

# 新規殺菌剤シメコナゾールの開発と作用特性

三共アグロ株式会社 にい **新** み **美** しん **信** や **哉**

## はじめに

シメコナゾールは、三共株式会社（現三共アグロ株式会社）が独自に開発した殺菌作用をもつ化合物である。本剤を有効成分として配合した、サンリット水和剤、テーク水和剤、モンガリット粒剤、サンリットカルホス粉剤、パッチコロン水和剤の農薬登録を取得したので、シメコナゾールの作用特性を中心に登録薬剤の使用方法などについて概要を紹介する。

## I 開発の経緯

EBI (Ergosterol biosynthesis inhibitor) 剤は、菌類の細胞膜成分の一つであるエルゴステロールの生合成を阻害する薬剤である。その中でも、ラノステロールの14位脱メチル化を阻害する薬剤はDMI (Demethylase inhibitor) 剤と称される。DMI 剤は一般的に、抗菌活性が高い上に抗菌スペクトルが広く、また、耐性の発達が緩やかであるなどの特長を有し、農業用殺菌剤として欧米および日本で数多く開発されてきた。

シメコナゾールの研究開発は、1987年から開始された。当時既にいくつかのDMI 剤が開発されていたため、それら既存のDMI 剤にはない特長、すなわち、植物体が根から容易に吸収でき、かつ植物に対して薬害のない性質を有した化合物の選抜を試みた。その結果既存のDMI 剤が有効な果樹の黒星病、赤星病、うどんこ病などに高い効果を示すだけでなく、イネにおいては水面施用で紋枯病（伊藤，2000）、擬似紋枯症、穂枯れ、稲こじ病（津田，2003）に、ムギ類においては種子処理で裸黒穂病、うどんこ病、眼紋病など（津田，2000）に高い防除効果を示す化合物としてシメコナゾールを選抜した。

日本植物防疫協会での委託試験を通じて、1996年からSF-9607水和剤（果樹，チャ，シバ用殺菌剤，後のサンリット水和剤，パッチコロン水和剤），SF-9701粒剤（水稲用殺菌剤，後のモンガリット粒剤）について薬

効薬害の評価を行った。続いて、マンゼブとの混合剤であるSF-9804水和剤（果樹・野菜用殺菌剤，後のテーク水和剤），イソキサチオンとの混合剤であるSC-9703粉剤（ダイズ用殺菌殺虫剤，後のサンリットカルホス粉剤）の試験がなされた。一連の試験を通じてその高い防除効果と優れた安全性が確認されたことから，2001年10月にシバ用殺菌剤としてパッチコロン水和剤（登録番号：第20695号）が登録され，2002年7月に販売を開始した。食用作物用としては，2002年12月にサンリット水和剤（登録番号：第20980号），モンガリット粒剤（登録番号：第20979号），テーク水和剤（登録番号：第20990号），およびサンリットカルホス粉剤（登録番号：第20988号）が農薬登録となり，2003年2月から販売を開始した。

## II 有効成分とその物理化学的性質

一般名：シメコナゾール simeconazole (ISO 申請中)  
 化学名：(RS)-2-(4-fluorophenyl)-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-3-trimethylsilyl-propan-2-ol

表-1 サンリット水和剤（シメコナゾール水和剤）の適用病害および使用方法

作物名	適用病害名	希釈倍数	使用液量	使用時期	本剤の使用回数	使用方法	シメコナゾールを含む農薬の総使用回数
リンゴ	黒星病 赤星病 うどんこ病 モニリア病 斑点落葉病	2,000～ 4,000倍	200～700 l/10 a	収穫7日 前まで	3回以内	散布	3回以内
	褐斑病	2,000倍					
ナシ	黒星病 赤星病 うどんこ病	4,000倍	10～30 L /樹	収穫14日 前まで	2回以内	散布	2回以内
モモ	灰星病	2,000～ 4,000倍		収穫前日 まで			
オウトウ	幼果菌核病	2,000倍	200～400 l/10 a	摘採7日 前まで	2回以内	散布	2回以内
チャ	炭疽病 もち病	4,000倍					

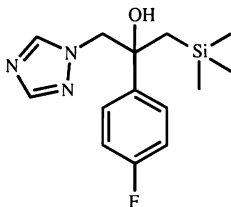
Development and Characteristics of New Fungicide Simeconazole. By Shinya Niimi

(キーワード：DMI，シメコナゾール，サンリット水和剤，テーク水和剤，モンガリット粒剤，サンリットカルホス粉剤，パッチコロン水和剤)

表-2 テーク水和剤(シメコナゾール・マンゼブ水和剤)の適用病害および使用方法

作物名	適用病害名	希釈倍数	使用液量	使用時期	本剤の使用回数	使用方法	シメコナゾールを含む農薬の総使用回数	マンゼブを含む農薬の総使用回数
リンゴ	うどんこ病 モニリア病 すす点病 すす斑病 褐斑病 黒星病 赤星病 斑点落葉病 黒点病	600~800倍	200~700 l/10 a	収穫 60 日前まで	3 回以内	散布	3 回以内	3 回以内
カキ	うどんこ病 落葉病 炭疽病	600 倍		収穫 45 日前まで	2 回以内		2 回以内	2 回以内
ミカン	そうか病 黒点病	500~600 倍		収穫 30 日前まで	3 回以内		3 回以内	4 回以内
カンキツ (ミカンを除く)	そうか病 黒点病	600 倍		収穫 90 日前まで				
小粒種ぶどう (露地栽培)	べと病 黒とう病 晩腐病 うどんこ病	1000 倍	収穫 60 日前まで	2 回以内	2 回以内 (ただし、 開花後 1 回)	2 回以内	2 回以内	
大粒種ぶどう (露地栽培)				2 回以内			2 回以内 (ただし、 開花後 1 回)	
ぶどう (施設栽培)				2 回以内			2 回以内	
メロン	べと病 うどんこ病	600~800 倍	150~300 l/10 a	収穫 7 日前まで	5 回以内	5 回以内	5 回以内	
キュウリ	うどんこ病 べと病 炭疽病			収穫前日まで	3 回以内	3 回以内	3 回以内	
ネギ	さび病 べと病 黒斑病			600 倍				収穫 30 日前まで
ニンニク	さび病 葉枯病	600~800 倍	100~300 l/10 a	収穫 7 日前まで			5 回以内	

構造式：



分子式：C<sub>14</sub>H<sub>20</sub>FN<sub>3</sub>OSi

分子量：293.4

試験名：F-155

製剤

サンリット水和剤：シメコナゾール 20%

表-3 モンガリット粒剤(シメコナゾール粒剤)の適用病害および使用方法

作物名	適用病害名	使用量	使用時期	本剤の使用回数	使用方法	シメコナゾールを含む農薬の総使用回数
イネ	紋枯病	3~4 kg /10 a	出穂 5 日前まで (収穫 60 日前まで)	2 回以内	散布	2 回以内

パッチコロン水和剤：シメコナゾール 20%

モンガリット粒剤：シメコナゾール 1.5%

テーク水和剤：シメコナゾール 2.4%

表-4 サンリットカルホス粉剤（シメコナゾール・イソキサチオン粉剤）の適用病害虫および使用方法

作物名	適用病害虫名	使用量	使用時期	本剤の使用回数	使用方法	イソキサチオンを含む農薬の総使用回数	シメコナゾールを含む農薬の総使用回数
ダイズ	フタスジヒメハムシ ハスモンヨトウ 紫斑病	4 kg/10 a	収穫 14 日前まで	2 回以内	散布	2 回以内	2 回以内

表-5 パッチコロン水和剤（シメコナゾール水和剤）の適用病害虫および使用方法

作物名	適用病害名	希釈倍数	使用時期	本剤の使用回数	使用方法	シメコナゾールを含む農薬の総使用回数
シバ（日本芝）	葉腐病（ラージパッチ）	4,000 倍	発病初期	8 回以内	1 m <sup>2</sup> 当たり 0.5 / 散布	8 回以内
		2,000 倍			1 m <sup>2</sup> 当たり 0.25~0.5 / 散布	
シバ（ベントグラス）	葉腐病（ブラウンパッチ） グラススポット病					

マンゼブ 65%

サンリットカルホス粉剤：シメコナゾール 0.4%  
イソキサチオン 2%

### III 原体の物理化学的性質

性状：白色結晶性固体

融点：118.5~120.5°C

溶解性：水 57.5 mg/l (20°C)，有機溶媒には易溶

分配係数：log<sub>10</sub> Pow；3.2

安定性：熱に安定，光に比較的安定

### IV 安全性について

#### 1 原体の毒性（普通物）

(1) 急性毒性

急性経口毒性

ラット LD<sub>50</sub>（雄 611 mg/kg，雌 682 mg/kg）

マウス LD<sub>50</sub>（雄 1,178 mg/kg，雌 1,018 mg/kg）

急性経皮毒性=ラット LD<sub>50</sub>（雄，雌>5,000 mg/kg）

急性吸入毒性=ラット LD<sub>50</sub>（雄，雌>5.17 mg/l）

(2) 刺激性

皮膚刺激性：刺激性なし（ウサギ）。

眼刺激性：刺激性なし（ウサギ）。

#### 2 製剤の毒性（シメコナゾール 20%水和剤）

急性経口毒性

ラット LD<sub>50</sub>（雄 2,714 mg/kg，雌 2,982 mg/kg）

マウス LD<sub>50</sub>（雄 4,770 mg/kg，雌 6,325 mg/kg）

皮膚刺激性：軽度の刺激性（ウサギ）ただし、1,000 倍希釈液では、刺激性なし。

眼刺激性：中程度の刺激性（ウサギ）ただし、1,000 倍

希釈液では、刺激性なし。

#### 3 有用生物に対する影響

(1) 水生生物に対する影響（原体）

コイ（96 時間 LC<sub>50</sub>）：9.08 ppm

ニジマス（96 時間 LC<sub>50</sub>）：12.0 ppm

ブルーギル（96 時間 LC<sub>50</sub>）：14.8 ppm

オオミジンコ（48 時間 EC<sub>50</sub>）：14.0 ppm

(2) 鳥類に対する影響（原体）

コリンウズラ LD<sub>50</sub>：>2,000 mg/kg（14 日間観察）

マガモ LD<sub>50</sub>：>500 mg/kg（14 日間観察）

(3) その他の有用生物に対する影響

カイコ（20%水和剤）：100~1,000 ppm 液を処理した飼料を蛹になるまで摂食させ、異常なし。

ミツバチ（原体）：経口毒性 LD<sub>50</sub>（48 時間），接触毒性 LD<sub>50</sub>（48 時間）とも >100 μg/頭。

マメコバチ（製剤）：直接法・間接法ともに影響なし。

### V シメコナゾールの特長

#### 1 抗菌スペクトル

シメコナゾールは広い抗菌スペクトルを有し、子のう菌類，担子菌類および不完全菌類の多くに抗菌活性を示す（表-6）。したがって多くの病害を同時に防除できる。例えばリンゴの場合，開花直前の散布で黒星病，赤星病，うどんこ病だけでなくモニリア病にも高い効果を発揮する。

#### 2 作用機構

イネ紋枯病菌にシメコナゾールを処理した試験で，菌体中の脂質組成を分析した結果，投与したシメコナゾール量の増加に伴って菌体中のエルゴステロール含量が低下し 2,4-メチレンジヒドロラノステロールの蓄積を認

表-6 シメコナゾールの抗菌スペクト (PDA培地上における50%菌糸伸長阻害濃度 (ppm))

リンゴすす点病	<i>Zygothiala jamaicensis</i>	0.45	イネばか苗病	<i>Gibberella fujikuroi</i>	0.21
リンゴモニリア病	<i>Monilinia mali</i>	0.81	イネ灰色菌核病	<i>Ceratobasidium cornigerum</i>	0.09
リンゴ黒星病	<i>Venturia inaequalis</i>	0.25	イネ褐色菌核病	<i>Ceratobasidium setariae</i>	0.36
リンゴ紫紋羽病	<i>Helicobasidium mompa</i>	1.25	イネ褐色米	<i>Curvularia lunata</i>	1.6
リンゴ炭疽病	<i>Glomerella cingulata</i>	1.23	〃	<i>Curvularia intermedia</i>	0.39
リンゴ白紋羽病	<i>Rosellinia necatrix</i>	7.9	イネ紅変米	<i>Epicoccum nigrum</i>	1.7
リンゴ斑点落葉病	<i>Alternaria mali</i>	4.3	イネ小球菌核病	<i>Magnaporthe salvinii</i>	0.37
リンゴ腐らん病	<i>Valsa ceratosperma</i>	24	イネ赤色菌核病	<i>Waitea circinata</i>	0.08
リンゴ輪紋病	<i>Botryosphaeria berengeriana</i>	0.12	イネ腹黒米	<i>Trichoconiella padwickii</i>	0.87
ナシ黒斑病	<i>Alternaria kikuchiana</i>	20	イネ紋枯病	<i>Thanatephorus cucumeris</i>	0.03
モモホモプシス腐敗病	<i>Phomopsis</i> sp.	7.4	イネ苗立枯病	<i>Rhizopus oryzae</i>	18.9
モモ黒斑病	<i>Alternaria alternata</i>	5.2	ニカラガ茶米	<i>Aspergillus nidulans</i>	1
モモ灰星病	<i>Monilinia fructicola</i>	0.53	コムギ眼紋病	<i>Pseudocercospora herpotrichoides</i>	0.26
カンキツ黒点病	<i>Diaporthe citri</i>	1.5	コムギ紅色雪腐病	<i>Monographella nivalis</i>	5.2
カンキツ緑かび病	<i>Penicillium digitatum</i>	0.73	コムギ赤かび病	<i>Fusarium culmorum</i>	2.8
カキ炭疽病	<i>Glomerella cingulata</i>	0.51	〃	<i>Gibberella zeae</i>	2.6
オウトウ黒かび病	<i>Alternaria</i> spp.	4	コムギ斑点病	<i>Cochliobolus sativus</i>	1.3
灰色かび病	<i>Botrytis cinerea</i>	0.24	コムギ立枯病	<i>Gaeumannomyces graminis</i> var. <i>tritici</i>	0.56
苗立枯病	<i>Pythium aphanidermatum</i>	42.5	コムギふ枯病	<i>Phaeosphaeria nodorum</i>	0.94
キャベツ黒斑病	<i>Alternaria brassicae</i>	10.7	エンバク葉枯病	<i>Pyrenophora chaetomioides</i>	1.03
キャベツ黒すす病	<i>Alternaria brassicicola</i>	1.9	オオムギ株腐病	<i>Ceratobasidium gramineum</i>	0.05
ダイコン萎黄病	<i>Fusarium oxysporum</i> f. sp. <i>raphani</i>	13.2	オオムギ斑葉病	<i>Pyrenophora graminea</i>	0.78
ナス半身萎凋病	<i>Verticillium dahliae</i>	0.41	トウモロコシごま葉枯病	<i>Cochliobolus heterostrophus</i>	0.27
キュウリつる割病	<i>Fusarium oxysporum</i> f. sp. <i>rcucumeris</i>	4.4	トウモロコシ黒穂病	<i>Ustilago maydis</i>	0.16
ウリ類つる枯病	<i>Mycosphaerella melonis</i>	0.62	茶炭疽病	<i>Colletotrichum theae-simensis</i>	0.02
イチゴ炭疽病	<i>Glomerella cingulata</i>	4.7	茶輪斑病	<i>Pestalotiopsis longiseta</i>	10
メロン黒点根腐病	<i>Monosporascus cannonballus</i>	41.8	ダイズ紫斑病	<i>Cercospora kikuchii</i>	2.2
ゴボウ黒あざ病	<i>Rhizoctonia solai</i> AG-2-2 III B	0.04	ダイズ白網病	<i>Sclerotium rolfsii</i>	0.18
イネいもち病	<i>Pyricularia grisea</i>	1.3	テンサイ	<i>Cercospra beticola</i>	0.2
イネ褐色紋枯病	<i>Thanatephorus cucumeris</i>	0.27	トルコギキョウ炭疽病	<i>Colletotrichum acutatum</i>	1.9
イネごま葉枯病	<i>Cochliobolus miyabeanus</i>	1.4	カーネーション萎凋病	<i>Fusarium oxysporum</i> f. sp. <i>Dianthi</i>	1.03

めた (図-1)。この結果から、本剤がデメチラーゼによる脱メチル化反応を阻害することが明らかとなった。

### 3 植物における移行性

シメコナゾール灌注処理での防除効果 (うどんこ病) が他剤と比べて高かった結果から、根からの吸収に優れると判断できる (表-7)。また、トマト果実から調製したクチクラ膜に対するシメコナゾールの透過率は20%以上であった (表-8)。一方、比較に用いた5種類のDMI剤がいずれも5%以下であったことから、シメコナゾールは膜透過性に優れることが明らかとなった。

### 4 ガス効果

うどんこ病を用いた試験でシメコナゾールはガス効果を有することも明らかにされた (津田・加藤, 2003)。

### 5 未展開葉における防除効果

シメコナゾールは上方移行性、植物内部への浸透移行性およびガス効果に優れるため、薬剤散布時に未展開の葉において高い防除効果を示すことが予想された。そこで、キュウリうどんこ病 (表-9) およびナシ赤星病 (表-10) について未展開葉における防除効果を評価した。その結果、散布時に未展開だった葉において、シメ

表-7 シメコナゾールを灌注処理した場合のオオムギうどんこ病防除効果

供試薬剤	防除価
シメコナゾール	100
D 剤 (トリアゾール系 DMI 剤)	0
F 剤 (トリアゾール系 DMI 剤)	0
H 剤 (トリアゾール系 DMI 剤)	7
T 剤 (トリアゾール系 DMI 剤)	23
T 剤 (イミダゾール系 DMI 剤)	0

20 ppm に調製した水溶液を灌注処理した 24 時間後にオオムギうどんこ病菌を接種した。

表-9 シメコナゾールの未展開葉における防除効果：キュウリうどんこ病

供試薬剤	希釈倍数	防除価	
		散布時 展開葉	散布時 未展開葉
シメコナゾール, マンゼ ブ混合剤	600 倍	96.4	95.5
C 剤 (有機塩素系殺菌剤)	1,000 倍	76.4	45.5

薬剤散布 7 日後にキュウリうどんこ病菌を接種した。

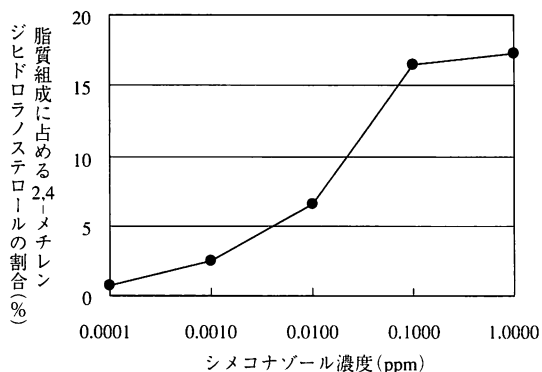


図-1 シメコナゾール処理によるイネ紋枯病菌における 2,4-メチレンジヒドロラノステロールの蓄積

シメコナゾールは他剤と比べて高い防除効果を示した。

### 6 作物に対する安全性

これまでの薬効薬害試験はもちろん、高濃度薬害試験でも実用的に問題となる薬害は認められていない。

## VI おわりに

以上のようにシメコナゾールは広い抗菌スペクトルをもち、植物への浸透性が優れているため予防効果に加えて治療効果も示す。例えばサンリット水和剤ではリングのモニリア病、黒星病、赤星病などに対して病原菌の感

表-8 シメコナゾールのクチクラ膜透過性

供試薬剤	クチクラ膜透過率 (%)
シメコナゾール	24.6
D 剤 (トリアゾール系 DMI 剤)	<1
F 剤 (トリアゾール系 DMI 剤)	<1
H 剤 (トリアゾール系 DMI 剤)	3.9
T 剤 (トリアゾール系 DMI 剤)	4.7
T 剤 (イミダゾール系 DMI 剤)	<1

トマト果実から調製したクチクラ膜を使用した。供試薬剤はすべて市販の製剤を使用した。

表-10 シメコナゾールの未展開葉における防除効果：ナシ赤星病

供試薬剤	希釈倍数	葉位ごとの発病度								
		1*	2	3	4	5	6	7	8	9
シメコナゾール剤	4,000 倍	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0
D 剤 (トリアゾール系 DMI 剤)	4,000 倍	0.0	0.2	0.7	2.0	1.0	0.0	0.0	0.0	0.0
T 剤 (イミダゾール系 DMI 剤)	2,000 倍	1.6	2.5	3.7	3.2	0.6	0.7	0.2	0.1	1.0
無処理		1.9	4.3	4.8	4.8	4.4	4.6	4.4	4.3	3.3

\*：最上位葉を 1 とした場合の葉位を示す。

染後あるいは初期病斑形成後の散布でその後の病斑の進展を強く抑制する。マンゼブとの混合により予防効果を高めたテーク水和剤との体系的な使用などにより、さまざまな場面で、難防除病害を含む多くの病害の同時防除が効果的に行える。シメコナゾールを有効成分に、各分野にあわせた 5 種の製剤を販売しており、農家の方々の広い期待に応えられると確信している。

また、植物の根から吸収されやすいことはシメコナゾールの大きな特長である。一方、シメコナゾールはさまざまな作物の白絹病、*Rhizoctonia* 属菌による苗立枯病などの土壌病原菌に対しても高い殺菌活性を示す。これらの特長を生かし農業生産に寄与していきたいと考えている。現在、モンガリット粒剤の土壌混和処理でネギ白絹病などに対する実用性を委託試験で評価中である。また、抗菌スペクトルが広く作物に対する薬害が少ない特長を生かして、さらに適用病害および適用作物を広げる予定である。

### 引用文献

- 1) 伊藤寛之ら (2000): Chem. Pharm. Bull. 48: pp.1148~1153.
- 2) 津田幹雄ら (2003): 北日本病害虫研究会報, 投稿中.
- 3) ————ら (2000): in Proc. Brighton Crop Protec. Conf. -Pests Dis., CPC, UK, pp.557~562.
- 4) ————・加藤重博 (2003): 日植病報 69; 295.