1989, 1995), 本稿では、最近の上市剤、開発剤の化学構造と殺ダニ活性の特徴を紹介するとともに、今後の殺ダニ剤研究開発の展望を述べる。

I 最近の上市剤

1990 年から 1995 年までに日本で登録、上市された殺ダニ剤について述べる。

1 フェンピロキシメート (図-2)

フェノキシピラゾール構造を有する殺ダニ剤で、ハダニの全ステージに有効であり、特に幼虫、若虫に対する活性が強い。速効的なノックダウン作用を有し、残効性にも優れる。ケルセン、シヘキサチン、ヘキシチアゾクス (図-1) とは交差しない (KONNO et al., 1990)。チャノミドリヒメヨコバイおよびチャノホソガにも有効である。

2 ビリダベン (図-2)

ビリダジノン骨格を有する殺ダニ剤である。ハダニの全ステージに有効であるが、特に幼虫、若虫に対する活性が強い。速効的なノックダウン作用があり残効性にも優れる (HIRATA et al., 1988)。チャノミドリヒメヨコバ

イ、コナジラミ類にも有効である。

3 テブフェンピラド (図-2)

ピラゾール骨格を有する殺ダニ剤で、ハダニの全ステージに有効であり、速効的で残効性にも優れる。浸透移行活性はないが、浸透性がある (KYOMURA et al., 1990)。

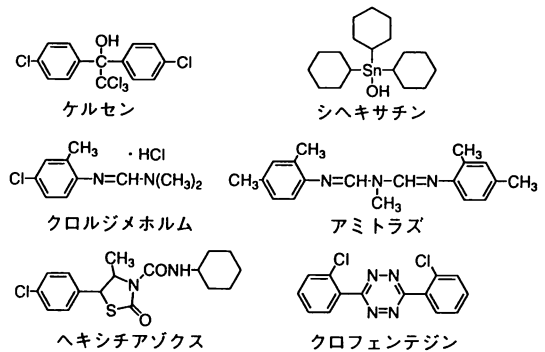


図-1 1989 年以前に上市された殺ダニ剤の例

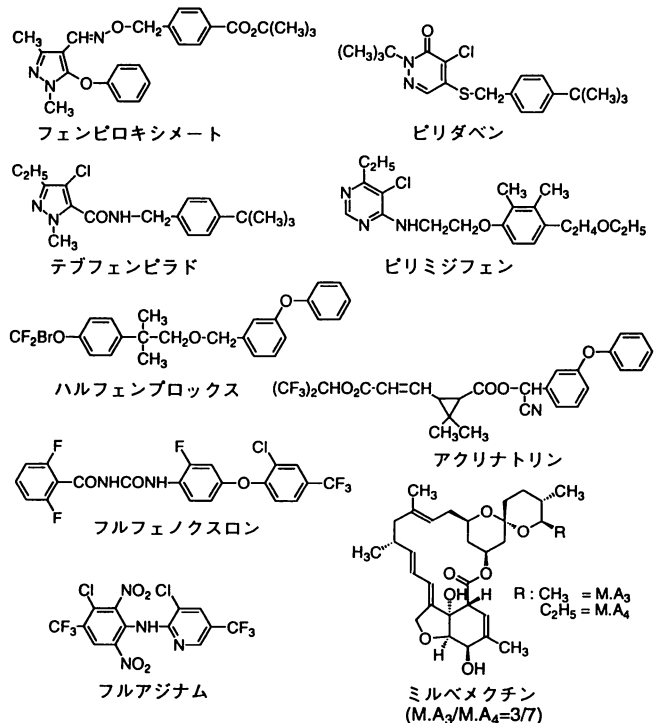


図-2 最近上市された殺ダニ剤

4 ビリミジフェン (図-2)

ビリミジン骨格を有する殺ダニ剤で、ハダニの全ステージに有効であり、速効性、残効性に優れる。コナガにも有効である。

5 ハルフェンブロックス (図-2)

フェノキシベンジルプロピルエーテル系の殺ダニ剤で、ハダニ類に速効的に作用し、高温時より低温時に活性が高い。残効も中程度である。卵に処理するとふ化直後に致死作用が現れる。神経軸索などにおけるナトリウムチャンネルの働きを阻害し、速効的に興奮、麻痺を引き起こし死に至らしめる。合成ピレスロイド剤に感受性が低下したハダニに対しては効果が劣る事例があり、それらとの交差性が疑われる (農薬紹介, 1996)。ほかに、サビダニ、チャノミドリヒメヨコバイ、チャノキイロアザミウマにも有効である。

6 アクリナトリン (図-2)

アクリレート構造を有する合成ピレスロイド剤であり、ハダニ類に対しても殺卵作用はないが、それ以外のステージには有効である。ほかに、アザミウマ類、チャノミドリヒメヨコバイ、チャノホソガなどに有効である。

7 フルフェノクスロン (図-2)

キチン生合成阻害作用を有する昆虫成長制御剤 (IGR) であり、ハダニのほかに、鱗翅目、半翅目、アザミウマ類にも有効である。殺卵活性の高いヘキシチアゾクスとの交差抵抗性が、リングハダニで報告されている (GROSSCURT et al., 1994)。

8 ミルベメクテン (図-2)

Streptomyces 属の放線菌の培養液から分離された 16 員環マクロライド構造を有する二次代謝産物 2 種の混合物からなる殺ダニ剤である。ナミハダニではすべてのステージに有効であるが、ミカンハダニの殺卵活性は劣る (山本ら, 1981 a)。GABA (γ -アミノ酪酸) リセプターに作用して効果を発現すると考えられており、薬剤処理後に麻痺し、死に至る。室内淘汰試験では感受性低下の報告はあるが (山本ら, 1981 b)、使用現場における感受性低下は顕在化していない。

9 フルアジナム (図-2)

殺菌剤であるが、ハダニ類に対しても殺卵および殺幼虫効果を有している。本剤は ATP 合成を阻害する脱共役剤と考えられるが、殺成虫作用は示さない。

II 最近の開発剤

現在、国内および海外で開発中の新規殺ダニ剤ならびに最近殺ダニ活性が報告された化合物について紹介する。

第1章で紹介した最近の上市剤を含めて、現在市販されているほとんどの殺ダニ剤に大なり小なり抵抗性の発達の疑いがある現状から、これらの開発剤に、近い将来の基幹殺ダニ剤としての期待が掛けられている。

1 エトキサゾール (YI-5301) (図-3)

2,4-ジフェニルオキサゾリンを基本構造とする新規骨格化合物であり、*Tetranychus* 属ならびに *Panonychus* 属のハダニ類に高い防除効果を示す。ハダニ類の卵および幼若虫に対しては 1 mg/l 以下の濃度で効果を示すが、成虫には不効である。その作用発現様式はヘキシチアゾクスと類似している (ISHIDA et al., 1994)。ヘキシチアゾクスと同様の作用性を示すフルフェノクスロンおよびクロフェンテジン (図-1) は、ヘキシチアゾクスに感受性が低下したハダニに対して低い活性しか示さないが、本剤は高い活性を有する。また、ハダニのほかにアブラムシ類にも高い防除効果を示し、既存の IGR 剤とは異なる広い殺虫スペクトルを有する (石田ら, 1996)。

2 フルテンジン (SZI-121) (図-3)

テトラジン骨格を有する殺ダニ専用剤でクロフェンテジンの類縁体である。*Tetranychus* 属および *Panonychus* 属など、リンゴ、ブドウを加害する主要なハダニ類に高い防除効果を示す。作用性は、クロフェンテジン、ヘキシチアゾクスと同様で、成虫を除くすべてのステージに有効である。クロフェンテジンと比べたときの活性面での特徴としては、①基本活性が高い、②葉面の表裏間の

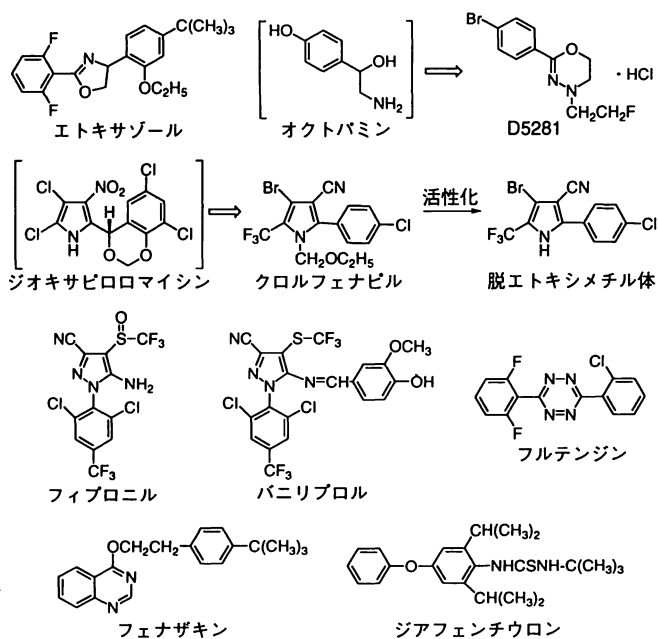


図-3 最近の殺ダニ活性化合物

浸透性が高い、③ペーパーアクションによる効果が高い、などが挙げられる。圃場試験では、実用葉量 60~100 gAI/ha で良好な防除効果と残効性を示し、捕食性ダニを含む天敵および有用昆虫に対する影響も少ないといわれている (PAP et al., 1994)。

3 D5281 (図-3)

ジヒドロオキサジアジン構造を基本骨格とする新規な殺虫、殺ダニ剤であり、*Heliothis* 属の重要鱗翅目害虫であるタバコバッドワームと *Tetranychus* 属のハダニに対して、殺卵活性を示す (DEKEYSER, 1993 a)。節足動物の主要な神経伝達物質、神経ホルモンおよび神経修飾物質として知られているオクトパミン (図-3) は、ダニや昆虫の摂食、運動および生殖など多様な生理学的作用に影響を及ぼすが、D 5281 は、オクトパミンの構造を基に分子設計された誘導体であり、先に記したようなオクトパミン関与の生理機能を混乱させることで殺虫、殺ダニ活性を示すとされている。構造的にも、オクトパミンの安定コンフォメーションとよく一致することが、コンピュータ解析により明らかになっている (DEKEYSER, 1993 b)。類似の作用性と考えられる薬剤としてはクロルジメホルム、アミトラズ (図-1) が知られている。

4 クロルフエナビル (図-3)

ピロール環構造を有する新規骨格の殺虫、殺ダニ剤であり、ワタ、野菜、果樹、チャなどの鱗翅目、アザミウマ類および *Tetranychus* 属のハダニなど広いスペクトルの害虫に対して、接触毒および食毒作用による高い活性を示す。有機リン剤および、ピレスロイド剤に対する抵抗性が発達した系統に対しても、感受性系統と同程度に有効である (LOVELL et al., 1990)。クロルフエナビルの創出研究は、多数の土壤微生物サンプルをスクリーニングするなかで、*Streptomyces* 属の放線菌の培養液から単離されたジオキサピロロマイシン (図-3) に弱い殺虫、殺ダニ活性が見いだされたことに始まる。ピロロマイシン類は、酸化的リン酸化の脱共役により抗菌、抗真菌活性などを示すが、強い活性発現のためには、弱酸性と適度の脂溶性を持つことが重要な特性とされていた。このような知見をもとにピロール環の置換基変換が行われ、活性が強化された最適化合物が見いだされた (ADDOR et al., 1992)。クロルフエナビルは哺乳動物などに対する毒性を軽減するためにピロール環をエトキシメチル基で保護したプロインセクティサイドであり、これ自体にはほとんど生理作用は認められない。しかし、昆虫細胞内では、酸化酵素系により容易に脱エトキシメチル体 (図-3) が生成し、これが脱共役作用を示すことが明らかとなっている (東野, 1996)。本年 4 月、国内で登録されている。

5 フィプロニル、バニリプロル (図-3)

フィプロニルは、フェニルピラゾール構造を有する新規骨格の殺虫剤であり、イネ、ワタ、野菜などの鱗翅目、半翅目など幅広いスペクトルの害虫に有効であるとともに、ダニ類にも効果を示す。ただし、殺ダニ効果はハダニ類には弱く、動物寄生性ダニに強い。既存薬剤に抵抗性の発達した害虫に対しても交差抵抗性を示さない。フィプロニルは神経毒であり、抑制性の神経伝達物質 GABA によるシグナルの伝達を妨げることで殺虫活性を示すとされている。また、昆虫の GABA リセプターに対する本剤の特異性が、哺乳類のそれよりもはるかに高いことが、高等動物への毒性の軽さに繋がっていると考えられている (MOFFAT, 1993)。本年 4 月、殺虫剤として日本国内で登録されている。

バニリプロルは、フィプロニルの誘導体であり、殺虫、殺ダニ剤としてワタ、果樹、野菜用に現在開発が行われている。

6 フェナザキン (図-3)

キナゾリン骨格を有する殺ダニ剤で、ハダニの全ステージに有効である。ミトコンドリアの電子伝達系を阻害すると考えられる (LONGHURST, 1992)。

7 ジアフェンチウロン (図-3)

チオウレア構造を有する鱗翅目、半翅目害虫にも有効な殺虫、殺ダニ剤である。成虫、幼虫に対しては速効的であり、殺卵活性もあるが弱い。ミトコンドリアにおける呼吸系を阻害するといわれる (RUDER, 1992)。

8 オレート、JT-941, KI-66, AGI-941

気門閉鎖による殺虫効果を示す化合物群であり、それぞれオレイン酸ナトリウム、オレイン酸カリウム、精製マシン油+大豆レシチンおよびデンプンが有効成分である。作用性から抵抗性は発現しにくいと思われるが、残効性がなく、散布むら部分での効果が期待できない。しかし、散布後侵入してくる天敵類への影響はないと思われる。

III 生物農薬

ハダニ防除用生物農薬として、国内では 1994 年にチリカブリダニが登録を取得している。

チリカブリダニ (*Phytoseiulus persimilis*) はハダニ類の天敵であり、特に *Tetranychus* 属のハダニを捕食し、ハダニのいないところでは生存できない。20°C の条件下で 1 頭のチリカブリダニが捕食する能力は、カンザワハダニの場合には、成虫では 5 頭、幼虫では 20 頭そして卵では 20 卵といわれている。なお、30°C 以上の高温時には捕食量が低下する (和田, 1995)。使用量としては 10 a 当

たり 500 ml (約 2,000 頭) で、ハダニの発生初期を狙う
とよいとされている。

お わ り に

殺ダニ剤の開発には、常に抵抗性問題が付きまとうのを回避できない状況にある。1990 年以前に登録された殺ダニ剤については、精製マシン油を除けば、それぞれ程度の差はあるものの抵抗性問題を抱えており、最近登録された多くの新規殺ダニ剤についても、地域、種によっては十分な効果が得られない例も報告されており、現実の使用に当たっては、有効剤の選択に苦慮する状況が生まれている。これらの対策として、相乗効果、共力効果の認められる他剤との混用や混合剤化の検討がなされているが、将来的にはやはり新規な殺ダニ剤の創出が必要である。その意味で、先に紹介した現在開発中の薬剤に大きな期待が掛けられているが、その作用性の面から交差抵抗性に不安があるものも認められる。将来のハダニ防除を展望するとき、既存の薬剤とは異なる新たな作用性あるいは作用点を持つ多様な新規剤の創出がさらに必要と考えられる。また、そのためにはハダニ類の生理、生化学的な研究とそれに伴う合理的な創薬研究の進歩も必須と思われる (DEKEYSER, 1994)。

最近では、生物農薬の使用もなされつつあるが、これらは現状では施設内に使用範囲が限られており、殺ダニ剤に代わりうるものではないと思われる。ただし、これらと殺虫、殺ダニ剤との併用化による防除は時流でもあ

り、今後開発される新規剤には、天敵への影響が少なく、総合的防除 (IPM) に使用可能な性能も期待されるようになると考えられる。

引 用 文 献

- 1) 浅田三津男 (1989): 植物防疫 43(11): 603~608.
- 2) ——— (1995): 化学と生物 33(2): 104~113.
- 3) ADDOR, R. W. et al. (1992): Synthesis and Chemistry of Agrochemicals III, ACS, Washington, pp. 283~297.
- 4) DEKEYSER, M. A. et al. (1993 a): J. Agric. Food Chem. 41: 1329~1331.
- 5) ——— et al. (1993 b): Pestic. Sci. 38: 309~314.
- 6) ——— and DOWNER, R. G. H. (1994): ibid. 40: 85~101.
- 7) GROSSCURT, A. C. et al. (1994): Experimental & Applied Acarology 18: 445~458.
- 8) 東野純明 (1996): 日本農薬学会第 21 回大会講演要旨, p. 56.
- 9) HIRATA, K. et al. (1988): Proc. Bri. Crop Protect. Conf.: 41~48.
- 10) ISHIDA, T. et al. (1994): ibid.: 37~44.
- 11) 石田達也 (1996): 応動昆大会要旨, p.90.
- 12) KONNO, T. et al. (1990): Proc. Bri. Crop Protect. Conf.: 71~78.
- 13) KYOMURA, N. et al. (1990): ibid.: 55~62.
- 14) LONGHURST, C. et al. (1992): ibid.: 51~58.
- 15) LOVELL, J. B. et al. (1990): ibid.: 37~42.
- 16) MOFFAT, A. S. (1993): Science 261: 550~551.
- 17) 「農薬紹介」(1996): 植物防疫 50(2): 75.
- 18) PAP, L. et al. (1994): Proc. Bri. Crop Protect. Conf.: 75~82.
- 19) RUDER, F. J. and H. KAISER (1992): Pestic. Biochem. Physiol. 42: 248~261.
- 20) 和田哲夫 (1995): 植物防疫 49(9): 365~368.
- 21) 山本 慎二郎ら (1981 a): 日本応用動物昆虫学会誌 25(4): 182~190.
- 22) 山本 慎二郎ら (1981 b): 同上 25(4): 286~291.

本会発行の最新刊図書：植物保護ライブラリー

各冊 B6 版 定価 1,300 円 (本体価格 1,263 円) 送料 240 円

「イネいもち病を探る」 —研究室から現場まで—

小野小三郎 著
口絵カラー 2 頁 本文 174 頁

「作物の病気を防ぐくすりの話」

上杉 康彦 著
本文 121 頁

「虫たちと不思議な匂いの世界」

玉木 佳男 著
本文 187 頁

「日本ローカル昆虫記」 —虫の心・人の心—

今村 和夫 著
本文 220 頁

お申し込みは、直接本会出版部に申し込むか、お近くの書店で取り寄せて下さい (出版者コード: 88926)

社団法人日本植物防疫協会 〒170 東京都豊島区駒込 1-43-11 TEL: (03)3944-1651 FAX: (03)3944-2103