

日本における家庭用殺虫剤及び 人体用忌避剤の製品開発動向

大日本除蟲菊株式会社 中央研究所 顧問 南手 良裕

要 約

ここ数年来、日本ではデング熱、ジカウィルス感染症、チクングニア熱等の蚊媒介感染症に対するリスクが高まっており、殺虫剤及び忌避剤の社会的使命がますます重要になっている。日本における家庭用殺虫剤は、蚊取り線香やエアゾール殺虫剤等の「化学遺産」技術を礎として目覚ましい発展を遂げた。例えば、数多くの有用な新規ピレスロイド化合物が実用化され、最近では、社会のニーズに応じて「空間用虫よけ剤(樹脂蒸散剤)」や「ワンプッシュ式エアゾール」等の新しいタイプの製剤が市場に登場し高い支持を得ている。また、人体用忌避剤の分野においては、2015年イカリジンが約50年ぶりに新有効成分として承認され、これを用いた製剤は蚊媒介感染症予防対策に大きく貢献できるものと期待されている。

1. はじめに

家庭用殺虫剤及び人体用忌避剤業界の最近の話題として、(1)大日本除蟲菊(株)が所蔵する「日本における殺虫剤産業の発祥を示す資料」が、2017年3月に日本化学会から「化学遺産」(南手, 2017)として価値ある旨認められ認定を受けたこと、ならびに(2) 2014年8月にデング熱の国内感染が発生したことに伴い蚊防除対策の重要性が認識されるとともに、従来ディートのみ薬事登録が認められた人体用忌避剤の分野において、2015年イカリジン(佐々木・山里, 2017)が約50年ぶりに新有効成分として承認されたことがあげられる。

前記(1)で認定の対象となった物品は、具体的には、①除虫菊栽培書、②棒状蚊取り線香「金鳥香」、③渦巻き型蚊取り線香「金鳥の渦巻き」、④渦巻き型蚊取り線香の試作木型、⑤機械式手巻き用線香押し機、⑥エアゾール殺虫剤、及び⑦ピレトリン類のアルコール部分の立体

構造解明に関わる実験ノートの7資料で、これらは19世紀末から20世紀中頃にかけて製作され、日本の殺虫剤産業の黎明期を支えるとともに、その後の殺虫剤産業の発展に繋がる礎となったものである。

一方、(2)において、人体用忌避剤の有効成分として新たに登録が認められたイカリジンは、ディートにはない有用な特性を備えており、大日本除蟲菊(株)及びフマキラー(株)が2016年から市場導入したイカリジン製剤は、人体用忌避剤としての適用範囲が広がることによって蚊防除対策に大きく貢献することが期待される。

そこで、殺虫剤及び忌避剤の社会的使命がますます高まっている現状を踏まえ、今般、前記話題の内容を盛り込みつつ、家庭用殺虫剤及び人体用忌避剤の製品開発動向について述べてみたい。

日本における家庭用殺虫剤及び人体用忌避剤の製品開発動向

2. 殺虫剤及と忌避剤

(1) 殺虫剤

殺虫剤の対象害虫は、表1に示すように厚生労働省主管の衛生害虫、不快害虫(衣料害虫、建築害虫等を含む)、食品害虫と、農林水産省主管の動物の外部寄生虫、農業害虫とに大きく分類される。そして、衛生害虫を対象とする医薬品殺虫剤もしくは医薬部外品殺虫剤(2009年施行の法改正で“防除用医薬部外品”と表記されることとなった)は薬機法の、また、農業害虫を対象とする農薬は農薬取締法の規制を受けている。一方、不快害虫用の殺虫剤については生活害虫防除剤協議会自主基準に基づいているものの直接許認可を司る法律はない。

衛生害虫とは、病気を媒介して人に疾病をもたらすなど、衛生上の損害を与える昆虫をいい、具体的には、蚊、ハエ、ゴキブリ、ノミ、シラミ、イエダニ、ナンキンムシ、屋内塵性ダニ類、更に最近SFTS(重症熱性血小板減少症候群)の国内感染に関連して追加されたマダニがあげられる。従来、伝染病予防法のもとに、蚊やハエのベクターコントロールが殺虫剤の主たる目的であったが、近年、下水道の普及など環境整備が進むにつれて都市部でのハエの発生は減少し、その発生源は養豚、養鶏等畜舎やゴミ集積場の周辺に限られている。また、居住環境の変化は種々の害虫の生息パターンに大きな影響を及ぼし、例えば、生活様式の変化、冷暖房設備の完備によりゴキブリが家庭内で1年中はびこるようになった。そして、最近のデング熱、ジカウィルス感染症、チクングニア熱等の蚊媒介感染

症の世界的な流行を背景に、蚊防除対策の重要性が叫ばれているのは衆知のとおりである。

一方、主に家庭内に生息あるいは侵入して感覚的な加害を与え、衛生害虫の範疇に含まれない害虫は不快害虫と総称されている。不快という概念やその感じ方は人によって千差万別であって不快害虫の定義付けは曖昧であるが、近年、宅地開発が農村地域や山ろく地域に広がるにつれ、屋外で遭遇したり、屋外から家庭内に侵入してくるアリ類、ハチ類、ケムシ、ムカデ、ユスリカ、カメムシ等の不快害虫の被害、苦情が増加している。特に、幾例かの死亡被害が報告されているスズメバチの脅威は記憶に新しい。

このように、殺虫剤が対象とする害虫の種類や重要度はその時代の社会環境とともに変化し、適用する殺虫剤の分類や剤型もますます複雑になっているのが現状である。近年、昆虫との共生を是とし、殺虫剤よりむしろ忌避剤を志向する傾向もみられるが、快適な生

表1 殺虫剤の対象害虫と法的関係

分類	対象害虫	法的関係	剤型例 [有効成分]
厚生労働省	医薬品 衛生害虫 蚊、ハエ、ゴキブリ、ノミ、シラミ、 イエダニ、ナンキンムシ、屋内塵性 ダニ類、マダニ	薬機法	家庭用一燻煙剤 [ピレスロイド] -エアゾール、粉剤 [有機リン] 防疫用-乳剤、粉剤 [有機リン]
	医薬部外品 衛生害虫 蚊、ハエ、ゴキブリ、ノミ、シラミ、 イエダニ、ナンキンムシ、屋内塵性 ダニ類、マダニ	薬機法	家庭用-蚊取り線香、電気 蚊取り、エアゾール [ピレスロイド] 防疫用-油剤、乳剤、粉剤 [ピレスロイド]
	非該当品 不快害虫 アリ類、ハチ類、ケムシ、ムカデ、 ユスリカ、カメムシ等 衣料害虫 建築害虫	化審法 生活害虫防除剤 自主基準	空間用虫よけ剤(樹脂蒸散剤)、 エアゾール、乳剤、粉剤 [ピレスロイド]、有機リン剤、 カーバメート剤]
	食品添加物 食品害虫 コクゾウムシ、コナストモトキ、 カバコシバムシ等	食品衛生法	燻蒸剤 [メチルプロパイト]
農林水産省	動物用医薬品 又は動物用 医薬部外品 動物外部寄生虫 犬バ、畜鶏舎の蚊、ハエ、 マダニ等	動物用医薬品等 取締規則	蚊取り線香、乳剤、粉剤 [ピレスロイド]、有機リン剤]
	農薬 農業害虫 ヨトウムシ、コガ、コメイト等	農薬取締法	乳剤、水和剤、粉剤 [ピレスロイド]、有機リン剤、 カーバメート剤]

活環境を創生するうえで適時・適量の殺虫剤が必要とされることに変わりはない。

(2) 忌避剤

昆虫や動物が、ある種の化学物質に対して方向性の反応を示すことを走化性という。刺激物質や匂いから遠ざかろうとするのが負の走化性で、この負の走化性を利用して害虫を防除する薬剤が忌避剤である。

忌避剤といえば、蚊、ブユ、アブ、マダニ等の吸血昆虫を対象とし、人体に処理される人体用忌避剤が代表的で、これらは薬機法に基づく医薬品や医薬部外品に該当する。そのほか、虫よけ効果を有する香料成分等を用いた飛翔昆虫の忌避、ゴキブリ等の進入防止、天然由来成分によるダニよけ、動物につく外部寄生虫等の忌避、ハトやカラス等の飛来防止、のら犬やのら猫の進入防止を目的としたものなど、多岐にわたっている。また、イガ、コイガ、カツオブシムシ等の衣料害虫による衣類への加害を防止するために従来からタンクス等で使用されている衣料用防虫剤や、植物体に散布して害虫が植物体を摂食するのを防ぐ摂食阻害剤も広義の忌避剤といえる。

忌避剤と殺虫剤の区別は必ずしも明確でなく、例えば、ピレスロイド系殺虫剤を含む蚊取り線香、電気蚊取り、ファン式蚊取り等の空間処理剤の場合、蚊をノックダウンさせる濃度に達しない低濃度では蚊に対して忌避作

用を示すことが知られており、忌避剤は殺虫剤のより優しい形態ということもできる。また、衣料用防虫剤のなかでも、従来から使用されているパラジクロルベンゼンは衣料害虫に対する忌避作用が効果の主体であるが、近年導入された常温揮散性ピレスロイド系殺虫剤のエムペントリン(Hirano et al., 1973) やプロフルトリン(Ujihara et al., 2004)は衣料害虫に対して高い殺虫効果を示し殺虫剤としての色合いが強い。

3. 家庭用殺虫剤の製品開発動向

(1) 殺虫剤の有効成分

殺虫剤の有効成分の種類としては、ピレスロイド剤、有機リン剤、カーバメート剤、有機塩素剤、ネオニコチノイド系化合物、フェニルピラゾール系化合物等があげられるが、有機塩素剤は残留毒性のため使用禁止となった。家庭用殺虫剤の分野ではピレスロイド剤が主体で90%以上を占め、他には、ネオニコチノイド系化合物(ジノテフラン、イミダクロプリド等)、フェニルピラゾール系化合物(フィプロニル)等が僅かに使用されているに過ぎないので、以下ピレスロイド剤を中心に述べる。表2に示すとおり、ピレスロイド剤は昆虫に対し極めて微量で高い殺虫活性を示す一方、温血動物の体内では速やかに解毒されるため毒性は極めて低い。即ち、表中の他の有効成分に

表2 有効成分の選択毒性

有効成分	毒 性			作用機作
	ラット	昆虫	選択性	
カーバメート剤	45 mg/kg * (15)	2.8 mg/kg * (27)	16	アセチルコリンエステラーゼ 阻害
有機リン剤	67 (83)	2.0 (50)	33	〃
有機塩素剤	230 (21)	2.6 (26)	91	神経軸策に作用
ピレスロイド	2000 (11)	0.45 (35)	4500	〃

* 数字はLD₅₀値の平均、()内は試験データ数。[Elliott,M., ACS Symposium Series 42, 1977]

日本における家庭用殺虫剤及び人体用忌避剤の製品開発動向

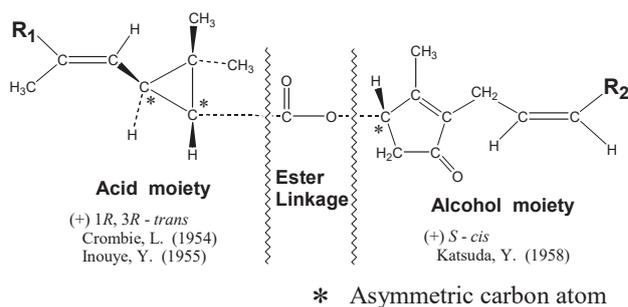
較べて選択性が非常に大きく、家庭用殺虫剤の有効成分として理想的な特長を有している。

(2) ピレスロイド

「ピレスロイド」とは、除虫菊(シロバナムシヨケギク)に含まれる殺虫成分・ピレトリン類及びこれと化学構造のよく似たピレトリン類似の合成化合物の総称である。

除虫菊の原産地は旧ユーゴスラビア(現 クロアチア)のダルマチア地方で、日本に除虫菊が渡来したのは1885年(明治18年)に遡る。現大日本除虫菊(株)の創業者である上山英一郎は、和歌山県で除虫菊の栽培を開始し、今般「化学遺産」に認定された「除虫菊栽培書」を自ら発刊して栽培の普及に努めた。これが日本における殺虫剤産業の発祥である。その結果、1935年(昭和10年)には日本の除虫菊乾花の収穫高は約13,000トンに達し、世界生産量の約90%を占め世界一の輸出量を誇った。しかしその後、除虫菊の主要生産国はオーストラリアのタスマニア、中国の雲南地方、アフリカのケニア、タンザニア、ウガンダ等に移り、また合成ピレスロイドの目覚ましい発展に押されて、現在では殺虫剤に使用されるピレスロイドのほとんどが合成ピレスロイドに移り変わっている。

殺虫成分・ピレトリン類は、図1に示すように、酸成分とアルコール成分からなる6種類のエステル化合物(ピレトリン I、II、シネリン I、II、ジャスモリン I、II)の混合物である。1958年大日本除虫菊(株)の勝田純郎ら(Katsuda et al., 1958)は、それまで未決定であったアルコール部分の不斉炭素の絶対配置を決定してピレトリン類の化学構造の全貌を明らかにしたが、その実験経過を記した「実験ノート」は今般「化学遺産」として認定された。



Compound	R ₁	R ₂	%
Pyrethrin I	-CH ₃	-CH=CH ₂	38
Pyrethrin II	-COOCH ₃	-CH=CH ₂	30
Cinerin I	-CH ₃	-CH ₃	9
Cinerin II	-COOCH ₃	-CH ₃	13
Jasmolin I	-CH ₃	-CH ₂ CH ₃	5
Jasmolin II	-COOCH ₃	-CH ₂ CH ₃	5

図1 天然ピレトリンの化学構造

この化学構造の解明を契機としてピレトリン類の改変研究が世界的に加速し、数多くの合成ピレスロイドが発明された。表3に、現在、家庭用殺虫剤の有効成分として実用化されている主要ピレスロイドの特長と主な用途を示すが、これらは家庭用殺虫剤の種々剤型により適したピレスロイドを求める必要性から開発されたものと言える。

例えば、アレスリン(Schechter et al., 1949)やプラレトリン(Katsuda et al., 1971; Matsuo et al., 1980)はピレトリンに比べて熱に対する安定性が高いため蚊取り線香に適し、天然除虫菊に代わり広く使われるようになった。フタルスリン(Kato et al., 1965)は優れた速効性を持ち、一方、レスメトリン(Elliott et al., 1967)は卓越した致死効果を示すので油剤やエアゾールにはこれらの2成分を混用したものが多し。また、電気蚊取りは、発熱体の温度が120~170℃で、蚊取り線香の燃焼部の温度に比べて低いためアレスリンより低温で揮散するピレスロイドが要求され、蒸気圧の高いフラメトリン(Katsuda et al., 1969)が発見され

た。更に、ゴキブリ等の駆除用として、従来のピレスロイドより残効性の長いフェノトリン (Fujimoto et al., 1973)、ペルメトリン (Elliott et al., 1974) やシフェノトリン (Matsuo et al., 1976) が誕生し、イミプロトリン (Senbo et al., 1995) はゴキブリに特化したノックダウン剤として実用化されている。近年導入されたトランスフルトリン (Mrusek et al., 1995) やメトフルトリン (Ujihara et al., 2004) は、基礎殺虫活性が高いうえ、熱源に頼らずとも送風や遠心力等の僅かな外的エネルギーで揮散が可能なので、ファン式蚊取りや空間用虫よけ剤 (樹脂蒸散剤) 等、特に自然蒸散型殺虫剤の分野で有用性が高い。また、最近では、ハエ用ノックダウン剤として開発されたモンフルオロトリン (岡本, 2016) が、ハチ類等の種々不快害虫に対しても有効であることが確認されている。なお、屋外での耐候性を付与した数多くの農業用ピレスロイド (若しくはピレスロイド様化合物) が開発されているが、そのなかで、より安全性の高い、例えばエトフェンプロックス (Nakatani et al., 1982) やシラフルオフエン (勝

田ら, 1986) は農業用のみならず、家庭用殺虫剤分野への適用も活発である。

(3) 家庭用殺虫剤の剤型と今後の製品開発動向

市販の家庭用殺虫剤の剤型としては、蚊取り線香、電気蚊取り (マット式、液体式)、エアゾール (ワンプッシュ式エアゾールを含む)、燻煙剤、ファン式蚊取り、空間用虫よけ剤 (樹脂蒸散剤)、毒餌剤、粉剤、油剤、乳剤等、種々のものがあり、それぞれの使用目的に応じて最適の有効成分が配合され、剤型上の工夫がなされている。各剤型の特長や使用方法については、例えば「家庭用殺虫剤概論Ⅲ」 (勝田ら, 2006) 等に詳しく解説されているのでそれらを参照していただき、ここでは「化学遺産認定」にちなんだ蚊取り線香とエアゾール、並びに、近年新たな家庭用殺虫剤の剤型として市場に登場し今後の動向が注目されている「空間用虫よけ剤 (樹脂蒸散剤)」 (上山, 2011) と「ワンプッシュ式エアゾール」 (小林, 2015) について述べることにしたい。

(3-1) 蚊取り線香

蚊の成虫駆除を目的とした最も代表的な家庭用殺虫剤は蚊取り線香で、高温多湿の日本及び東南アジア諸国において夏の必需品、風物詩として親しまれている。その原型は、上山英一郎が1890年 (明治23年) に発明した世界初の棒状蚊取り線香「金鳥香」、並びに上山英一郎の妻「ゆき」の発案で1895年 (明治28年) に誕生した渦巻き型蚊取り線香「金鳥の渦巻き」に遡り、これらは化学遺産として認定された。120年以上の歴史を有する、この一見古い商品が、科学の進んだ今日に至るまで

表3 実用化されているピレスロイドと主な用途

一般名	商品名	特長	主な用途
ピレトリン (除虫菊)	ピレトリン	速効性	蚊取り線香、エアゾール、乳剤、粉剤
アレスリン	ピナシン	熱安定性	蚊取り線香、電気蚊取り
ファルスリン	ネビナシン	速効性	エアゾール
レスメトリン	クリロン	致死効果	エアゾール
フラマトリン	ピナシン D	加熱蒸散性	電気蚊取り
フェノトリン	スミスリン	残効性	ゴキブリ用エアゾール、燻煙剤、乳剤、粉剤、シラフルオフエン
ペルメトリン	エクミン	残効性	ゴキブリ用エアゾール、燻煙剤、乳剤
シフェノトリン	ゴキテート	残効性	ゴキブリ用エアゾール、燻煙剤、乳剤
エムベントリン	ペーパスリン	常温揮散性	衣料用防虫剤
アラトリン	エック	加熱蒸散性	蚊取り線香、電気蚊取り、エアゾール
イミプロトリン	ブラル	速効性	ゴキブリ用エアゾール
トランスフルトリン	バイオスリン	自然蒸散性	電気蚊取り、空間用虫よけ剤 (樹脂蒸散剤)、ファン式蚊取り、エアゾール、ワンプッシュ式エアゾール
メトフルトリン	エミネス	自然蒸散性	電気蚊取り、空間用虫よけ剤 (樹脂蒸散剤)、ファン式蚊取り、エアゾール、ワンプッシュ式エアゾール
プロフルトリン	フェアリテール	常温揮散性	衣料用防虫剤
モンフルオロトリン	スミリアーズ	速効性	ハエ用エアゾール、ハチ用防除剤
エトフェンプロックス	トロボン	化学的安定性	乳剤、シロアリ用防除剤
シラフルオフエン	シロネ	化学的安定性	乳剤、シロアリ用防除剤

日本における家庭用殺虫剤及び人体用忌避剤の製品開発動向

広く普及しているのは、マッチ一本で空間処理を時間的にも保持し、燃え尽きるまで効力一定で、非常に合理的な殺虫形態といえるからであろう。また、煙が有効成分のキャリアーとして働き広い空間でも卓越した殺虫効力を示すので、蚊取り線香は庭先で長時間作業する時や公園等でアウトドア活動を行う際などにおいて、蚊媒介感染症対策の面からも利用価値は高い。近年、賦香を施した芳香タイプや、煙量を低減させた微煙タイプなど、市場のニーズに沿った製品開発も積極的に進められている。

(3-2) エアゾール

エアゾールとは、「空中に浮遊する微粒子」のことで、エアゾール殺虫剤は蚊取り線香とともに一般家庭で広く使われている。第二次世界大戦後、アメリカ軍が日本に持ち込んだスプレー缶(Bug bomb)からヒントを得て試作検討が進められ、1952年大日本除蟲菊(株)は企業ベース製造されたエアゾール殺虫剤(化学遺産認定資料)を日本で初めて市販した。その後、エアゾール殺虫剤は、その利便性が受け入れられるとともに製造技術の向上によって目覚ましい進展を遂げた。最近の動向としては、ハエ・蚊用、ヤブ蚊用、ゴキブリ用、コバエ用、屋内ダニ用、ハチ用等と対象害虫ごとに細分化が進み、また、殺虫成分を使用せず噴射ガスの冷却効果を利用してゴキブリを退治するエアゾールが市場に登場するなど、多様化の様相が強い。

(3-3) 空間用虫よけ剤(樹脂蒸散剤)

大日本除蟲菊(株)は、比較的揮散性が高く且つ微量で高い殺虫効果を有するトランスフルトリンやメトフルトリンをプラスチック樹脂に練り込んだ樹脂蒸散剤の用途開発を検討し、

2007年業界初の「空間用虫よけ剤」を市場に導入した。この製剤は、窓辺や玄関に吊り下げたり若しくは網戸に貼り付けたりするだけで、蚊、ユスリカ、チョウバエ等の飛翔害虫の屋外から屋内への侵入を長期間にわたり防止しえることを特長としている。なお、有効成分を樹脂に練り込むのではなく、樹脂繊維に塗布するタイプの樹脂蒸散剤もいくつかのメーカーから市販されているが、練り込み型の方が有効成分を長期間安定して揮散させることができるうえ、耐候性や耐雨性にも優れるのでより好ましい形態と言える。「空間用虫よけ剤(樹脂蒸散剤)」は、市場導入以降年々目覚ましい伸長を遂げ、殺虫剤市場の変革をもたらすとともに、「予防剤」という新たな殺虫剤カテゴリーを形成するに至った。

当初品は使用期間が30～60日であったが、その後市場のニーズが更に長期間用にシフトしたことから、従来平面ネット状であった樹脂成型体の改良が求められた。大日本除蟲菊(株)が開発した「三次元クロスリンクメッシュ」(松元ら, 2014)は、樹脂成型体として「厚みのある立体構造体」を採用し、表面積を大きくして有効成分がより長期間安定して揮散するようになった画期的な技術で、大阪府の発明奨励賞を受賞している。現在、長期間用製品(例えば、150日用、250日用、あるいは1年用等)が主流となっているが、今後も、効率的な揮散システムを目指し、製品開発の動向が注目される分野である。

(3-4) ワンプッシュ式エアゾール

前記「空間用虫よけ剤(樹脂蒸散剤)」の「予防」ニーズの広がりを背景に、従来速効性に重点が置かれていたエアゾールの分野でも予防効果をメインにした新たな製剤開発が進めら

れ、ワンプッシュ式エアゾールの誕生に繋がった。アース製薬(株)とフマキラー(株)によって市場導入された当初品は、室内に1～4プッシュするだけで蚊の駆除効果が8時間ないしは12時間持続するというものであった。その製品設計として、薬剤噴霧粒子を空中に長く浮遊させて飛翔中の蚊との接触を増やそうとする方向性もあるが、大日本除虫菊(株)では、「屋内にいる蚊は飛翔時間に比べて壁や天井等に係留している時間が圧倒的に長い」という蚊の習性に着目するとともに、人やペットが薬剤噴霧粒子を吸入するリスクをできる限り低減させる観点から、薬剤噴霧粒子を壁や天井等に素早く到達・付着させるタイプを設計コンセプトとしている。また、デング熱を媒介するヒトスジシマカが主に昼間活動し、一方、日本脳炎ウィルスを媒介するアカイエカが主に夜間吸血することを考慮すると、その後開発された「24時間持続タイプ」は2種の蚊の活動時間を1個の製品でカバーでき、効率的かつ総合的な感染症予防に有効である。ワンプッシュ式エアゾールは、使用溶剤や噴射ガスの使用量を減らし省資源化の面でもメリットが大きいので、トイレ用消臭剤等の他の分野でも本格的に開発が進められている。

4. 人体用忌避剤の製品開発動向

(1) 忌避剤の有効成分

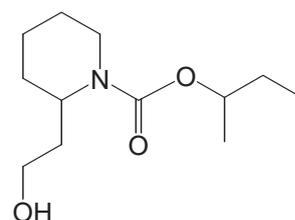
昆虫に対する忌避剤としては、古くはクロシン、クレオソート、ボルドー液等が使用され、最近ではシトロネラ油、ユーカリ油、ヒマラヤ杉のオイル等も使用されている。一般に、アミド、アミドエステル、グリコール、アセタール等の官能基を有するものが効果的と言われ、例えば、ディート、ジメチルフタレート、

ジブチルサクシネート、2-エチル-1, 3-ヘキサジオール等に忌避効果が認められている。なかでも、ディートは、2015年までは人体用忌避剤として薬事登録が認められた唯一の有効成分であり、昆虫スペクトラムが広いこと、皮膚に対する刺激性が極めて弱いこと、安価なこと等から、エアゾール、ポンプスプレー、ジェル等の剤型で、吸血昆虫防除用として長年にわたり汎用され、今なおその需要は大きい。

2015年に人体用忌避剤の有効成分として新たに登録が認められたイカリジンは、図2に示す化学構造を有し1980年代にドイツで開発された。その後、ヨーロッパ、アメリカ、オーストラリア等多くの国で製品化され、人体用忌避剤としての使用実績と高い評価を得ている。イカリジンは、蚊、ブユ、アブ、マダニ等に対してディートと同等以上の忌避効果を奏するとともに、ディートにはない下記のような有用な特性：

- 1) 小児への使用制限・回数制限がなく、乳幼児から大人まで安心して使用可能である。
- 2) ディート特有の嫌な臭いがない。
- 3) 繊維や樹脂を傷めにくく、服の上から使用しても殆ど影響を生じない。

を備えるので、人体用忌避剤としての適用範囲を拡大し、デング熱、ジカウィルス感染症、



[1-Methylpropyl 2-(2-hydroxyethyl)-1-piperidinecarboxylate]

図2 イカリジンの化学構造式

日本における家庭用殺虫剤及び人体用忌避剤の製品開発動向

チクングニア熱等の蚊媒介感染症に対する効果的な予防対策を提供できるものと期待される。

(2) 忌避剤の作用メカニズム

一般に、蚊等の吸血昆虫が温血動物を感知し吸血行動を起こすためには、適度の炭酸ガス濃度及び暖湿対流が必要とされる。これらの吸血昆虫に対する忌避剤の作用メカニズムは、現在のところ完全に解明されているわけではないが、吸血昆虫が炭酸ガスや暖湿度を感知する機能を攪乱させる作用があると言われている。

(3) 今後の製品開発動向

従来、日本では、ディート製剤における有効成分濃度の上限は医薬品が12%、医薬部外品が10%で、一方、イカリジン製剤については医薬部外品の5%が最大濃度となっていた。近年、前記したように、日本においても蚊媒介感染症へのリスクが高まっており、2016年厚生労働省は、従来日本で販売されている人体用忌避剤よりも高濃度の有効成分を含む製品について製造販売承認の迅速審査を行う旨の通知を発出した。これを受けて、有効成分高濃度製品(ディート30%製品、イカリジン15%製品)の製造販売承認が認められ、2016年後半から一部市販されるに至っている。有効成分の高濃度化は、忌避効果を長持ちさせるというメリットを有するが、忌避効果が濃度に相応して強くなるわけではない。しかも、有効成分濃度をむやみに高めることは製剤上あるいは安全上の支障を来す恐れもあるので、今後、忌避効果をより効果的に発揮させるための製剤技術研究が活発になるものと予想される。

参考文献

Elliott, M., Farnham, A. W., Janes, N. F., Needham, P. H. and Pearson, B. C. (1967) 5-Benzyl-furylmethyl chrysanthemate; A new potent insecticide. *Nature*, 213: 493-494.

Elliott, M., Farnham, A. W., Janes, N. F., Needham, P. H. and Pulman, D. A. (1974) Synthetic insecticide with a new order of activity. *Nature*, 248: 710-711.

Fujimoto, K., Itaya, N., Okuno, Y., Kadota, T. and Yamaguchi, T. (1973) A new insecticidal pyrethroid ester. *Agric. Biol. Chem.*, 37: 2681-2682.

Hirano, M., Ohno, I., Kitamura, S., Nishioka, T. and Fujita, Y. (1973) Efficacy of the pyrethroid compound possessing a new type of alcohol moiety. *Jpn. Sanit. Zool.*, 29: 219-224.

Kato, T., Ueda, K. and Fujimoto, K. (1965) New insecticidally active chrysanthemate. *Agric. Biol. Chem.*, 28: 914-915.

Katsuda, Y. (1971) Novel chrysanthemate esters. *Proceedings of the Second International Congress of Pesticide Chemistry*. 443-453pp.

Katsuda, Y., Chikamoto, T. and Inouye, Y. (1958) The absolute configuration of naturally derived pyrethrolone and cinerolone. *Bull. Agric. Chem. Soc. Jpn.*, 22: 427-428.

Katsuda, Y., Chikamoto, T., Ohgami, H., Hirobe, H. and Kunishige, T. (1969) Novel insecticidal chrysanthemic esters. *Agric. Biol. Chem.*, 33: 1361-1362.

勝田純郎、小川謙吾、村上幸雄、木村碩志、内海清、井口辰興、栗原雄司、岩本龍彦、武部泰雄、舛田和則、上村慎一郎、亀澤達也、志澤寿保、渡辺登喜郎、池田文明、石井一弥

(2006) 家庭の環境衛生。家庭用殺虫剤概論Ⅲ、1-77pp. 日本家庭用殺虫剤工業会。

勝田純郎、広部肇、南手良裕 (1986) 有機ケイ素系芳香族アルカン誘導体を含有する殺虫、殺ダニ剤及びその製法。日本公開特許公報：特開昭61-87687。

小林洋子 (2015) 新春特別寄稿 エアゾール殺虫剤の新しい開発傾向と展望。エアゾール & 受託製造産業新聞、14pp. エアゾール産業新聞社。

松元増夫、中山幸治、川尻由美、鹿島誠一 (2014) 薬剤含有構造体。日本特許公報：特許第5547350号。

Matsuo, T., Itaya, N., Mizutani, T., Ohno, N., Fujimoto, K., Okuno, Y. and Yoshioka, H. (1976) 3-Phenoxy- α -cyano-benzyl esters, the most potent synthetic pyrethroids. *Agric. Biol. Chem.*, 40: 247-249.

Matsuo, T., Nishioka, N., Hirano, M., Suzuki, Y., Tsushima, K., Itaya, N. and Yoshioka, H. (1980) Recent topics in the chemistry of synthetic pyrethroids containing certain secondary alcohol moieties. *Pestic. Sci.*, 11: 202-218.

南手良裕 (2017) 除虫菊との出会いから“夏の風物詩”蚊取り線香の発明と殺虫剤産業の発展へ。第11回化学遺産市民公開講座講演資料、14-17pp. 日本化学会化学遺産委員会。

Mrusek, K., Naumann, K. and Sonneck, R. (1995) NAK 4455 (transfluthrin): a fast-acting insecticide for use in household and

hygiene products. *Pflanzenschutznachr*, Bayer 48(special edn.): 1-48.

Nakatani, K., Inoue, T., Numata, S., Oda, K., Udagawa, T. and Gohbara, M. (1982) MTI-500; A novel insecticide. Abstracts of the 5th International Congress of Pesticide Chemistry, Kyoto, I a-9.

岡本央 (2016) 新規ピレスロイド系殺虫剤モンフルオロトリン。日本衛生動物学会 殺虫剤研究班のしおり、87: 34-40。

佐々木智基、山里圭 (2017) 新規忌避成分イカリジンを採用した人体用虫よけ剤について。ペストコントロール、177: 47-49。

Senbo, S., Makita, M., Yano, T., Abe, Y., Itoh, T. and Hirano, M. (1995) Characteristics of insecticidal activity of a new synthetic pyrethroid, imiprothrin, against household insect pests. *Jpn. J. Environ. Zool.*, 7: 79-86.

Schechter, M. S., Green, N. and LaForge, F. B. (1949) Constituents of pyrethrum flowers XXIII. *J. Am. Chem. Soc.*, 71: 3165-3173.

上山久史 (2011) The Episode 商品開発物語：虫コナーズプレートタイプ。発明、14-18pp, 発明推進協会。

Ujihara, K., Mori, T., Iwasaki, T., Sugano, M., Shono, Y. and Matsuo, N. (2004) Metofluthrin: a potent new synthetic pyrethroid with high vapor activity against mosquitoes. *Biosci. Biotechnol. Biochem.*, 68(1): 170-174.