

2-ヒドロキシメチル-5-ヒドロキシ-4-ピリドンの経口投与による4眠交雑種からの3眠蚕出現について

誌名	日本応用動物昆虫学会誌
ISSN	00214914
著者	村越, 重雄 櫛本, 五男
巻/号	16巻3号
掲載ページ	p. 159-161
発行年月	1972年9月

PHC は他の殺虫剤よりもイエバエに対して効果的であるが、共力剤の効果は顕著ではなかった。

CPMC は各系統に対し PHC より感受性が低く、共力剤の効果は認められなかった。

また、MPMC は各系統に対し、NAC よりも感受性であるが、PHC や PMC よりも感受性は低かった。共力剤の効果は認められたが、1:10 に混合した場合でも PHC 単独の効果に及ばなかった。この薬剤においても札幌系の感受性は高く、malathion 抵抗性とカーバメート系殺虫剤に対する感受性の間に特異な関係のあることがうかがえる。

GD-11 は pyrethroid 類に対しては顕著な共力作用が認められていないが、カーバメート系殺虫剤に対してははかかなり効果的で、ことに、NAC に著しい共力作用のあることは新しい知見である。また、NAC や MPMC が系統間に感受性の差異が大きいことも興味深い点である。

引用文献

林 晃史・向 暁・山口 宏・田中哲雄 (1972) 防虫科学 37: 3~7.

2-ヒドロキシメチル-5-ヒドロキシ-4-ピリドンの経口投与による4眠交雑種からの3眠蚕出現について^{1,2}

村越 重雄・樺本 五男

神奈川県蚕業センター・大阪府立大学農学部

(1972年5月29日受領)

前報(村越, 1972)において通常飼育している4眠交雑種の4齢起蚕よりこうじ酸(以下KAと略す)を経口投与することによって3眠蚕が出現することを報告した。さらに3眠蚕の出現と化学構造の関係を調べるため14種類のKA関連物質について調べたところ、2-ヒドロキシメチル-5-ヒドロキシ-4-ピリドンがKAより低濃度において3眠蚕を出現させることを見出したので、その結果について報告する。

本報告を行なうにあたり、研究の遂行に御援助を賜りました東京大学農学部鈴木昭憲助教授並びに理化学研究所張清芬博士、実験に御協力いただいた神奈川県蚕業センター富田一郎氏、田所トミエ嬢の各位に対しまして厚くお礼申し上げます。

材料と方法

供試化合物: 4-ピロン系化合物としてKA〔1〕の他にマルトール〔2〕、アロマルトール〔3〕、5-メチル-KA〔4〕、6-ヒドロキシメチル-アロマルトール〔5〕、2,6-ジメチル-4-ピロン〔6〕、6-ヒドロキシメチル-KA〔7〕、5-ペンジル-KA〔8〕、ケリドン酸〔9〕、コメン酸エチルエステル〔10〕、 α -クロル KA〔11〕の10種、4-ピリドン系化合物として2-ヒドロキシメチル-5-メトキ

シ-4-ピリドン〔12〕、2-メチル-3-ヒドロキシ-4-ピリドン〔13〕、2-ヒドロキシメチル-5-ヒドロキシ-4-ピリドン〔14〕の3種、他に3,6-ジヒドロキシメチル-1,4-ジヒドロピリダジン〔15〕の合計15種類を用いたが、これらの化合物は著者の一人樺本らの合成したものである(ICHIMOTO *et al.*, 1965, 1966, 1967; 樺本, 1970)。各化合物の構造を第1表に示した。

第1表 供試化合物の構造

供試化合物	置 換 基				基本骨格
	R ₂	R ₃	R ₅	R ₆	
〔1〕	CH ₂ OH	H	OH	H	
〔2〕	CH ₃	OH	H	H	
〔3〕	CH ₃	H	OH	H	
〔4〕	CH ₂ OH	H	OCH ₃	H	
〔5〕	CH ₃	H	OH	CH ₂ OH	
〔6〕	CH ₃	H	H	CH ₃	
〔7〕	CH ₂ OH	H	OH	CH ₂ OH	
〔8〕	CH ₂ OH	H	OCH ₂ C ₆ H ₅	H	
〔9〕	COOH	H	H	COOH	
〔10〕	COOC ₂ H ₅	H	OH	H	
〔11〕	CH ₂ Cl	H	OH	H	
〔12〕	CH ₂ OH	H	OCH ₃	H	
〔13〕	CH ₃	OH	H	H	
〔14〕	CH ₂ OH	H	OH	H	
〔15〕	—	CH ₂ OH	H	CH ₂ OH	

1 On the appearance of three-moulters from the F₁-hybrid of four-moulters in the silkworm, *Bombyx mori* L., due to oral administration of a 2-hydroxymethyl-5-hydroxy-4-pyridone. By Shigeo MURAKOSHI (Kanagawa Prefectural Institute for Sericultural Science, Ebina-shi, 243), Itsuo ICHIMOTO (Department of Agricultural Chemistry, College of Agriculture, University of Osaka Prefecture, Sakai, 591)

2 本報告の一部は昭和47年度応動昆虫大会において発表した。
日本応用動物昆虫学会誌(応動昆)第16巻第3号:159~161(1972)

カイコ幼虫に対する経口投与：カイコの品種は4眠交雑種である8・3×3・4と春嶺×鐘月を用いた。1～3齢期の飼育と4齢起蚕よりの実験には前報(村越,1972)の人工飼料を用いた。1～3齢期の飼育は27～30°Cで無菌飼育した。各化合物は主として温水に溶解して飼料に混入したが、5-ペンシル KA のみはエタノールに溶解して飼料に混入した後エタノールを除去した。なお、濃度は加水後の人工飼料中に含まれる量で示した。まず、各化合物の1.0%含有飼料を4齢起蚕各区共5頭に連続投与した。この濃度で影響のあった化合物についてはさらに0.2%、0.1%で調べた。2-メチル-3-ヒドロキシ-4-ピリドン〔13〕と2-ヒドロキシメチル-5-ヒドロキシ-4-ピリドン〔14〕は0.1%以下についても検討した。〔14〕は最も活性が高かったため、経口投与量を算出するために近似食下量を調査した。4齢幼虫の飼育は25°Cでシャーレー育とし、飼料は1～3日に1度交換した。

結果と考察

供試化合物1%含有飼料を4齢起蚕より連続投与した結果を第2表に示す。

第2表に示したように成育に対する影響は3つのグループに別れた。第1のグループは4齢飼育中に死亡したものが多かった化合物で、〔2〕,〔3〕,〔6〕,〔7〕,〔8〕,〔11〕,〔12〕,〔13〕,〔14〕の9種が含まれる。第2のグループは3眠蚕出現の多かった化合物で〔1〕,〔4〕,〔5〕の3種が含まれる。このグループは-CH₂OH基をいずれも持っている。第3のグループは影響の見られなかった化合物で側鎖に-COOHおよび-COOC₂H₅を有する〔9〕,〔10〕とピリダジン系化合物〔15〕である。

以上の結果より、さらに、第3のグループを除いた化合物について0.2%含有飼料を春嶺×鐘月の4齢起蚕より各区共5頭に連続投与した。

その結果、〔13〕と〔14〕は4令3日後までに死亡した。〔8〕と〔11〕は成育が非常に劣った。他の化合物、〔1〕,〔2〕,〔3〕,〔4〕,〔5〕,〔6〕,〔7〕,〔12〕は7日後までにすべて5齢になりほとんど影響は見られなかった。〔1〕,〔4〕,〔5〕,〔12〕はいずれ

第2表 カイコ4齢幼虫に対する各化合物の影響*

供試化合物	6日後の成育			4齢飼育中	
	生存数(5齢-4眠-4齢)			死亡数	上蔭数 4齢-5齢
無添加	5頭	(5-0-0)		0頭	0頭 5頭
〔1〕	5	(0-0-5)		2	3 0
〔2〕	0	—		5	—
〔3〕	0	—		5	—
〔4〕	5	(0-1-4)		0	3 2
〔5〕	5	(0-0-5)		0	5 0
〔6〕	0	—		5	—
〔7〕	4	(0-0-4)		5	—
〔8〕	0	—		5	—
〔9〕	5	(5-0-0)		0	0 5
〔10〕	5	(4-1-0)		0	0 5
〔11〕	0	—		5	—
〔12〕	5	(0-0-5)		4	1 0
〔13〕	0	—		5	—
〔14〕	0	—		5	—
〔15〕	5	(2-3-0)		0	0 5

* 供試化合物の飼料中濃度は1.0%。

も3眠蚕の出現が見られなかったため、0.5%含有飼料による影響を調べたところ、〔1〕,〔5〕,〔12〕は若干の3眠蚕が出現したが〔4〕は出現しなかった。さらに〔13〕と〔14〕は0.1%でテストしたところ、4齢3日後までに全て死亡した。この2つの化合物についてはより低濃度においての影響を検討した。すなわち、春嶺×鐘月の4齢起蚕1区10頭に両化合物の100, 200, 400, 800 ppmを連続投与した。その結果を第3表に示す。

表より明らかなように〔13〕は400 ppm以上、〔14〕は200 ppm以上ですべて死亡した。〔13〕の100 ppmはほとんど影響が見られなかったが、200 ppmでは最終的に3頭の3眠蚕が出現した。化合物〔14〕については100 ppmで3眠蚕の出現を起こすことがわかったが(10頭中2頭の3眠蚕が出現した)、200 ppmでは死亡してしまったので、4齢3日後まで200 ppmを投与し、以後は無添加飼料を与えて、前報(村越,1972)のKAの場合と同様に3眠蚕が出現するかどうか調べたところ、

第3表 2-メチル-3-ヒドロキシ-4-ピリドンと2-ヒドロキシメチル-5-ヒドロキシ-4-ピリドンの経口投与によるカイコ4齢幼虫に対する影響

供試化合物	濃度 (ppm)	平均生体重* (mg)								累積死亡率 (%)					
		0日	1	2	3	4	5	6	7	2日	3	4	5	6	7
無添加	—	145	251	410	600	715	798	958	1,431	0	0	0	0	0	0
〔13〕	100	128	222	346	472	693	793	826	995	0	0	0	0	0	0
	200	130	216	303	386	496	607	703	804	0	0	0	0	0	0
	400	132	189	235	264	288	311	—	—	0	0	0	70	100	—
	800	136	187	199	206	—	—	—	—	0	70	100	—	—	—
〔14〕	100	127	215	301	378	470	557	639	703	0	0	0	0	0	0
	200	130	216	253	272	289	300	—	—	0	0	30	80	100	—
	400	131	198	239	257	266	—	—	—	0	10	40	100	—	—
	800	141	199	205	—	—	—	—	—	0	100	—	—	—	—

* 生体重は生存蚕の平均で示した。

第4表 2-ヒドロキシメチル-5-ヒドロキシ-4-ピリドン〔14〕の経口投与量と3眠蚕出現との関係*

飼料中 濃 度	起 蚕 平 均 生 体 重	3 日 後 平 均 生 体 重	3 眠 蚕 出 現 数	4 齢 0 ~ 3 日 後 に お け る (1 頭 当 り 平 均)			
				給 餌 量 生 物 - 乾 物	食 下 量 生 物 - 乾 物	食 下 率	〔14〕の 食 下 量
0 ppm	164 mg	678 mg	0 頭	1,400 mg-368 mg	1,229 mg-323 mg	87.8%	0 μ g
100	162	650	1	1,400 -368	1,124 -296	80.3	112.4
200	161	576	9	1,400 -368	911 -240	65.1	182.3

* 春嶺×鐘月の4齢起蚕1区10頭, 25°C, シャーレー育.

〔14〕の100ppmと200ppm含有飼料は4齢起蚕より3日後まで与え, それ以後は無添加飼料を与えた.

10頭中8頭が3眠蚕となって, 同じく4齢の前半期投与により3眠蚕が出現した.

よって, 〔14〕の経口投与量と3眠蚕出現との関係を調べるために, 春嶺×鐘月の4齢起蚕10頭に100ppmと200ppmを3日間連続投与し, 近似食下量より経口投与量を算出した. その結果を第4表に示す.

〔14〕の100ppmでは1頭, 200ppmでは9頭の3眠蚕が出現した. さらに, 食下率より換算した1頭当り〔14〕の食下量(経口投与量)は100ppmの場合が112.4 μ g, 200ppmの場合が182.3 μ gとなり3眠蚕の出現は経口投与量と正の相関を示した. 別にKAの経口投与量と3眠蚕の出現との関係を調べたところ, KA1%含有飼料を4齢3日後まで与えた場合に3眠蚕の出現は10頭中3頭で1頭当りKAは6.4mg, KA1%含有飼料を4齢中与えた場合に3眠蚕の出現は10頭中8頭で1頭当りKAは22.6mg食下された. したがって, ほとんどの4齢蚕を3眠蚕化するに要する1頭当り経口投与量をKA20mg, 〔14〕200 μ gとすると〔14〕の2-ヒドロキシメチル-5-ヒドロキシ-4-ピリドンはKAの100倍の活性を示したことになる.

KAと〔14〕の構造的相違はKAが4-ピロン骨格であるのに対して〔14〕が4-ピリドン骨格であることで, このような化学構造の相違は〔2〕と〔13〕, 〔4〕と〔12〕においてもあてはまる. したがって, 基本骨格および置換基の相違とカイコ幼虫成育に

対する影響との間には興味ある関係が見られた.

3眠蚕がいかなる生理機構により出現するのかが物質代謝レベルでは明白にされていない. しかしながら, 実験形態学的には4齢の2/3経過時までにアラタ体を摘出することによって, 3眠蚕が出現することは良く知られている(金, 1939). このことから, KAおよび2-ヒドロキシメチル-5-ヒドロキシ-4-ピリドン等の化学物質を4齢前半期に一定量以上経口投与した場合にアラタ体摘出と結果的には同様な現象が現われ3眠蚕化するのかも知れない. さらに, これらの化学物質がいかなる作用機構で3眠蚕の出現に関与しているかは今後の検討に待たれる問題である.

引用文献

- ICHIMOTO, I., K. FUJII and C. TATSUMI (1965) *Agr. biol. Chem.* **29**: 325~330.
 ICHIMOTO, I., K. FUJII and C. TATSUMI (1967) *Agr. biol. Chem.* **31**: 979~989.
 ICHIMOTO, I., Y. KITAOKA and C. TATSUMI (1966) *Tetrahedron* **22**: 841~846.
 樺本五男 (1970) 大阪府立大学紀要 農学・生物学 **22**: 209.
 金 順鳳 (1939) 日蚕雑 **10**: 86~97.
 村越重雄 (1972) 応動昆 **16**: 111~113.

ブニョール教授講演会のご案内

仏国ボルドー大学の J. J. BOUNIOL 教授は, 日仏農学会の招聘により, 仏国政府文化使節として9月27日來日されることになりました。

教授が動物学者として, また昆虫内分泌学研究の先駆者として令名の高いことは, ここにご紹介するまでもありますまい。教授は約1か月日本に滞在し, 各地で講演を行なうことになっていますが, 東京では日仏農学会, 日本応用動物昆虫学会, 日本蚕糸学会などの共催で次のような講演会が開かれます。会員諸氏の多数ご参加をお待ちしております。

日 時: 10月16日(月)午後6時半

場 所: 日仏会館講堂(神田駿河台)

演 題: 脊椎動物の生物学(通訳つき)