

## 用語

日本語：脱塩素化オキソン体 英語：dechlorinated oxon-compounds

【定義】おもに農薬の有効成分である有機リン化合物において、分子内のチオホスホリル基がホスホリル基へ酸化され、かつ塩素置換基が離脱することで生成する化合物の総称をいう。

【説明】一部の有機リン化合物は、殺虫剤や家庭用防除剤の有効成分として、農業生産や生活環境の保全に重要な役割を果たしている。これらは、分子内にチオホスホリル (P=S) 基をもつチオノ体として商品化されており、散布後、昆虫などの標的生物体内でP=S基がP=O基へと酸化され、オキソン体となる。このP=S基からP=O基への変化は、活性化と呼ばれ、生じたオキソン体は、興奮性神経伝達物質であるアセチルコリンを分解するアセチルコリンエステラーゼのはたらきを強く阻害することが知られており、このオキソン体こそが殺虫作用を示す真の有効成分である。なお、アセチルコリンエステラーゼや神経伝達機構については、過去の用語解説を参照されたい。

オキソン体は、分子内のリン酸エステル結合が加水分解されることで、アセチルコリンエステラーゼ阻害能が著しく低下し、殺虫剤としての役割を終えることになる。このため、有機リン化合物由来の環境リスクあるいは生体リスクを評価するときは、散布されたチオノ体である有機リン化合物、活性化された真の有効成分であるオキソン体、そして、加水分解後に生じる分解生成物を分析対象物質とし、これらの残存量や生成量を定量化することが行われている。

一方、有機リン化合物を骨格として薬剤分子を設計するとき、標的生物体内への浸透性や残留性、代謝過程と関連する疎水性などを制御する目的で、分子内に塩素置換基を導入する場合がある。代表的な化合物としてクロルピリホスが挙げられるが、塩素化されている有機リン化合物は、オキソン体へ酸化されたのち加水分解されて薬剤としての役割を終える前に、体内の酵素などにより脱塩素化され残存・蓄積してしまう可能性がある。また、農薬として散布された有機リン系殺虫剤は、自然環境中でも酸化されてオキソン体となることや太陽光などにより脱塩素化されることが知られており、脱塩素化オキソン体が非意図的に生成する場合は考えられる。

1975年に脱塩素化チオノ体の存在が、2020年には脱塩素化オキソン体が線虫類に毒性を示すことがそれぞれ報告されている。しかし、現状では脱塩素化物のアセチルコリンエステラーゼ阻害能は定量化されていないため、農薬由来のリスクをより高度に評価する目的として、今後脱塩素化物、特にそのオキソン体のアセチルコリンエステラーゼ阻害能の解明がもとめられるものと思われる。

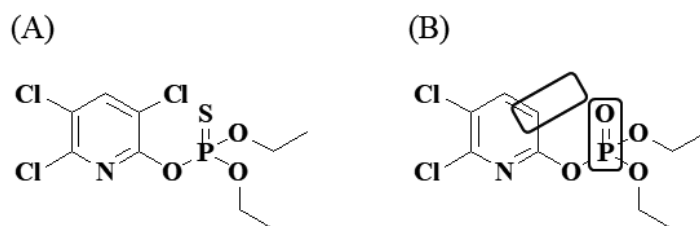


図 分子構造模式図

(A) クロルピリホス (原体),

(B) 脱塩素化オキソン体の例 (四角内の置換基が変換されている)

【解説者】 牧野正和 所属：静岡県立大学 食品栄養科学部