

8-Hydroxy-5-chloroquinolyl Carbamates의 殺蟲效果 및 抗菌力에 關한 研究

姜 會 洋

啓明大學校 自然科學大學 公衆保健學科

A Study on the Insecticidal and Antibacterial Activity of the 8-Hydroxy-5-chloroquinolyl Carbamates

Hoe-Yang Kang

Department of Public Health, College of Natural Science,
Keimyung University, Daegu, 704-701, Korea

ABSTRACT

The insecticidal and antibacterial activity of new synthesized carbamate derivatives(8-Hydroxy-5-chloroquinolyl-N-methylcarbamate(I), 8-Hydroxy-5-chloroquinolyl-N-ethylcarbamate(II)) was examined using 0.2 w/v% acetone solutions and 50 r/ml~1000 r/m N,N'-dimethylformamide-H₂O(2:3) solutions of each compounds, respectively.

1) Two carbamates exerted insecticidal effects on *Sogata furcifera* HORVATH, *Delphacodes Striatella* FAUEN, Whereas no significant effects were observed on the *Nilaparvate lugens* STAL, *Inazuma dorasalis* MOISCHULSKY and *Nephateffix apicalis* Cincticeps UHLER.

2) These compounds exhibited growth-inhibitory activity against *Staphylococcus aureus*, *Salmonella paratyphi* A, *Shigella dysenteriae* 1a, *Escherichia coli* NL 1401, at the concentration range of 100~500 r/ml in general.

Keywords : Insecticidal activity, Antibacterial activity, Insecticidal effect, Growth-inhibitory activity, 8-Hydroxy-5-chloroquinolyl-N-methylcarbamate, 8-Hydroxy-5-chloroquinolyl-N-ethylcarbamate.

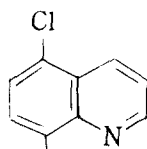
I. 緒 論

Carbamate 誘導體는 醫藥으로 使用되는 外 벌기, 매미충 等의 昆蟲에 選擇的으로 殺蟲效果가 있음을 報告한 바 많다.¹⁻⁵⁾ 또한 carbamate의 化學構造와 生理的 活性에 關하여는 N-alkyl基의 變化에 따라 NH·CH₃>N<_{CH₃}>NH·C₂H₅>NH·C₃H₇의 順으로 生理的 活性도가 低下⁶⁾하고 halgen 치환기는 一般的으로 I>Br>Cl>F와 같이 原子量이 큰 halogen이 生理的活性이 크다고 한다.⁷⁾ 最近 殺蟲劑로서 有機水銀劑, 有機鹽素劑 等은 急性 및 慢性中毒의 危險과 農産物을 經由한 人體內에 攝取, 蓄積 等의 결함 등으로 使用이 적어지고 carbamate誘導體가 殺蟲劑로서 選擇的이고 溫血動物 및 魚類에 對한 毒性이 적은 點⁸⁾ 등으로 殺蟲劑로서 널리 使用하게 되어 이에 對한 多數의 報告⁹⁻¹³⁾가 있다. 徐는 七種의 car-

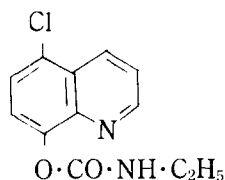
bamate系 新化合物을 合成하고 그들의 殺蟲效果 및 抗菌力에 對한 研究결과를 보고한 바 있다.¹⁴⁾

또한 姜은 alkyl-N-[2-(6-substituted benzothiazolyl)]carbamate類를 合成하고 腸管에 對한 藥理作用과 抗菌力을 報告한데 이어 Pyridinol carbamate類를 合成하고 藥理作用과 항균작용에 對한 性적을 보고^{18,19)}한 바 있다.

著者는 今般 新 carbamate系 化合物인 2種의 8-Hydroxy-5-chloroquinolyl-N-methylcarbamate(I), 8-



(I)



(II)

Hydroxy-5-chloroquinolyl-N-ethylcarbamate(II)가 멸구 및 매미충에 대하여 살충력 및 抗菌력이 있음을 究明하고 若干의 知見을 얻었기에 보고하는 바이다.

II. 實驗方法 및 材料

1. 殺蟲力 試驗

供試藥品—供試藥品은 合成한 다음 2種의 化合物 即 8-Hydroxy-5-chloroquinolyl-N-methylcarbamate (I), 8-Hydroxy-5-chloroquinolyl-N-ethylcarbamate (II)

供試昆蟲—稻作에 關係가 깊은 애멸구 *Delphacodes striatella* FAUEN, 벼멸구 *Nilaparvata lugens* STAL, 흰등멸구 *Sogata furcifera* HORVATH, 번개 매미충 *Inazuma dorsalis* MOISCHULSKY 및 끝동매미충 *Nephoteffix apicalis cincticeps* UHLER를 擇하였다.

飼育裝置—徐의 裝置¹⁴⁾를 援用하였으며 즉 直徑 5 cm, 높이 10 cm의 硝子筒으로써 全體를 微細한 網으로 덮은 것을 使用하였으며, 벼씨를 濕한 脫脂 線上에서 發芽시키어 키가 10 cm程度로 成育시키고, 이 裝置에서 부화시킨 後 25°C에서 18일간 飼育한 成蟲 中 短翅인 것을 골라서 雌雄의 區別없이 使用하였다.

實驗方法—Ishii의 方法¹⁵⁻¹⁷⁾을 援用하였다. 即 各 供試蟲 20마리씩을 一群으로 하여 炭酸gas로 麻酔시킨 後 micro를 使用하여 topical application method에 依하여 供試藥品의 各 濃度(acetone, dioxane, p-xylene, n-hexane, m-xylene, carbon tetrachloride, benzene等의 溶媒에 各各 0.2, 0.1, 0.05, 0.025 w/v% 濃度로 溶解하여 使用하였다)의 溶液을 1 μl씩 腹部에 塗布한 後 25°C에서 24時間 經過하여 死蟲率을 調査하였다. 이 實驗은 1회 20마리를 一群으로 하고 2회 反復하였다. 比較試驗藥品으로는 1-naphthyl N-methylcarbamate(NAC, Sevin)를 使用하였다.

2. 抗菌力 試驗

합물의 항균력 실험은 agar dilution method^{20, 24)}

준하여 행하였다. 배지는 nutrient broth medium (peptone 10 g, beef extract 10 g, NaCl 5 g)을 증류수 1l에 용해시켜 조제, pH 7.1~7.2를 사용하였고, 시험균주는 경상북도 보건환경연구원 미생물과에 계대보관되어온 다음 5종의 균주를 사용하였으며 실험직전에 육즙배지에 배양하였다.

供試菌—*Staphylococcus aureus*(S. aureus), *Escherichia coli* NL1401(E. coli), *Bacillus subtilis* ATCC 6633(B. subti), *Salmonella paratyphi A*(S. para A), *Shigella dysenteriae*(S. dysent)를 택하였다.

實驗方法—Nutrient broth 를 2 ml씩 tube에 分注하여 멸균하고 sample을 N,N'-dimethylformamide와 蒸溜水의 混液(2:3)에 녹여서 最終濃度가 50 r/ml, 100 r/ml, 250 r/ml, 500 r/ml, 1,000 r/ml, 및 control이 되게 一定量씩 添加한 各tube에 供試菌을 nutrition broth에 18~24時間 培養한 培養菌液을 100배 희석하여 희석한 菌液 한방울씩(生菌數約 3×10⁴~7×10⁷ 정도)을 tube에 接種하여 37°C에서 18~24時間 培養시킨 다음 肉眼으로 菌의 發育有無를 관찰하였다.

肉眼으로 菌의 發育이 보이지 않는 것은 그 培養液 0.5 ml를 取하여 plate에 培養하여 colony의 生成有無를 調査하였다. 以上操作을 2~3회 반복 시행하였다.

III. 結果 및 考察

1) 殺蟲力 檢査는 供試藥品을 acetone을 爲始한 前述한 溶媒로 溶解한 0.2 w/v%~0.025 w/v%溶液으로 殺蟲率을 檢討한 바 0.2 w/v% acetone溶液이 가장 좋은 殺蟲率을 나타내고 그외는 殺蟲效果가 매우 弱하였다.

農藥으로서 實用價値가 있는 最高濃度인 0.2 w/v% acetone溶液에 대한 殺蟲力 調査結果는 Table 1과 같다.

以上の 結果로 보아 前述한 5種의 昆蟲에 對한 殺蟲效果는 *Nilaparavate lugens* STAL에 對하여는 弱하게 나타나며 *Sogata furcifera* HORVATH, *Delphacodes striatella* FALLEN 에 對하여는 對照인 NAC보다 弱하지만 methyl基로 치환된 I보다는 ethyl基로 치환된 II의 殺蟲效果가 增大하였다.

이는 R.L.Metcalf⁶⁾의 Cholinesterase 저해작용은 alkyl基가 증가함에 따라 증대한다는 報告와 一致한다.

2) 抗菌力 檢査結果는 Table 2와 같다.

合成化合物 I, II에 對하여는 Table 2에서 보는

Table 1. Insecticidal effects of 0.2 w/v% acetone solution of carbamate derivatives

Insect	<i>Nilaparvata lugens</i> STAL	<i>Sogata furcifera</i> HORVATH	<i>Delphacodes striatella</i> FALLEN	<i>Inazuma dorsalis</i> MOISCHIULSKY	<i>Nephotettix apicalis</i> <i>cincticeps</i> UHLER
compd. No.	Insecticidal rate ※				
I	25	60	75	0	0
II	40	65	85	5	0
Control	0	0	2.5	2.5	0
N.A.C	100	100	100	100	100

※ mean value from two times of examination using a group of 20 insects of the same kind.

Table 2. Antibacterial activity of the compounds I, II

Bacteria tested Concn. r/ml	<i>S. aureus</i>	<i>E. coli</i>	<i>B. subtili</i>	<i>S. para. A</i>	<i>S. dysent</i>	nitrofurantoin	control
I							
50	-	-	-	-	-	-	+
100	-	+	-	+	+	-	+
250	-	+	+	+	+	-	+
500	+	+	+	+	+	-	+
1000	+	+	+	+	+	-	+

- : absence of growth, + : presence of growth.

II

50	-	-	-	-	-	-	+
100	-	-	+	+	-	-	+
250	-	+	+	+	+	-	+
500	+	+	+	+	+	-	+
1000	+	+	+	+	+	-	+

- : absence of growth, + : presence of growth.

바와 같이 I, II 모두 50 r/ml에서 5種의 菌株(*S. aureus*, *E. coli*, *S. subtili*, *S. para A*, *S. dysent*)에 대하여 抗菌力이 없었으며 I은 *E. coli*, *S. para A*, *S. dysent*에 對해서는 100 r/ml, *B. subtili*에는 250 r/ml에서, 또한 *S. caures*에 對해서는 500 r/ml에서 抗菌力을 나타내었다.

그리고 II는 *B. subtili*, *S. para A*에 對해서는 100 r/ml에서, *E. coli*, *S. dysent*, *S. aureus*에는 250 r/ml에서 抗菌力을 나타내었다.

위의 結果로 볼 때 抗菌力은 人體로 Gram 陽性菌에 對해서는 methyl基로 代換된 I보다는 ethyl基로 代換된 II가 強함에 반해서 Gram陰性菌에 對해서는 弱化됨을 알 수 있다.

IV. 結 論

1) 8-Hydroxy-5-chloroquinolyl-N-methylcarba-

mate(I), 8-Hydroxy-5-chloroquinolyl-N-ethylcarbamate(II) 2種의 化合物은 0.2 w/v% acetone溶液으로서 *Nilaparvata lugens* STAL, *Inazuma dorsalis* MOISCHIULSKY, *Nephotettix apicalis cincticeps* UHLER등 3種의 昆蟲에 對하여는 效果가 거의 인정되지 않고 *Delphacodes striatella* FALLEN, *Sogata furcifera* HORVATH에 對해서는 弱한 殺蟲效果를 나타내며 그 作用은 8-Hydroxy-5-chloroquinolyl-N-methylcarbamate 보다는 8-Hydroxy-5-chloroquinolyl-N-ethylcarbamate 의 效果가 크다.

2) 細菌에 對한 作用에 있어서는 8-Hydroxy-5-chloroquinolyl-N-methylcarbamate(I), 8-Hydroxy-5-chloroquinolyl-N-ethylcarbamate(II)모두 50 r/ml에는 抗菌力이 없고 人體로 Gram陽性菌에 對해서는 methyl基로 代換된 (I)보다는 ethyl基로 代換된(II)가 抗菌力이 強하였고 반대로 Gram陰性菌에 對해서는 methyl基가 ethyl基로 代換된 群의 抗菌力이 人體로

弱化됨을 알 수 있다.

參考文獻

- 1) R. L. Metcalf, *et. al.* : *J. Econ. Entomol.* **43**, 670, 1950.
- 2) Geigy : Swiss pat. **279**, 553, 282, 655, 1952.
- 3) Takeda Co. : Japanese pat., 4,780, 1966.
- 4) Hercules : U.S. pat., **3202**, 573, 1965.
- 5) Bayer : Ger. pat., 1, 117, 598, 1961.
- 6) M. A. Fahmy, *et al.* : *J. Agr. Food Chem.* **14**, 79, 1966.
- 7) R. L. Metcalf, *et. al.* : *J. Econ. Entomol.* **55**, 345, 1962.
- 8) R. L. Metcalf, *et. al.* : *J. Agr. Food Chem.* **17**, 917, 1969.
- 9) M. J. Kolben, *et al.* : *J. Agr. Food Chem.* **2**, 864, 1954.
- 10) Takeda Co. : Japanese pat, **22**, 458, 1965.
- 11) Nihon Kayaku : Japanese pat. **24**, 449, 1964.
- 12) Nihon Kayaku : Japanese pat, **30**, 278, 1964.
- 13) Nihon Kayaku : Japanese pat. **6**, 524, 1963.
- 14) B. C. Seoh : *J. phram, Soc. R. O. K*, **17**, 16, 1973.
- 15) Shoziro Ishii : Laboratory Guide for Applied Entomologists, 日本植物防疫協會編, **375**, 1960.
- 16) G. F. Ludvig : *J. Econ. Entomol.*, **46**, 364, 1953.
- 17) Shoziro Ishii : Laboratory Guide for Applied Entomologists, 日本植物防疫協會編, **376**, 1960.
- 18) 姜會洋 : 啓明大學校 生活科學研究所, 科學論集, **11**, 1985.
- 19) 姜會洋 : 啓明大學校 生活科學研究所, 科學論集, **12**, 1986.
- 20) 金重明 : Studies on Antibiotic Activity of Various Plants, 慶北大學校論文集(自然), **8119**, 1965.
- 21) 朴商煥 : 抗生物質感受性 試驗法에 關한 研究, 中央醫學, **6**, 401, 1964.
- 22) 全壽基, 金在九 : 韓國에서 分離한 Salmonella 및 Shigella의 抗生物質耐性, 中央醫學, **10**, 715, 1966.
- 23) 金炯祐, 尿路系 및 腸系 病原細菌의 各種 抗菌劑에 對한 感受性, 中央醫學, **25**, 165, 1973.
- 24) 梁學道 : 抗生劑 感受性 試驗, 中央醫學, **20**, 491, 1971.