

Studies on S-3151 [I]. Basic Studies on Insecticidal Activities of New Insecticidal Compound, 3-Phenoxybenzyl (±)-*cis, trans*-2,2-dimethyl-3-(2,2-dichlorovinyl)-cyclopropanecarboxylate (S-3151, Permethrin). Shigenori TSUDA, Yoshitoshi OKUNO, Takashi YAMAGUCHI, Haruka OUCHI, Chuji HIROSE (Reserch Department, Pesticide Division, Sumitomo Chemical Co., Ltd, Takarazuka, Hyogo, Japan) Received Feb. 14, 1976. *Botyu-Kagaku*, 41, 90, 1976. (with English Summery 98)

19. S-3151 に関する研究 (第一報) 新規殺虫剤 S-3151 の殺虫特性 津田重典, 奥野吉俊, 山口堯士, 大内 晴, 広瀬忠爾 (住友化学工業株式会社, 農薬事業部研究部, 兵庫県宝塚市高司 4 丁目)

新規殺虫剤 S-3151 (パーメスリン, NRDC-143) の各種衛生害虫に対する殺虫効力を, 既存のピレスロイド系および, 有機燐系殺虫剤と, 種々の施用法を用いて比較した。

その結果, S-3151 の基礎的な殺虫効力に関して, ノックダウン効果は従来の速効性ピレスロイドに及ばないが, 致死効力は極めて高いことが確認された。特に, イエバエに対しては, ピレトリンの 18~42 倍の致死効力を示し, レスメトリン, フェニトロチオン同等の殺虫特性をもつ化合物であった。

S-3151 の幾何異性体間の殺虫効力を比較すると, トランス体よりもシス体がまさり, 一般にピレスロイドがトランス化されることによって, イエバエなどに対し強い致死効力を示す現象とは異なる傾向がみとめられた。しかし, シス体の効力をシス・トランス (45/55) 混合体と比較した場合大差なく, この性質から, 適当な割合でシス体が混入されていることにより, 殺虫効力の面で好結果が得られることが示唆された。

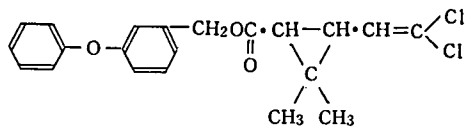
ゴキブリに対する残留接触法による検討から S-3151 の最も特徴的な作用性が明らかとなった。すなわち, レスメトリン, フェニトロチオンと比較すると, 著しく残効性に富み, かつ, ゴキブリの潜み場所への棲みつきを乱す作用も示唆され, 残留塗付剤としての有用な特性を具備しているものと考えられた。

S-3151 に関する本報での基礎的な検討から, 著者らはこの殺虫剤の実際的な害虫防除への適用は, 残効性を要求される分野に最適であることを確認し, 今後更に, その物理化学的性質, 製剤, 生物効果に関する研究を継続する考えである。

緒 言

衛生害虫を駆除する目的で使用される, いわゆる防疫用殺虫剤の具備すべき重要な条件は, 人畜に対し安全で, 害虫防除効果の高いことである。この条件によく合致する殺虫剤として, 合成ピレスロイド系殺虫剤と称される種々の菊酸エステル化合物が高く評価され, 多くのすぐれた殺虫剤が創製されているのは周知の通りである。

S-3151 は*, 近年英国 NRDC (National Research Development Corporation) によって発表されているパーメスリン (permethrin) の住友化学工業株式会社におけるコード・ナンバーであり, 次のような構造式をもつ化合物である。



3-phenoxybenzyl (±)-*cis, trans*-2,2-dimethyl-3-(2,2-dichlorovinyl)-cyclopropanecarboxylate.

この化合物の一般的性質, 殺虫効力などの一部については, すでに Elliott^{2,3,4)} によって報告がなされており, 優れた殺虫効力と, 哺乳動物に対する低毒性と, 高い安定性をあわせもった化合物であることが知られている。

著者らは, この化合物の生物活性について, 更に詳しい検討を加え, その特徴を見出し, 有意義に利用することを目的として実用化への研究に着手した。本報では, 第一報として, 基礎的な殺虫効力について検討を行ない, その有用な特性を確認したので報告する。

実験材料および方法

I. 実験に使用した薬物

1. S-3151 : 住友化学工業株式会社農薬研究部にて合成されたもので, 化学純度 92.4% [(+):(-) = 1:1, *cis* : *trans* = 45:55] である。その物理化学的性質の要

* S-3151 は住友化学工業株式会社農薬研究部にて合成されたパーメスリン (NRDC-143) のコード・ナンバーであり, 本報では便宜上この名称に統一した。

約を Table 1 に示す。また、その幾何異性体試料はすべて、住友化学工業株式会社農薬研究部にて合成されたもので、化学純度は次に示すとおりである。

(±)trans S-3151 99%以上 [(+):(-)=1:1, trans 体99%以上]

(±)cis S-3151 99%以上 [(+):(-)=1:1, cis 体99%以上]

2. レスメトリン：住友化学工業株式会社製のクリスロン®で、化学純度91.6%の工業品

3. ピレトリン：大日本除虫菊社製のコックスリン®で、全ピレスロイド含量20.35% (ピレトリンⅠ：10.77%, ピレトリンⅡ：9.58%)

4. フェニトロチオン：住友化学工業株式会社製のスミチオン®で、化学純度98.3%の工業品

5. フタルスリン (tetramethrin)：住友化学工業株式会社製のネオピナミン®で、化学純度93.3%の工業品

6. (+)trans-アレスリン：住友化学工業株式会社農薬研究部にて合成された (±)-allethronyl-(+)trans-chrysanthemate で化学純度90.9%

I. 供試昆虫

供試昆虫は、すべて住友化学工業株式会社農薬研究部にて温度 27±2°C, 相対湿度 60±5% に調節された飼育室で累代飼育中のものである。

1. イエバエ (*Musca domestica* L.)

次のような感受性系統の、羽化後3~5日の雌雄成虫、もしくは終令幼虫を用いた。

(1) Lab-em-7-em 系

(2) NAIDM 系

(3) CSMA 系

2. アカイエカ (*Culex pipiens pallens*)

感受性系統の羽化後2~3日の雌成虫、もしくは終令幼虫を用いた。

3. チャバネゴキブリ (*Blattella germanica*)

感受性系統の雌雄成虫を用いた。

II. 実験方法

1. イエバエ, アカイエカ, チャバネゴキブリ成虫に対する微量滴下法⁵⁾

2. イエバエ成虫に対するターン・テーブル法⁶⁾

3. イエバエ, アカイエカ幼虫に対する浸漬法⁵⁾

4. イエバエ, アカイエカ成虫に対するグラス・チャンパー法⁶⁾

5. チャバネゴキブリ成虫に対する油剤の直接噴射法

(i) 長沢式噴霧降下装置を用いる方法⁶⁾

(ii) 小型ガラス円筒 (径10cm, 高さ37cm) を用いる方法⁶⁾

6. イエバエ, アカイエカ成虫に対する油剤の加熱煙霧法⁶⁾

7. チャバネゴキブリ成虫に対するベニヤ板面残留接触試験法

(i) 強制接触試験法⁶⁾

15cm×15cm のベニヤ板面に薬剤処理し、その上に腰高シャーレを伏せてゴキブリを強制的に24時間接触させる方法。

(ii) 準実地試験法⁶⁾

5m² の試験区画内に15cm×15cm の薬剤処理ベニヤ板を20枚配置し、ゴキブリに対する非強制的な接触

Table 1. Physicochemical properties of S-3151

| Items | Outline of properties |
|-------------------|---|
| Empirical formula | C ₂₁ H ₂₁ O ₃ Cl ₂ |
| Molecular weight | 391.3 |
| Appearance | Brown clear liquid at 30°C |
| Specific gravity | d ₂₅ ²⁵ =1.214 |
| Melting point | 25—30°C |
| Viscosity | 250 C. P. at 30°C |
| Vapor pressure | 11.2 mmHg at 250°C (gaschromatographic determination ¹⁶⁾) |
| Solubility | Soluble in methanol, isopropanol, acetone, cyclohexanone, xylene, n-hexane, deodorized kerosene and methylchloroform (>50% w/w at 30°C) Almost insoluble in water (0.2 ppm at 30°C) |
| Stability | Effect of temperature Very stable under storage conditions, in most organic solvents and inorganic mineral diluents. Effect of pH Stable at neutral to acidic pH, but unstable at alkaline pH. Effect of irradiation More stable than resmethrin, allethrin, tetramethrin, phenothrin or other pyrethroidal compounds. |

による準実地的な効果を試験する方法。

以上の方法は奥野らによる防虫科学(1969⁹⁾, 1976¹⁰⁾ 既報の方法と同様である。

(iii) 薬剤処理ベニヤ板配置によるチャバネゴキブリの棲みつき試験法—A法—

各供試薬剤〔有効成分5%, ソルポール SM 200 (東邦化学工業社製) 5%, キシレン90% (w/w), 本報で用いた乳剤はすべてこの組成のものである。〕の水による希釈液を15cm×15cmのベニヤ板面に50ml/m²の割合で均一に塗付し, 所定量の有効成分量の薬剤処理ベニヤ板を用意する。前記(ii)と同様の塩化ビニール板により区切った5m²試験区画(2m×2.5m)内に, Fig. 1-(A)に示されるように, マウス用固型飼料(CE-2, 日本配合飼料社品)入り容器2個, 5%砂糖水を含ませた脱脂綿入り容器4個を餌として配置

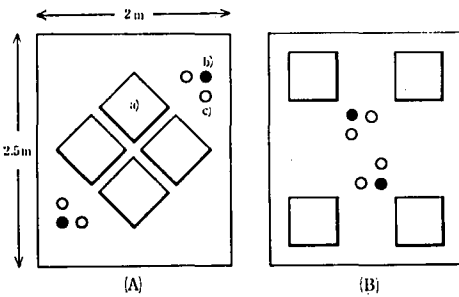


Fig. 1. The positions of foods, shelters and test plywood panels treated with S-3151 or Fenitrothion in comparative harbourage tests (A) and (B) with cockroaches.

- a) Test plywood panels under the shelter.
- b) Solid mouse food in a cup.
- c) 5% Sugar solution in a cup.

し, 30cm×60cmの沓紙を4つの波型に折ったシェルターを4個配置する。その区画内に約100頭のチャバネゴキブリ成虫(♂:♀=1:1)を放ち, 1日間放置し環境馴化させてシェルター内にひそむことを確認する。その後, シェルターの下に薬剤処理ベニヤ板, 各3枚ずつ計12枚を静かにおき, 1週間経時的にノックダウンおよび死虫数を数えた。

(iv) 薬剤処理ベニヤ板配置によるチャバネゴキブリの棲みつき試験法—B法—

Fig. 1-(B)に示されるように, 区画の4隅にシェルターを配置する方法で, その他は, 7—3と全く同様に行なう。

8. ピート・グラディー・チャンバーによる油剤の噴霧試験法

5.8m³のピート・グラディー・チャンバー内に約100頭のイエバエ成虫(♂:♀=1:1)を放ち, 所定濃

度に調製した油剤約700mgをアトマイザー(明治スプレーガン No. 3)を用いて噴射圧0.5kg/cm²で4個の散布孔より1分以内に噴霧する。5分, 10分, 15分後にノックダウン虫数を数え, 15~20分の間に排気しながら全供試虫を回収し, 観察用カゴに移す。5%砂糖水を与え24時間放置したあと, 死虫数を数える。5回の反復の結果より経過時間ともなうノックダウン率および致死率を求めた。なお油剤は所定量の有効成分をメチルクロロホルムと脱臭ケロシンの等重量混合液に溶解して調製した。

9. 乳剤のイエバエ幼虫培地面噴霧試験法

イエバエ幼虫の培地(大麦外皮とフスマとルーサンミールの等量混合物200gとエビオス4gに400ccの水を混合して調製する。)約60gを径10cm高さ5cmのプラスチック・カップに入れる。これにイエバエ終令幼虫を1群40頭ずつ放ち, 各供試薬剤の所定濃度の水希釈液を所定量アトマイザー(明治スプレーガン No. 3)を用いて噴射圧0.5kg/cm²で培地面に噴霧する。約10日後に羽化成虫数を観察しイエバエ幼虫の非羽化率を算出しておのおの防除効果を求めた。

実験結果および考察

1. 致死効力

S-3151の致死効力を知るために, イエバエ, アカイエカ, チャバネゴキブリ成虫に対し微量滴下法, イエバエ成虫に対しターン・テーブル法, チャバネゴキブリ成虫に対し小型ガラス円筒での直接噴射法による効力試験を行なった。その結果をTable 2に示す。

イエバエ成虫に対する致死効力はピレスロイドの中では卓効を示すレスメトリンや, 有機リン剤であるフェニトロチオンと同等もしくはそれ以上であり, 対ピレトリン比では18~42倍にも達した。アカイエカおよびチャバネゴキブリに対する致死効力も高く, S-3151はレスメトリン様の致死効力の高い化合物であった。しかし, チャバネゴキブリ成虫に対する油剤の直接噴射法によれば, S-3151, レスメトリン, ピレトリン, フェニトロチオンはともにほぼ同等の効力となり微量滴下法とは異なる傾向を示した。なお, 微量滴下法において, 2系統のイエバエのピレトリンに対する効力が大きく異なるのはすでに林ら^{7,8)}によって指摘されたように系統による感受性の相違に起因するものであると考えられる。

2. 幾何異性体間の致死効力

S-3151の幾何異性体間の致死効力を知るため, イエバエ, チャバネゴキブリ成虫に対する微量滴下法による試験を実施した。その結果をTable 3に示す。

イエバエ成虫に対する致死効力は, (±)シス・トランス(45/55)体での効力を100とした場合, (±)トラ

Table 2. Toxicity of S-3151 to insects in comparison with Resmethrin, Pyrethrins and Fenitrothion

| Insects | Toxicity | | | |
|-------------------------------------|--------------------|--|-----------------|----------------|
| | S-3151 | Resmethrin | Pyrethrins | Fenitrothion |
| | | Topical LD₅₀ (μg/insect) | | |
| Houseflies | Lab-em-7-em strain | 0.046 (18.2) | 0.029 (28.0) | 0.84 (1.0) |
| | CSMA strain (♀) | 0.036 (41.7) | 0.038 (39.5) | 1.5 (1.0) |
| | | Turn table LC₅₀ (mg/100ml) | | |
| Houseflies | Lab-em-7-em strain | 13.4 (22.4) | 22.0 (13.6) | 300 (1.0) |
| | | Topical LD₅₀ (μg/insect) | | |
| Mosquitoes (<i>C. pipiens</i>) | | 0.008 (3.3) | 0.0127 (2.0) | 0.026 (1.0) |
| Cockroaches (<i>B. germanica</i>) | | 0.64 (2.3) | 0.88 (1.7) | 1.47 (1.0) |
| | | Direct spray LC₅₀ (mg/100ml) | | |
| Cockroaches (<i>B. germanica</i>) | | 80 (0.8) | 65 (0.9) | 60 (1.0) |
| | | | | 55 (1.1) |

(): Relative toxicity (Pyrethrins=1.0)

Table 3. The toxicity of (±) cis and (±) trans isomers of S-3151 to insects by topical application method

| Insects | Isomers | LD ₅₀ (μg/insect) | Relative toxicity |
|--|-------------------------------------|---------------------------------|-------------------|
| Houseflies (♀) (CSMA strain) | (±) <i>cis, trans</i> ^{a)} | 0.036 | 100 |
| | (±) <i>trans</i> | 0.055 | 66 |
| | (±) <i>cis</i> | 0.026 | 139 |
| Cockroaches (<i>B. germanica</i>) | (±) <i>cis, trans</i> ^{a)} | 0.87 | 100 |
| | (±) <i>trans</i> | 1.70 | 51 |
| | (±) <i>cis</i> | 0.83 | 105 |

a) (±) *cis* : (±) *trans* = 45 : 55

ンス体で66, (±)シス体で139となり, シス体はトランス体のほぼ2倍の効力を示した。アレスリン, フタルスリン (tetramethrin), レスメトリン, フェノスリンなど現在知られている多くの合成ピレスロイド系殺虫剤では, すでに Gersdorff^{9,10), Elliott^{11), 西沢^{12), 宮本^{13),}らの報文で述べられているように, イエバエ成虫に対する致死効力において, いずれも(+)または(±)トランス体が対応するシス体よりも高い効力を示している。これに対し S-3151 の(±)シス体が(±)トランス体よりも高い効力を示すことは特徴的な性質である。チャバネゴキブリに対しても同様にシス体はトランス体のほぼ2倍の効力を示した。しかし, (±)シス・トランス体の効力と比較すると同等か, やや勝る程度であった。}}}

これらの結果より判断すると, S-3151の場合適当な割合でシス体が混入されていることによって殺虫効力の面で好結果が得られることが示唆された。なお, 本実験においては幾何異性体間の効力比較のみ行なったが, さらに光学異性体を含めた総合的な異性体に関する比較検討を要するものと考えている。

3. 共力剤の効果

S-3151に対し, 各種共力剤を添加した場合のイエバエおよび, チャバネゴキブリ成虫に対する致死効力増強効果を微量滴下法により検討した。その結果を Table 4 に示す。

S-3151への各種共力剤の添加による効力増強効果はわずかにイエバエに対するピペロニルブトキサイド (PBO) の場合にのみみられるだけで, 他の共力剤で

Table 4. Effect of several synergists on S-3151 toxicity by topical application method

| Insects | Synergists | LD ₅₀ (μ g/insect) | Degree of ^{f)} synergism |
|--|-------------------------------|---------------------------------------|--------------------------------------|
| Houseflies (♀) (CSMA strain) | S-3151 alone | 0.0260 | 1.00 |
| | × 2 P. B. O. ^{a)} | 0.0130 | 2.00 |
| | × 5 P. B. O. | 0.0125 | 2.08 |
| | × 10 P. B. O. | 0.0082 | 3.17 |
| | × 5 S-421 ^{b)} | 0.0184 | 1.41 |
| | × 5 Safroxane ^{c)} | 0.0193 | 1.35 |
| | × 5 I. B. T. A. ^{d)} | 0.0200 | 1.30 |
| Cockroaches (<i>B. germanica</i>) | S-3151 alone | 0.66 | 1.00 |
| | × 2 P. B. O. | 0.69 | 0.96 |
| | × 5 P. B. O. | 0.58 | 1.14 |
| | × 10 P. B. O. | 0.54 | 1.22 |
| | × 5 S-421 | 0.60 | 1.10 |
| | × 5 Safroxane | 0.54 | 1.22 |
| | × 5 I. B. T. A. | 0.57 | 1.16 |
| × 5 MGK-264 | 0.59 | 1.12 | |

a) α -[2-(2-Butoxyethoxy)-ethoxy]-4,5-methylenedioxy-2-propyltoluene

b) Octachlorodipropylether

c) 4-(3',4'-Methylenedioxyphenyl)-5-methyl-meta-dioxane

d) Isobronylthiocyanacetate

e) N-(2-Ethylhexyl) bicyclo-(2,2,1)-5-heptene-2,3-dicarboximide

f) Degree of synergism = $\frac{\text{LD}_{50} \text{ insecticide alone}}{\text{LD}_{50} \text{ insecticide \& synergist}}$

Table 5. Knock down activity of oil formulations of S-3151, Resmethrin and Pyrethrins against houseflies and mosquitoes by glass chamber method

| Insecticides | conc. (%) | KT ₅₀ (sec.) | |
|--------------|--------------|------------------------------------|-------------------------------------|
| | | Houseflies (Lab-em-7-em strain) | Mosquitoes (<i>C. pipiens</i>) |
| S-3151 | 0.5 | 400 | 320 |
| Resmethrin | 0.5 | 180 | 198 |
| Pyrethrins | 0.5 | 50 | 42 |
| | 0.1 | 270 | 157 |

は5倍量程度の添加によってはほとんど期待できず、既に奥野⁵⁾らによって報告されているレスメトリンの場合と同様の傾向を示すものであった。

4. 油剤のノックダウンおよび致死効力

S-3151のノックダウン効力を知るために、イエバエおよびアカイエカ成虫に対し、グラスチャンパー法による油剤噴霧試験、およびピート・グラディー・チャンパーによる油剤の加熱煙霧試験を実施した。その結果をTable 5およびTable 6に示す。

グラスチャンパー法による油剤噴霧試験結果より

(Table 5), S-3151のノックダウン効力はピレトリンはもちろん、レスメトリンにも劣り、速効性に欠けていることが判明した。

一方、加熱煙霧法による結果 (Table 6) では、S-3151のノックダウン効力はレスメトリスとほぼ同等であったが、ピレトリンの速効性にはおよばなかった。しかし、致死効力では、すでに述べたように、ピレトリンやレスメトリンをしのぐものであった。

そこで、S-3151にフタルスリン (tetramethrin), (+)トランス・アレスリン等のノックダウン剤を適量

Table 6. Efficacy of oil formulations of S-3151, Resmethrin and Pyrethrins against houseflies and mosquitoes by thermal fogging method

| Insecticides | Conc. (%) | Dosage (ml/5.8m ³) | % knockdown | | | | % Mortality at 24 hrs. |
|---------------------------------------|-----------|--------------------------------|-------------|--------|--------|----------|------------------------|
| | | | 5min. | 10min. | 15min. | (20min.) | |
| Houseflies (NAIDM strain) | | | | | | | |
| S-3151 | 0.1 | 4.8 | 0 | 7 | 49 | 69 | 62 |
| | 0.2 | 4.7 | 1 | 54 | 85 | 93 | 92 |
| Resmethrin | 0.1 | 4.5 | 1 | 22 | 63 | 81 | 63 |
| | 0.2 | 4.5 | 10 | 53 | 76 | 88 | 72 |
| Pyrethrins | 0.1 | 4.5 | 55 | 76 | 83 | 89 | 3 |
| Mosquitoes (<i>C. pipiens</i>) | | | | | | | |
| S-3151 | 0.1 | 4.8 | 0 | 31 | 62 | 97 | 97 |
| | 0.2 | 4.7 | 3 | 47 | 89 | 99 | 99 |
| Resmethrin | 0.1 | 4.5 | 6 | 49 | 72 | 91 | 87 |
| | 0.2 | 4.5 | 25 | 69 | 79 | 94 | 88 |
| Pyrethrins | 0.1 | 4.5 | 35 | 61 | 77 | 85 | 67 |

配合した油剤のイエバエ成虫に対する効果を、ピート・グラディー・チャンバーによる油剤の噴霧試験法により、また、チャバネゴキブリ成虫に対する効果を直接噴射法⁶⁾により調べた。その結果をそれぞれ Table 7, および Table 8 に示す。

イエバエおよびチャバネゴキブリの両害虫に対し、S-3151 は速効性には欠けるが、致死効力が強かった。

それに対し、フタルスリン (tetramethrin), (+)トランス・アレスリンは、致死効力は弱い非常に速効的であった。S-3151 に、このようなノックダウン剤を配合した場合には、ノックダウン効果における速効性が付与されしかも強い致死効力を示した。

以上のことより、S-3151 にノックダウン剤を配合することの有用性が明らかとなった。

Table 7. Efficacy of oil formulations of S-3151, Tetramethrin and (+) *trans* Allethrin alone, and their combinations against houseflies (NAIDM strain) by Peet Grady chamber method

| Insecticides | Conc. (%) | Dosage (mg/5.8m ³) | % Knock down | | | | % Mortality at 24 hrs. |
|---------------------------------------|------------|--------------------------------|--------------|--------|--------|----------|------------------------|
| | | | 5min. | 10min. | 15min. | (20min.) | |
| S-3151 | 0.3 | 695 | 1 | 38 | 63 | 77 | 69 |
| Tetramethrin | 0.3 | 695 | 48 | 72 | 83 | 86 | 2 |
| (+) <i>trans</i> Allethrin | 0.3 | 695 | 36 | 70 | 81 | 87 | 5 |
| (S-3151 Tetramethrin | 0.1 0.2 | 700 | 35 | 67 | 82 | 83 | 60 |
| (S-3151 (+) <i>trans</i> Allethrin | 0.1 0.2 | 695 | 37 | 69 | 74 | 82 | 59 |

Table 8. Efficacy of oil formulations of S-3151 and Tetramethrin alone, and their combinations against German cockroaches by direct spray method.

| Insecticides | Conc. (%) | Dosage (mg) | % Knock down | | | | % Mortality at 72 hrs. |
|-------------------------|--------------|-------------|--------------|-------|--------|--------|------------------------|
| | | | 2.5min. | 5min. | 10min. | 20min. | |
| S-3151 | 0.3 | 493 | 0 | 3 | 13 | 22 | 88 |
| (S-3151 Tetramethrin | 0.15 0.15 | 487 | 23 | 47 | 58 | 67 | 60 |
| Tetramethrin | 0.3 | 487 | 33 | 55 | 73 | 87 | 5 |

5. イエバエ, およびアカイエカに対する乳剤の殺幼虫効果

S-3151 乳剤のイエバエおよびアカイエカ幼虫に対する致死効力を浸漬法により調べた。その結果を Table 9 に示す。いずれの供試虫に対しても、S-3151 の致死効力は著しく、ピレトリンに対する相対効力比では 3~10 倍にも達した。

より実的な効力をみるために、イエバエ幼虫に対して、その培地面上に乳剤を散布したときの羽化阻止効果を調べた。その結果を Table 10 に示す。

2ml/cup 散布の条件では、S-3151 はフェニトロチオンとほぼ同等の効力を示し十分に実用性が期待された。しかし、散布量の少ない 1ml/cup では、レスメトリンにはまさるがフェニトロチオンにはやや劣った。これらの結果より、S-3151 はイエバエ、アカイエカなどの殺幼虫剤として著るしい効力を有すること、培地面散布による殺蛆処理にあたっては、高濃度の希釈液を少量散布するよりも、低濃度の希釈液を多量散布する方がより効果的であることが示唆された。

なお、S-3151 はすでに Chemical Week 誌⁹⁾で述べられているように、実際の使用にあたっては魚類の棲息する水系への流出を十分考慮する必要がある。

6. チャバネゴキブリ成虫に対する乳剤の残留接触効果

S-3151 のチャバネゴキブリ成虫に対する接触法による殺虫効力を知るために、所定量の乳剤を塗付したベニヤ板面にチャバネゴキブリを 24 時間強制的に接触させた。また、残留効果をみるために、薬剤処理ベニヤ板を温度 25°C、相対湿度 60% に調節された部屋に保存し所定期間ごとに同様の試験を行なった。その結果を Table 11 に示す。有効成分として、250mg/m² の割合で処理したベニヤ板では薬剤処理直後の試験において、S-3151、フェニトロチオン、レスメトリン、ピレトリンともにほぼ 100% の致死効果が得られた。しかし、ピレトリン、レスメトリンでは 1 カ月後に、フェニトロチオンでは 2 カ月後になると効力が低下した。その中で S-3151 のみは 6 カ月後も 85% の強い致死効力を持続し、著しく残効性に富むことが示唆された。また S-3151 とフェニトロチオンについては、施用薬量を 125mg/m²、62.5mg/m² とした時の残留効果もみたが、このように薬量を減じた場合、薬量の減少に応じて、残効性も低下する傾向にあった。これらの結果から、S-3151 は極めて残効性に富むものではあるが、適当な施用薬量を選ぶことによって好ましい程

Table 9. Larvicidal activity of emulsion formulations of S-3151, Resmethrin, Pyrethrins and Fenitrothion against mosquitoes and houseflies by immersion method

| Insecticides | LC ₅₀ (ppm) | | |
|--------------|---------------------------|--------------------------|-------------------------|
| | Houseflies (NAIDM strain) | Houseflies (CSMA strain) | Mosquitoes (C. pipiens) |
| S-3151 | 0.22 (8.4) | 0.57 (2.9) | 0.006 (10.2) |
| Resmethrin | 0.91 (2.0) | 0.34 (4.9) | 0.028 (2.2) |
| Pyrethrins | 1.85 (1.0) | 1.66 (1.0) | 0.061 (1.0) |
| Fenitrothion | 1.35 (1.4) | 0.19 (8.7) | 0.009 (6.8) |

(): Relative toxicity (Pyrethrins=1.0)

Table 10. Larvicidal activity of emulsion formulations of S-3151, Resmethrin and Fenitrothion against houseflies in breeding medium by surface spray method.

| Insecticides | conc. (ppm) | % unemerged | |
|--------------|-------------|-----------------------|-----------------------|
| | | 1ml/cup ^{a)} | 2ml/cup ^{a)} |
| S-3151 | 25 | 32 | 78 |
| | 100 | 52 | 98 |
| Resmethrin | 25 | 16 | 33 |
| | 100 | 40 | 86 |
| Fenitrothion | 25 | 55 | 83 |
| | 100 | 73 | 100 |

a) Plastic cup (10 cm in diameter and 5 cm in height)

Table 11. Residual effect of emulsion formulations of S-3151, Fenitrothion, Resmethrin and Pyrethrins against German cockroaches by confined contact method.

| Insecticides | Dosage (mg/m ²) | % Mortality at indicated months | | | | |
|--------------|-----------------------------|---------------------------------|-----|----|----|----|
| | | 0 | 1 | 2 | 3 | 6 |
| S-3151 | 250 | 100 | 100 | 95 | 95 | 85 |
| | 125 | 95 | 50 | 20 | — | — |
| | 62.5 | 80 | 18 | 5 | — | — |
| Fenitrothion | 250 | 100 | 100 | 5 | — | — |
| | 125 | 100 | 35 | 5 | — | — |
| | 62.5 | 70 | 0 | 0 | — | — |
| Resmethrin | 250 | 95 | 5 | — | — | — |
| Pyrethrins | 250 | 100 | 43 | — | — | — |

度の致死効力と残効性を得られることが示唆された。

次に、5m²の区画を用いて、残留塗付効果を準実地条件下で調べた。各薬剤は有効成分で、31.25mgを1枚のベニヤ板に均一に塗付し、その20枚を5m²の区画内に配置し(床面積1m²あたり125mgとなる)、7日間継続的に観察して累積的な死虫およびノックダウン虫を数えた。残留効果については前記と同じ条件でベニヤ板を保存して所定期間ごとに同様の実験を行った。その結果をFig.2に示す。薬剤処理直後の結果では、S-3151、フェニトロチオン、レスメトリンらは高い効力を示し、いずれもピレトリン以上であった。

その後ピレトリンは1カ月目で、レスメトリンは2カ月目でほぼ無効となり、フェニトロチオンも4カ月目には効力が低下した。S-3151のみは、4カ月迄のいずれの時期においても十分に強い効力を持続し、準実地試験においても残留塗付剤として著しい効果を示すことが明らかとなった。

今回行った準実地試験では、ゴキブリの通路へ部分的に薬剤噴霧を行なった場合の効力を観察したことになる。しかしながら、ゴキブリの駆除を目的とした実際の残留塗付にあたっては、薬剤をゴキブリの潜み場所に噴霧することも多い。そこで、施用場所の違いの薬効におよぼす影響を知るために、ゴキブリの潜み

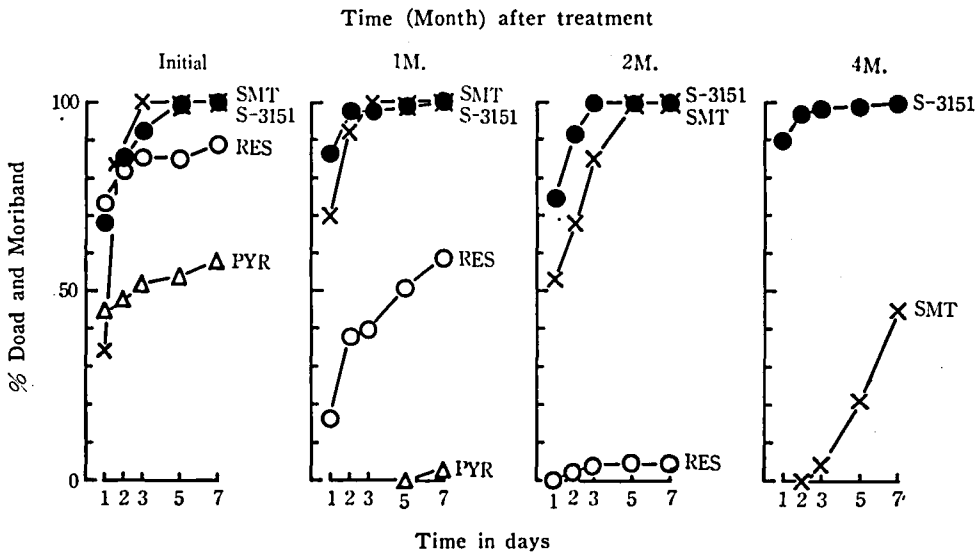


Fig. 2. Residual effect of emulsion formulations of S-3151, Fenitrothion, Resmethrin and Pyrethrins against German cockroaches by semi-field test method. Dosage : 125 mg/m²=625 mg active ingredient/20 panels/test area (5m²) SMT : Sumithion® (Fenitrothion) RES : Resmethrin PYR : Pyrethrins

場所（シェルター）に S-3151 あるいは、フェニトロチオンを処理したベニヤ板を設置した場合の効果を見た。

Fig. 1 に示すように A 法では区画内の四隅をさけて、中央に近いところにシェルターを配置するのに対し、B 法では四隅に配置する。いずれの方法の場合も、シェルターの下には薬剤処理したベニヤ板をおく。A 法では、ゴキブリが、比較的潜みやすい四隅が薬剤無処理で残されているから、薬剤処理ベニヤ板のあるシェルターを好まなければ四隅にのがれることができるよう想定した。他方、B 法ではゴキブリの潜みやすい四隅を薬剤処理したベニヤ板を配置したシェルターにて占拠してみた。このような設定のもとに試験した結果を Fig. 3 に示す。フェニトロチオンでは両施用法ともに

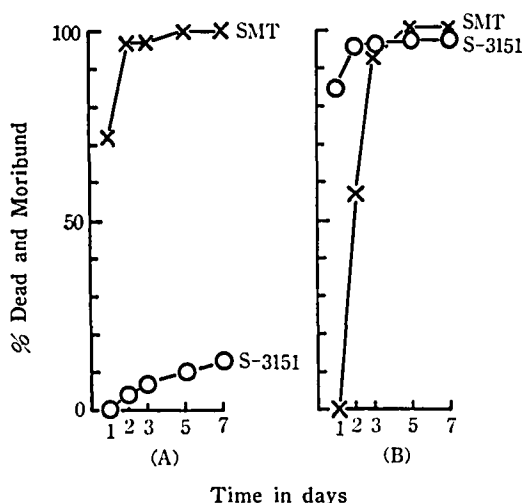


Fig. 3. Contact activity of emulsion formulations of S-3151 and Fenitrothion against German cockroaches by harbourage test methods (A) and (B)

Dosage : $25\text{mg}/\text{m}^2 = 125\text{mg}$ active ingredient/12panels/test area (5m^2)

SMT: Sumithion® (Fenitrothion)

強い効果を示したが、S-3151 では A 法の効力が極めて悪かった。実験中の詳しい観察によれば、S-3151 を A 法によって試験した場合、ゴキブリがシェルターを避けて区画の四隅に群がる傾向が目立った。これらの事実から、ゴキブリに対し S-3151 は、フェニトロチオンとは異なるある種の特性をもっていることが示唆された。

すでに Burden らは^{14,15}ピレトリン、アレスリン、レスメトリンなどのチャバネゴキブリに対する忌避性を報告している。S-3151 にみられた特性もこれに類

似のものであろうと考えられるが、本実験の結果からでは、それほど強いものではなくて、むしろゴキブリの棲みつきを乱す程度の作用であると考えられ、この性質の有効な利用によって、より効果的にゴキブリ駆除ができるのではないかと考えられた。

引用文献

- 1) Elliott, M., et al.: Patent GB-024809, GB-024810.
- 2) Elliott, M.: *Chem. Ind.*, 84, 978 (1974).
- 3) Elliott, M., A. W. Farnham, N. F. Janes, P. H. Needham, D. A. Pulman and J. H. Stevenson: *Nature*, 246, 169 (1973).
- 4) *Chemical Week, March*, 19, 38 (1975).
- 5) 奥野吉俊, 藤本敬明, 門田忠臣, 宮本純之, 羽室桂三: *防虫科学*, 34, 157 (1969).
- 6) 奥野吉俊, 山口堯士, 藤田義雄: *防虫科学*, 41-I (1976).
- 7) 林 晃史, 廿日出正美: *防虫科学*, 32, 61 (1967).
- 8) 林 晃史, 廿日出正美: *防虫科学*, 33, 39 (1968).
- 9) Gersdorff, W. A. and N. Mitlin: *J. Econ. Entomol.*, 46, 999 (1953).
- 10) Gersdorff, W. A. and P. G. Piquett: *J. Econ. Entomol.*, 51, 181 (1958).
- 11) Elliott, M., A. W. Farnham, N. F. Janes, P. H. Needham and B. C. Pearson: *Nature*, 213, 493 (1967).
- 12) Nishizawa, Y.: *Bull. W. H. O.*, 44, 325 (1971).
- 13) 宮本純之, 吉岡宏輔, 藤本敬明, 門田忠臣, 奥野吉俊: *住友化学特集号*, 1973-II, 1 (1973).
- 14) Burden, J. S.: *Pest Cont.*, 6, 16 (1975).
- 15) Fales, J. H., O. F. Bodenstern, R. M. Waters, E. S. Fields and R. P. Holl: *J. Econ. Entomol.*, 5, 58 (1971).
- 16) Jensen, D. J. and E. D. Schall: *J. Agr. Food Chem.*, 14, 123 (1966).

Summary

Basic studies on insecticidal performance of S-3151 were conducted in comparison with pyrethrins, resmethrin and fenitrothion, and several outstanding properties of S-3151 were found as follows;

- 1) The insecticidal efficacy of S-3151 was similar to those of resmethrin and fenitrothion, i.e., slow knock down effect but high killing effect against such sanitary insects as housefly, mosquito and cockroach.

- 2) Of the two geometric isomers, (\pm)*cis* isomer was about 2 times more effective than (\pm)*trans* isomer, but was only 1-1.4 times more than a combination of the two isomers (*cis:trans*=45: 55) against housefly and cockroach.
- 3) The most outstanding was the long lasting property of S-3151 in residual contact activity.

Moreover, we obtained results suggesting that S-3151 possesses a slight activity to expel cockroaches from their harbourage when applied into it.

These results suggest that S-3151 will be of great practical use for residual control against cockroach.

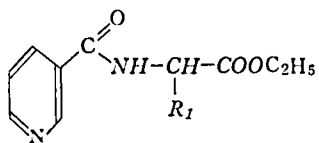
Zur Beeinflussung von Stoffwechselvorgängen durch unphysiologische Verbindungen, IV*:
Nicotinylaminosäureester und Nucleosid-Derivate. R. RIEMSCHEIDER und H. PEHLMANN**
 (Insitut für Biochemie der Freien Universität Berlin und Chemisches Zentralinstitut der Bundesuniversität Santa Maria (UFSM), Brasilien) Received Dec. 13, 1975. *Botyu-Kagaku*, 41, 99, 1976.

20. 生体系に見られない化合物による物質代謝への影響 IV. ニコチルアミノ酸エステルとヌクレオシド誘導體 R. RIEMSCHEIDER und H. PEHLMANN (Institut für Biochemie der Freien Universität Berlin und Chemisches Zentralinstitut der Bundesuniversität Santa Maria (UFSM), Brasilien) 50. 12. 13 受理

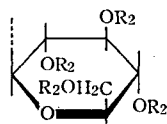
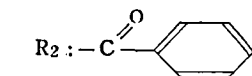
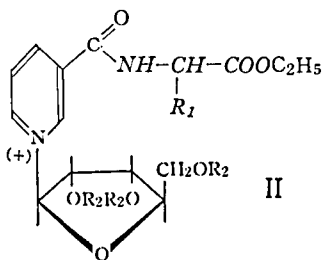
昔から使われている殺虫剤よりも、環境適応性の高い害虫防除剤を開発せんとする、われわれの研究を更に進めて一連のニコチルアミノ酸エステルとヌクレオシド誘導體を合成し、それらの昆虫の代謝系と、世代に対する影響を調べた。

In unseren Laboratorien werden seit einer Reihe von Jahren Versuche zur Entwicklung von Stoffen zur Schädlingsbekämpfung angestellt, die den Stoffwechsel und/oder die Generationsfolge von Insekten beeinflussen, ohne jedoch die toxischen und sonstigen Nebenwirkungen der gebräuchlichen Insektizide zu besitzen. Angestrebt sind also keine Insektizide im eigentlichen Sinn, sondern Verbindungen, die zwar als Ersatz für physiologisch wirksame Verbindungen wegen ihrer konstitutionellen Ähnlichkeit vom Insektenstoffwechsel aufgenommen werden, jedoch die Vermehrung oder andere Funktionen des Organismus beeinträchtigen. Ihre Anwendung könnte eine "umweltfreundliche" Bekämpfungsmethode darstellen. Zu diesen, in den Stoffwechsel eingreifenden Verbindungen rechnen wir z. B. a) die in früheren Mitteilungen^{2,3,4)} dieser Reihe behandelten *p*-X-substituierten Phenylalanine (X=F, CH₃), die in körpereigene Eiweißstoffe eingebaut werden und/oder Enzyme stören, b) unphysiologische Säuren des Citronensäurecyclus wie

Fluoräpfelsäure⁵⁾, welche Enzyme blockieren können, ferner c) abgewandelte Nucleinsäurebausteine, die den Stoffwechsel von Nucleinsäuren beeinflussen und ähnliche Verbindungen, wie z. B.



I R^1 : z. B. $-H$, $-CH_3$, $-CH_2-CH_2-S-CH_3$, u. a.



III

* Mitt. III Z. Naturforschg. 20b, 540 (1965).

** Anschrift für den Schriftverkehr; Prof. Dr. h. c. R. RIEMSCHEIDER, 1 Berlin 19, Bolivarallee 8, Postfach 191 164.