

リレー連載

農薬を変えた農薬～開発ものがたり・日本の創薬力～ (7)

殺ダニ剤シフルメトフェン

OAT アグリオ株式会社 研究開発本部

笹間 康弘 (ささま やすひろ)

高橋 宣好 (たかはし のぶよし)

はじめに

シフルメトフェンはOATアグリオ(株)が創製・開発したベンゾイルアセトニトリル骨格を有する新規殺ダニ剤で、果樹、野菜、茶等の農作物および花き類を加害するハダニ類に対して優れた防除効果を示す。また、既存の殺ダニ剤とは異なる作用性を示すことから、他の作用点を阻害する殺ダニ剤が効きにくくなったハダニ類に対して高い効果を示す。

日本においては、2001年からの日本植物防疫協会における公的委託試験を経て、八洲化学工業(株)(現協友アグリ(株))並びに全国農業協同組合連合会の協力を得ながら開発を進め、2007年にダニサラバ®フロアブルとして上市した。また、海外においては、南北米国および東アジア諸国を含む世界15か国で農薬登録を取得しており、Danisaraba®のほか、Scelta®, Powershot®, Okay®の商品名で既に販売されている。また、北中米市場においては、BASF社との共同開発により農薬登録を取得し、Nealta®(BASF社登録商標)の商品名で販売している。そのほかにも、海外パートナーとの共同開発も含め、今後さらに、EU、東南・中央アジア、アメリカ、オセアニアの各国での開発展開を計画している。

このたび、シフルメトフェンの上市から来年で10年

目の節目を迎えるにあたり、日本植物防疫協会からシフルメトフェンにまつわる開発ものがたりについて本誌掲載の機会を得たので、開発上市に至るエピソードについていくつか述べたいと思う。創薬研究は無論のこと農薬開発にかかわっている方々に何かしらの参考になれば幸いである。なお、シフルメトフェン(ダニサラバフロアブル)の特性と使い方については、拙著(笹間・宮田, 2008)を参考にさせていただきたい。

I 創薬研究

シフルメトフェンの最初のリード化合物の発見は1999年晩秋のころで、その発見には紆余曲折を経て辿り着いたのであった。90年代初頭、当社は宇部興産(株)が創製したSBI剤オキスポコナゾールの共同開発を進めていたが、合成グループに所属していた筆者(高橋)は、入社後間もなくして、幅広い殺菌活性を有するストロビリン系化合物に着目し、アナログ合成を展開していた。その中で、デュポン社や住友化学(株)が出願した活性部位であるメトキシアクリレート部位をトリアゾール基に変換した化合物に関する特許を基に化合物Aをデザインし、4-(2-メチルフェニル)-1,2-ジメチルピラゾール-3,5-ジオン(図-1, 化合物1)の臭素化反応から化合物Aを合成しようと計画した。実際に反応

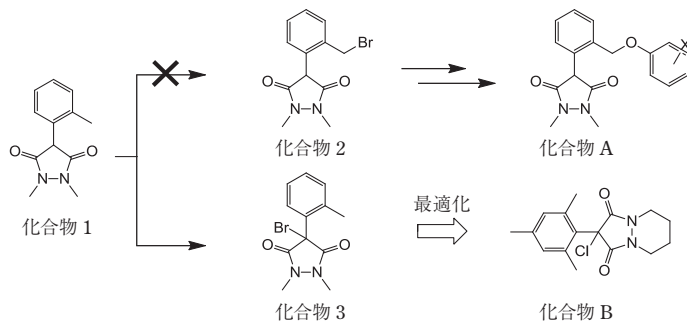


図-1 リード化合物の発見(その1)