

モスピラン30周年

# アナザーストーリーズ： モスピラン®の探索研究と広告宣伝 —モスピラン発売30周年を迎えて—

<sup>1</sup>東京農業大学 総合研究所 客員教授  
<sup>2</sup>日本曹達(株) リサーチ&イノベーションセンター  
山本 敦司<sup>1</sup>， 浅野 薫<sup>2</sup>  
Atsushi Yamamoto Kaoru Asano

## 1. はじめに

殺虫剤モスピラン（有効成分アセタミプリド）は、2025年に農薬登録30年を迎えた。1980年代にネオニコチノイド系化合物の探索研究を開始し、1989年にアセタミプリドが発明、1991年に開発決定、1995年に国内登録が認可された。本剤はネオニコチノイド系殺虫剤（IRACコード：4A）であり、国内外で様々な製剤型で普及販売が進み、現在でも農業生産に貢献している化学農薬の一つである。

### (1) アナザーストーリーズ

モスピランは、アドマイヤー（イミダクロプリド／当時の日本特殊農薬(株)により開発）とベストガード（ニテンピラム／当時の武田薬品工業(株)により開発）に続く、3番目のネオニコチノイド剤である。厳しい開発競争の中で特許はクリアしたものの、その開発研究当時には販売上の決定的な差別化点が見当たらなかった。本稿は研究開発（特に生物研究）の視点から、その差別化点を科学的に解明し普及販売につなげたモスピランのアナザーストーリーズである。

本剤の探索・開発時期および上市後の普及時期にさかのぼって、生物研究を担当した山本と浅野からお話します。モスピランの創薬研究では活性の強さを追求するだけでなく「弱点も的確に把握し、弱みを強みに変える発想力」で普及販売へつなげた。なお、本稿の構成アイデアは、某TV局の某番組にならっていることはおわかりと思う。

### (2) 登場者たち

著者の山本と浅野は1985年の同期入社で、旧・

小田原研究所生物研究部殺虫剤研究グループにて、1980年代後半～1990年代前半のモスピラン探索研究に生物屋として共に邁進した研究仲間である。本稿中に登場する高草伸生さんと岩佐孝男さんも、同時期の同グループの研究仲間である。さらに、モスピラン販売後にも継続された質の高い研究成果では、平田晃一さん（元・生物研、殺虫剤G）と金澤潤さん（創薬解析研究部）が登場する。

モスピランの探索研究・開発当時を語り記す生物研究者（元在職者も含め）は、2026年現在では本社にも研究所にもほほいない。このタイミングで本稿執筆を企画された普及部広報課には感謝したい。また、本稿の作成にあたり資料の作成にご協力いただいた、風間公美子さん（リサーチ&イノベーションセンター研究管理部：以下R&Iセンター）には厚く御礼申し上げる。

【参考】本剤の開発経緯は、国内登録20周年と25周年に「農業時代197, 23-25」と「農業新時代2, 16-18」にそれぞれ紹介されている。

## 2. 視点：ゴキブリとイエバエの神経が… 作用機構研究

モスピランの探索研究では、当初から殺虫試験だけでなく、作用点を特定して作用点への影響も調べる評価方法も取り入れていた。

### (1) ゴキブリたちへ

ある朝の殺虫剤研究室での会話。

山本：「浅野さん、今日は10匹をお願いね。僕は機材を準備しとくから」。

浅野：「了解、ゴキブリを解剖して神経を出しとくね！」（写真1）。

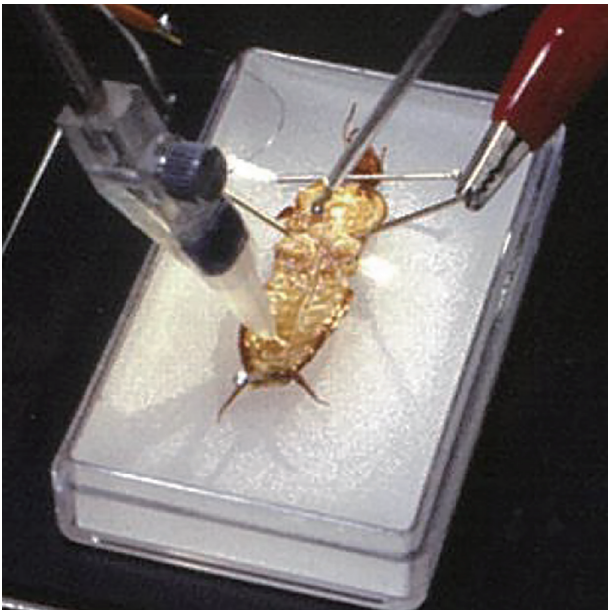


写真1. ワモンゴキブリの摘出神経（細胞外電極法）  
ワモンゴキブリの内臓などを除去し神経線維のみにした状態（小田原研究所のパフレットから引用）

今日はモスピランの作用を電気生理学的な方法（細胞外電極法）で調べる日である。

浅野が解剖して露出させた神経へ電極を設置する。山本が、モスピランをゴキブリの神経に処理する前後で電気刺激を与えて、神経の反応がどのように変わるかを機材で検出するといった（手荒い？）方法を使った（写真2）。

ワモンゴキブリの神経にはシナプス（神経細胞同士の結合部分）があり、好適な実験材料だ。ここにはニコチン性アセチルコリン受容体があり正常な神経伝達を担っている。

モスピランを神経へ処理すると、神経が興奮して自発放電（スパイク）が激しくなった後に消失した。ここで神経に電気刺激を与えるとナトリウムチャンネルなどがある「軸索」は正常であったが、アセチルコリン受容体を含む「シナプス」での反応はブロックされ使い物にならなくなっていた。すなわち、作用点がこの受容体であることがわかった。

## (2) イエバエたちへ

電気生理学的実験だけでは、作用機構研究は不十分である。そこで、モスピランが受容体に結合する強さを生化学的に調べた。これが薬物・受容体結合実験で、高草伸生が担当した。イエバエの脳をすりつぶしてアセチルコリン受容体を準備する（これも手荒い？）方法である。結果はもちろん、モスピラ

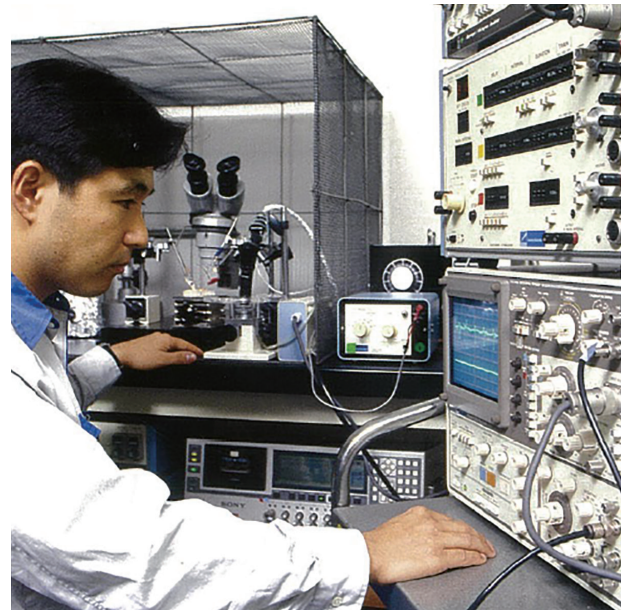


写真2. 電気生理学の実験機器（1990年代）  
（小田原研究所のパフレットから引用）

ンは受容体へ強い結合力を示した。

## (3) 動物慰霊碑での虫供養

この2つの異なる実験方法でモスピランが、この作用点にアゴニストとして作用することを明らかにした（アゴニスト：もともと生物が持っている神経伝達物質であるニコチンと同じ興奮作用を示す化合物）。モスピランを処理した害虫が痙攣などの「興奮作用」を示した後に死亡するのが、作用点で生じていることがこれでお分かりでしょう。

ゴキブリさんたちとイエバエさんたち、あとで出てくるアフリカツメガエルさんたち、ごめんなさい。それ以来（それ以前からも）、当時の小田原研究所の動物慰霊碑での虫供養や動物慰霊は欠かしていません！

## 3. 視点：レモンをレモネードに変える

### (1) レモン（欠点）

モスピランは、卵からふ化したてのコナガ幼虫には効くが、大きく成長した幼虫（中齢～老齢幼虫）には効きが良くない。この現象はハスモンヨトウやオオタバコガでも同じである。「これでは、キャベツの害虫による食害を発見してからモスピランを散布してもダメじゃないか！」と営業マンに怒られそうだ。また、イネを加害するウンカ類にも効かない。このようなモスピランの欠点は、本剤の研究段階か

ら研究サイドではすでにわかっていた。

その理由を解明したのが、岩佐孝男だ。彼はアメリカのノースウエスタン州立大学に研究員として日本曹達(株)から派遣され、モスピランの昆虫における薬物代謝の研究を行った。モスピランはチョウ目害虫幼虫の体内で酸化酵素 (CYP) によって代謝分解され、多くが殺虫活性を持たない化合物 (代謝物) になってしまう。その分解力はふ化幼虫では弱いものの、中～老齢幼虫では強い。でも…、こんな結果はモスピランが効かない言い訳…?

## (2) レモネード (長所) : ミツバチへの低毒性

ここからが、レモネードへ変えた岩佐さんの努力の賜物である。アメリカへ派遣される以前から、岩佐さんはミツバチの室内試験から、モスピランが他のネオニコチノイド剤 (チアクロプリドを除く) とは異なり、ミツバチに影響が少ないこと明らかにしていた。そこで、岩佐さんはアメリカの派遣先大学で、ミツバチの低毒性のメカニズム (理由) も生化学的手法で解明した。結果は、先述のヨトウ類の幼虫を用いた実験と同様であり、薬物酸化酵素 (CYP) による解毒分解力の増大である。モスピランのミツバチ体内での代謝物はミツバチに殺虫力を持たない。一方、その他のネオニコチノイド剤 (チアクロプリドを除く) の代謝物は、ミツバチへの殺虫力があり、現場での毒性を回避できなかったのだ。

この研究成果は英文で執筆され、引用回数の多い名論文となった。ちなみに、この研究成果の日本語解説は「農業時代 190, 30-36」に執筆されている。

## 4. 視点 : ネオニコチノイド剤抵抗性害虫に効くモスピラン

### (1) あるデータをきっかけに

時は流れて…、2013年のある日、小田原研究所のデスクで山本 (当時、生物研究部殺虫剤研究 G 長) は宮崎県農業試験場の研究レポートを見ていた。そこには、ネオニコチノイド剤が効かなくなった抵抗性ワタアブラムシに、モスピランが効く殺虫試験データがあった。「この理由は解明できるな！」と山本は妄想しつつも確信していた。

### (2) 農林水産省委託プロジェクト研究への参画

2010年代になると、科学技術の進展とともに日

曹にも新しい研究技術を習得した研究員が入社しはじめた。そのため、次の小項目で紹介する研究技術も日曹は兼ね備えていた。山本が上記の宮崎県レポートを見た数ヶ月後、日本曹達と宮崎県と農研機構の3者での共同研究がセットアップされ研究が始まった。そしてこの共同研究は発展して、農林水産省の研究プロジェクトに採択された。それは、農林水産省委託プロジェクト研究「ゲノム情報等を活用した薬剤抵抗性管理技術の開発」(2014~18)である。山本は名ばかりの日曹の研究代表者になったが、実際には平田晃一さんと金澤潤さんといった優秀な日曹の研究員の神の手が動き、次の研究成果をあげた。

### (3) 抵抗性系統ではアセチルコリン受容体の形が変化していた

まず平田さんが、ワタアブラムシのニコチン性アセチルコリン受容体の構造 (塩基配列) を調べた。そして、ネオニコチノイド抵抗性系統では、 $\beta$ 1-サブユニット・ループDの81番目のアミノ酸が、アルギニン (R) からスレオニン (T) に変化した作用点変異 (R81T) があることを解明した。この作用点変異が次以降のモスピランの特長を解明する研究材料となった。

### (4) コンピューター上でアセチルコリン受容体の実験をする

この変異 (R81T) した受容体を、なんと計算科学的にコンピューター上に発現させてしまったのが金澤さん (当時、創薬研究部) だ。この変異した作用点に薬剤が結合しやすいかどうか、その強弱を調べた。ニトロ基をもつネオニコチノイド剤は、アルギニンが無くなってしまった作用点 (R81T) には結合しにくいので神経伝達ができなかった。一方、シアノ基をもつモスピランでは、変異してなくなったアルギニンよりも別のアミノ酸 (システイン) との結合の相性がもともと良く、正常な神経伝達をしていることがわかった。その理由で、作物生産現場で困っている抵抗性害虫 (R81Tの害虫) にモスピランが効くことを突き止めた。簡単に言うと、「ニトロ基を含むネオニコチノイド剤とモスピラン (シアノ基含む) は、同じ作用点 (ニコチン性アセチルコリン受容体) に作用し神経伝達するが、それぞれがくっつく部位が少し違う」のである。



プリントされているクジラは「世界一大きな動物」であるが、モスピラン剤の「いろいろな作物に高い（大きな）効果をしめす」ことを表現している。

## 7. おわりに

本稿を一言でまとめると、「モスピランの他剤とは異なる光る特長を科学的に明らかにしてきたアナザーストーリー」である。モスピラン開発 30 年を記念して、農業生産現場ではあまり語られなかった他のネオニコチノイド系殺虫剤との差別化研究（特に生物研究）の苦労話を取り上げた。できるだ

け一般の方々へも理解していただきたく、学術的な報告をできるだけかみ砕いでわかりやすく説明してみた。したがって、専門的には不十分な表現や、ロジックを割愛している部分もあるがご容赦いただきたい。（引用文献も割愛した。）一方、製品をより身近に感じてもらうための広告宣伝活動の例として歴代のノベルティを紹介した。

今後ともモスピランが世界の農業生産現場へ持続的に貢献し、IPM（総合的病害虫・雑草管理）の化学的防除の一資材として、これからも活躍することを期待したい。