

Comparative Effectiveness of New Synthetic Pyrethroids, Resmethrin and Prothrin, against Adults of the House Fly and House Mosquito. Studies on the Biological Assay of Pyrethroids. V. Kazuo BUEI (Osaka Prefectural Institute of Public Health, Osaka) Hiroshi OGAMI (Research Laboratory of Dainippon Jotyugiku Co., Ltd., Osaka) Akifumi HAYASHI (Laboratory of Applied Entomology, Taisho Pharmaceutical Co., Ltd., Tokyo) and Shiro ASADA (Department of Medical Zoology, Osaka City University Medical School, Osaka). Received October 11, 1971. *Botyu-Kagaku* 36, 184 (1971). (with English Summary 188).

25. レスメスリン、プロスリンのイエバエ及びアカイエカに対する効力比較* ピレスロイドの生物試験に関する研究 第5報 武衛和雄 (大阪府立公衆衛生研究所) 大神 弘 (大日本除虫菊株式会社中央研究所) 林 晃史 (大正製薬株式会社研究部防虫科学研究室) 浅田四郎 (大阪市立大学医学部医動物学教室) 46. 10. 11 受理

resmethrin と prothrin は既存のピレスロイドに比べて高い殺虫効力を有し、とくに resmethrin はイエバエに対し allethrin の31倍の効力があった。噴霧テストの結果、イエバエとアカイエカに対する速効性は平行的に tetramethrin > pyrethrins > prothrin > allethrin > resmethrin の順に低下するが、致死効果は resmethrin と prothrin がきわめて大きく、実用的にもすぐれたピレスロイドであることが認められた。

最近、ピレスロイドの合成が急速に進展し、いくつかのすぐれた殺虫効力をもつ新ピレスロイドが発表されている。天然ピレトリンや多くの合成ピレスロイドが速効性を有する反面、致死効力には乏しい欠陥がみとめられ、実用的には共力剤の混用によって殺虫効力を補強することが必要とされた。1967年、Elliott ら³⁾によって合成された resmethrin (chryson, NRDC-104) は卓越した致死効力をもつことで注目され、奥野ら⁷⁾、Brooks ら¹⁾、林¹⁰⁾、Fujimoto ら⁴⁾、によって確認された。Brooks ら¹⁾によると、Penick's laboratory で行われた実験では40種類の昆虫に対し有効であったと記述されている。prothrin は1969年に Katsuda ら⁹⁾によって合成され、その殺虫特性は大神ら⁸⁾により発表されているが、とくに燻蒸剤としての効力は抜群であるといわれる。

本報告は、これらふたつのピレスロイドのイエバエ及びアカイエカに対する効力を、在来のピレスロイドと比較検討したもので、さらにエアゾールとしての実用性について2,3の実験を行なったので、その成績を報告する。

実験材料及び方法

1. 供試薬剤

resmethrin: 5-benzyl-3-furyl-*dl-cis, trans*-chrysanthemate 住友化学工業株式会社で製造された純度 92.9%.

prothrin : 5-propargylfurfuryl-*dl-cis, trans*-

* 本報告の概要は昭和46年4月4日第23回日本衛生動物学会大会 (東京) で発表。

chrysanthemate 住友化学製造, 純度 83.4%
tetramethrin : 住友化学製造, 純度 85%
allethrin : 住友化学製造, 純度 92.5%
pyrethrins : ケニア産, total pyrethrins 25%のエキス

2. 供試昆虫

イエバエ *Musca domestica vicina* Macq. : 当研究室で累代飼育中の高槻系メス成虫。

アカイエカ *Culex pipiens pallens* Coquillett : 1969年奈良県御所市で採集し、以後累代飼育中のコロニーで、メス成虫を供試した。但し、エアゾール試験では大岡山系のメス成虫を用いた。

3. 実験方法

1) 微量滴下法 : 供試昆虫をエーテルでかるく麻醉し、胸背に microsyringe を用いて供試薬剤のアセトン溶液を 0.9 μ l または 0.74 μ l づつ滴下する。処理した昆虫は、砂糖水を浸した脱脂綿を餌として入れた直径 9cm、深さ 6cm の腰高シャーレに20匹づつ入れ、25°C で約24時間経過後に生死を判別した。

2) 噴霧降下法 : 実験の装置や方法は前報²⁾と同様である。1回の実験には15匹を供試し、1濃度について5回以上くりかえし、実験中の温度は25°C 前後に保つようにした。

3) 0.5m³ 箱型装置法 : 林ら⁸⁾が記載したとおりで、前面中央部の噴射口から供試エアゾールを2秒間噴射し、10秒経過後に供試虫を放ち、時間の経過にともなうノックダウン虫数を観察した。10分経過後に、餌をいれた清潔な容器に移し、24時間後の生死を判別記録した。

Table 1. The toxicities of pyrethroids applied topically to house fly and house mosquito. $-LD_{50}$ values/insect (μg).

Pyrethroids	<i>Musca domestica vicina</i>	Relative effectiveness	<i>Culex pipiens pallens</i>	Relative effectiveness
Resmethrin	0.0192	31.406	0.0032	6.094
Prothrin	0.163	3.699	0.0042	4.643
Allethrin	0.603	1.000	0.0195	1.000

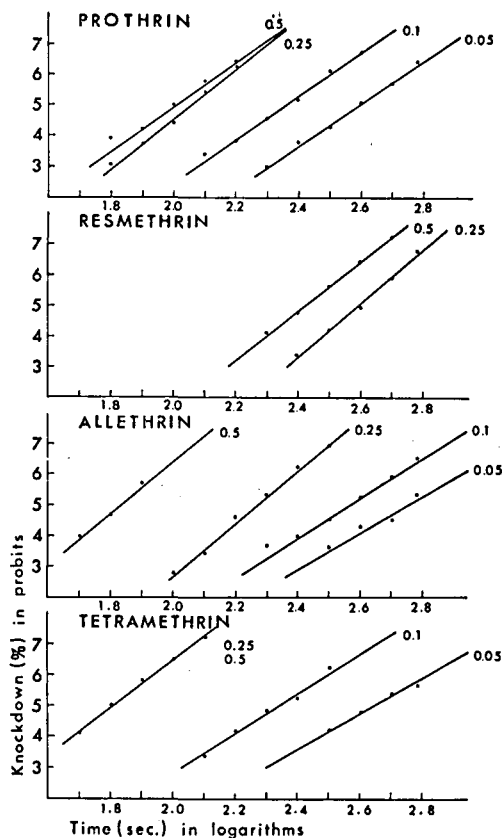


Fig. 1. The relation between time and percent knockdown of adults of the house fly applied with prothrin, resmethrin, allethrin and tetramethrin.

4) DS型装置法: この方法はベルギーの Detroux et Seutin により考案され, 林ら⁹⁾ が記載した方法によった. 装置内に供試エアゾールを2秒間噴射し, 10秒経過後に, 直径9cm, 深さ5cmの容器に供試虫をいれ, 16メッシュの金網ぶたをして5秒間通過せしめ, 別の場所に移して, 30分, 4時間, 24時間後のノックダウン虫数を観察した.

実験結果と考察

1. 微量滴下法による効力比較

高槻系イエバエと御所コロニーのアカイエカに対する LD_{50} 値を第1表に示す. イエバエにおいては resmethrin は allethrin の31倍, prothrin では3.7倍の効力を示している. これは高槻系イエバエの resmethrin に対する感受性が NAIDM 系⁷⁾ のそれとほぼひとしいことを示す.

アカイエカでは, resmethrin は allethrin の6.1倍, prothrin では4.6倍の効力を示す. 大神ら⁹⁾ は, 大日本系(大阪府豊中市産)のアカイエカのピレスロイドに対する感受性は, この成績に比べて約10倍抵抗性であり, 淘汰の過程などは不明であるが, 注目すべきことといえる. しかし prothrin/allethrin の効力比は大神ら⁹⁾ の成績では3.9倍であるから, この成績の4.6倍とは大差がない. したがって, ピレスロイド抵抗性のアカイエカは, 同一基本骨格をもつ菊酸エステル類にはすべて抵抗性であるのかも知れない.

2. 噴霧降下法による効力比較

ピレスロイド石油液(0.025~0.5%)の噴霧テストによるイエバエ及びアカイエカに対するノックダウン効果および致死効果について比較検討した.

各種濃度のピレスロイド石油液のイエバエに対する時間-ノックダウン虫数率の関係を第1図に示す. Finney の図解法により KT_{50} 値を求め, また24時間後の死虫率を要約したのが第2表である.

第2表の成績にもとずいて, 葉液の対数を横軸にとり(ケロシン100cc中に含まれるピレスロイドの葉量mgで示す), KT_{50} の対数をたて軸にとって, 各ピレスロイドの時間-濃度の中央致ノックダウン虫率曲線を作図したのが第2図である. これらの曲線は, ある濃度範囲内では直線的な関係がみられる. 高濃度になると, この直線が折れ曲っており, ふたつの折線にわかれる点は最大の効力値を示す濃度と考えられるが, resmethrin を除いて250mg(0.25%)の濃度であらわれている. この濃度での KT_{50} 値から対 allethrin の相対効力比を求めてみると, tetramethrin が2.9で最も速効性であり, prothrin の1.6がこれに次ぎ, resmethrin は allethrin の $\frac{1}{2}$ の効力を示す.

しかし致死効果では resmethrin と prothrin が最も大きく, tetramethrin, allethrin の順に低下している.

Table 2. The rates of knockdown and mortalities of house flies treated with four pyrethroids by the settling mist apparatus.

Pyrethroids		0.05%	0.1%	0.25%	0.5%
Resmethrin	KT ₅₀	600<	668	394	266
	% kill	18.7	56.2	97.8	100.0
Prothrin	KT ₅₀	384	229	113	101
	% kill	17.4	33.3	96.7	100.0
Allethrin	KT ₅₀	562	371	186	68
	% kill	0.7	2.6	44.3	97.8
Tetramethrin	KT ₅₀	441	218	64	64
	% kill	2.2	1.1	84.1	98.6

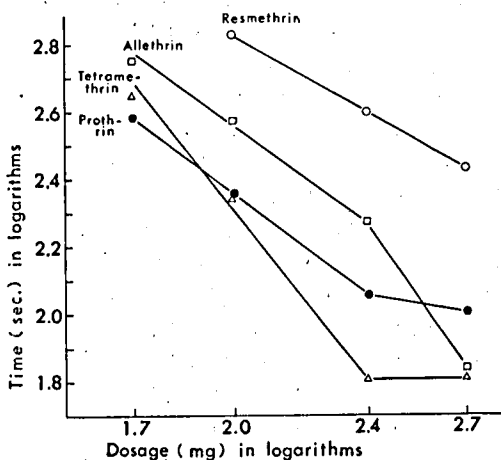


Fig. 2. The relation between log time and log dosage at the 50 percent knock down of adults of the house fly applied with pyrethroids in kerosene (50 mg to 500mg of pyrethroids per 100 cc of solvent).

アカイエカに対する効果を、イエバエの場合と同様に示したのが第3図、第3表である。速効性に関しては prothrin は allethrin の 1.1~1.5 倍の効力を示すが、resmethrin ではかなり劣る。致死効果では resmethrin, prothrin がすぐれている。このように、アカイエカに対するピレスロイドの効力は、イエバエのそれと平行的な関係がみられる。

3. エアゾールによる効力比較

各供試薬剤 0.2% を含むエアゾール剤について、0.5m³ 箱型法及び DS 型装置法によって、イエバエ及びアカイエカに対する効力を観察した。成績を第4表、第5表に示す。

0.5m³ 箱型法によるピレスロイドエアゾールのイエバエに対するノックダウン効果を、KT₅₀ 値で比較すると、tetramethrin が最も速効性であり、つづいて pyrethrins, prothrin, allethrin, resmethrin の順

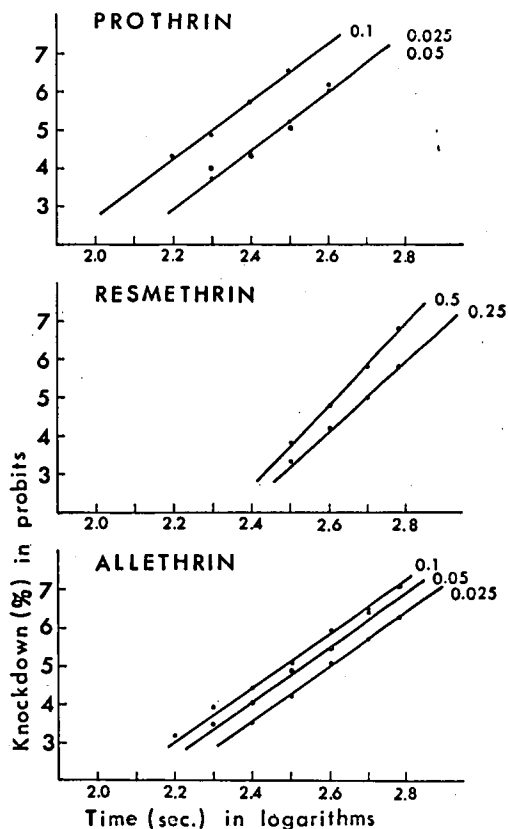


Table 3. The relation between time and percent knockdown of adults of the house mosquito, *Culex pipiens pallens*, applied with prothrin, resmethrin and allethrin.

位になって、tetramethrin と resmethrin との間では 2.3 倍の効力のひらきがあらわれている。アカイエカにおいても同様な傾向がみられ、tetramethrin と resmethrin との間では 3.3 倍の効力のひらきがみられる。エアゾール剤によるイエバエ、アカイエカの致

Table 3. The rates of knockdown and mortalities of house mosquitoes treated with three pyrethroids by the settling mist apparatus.

Pyrethroids		0.025%	0.05%	0.1%	0.25%	0.5%
Resmethrin	KT ₅₀	600<	600<	600<	495	417
	%kill	57.0	90.0	98.9	100.0	100.0
Prothrin	KT ₅₀	299	299	202		
	%kill	72.0	71.8	98.5		
Allethrin	KT ₅₀	403	339	302		
	%kill	14.8	34.3	50.5		

Table 4. Comparative effectiveness of aerosols containing pyrethroid against house flies and house mosquitoes by 0.5m³ box type method.

Pyrethroids	<i>Musca domestica vicina</i>		<i>Culex pipiens pallens</i>	
	KT ₅₀	% kill	KT ₅₀	% kill
Resmethrin	191	98.3	282	100.0
Prothrin	142	100.0	126	100.0
Allethrin	159	85.8	132	100.0
Tetramethrin	82	90.8	88	100.0
Pyrethrins	112	80.0	89	100.0

Table 5. Comparative effectiveness of aerosols containing pyrethroid against house flies by DS-type method.

Pyrethroids	Number of tested	No. of insects tested	Percent knockdown after		
			30 min.	4 hrs.	24 hrs.
Resmethrin	3	144	89.5	95.8	95.8
Prothrin	3	144	29.1	4.2	2.8
Allethrin	3	144	32.6	0	
Tetramethrin	3	144	72.9	13.9	7.6

死率は全般的にたかいが、prothrin と resmethrin ではとくにたかい。

DS型装置法によると、イエバエの時間一致ノックダウン虫数率は resmethrin 以外では時間の経過とともに小さくなっている。これは、いったん薬剤の被毒によって麻痺した個体が蘇生したためである。これに対し、resmethrin では時間がすすむにつれてノックダウンする個体がふえ、蘇生することなく致死への転帰をとるものと思われる。奥野ら⁷⁾、Fujimoto ら⁸⁾は、Peet-Grady 法により各種ピレスロイドのエアゾール剤について、イエバエに対する効果をしらべた。それによると resmethrin のノックダウン効果は、最初は他のピレスロイドよりも劣るが、最終的にはピレトリンと同等の効果であらわし、ノックダウンした個体の蘇生率は他のピレスロイドに比較してはるかに少なかったという。これと全く同様な傾向を示すことが Brooks ら⁹⁾によっても報告されている。

以上の成績を総括すると、resmethrin, prothrin は既存のピレスロイドに比べて高い殺虫性がみとめられ

実用的にもすぐれたピレスロイドであると思われる。

ま と め

1. resmethrin, prothrin のイエバエとアカイエカに対する効力を、allethrin, tetramethrin, pyrethrins などと比較検討した。

2. 微量滴下法による各ピレスロイドの LD₅₀ 値を allethrin と比較すると、イエバエにおいては resmethrin は 31.4 倍、prothrin は 3.7 倍の効力を示し、アカイエカではそれぞれ 6.1, 4.6 倍の効力を示した。

3. 噴霧降下法によりピレスロイド石油液のノックダウン効果をみると、速効性に関してはイエバエ、アカイエカとも平行的に tetramethrin, prothrin, allethrin, resmethrin の順に低下するが、致死効果では resmethrin と prothrin がとくに大きかった。

4. 実用的な剤型として 0.2% の各ピレスロイドエアゾール剤について効力を比較した。速効性に関しては prothrin は tetramethrin や pyrethrins には劣るが、allethrin よりもすぐれており、resmethrin,

prothrin の致死効果はとくに大きく、実用的にもすぐれたピレスロイドであると思われる。

文 献

- 1) Brooks, I. C., J. Haus, R. R. Blumenthal and B. S. Davis : *Soap & Chem. Spec.* 45, 62 (1969).
- 2) 武衛和雄, 浅田四郎, 児玉昌克, 蓮生明郎, 大森嶺男 : *防虫科学*, 30, 37 (1965).
- 3) Elliott, M., A. W. Farnham, N. F. Janes, P. H. Needham and B. C. Pearson : *Nature* 213, 493 (1967).
- 4) Fujimoto, K., T. Kadota, Y. Fujita, Y. Okuno and H. Koda : *Rept. International Aerosol Congress in Tokyo*, 23 pp. (1970).
- 5) Katsuda, Y., T. Chikamoto, H. Ogami, H. Hirobe and T. Kunishige : *Agr. Biol. Chem.* 33, 1361 (1969).
- 6) 大神 弘, 吉田安俊, 勝田純郎, 宮本純之, 門田忠臣 : *防虫科学*, 35, 45 (1970).
- 7) 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).
- 8) 林 晃史, 廿日出正美, 山口 宏 : 殺虫剤の効力試験法に関する研究論文集, 50, 防疫殺虫剤協会, 東京 (1968).
- 9) 林 晃史, 廿日出正美 : *衛生動物*, 20, 42 (1969).
- 10) 林 晃史 : *衛生動物*, 20, 261 (1970).

Summary

The knockdown and lethal effects of new pyre-

throids, resmethrin and prothrin were compared with those of allethrin, tetramethrin and pyrethrins against adults of the house fly, *Musca domestica vicina* Macq., and the house mosquito, *Culex pipiens pallens* Coquillett.

The results of experiments were as follows :

1. The toxicities of resmethrin and prothrin were evaluated by the topical application test. Resmethrin was 31 times as toxic to adult female house flies as allethrin and 6.1 times to house mosquitoes. Prothrin was 3.7 times as toxic to house flies as allethrin and 4.6 times to house mosquitoes.

2. By the settling mist apparatus method, the knockdown effect of tetramethrin was the most effective among four pyrethroids, and prothrin, allethrin and resmethrin were followed. On the other hand, the lethal effects of resmethrin and prothrin were the most excellent.

3. Insecticidal activities of resmethrin and prothrin containing aerosol formulations were compared with those of other pyrethroids. In the knockdown effect, prothrin was inferior to tetramethrin and pyrethrins, but it was more effective than allethrin. In the lethal effect, resmethrin and prothrin were found to be superior to other pyrethroids.

抄 録

イエバエの性フェロモンの単離, 同定, 合成.
Sex Attractant Pheromone of House Fly:
Isolation, Identification and Synthesis.
D. A. Carlson *et al.*, *Science* 174, 76 (1971).

雌のイエバエ *Musca domestica* L. の糞ならびに体表より, その雄を誘引する性フェロモンが単離され muscalure と名づけられた物質が, (z)-9-tricosene であると同定された。この性フェロモンは実験室で飼育され, 性的に成熟した雌のイエバエ (Orland Regular strain) の体表をヘキサンまたはエーテルで洗浄した洗液中より単離された。

単離および構造決定は, ケイ酸カラムクロマトグラフィー, 硝酸銀処理シリカゲル TLC, ガスクロマトグラフィー, 分取ガスクロマトグラフィー, 質量分析, ミクロオゾン分解などによりなされた。またその物質は Wittig 反応を使って合成された。

生物検定の結果は, 一応天然物の活性が (z)-9-tricosene と同定された C_{23} monoolefin によることを示しているが, cuticular monoolefin C_{23} 100 μ g により30分間に誘引された雄バエが23.0%, また合成 (z)-9-tricosene 100 μ g に誘引されたものが26.9%と一般的な性フェロモンの概念から言うとその誘引率は低い。しかしながら長時間すなわち60分ならびに90分の間に誘引される雄はそれぞれ61%, 76%と高率になり, またこの天然ならびに合成物を濾紙につけ olfactometer 内に入れることによりその近辺の雄は明らかに性的に興奮し交尾行動の回数が増加することが観察された。muscalure は他の性フェロモンと比較して強力な誘引力は持っていないが, 生産費が安価な点を考慮すると遍在するイエバエを駆除するのに必要な殺虫剤の量を減らすのに有効な手段となり得るかもしれない。(山岡亮平)