

殺虫剤

- 虫への侵入経路
 - » 接触 (contact) :
 - 直接散布・皮膚透過
 - » 食毒 (stomach)
 - 散布された茎葉を摂食して作用
 - » 浸透性 (systemic)
 - 根茎葉から吸収され植物体内に移行し食毒
 - » 燻蒸 (fumigant)
 - ガス, 気門

殺虫剤のターゲット

- 神経伝達機構の阻害
- 成長制御
- (呼吸阻害)

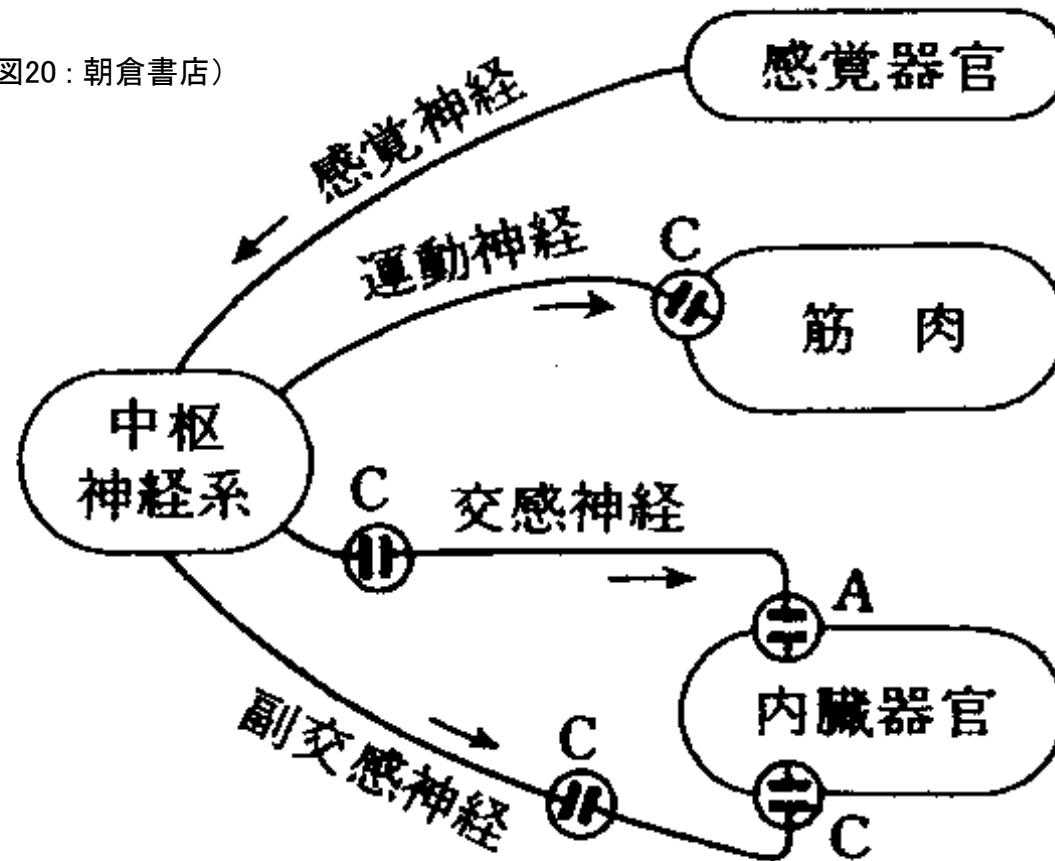
神経に作用する殺虫剤

- シナプス伝達の攪乱
 - » アセチルコリンエステラーゼ阻害剤
 - » アセチルコリン受容体に作用
 - » 抑制性（GABA作用性）シナプスに作用
- 軸索伝導の攪乱

神経系

(出所：新農業学概論 p63, 図20：朝倉書店)

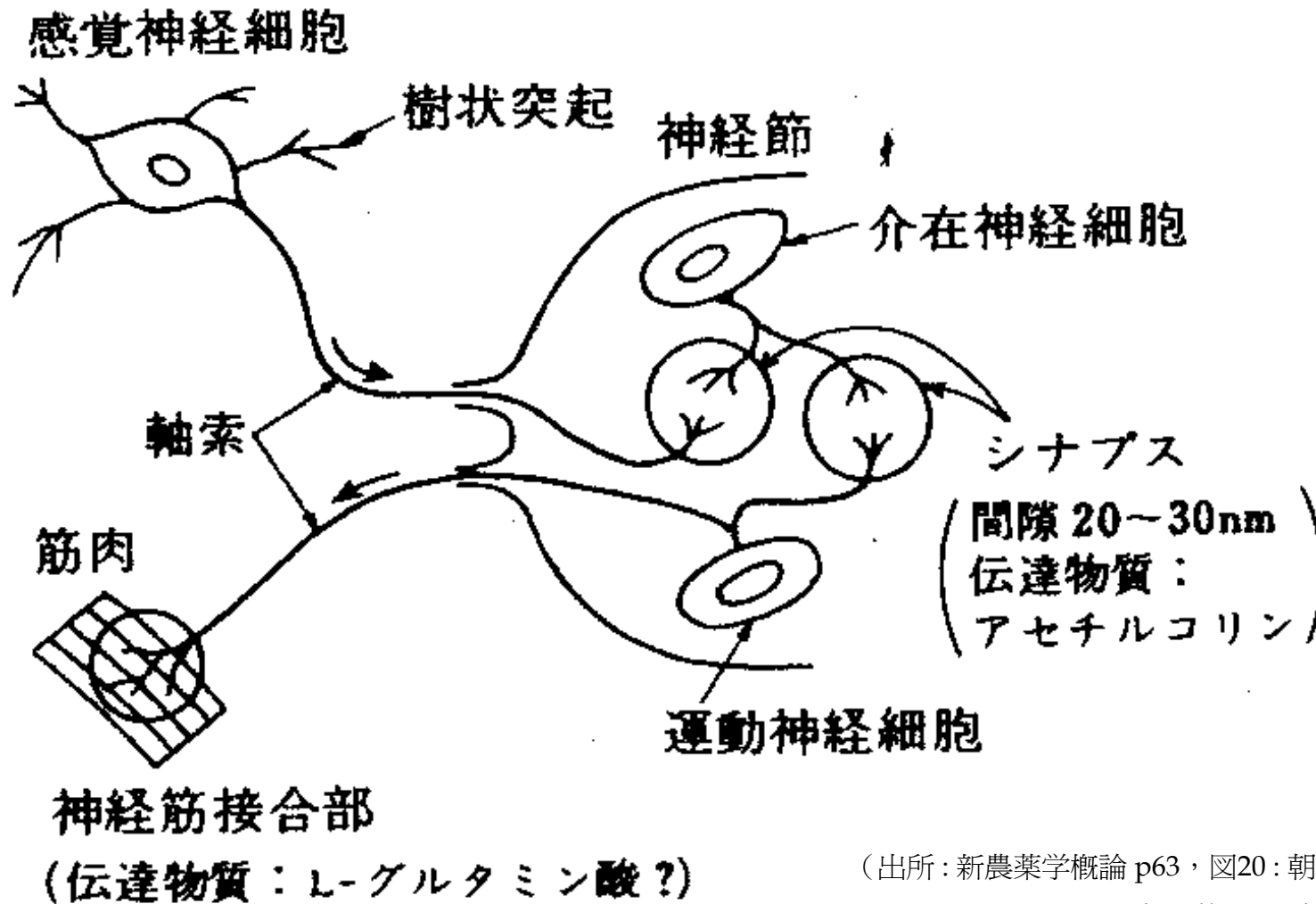
<http://www.asakura.co.jp>



C：コリン作動性シナプス

A：アドレナリン作動性シナプス

神経系

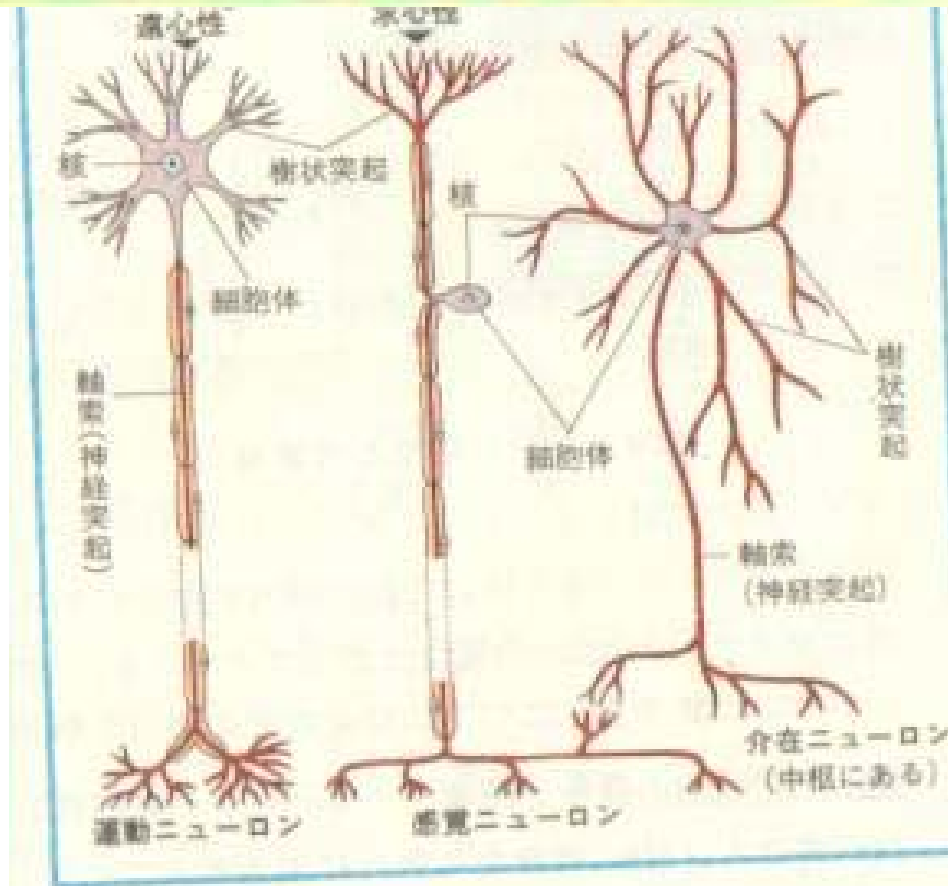
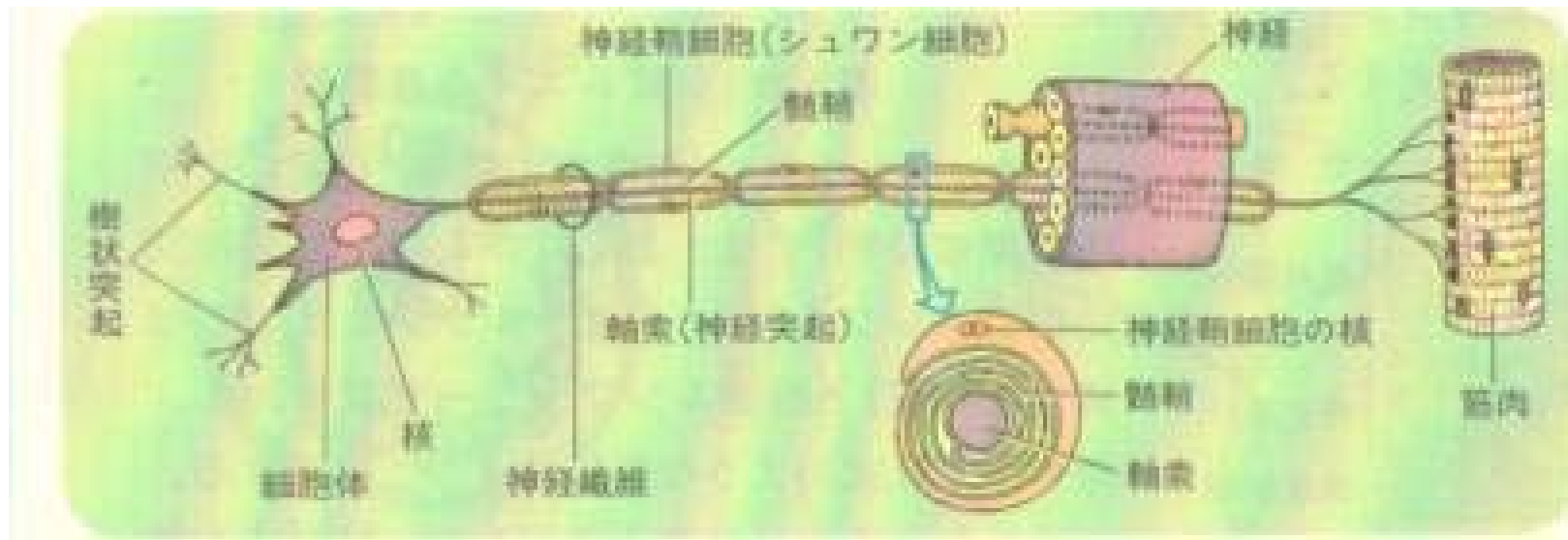


(出所:新農業学概論 p63, 図20:朝倉書店)

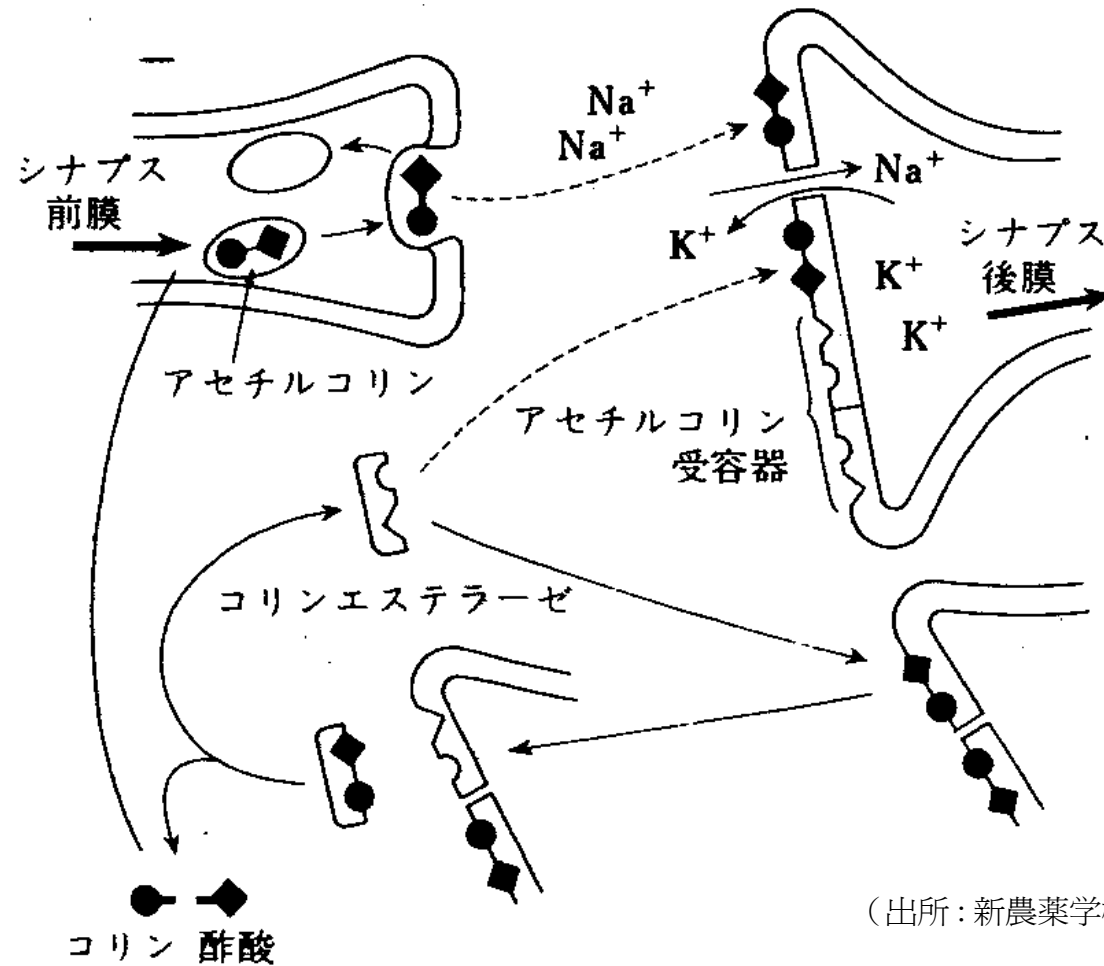
<http://www.asakura.co.jp>

神経の刺激伝達

- 軸索伝導
 - » 神経細胞内
 - » 電気刺激
- シナプス伝達
 - » 神経細胞間
 - » 間隙を化学物質で伝達
 - » 次の神経細胞に電気刺激を引き起こす



シナプス伝達



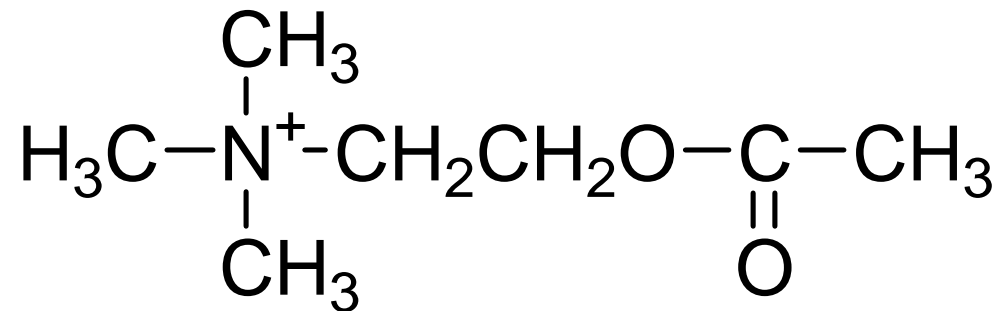
(出所:新農薬学概論 p64, 図22:朝倉書店)

<http://www.asakura.co.jp>

図 22 神経シナプスにおける伝達模式図

神経伝達物質

- 末端の小胞に蓄えられている
- アセチルコリン, ノルアドレナリン
 - » 昆虫の中樞はコリン作動性

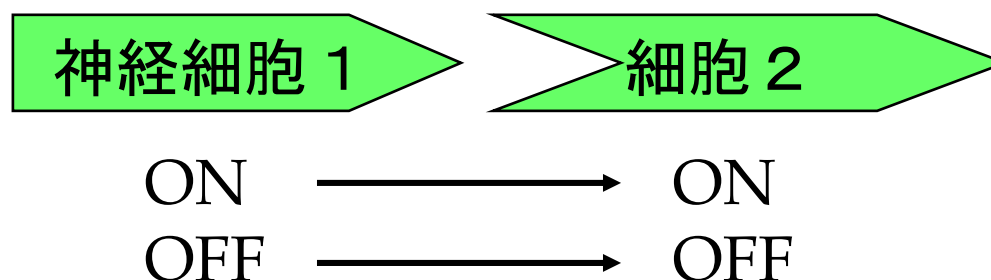


アセチルコリン

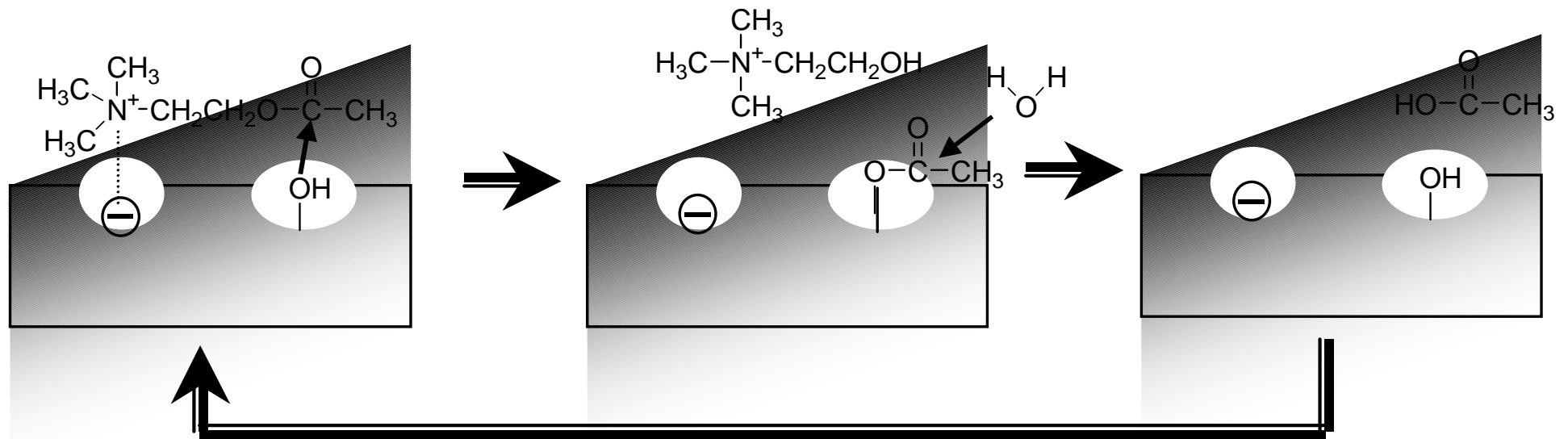
アセチルコリンエステラーゼ

- アセチルコリンの加水分解を触媒する酵素
- 前の細胞の興奮が収まると速やかに伝達物質を分解し，後の細胞の興奮を収める。

刺激伝達

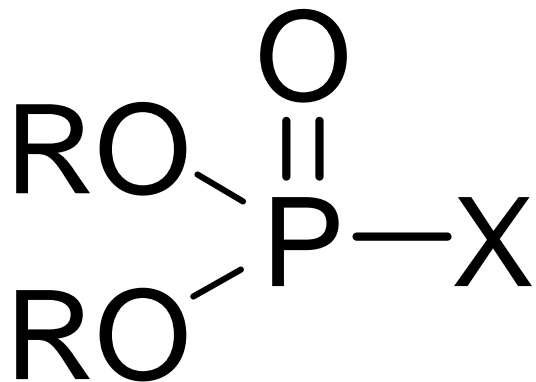


アセチルコリンの加水分解

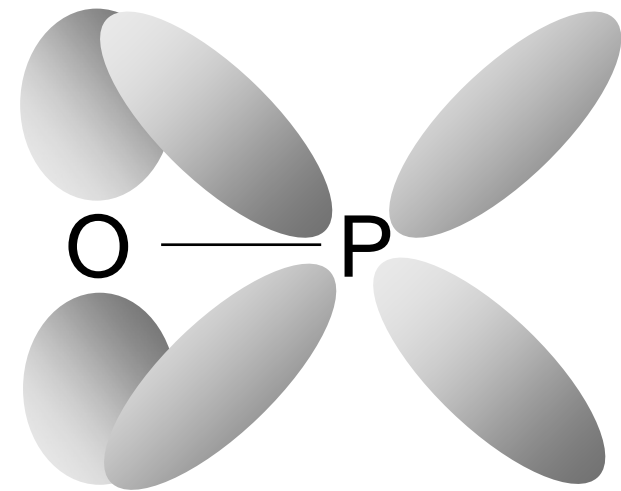


有機りん殺虫剤

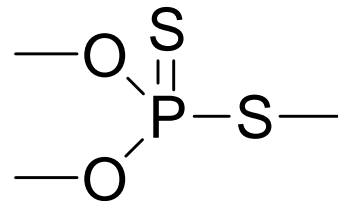
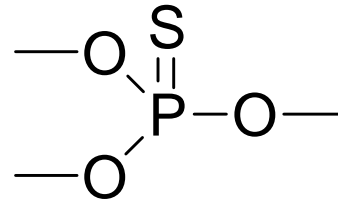
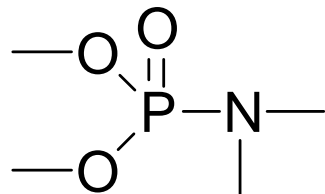
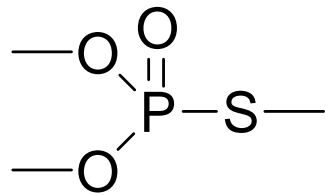
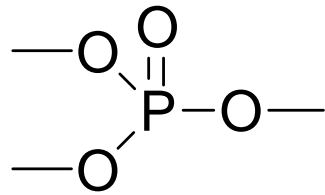
- りん原子
 » Naの列, Nの下
- 基本形



R: アルキル基
X: アルコール (アミン)



有機りん剤の構造バリエーション



etc

P=OとP=S

- 毒性が低い
- より安定
 - 使いやすい
- 低極性
 - 透過性が高い

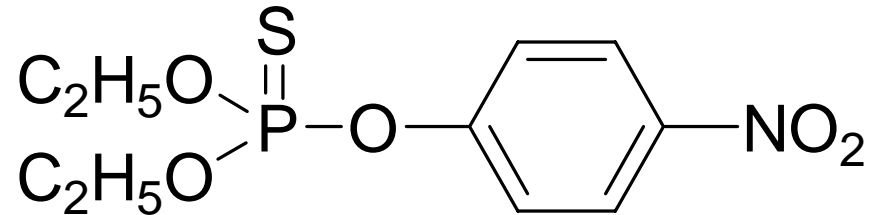
有機りん剤の歴史

- 1932年ドイツ化学会誌
 - » 「ジアルキルリン酸フルオリドに強い人体への毒性がある」
- Schrader（ドイツ）
 - » 殺虫作用を見いだす。合成展開。
 - » TEPP
 - » パラチオン（1944）；戦後に普及。日本ではニカメイチュウの防除に多く使われる。
- 以後多数の化合物が試験され実用化

初期の有機りん剤

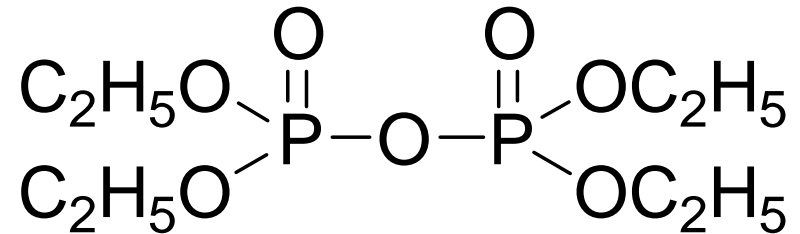
- パラチオン

» マウス 6 mg/kg



- TEPP

» マウス 1.9 mg/kg



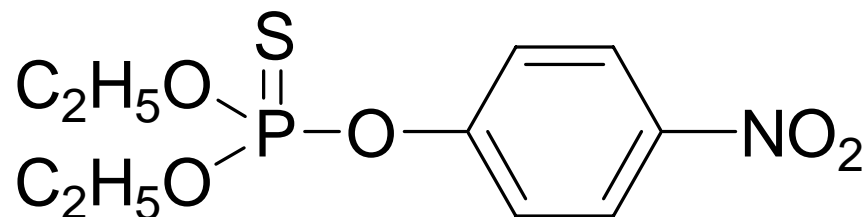
猛毒！

代表的な有機りん殺虫剤

- パラチオン

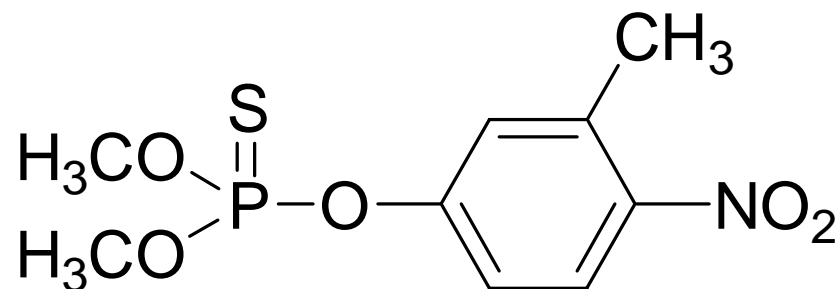
- » マウス 6 mg/kg

- » **使用禁止**



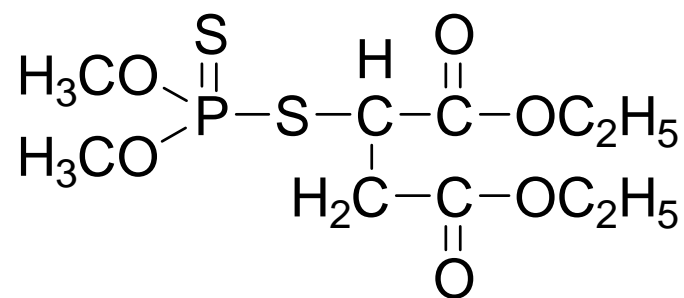
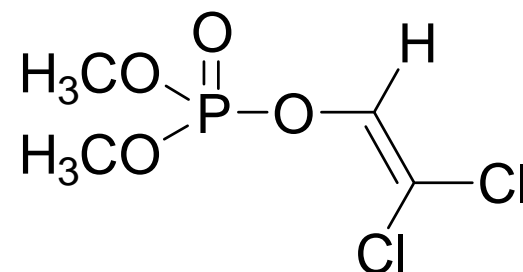
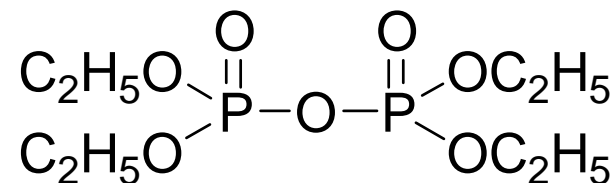
- フェニトロチオン

- » マウス 1336 mg/kg



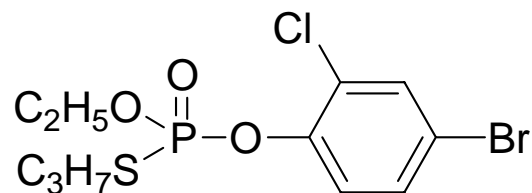
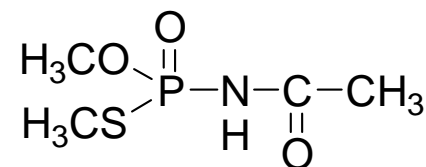
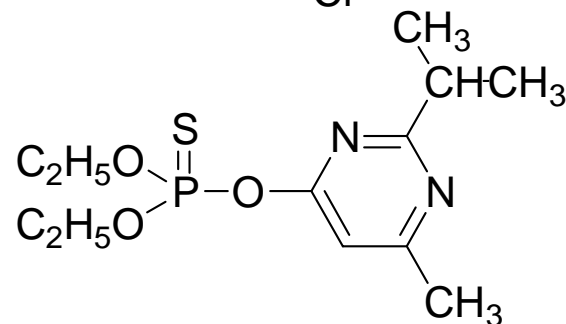
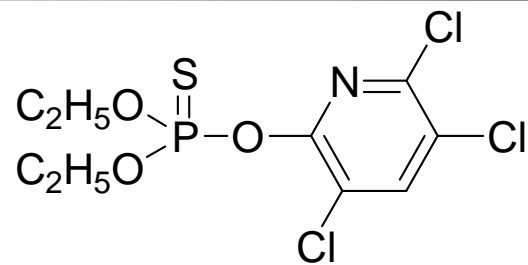
代表的な有機りん殺虫剤

- TEPP
 - » マウス 1.9 mg/kg
 - » **使用禁止**
- dichlorvos (DDVP)
 - » マウス 124 mg/kg
- マラチオン
 - » マウス 720 mg/kg



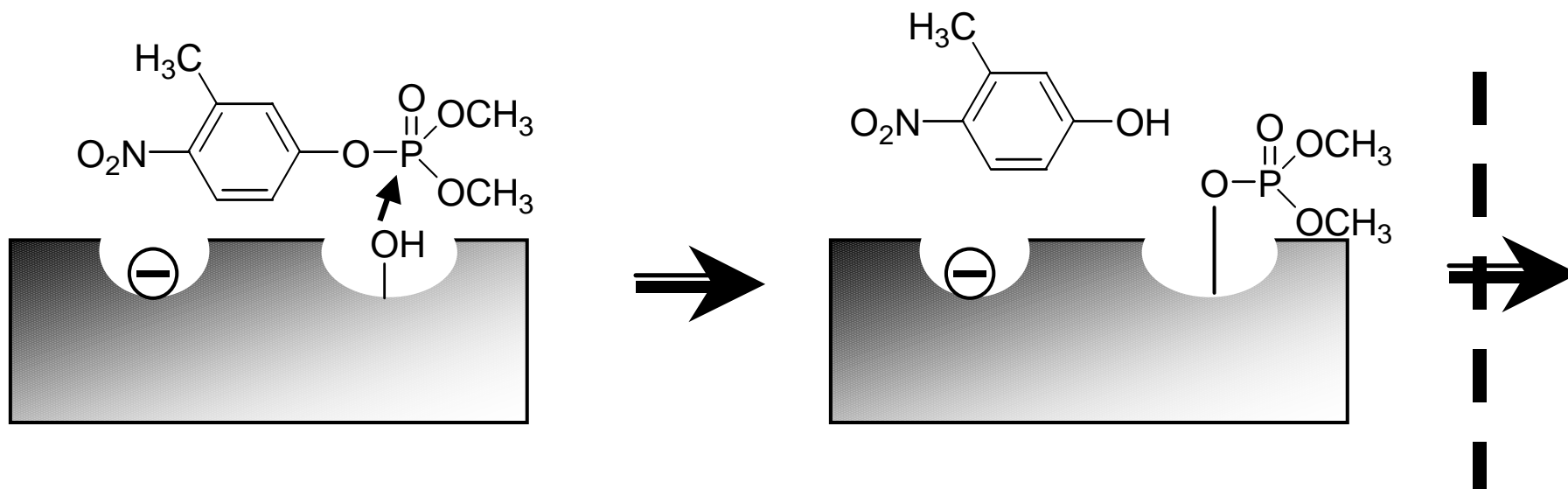
代表的な有機りん殺虫剤

- クロルピリフォス
» マウス 102 mg/kg
- ダイアジノン
» ラット 250 mg/kg
- アセフェート
» マウス 361 mg/kg
- プロフェノホス
» マウス 315 mg/kg



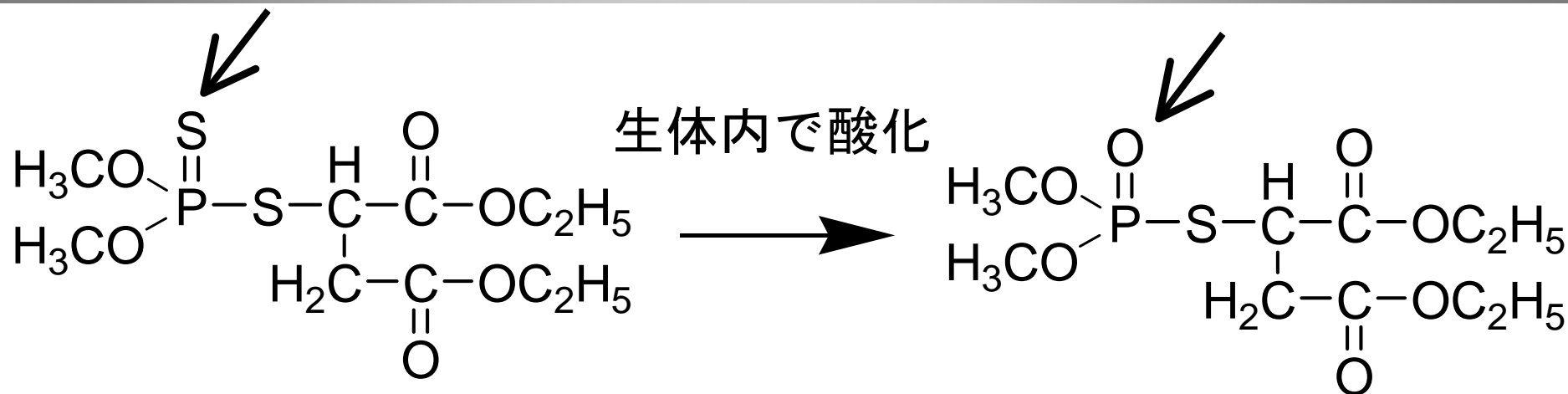
作用機構

- アセチルコリンエステラーゼの阻害



酵素の不活性化

P=S結合の酸化による活性化



マラチオン（不活性）
（酵素を阻害しない）

P=O型が活性

	酸化前	酸化後
AChE阻害濃度(M)	2.9×10^{-3}	7.0×10^{-7}
LD ₅₀ ラット (mg/kg)	2600	308

有機りん殺虫剤

- 接触剤，浸透性殺虫剤，燻蒸剤（一部）
- 幅広いスペクトル
- 即効性
- 毒性？
 - » 選択性改善

選択性

- 急性毒性の指標
 - » 半数致死量 (LD_{50}) : mg/kg
- 神経作用：動物に共通
 - » 虫にも人にも作用？
 - » 実際には選択性が実現

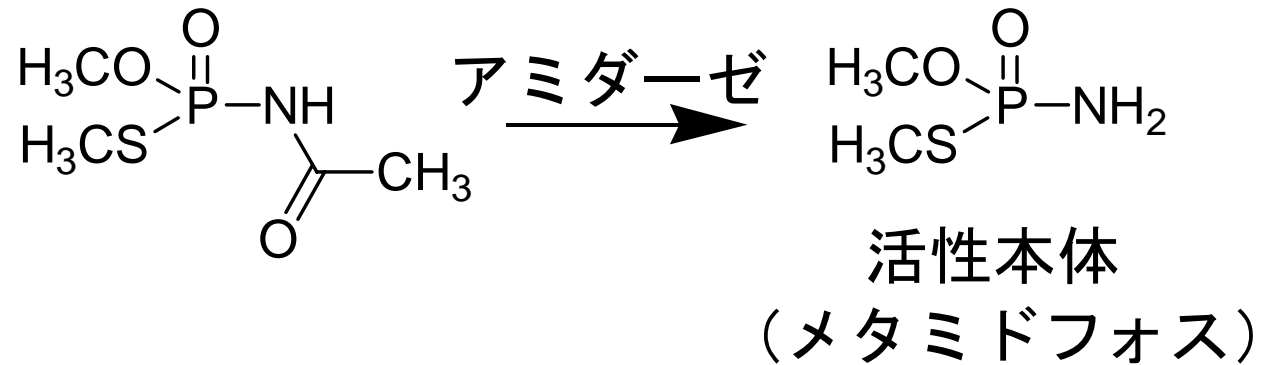
選択性をもたらす因子

- 酵素（作用点）の構造の違い
- 代謝能力の違い

代謝能力の違いと選択性

- 生体内で活性化
 - » そのものに効力はない
 - » 活性化能力に種差
 - » 例) アセフェート
- 代謝経路の種差
 - » 哺乳動物では分解
 - » 例) マラチオン

アセフェート



LD50(mg/kg)

マウス経口	360	27
イエバエ	1.8	1.3
選択係数	200	21

環境中での挙動

- アルカリ条件で加水分解
- 環境中でも分解しやすい
- 残留性少ない