

連載 日本の農薬産業技術史(6)

—農薬のルーツと歴史, 過去・現在・未来—

独立行政法人 国立科学博物館
産業技術史資料情報センター 元主任調査員

大田 博樹 (おおた ひろき)

はじめに

前稿では1990年代から現在に至るまでの超高性能農薬の出現について概観と殺虫剤について述べた。ここでは同様に大きな進歩と変革があった殺菌剤と除草剤について述べる。この分野においても化学構造は全く新規で、作用機構も新しい新規薬剤が数多く登場する。

(2) 殺菌剤

1) メラニン生合成阻害剤 (MBI)

呉羽化学が1970年(昭和45年)にフサライド(ラブサイド)を開発、市販した。作用機構的には、第2世代のMBI(MBI-R)と位置付けられている。その後、以下の新規なMBI剤が1990年代の後半に登場した。これらの剤はいち菌のメラニン生合成の過程の中で、フサライドとは異なるステップすなわちシタロン脱水素酵素を阻害することから、第3世代のMBI(MBI-D)と呼ばれる。

日本バイエルは1997年(平成9年)にカルプロバミド(ウィン)を開発、市販した。発明者の利部は、イネのファイトアレキシンであるモミラクソンを誘導する物質(抵抗性誘導物質)に着目してその関連化合物を検討していた。当初の狙いは抵抗性誘導作用だったが、結果的にはカルプロバミドはメラニン合成阻害作用によるものであるということがわかった。数多く発表される論文に対する着眼力、それをリード化合物として展開するときの着想力、さらには、失敗の連続を克服する執着力の結果がこの成功につながったものと言える。

このカルプロバミドの登場に続いて、住友化学が2000年(平成12年)にジクロシメット(デラウス)を、そしてACCと日本農薬が同年にフェノキサニル(アチーブ)を開発、市販した。

2) エルゴステロール生合成阻害剤 (EBI)

糸状菌の細胞膜を構成する脂質成分のエルゴステロールの生合成を阻害して殺菌作用を示す薬剤群(Ergoster-

ol Biosynthesis inhibitor: EBI)がこの時期に多数登場した。植物体内への浸透性があり、予防効果だけでなく治療効果があること、ムギ類、大豆、野菜類、果樹等の幅広い重要病害に優れた効果を示すことから広く普及した。

日本で最初に開発されたEBI剤はセラメルクが発明し、1977年(昭和52年)に登録を取得したトリホリン(サブロール)である。その後バイエルが1983年(昭和58年)トリアジメホン(バイレトン)を市販した。これをきっかけに各社が開発に乗り出し、EBI剤の開発ラッシュとなった。現在国内登録を有しているEBI剤は20に上るが、そのうち日本企業が発明したものは以下に示す7剤があり、それぞれ特徴を持っている。

トリフルミゾール(トリフミン) 日本曹達(1986)
ヘフテゾエート(ヘルシード) 北興(1989)
イプコナゾール(テクリード) 呉羽(1993)
イミベンコナゾール(マネージ) 北興(1994)
オキシポコナゾール(オーシャイン) 宇部(2000)
シメコナゾール(パッチコロン) 三共(2001)
メトコナゾール(ワークアップ) 呉羽(2006)

3) ストロビルリン系殺菌剤

上述したEBI剤の開発競争が一段落したころ、新しい作用機構の殺菌剤が登場した。これが天然ストロビルリン(担子菌が産生する抗菌性物質)をモデルとしたストロビルリン系薬剤である。日本で最初に農薬登録を受けたのは1997年(平成9年)にBASFが開発したクレソキシムメチル(ストロビー)である。ついでゼネカが翌年にアズキシストロピン(アミスター)を市販した。その後多くの企業が開発競争に参入し、現在まで10剤が農薬登録を受けた。このうち日本企業が開発したのは2剤ある。

塩野義製薬は、メトミノストロピン(オリブライト)を発明し1998年(平成10年)に市販した。これはイネいち病を始め紋枯れ病葉枯れ病など、水稻の病害に幅広く効果がある。