

農業研究の現場から

リレー随筆

農業研究施設紹介(12)

三井化学株式会社  
機能化学品研究所

ふもと やすのり  
麓 康 紀

所在地：千葉県茂原市東郷 1144

Message from Our Research Site. Mitsui Chemicals, Inc. By

Yasunori FUMOTO

(キーワード：農業研究，農業開発)



機能化学品研究所研究本館

I 三井化学の研究拠点・組織

三井化学では、1998年から研究開発拠点の統合を開始し、2002年に千葉県の内房に関連会社を含め約1,000名という国内最大規模の研究開発拠点「袖ヶ浦センター」を完成させた。研究開発組織は、「コーポレート研究所」と「事業グループ研究所」に大別され、組織横断的な技術シナジーを追求する研究開発に取り組んでいる(図-1)。「コーポレート研究所」には、「触媒科学研究所」、「マテリアルサイエンス研究所」、「生産技術研究所」があり、化学の次世代を見据えた基盤技術開発、材料開発、プロセス開発等の全社共通研究を担っている。一方、「事業グループ研究所」には、「機能樹脂研究所」、「機能材料研究所」、「機能化学品研究所」があり、コア事業の維持・強化・拡大に資する製品の研究開発に取り組んでいる。農業の研究開発は「機能化学品研究所」で行われ、原体の創製研究は農業化学品グループが、製剤開発研究は三井化学クロップライフ(株)技術部がそれぞれ担当している。温室や圃場を有する「機能化学品研究所」の主要拠点は、九十九里地区の茂原市に位置している。茂原市は

良質な天然ガス資源を有し、近隣に雄大な外房の海を望む歴史と緑豊かな街である。

II 機能化学品研究所の沿革

「袖ヶ浦センター」設立に先駆け、1990年に神奈川県横浜市と茅ヶ崎市に分散していた農業を含むライフサイエンス関連の研究機能を集約し、千葉県茂原市に「ライフサイエンス研究所」が設立された。その後「ライフサイエンス研究所」は、2003年の組織改正に伴い「機能化学品研究所」となり、農業化学品に加え、精密化学品と高屈折率メガネレンズ等のビジョントケア材料の研究開発を担うこととなった。また、2005年7月には、製剤品事業会社である三井化学クロップライフが設立された。

III 主要な業績・エピソード

当社は、戦前からクロロピクリンなどの農業を生産していたが、食糧増産や農作業の重労働からの解放を通して社会に貢献すべく、1950年代に入ると殺虫剤、除草剤などの導入品により農業事業の基盤を築いた。その後、本格的に自社開発を展開し、1960～70年代

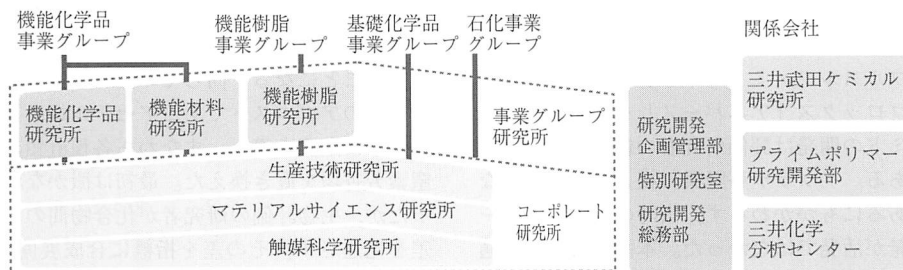


図-1 三井化学 R & D 体制

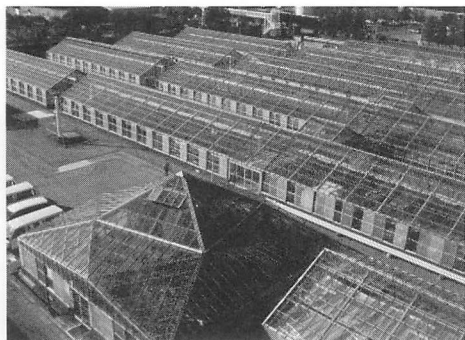


図-2 機能化学研究所温室群

には CNP とピリダフェンチオンを、1980 年代には水田用除草剤ナプロアニリド「ウリベスト」と低毒性殺虫剤エトフェンプロックス「トレボン」を開発した。ナプロアニリドとエトフェンプロックスはそれぞれ 1987 年、93 年に大河内記念賞を受賞している。エトフェンプロックスの研究開発に際して、当初は、農業用ピレスロイドの持つ高活性、哺乳類への低毒性、光安定性、有機リン剤・カーバメート剤抵抗性害虫への効果などの特徴に魅力を感じた反面、魚毒性が高いため水田で使用できないことを、解決すべき課題として強く意識した。そこで、既存ピレスロイド剤と同等の殺虫活性を持ち、水田でも使用可能な低魚毒性ピレスロイド剤の開発を目標に掲げ研究に取り組んだ。当時、ピレスロイド剤は一般にエステル結合が必須構造とされていたが、オキシムエーテルでも殺虫活性があるという知見を頼りに、エステルにこだわらず探索を行った。試行錯誤の末、エステル結合の代わりにエーテル結合を有する新規骨格の化合物群を見出すことに成功し、それまでのピレスロイドの構造活性相関の概念を覆すことになった。オキシムエーテルでの殺虫活性という小さな突破口から、それまでの定説に挑んだ合成研究者の執念が実った好例であろう。エトフェンプロックスは水稲をはじめ、果樹、野菜、花き、樹木、茶などの作物のほか、ハエ、カ、ゴキブリなどの衛生害虫防除、シロアリなど木材害虫防除、動物に寄生する害虫防除にも使用されている。

1990 年代に入ると、アブラナ科野菜の根こぶ病に効果を示すフルスルファミド「ネビジン」と殺ダニ剤ハルフェンプロックス「アニバース」を開発した。フルスルファミドの開発は評価研究者の創意工夫が実を結んだ例である。アブラナ科野菜の根こぶ病は重要な土壌病害であるにもかかわらず、当時の農薬メーカーでは研究開発が活発ではなかった。本病害に対する適切なスクリーニング法がなかったことや、適当なりー

ド化合物が見当たらなかったことがその理由であったが、まずスクリーニング法の確立から研究を開始した。根こぶ病菌は絶対寄生菌であるため人工培養ができず、常時大量の接種源を確保できないこと、発病までに長期間を有し、検定のサイクルが長いこと、根こぶの形状からの効果判定に熟練を要することが問題であった。これらの問題を解決するために検討を重ねた結果、コマツナを用いた簡便迅速でかつ高精度なスクリーニング法を確立した。一方、適当なりード化合物の選抜については、当時探索サンプルの保管庫に眠っていた化合物のうち、病原菌の種類を問わず、殺菌活性の認められていたものを片端から根こぶ病のスクリーニング系に供試して行った。その結果、スルホンアミド系化合物に根こぶ病防除活性を有することを見出し、以後の集中合成展開によりフルスルファミドの発見に至った。この研究は、改めて独自評価系開拓の重要性を認識するとともに、既に一連の生物評価が終了した化合物ライブラリーの中にも貴重な発見があることを信じ、諦めず評価を継続した不屈の研究者の勝利であったと思う。現在、フルスルファミド「ネビジン」はアブラナ科野菜の根こぶ病の基幹防除剤として国内はもとより海外でも高い信頼を得ている。

近年、農薬が広く使用されるにつれて、農薬の環境や人畜に対する影響が懸念されるようになり、より安全な農薬の開発が社会的要請となった。当社もこの要請に応えるべく低毒性農薬の開発を進め、2002 年にはハロゲンフリーのネオニコチノイド系殺虫剤ジノテフラン「スタークル/アルバリン (アルバリンはアグロ カネショウ(株)の登録商標である。)」を上市した。

ジノテフランの研究開始前、我が国において「トレボン」が水田用殺虫剤としてのトップブランドとなり、さらなる新製剤や混合剤の開発で、その地位を磐石なものにしようとしていたとき、「トレボン」の脅威となるネオニコチノイド系殺虫剤が出現した。研究者たちは「トレボン」の危機を直感し、直ちに対抗剤の開発に着手した。初期のネオニコチノイド剤は、ニコチン性アセチルコリン受容体のアゴニストで、ニコチンとの構造類似性から含窒素芳香環が殺虫活性に必須と考えられていた。しかし、ここでも当社の合成研究者たちは、それまで必須と考えられていた構造打破に挑むことになる。同じくニコチン性アセチルコリン受容体のアゴニストであるアセチルコリンの構造を手掛かりに酸素を導入、すなわち各種直鎖エーテルで含窒素芳香環を置き換えた。最初は微かな活性しかなかったが、生物評価の研究者が化合物間のわずかな活性差を見逃さず、その差を指標に合成展開を継続した。しかし、その後の活性向上は困難を極め、社内からは

研究打ち切りの声が上がった。しかし、当時の研究グループリーダーをはじめ、研究者たちは諦めなかった。研究を継続して間もなく、エーテル部の環化により飛躍的な活性向上が見られた。一気に勢いづいた研究者たちは、1,000を超える化合物を合成し、最終的にテトラヒドロフラン環を有するジノテフランを創製した。合成研究者の独自の発想、評価研究者の緻密な観察力、そして決して諦めず挑戦を続けた研究者達の熱意が生んだ成果である。

ジノテフランは、現在、国内の水稻、園芸分野を中心に様々な使用場面への適用を可能とする利便性の高い農薬として市場を拡大している。また、本剤はその安全性の高さから、米国 EPA においてリスク削減剤として 2004 年に米国登録を取得した。さらに、生活環境用途や動物薬分野でも優位性を発揮できる可能性も高く、全世界を対象に新たな市場価値を創造している。

## おわりに

どうすれば画期的な新農薬を見出せるか？ 農薬の研究開発に携わる者の永遠のテーマである。近年、農薬に求められる性能は、対象病虫害雑草に対する効力に加えて、安全性、利便性、経済性など要求度は高まる一方である。また、地球環境や社会環境の変化により、今後さらなる課題も生じるだろう。一方、農薬の開発には、化学、生化学、生物学、生態学、環境化学、毒性学など様々な分野の研究者が関与する。新農薬開発のためには、これらの研究者が、絶え間ない技術革新の中で市場ニーズを的確にとらえ、課題解決に向けて自由に多面的な議論をすることが重要である。また、実験研究とセレンディピティーの研究の重要性を再認識することも必要だろう。そのためにも、先人たちが積み上げてきた研究手法・精神を継承・発展させるとともに、分子生物学や情報技術などの手法を新たに加え、創農薬技術を進化させることが我々研究者に与えられた役割であり楽しみであると考えます。

### 新しく登録された農薬 (42 ページから続き)

#### ●チアジニル・インダノファン・クロメプロップ・ベンスルフロロンメチル粒剤

21631: ブイゲットダイナマン粒剤 (日本農薬) 2006/2/8  
チアジニル: 6.0%, インダノファン: 0.46%, クロメプロップ: 1.16%, ベンスルフロロンメチル: 0.25%

移植水稻: いもち病, 水田一年生雑草, マツバイ, ホタルイ, ヘラオモダカ, ミズガヤツリ (東北), ウリカワ, ヒルムシロ, セリ, アオミドロ・藻類による表層はく離

#### ●イソウロン粒剤

21635: クサキック粒剤 (ニチノーサービス) 2006/2/8

21636: ハイキック粒剤 (ニチノー緑化) 2006/2/8

イソウロン: 1.0%

さとうきび (春植又は夏植), さとうきび (株出): 畑地一年生雑草, ムラサキカタバミ, 樹木等: 一年生雑草

#### ●オキサジクロメホン・クロメプロップ・プロモブチド・ベンスルフロロンメチル粒剤

21637: ホクコーホームランキング 1 キロ粒剤 75 (北興化学工業) 2006/2/8

21638: ホームランキング 1 キロ粒剤 75 (デュボン) 2006/2/8

オキサジクロメホン: 0.8%, クロメプロップ: 3.0%, プロモブチド: 6.0%, ベンスルフロロンメチル: 0.75%

移植水稻: 水田一年生雑草, マツバイ, ホタルイ, ウリカワ (北海道), ミズガヤツリ (東北), ヘラオモダカ, ヒルムシロ, セリ, アオミドロ・藻類による表層はく離 (北海道)

#### ●オキサジクロメホン・クロメプロップ・プロモブチド・ベンスルフロロンメチル粒剤

21639: ホクコーホームランキング 1 キロ粒剤 51 (北興化学工業) 2006/2/8

21640: ホームランキング 1 キロ粒剤 51 (デュボン) 2006/2/8

オキサジクロメホン: 0.8%, クロメプロップ: 3.0%, プロモブチド: 6.0%, ベンスルフロロンメチル: 0.51%

移植水稻: 水田一年生雑草, マツバイ, ホタルイ, ウリカワ, ミズガヤツリ, ヒルムシロ, セリ, アオミドロ・藻類による表層はく離

#### ●イマゾスルフロロン・オキサジクロメホン・ベンゾビシクロン粒剤

21647: キチット 1 キロ粒剤 (協友アグリ) 2006/2/22

イマゾスルフロロン: 0.90%, オキサジクロメホン: 0.80%, ベンゾビシクロン: 2.0%

移植水稻: 水田一年生雑草, マツバイ, ホタルイ, ヘラオモダカ (北海道、東北), ミズガヤツリ (北海道を除く), ウリカワ, ヒルムシロ, セリ (北陸を除く), アオミドロ・藻類による表層はく離 (北陸を除く)

21648: キチットジャンボ (協友アグリ) 2006/2/22

イマゾスルフロロン: 2.25%, オキサジクロメホン: 1.5%, ベンゾビシクロン: 5.0%

移植水稻: 水田一年生雑草, マツバイ, ホタルイ, ヘラオモダカ (北海道、東北), ミズガヤツリ (北海道を除く), ウリカワ, ヒルムシロ, セリ (北陸を除く), アオミドロ・藻類による表層はく離 (北陸, 九州を除く)