

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～(8)

## ニテンピラム

住友化学株式会社 アグロ事業部マーケティング部 赤山 敦夫 (あかやま あつお)

## はじめに

ニテンピラムは住友化学株式会社（当時は武田薬品工業株式会社）が開発したネオニコチノイド系殺虫剤である。1995年11月28日に、ベストガード®の商品名で登録取得して以来20年あまりになる。その間、社内外の事情によってニテンピラムの位置付けが様々に変化してきた。

我が国の水稲面積は年々減少してきているが1985年には233万haもあり、農薬市場として現在以上に魅力的な分野であった。その頃、武田薬品工業株式会社（以下、武田薬品）は、水稲用の病害虫防除剤として鱗翅目防除剤のカルタップ塩酸塩（商品名：パダン®）、紋枯病防除剤バリダマイシンA（商品名：バリダシン®）を既に上市しており、いもち防除剤フェリムゾンを開発中であった。残る課題はウンカ防除剤と水稲用除草剤であった。その水稲用除草剤としてイマズスルフロンを、1993年12月に登録取得していたことから、ウンカ類に卓効を示すニテンピラムの登録取得によって、水稲での品揃えが大いに充実することになった。

ところが、武田薬品はニテンピラムに続いて約1年遅れで合成されたクロチアニジンを開発し、それによって、ウンカ防除剤として開発したニテンピラム粉剤の販売を中止することになるのである。

2016年3月に筆者は還暦を迎え住友化学株式会社を定年退職した。その節目にあたり、入社間もないころの思い出を以下に綴る。創製研究に携わる若い方々の参考になれば望外の喜びである。

## I 創製研究

## 1 化合物合成

1980年代中ごろ、武田薬品は、鱗翅目防除剤カルタップ塩酸塩と組合せる半翅目用殺虫剤の創製を強く望んでいた。水田用除草剤イマズスルフロンの開発に一定の

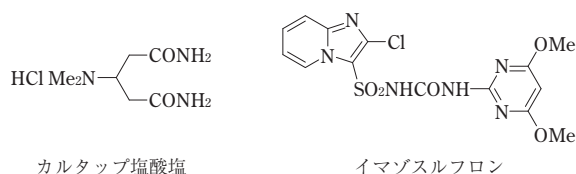


図-1

目処がついたことから、同社では研究陣の主力を半翅目用殺虫剤の探索に投入した（図-1）。

ちょうどそのころ、当時の日本特殊農薬製造株式会社（現在のバイエルクロップサイエンス株式会社）からニトロ基を有する複素環化合物に関する多数の特許が出版・公開された。これらの特許中の化合物には、後にネオニコチノイド系と呼ばれる一連の化合物の草分けとなるイミダクロプリドも含まれていた。その中の比較的初期の化合物1を合成したところ、ウンカ・ヨコバイ類やアブラムシ類に強い活性を示すことがわかった。奇遇にも、ほぼ同時期に武田薬品におけるランダムスクリーニングによって、1と同じくニトロメチレン基を有する化合物2および3が半翅目害虫に活性を示すことが見いだされた。ネオニコチノイドは1970年代後半に発表されたニチアジン（シェル社）がその発端であるが、シェル社は活性の発現にはニトロメチレンの結合部位でのヘテロ環状構造が重要であると報告していた（SOLWAY et al., 1978）。しかしながら武田薬品での結果はこの結論とは異なっていた。さらに医薬品である抗潰瘍剤ラニチジンがニトロメチレン基を有する鎖状構造であることに、医薬品メーカーでもある武田薬品の合成研究者は気付いていた（図-2）。

これらのことから、日本特殊農薬製造の特許化合物における環状構造は不要ではないかと推測し、環を開いた形の化合物4を合成したところ、思惑通りウンカ類・アブラムシ類に高い効果を示した。次のステップとして4をリード化合物として構造展開がなされ、最適化研究の