

植物  
防疫  
講座

農薬編-16

グルタミン酸作動性塩素イオンチャンネル  
アロステリックモジュレーター

—アバメクチン系およびミルベマイシン系—

シンジェンタジャパン株式会社 <sup>ふな</sup>船 <sup>だ</sup>田 <sup>たか</sup>剛 <sup>つね</sup>玄

はじめに

本稿では、IRAC (Insecticide Resistance Action Committee) による作用機構分類のグループ6, グルタミン酸作動性塩素イオンチャンネルアロステリックモジュレーター (表-1, 農薬工業会, 2018) について解説する。

本グループの化合物は、放線菌の代謝産物であるアバメクチンまたはミルベマイシンに属する化合物, およびそれらを化学修飾した半合成化合物であり, その化学構造からマクロサイクリックラクトン系またはマクロライド系化合物とも呼ばれる。アバメクチンとミルベマイシンはそれぞれ16員環のマクロサイクリックラクトン構造をもつ一連の化合物群を指す名称であり, これらの化合物は作物・樹木保護のほか, 動物およびヒト用の駆虫薬等, 様々な分野で使用されている。2015年に北里大学特別荣誉教授の大村智博士がノーベル生理学・医学賞を受賞したことは記憶に新しいが, 駆虫薬として実用化されたアバメクチンも, アバメクチンを基にした半合成化合物である。現在, 農業分野においては, アバメクチン, エマメクチン安息香酸塩, ミルベメクチンおよびレピメクチンが商業化されており, 本稿ではこれ

らの化合物に焦点をあてる。

I 開発の経緯

1 アバメクチンおよびエマメクチン

アバメクチンは, 静岡県内の土壌から分離された *Streptomyces avermitilis* の培養液から見いだされた代謝産物である。1970年代に, 北里研究所の研究員が採取した土壌から1976年にメルク社が同放線菌を分離した。発酵物から得られる一連のアバメクチン化合物群は16員環マクロサイクリックラクトン構造をもつことが解明され, 4対の同族体からなる計8種の化合物 (A1a, A1b, A2a, A2b, B1a, B1b, B2a および B2b) が特定された。対となる同族体の化合物名末尾の a が主成分, b が副成分を表し, これらは8:2または9:1の比率で産生される。これらのうちアバメクチン B1 (B1a > 80% と B1b < 20% の混合物) がアバメクチンである (図-1) (KRÄMER et al., 2007)。アバメクチンは幅広い殺虫, 殺ダニ, 殺センチュウ活性を有することが見いだされ, 海外では1984年に南アフリカ共和国で最初に農薬登録が取得された。現在では90か国以上で使用されており, 日本では2013年に商品名アグリメック®として

表-1 日本における農業用殺虫剤の作用機構 (一部抜粋, 改変)

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
6 グルタミン酸作動性塩素イオンチャンネル (GluCl) アロステリックモジュレーター	6 アバメクチン系 ミルベマイシン系	アバメクチン	アグリメック	神経および 筋肉作用
		エマメクチン安息香酸塩	アフアーム	
		レピメクチン	アニキ	
		ミルベメクチン	ミルベノック, コロマイト	

Review of Glutamate-gated Chloride Channel Allosteric Modulators. By Takatsune FUNADA

(キーワード: グルタミン酸作動性塩素イオンチャンネルアロステリックモジュレーター, 殺虫剤, アバメクチン, ミルベマイシン, マクロサイクリックラクトン, マクロライド, アバメクチン, エマメクチン安息香酸塩, ミルベメクチン, レピメクチン)