

Reference Cited

- 1) Barbesgaard, P. and Keiding, J.: *Vidensk. Medd. fra Dansk Naturh. Foren.*, **117**: 84(1955).
- 2) Brown, A.W.A.: *Misc. Publ. Ent. Soc. Amer.*, **1**: 20 (1959).
- 3) Bruce, W.N. and Decker, G.C.: *Soap Sanit. Chem.*, **26** (3): 122 (1950).
- 4) Crow, J.F.: *Ann. Rev. Ent.*, **2**: 227 (1957).
- 5) D'Alessandro, G. and Mariani, M.: *Boll. Soc. Ital. Biol. Sper.*, **29**: 687 (1953).
- 6) Davidson, G. and Mason, G.F.: *Ann. Rev. Ent.*, **8**: 177 (1963).
- 7) Harrison, C.M.: *Nature*, **167**: 855 (1951).
- 8) Harrison, C.M.: *J. Econ. Ent.*, **46**: 528 (1953).
- 9) Harrison, C.M.: *R. C. Ist. Sup. Sanita, Suppl.*: 235 (1954).
- 10) Johnston, E.F., Bogart, R., and Lindquist, A.W.: *J. Hered.*, **45**: 177 (1954).
- 11) Keiding, J.: *Ann. Rept., Stat. Skad.-Lab. 1950-1951*: 28 (1953).
- 12) La Face, L.: *Riv. Parassitol.*, **13**: 57 (1952).
- 13) Lichtwardt, E.T.: *J. Hered.*, **47**: 11 (1956).
- 14) Lichtwardt, E.T.: *Ent. Exp. Appl.*, **7**: in press (1964).
- 15) Lovell, J.B. and Kearns, C.W.: *J. Econ. Ent.*, **52**: 931 (1959).
- 16) Maelzer, D.A. and Kirk, R.L.: *Austra. J. Biol. Sci.*, **6**: 244 (1953).
- 17) March, R.B.: *Nat. Res. Council, Publ.* **219**: 45 (1952).
- 18) Milani, R.: *Riv. Parassitol.*, **15**: 513 (1954).
- 19) Milani, R.: *Riv. Parassitol.*, **17**: 223, **18**: 713 (1956).
- 20) Milani, R.: *Boll. Zool.*, **23**: 749 (1956).
- 21) Milani, R.: *Bull. Wld. Hlth. Org.*, **29**, *Suppl.*: 77 (1963).
- 22) Milani, R. and Franco, M.G.: *Symp. Genet.*, **6**: 269 (1959).
- 23) Milani, R. and Travaglini, A.: *Symp. Genet.*, **6**: 213 (1959).
- 24) Norton, R.J.: *Contrib. Boyce-Thompson Inst.*, **17**: 105 (1953).
- 25) Tsukamoto, M.: *Japan. J. Sanit. Zool.*, **13**: 179 (1962).
- 26) Tsukamoto, M.: *Botyu-Kagaku*, **28**: 91(1963).
- 27) Tsukamoto, M.: *Botyu-Kagaku*, **29**: 51(1964).
- 28) Tsukamoto, M.: *Japan. J. Genet.*, **39**: in press. (1964).
- 29) Tsukamoto, M., Baba, Y. and Hiraga, S.: *Japan. J. Genet.*, **35**: 168 (1961).
- 30) Tsukamoto, M. and Hiroyoshi, T.: *Japan. J. Genet.*, **39**: in press (1964).
- 31) Tsukamoto, M. and Suzuki, R.: *Japan. J. Genet.*, **38**: 210 (1963).

抄 録

哺乳動物に低毒性の昆虫不妊剤

Insect Chemosterilants with Low Toxicity for Mammals. S. H. Chang, P. H. Terry and A. B. Borkovec, *Science*, **144**, 57~8 (1964)

Triethylene phosphoramidate (Tepa), Tretamine などの aziridine (ethylenimine) 誘導体が昆虫の雄に対する強力な不妊剤であることはすでに明らかにされている。しかし、これらは突然変異や癌を発生させる (mutagenic and carcinogenic) 可能性が考えられるために、不妊剤として昆虫の撲滅のために実用に供することには難点がある。突然変異をおこさないで、哺乳類に対して毒性の少ない不妊剤を開発することは現在の研究課題である。この意味から、Tepa および Tretamine にそれぞれ化学構造がよく似ている hexamethyl phosphoramidate (HMPA) および hexamethyl melamine (HMM) の雄のイエバエに対する不妊剤として試験された結果はそれぞれ Table 1 及び 2 に示す通りである。HMPA の場合注射法では水

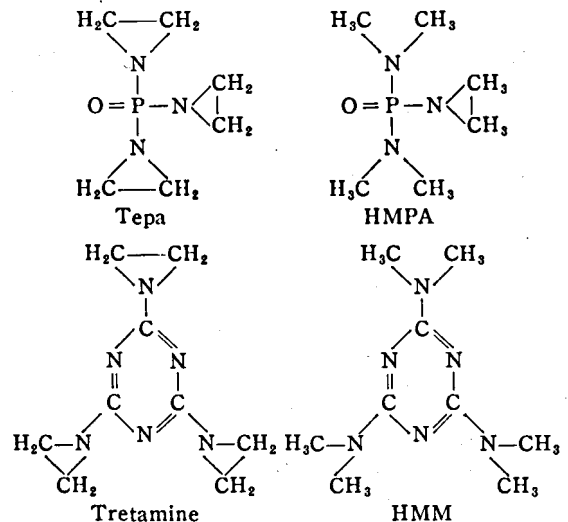


Table 1. Male-sterilizing properties of HMPA administered by different methods; at each concentration ten treated males were mated with five virgin females.

Dosage (μg per fly)	Percentage in food	Total No. of eggs	Sterility (%)
<i>Injection method</i>			
0.5		604	1
1.0		300	3
2.5		535	19
5.0		630	38
10.0		352	86
20.0		161	93
40.0		432	100
<i>Topical application</i>			
5.0		119	31
10.0		844	13
25.0		1123	48
50.0		663	91
100.0		617	99.8
200.0		375	100
<i>Oral application</i>			
	0.01	708	3
	0.05	249	86
	0.25	300	100
	0.50	172	100
	1.00	514	99.9

Table 2. Sterilizing activity of hexamethyl-melamine applied topically to male house flies.

Dosage (μg per fly)	Total No. of eggs	Sterility (%)
10	140	20
20	130	38
40	256	85
60	192	100
80	203	100

溶液、点滴法では $0.85\mu\text{l}$ のアセトン溶液、経口法では食餌中に混入して行われた。HMM の場合は水に不溶であり、点滴法のみアセトン溶液で行われた。HMPA の注射法の結果の Probit 分析による回帰方程式は $y=2.7x+0.32$ であり、雄イエバエに対する ED_{50} は $5.42\mu\text{g}$ である (ED_{50} : 卵のふ化を 50% に減少させる薬量)。注射法によって求められた HMPA のイエバエに対する LD_{50} は $95\mu\text{g}$ で $\text{LD}_{50}/\text{ED}_{50}$ は約 20 となり、HMPA を実用に供する場合のすぐれた点とみられる。また HMPA の哺乳類に対する毒性は LD_{50} 2040mg/kg (rat, 経口法), 1500mg/kg (domestic rabbit, stomach tube 法) であり、不妊剤としては Tapa の 1/50 の効力しかないが、このように低毒性の点ですぐれている。HMM の毒性は LD_{50} 220mg/kg (mice), 265mg/kg (rat) であり nitrogen mustard 類の場合の骨髄中の細胞変化は認められぬ。(深海浩)

雄イエバエの不妊化に対する Tapa, Metapa および Apholate の効力

Quantitative Effects of Tapa, Metapa, and Apholate on Sterilization of Male House Flies. S. C. Chang and A. B. Borkovec, *J. Econ. Entomol.*, 57, 488-490 (1964)

昆虫に対する不妊剤の効力の僅かな違いを微量の試

料で検定できる生物試験法を確立することはその作用機作や化学構造と効力の関係を知るためにも、新しい化学不妊剤の開発のためにも必要であり、表題の 3 種の aziridine 化合物の不妊化の効力の検定が行われた。それらの化合物の種々の濃度の水溶液 $0.855\mu\text{l}$ を雄イエバエに注射しその 10 個体を正常の処女雌 5 個体と一定条件下に共棲させ、10 日間の産卵数と孵化個数から不妊率を求めた。産卵数は条件により変動するが、不妊率は一定であつた。その結果は Table 1. であり、それから求められた効力の比較が Table 2. に示してある。 ED_{50} の比較では Tapa は Apholate の 4 倍、Metapa の 12.5 倍の効力を示す。回帰直線の傾斜は Tapa と Metapa は殆んど同じで、作用機構が同じであることを示唆し、Apholate の傾斜は Tapa の約半分、両者の効力の差は ED_{50} では 1:10 以上となる。Apholate の化学構造は他の二つと相当異り、分子内の aziridine 基の数が Apholate では 6 個、Tapa では 3 個であるから、aziridine 基が不妊の効力の重要な因子であるとしても、その多少が効力と単純に相関するものでないことは明かである。(深海浩)

Table 1. Dose-response data of tapa, apholate, and metapa on male house flies. Ten treated males and 5 untreated females in each cage.

Injected dose ($\mu\text{g}/\text{male fly}$)	No. of egg batches	Total no. of eggs	Sterility (%)
<i>Tapa</i>			
0.01	8	1590	0.9
.05	3	323	20.0
.10	8	1249	47.9
.25	6	1375	90.9
.40	5	631	99.0
.50	4	659	99.7
Control	2	569	0.0
<i>Apholate</i>			
0.025	1	315	0.2
.050	2	537	8.8
.100	2	631	11.9
.250	4	1125	35.5
.500	1	194	43.1
1.000	2	530	79.8
Control	2	569	0.0
<i>Metapa</i>			
0.25	2	624	2.2
.50	3	343	12.8
1.00	2	357	29.8
2.00	3	369	69.5
4.00	2	276	97.8
8.00	3	462	99.3
Control	2	569	0.0

Table 2. Comparison of tapa, apholate, and metapa as chemosterilants to male house flies.

Compound	ED_{50} * ($\mu\text{g}/\text{fly}$)	Relative potency	
		Metapa =1	Tapa =100
Tapa	0.100(0.089-0.113)	13.10	100
Apholate	0.404(0.309-0.574)	3.24	25
Metapa	1.310(1.082-1.570)	1.00	8

* Values in parentheses indicate lower and upper fiducial limits for 95% probability.