

Poster Session Category I

1. Chemistry Including Natural Products
i. Insect Control

昆虫やダニなどに活性を示す合成化合物ならびに天然物に関して、67件(#1~57, #59~68)のポスター発表が行われた(内、#25の1件はキャンセル)。日本からの発表が41件で、他に米国7件、中国7件、イラン3件、ドイツ2件、タイ、韓国、ヨルダン、ハンガリー、セルビア、ロシアから各1件が発表された。これらの中から6件が選ばれ、8月10日の午前にポスターワークショップが開催された。

ここに含まれているポスターは種々の内容を含んでおり、一覧することは難しいが、その一助として合成農薬と天然物に分けて簡単に紹介する。合成農薬に関しては、すでに実用化の段階にある化合物として、殺線虫剤 imicyafos (#7), 殺ダニ剤 acaritouch (#11), cyflumetofen (#21), milemectin (#67), 浸透性殺虫剤 spirotetramat (#29), ノル菊酸型ピレスロイド剤 metofluthrin (#30), マクロライド系殺虫剤 lepimectin (#66) の開発研究が報告された。一方、開発途上の新規化合物の合成と活性試験や構造活性相関に関する研究としては、IGR 活性を有する indolines (#4), 摂食阻害活性を有する aurones (flavonoid) (#4), 殺ゴキブリ活性を有する α -pyrones (#15), 殺シロアリ活性を有する gallic esters (#16), 殺虫剤 pyridalyl 誘導体 (#22), JH アンタゴニストである benzoates (#23, 24), ハダニ等に殺虫活性を示す pyrazole-4-carboxamides (#26), ガ類等に殺虫活性を示す hydrazone 誘導体 (#27), 殺虫剤 flubendiamide 誘導体 (#28), 殺シロアリ活性を有する benzoylphenylureas (#31), 殺虫性抗生物質 spinosyns (#36, 37, 39), ニコチン系 ACh レセプターに作用する anabaseine 誘導体 (#38), GABA アンタゴニストである *N*-phenylamidines (#42), ハダニに殺虫活性を示す 3*H*-benzoxazol-2-ones (#43), 既存農薬のアミノ酸や糖との包合体 (#44, 45), photolarvicidal 活性を示す 2,5-diarylethynylthiophenes (#46), 殺虫殺菌活性を示す benzoxazaphosphorins (#48), ガ類に高活性を示す anthranilic diamides (#52), 殺ダニ活性を示す milbemycin A₄ 誘導体 (#68) の様に、20件以上が報告された。さらに、既存薬剤の圃場試験の発表もされた (#1, 20)。

天然物に関しては、植物精油成分の殺虫活性試験 (#35, 49, 53) や同定 (#54, 55) が報告され、また果皮抽出物の殺虫活性等の報告 (#6) もあった。新たな生理活性物質の同定としては、絶食カイコからの新規ペプチド (#8), 殺ボウフラ活性を有する植物アルカロイド (#10), キチン分解

酵素阻害活性を有する抗生物質 (#13), サソリ毒 (#32), 植物の殺線虫物質 (#47), チョウの摂食刺激物質 (#51), ミバエの性誘引物質 (#56), 寄生蜂に作用する植物成分 (#60), 塊茎からの殺ダニ物質 (#62) が発表された。またミトコンドリア複合体 I の阻害物質 (#2, 3), カイコ幼虫のステロイド嗜好性 (#19), 共生細菌の生産する殺線虫物質 (#64) についても報告された。フェロモンに関しては、蛾類の交信攪乱 (#17, 18), アズキゾウムシの性フェロモンの同定 (#34), カゲロウ性フェロモンの構造変換 (#40), アブラムシ警報フェロモンの類縁体の合成と活性試験 (#41), ダニ警報フェロモンの生合成 (#57) が報告された。天然物の全合成研究としては、駆虫薬であるカイニン酸 (#5), 殺線虫マクロライド (#9), 麻痺性アルカロイド (#33) があり、また ¹⁴C 標識ピレスロイドの合成 (#14) も報告された。加えて、天然ピレスロイド (#50), 生物間相互作用物質である volicitin の生合成研究 (#59, #61) が、ACh レセプターの構造変換による受容部位解析 (#63), 摂食阻害活性物質である pymetrozine の構造解析 (#65) が報告された。

ポスターの英文要旨はすべて公開されているが、さらにいくつかのポスターの概要と感想を以下にとりまとめた。国際会議に参加できなかった学会員の方々の参考になれば幸いである。

I-1-i-03C. Essential structural factors of mitochondrial complex I inhibitor acetogenins (M. Abe, T. Nishioka, T. Miyoshi, Kyoto Univ.)

アセトゲニン類は殺虫活性、抗癌活性など多様な活性を有する。その構造は γ -ラク톤を一端に有し、中央部の連続する2つの5員環エーテル部と長いアルキル鎖で結合し、他端も長いアルキル鎖を有する。本研究では、構造と活性の関係をさまざまな類縁化合物を合成することによって活性に必須な構造を推定した。活性はウシのミトコンドリア複合体 I に対する阻害活性を指標とした。すなわち、 γ -ラク톤は活性に不要なこと、5員環エーテル部はひとつで充分なこと、 γ -ラク톤と5員環エーテル部との間のアルキル鎖長は炭素で13個分が最適長であること、他端のアルキル鎖長は天然物(炭素10個分)より短くてよいことなどを明らかにした。しかし、これが殺虫活性において同様の構造活性相関が成立するかどうかはさらに検討する必要がある。

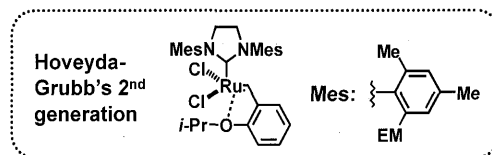
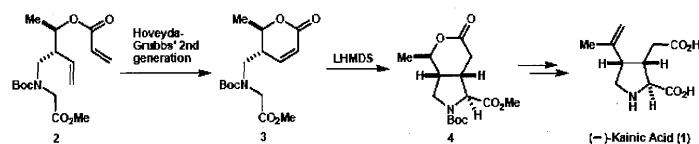


図 1.

あるであろう。

I-1-i-05B. Stereocontrolled total synthesis of (–)-kainic acid (H. Sakaguchi, H. Tokuyama, T. Fukuyama, Univ. Tokyo)

(–)-Kainic acid (1) は海洋性の藻類から単離されるもので、寄生虫駆除作用のあるカイノイドの一種である。Kainic acid は glutamate receptor の強いアゴニストとしても働くため、この化合物は神経薬理学の分野で広く利用できると考えられる。しかし、天然から得られる kainic acid の量は限られているため、今回、Sakaguchi らは、L-phenylalanine を出発として、kainic acid の全合成を行った。今回の合成の鍵となる反応は、光学活性な acrylate 誘導体である 2 の環化反応と、ジアステレオ選択的な分子内マイケル付加反応である。2 から 3 への合成は 0.8 mol% の触媒を用いることにより、99% の高い収率で合成される。また、3 から 4 への合成では、目的とする化合物以外に、光学異性体が合成されるが、塩基、溶媒、温度の検討により、91:9 (収率 95%) で目的とする化合物を得ることに成功し、最終的に 15 ステップ、13% の収率で、kainic acid の合成に成功した (図 1)。

I-1-i-08B. Identification and characterization of a novel peptide (pp3158) from the starved larval hemolymph of the silkworm, *Bombyx mori* (S. Nagata, H. Nagasawa, Univ. Tokyo)

カイコの摂食リズムを調べた結果、幼虫期間を通して概日リズムとは異なる約 3 時間の周期で摂食-休止のリズムを繰り返していることを見出した。また、これに対応して変化する体液中のペプチド成分を TOF-MS を用いて調べたところ、 m/z 3158 のペプチドが休止期に高くなることがわかった。これを単離してアミノ酸配列を決定したところ、28 アミノ酸残基からなることがわかった。この配列を基に、このペプチドをコードする cDNA をクローニングしたところ、64 アミノ酸の前駆体 (pp3158) にコードされており、その後の検討から m/z 3158 のペプチドは精製中に生じた分解物であることがわかった。発現解析の結果から、このペプチドは主に脂肪体で合成されていることがわかった。このような摂食調節の分子機構の解明から、将来、害虫制御の標的が探索されることが期待される。

I-1-i-10A. New leading alkaloids for insecticide from *Macleaya*

cordata (T. Ueno, M. Inoue, K. Nakayama, Y. Katsuda, Dainihon Jochugiku)

タケネグサ (*Macleaya cordata*) を乾燥させたものは、蚊やイエバエに対する植物由来の殺虫剤として古くから使用されてきたものである。この植物の持つ殺虫活性がどのような物質に起因するのかを、この植物の抽出液を用いて調査、報告している。LC-MS での測定の結果、protopine、allocryptopine、そして chelerythrine と sanguinarine の混合物が得られた。これらの化合物は、生物試験 (蚊の幼虫を使用) において、ニコチンを上回る殺虫活性を示した。さらにニコチンが高い魚毒を有するのに対し、これらの化合物は魚毒をほとんど示さない。蚊の幼虫以外への生物試験はまだ行われておらず、他の昆虫に対しての作用や、投与方法の検討など、問題は残されているようだが、今後、安全性の高い殺虫剤への応用が期待される。

I-1-i-12C. Synthesis and insect antifeedant activity of auronones against *Spodoptera litura* larvae (H. Fukumoto, M. Morimoto, T. Nozoe, A. Hagiwara, K. Komai, Kinki Univ.)

タイ国の浜辺に生息しているシンチクグは、周辺に生息している植物に比べ、根が貧弱であるにもかかわらず、広範囲に生息していた。このことから、この植物は生育に有利ななんらかの能力を見に付けているのではないかと考え、シンチクグの根を抽出したところ、数種のオーロン類が多量に含まれていた。オーロンは植物の黄色色素として天然に存在し、種々の生理活性を持つフラボノイドである。これまで、数種のフラボノイドにハスモンヨトウ幼虫に対する摂食阻害活性が認められていることから、オーロンにも摂食阻害活性があるのではなかと考え、摂食阻害活性を評価し、その構造活性相関を検討することを目的とした。植物からのオーロンの収量が少なかったため、各種フェノールを出発物質として種々のオーロン類を合成し、オーロン 19 種とその前駆体であるクマラノン 4 種のハスモンヨトウ幼虫に対する摂食阻害試験を行った。その結果、天然型である 4,6,3',4'-tetramethoxyaurone が供試化合物中で最も高い活性を示し、順相 TLC の R_f 値が低いほど摂食阻害活性が高い傾向が認められた。

I-1-i-16A. Gallic ester effective on termites feeding (T. Mori, S. Kubota, Y. Shono, N. Matsuo, Sumitomo Chemical)

Gallic esters (没食子酸エステル) は、多くの植物に含まれる没食子酸誘導体であり、タンニンや茶カテキンなどで知られるように抗酸化作用を有する事から、食品添加物等にも用いられている。本研究では、gallic ester のエステル部分炭素鎖を伸長した誘導体を合成し、シロアリの摂食に対する影響を検討している。結果として、undecanoyl gallate はシロアリに対し高い摂食阻害作用を示し、nonadecanoyl gallate は逆に、高い摂食刺激作用を示す事が明らかとなった。今後、シロアリの餌嗜好性のメカニズムを探るツールとして、また、シロアリへの忌避物質もしくは誘引物質として、期待できるものである。

I-1-i-19A. Selection test of sterol preference by the silkworm, *Bombyx mori* larvae (S. Nagata, Y. Ohmori, H. Nagasawa, Univ. Tokyo)

昆虫にはエクダイソンなどのステロイド物質が存在するが、自身でステロイド骨格を生合成することはできない。そのため、餌として体内に取り込んだ植物由来のステロイドから誘導化される。カイコ幼虫は桑の葉のみ食するため、桑に含まれる β -sitosterol が成育に効果的である事は知られている。しかし、カイコ幼虫の sterol 嗜好性に関しては知られていない。本研究では、 β -sitosterol を含む 4 種類の sterol を餌に混ぜ、餌を噛む事を指標としてその嗜好性を調査した。結果、 β -sitosterol が最も高い嗜好性を示し、他は ergosterol, cholesterol, stigmasterol の順となった。その中で、ergosterol に関しては、摂食した幼虫の成育に著しい阻害作用が見られるにも関わらず、2 番目に高い嗜好性を示している事が大変興味深い。カイコ幼虫の餌嗜好性と、成育への作用は別の認識機構によるものである事を示唆する結果であり、口の部分に存在するであろう独立した餌認識機構は農薬の新規ターゲットとして有望である。

I-1-i-20B. Efficacy of clothianidin 0.5% granule against rice leafbug (*Trigonotylus caelestialium* Kirkaldy) on rice by paddy water application (A. Iwata, N. Tokoro, M. Tabuchi, T. Yanai, Sumitomo Chemical)

米農家にとって、カメムシの捕食により生じる斑点米が問題になっている。有用な対処法が少なく、これまで斑点米を軽減するために、薬剤のヘリコプター散布などが行われている。農薬飛散の問題がある事から、薬剤の散布方法

が問題になっている。そこで、斑点米を軽減させるクロチアニジンの施用方法について検討した。その結果、クロチアニジンを粒剤にして水田にまく事により、ドリフトが無く、省力で散布でき、効率よく斑点米の発生を抑制する事が出来た。しかし、クロチアニジンは米にほとんどは移行しないことから、斑点米の発生抑制効果はカメムシのどのような摂食行動によるものか観察した。カメムシは、米だけではなく、葉心からも吸汁しており、葉心に含まれるクロチアニジンの効果であることが明らかとなった。さらにその活性は経口だけではなく、接触によっても効果を示すことが示された。この事から、クロチアニジン粒剤は斑点米を軽減する上で有用なツールであると考えられる。

I-1-i-22A. Synthesis and insecticidal activity of monocyclic derivatives of pyridalyl (H. Ikegami, M. Suzuki, K. Izumi, S. Saito, K. Umeda, N. Sakamoto, Sumitomo Chemical)

Pyridalyl は、綿や野菜に対する様々な鱗翅目や双翅目の害虫に高い活性を示す新規殺虫剤である。Pyridalyl は、ジクロロフェニルの部位と炭素鎖で繋がった二つの芳香環で構成されている。ジクロロフェニルの部分にトリフルオロメチル基を導入するなど、芳香環の部分の改変は以前行っていたが、今回は、ピリジン環を様々な非環状のものに変換し、その活性を検討している。その中でも、アリルタイプとオキシムタイプの化合物は、いくつかの鱗翅目の害虫に対して効果が確認された。今回の結果により、ピリジン環部位が殺虫活性に必須でない可能性が示唆された (図 2)。

I-1-i-23B. Characterization of ethyl 4-(2-substituted alkyloxy)benzoate with precocious metamorphosis-inducing activity (N. Fujita, E. Kuwano, T. Shiotsuki, Kyushu Univ.)

幼若ホルモン (JH) の弱いアンタゴニストとして見いだされた ETB を構造改変する事により、ethyl 4-(2-substituted alkyloxy)benzoate 類により高い JH 阻害作用を見いだした。これらの化合物は、カイコ幼虫に塗布することで、JH の顕著な欠乏症状である早熟変態を誘導する。早熟変態という現象自体は、同じく重要な昆虫ホルモンであるエクダイソンの阻害によっても起こりうるが、これらの化合物の作用は、JH アゴニストのメソプレン処理によってのみ完全に打ち消された。また、通常最終齢のみ体液中で活性を示す JH エステラーゼの活性が、化合物を処理した個体の体液中で

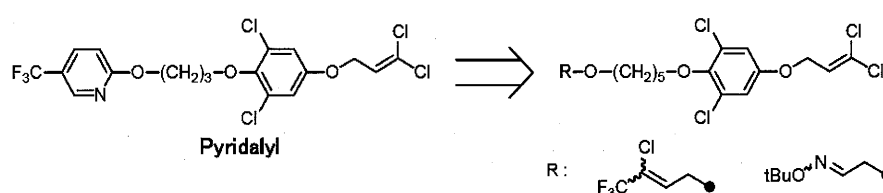


図 2.

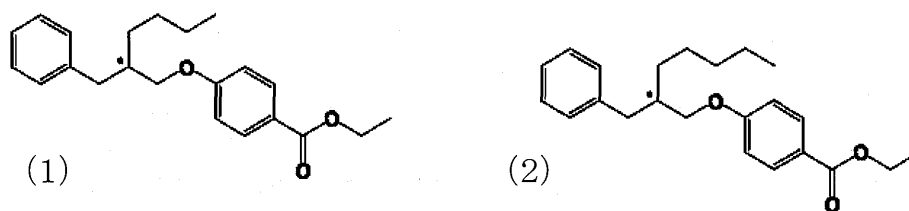


図 3.

終前齡から誘導されている事が明らかになった。今回見いだした化合物は、早熟変態誘導の際に JH の代謝経路に何らかの影響を及ぼしていると推察できるが、JH エステラーゼの誘導が直接的か間接的かなど、化合物の作用機構に関してはまだ不明な点が多い。

I-1-i-24C. Synthesis and anti-juvenile hormone activity of optically active ethyl 4-(2-benzylalkyloxy)benzoates (K. Ashibe, H. Shirahashi, K. Furuta, N. Yamada, E. Kuwano, Kyushu Univ)

昆虫に特異的に存在し、生体内で重要な働きを持つ JH に注目し、JH の働きを阻害する抗 JH 活性物質の合成と、それをリガンドとして利用した JH レセプターの単離を目指した研究である。今回の発表では、以前に発表されている、化合物 (1) の構造を改変し、より強い活性を示す化合物の合成を行い、その活性を検討している。

中でも、(2) はカイコ幼虫において、低薬量において強い抗 JH 活性を示すと共に、高薬量では JH 活性を示すという、興味深い結果が得られている。

しかし、この化合物が示す二つの相反した作用がどのような理由によるものか、また、これらの化合物の生体内での詳しい作用部位など、未だ判明していないことも多いが、JH の標的とした新規薬剤の開発へむけ、期待できる研究である (図 3)。

I-1-i-30C. Insecticidal activity of norchrysanthemic acid benzyl esters—A new class of synthetic pyrethroids with high vapor activity (K. Ujihara, T. Mori, T. Sakamoto, N. Matsuo, T. Iwasaki, M. Sugano, Y. Shono, Sumitomo Chemical)

これまでの蚊やハエなどを対象とした家庭用の殺虫剤は、蚊取り線香やマットなどいずれも熱をかけて薬剤を空気中に気散させるものであった。これを熱をかけないで、常温で気散させることを目的に化合物の最適化を行った。その結果、菊酸部分は 3 員環に結合したジメチルアリル基はメチル基 1 つを欠いたプロペニル基で十分活性があり、アルコール部分についてはフッ素原子で 4 置換した *p*-メチル (あるいは *p*-メトキシメチル) ベンジルアルコールが上述の性質を有することがわかった。これらの化合物を利用した殺虫剤は簡易な乾電池式のファンで利用できるものがすでに市販されている。熱をかけないので、安全で、長持ちする

ことから、利用範囲は広がりそうである。

I-1-i-32B. Analysis of peptide components in the venom of the Japanese scorpion *Liocheles australasiae* (Y. Hanai, M. Miyashita, J. Otsuki, Y. Nakagawa, H. Miyagawa, Kyoto Univ.)

サソリの持つ毒のペプチド成分を MALDI-TOF MS, LC/ESI-IT-TOF MS, MSⁿ, 生物活性試験を用いて分析していく手法の確立。ほ乳類および昆虫に対する毒性の傾向を上記の分析で把握する事が可能。MALDI-TOF MS において、ペプチド成分の分子量の分布を知る事ができる。一般に 30~40 AA の低分子量ペプチド群および 60~70 AA の高分子量ペプチド群に大別でき、特に高分子量ペプチド群がほ乳類に対して強い毒性を持つ。今回は日本産の無害なサソリと、外国の猛毒を持つサソリの MS データを得たが、今後データも蓄積していく事により、機器分析のみで毒性を推定することが可能になると思われる。

I-1-i-37A. From QSAR to product: ANN-based QSAR and discovery of XDE-175—the next generation spinosyn insecticide (T. C. Sparks, G. D. Crouse, P. B. Anzeveno, J. Martinow, J. Dripps, J. Gifford, Dow AgroSciences)

スピノシン A はマクロライドに 2 種類の糖が結合した化合物で、微生物が生産する殺虫活性物質である。この化合物に対して、ANN-based QSAR (artificial neural network-based quantitative structure-activity relationship) を適用して、より活性の強い化合物を予測したところ、2 種類の糖のうちの 1 つのフコースの 3' 位の *O*-メチル基は *O*-エチル基の方が活性が強いと予想されたので、実際に合成してみたところ確かに活性が強いことを確認した。このことから、発表者らはこの方法が有効であることを述べている。しかし、この方法の適用範囲ははっきりせず、どの程度の確率で有効な予測が出来るかは明確ではない。その他、構造中のマクロライドに付随する 5-6-5 員環の 6 員環部分はシクロヘキセンよりシクロヘキサンの方が高活性であることもわかった。

I-1-i-38B. Structure-activity relationships of 3-benzylidene-anabaseine and 3-benzylidenemyosmine probes for insect nicotinic acetylcholine receptors (I. Ikeda, T. Utsunomiya, M. Sadamitsu,

A. Hirohara, I. Sultana, Y. Ozoe, K. Mochida, Shimane Univ.)

殺虫剤の効果的なターゲットであるニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR) は昆虫の神経伝達において、重要な役割を果たす事が知られている。3-Benzylidenecyanabazine 類縁体は、脊椎の $\alpha 7$ nAChR に選択的なアゴニストであるにもかかわらず、 $\alpha 4\beta 2$ nAChR に対しアンタゴにスト活性を示す。このようなサブタイプ選択的な化合物は種々のサブタイプが持つ結合部位の構造を明らかにするばかりではなく、昆虫 nAChRs とその結合部の特徴を説明する事が出来るかもしれないと考えた。そこで、 $[^3\text{H}]$ エピバチジンを用いてキブリ神経の nAChR に対する 3-benzylidenecyanabazine と 3-benzylidenemyosmine 類縁体の親和性を測定した。その結果、3-benzylidenecyanabazine および 3-benzylidenemyosmine 類縁体の benzylidene 基のオルト位への電子供与対の挿入はゴキブリの nAChRs に対する結合親和性を増大させた。これらの結果を元に、種々のサブユニットが持つ特徴を明らかにするとともに、昆虫 nAChR 特異的に作用する新規殺虫剤の開発が期待される。

I-1-i-42C. Synthesis of insecticidal *N*-phenylamidine derivatives and their structure-activity relationships (T. Uekawa, H. Miyazaki, O. Matsumoto, S. Sembo, Y. Shono, N. Matsuo, Sumitomo Chemical)

殺虫活性を持つ化合物、*N*-phenylamidine の誘導体を合成し、その構造活性相関を求めた。構造改変部位はベンゼン環の *p*-位および *o*-位、アミノ基、ハロアシル基の三カ所とした。チャバネゴキブリを用いた活性試験の結果、ベンゼン環の *p*-位に CF_3 、*o*-位の両方に NO_2 -アミノ基は NH_2 、ハロアシル基に $\text{C}_2\sim\text{C}_3$ のハロゲン化物を用いた化合物で、最も高い殺虫活性を得る事ができた。この化合物昆虫の GABA-レセプターにアンタゴニストとして作用する活性を持つ事が示されている。

I-1-i-48C. Synthesis and biological activity of 4*H*-1,3,2-benzoxazaphosphorin derivatives (H. Yoshikawa, H. Tamura, Y. Ichiki, Fukuoka Inst. Technol.)

マラチオンやフェントロチオンといった有機リン剤は現在も広く利用されている薬剤だが、徐々に衰退していく傾向にある。しかしながら、リン元素は水素、酸素、炭素、窒素、硫黄などの多様な元素と結合可能である。つまり、有機リン化合物には、生理活性物質としてまだ多くの可能性が残されている。本研究では、殺虫活性に関してすでに多くの報告がある 2-methoxy 4*H*-1,3,2-benzodioxaphosphorin-2-thione 誘導体ではなく、salicyl aldehyde 誘導体から改変した 4*H*-1,3,2-benzoxazaphosphorin についてその生理活性を検討した。6 位に Cl や Br を導入した誘導体は *Laodelphax striatella* 特異的に殺虫活性を示した。また、6 位にニトロ基を

導入すると殺虫活性は低下するが、逆にコリンエステラーゼ阻害活性は向上した。N 原子上に Allyl 基を導入した誘導体は *Pyricularia oryzae* や、*Diaporthe citri* などにも効果を示した。有機リン剤の新しい可能性を示唆する興味深い研究である。

I-1-i-50B. Biosynthesis of pyrethrins in seedlings of *Chrysanthemum cinerariaefolium* (Y. Kikuta, M. Takahashi, K. Matsuda, A. Hatanaka, K. Nakayama, Y. Katsuda, Dainihon Jochugiku)

天然ピレトリン類は、除虫菊 (*Chrysanthemum cinerariaefolium*) に含まれる殺虫性物質であり、近年では天然物嗜好の高まりとともに殺虫薬としての需要が高まっている。これまでに、構造や作用機構などの研究は多く行なわれているものの、植物体内におけるピレトリン類の生合成経路についてはほとんど明らかとなっていない。菊田らは、 $[1-^{13}\text{C}]$ D-glucose を取り込ませた除虫菊幼苗からピレトリン I を分取し、その ^{13}C -NMR スペクトルを解析することにより天然ピレトリン類の生合成経路の解明を試みた。その結果、エステル化合物であるピレトリンの酸部分は、2-*C*-methyl-D-erythritol 4-phosphate を中間体とする非メバロン酸経路により生合成されることが明らかとなった。一方、アルコール部分はリノレン酸由来のオクタデカノイド経路により生合成されることが強く示唆された。両経路に関わる酵素は葉緑体に局在することから、ピレトリン生合成には葉緑体が深く関与することが明らかとなった。今後、さらに詳細なピレトリンの生合成経路の解明が期待される。

I-1-i-51C. Larval feeding stimulants of a Rutaceae-feeding swallowtail butterfly, *Papilio xuthus* (T. Murata, N. Mori, R. Nishida, Kyoto Univ.)

Papilio xuthus の幼虫は、主としてミカン科植物を餌として食べる事が知られている。本研究では、トイレットペーパーにしみ込ませた植物のエタノール抽出物が幼虫の摂食を強く刺激する事を見だし、その要因となる成分の探索を行った。その結果、polymethoxyflavone や cyclic peptide、複数種の糖を含む多数の化学物質が検出された。検出された物質を単独で用いても、全く摂食刺激作用は認められず、混合する事によって初めて摂食を開始する。昆虫のフェロモンや、植物が天敵を呼び寄せる揮発性物質なども、種特有の化学物質やその混合比によって受け手側の認識が異なる事は知られているが、本研究の嗜好性に関する刺激物質に関しても特定の混合比やそれを認識する複雑な受容機構の存在が伺える。自然界において種特異性、選択性の高いこれら誘引物質、刺激物質の認識機構の解明は、より安全な薬剤の開発に非常に有効である。

I-1-i-52A. Substituted arylpyrazole anthranilic diamide: novel

insecticidal activators of the ryanodine receptor (T. P. Selby, K. A. Hughes, DuPont Crop Protection)

リアノジン受容体は殺虫活性の新しい標的になっている。細胞内のカルシウムイオン濃度は細胞外に比べてかなり低い濃度に保たれているが、細胞内のカルシウム貯蔵器官からの細胞内へのカルシウムイオンの放出を制御しているリアノジン受容体が細胞の活性において重要である。日本農薬(株)で開発されたフタル酸ジアミド誘導体(フルベンジアミド)をヒントにひとつのアミドの向きを逆にしてアントラニル酸誘導体に変え、それを基本に各種置換基の構造を最適化した。DuPontによって開発されたこの最終化合物はその最適化の過程で、さまざまな複素環誘導体を検討したことを報告している。この種のリアノジン受容体に対する阻害活性は昆虫と哺乳動物(ヒトやマウスには3種類の受容体がある)の間で高い選択性(いずれも3桁以上の差)があり、この点でも有望な殺虫剤といえる。この薬剤を投与すると、鱗翅目昆虫の幼虫は痙攣とともに動きが不活発になり、じっとして動かなくなる。リアノジン受容体に対する結合部位はリアノジンが結合する部位とは異なることがわかっている。しかし、フルベンジアミドとの構造の違いを考慮すると、このアントラニルジアミドがリアノジン受容体の同じ部位に結合するかどうか疑問もあり、検討の余地があるように思われる。この発表に関連する発表がポスター発表と口頭発表を含めて多数行われたことから、この分野で高い注目を浴びていることが伺える。

I-1-i-55A. Insecticidal activity and chemical composition of essential oil from *Artemisia scoparia* (M. Negahban, S. Moharrampour, F. Sefidkon, Tarbiat Modarres Univ.)

イランの乾燥地帯に植生するヨモギの一種、*Artemisia scoparia* は薬草として用いられている。この仲間のエッセンシャルオイルが、貯蔵食糧害虫への殺虫活性を持つという報告が数件ある。アズキマメゾウムシ、コクゾウムシ、コクヌストモドキの仲間三種を*A. scoparia*のエッセンシャルオイルの薫蒸による殺虫活性試験した結果、37~926 $\mu\text{L/L}$ で活性が確認できた。このエッセンシャルオイルの主成分はモノテルペンであり、それらは既に多くの殺虫、殺菌活性などが知られている。以上から、このヨモギを用いた貯蔵穀物の薫蒸殺虫、殺菌が期待できる。

I-1-i-56B. Male attractants of tropical fruit flies in the floral fragrance of "fruit fly orchids (*Bulbophyllum* spp.)" (R. Nishida, K.-H. Tan, Kyoto Univ.)

ミバエの仲間、*Bactrocera dorsalis* と *Ba. cucurbitae* は多くの亜熱帯性果実を食害する東南アジアの害虫である。洋蘭の仲間 *Bulbophyllum* 族は花から化合物を放出し、これらのミバエの雄を誘引し、受粉の媒介者とさせる。洋蘭 *Bu.*

Cheiri は methyl eugenol を放出して *Ba. dorsalis* を、*Bu. apertum* は raspberry ketone を放出して *Ba. cucurbitae* を誘引していた。しかし、*Bu. patens* が放出する zingerone は methyl eugenol のメトキシ基と raspberry ketone の水酸基、直鎖-2-ケトンの両方の構造を持っており、一成分で両ミバエに対して誘引活性を示した。これらの成分はミバエの雄が雌に対して放出する性フェロモンであり、また洋蘭によってシノモンとしても使われる。

I-1-i-59B. Volicitin and nitrogen metabolism in *Spodoptera litura* (N. Yoshinaga, R. Nishida, N. Mori, Kyoto Univ.)

トウモロコシやタバコなどの農作物は、ヨトウガの幼虫に食害されると、幼虫の唾液に含まれる volicitin を認識し、ヨトウムシの天敵である寄生蜂を誘引する揮発成分を放出する事が知られている。しかし、鱗翅目昆虫はなぜ生存に不利に働く volicitin を持っているのか明らかではない。そこで、吉永らは volicitin が幼虫の生理代謝に重要な役割を果たしていると考え、volicitin 類縁体の同定を行った。その結果、ヨトウガ幼虫に含まれる volicitin 類縁体は全てグルタミン縮合物だったことから、グルタミン代謝と volicitin 生合成との関連について安定同位体 (^{15}N) を用いて調べた。一般に、グルタミンは窒素の供給源として体液中に蓄えられており、カイコでは、グルタミンはアンモニアの解毒によって生合成(窒素の再利用)されることが知られている。本研究では、ハスモンヨトウにおいても ^{15}N ラベルのアンモニアがグルタミンの末端アミドに取り込まれるだけでなく、さらにその ^{15}N -グルタミンがリノレン酸と縮合し、各種の volicitin 類縁体が生成することを明らかにした。こうして生成した volicitin は中腸腸管内に高濃度に蓄積され、一部は分解されて再吸収されることから、volicitin はグルタミンの蓄積形態の一つであり、これによって効率的窒素代謝が可能になっていると示唆された。

I-1-i-61A. Positive incorporation of unsaturated fatty acids to the fatty acid amides in *Spodoptera litura* (T. Aboshi, N. Yoshinaga, K. Noge, R. Nishida, N. Mori, Kyoto Univ.)

Volicitin は *Spodoptera litura* (ハスモンヨトウ) の幼虫の口内で分泌され、食害植物に揮発成分を放出させるエリシターであり、*S. litura* を目標とする寄生蜂が揮発成分に誘引される。Volicitin 生合成におけるグルタミンと脂肪酸の結合が *S. litura* 中腸で行われる事が明らかになっているが、ここではその脂肪酸の選択性について研究をおこなった。食草の脂肪酸組成を調べた結果、リノレン酸、リノール酸、パルミチン酸、ステアリン酸から構成されていることがわかった。これらの脂肪酸のナトリウム塩を人工飼料に加え、食餌させた幼虫中腸内の脂肪酸-グルタミン結合成分を調べた結果、不飽和脂肪酸は飽和脂肪酸と比較して、明らかに

多くの化合物が生合成されていることがわかった。また、リノレン酸およびパルミチン酸のラジオアイソトープ標識化合物を与えたところ、リノレン酸は体組織に取り込まれやすいが、パルミチン酸は体外に放出される量が多かった。以上の結果より、幼虫は不飽和脂肪酸を選択的に体内に取り込み、volicitinを生合成することが示唆された。

芦邊希代（九州大学大学院生物資源環境科学府），
安藤 哲（東京農工大学共生科学技術研究院先端生物
システム学部門），下村 勝（近畿大学農学部），
長澤廣道（東京大学大学院農学生命研究科），
藤田雄大（九州大学大学院生物資源環境科学府），
山本雅信（東京農工大学共生科学技術研究院
先端生物システム学部門）