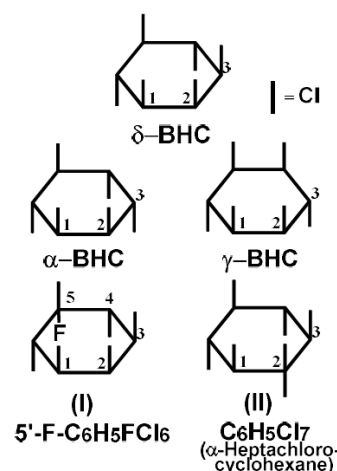


B214 δ -BHC とその誘導体の殺虫活性

○田中啓司¹、岩井崇晃¹、鈴木克規²、尾添嘉久³、松田一彦¹

¹近畿大農、²名古屋大学工、³島根大生物資源

【背景と目的】 50年ほど前まで農薬として使用され、今はレガシーとなっている有機塩素系殺虫剤 BHC は、ベンゼンを光塩素化して得られる 1,2,3,4,5,6-Hexachlorocyclohexane の複数の立体異性体の混合物である。BHC には、理論上 8 種類の立体異性体が存在し、その中で、 γ -異性体(γ -BHC)にのみ高い殺虫活性が存在し、 α -異性体(α -BHC)と δ -異性体(δ -BHC)に弱い殺虫活性の存在が報告されている。ただ非常に興味深いことに、 γ -BHC と α -BHC は害虫を興奮 (excitant) させ、その後致死させるのに対し、 δ -BHC は興奮を誘起することなく、害虫を鎮静 (depressant) させ、その後死に至らせるという、極めて大きな違いの存在することが昔から知られていた。



γ -BHC と α -BHC の作用部位が抑制性の神経伝達物質である GABA の受容体である GABA-Cl イオンチャネル複合体であり、そこに γ -や α -BHC が、GABA アンタゴニストとして作用することにより、殺虫活性を引き起こすと報告されている。しかし δ -BHC についての研究は少なく、これまで深く研究されて来なかった。

【方法】 Benzene、Monochlorobenzene、Monofluorobenzene を光塩素化して得られる δ -BHC や、塩素原子(Cl)、あるいはフッ素原子(F) が δ -BHC 骨格に付加した δ -BHC 類縁体(I)、(II)を単離精製し、イエバエやチャバネゴキブリに供試し、それらが引き起こす中毒症状や殺虫活性を調べた。それぞれの化合物の立体構造は NMR で確認し、NMR で確認できない構造に関しては X 線構造解析により、その立体構造を決定した。GABA アンタゴニスト活性はイエバエ頭部やラット脳から調製した神経膜画分に対する³H]EBOB 結合阻害試験等で評価した。

【結果および考察】 δ -BHC 骨格上の水素原子(H)を F 原子や Cl 原子で置換した δ -BHC は、いずれも δ -BHC 同様の鎮静作用を引き起こしたが、F 原子や Cl 原子で置換した γ -や α -BHC 類縁体は興奮作用を引き起こすが、鎮静作用は誘起しなかった。このことから、鎮静作用には δ -BHC と同様の塩素原子の配位が関連していることが示唆された。特に F 原子が付加した δ -BHC 類縁体の供試虫に対する興奮誘起活性は δ -BHC よりはるかに強いものであったが、最終的な致死作用は δ -BHC と同等か少し劣る結果であった。

Insecticidal activities of δ -BHC and its derivatives

○Keiji Tanaka¹, Takaaki Iwai¹, Katsunori Suzuki², Yoshihisa Ozoe³, Miki Akamatsu⁴, Kazuhiko Matsuda¹

(¹Kindai Univ., ²Nagoya Univ., ³Shimane Univ., ⁴Kyoto Univ.)