

驅虫剤に関する研究 (第9報)

tert. Butyl-naphthol 及び Biphenyl のプロモ誘導体の ガマ線虫に対する作用

池田 政男, 志茂坂 義明*, 松江 晃
(薬物学教室)

Studies on Anthelmintics. Part 9. Anthelmintic power of Bromocompounds of tert. Butyl-naphthol and Biphenyl on the Toad Worms, *Rhabdias Eufonis*

By Masao Ikeda, Yoshiaki Shimosaka and Akira Matsue

前報¹⁾において余等は naphthalen 核上における
ブロームの数並びに位置の驅虫作用に及ぼす
影響について報告したが、今回は tert. butyl-
naphthol 並びに biphenyl のプロモ誘導体の効
果を 1-bromonaphthol-(2) と比較検索したので
ここに報告する。

本研究に供した被検物質 (第1表) は naph-
thol 誘導体 6 物質及び biphenyl 体 7 物質であ
つて、これらの内文献未記載物質についてのみ
合成法を述べ他は mp (又は bp) を示すに止め
る。

第 1 表

被 検 物 質	融 点 C° () : 沸点	融 点 (研究者名)
6-tert. Butyl-naphthol-(2)	118~119	119~120 (Contractor)
7-tert. Butyl-naphthol-(2)	(135-143/4)	195/20 (Buu-IIoi)
1,6-Di-tert. butyl-naphthol-(2)	139	138~139 (Buu-IIoi)
1-Bromo-6-tert. butyl-naphthol-(2)	66	78 (Buu-IIoi)
x-Bromo-7-tert. butyl-naphthol-(2)*	(154-155/2.5)	.
x-Bromo-1,6-di-tert. butyl- naphthol-(2)*	63~65	.
2-Hydroxy-biphenyl	56~57	56 (Hirsch)
4-Hydroxy-biphenyl	164~165	164 (Hirsch)
x-Bromo-2-hydroxy-biphenyl*	(197/19)	.
3,5-Dibromo-2-hydroxy-biphenyl	56~57	56~57 (Wittig)
3-Bromo-4-hydroxy-biphenyl	96	96 (Robinson)
3,5-Dibromo-4-hydroxy-biphenyl	92~94	96 (Raiford)
4,4'-Dihydroxy-biphenyl	272	272 (Schmidt)

* 文献未載物質

* 専攻科学生

〔I〕 化学的事項：

x-Bromo-7-tert.butyl-naphthol-(2) 7-tert. butylnaphthol-(2) (b.p 135 ~ 143°) 2.5g を二硫化炭素 5cc に溶解し、これにブローム 2g と二硫化炭素 3cc の混液を滴下常温にて反応せしめ、30分間放置後溶媒を溜去し、減圧蒸溜する。黄色油状 b.p_{29.5} 154~155° 得量 1.0g C₁₄H₁₅OBr 計算値 Br 28.62, 実験値 Br 28.41.

x-Bromo-1,6-di-tert. butyl-naphthol-(2) 1,6-di-tert. butylnaphthol-(2) (m.p 139°) 5g を醋酸 80cc に溶解し、これにブローム 3.2g と醋酸 3cc の混液を滴下常温にて反応せしめ、30分間放置後冷水中に投入する。分離する油状物質をベンゼンにとり初めに重曹水次いで酸性亞硫酸ソーダ液にて洗滌、水洗後ベンゼンを溜去、減圧蒸溜し石油エーテルより再結。無色針状晶 m.p 62° 得量 4.1g. C₁₈H₂₅OBr 計算値 Br 23.84, 実験値 Br 23.51.

x-Bromo-2-hydroxy-biphenyl 2-hydroxy-biphenyl (m.p 56~57°) 4g を醋酸 40cc に溶解し、これにブローム 4g と醋酸 8cc の混液を滴下し 30° C, 30分間加温する。冷後溶媒を溜去し残留物をエーテルにとり乾燥後エーテルを溜去し減圧蒸溜すると淡黄色油状物質として得られる。b.p₁₉ 196~197° 得量 2.2g アセチル体：無色稜柱状晶 m.p 65°

C₁₄H₁₁O₂Br 計算値 Br 27.45,
実験値 Br 27.64.

〔II〕 ガマ線虫に対する実験：

(A) In vitro 実験

実験方法は既報で述べた所に準拠し、ガマ線虫について被検物質の 1:1000 懸濁液の殺虫力(虫浸漬より致死に到る殺虫時間)及び標準殺虫濃度を検しそれらの駆虫効力を比較検討した。得たる結果を第 2 表及び

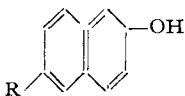
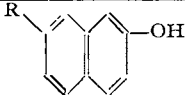
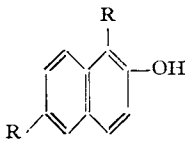
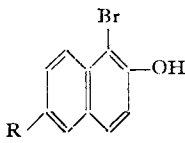
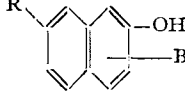
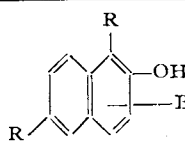
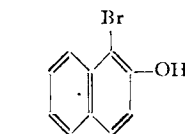
第 3 表に示す。

第 2, 3 表について見るに

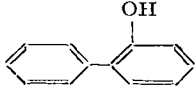
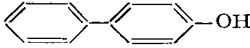
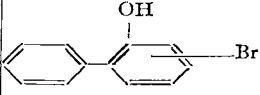
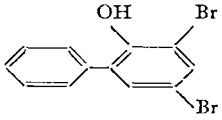
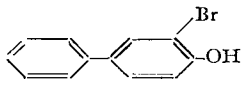
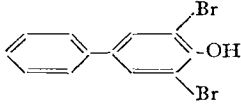
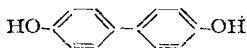
1) tert.butyl-naphthol 誘導体では 7 位に tert. butyl 基を有するものは可成りの殺虫力を有しそのブロモ体も同等の作用を呈したが、他の被検物質中には見るべきものがなかつた。6-tert. butyl-1-bromo-naphthol-(2) と 1-bromo-naphthol-(2) とを比較するに tert.butyl 基を導入することは駆虫効力を減弱するものなることが認められた。

2) biphenyl 体では 2-hydroxy 体及びその

第 2 表

被検物質 $\left\{ R = -C \begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \right.$	殺虫時間(分) (1 : 1,000)	標準殺虫濃度
	>120	無作用 (1 : 1,000にて)
	28	1 : 1,000
	>120	.
	66	無作用 (1 : 1,000にて)
	32	1 : 1,000
	>120	.
	25	1 : 16,000

第 3 表

被 検 物 質	殺虫時間(分) 1 : 1,000	標準殺虫濃度
	5	1 : 4,000
	61	無作用 (1 : 1,000にて)
	2.5	1 : 8,000
	>120	•
	61	無作用 (1 : 1,000にて)
	120	•
	>120	•

monobromo 体が強力な駆虫効力を示した。これに対し 4-hydroxy 体及びその bromo 体は弱く又 2-hydroxy 体の dibromo 体について見るにブロームの数の増加はその効力を減弱するものなることが認められた。

(B) In vivo 実験

γ に tert. butyl-naphthol 誘導体を経口的に 400mg/kg を投与した実験成績 (実験方法: 既報³⁾ 参照) は次の第 4 表のようである。

被検の各物質は可成りの程度迄駆虫作用を呈したが、対照として行つた 1-bromo-naphthol-(2) のそれに比して何れもなお及ばなかつた。

結語:

以上の実験を総合して余等は次の如き新知見に到達した。

1) tert. butyl-naphthol 誘導体は一般に可成りの駆虫効力を示すが、その作用は不確実で 1-bromo-naphthol-(2) のそれに遠く及ばない。

2) x-bromo-2-hydroxy-biphenyl

第 4 表

被 検 物 質	排 虫 率 %	駆 虫 率 %
6-tert. Butyl-naphthol-(2)	27.9	27.9
1-Bromo-6-tert. butyl-naphthol-(2)	26.1	26.2
7-tert. Butyl-naphthol-(2)	14.1	14.1
x-Bromo-7-tert. butyl-naphthol-(2)	27.6	32.4
1-Bromo-naphthol-(2)	94.5	96.6

体は in vivo 実験が未完であるが、in vitro 実験において強力な殺虫効力を示し興味ある物質と考えられる。

欄筆するに当り種々御指導賜りたる教室主任三浦孝次教授に対し衷心より感謝の意を表す。

文 献

- 1) 大橋富次: 金沢大学薬学部薬研報; Vol 4 15 (1954).
2) 三浦孝次等: 金沢大学

薬学部薬研報; Vol 2 56 (1952).

Summary

Six kinds of tert.butyl-naphthol derivatives and seven kinds of biphenyl derivatives were compared with 1-bromo-naphthol-(2) concerning the anthelmintic action on toad worms. As for the anthelmintic action, we could not pick up a better effective substance than that of 1-

bromo-naphthol-(2) among the killing effect of x-bromo-2-hydroxy-biphenyl on the toad worm is weaker than that of 1-bromo-naphthol-(2) but stronger than any other compounds tested.

昭和30年6月30日受理