

Toxic Properties of NS 2662 against the American Cockroach and the Mouse.¹⁾ Tadashi MIYATA and Tetsuo SAITO (Laboratory of Applied Entomology, Faculty of Agriculture, Nagoya University, Nagoya (Received December 9, 1967. *Botyu-Kagaku*, 33, 13, 1968 (with English Summary).

3. NS 2662 のワモンゴキブリおよびマウスに対する中毒症状¹⁾ 宮田 正, 斎藤哲夫 (名古屋大学農学部害虫学教室, 名古屋市) 42. 12. 9 受理

NS 2662 のワモンゴキブリおよびマウスに対する中毒症状をしらべた。

LD₅₀ および LD₉₅ の薬量で NS 2662, trichlorfon および dichlorvos をワモンゴキブリに処理した時, ワモンゴキブリはいわゆる有機燐殺虫剤特有の, 興奮, けいれん, まひ, 死という中毒過程を示した。この結果にもとづいて leg-jark 法によりワモンゴキブリの中毒症状を解析したところ, 有機燐殺虫剤や塩素系殺虫剤を処理したワモンゴキブリは, 激しい興奮, けいれん症状を示し, また死亡した。Rotenone, フッ化酢酸ソーダや青酸カリを処理した時には, 殆んど興奮症状を示すことなくまひ症状を呈した。

マウスに DMVP をはじめ, 各種の有機燐殺虫剤やフッ化酢酸ソーダを投与した時には激しい興奮, けいれん症状を示したが, NS 2662 を投与した時には有機燐剤中毒によりあらわれる興奮, けいれん症状を示さずに, まひ状態になり死亡した。NS 2662 の LD₅₀ は約 2,600mg/kg で, 非常に低毒性であった。

現存する浸透殺虫剤の多くは, アブラムシ等の吸水性口器を有する害虫には有効であるが, ニカメイガ幼虫等の咀嚼性口器を有する害虫には効果が低い。そこで Saito and Honda²⁰⁾ は咀嚼性口器を有する害虫に有効な浸透殺虫剤の探究を行ない, NS 2662 (O, O-dimethyl 2,2-dichloro 1-hydroxyethyl phosphonate) が吸水性口器を有する害虫のモモアカアブラムシ *Myzus persicae* Sulzer 成虫よりも, 咀嚼性口器を有するハスモンヨトウ *Prodenia litura* Fabricius 幼虫に対し強い浸透殺虫力を示すと報告した。また池田¹⁹⁾ は, NS 2662 はマウスに対し急性経口毒性が低く, その中毒症状が一般の有機燐殺虫剤と異なり, 中枢神経の刺激による異常興奮を示すことなく, 軽度の筋収縮とけいれんを起こし, まひ, 死亡するとのべている。

DuBois *et al.*⁹⁾ は parathion をマウス, ウサギ, ネコやイスに投与し, 薬量により中毒症状はやや異なるが, 動物の種による違いは認められなく, 排尿, 排便, 流涎等の副交感神経刺激による中毒症状が顕著であり, 筋肉けいれん, 全身のけいれん, 間代性および強直性けいれんを呈し, まひ, 死亡したと報告している。しかし, DuBois *et al.*⁹⁾ は schradan をラット, マウスあるいはモルモットに投与した時には, 副交感神経刺激による中毒症状を示したが, けいれん症状は弱く, 中枢神経刺激による中毒症状は見られなかったと報告している。

有機燐殺虫剤は一般に強い cholinesterase (ChE) 阻害作用を示すことが知られており, このことが殺虫機構における主要な原因と考えられている^{3,10,14,15,16)}。しかし, 例えば malathion は *in vivo* におけるイエバエやワモンゴキブリの中毒症状の進行と ChE 阻害とは同調しないため, すべての中毒現象を ChE 阻害作用のみで説明することは困難であろうとされている^{14,18)}。

山崎, 石井²⁰⁾ は, 殺虫剤の作用機構を解明するには, まずはじめにその中毒症状を精細に観察し, それがどの器官の機能変化にもとづくものであるかを推論すべきであるとのべている。そこで本実験では NS 2662 をワモンゴキブリおよびマウスに処理し中毒症状をしらべ, さらに他の化合物のそれと比較を行なった。

本文に入るに先だち, 終始御指導いただいた名古屋大学農学部弥富喜三教授に厚く御礼申し上げると共に, 兼久勝夫, 西沢務, 富田武文部教官, 本多八郎文部技官をはじめ, 実験を行なうにあたりいろいろ御援助いただいた方々に感謝する。また国立衛生試験場油田良雄博士にはマウスにおける経口毒性試験についてご懇篤なご指導を頂いた。深く御礼を申し上げる。

材料および方法

供試昆虫および動物: 実験に用いたワモンゴキブリ *Periplaneta americana* L. 雄成虫は, マウス用固型試料 MC-5 (オリエンタル酵母工業株式会社製) と水とを与え, 25°C 恒温室で累代飼育した東京大学系の羽化後1~2カ月, 平均体重 1g のものである。マウスは財団法人実験動物中央研究所より入手した ICR-JCL 系の生後約30日の雄で, 水と CE-2 型固型飼料 (日本

1) This work was supported in part by the grant of IAEA Contract No.236/RB.

配合飼料株式会社製)を与えて飼育したもので、平均体重は約23gであった。

供試薬剤: NS 2662 は日本化学工業株式会社より、trichlorfon は日本特殊農薬製造株式会社より、dichlorvos は日本曹達株式会社より入手した純度がそれぞれ95%, 90%, 99% 以上のものである。DMVP (*O, O*-dimethyl 2-monochlorovinyl phosphate) は Allen and Johnson¹⁾の方法に準じて、dichloroacetaldehyde と trimethylphosphite から当教室で合成した純度95%以上のものである。Parathion と paraoxon は住友化学工業株式会社、フッ化酢酸ソーダはダイキン工業株式会社より入手した純度95%以上のものである。*pp'*-DDT, γ -BHC および Rotenone は再結晶したものを、青酸カリは片山化学株式会社製の試薬を用いた。

方法: ワモンゴキブリ中毒症状の観察。水のみを与えて24時間絶食させたワモンゴキブリの腹部背板第3-4環節に、プロピレングリコールに溶かした NS 2662, trichlorfon および dichlorvos を 0.4 μ l ずつ、マイクロメーターシリンジを用いて塗布処理した。処理薬量は佐藤、斎藤²²⁾および予備実験より得た LD₅₀ および LD₉₅ の薬量である。処理後は水のみを与え、25°C 恒温室に置き、所定時間毎に中毒症状を観察した。ワモンゴキブリの症状は正常、興奮、けいれん、まひ、死の5段階に分け、容器の中で活発に異常活動をしているもの、あるいはわずかに刺激を与えた時に同様な症状を示すものを興奮、脚をけいれんさせているものをけいれん、触角や尾葉の先端あるいは脚のみをわずかに動かすものをまひ、全く動かなくなったものを死と区分した。個々のワモンゴキブリは、翅の切り方を変えたり、脚に色を塗ったりして標識し、同一の個体を連続的に観察できるようにした。

Leg-jark 法によるワモンゴキブリ中毒症状の記録法。昆虫の行動を記録する方法として Yeager and Swain²³⁾ および Hutzel²⁴⁾ らにより各種の方法が報告されているが、ここでは酒井²¹⁾および森川¹⁷⁾の方法に準じ、後脚の活動を記録する leg-jark 法を用いた。まずカイモグラフの円筒にカイモグラフ用紙をつけ、これにベンゼンを燃焼させた煤を均一につけた。一方水のみを与えて24時間絶食させたワモンゴキブリを背部を下にし、翅をセロテープで固定し、後脚附節に婦人の頭髮の一端をコロジオンで接着し、他の一端を竹製のペンに接着した。こうして後脚の運動をペンに伝え、媒紙上に記録し、記録終了後は速乾性ニス、アルコール、エーテル、トルエンの等量混合液に浸し、固定、保存した。

薬剤処理前の正常時の後脚の運動を約5分間記録した後、薬剤を処理し、所定時間毎に同様に運動を記録

した。NS 2662 (66 γ /g, 240 γ /g), DMVP (3 γ /g, 30 γ /g), trichlorfon (6.4 γ /g, 12.3 γ /g), dichlorvos (3.4 γ /g, 13.2 γ /g), parathion (0.9 γ /g, 1.8 γ /g) および paraoxon (0.75 γ /g, 1.5 γ /g) をプロピレングリコールに溶かし、マイクロメーターシリンジで 0.4 μ l ずつ腹部腹板第1-2環節に塗布処理した。*pp'*-DDT (10 γ /g, 40 γ /g), γ -BHC (5 γ /g, 20 γ /g) および Rotenone (10 γ /g, 30 γ /g) はアセトンに溶かし 0.4 μ l ずつ腹腔内に注射した。Rotenone を 30 γ /g 処理の時には 1.2 μ l 注射した。青酸カリ (20 γ /g, 50 γ /g) およびフッ化酢酸ソーダ (40 γ /g, 80 γ /g) は蒸留水に溶かし、0.4 μ l ずつ腹腔内に注射した。

実験は 22~28°C の室内で行ない、4~5回回復をした。

マウスに対する急性経口毒性与中毒症状。有機燐殺虫剤はプロピレングリコールに、フッ化酢酸ソーダは水に溶かし、1頭あたり、0.2ml ずつ胃ゾンデにより強制投与を行ない、水と固型飼料を与え 20~30°C の室内に置き、中毒症状を観察し、死亡数をしらべた。

結果および考察

LD₅₀ および LD₉₅ の薬量で処理したワモンゴキブリの中毒症状を観察した結果を示すと第1表の如くである。

一般に高薬量で処理した時には、中毒症状の発現がはやく、3種の薬剤に対し、ワモンゴキブリはいわゆる有機燐殺虫剤特有の興奮、けいれん、まひ、死という中毒過程を示した。このことは、NS 2662 がワモンゴキブリに対して他の有機燐殺虫剤と同様な作用をしているように思われる。

中毒症状の発現は、dichlorvos を処理したワモンゴキブリが最も速く、NS 2662, trichlorfon の順序であった。同一個体を連続的に観察した結果からは、けいれんあるいはまひした昆虫が再び正常状態に回復することは認められなかった。まひ状態の期間は、けいれん状態の期間にくらべ長く続いた。

Leg-jark 法による entomogram の代表的な結果を第1図に示す。

更に中毒症状を定量的に解析するため、森川¹⁷⁾の方法に準じ、正常波相対頻度および小波相対頻度を求めた。すなわち、無処理個体の leg-jark の振巾の平均を1とし、処理後各時間における5分間に現われた leg-jark を、処理前の振巾の $\frac{1}{2}$ 以上のものと $\frac{1}{2}$ 以下のものに分け、次の式に従い相対頻度を求めた。

$$\text{正常波相対頻度} = \frac{\text{処理後の振巾が } \frac{1}{2} \text{ 以上の leg-jark の頻度}}{\text{処理前の leg-jark の頻度}}$$

Table 1. Toxic symptoms of American cockroach treated with NS 2662, DMVP or trichlorfon.

Insecticides	Dosages (γ /g)	Toxic symptoms	Time after treatment (Hour)												
			1	2	3	6	9	12	15	18	24	48	72	96	120
NS 2662	240.7	N	45%	40	15										
		H		15	5										
		C	5	45	60	65	40	10	10						
		P			20	30	35	45	30	20	10	5			
		D				5	25	45	60	80	90	95	100		
	66.4	N	100%	65	35	15									
		H		25	45	0	5								
		C		5	10	70	50	45	5						
		P		5	5	5	35	40	70	55	15	5			
		D			5	10	10	15	25	45	85	95	100		
Trichlorfon	12.7	N	95%	90	75	50	20	5	5	5	5	5	5	5	5
		H				10		5							
		C	5	10	20	20	60	50	25	10	5				
		P			5	10	10	15	40	55	50	5			
		D				10	10	25	30	30	40	90	95	95	95
	6.4	N	100%	100	100	95	95	90	70	85	80	80	75	75	75
		H				5			15						
		C					5	5	5	5					
		P						5	10	10	20				
		D										20	25	25	25
Dichlorvos	13.2	N	60%	10	10	10	10	10	10	10	10	10	10	10	10
		H	10												
		C	30	90	90	60	40	25	10						
		P				25	45	55	65	65	35				
		D				5	5	10	15	25	55	90	90	90	90
	3.5	N	55%	85	75	40	40	35	35	35	40	35	40	40	40
		H	45	5	10	10	10	10	10	10	5	5			
		C		10	15	20	15	15							
		P				25	25	30	45	35	30				
		D				5	10	10	10	20	25	60	60	60	60

N; Normal, H; Hyperactivity, C; Convulsion, P; Paralysis, D; Death.

小波相対頻度

$$= \frac{\text{処理後の振巾が}\frac{1}{2}\text{以下の leg-jark の頻度}}{\text{処理前の leg-jark の頻度}}$$

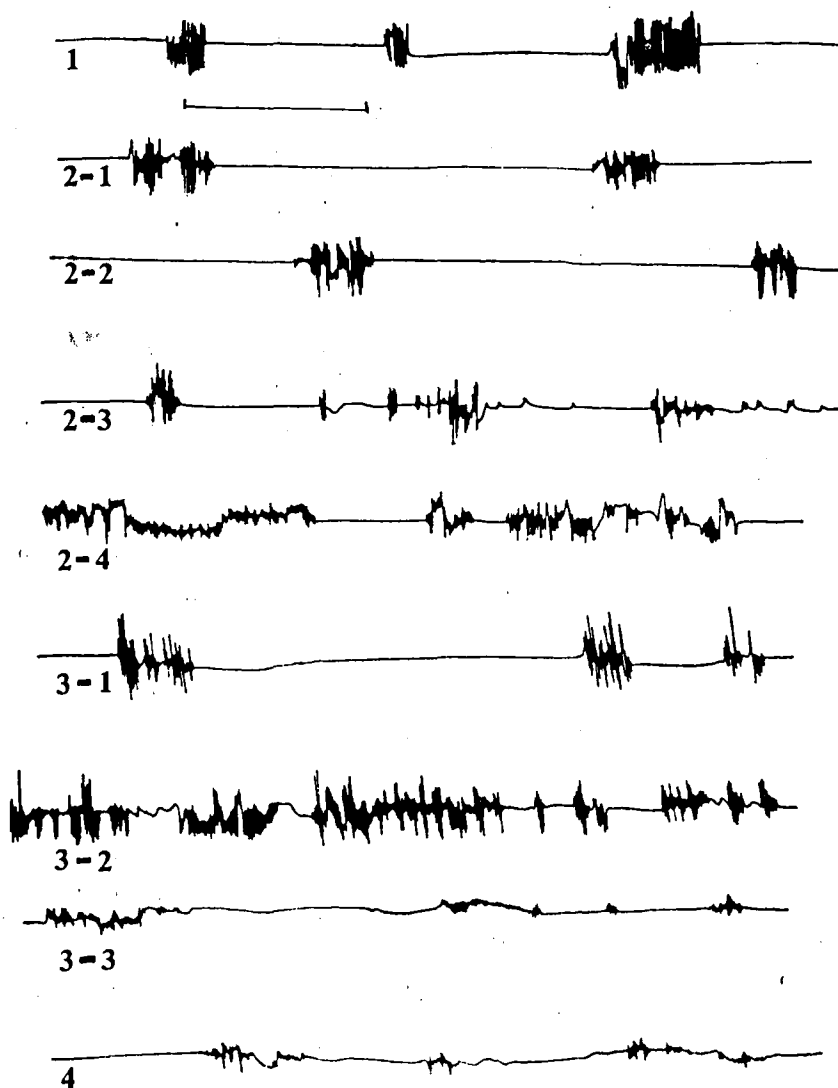
正常波相対頻度が1より大きくなることは中毒症状が興奮状態であり、小波相対頻度が大きければあるほど、けいれん状態が激しいことを示していると考えられる。求めた結果を第2図に示した。

第1, 2図から明らかなように、有機燐殺虫剤や Rotenone, 青酸カリ, フッ化酢酸ソーダはその作用が

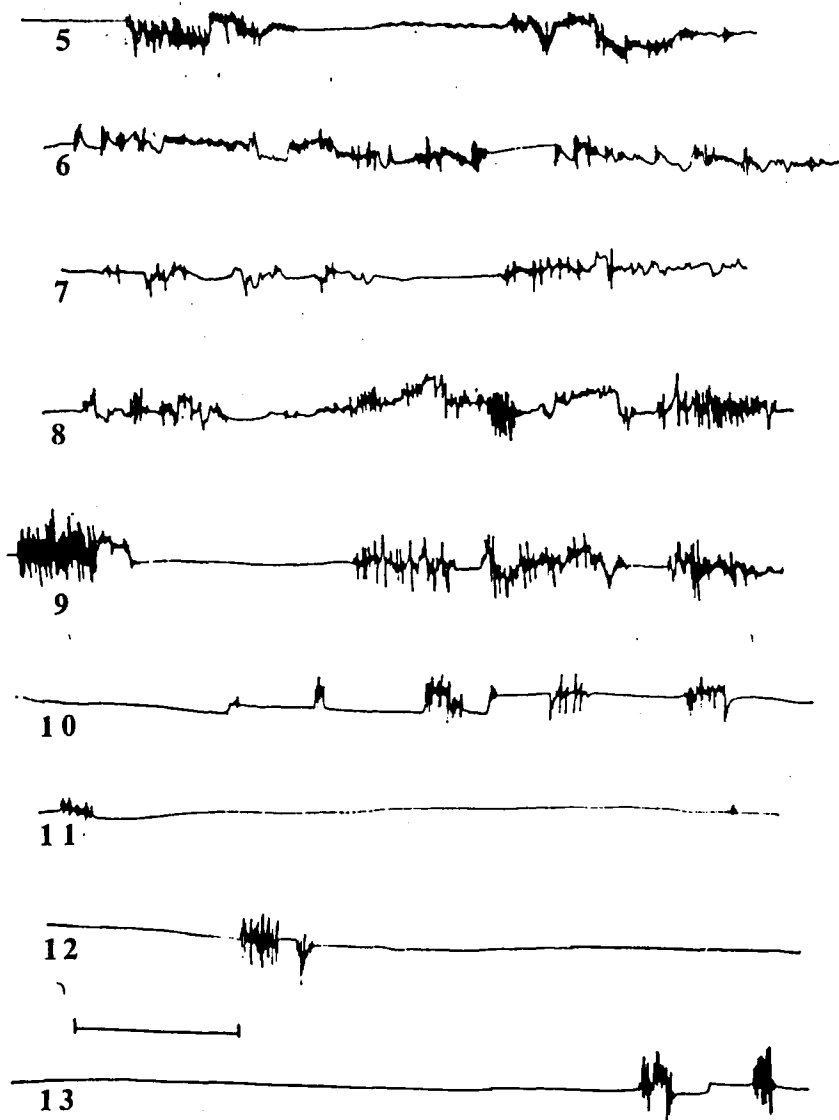
急速であり、塩素系殺虫剤は緩慢である。

NS 2662 を 66 γ /g 処理した時には、余り激しい興奮状態もけいれん状態も示さなかったが、240 γ /g 処理した時には殆んど同時に激しい興奮、けいれん症状を示した。DMVP を処理した時には興奮と殆んど同時に激しいけいれんを呈し、ChE 阻害剤と考えられている有機燐殺虫剤の trichlorfon, dichlorvos, parathion および paraoxon を処理した時にも同様な中毒症状を示した。また DMVP, dichlorvos およ

Fig.1. The entomogram of normal and insecticides-treated male adult of the American cockroaches recorded by the leg-jerk method. The straight line indicates the time in minutes.



- 1 ; Control.
- 2-1; NS 2662, 66 γ /g, after 1 hour.
- 2-2; *ibid.*, after 3 hours.
- 2-3; *ibid.*, after 6 hours.
- 2-4; *ibid.*, after 9 hours.
- 3-1; NS 2662, 240 γ /g, after 30 minutes.
- 3-2; *ibid.*, after 1 hour.
- 3-3; *ibid.*, after 2 hours.
- 4 ; DMVP, 3 γ /g, after 2 hours.



- 5 ; Trichlorfon, 6.4 γ /g, after 18 hours.
- 6 ; Dichlorvos, 3.4 γ /g, after 2 hours.
- 7 ; Parathion, 0.9 γ /g, after 6 hours.
- 8 ; Paraoxon, 0.75 γ /g, after 6 hours.
- 9 ; *pp'*-DDT, 10 γ /g, after 24 hours.
- 10 ; γ -BHC, 5 γ /g, after 24 hours.
- 11 ; Rotenone, 10 γ /g, after 3 hours.
- 12 ; Potassium cyanide, 20 γ /g, after 1 hour.
- 13 ; Sodium fluoroacetate, 40 γ /g, after 1 hour.

び paraoxon を処理した時には、けいれんの後期において、一部の個体で間代性けいれんから強直性けいれんへの変化が見られた。神経毒と考えられている *pp'*-DDT や γ -BHC を処理した場合にも有機磷殺虫剤と同様な中毒症状を示したが、呼吸酵素系の DPNH (還元型 diphosphopyridine nucleotide) から Cytochrome b への電子伝達を阻害するといわれる Rotenone⁹⁾ を 10 γ /g 処理した時には、弱いけいれんを示したが、30 γ /g 処理した時には急速にまひ状態を呈した。TCA サイクル系のアコニターゼ阻害剤であるフッ化酢酸ソーダ¹⁰⁾を処理した時には、小波相対頻度が殆んど増加することなく、昆虫は急激にまひ状態を

示した。また呼吸酵素系の cytochrome b から c への電子伝達を阻害するといわれる 靑酸カリ^{4,5)}で処理した時には、フッ化酢酸ソーダと同様な中毒症状を示したが、靑酸カリを 20 γ /g 処理した時には、6 時間後には中毒症状の回復が見られた。

有機磷殺虫剤や *pp'*-DDT, γ -BHC を多量に処理した時には、少量を処理した時より一般に激しい興奮、けいれんを示し、このことは特に NS 2662 処理の時にはっきり認められた。O'Brien¹⁸⁾ は malathion の殺虫作用はコハク酸化酵素阻害とは考えられないが、malathion はこの酵素をある程度阻害し、malathion によるワモンゴキブリ中毒症状と *in vivo* での ChE

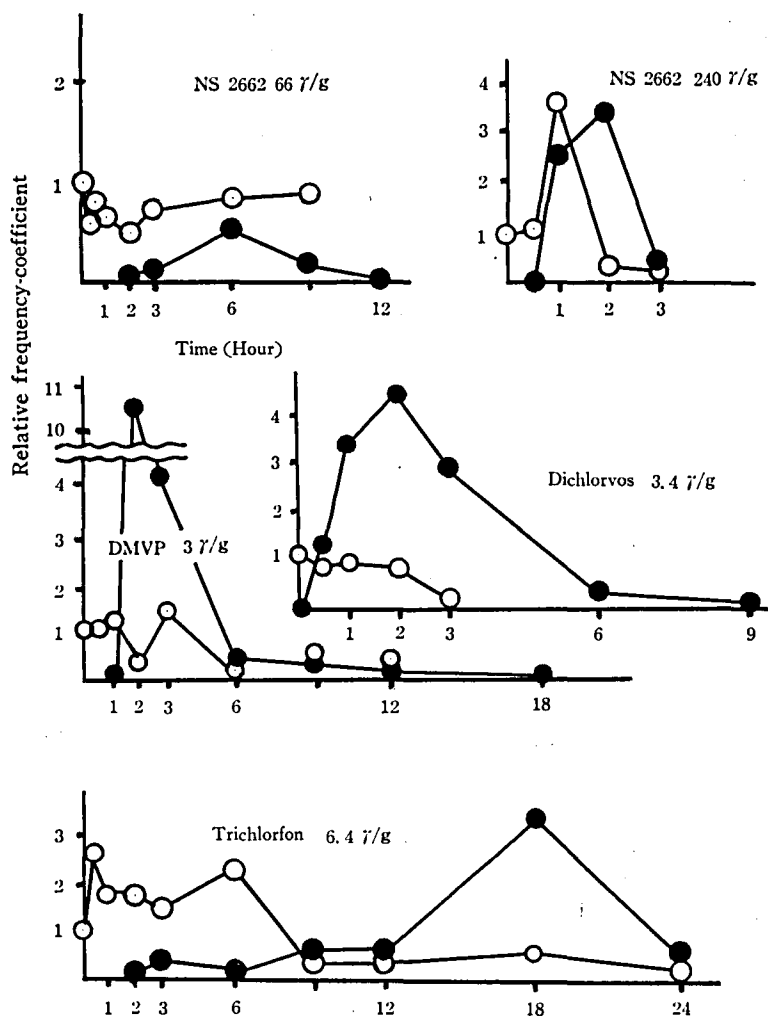


Fig. 2-1. Relative frequency-coefficients of normal and small waves of the leg-jerk.

- Relative frequency-coefficient of normal waves of the leg-jerk.
●—● Relative frequency-coefficient of small waves of the leg-jerk.

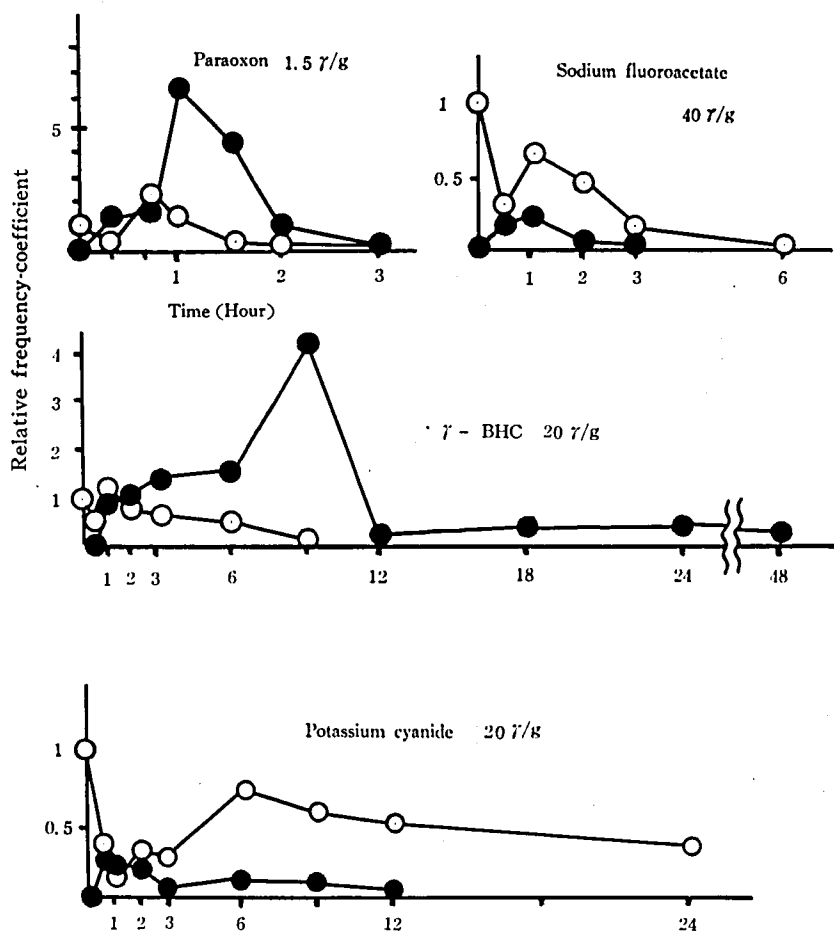


Fig. 2-2. Relative frequency-coefficients of normal and small waves of the leg-jerk.

- Relative frequency-coefficient of normal waves of the leg-jerk.
 ●—● Relative frequency-coefficient of small waves of the leg-jerk.

阻害度が並行でないと報告している^{14,18)}。

第2図において、有機磷殺虫剤および塩素系殺虫剤を処理した時に、一部で余り激しい興奮状態が見られないのは、第1表からも明らかなように、同時に全ての昆虫が興奮状態に入るのではなく、しかもけいれん状態に比べ興奮状態は長く続かないために、数頭の個体を平均して得た正常波相対頻度が、実際にそれぞれの個体で見られるより低くなっているためである。

マウスに対する経口毒性試験結果を第2表に示す。NS 2662 および trichlorfon は共に速効性であった。NS 2662 を投与したマウスは、投与直後は一カ所にうずくまっているが、やがて時々よろめくような歩行をし、再び一カ所にうずくまり時々弱い筋収縮を示し、うずくまったままの状態に死に至る。これは池田¹⁹⁾が NS 2662 の 50% 乳剤を与えてマウスの中毒を観察し

た結果と同じである。trichlorfon を投与した場合には、投与直後は NS 2662 と同様な中毒症状を示すが、軽いけいれんが起った後激しい呼吸を行ない、全身を激しくけいれんさせて死亡する。ワモンゴキブリの時と異なり、NS 2662 および trichlorfon を投与したマウスでは投与後数時間頃より中毒の回復が見られた。DuBois and Cotter⁶⁾ は、マウスで trichlorfon による中毒の回復が速いのは、trichlorfon がマウスにより急速に分解されるためであろうと述べており、Arthur and Casida²⁾ は、trichlorfon はヒト血漿により急速に分解され、その速さは dichlorvos が分解される速さより速いと報告している。

一方、DMVP を1頭当り 6mg 投与した時には NS 2662 の場合と全く異なり、投与後約 20 分で激しい間代性けいれんを呈して死亡した。1頭当り 3mg 投与

Table 2. Acute oral toxicities of NS 2662 and trichlorfon against the mouse.

Dosages (mg/mouse)	NS 2662				Dosages (mg/mouse)	Trichlorfon			
	Time (Hour)					Time (Hour)			
	24	48	72	96		24	48	72	92
96	7/7				38.4	8/8			
76.2	5/10	7/10	7/10	7/10	24.2	6/9	6/9	6/9	6/9
60.8	1/10	1/10	3/10	3/10	19.2	5/10	5/10	5/10	5/10
48	2/10	3/10	3/10	3/10	15.2	2/10	2/10	2/10	2/10
38.1	1/10	2/10	2/10	2/10	9.6	0/10	0/10	0/10	0/10
30.2	0/10	0/10	0/10	0/10					

した時にも同様な中毒症状を示した。Dichlorvos を 1 頭当り 1.9mg 投与した時には、投与直後はよろめくような歩行をするが、やがて激しく全身をけいれんさせ死亡した。またフッ化酢酸ソーダを 1 頭当り 0.4 mg 与えた時は、投与直後はやや興奮して容器内を歩きまわるが、やがて動かなくなり、全身の激しいけいれんの後、投与後約 15 分で死亡した。

投与後、96 時間で死亡率は完全に一定になったので、第 2 表の結果より Van der Waerden の面積法²³⁾により、96 時間後の LD₅₀ を求め第 3 表に示した。毒性試験の結果は、実験者の技術、動物の系統、その他いろいろな条件の相違により、実験者によってその結果に大きな差があるが、Gaines¹¹⁾や油田¹³⁾が報告している如く、本実験においても trichlorfon はマウスに対して非常に低毒性を示した。ここで得た値は彼らの結果とほぼ同様であり、NS 2662 については更に低い毒性を示した。

Table 3. LD₅₀ values of NS 2662 and trichlorfon against the mouse.

NS 2662	2,632 mg/kg (2,110mg/kg~3,283mg/kg)
Trichlorfon	873.5mg/kg (802mg/kg~951.3mg/kg)

NS 2662 がワモンゴキブリに対しては他の有機磷殺虫剤と類似の中毒症状を示すのに対し、マウスに対しては毒性が低く、しかも DMVP とは全く異なった中毒症状を示したことから、ワモンゴキブリとマウスでは NS 2662 の作用機構に違いがあるのではないかと考えられる。

引 用 文 献

- Allen, J. F. and O. H. Johnson: *J. Am. Chem. Soc.*, 77, 2871 (1955).
- Arthur, B. W. and J. E. Casida: *J. Agr. Food Chem.*, 5, 186 (1957).
- Chadwick, L. and D. Hill: *J. Neurophysiol.*, 10, 235 (1947).
- Chance, B.: *J. Biol. Chem.*, 197, 557, 567 (1952).
- Chance, B.: *J. Biol. Chem.*, 202, 383, 397 (1953).
- DuBois, K. P. and G. J. Cotter: *Arch. Ind. Hyg. Occupational Med.*, 11, 53 (1955).
- DuBois, K. P., J. Doull and J. M. Coon: *J. Pharmacol. Exptl. Therap.*, 99, 376 (1950).
- DuBois, K. P., J. Doull, P. R. Salerno and J. M. Coon: *J. Pharmacol. Exptl. Therap.*, 95, 79 (1949).
- Fukami, J. and C. Tomizawa: *Botyu-Kagaku*, 23, 205 (1958).
- Fukuto, T. R.: *Advances in Pest Control Res.*, 1, 147 (1957).
- Gaines, T. B.: *Toxicol. and Appl. Pharm.*, 2, 88 (1960).
- Hutzel, J.: *J. Econ. Entmol.*, 35, 929, 933 (1942).
- 油田良雄: 昭和 37 年度 浸透殺虫剤に関する試験研究成果 61 (1963).
- Mengle, D. C. and J. E. Casida: *J. Econ. Entmol.*, 51, 750 (1958).
- Metcalfe, R. L. and R. B. March.: *J. Econ. Entmol.*, 42, 721 (1949).
- Metcalfe, R. L.: *Organic Insecticides, their chemistry and mode of action*, p. 329, New York (1955).
- 森川 修: 応動昆 8, 1 (1964).
- O'Brien, R. D.: *J. Econ. Entmol.*, 49, 484 (1956).
- Peters, R. A.: *Proc. Poy. Soc. London series B.*, 139, 143 (1952).
- Saito, T. and H. Honda: *Botyu-Kagaku*, 31, 77 (1966).
- 酒井清六: 殺虫剤の連合作用に関する昆虫毒物学的研究 p. 479 東京 (1960).

- 22) 佐藤仁彦・斎藤哲夫：昭和 39 年度応動昆虫大会講演要旨 22 (1964).
 23) 貫文三郎・植木昭和：薬理学実験 p. 193 東京・金原出版 (1952).
 24) 山崎輝男・石井敏夫：応昆 10, 128 (1954).
 25) Yeager, J. S. and R. D. Swain: *Iowa J. Sci.*, 8, 519 (1934).

Summary

The present paper describes symptoms of intoxication with NS 2662 (*O, O*-dimethyl 2,2-dichloro 1-hydroxyethyl phosphonate) in the American cockroach and the mouse.

1) Cockroaches poisoned with LD₅₀ or LD₉₅ doses of NS 2662, trichlorfon or dichlorvos showed hyperactivity, followed by paralysis and finally death. These are the characteristic symptoms of organophosphorus insecticides poisonings.

2) Syndromes of poisoned cockroaches were analysed quantitatively by the leg-jerk method. Cockroaches treated with NS 2662, the dehydrochlorinated compound of NS 2662, *O, O*-dimethyl 2-monochlorovinyl phosphate (DMVP), trichlorfon, dichlorvos, parathion, *pp'*-DDT or γ -BHC showed violent symptoms of hyperactivity, convulsion and paralysis. While cockroaches poisoned with rotenone, sodium fluoroacetate or potassium cyanide paralysed very soon without showing apparent hyperactivity or convulsion.

3) NS 2662 has low mammalian toxicity against mice (LD₅₀; 2,600 mg/kg) and poisoned mice showed no marked hyperactivity, while those treated with DMVP, sodium fluoroacetate, trichlorfon or dichlorvos showed severe hyperactivity and convulsion.

Comparative Study on Saligenin Cyclic Phosphorus Esters and Triphenyl Phosphate in the Specificity of Esterase Inhibition. Hideo OHKAWA, Morifusa Eto and Yasuyoshi OSHIMA (Department of Agricultural Chemistry, Kyushu University Fukuoka, Japan) Received January 31, 1968. *Botyu-Kagaku*, 33, 21, 1968 (with English Summary 24)

4. 環状りん酸エステルと Triphenyl phosphate のエステラーゼ阻害における特異性の比較
 大川秀郎・江藤守穂・大島康義 (九州大学農学部 農芸化学科, 福岡市) 43. 1. 31 受理

Triphenyl phosphate (TPP) と Tri-*o*-cresyl phosphate (TOCP) の代謝生産物であるサリゲニン環状りん酸エステル類のイェバエステラーゼに対する阻害作用を比較した。

TPP のエステラーゼ阻害効果はサリゲニン環状りん酸エステル類に比べて極めて弱く 1 万分の 1 であった。また、エステラーゼ阻害の特異性を寒天ゲル電気泳動法で比較した結果、サリゲニン環状りん酸エステル類は極めて特徴的な Zymogram を示すが、TPP は非特異的であった。

Tri-*o*-cresyl phosphate (TOCP) およびその類縁化合物の *in vivo* におけるエステラーゼ阻害作用はその代謝生産物であるサリゲニンの環状りん酸エステルによることが既に明らかにされている^{1,2)}。一連のサリゲニン環状りん酸エステル誘導体の生理作用を検討した結果は側鎖の長さを変えると異なった作用を示すことが明らかとなった^{3,4)}。メチル誘導体 (K-7)*¹ は cholinesterase (ChE) を阻害して強力な殺虫作用を示すがフェニル誘導体 (K-2)*² は aliesterase (AliE) を特異的に阻害して、殺虫作用は示さず malathion に対して共力作用を示す。

ところが Plapp らは構造的に環状りん酸エステル

には代謝され得ない triphenyl phosphate (TPP) がイェバエの aliesterase を阻害して malathion の共力剤として有効であると報告している⁵⁾。

そこで著者らはイェバエのエステラーゼ類に対する TPP の阻害効果を検討し、さらに TPP とサリゲニン環状りん酸エステル類のエステラーゼ阻害の特異性を寒天ゲル電気泳動法を用いて比較した。

試料および実験方法

試料

阻害剤：TPP は Plapp より供与されたものと当研究室でオキシ塩化りんとフェノールから合成したものを使用した。サリゲニン環状りん酸エステル類 (K-2, K-7) および TEPP は当研究室で合成した^{3,4)}。malaoxon は malathion を *N*-bromosuccinimide で酸化することにより得た。

*1. 2-methoxy-4H-1, 3, 2-benzodioxaphosphorin-2-oxide.

*2. 2-phenoxy-4H-1, 3, 2-benzodioxaphosphorin-2-oxide.