

氏 名	本 田 建 夫 ほん だ たけ お
学 位 の 種 類	農 学 博 士
学 位 記 番 号	論 農 博 第 886 号
学位授与の日付	昭 和 55 年 11 月 25 日
学位授与の要件	学 位 規 則 第 5 条 第 2 項 該 当
学位論文題目	フタラミン酸系およびキナゾリン系化合物の合成と 殺菌活性に関する研究

(主 査)
論文調査委員 教 授 中 島 稔 教 授 深 海 浩 教 授 上 山 昭 則

論 文 内 容 の 要 旨

新農薬創製の研究は多彩かつ複雑な科学分野であり、そのための手法はいろいろ試みられているが、最も一般的に行われているのは経験的に数多くの化合物を合成して、生物試験により新しい生物活性をみつけだす方法である。

本論文は著者が比較的安価な原料であるテトラクロル無水フタル酸を出発物質として、多数のフタラミン酸系化合物を合成し、イネ白葉枯病防除活性と化学構造との関係を調べるとともに、さらに研究を発展させてキナゾリン系化合物の合成を行い、新しい殺菌活性をみつけた研究成果を記述したものである。

(1) テトラクロルフタラミン酸誘導体の合成とイネ白葉枯病防除活性

テトラクロル無水フタル酸に各種アミン類を反応させて約 200 種類のフタラミン酸誘導体を合成した。生物試験にはイネ（品種：金南風）を用い、イネ白葉枯病菌を散布接種した。薬剤処理は接種 3 日前に行い、1 区 3 ポット当り 300 ppm 液を 30 ml 散布し、1 ヶ月後に防除効果を調べた。

一般式(1)で表わされるテトラクロルフタラミン酸誘導体の置換基 R について検討した結果、アルキル基、アラルキル基などは活性が弱く、フェニル基、ナフチル基が勝れていることが判った。とくに *N*-(2, 3-dichlorophenyl)-3, 4, 5, 6-tetrachlorophthalamic acid(II) がイネ白葉枯病菌に対して最も活性が強く、実用化試験にも成功した。

(2) フタラミン酸関連化合物の合成と殺菌活性

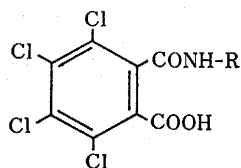
上記の結果から一般式(I)で示す構造式の R をナフチル基またはフェニル基に固定し、フタル酸部の置換基を変えて殺菌活性を調べたが、ハロゲン以外の置換基では活性を示さなかった。そこでイミド体、エステル類、ジアミド体、ビス体、さらにテトラクロルキナゾロン誘導体などを合成したが、いずれも活性を示さなかった。ただ 2-hydroxymethyl benzamide 誘導体は、イネいもち病、キュウリたんそ病に強い防除活性が認められた。

(3) キナゾリン系化合物の合成と殺菌活性

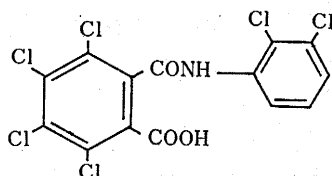
さらに広範囲な植物病原菌にも有効な化合物の探索を試み、3-置換キナゾロン誘導体を合成したとこ

ろ、弱いながらもイネ白葉枯病防除活性を示したので、4-置換キナゾリン類の合成を行い、その中で4-アミノキナゾリン誘導体(Ⅲ)に殺菌活性が認められた。

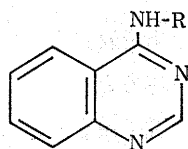
4-アミノキナゾリン誘導体は、アンスラニル酸とホルムアミドを加熱反応して得た4-キナゾロンをオキシ塩化リンで処理し、4-クロルキナゾリンとしたのち、各種アミン類を作用させて約2000種類に及ぶ誘導体を合成して広く殺菌活性を調べたところ、4-[2-(2-methyl-phenoxy) ethyl] aminoquinazoline (Ⅳ)がトマト疫病をはじめとする野菜病害に対して巾広く強い活性を示した。さらにトマト疫病に対する活性と化学構造との関係についても詳細に検討した。



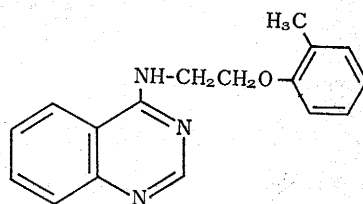
(I)



(II)



(Ⅲ)



(IV)

論文審査の結果の要旨

イネ白葉枯病は国内および国外、とくに東南アジアの稲作地帯で多発しているイネ重要病害の一つである。この病原菌は主としてイネ葉身内部の道管内で増殖して病気をおこすものであるから、たとえ抗菌力の強い薬剤でも菌の生息場所に到達できないものは防除効果が期待できない。したがって、これまで多くの薬剤の開発が試みられたが、まだ特効的に勝れた防除効果をあげるものは見つけられていない。

著者は比較的安価な原料であるテトラクロル無水フタル酸から、200種類に及ぶテトラクロルフタラミン酸誘導体を合成し、ポット試験によるイネ白葉枯病の防除試験を行った結果、*N*-(2,3-dichloro-phenyl)-3,4,5,6-tetrachlorophthalamic acid が顕著な防除効果を示すことをみつけた。本薬剤はさらに種々の実用化試験を行い、勝れた防除効果を示すことが証明された。

著者はさらにイネ白葉枯病菌以外の植物病原菌に対しても有効な化合物を探索するため、フタラミン酸誘導体の構造修飾を精力的に実施し、実に2000種類に及ぶ4-アミノキナゾリン誘導体を合成した。そしてトマト疫病をはじめとする野菜病害の防除試験を試みた結果、いろいろな病害に強い防除効果を有する

化合物をみつけた。

このように著者の行った研究は、これまで困難であったイネ白葉枯病の防除をめざして数多くの化合物を精力的に合成して、勝れた防除効果を有する化合物を発見し、実用化にも成功したものである。そこに至る過程においては、著者の長年の経験に基づいて建てられた実験計画により研究が遂行され、成功をみたものであって、基礎と応用の両面において農薬化学の分野に貢献するところが大きい。

よって、本論文は農学博士の学位論文として価値あるものと認める。