

植物
防疫
講座

農薬編-9

ミトコンドリア電子伝達系複合体 I 阻害剤 (METI)

日産化学株式会社 ^{いな}稲 ^だ田 ^{まこと}誠

はじめに

METI 剤とはミトコンドリア電子伝達系阻害剤の中でも複合体 I の阻害剤の総称で、IRAC の作用機構分類ではグループ 21 に位置付けられている。本グループは、21A METI 剤および 21B ロテノンの二つのサブグループから成る (表-1, 農薬工業会ホームページ)。

ミトコンドリア電子伝達系複合体 I は、熱帯性および亜熱帯性植物の *Derris* 属や *Lonchocarpus* 属植物の根や茎から抽出される天然物、ロテノン (図-1) の作用点として古くから知られており、1960 年代後半からの SINGER のグループによる一連の研究によってロテノンの詳細な作用機構がわかってきた (三芳, 1995)。日本お

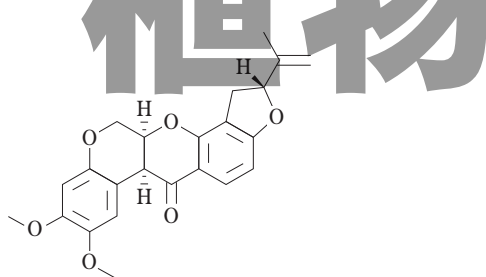


図-1 ロテノンの化学構造式

よび米国の化学会社の研究成果として、本作用点を共有する METI 剤が見いだされることになる。本報ではこれらについて解説する。

I 開発の経緯

1980 年代初頭から中期にかけて日本農薬、日産化学工業 (当時)、三菱化成 (当時)、宇部興産の 4 社において、全く独立に、異なったケミストリーの中から強い殺ダニ活性が発見された。それらは後に、フェンピロキシメート (KONNO et al., 1990)、ピリダベン (HIRATA et al., 1988)、テブフェンピラド (KYOMURA et al., 1990)、ピリミジフェン (Sankyo Company & Ube Industries, 1999) へと最適化され (図-2)、殺ダニ剤として上市された。上市年はフェンピロキシメートとピリダベンが 1991 年、テブフェンピラドが 1993 年、ピリミジフェンは 1995 年であった。

図-3 にフェンピロキシメートの発見の経緯を示す。

本剤の選抜の端緒は、合成の簡便さと、環上に多様な置換基を導入可能であることから、クロロホルミルピラゾール (3-1) に着目した所にある。ここから合成展開を進めた中で、化合物 (3-2) が高い殺ダニ活性を示す

表-1 IRAC 殺虫剤作用機構分類 (一部抜粋, 加筆)

主要グループと一次作用部位	サブグループ あるいは代表的有効成分	有効成分	農薬名 (例) (剤型省略)	標的 生理機能
21 ミトコンドリア電子伝達系複合体 I 阻害剤 (METI) エネルギー代謝	21A METI 剤	フェンピロキシメート	ダニトロン	呼吸
		ピリミジフェン	マイトクリーン	
		ピリダベン	サンマイト	
		テブフェンピラド	ピラニカ	
		トルフェンピラド	ハチハチ	
	21B ロテノン			

Mitochondrial Complex I Electron Transport Inhibitors (METI).

By Makoto INADA

(キーワード: METI 剤, ミトコンドリア電子伝達系複合体 I, フェンピロキシメート, ピリダベン, テブフェンピラド, ピリミジフェン, フェナザキン, トルフェンピラド, 作用機構)