

カイコ初齢幼虫を用いた高感度な殺虫活性評価系は効率的な農薬シード化合物探索を可能にする/ The establishment of a highly-sensitive insecticidal activity detection system using silkworm first instar larvae enables efficiently search for insecticide seed compounds. ^{1,2)}

1-1. 背景と目的 – ガ類害虫の薬剤耐性化

- 農作物の安定生産には農薬の使用による害虫制御が必須である。
- 同一系統の農薬を連続使用することで起こる害虫の薬剤耐性化が深刻である。
- 農業害虫の一群であるチョウ目害虫(主にガ類)は、薬剤耐性を獲得することが最も頻繁に報告されている(図1)³⁾。
- 薬剤耐性化の獲得を防ぐには、作用が異なる農薬のローテーションが有効である⁴⁾。

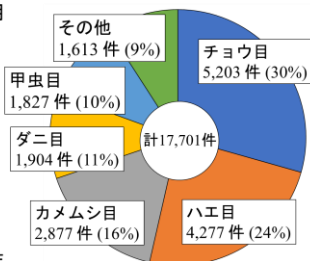


図1. 薬剤耐性化報告数 (-2022年)³⁾

➡ ガ類害虫に有効な新規作用の農薬創製が望まれている。

1-2. 背景と目的 – 農薬シード化合物探索におけるカイコの有用性

- ガ類害虫は化学物質に対する感受性が低く、天然の微量な殺虫活性成分を検出することが困難である。
- モデル生物であるカイコは、他のガ類害虫よりも薬剤感受性が高い⁵⁾。



ガ類害虫に有効な農薬シード化合物の効率的探索を目的として、カイコを用いた殺虫活性評価系の構築と有効性の検証を行った。

3. カイコとガ類害虫における薬剤感受性の比較

作用機序が異なる殺虫剤原体26化合物を用い、カイコ初齢幼虫とガ類害虫の1種であるハスモンヨトウ初齢幼虫との薬剤感受性を比較した。

| 作用分類* | 殺虫剤原体 | ED ₁₀₀ (ppm) | |
|-------|-------------------------------|-------------------------|-----------|
| | | カイコ** | ハスモンヨトウ** |
| 1B | Chlorpyrifos | 10 | 300 |
| 2B | Fipronil | 1 | 100 |
| 3A | Permethrin | 3 | 10 |
| 4A | Imidacloprid | 3 | 1,000 |
| 5 | Spinosad | 0.1 | 30 |
| 6 | Emamectin | 0.003 | 0.3 |
| 7C | Pyriproxyfen | > 1,000 | > 1,000 |
| 9D | Afidopyropen | > 1,000 | > 1,000 |
| 10A | Clofentezine | > 1,000 | > 1,000 |
| 12B | Azocyclotin | 30 | 1,000 |
| 13 | 4,6-dinitro- <i>o</i> -cresol | > 1,000 | > 1,000 |
| 14 | Bensultap | 10 | > 1,000 |
| 16 | Buprofezin | > 1,000 | > 1,000 |
| 17 | Cyromazine | > 1,000 | > 1,000 |
| 18 | Chromafenozide | 0.3 | 10 |
| 19 | Amitraz | 100 | > 1,000 |
| 20A | Hydramethylnon | 30 | 30 |
| 21B | Rotenone | 30 | > 1,000 |
| 22A | Indoxacarb MP | 1 | 3 |
| 23 | Spirodiclofen | > 1,000 | > 1,000 |
| 25A | Cyflumetofen | > 1,000 | > 1,000 |
| 28 | Cyclaniliprole | 0.1 | 3 |
| 29 | Flonicamid | > 1,000 | > 1,000 |
| 30 | Fluxametamide | 1 | 1 |
| 33 | Acynonapyr | > 1,000 | > 1,000 |
| 34 | Flometoquin | 10 | 1,000 |

* IRAC作用機序分類を参照⁴⁾。 ** それぞれ少なくとも3回以上試行した。

- カイコはハスモンヨトウと比較して高い薬剤感受性を示した。
- ハスモンヨトウに殺虫活性を示さない化合物の多くはカイコにおいても活性を示さなかった。

2. カイコ初齢幼虫を用いた殺虫活性評価方法

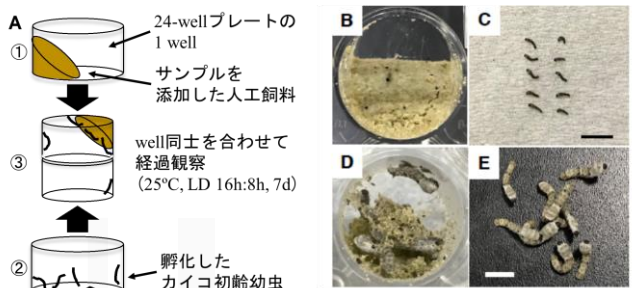


図2. カイコ初齢幼虫を用いた殺虫活性評価方法 Bars: 5 mm.

図2A: カイコ評価系の概略図。B, C: Spinosad 添加群。D, E: 10% DMSO水溶液添加群。B, D: 人工飼料のプレート。C, E: カイコ幼虫の成長度合い。

4. 大村天然化合物ライブラリーを用いたスクリーニング

大村天然化合物ライブラリー⁶⁾から微生物由来の724化合物を用いてカイコに対する殺虫活性物質のスクリーニングを行った。

| 天然化合物 | ED ₁₀₀ (ppm) カイコ** |
|------------------------|-------------------------------|
| Antimycin A complex | 3 |
| Aureothin | 100 |
| Avermectin B1a | < 1 |
| Borrelidin | 3 |
| Chrodrimanin B | 30 |
| Communesin B | 30 |
| Concanamycins A and B | 10 |
| Leucinostatins A and B | 100 |
| Nemadectin | < 1 |
| Nigericin | 100 |
| Octacyclomycin | 30 |
| Oligomycin A | 10 |
| Physostigmine | 30 |
| Staurosporine | 100 |

殺虫活性が報告されている様々な天然化合物は、カイコ評価系においても殺虫活性を示した。

殺虫剤として未開発の作用機序を有する borrelidin (1) に着目した。

5. 総括および結論

- カイコの薬剤感受性はガ類害虫と比較して最大で約300倍高く、薬剤選択性は相関する¹⁾。
- カイコ評価系で活性を示す化合物は、ガ類害虫に対する農薬シード化合物としてのポテンシャルを有する¹⁾。
- 殺虫剤として未開発の作用機序を有する borrelidin (1) の殺虫活性における構造活性相関を解明した^{1,2)}。

References

- ACS Agric. Sci. Technol. **2023**, 3, 278–286.
- ACS Agric. Sci. Technol. in press
- Arthropod Pesticide Resistance Database.
- Pestic. Biochem. Physiol. **2020**, 167, 104587.
- Afr. J. Biotechnol. **2010**, 9, 1771–1775.
- J. Antibiot. **2021**, 74, 266–268.

Lab. of Applied Microbial Chemistry
URL <https://www.kitasato-u.ac.jp/lisci/labo/LoAMC/>