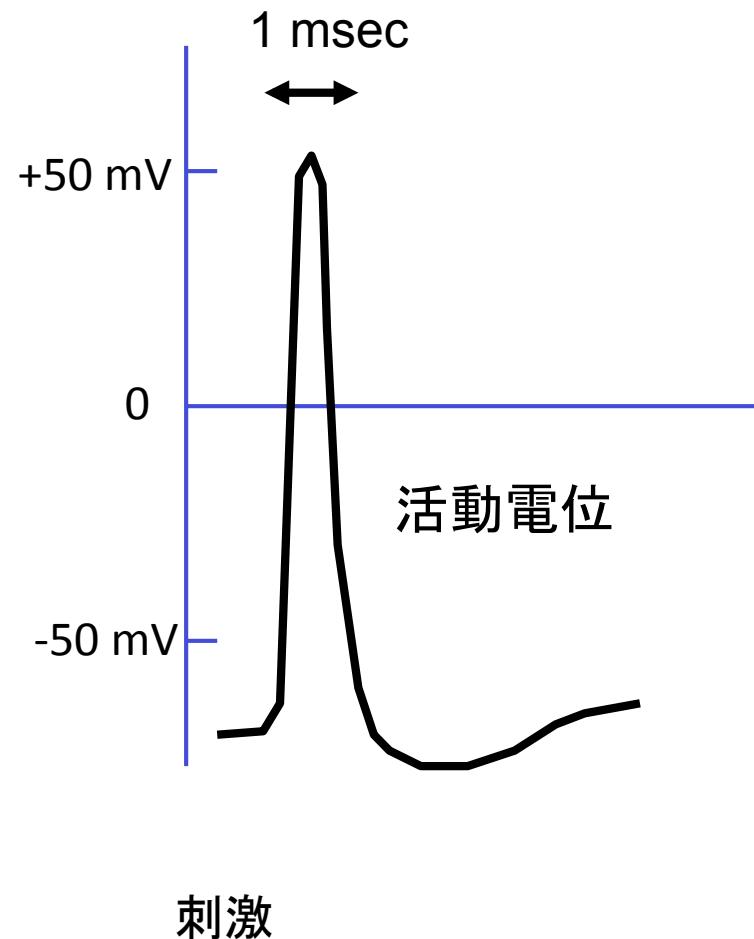


神経細胞膜の電位

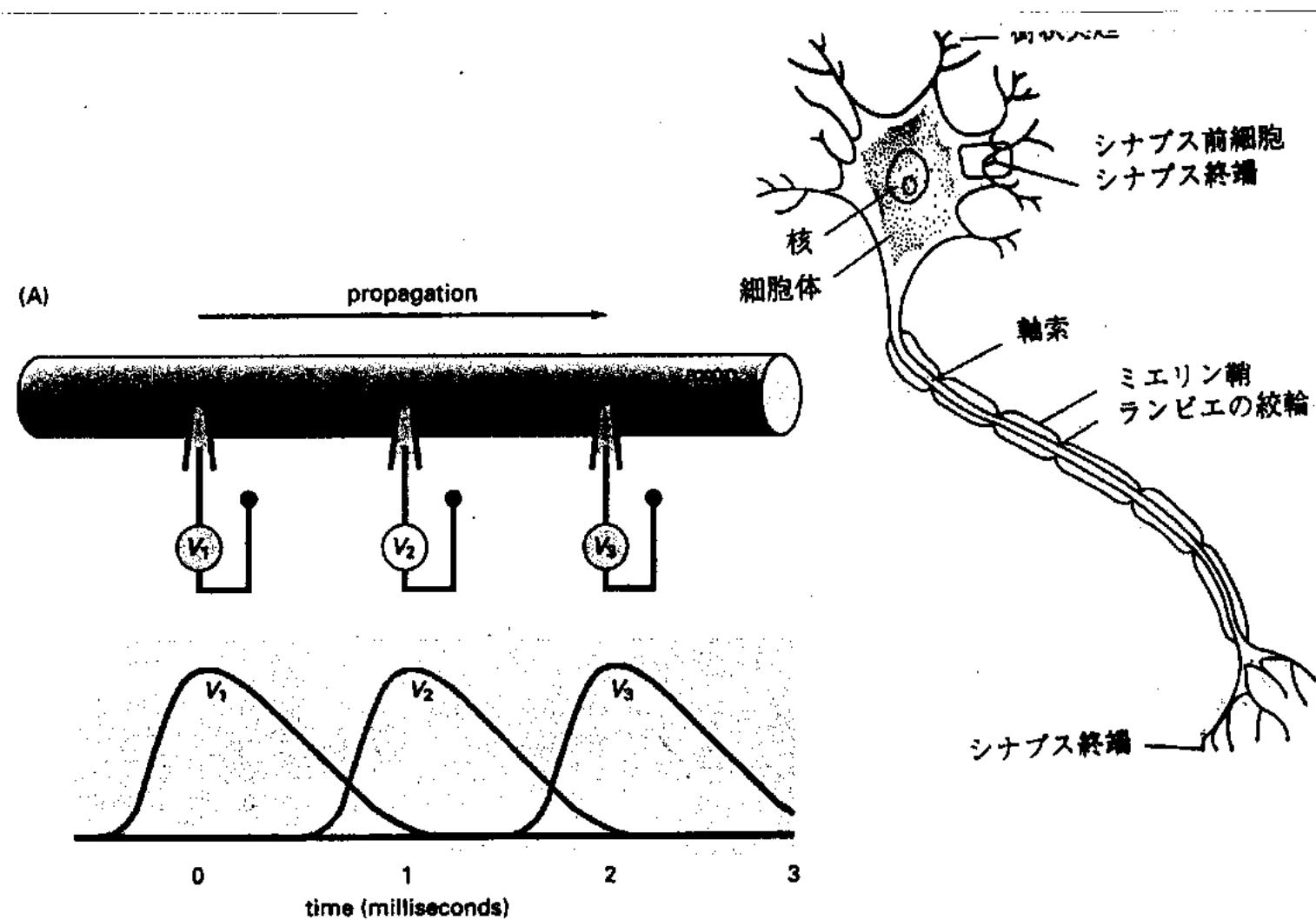
- ◆ 静止電位
- ◆ 細胞内外のイオン濃度のちがい

神経の刺激伝導

◆ 神経細胞膜電位の変化

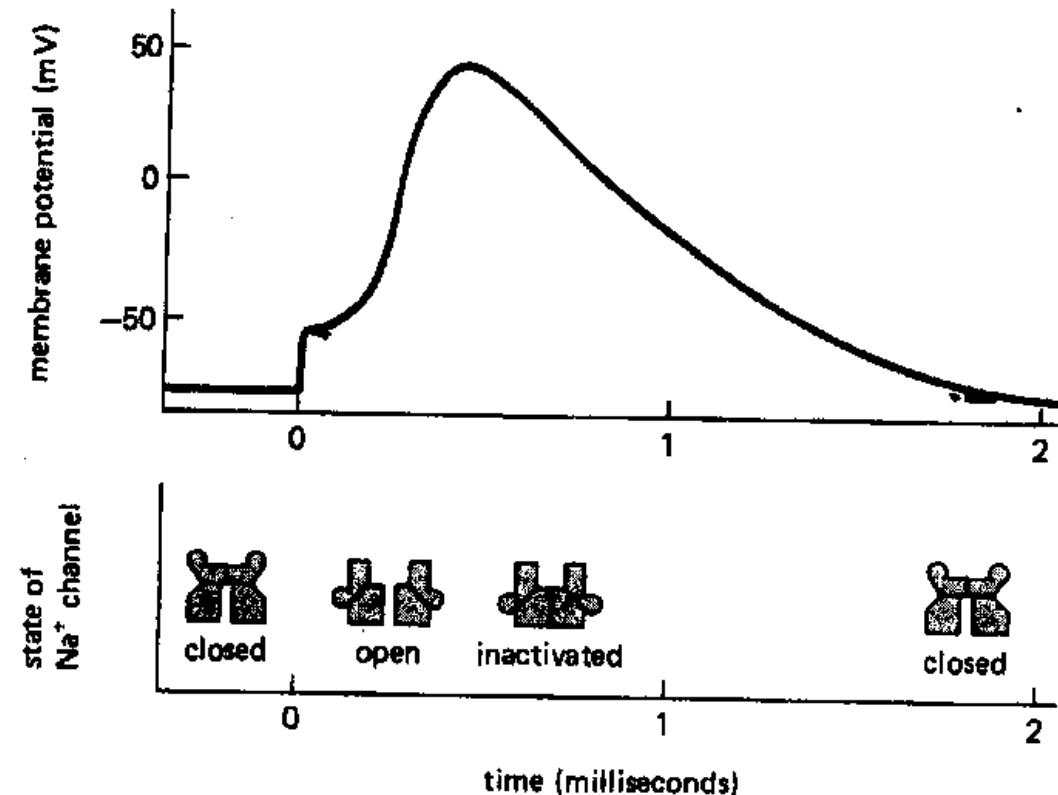


神経の刺激伝導

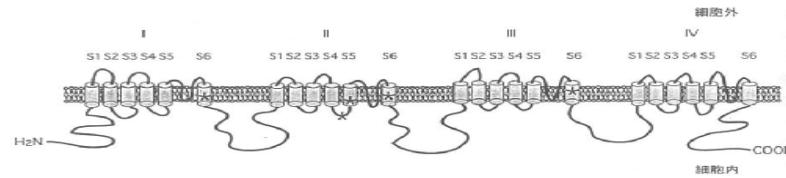


神経の興奮

- ◆ 活動電位の発生
 - ナトリウムチャンネルが開く
- ◆ 静止電位の回復



ナトリウムチャネル



「農薬の科学」46ページ

ナトリウムチャネルに作用する殺虫性化合物

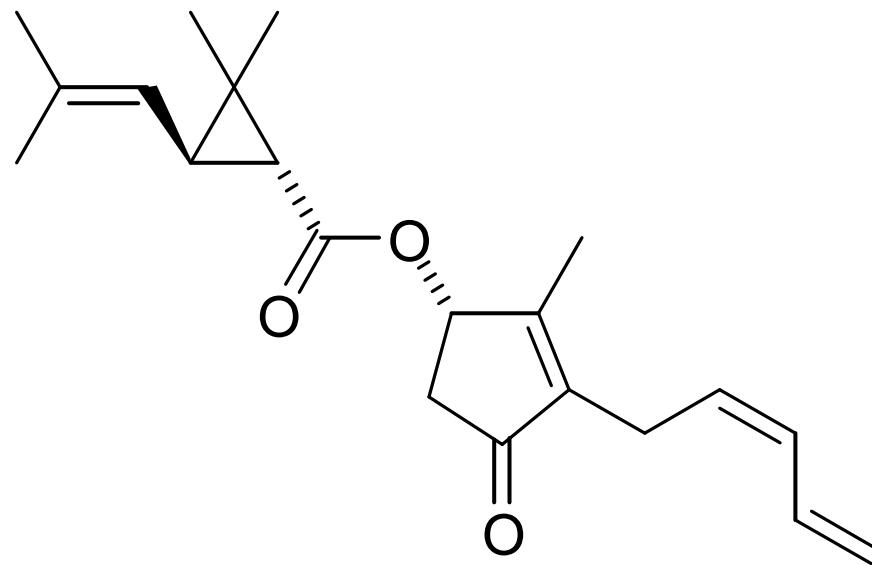
- ◆ ピレスロイド
 - ピレトリン
 - 合成ピレスロイド
- ◆ DDT
- ◆ オキサジアジン

除虫菊(シロバナムショケギク)

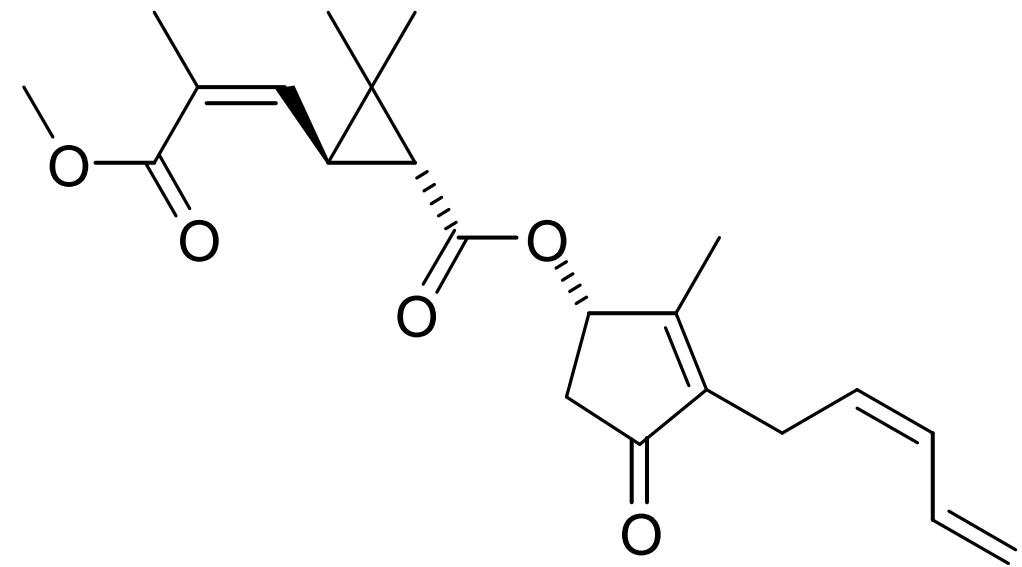


http://upload.wikimedia.org/wikipedia/commons/thumb/9/9e/Tanacetum_cinerariifolium1.jpg/250px-Tanacetum_cinerariifolium1.jpg

殺虫活性成分の構造研究



ピレトリンI



ピレトリンII

「ピレスロイド」の作用

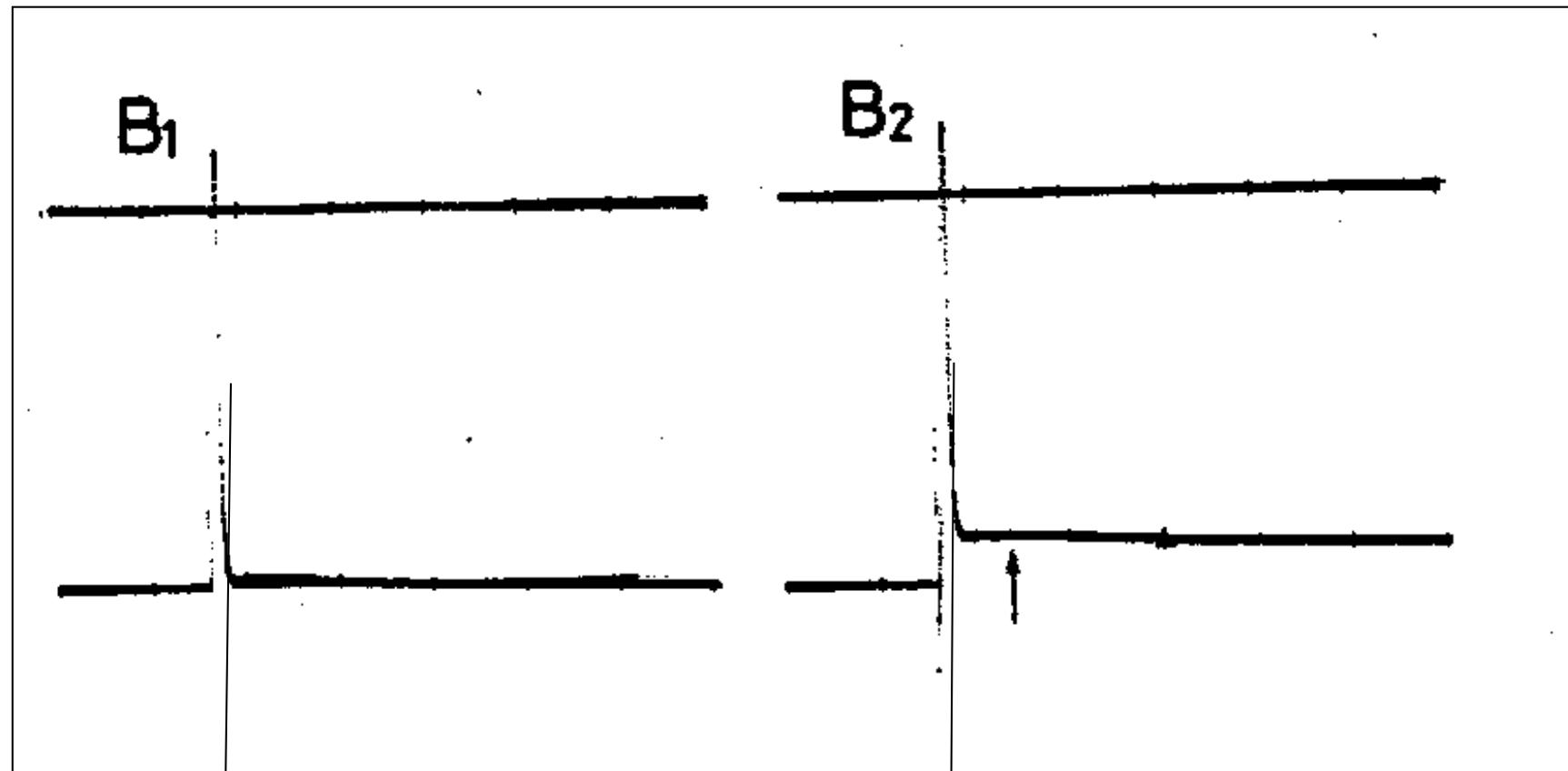
- ◆ 神経に作用

- 神経細胞内の刺激伝導を阻害

- ◆ ナトリウムチャネルに作用

- 軸索伝導の攪乱

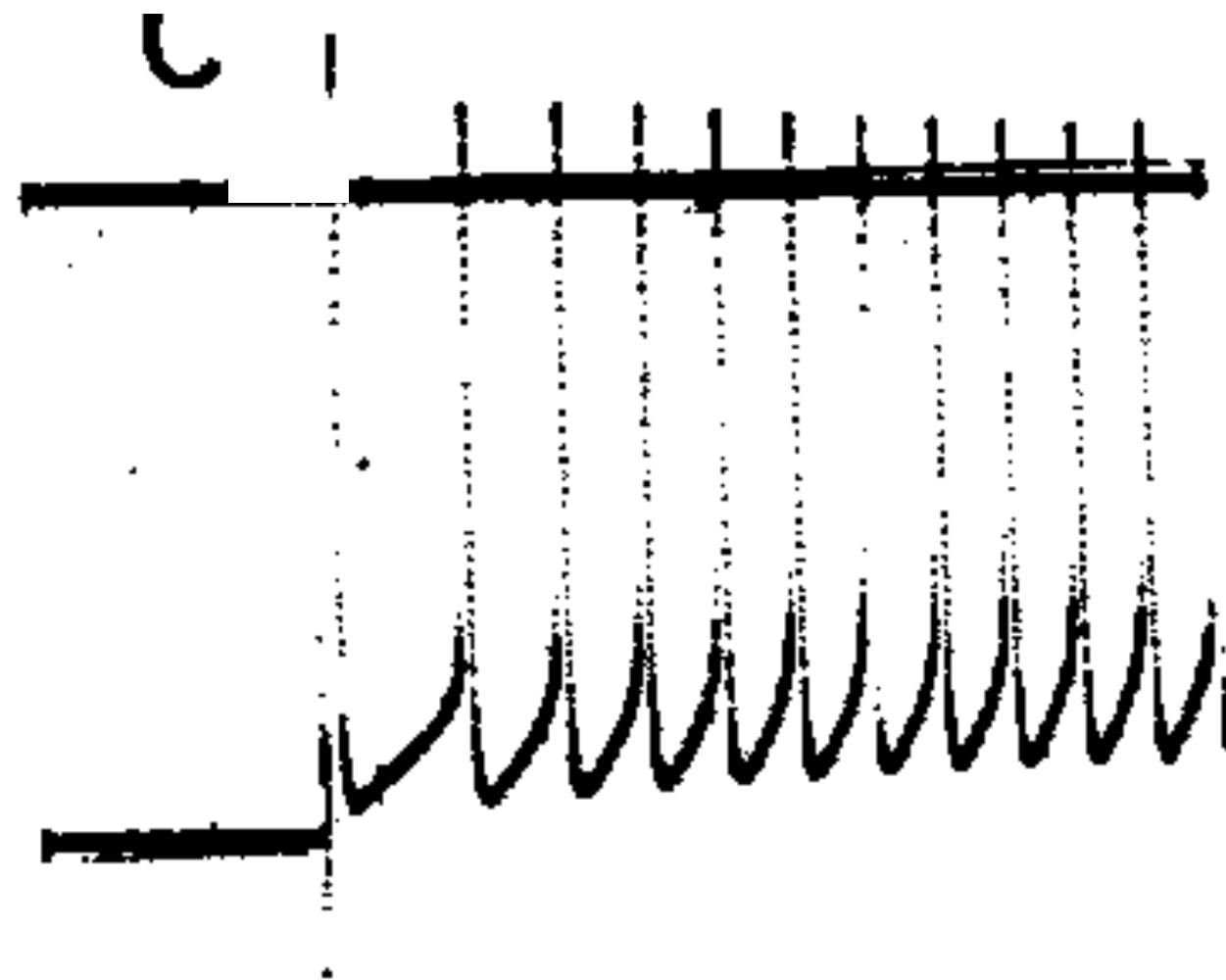
ピレスロイドの神経に対する作用



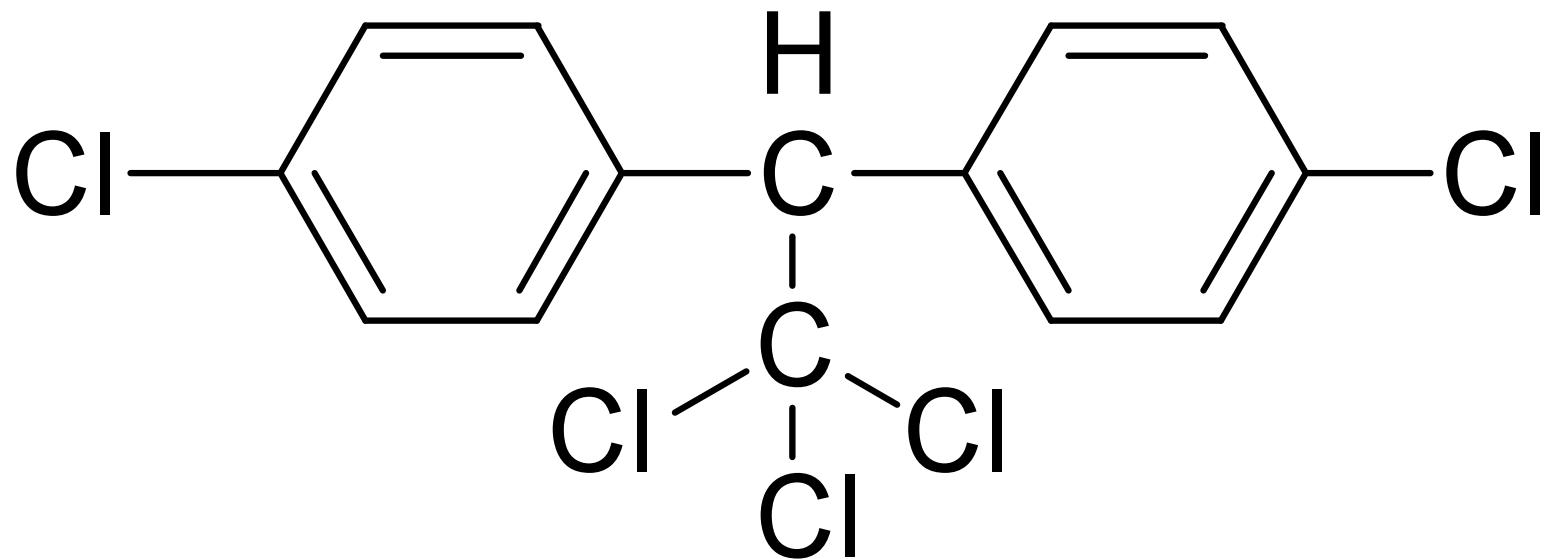
処理前

処理後

神経に対するピレスロイドの作用



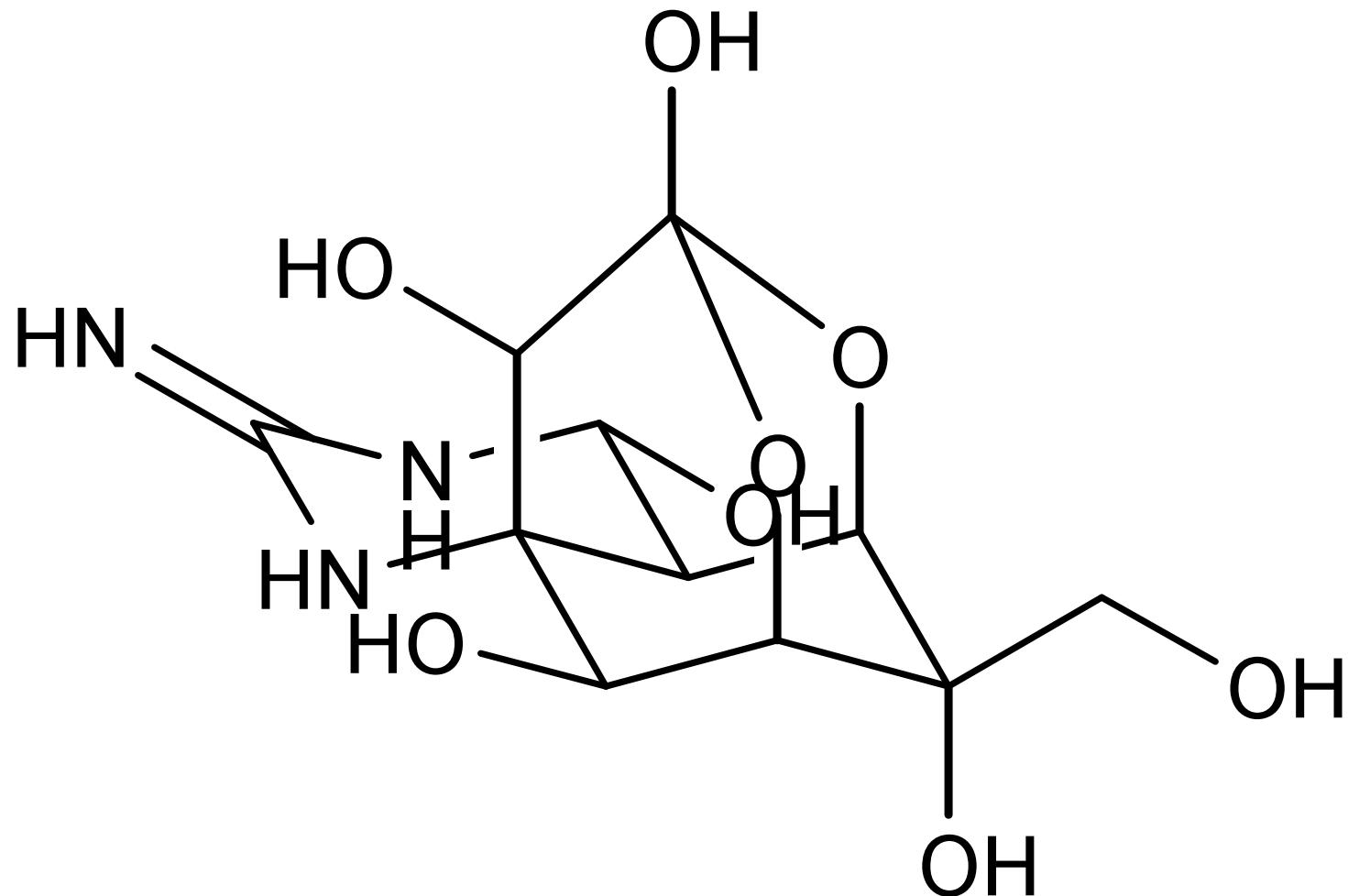
DDT



1874年に合成。1939年殺虫活性発見(スイス、ミュラー)。
農業用殺虫剤としてのほか衛生害虫の駆除に威力を発揮(マラリア(力)と発疹チフス(シラミ))

神経に反復興奮を引き起こす→ナトリウムチャンネルに作用
人畜には比較的低毒性(ラット経口LD50 113-118 mg/kg)
環境中での残留性が問題になり使用中止(土壤中での半減期:2.8年)

フグ毒テトロドキシン



ナトリウムチャンネルに作用(チャンネル不活性化)
猛毒(マウスのLD50 9マイクログラム/kg !)

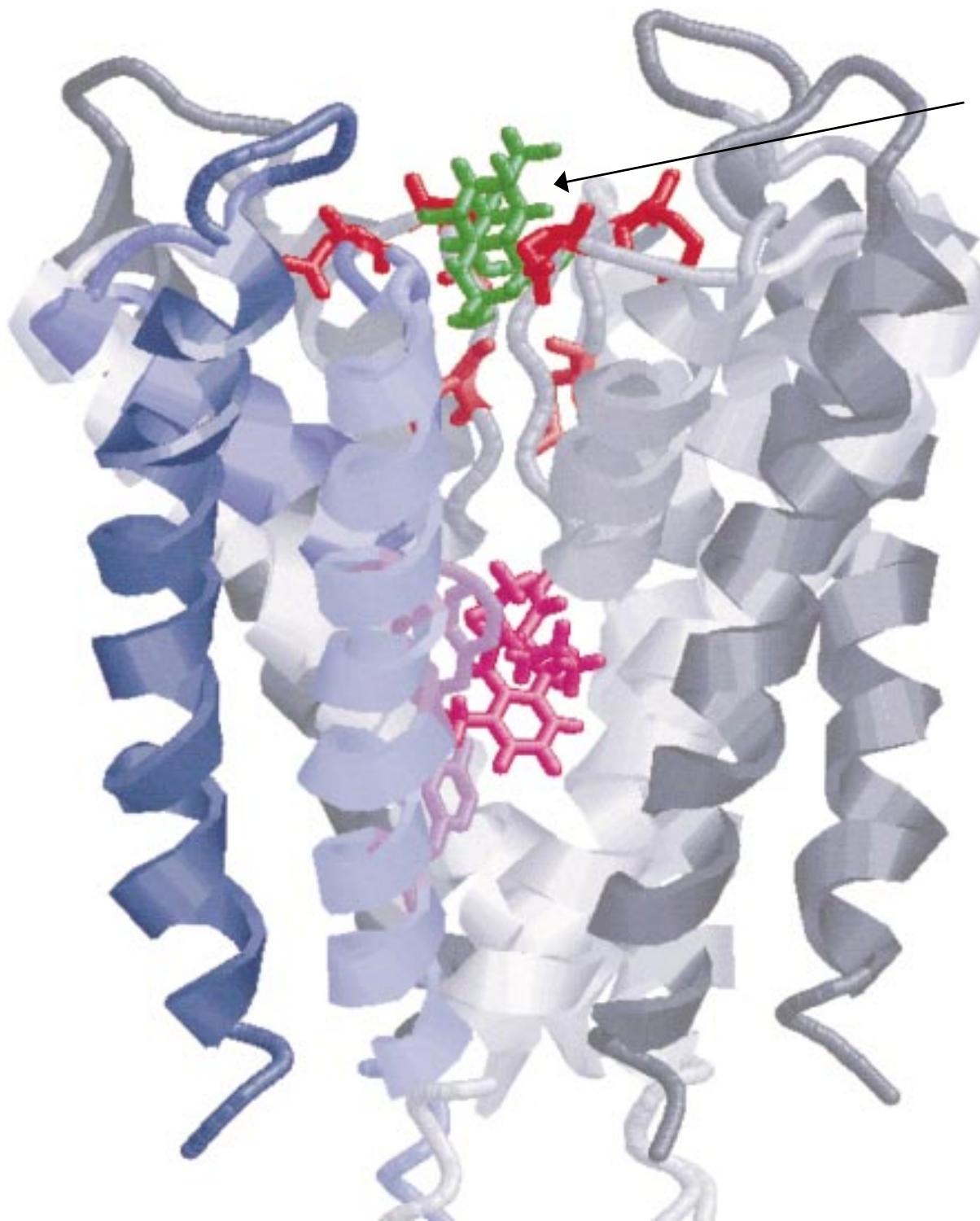
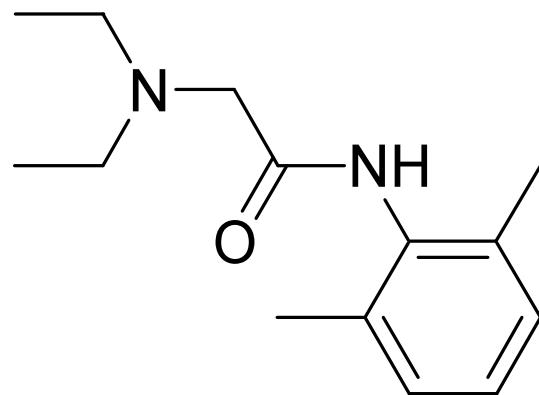


Figure 2. A Model of the Pore of the Sodium Channel

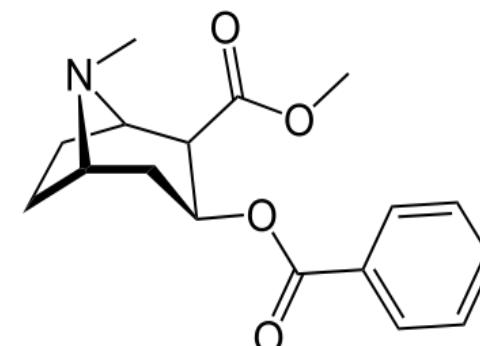
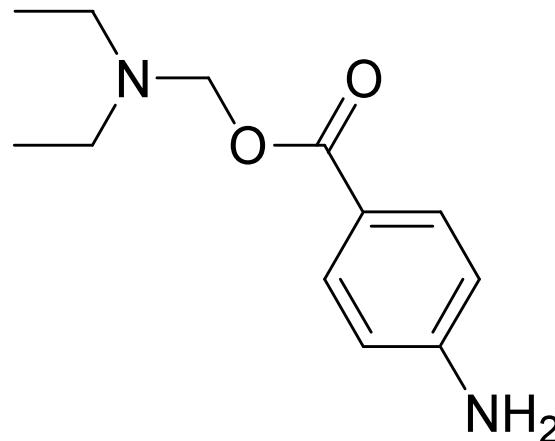
The α -helical fold of the KcsA potassium channel (Doyle et al., 1998) is used as a model for the sodium channel pore. Domain IV of the sodium channel is in blue while others are in gray. M2 segments (equivalent to S6) are in light gray or light blue. M1 segments (equivalent to S5) are in darker gray or blue. The amino acid residues of the selectivity filter in the outer pore are superimposed on the potassium channel structure: outer ring of acidic residues (EEDD) inner ring of DEKA residues in red. Tetrodotoxin (green) is shown approaching the outer mouth of the pore. Phe-1764 and Tyr-1771, which form part of the local anesthetic receptor site, are illustrated in dark blue in transmembrane segment IVS6, and etidocaine illustrated in purple is shown approaching the local anesthetic receptor site in the cavity in the inner pore.

局所麻酔剤

◆ リドカイン



◆ プロカイン



コカイン

ピレスロイドの特徴

- ◆ 速効性

- ◆ 無臭

- ◆ 忌避効果

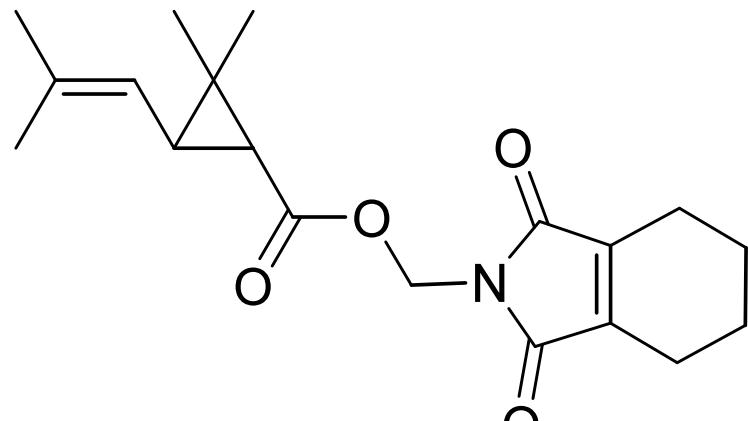
- ◆ 人畜に対し低毒性

- ◆ 化学的に不安定

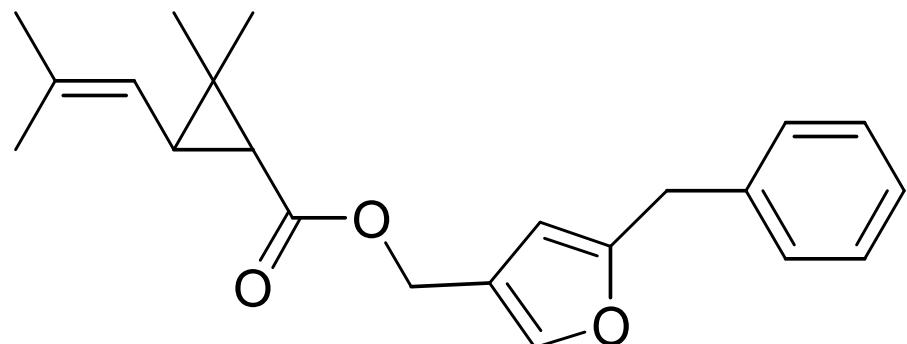
} 家庭用殺虫剤への応用

→ 合成ピレスロイド

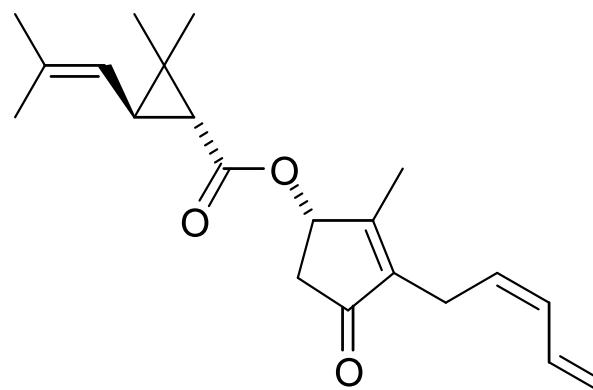
「キンチョール」の有効成分



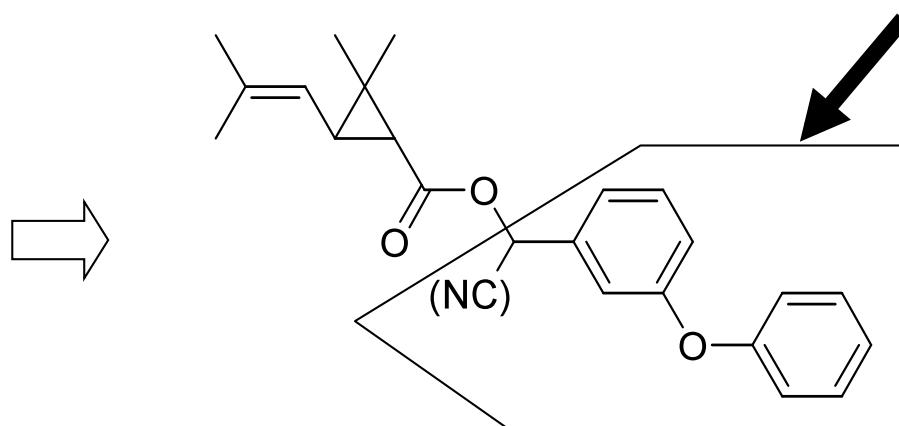
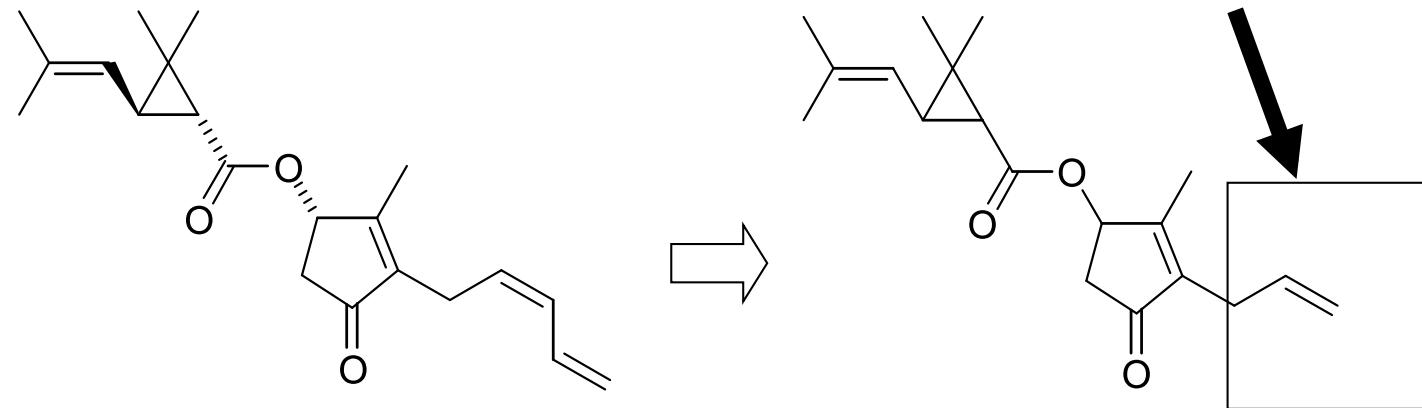
フタルスリン



レスメスリン

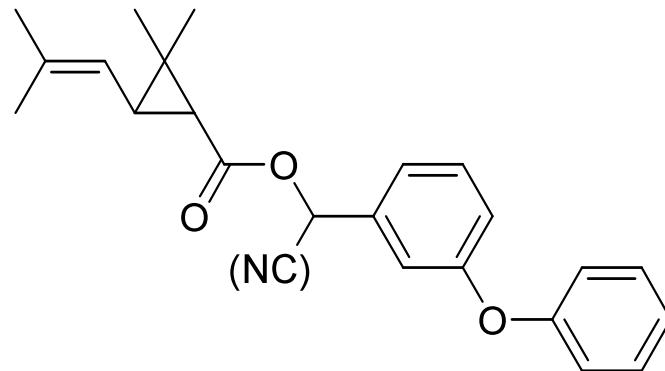


合成ピレスロイド

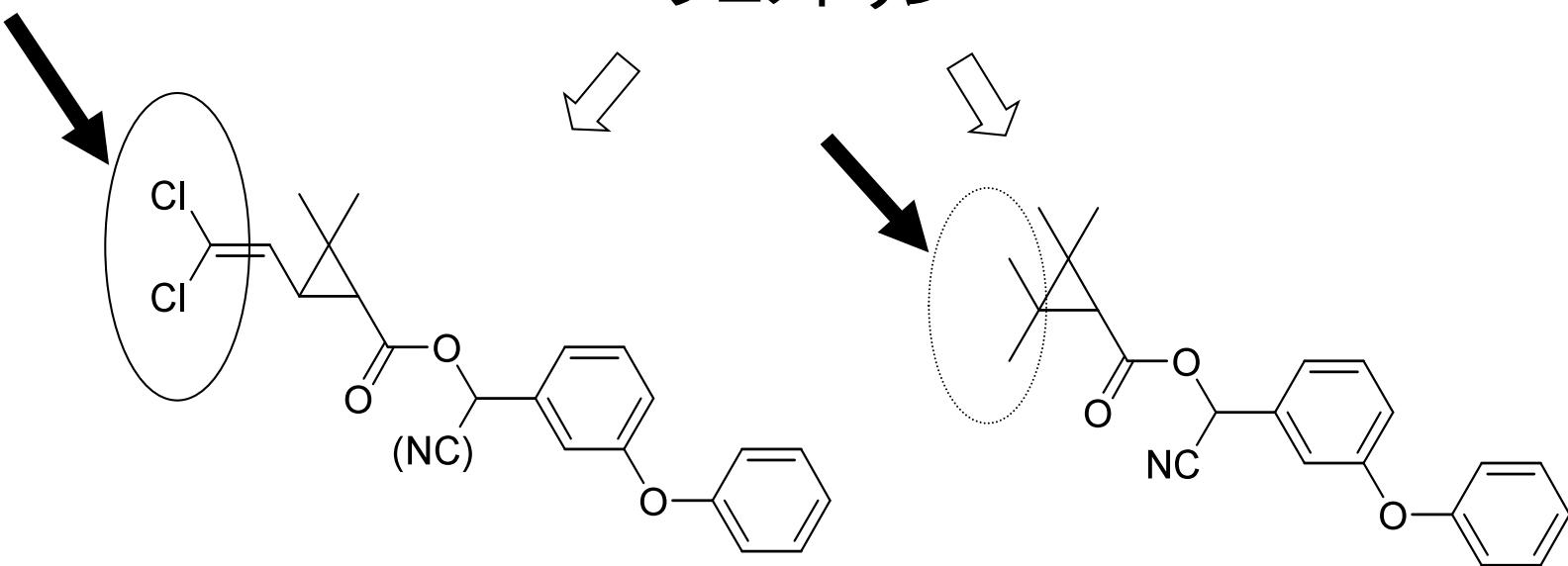


フェノトリン, (シフェノトリン)

合成ピレスロイド(2)



フェノトリン



ペルメトリン
(シペルメトリン)

フェンプロパトリン

応用例:オリセットネット(防虫蚊帳)

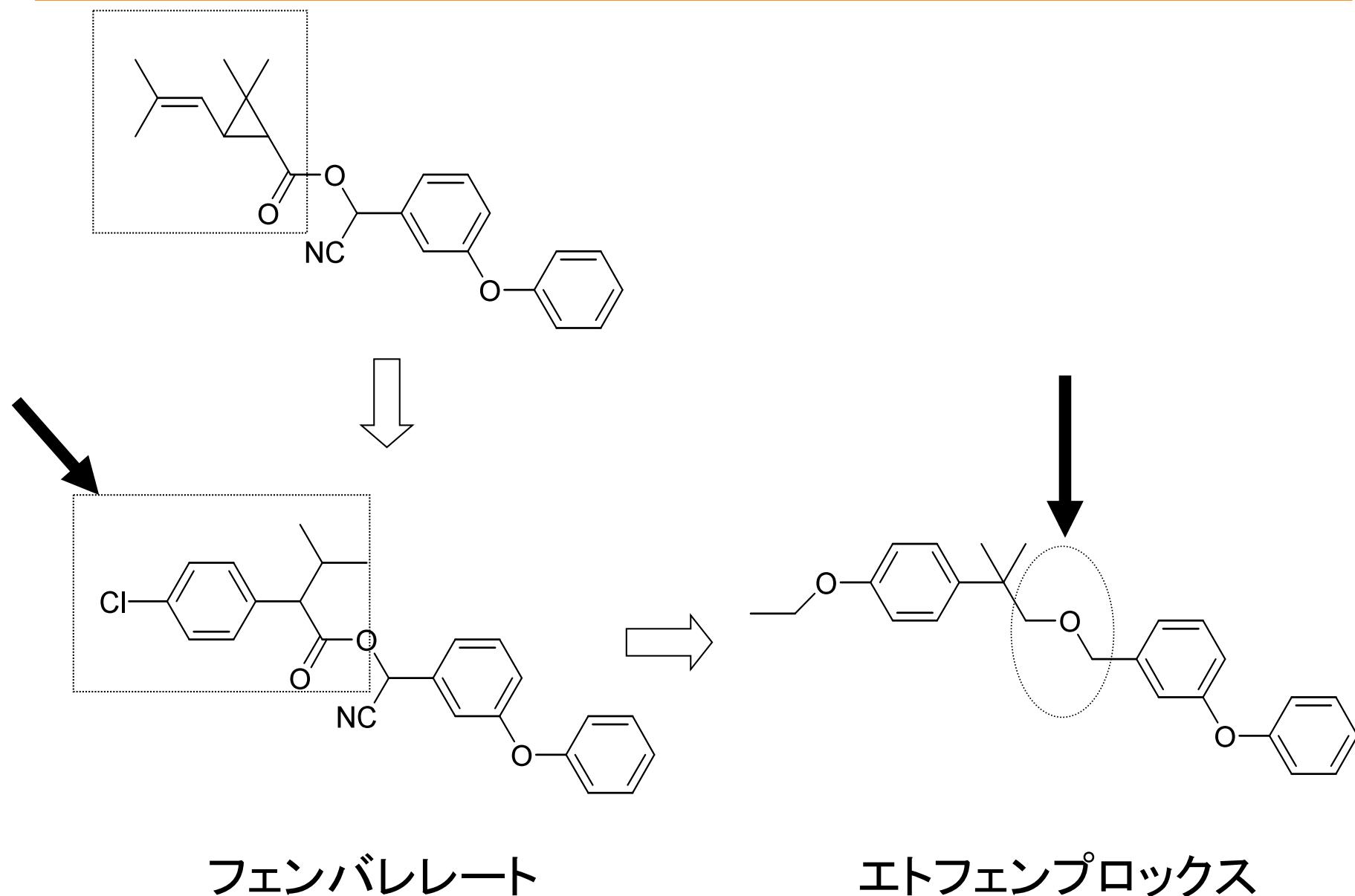
- ◆ あらかじめ薬剤を練り込んだポリエチレンで作製された蚊帳(カヤ)
 - 防虫成分:ペルメトリン
- ◆ 効力は3年持続
- ◆ マラリア感染予防

恐ろしい蚊による伝染病

- ◆ マラリア
- ◆ 日本脳炎
- ◆ ウエストナイル熱(脳炎)
- ◆ デング熱

<http://www.pref.aichi.jp/eiseiken/67f/mosquito.html>

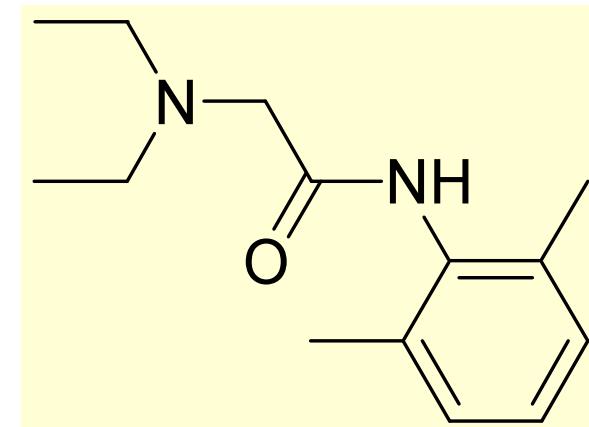
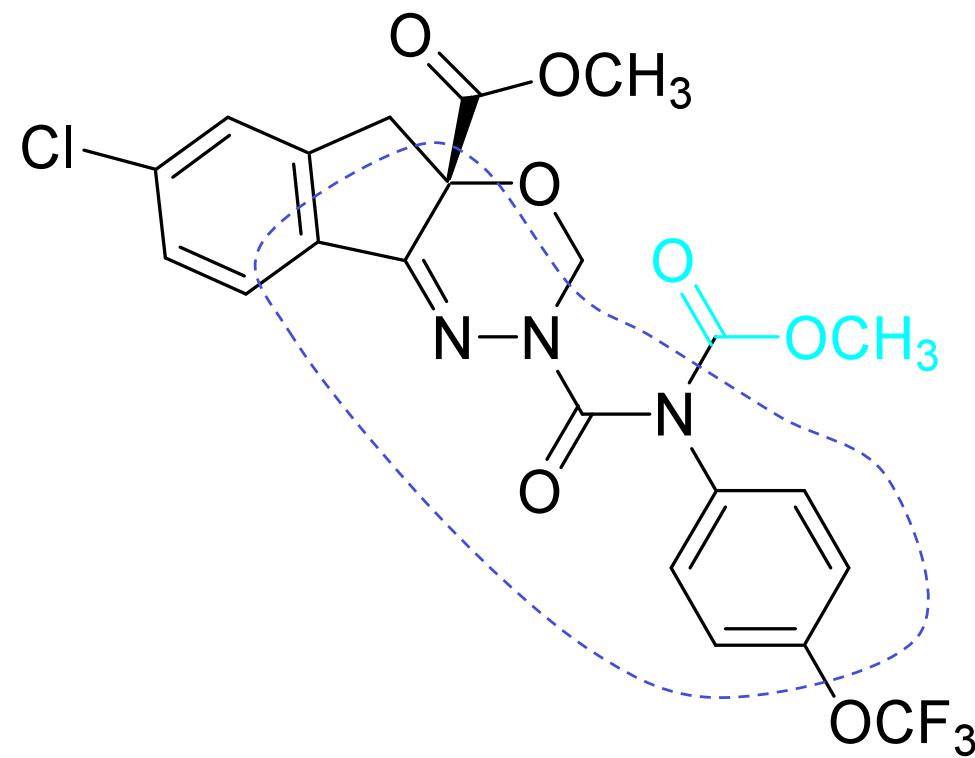
合成ピレスロイド(3)：農業用殺虫剤へ



選択性

- ◆ 人畜に対する毒性が低い
 - 代謝分解能力のちがい
 - 負の温度依存効果
 - 低温で効果が高い
 - 温血動物では作用が弱い？
 - 神経細胞膜、チャンネルの性質がちがう？

インドキサカルブ



リドカイン

殺虫剤「トルネードフロアブル」

成分: インドキサカルブ 10.0%

- 大型りん翅目害虫のヨトウムシ、ハスモンヨトウ、オオタバコガなどに高い効果を示します。
- 幼虫の各ステージに高い活性があり、老齢幼虫にも実用的な効果を示します。
- 従来の殺虫剤と異なる新しい作用機作を有するため、ピレスロイド剤やIGR剤等に抵抗性の顕在化したりん翅目害虫に対し高い効果を示します。