

外国文献抄録

化学農薬研究における未開拓の領域

本稿は、集会における講演内容である。除草剤に関する記載は少ないが、参考になると思われる事項を抄録した。

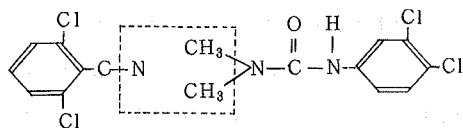
農薬科学の複雑さは、科学の進歩に貢献している学問の領域が多岐にわたっていることを考えなければ、本当はわからない。今日では、化学者・生物学者・生化学者・薬物学者・毒物学者などを含めた、徹底した学際的努力をしなければ、広範な農薬の研究は実を結ばないであろう。

今日まで、合成実験によって、また農薬同族体への誘導によって、一定のスクリーニング方法を経ながら沢山の新しい農薬が作り出されてきた。

ところで、除草剤の合成を意図しながら、新しいスクリーニング方法を採用した結果、新しい種類の殺虫剤を生み出した例として、difluben-zuron が挙げられる。

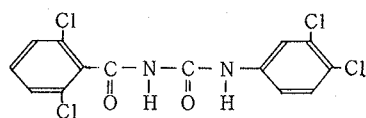
まず、diuron と dichlobenil の2つの除草剤から、Du-1911 が合成された。

これに刺激されて、difluben-zuron (PH 60-40), penfluron, EL-494, Bay Sir-8514 が相次いで生れた(この種の化合物をフェニルベンゾイル尿素系と呼ぶ)。

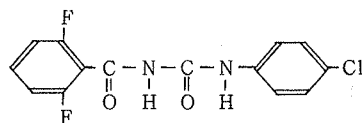


dichlobenil

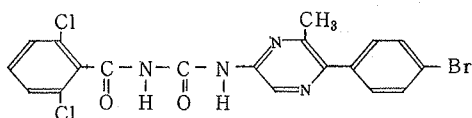
diuron



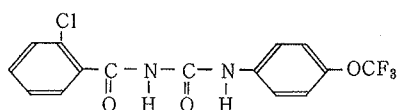
Du-1911



difluben-zuron (PH 60-40)



EL-494



Bay Sir 8514

以上は、こん虫表皮またはキチン形成阻害剤と呼ばれる新しいグループで、間接に虫を殺すほか、殺卵力や化学不妊の作用をもっている。

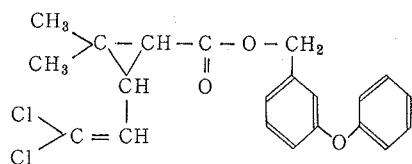
合成実験によって新しい農薬ができる割合は年々減っており、1956年に1/1800、1977年に1/12000 とすると、1997年には1/80,000 になることが予想される。

新農薬について成功率が低いこと、開発コストが増したこと、社会の規制がきびしくなることは、革新的な農薬研究を続けることにも水をさしている。

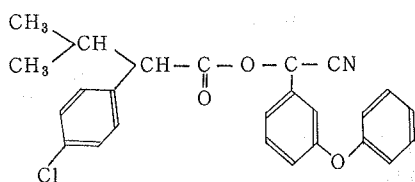
しかし、こん虫や植物の基礎的な生体内変化を、高性能の分析機器の助けを得て追求し、選択的で効果が高く、崩壊し易い農薬を開発するために合理的研究を進める絶好の機会と著者は考えている。

ピレトリン I は、天然物からの抽出物である

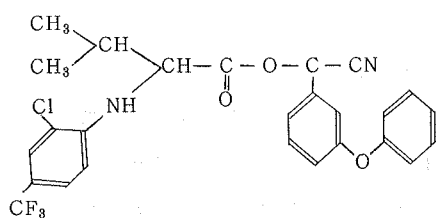
が、合成ピレスロイドの優れた原型である。それから、光に安定な permethrin が生れた。平行して fenvalerate が日本で生れた。最近では、著者の室で Fluvalinate が生れた。



permethrin (NRDC 143)



fenvalerate (S 5602)



fluvalinate (ZR 3210)

nitro ketene dimethyl mercaptol の合成が発表された。殺虫力が強いということである。これが成功すると、ニコチンをモデルとした新しい化合物になりそうである。

食害停止剤 (phago repellent, feeding inhibitor, antifeedant) とも言うべき薬剤として、ヤスキテルペン類がある。インドセンダンの木に含まれる azadirachtin は、その一つである。

農薬の生体内活性を高める作用の一つに、酸化がある。thio carbamate 系の除草剤は、動植物の体内で sulfoxide 化する。sulfoxide は、親化合物より除草効果が高い。

benomyl と thiophanate は共に alkyl benzimidazole carbamate (BMC) によって殺菌力を発揮する。BMC の誘導体は、駆虫力も有する (BMC の alkyl が methyl の場合は MBC とよんでいる)。

農薬の開発に関連して、非標的生物への安全を確保する研究が行なわれてきた。その例が、除草剤の毒性軽減である。thiocarbamate 系除草剤のトウモロコシへ dichloro acetamide 解毒剤の開発が成功してから、他の除草剤についても研究が行なわれるようになった。このモデルは、水稻除草剤 molinate にもあてはまる。molinate は予期しないことながら、日本のコイに毒性を示すことがわかった。50倍の濃度でも、アメリカのコイにはあらわれないことであった。

日本コイの研究では、molinate sulfoxide の解毒にあたり、グルタチオン接合はあまり起っていないことがわかった。これは、ネズミの実験では主たる解毒ルートなのであった。そこで、dichloro acetamide について、水に加えたり魚の餌にまぜたりして適当な化合物をさがしたところ、N-ethyl-N-benzyl dichloro acetamide を 4 ppm の割で水に加えるか、0.06% の割で餌に加えるとよいことがわかった。肝臓のグルタチオンが、それぞれ 3 倍、2.5 倍になり、魚の死亡率が減るのである。

軽減剤の存在で、グルタチオンの増加が、molinate sulfoxide の分解を進め、グルタチオンの carbamoyl 化を経て、S-carbamoyl グルタチオン接合と molinate mercapturate を生成すると説明されている。このモデルはなお不完全で、思いつきの点があると

しても、ここに軽減剤の今後の研究の方向が示されていると言えるだろう。

pheromone, insect growth regulator (IGR) (昆虫生長制御剤), 幼若ホルモン拮抗剤のような薬剤を“biorational”とよび、生物学的に成功した結果を化学的に追いかけることを biorational design と称したのは適切であった。天然の幼若ホルモン JH-1 の構造を決め、幼若ホルモン類似の構造で活性をもった物質 (IGR) を開発したのが, methoprene である。

IGR として、幼若ホルモンに拮抗する物質が適当であろうということは、研究者の間で一致していた。ホルモンの投与は、ホルモン過剰で、ホルモン拮抗剤はホルモンの機能低下で、共にこん虫を死に至らしめるものである。

以上に述べたことは、画期的な農薬創製へのアプローチに、少々光をあててみたものである。社会や環境からのニーズに応えて、今日の知識をすぐれた特異的な農薬へのアプローチに向け直すよい機会である。過去の輝かしい成果をあ

げた方法から、いままでに省みられなかった新しいアプローチへ、こん虫や植物の科学の新知識を自由に導入してゆきたい。

こう語ってくると、1945年 Aldous Huxley が語った言葉が、まことに適切であることがよく分かる。

「真実というのは、腹話術の人形のようなものである。賢者の膝に坐れば名言を吐くが、そうでないときは黙っているか、たわごとしか言わない」

Contemporary frontiers in chemical pesticide research.

Menn J. J.

J. Agric. Food Chem. 28, 2~8, 1980.
Metabolic fate of the N,N-dialkyl carbamoyl moiety of thiocarbamate herbicides in rats and corn.

Hubbell J. P., Casida J. E.

J. Agric. Food Chem.

25 (2), 404~413, 1977.

(鈴木照磨)

新 登 録 除 草 剤 一 覧

農林水産省農蚕園芸局植物防疫課
昭和 55 年 1 月 1 日 ~ 4 月 30 日

種類名	商品名	有効成分の種類及び含有量	剤型	適用作物 (場 所)	適用雑草	適用地帯	適用土壌	使用時期	使用量 〔10 a 当り〕	使用方法	登録会社
DCM U・D PA除 草剤	アイビ ックス 粒剤	2,2-ジクロ ロプロピオン 酸ナトリウム ……10% 3-(3,4- ジクロルフエ	粒 剤	桑	畑地一年 生雑草		全 土 壌 〔砂質土 壌を除 く〕	春 切 後 〔雑草発 生前〕 夏 切 後 〔雑草発 生前〕	3~5 kg 3 kg	土壌全面処 理.	石原産業 (株)