

驅虫剤に関する研究 (第10報)

豚蛔虫筋脱水素酵素阻害作用について

池田政男, 平信子
(薬物学教室)

Studies on Anthelmintics. Part 10. The Inhibitory Action of Various Substances against the Dehydrogenase in the Muscle of Hog Ascaris.

By Masao Ikeda, Nobuko Hira

余等は前報¹⁾において 1-bromo-naphthol-(2) が豚蛔虫筋脱水素酵素作用に強力な阻害作用を呈することを見出し、これが駆虫作用機転の要素であろうと報告した。この知見に基きより強力な脱水素酵素作用阻害物質を探索し、優秀な駆虫剤を見出さんとして引き続きナフタレン誘導体、チモール誘導体、既知駆虫剤、その他

の物質について、脱水素酵素に対する阻害作用について検索を進め、二三の知見を得たのでここに報告する。

本実験では併せて被検物質のガマ線虫に対する殺虫時間と標準殺虫濃度とを検し、殺虫力と脱水素酵素作用阻害との関連性について追究した。

実験方法

1) 脱水素酵素作用阻害実験 :

前報¹⁾に準拠し、豚蛔虫筋懸濁液を製しその 0.5cc をツンベルグ管にとりこれに 0.1% メチレンブラウ液 0.5cc 及び被検薬物の各種濃度液の 1cc を加え、ツンベルグ管内の空気を抜いて 7mm Hg となし 37.5°C の恒温槽中にて一定の速度で振盪しつつメチレンブラウ染脱色するに至る時間を測定し、被検物質を含まざる

同一の pH を有するそれぞれの対照のそれと比較した。

2) ガマ線虫に対する殺虫時間並びに標準殺虫濃度 :

既報²⁾に述べたところに準拠し、被検物質の 1:1,000 懸濁液にガマ線虫を浸漬し、虫浸漬より致死するまでの時間を測定して殺虫時間とし、又標準殺虫濃度も既報の方法に準じて行つた。

実験成績

hexylresorcinol を 1:1,000 濃度に含有する豚蛔虫筋懸濁液のメチレンブラウ脱色に要する時間を検するに、それと同 pH を有する対照の筋懸濁液のそれに比して約 2 倍の脱色時間の延長

を見た。この hexylresorcinol の 1:1,000 液の示す 2 倍の脱色時間延長効果を標準阻止効果としてこの標準阻止効果を呈する被検物質の最小有効濃度を検した。その結果を第 1 表に示す。

第 1 表

被 檢 物 質	標準阻止効果を示す最小有効濃度	ガ マ 線 虫	
		殺虫時間(分)	標準殺虫濃度
Hexylresorcinol	1:1,000	1~2	1: 4,000
β-Naphthol	1: 600	9	1: 4,000
1-Bromo-naphthol-(2)	1:2,400	10~11	1:16,000
6-Bromo-naphthol-(2)	1:2,400	6~7	1:16,000
1-Chloro-naphthol-(2)	1:2,400	8	1:16,000
1-Jodo-naphthol-(2)	1: 800	•	•
2-Chloro-naphthol-(1)	1:1,600	10	1:10,000
2-Bromo-naphthol-(1)	1: 800	2~3	1:16,000
4-Chloro-naphthol-(1)	1: 800	5	1:10,000
x-Bromo-7-tert.butyl-naphthol-(2)	1: 800	32	1: 1,000
1-Bromo-6-tert.butyl-naphthol-(2)	1: 800	66	無(1: 1,000)
7-tert.Butyl-naphthol-(2)	1: 400	28	1: 1,000
1,6-Di-tert.butyl-naphthol-(2)	無 効	>120	•
2-Nitro-naphthol-(1)	無 効	>120	無(1: 250)
4-Nitro-naphthol-(1)	1:1,600	20	1: 5,000
ac.2-Hydroxy-tetralin	1: 100	>120	無(1: 1,000)
ac.2-Bromo-tetralol-(1)	無 効	>120	無(1: 1,000)
2-Hydroxy-biphenyl	1: 800	5	1: 4,000
x-Bromo-2-hydroxy-biphenyl	1:2,000	2.5	1: 8,000
2-Hydroxy-3,4-dibromo-biphenyl	1: 200	>120	•
4-Hydroxy-biphenyl	無 効	61	無(1: 1,000)
4-Hydroxy-3-bromo-biphenyl	1: 800	61	無(1: 1,000)
4-Hydroxy-3,5-dibromo-biphenyl	無 効	>120	•
Thymol	1: 400	6~10	1: 2,000
4-Chloro-thymol	1:1,600	1~2	1:16,000
4-Bromo-thymol	1: 800	1~2	1:16,000
4-Jodo-thymol	1:1,000	1~2	1:16,000
Chlorcarvacrol	無 効	>120	無(1: 250)
Chenopodium oil	1: 600	•	•
Santonin	無 効	>120	無(1: 250)
Kainic acid	1: 200	•	•
Supatonin	1: 200	•	•
Tetren	無 効	•	•

上表より注目すべき事項を摘記すれば次の如し。

1) 薬物の豚蛔虫筋脱水素酵素作用阻害効果とガマ線虫に対する殺虫効果とは二三の例を除いて概ね平行するの結果を得た。

2) 被検物質中阻害効果の最強力物質は 1-bromo-naphthol-(2), 6-bromo-naphthol-(2), 1-chloro-naphthol-(2) であつてこれらの物質は

ガマ線虫の標準殺虫濃度においても最高の殺虫効果を示した。

3) x-bromo-2-hydroxy-biphenyl 体は前三者に亞いで強力な阻害効果を示した。しかしブロームを 2 個有する場合は既報³⁾の naphthol の場合と同様に阻害効果を減弱することが認められた。又 4 位に OH 基を有するものは 2 位に OH 基を有するものより遙かに劣る。

4) β -naphthol に tert.butyl 基を導入したものはその母体の β -naphthol よりも弱く、これにブロームを導入してもその効果の增强度は僅少に止まつた。

5) thymol 誘導体ではハロゲンを導入することによつて阻害効果が增强しクロールにて最

高の阻害効果を示した。

6) 既知駆虫剤の中では hexylresorcinol, chenopodium oil, β -naphthol, thymol が可成りの阻害効果を示したが、他は微弱か或いは効果が認められなかつた。

結

1) 余等は本実験において 1-bromo-naphthol-(2) が有する強力な脱水素酵素阻害効果を凌駕する如き強力な物質を見出しえなかつた。

2) x-bromo-2-hydroxy-biphenyl の阻害効果は 1-bromo-naphthol-(2) に亘るものであつて

語

naphthol 誘導体以外のものでは最も強力なもので、ガマ線虫に対する優秀な殺虫効果と相俟つて注目すべき物質と思惟する。

擷筆するに当り種々御指導賜わりたる教室主任三浦孝次教授に衷心より感謝の意を表する。

文

- 1) 三浦孝次・池田政男・平信子： 駆虫剤に関する研究（第8報），薬誌投稿中。
- 2) 三浦孝次等： 金沢大学薬学部薬研報，Vol

獻

- 2, 56 (1952).
- 3) 大橋富次： 金沢大学薬学部薬研報，Vol 4, 15 (1954).

Summary

We have studied on the inhibitory action against the dehydrogenase in the muscle of hog ascaris by the well known anthelmintics and the derivatives of naphthol and thymol. It has been found that the inhibitory activity against

dehydrogenase of 1-bromo-naphthol-(2), 6-bromo-naphthol-(2) and 1-chloro-naphthol-(2) is the strongest in the tested compounds, followed by that of x-bromo-2-hydroxy-biphenyl.

昭和30年6月30日受理