

# ピロキサスルホン (ブランドネーム：アクシーブ®) の国内畑作分野での展開

クミアイ化学工業株式会社  
生物科学研究所  
板屋 大吾  
吉野 幸則  
胡 文倩

## はじめに

ピロキサスルホン (ブランドネーム：アクシーブ®) は、クミアイ化学工業 (株) が開発したイソキサゾリン環を有する新規除草剤で、ダイズ、トウモロコシ、コムギなど多くの畑作物用土壌処理剤として、現在ではオーストラリアや米国をはじめとした世界 21 カ国で農業登録され使用されている。日本においては、ピロキサスルホン含有混合剤として、コムギ用にキタシーブ® フロアブルが農業登録され販売 (2021 年より)、ダイズ用にクリアシーブ® 乳剤が農業登録 (2023 年 3 月) されている。

本報では、ピロキサスルホンの畑作用除草剤としての生物活性に触れ、キタシーブ® フロアブル、クリアシーブ® 乳剤を中心に、国内畑作分野での本化合物における雑草防除技術について紹介する。

## 1. ピロキサスルホンの概要

### (1) 物理化学的性状と安全性

ピロキサスルホンは、イソキサゾリン環とピラゾール環の 2 つのヘテロ環を有する構造を持つ。本化合物は、クミアイ化学工業 (株) が開発した除草剤原体ベンチオカーブの活性本体であるチオカーバメートスルホキシドを参考に合成が進められ、開発された化合物である。特徴的な物理化学性とし

て、水溶解度、土壌吸着係数 ( $K_{\text{FOC}}^{\text{ads}}$ ) が、それぞれ 3.49 mg/L (20 °C)、36-664 (日本土壌条件 25 °C) であり、既存の畑作土壌処理除草剤と比較していずれも値が小さい化合物である (Nakatani *et al.* 2016)。また、人畜、環境生物への安全性も高い。

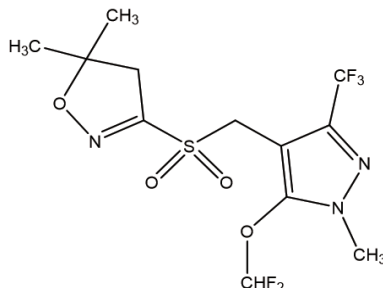
一般名：ピロキサスルホン

(ISO 名：pyroxasulfone)

化学名 (IUPAC)：

3-[5-(difluoromethoxy)-1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-4-ylmethylsulfonyl]-4,5-dihydro-5,5-dimethyl-1,2-oxazole

構造式：



分子式：C<sub>12</sub>H<sub>14</sub>F<sub>5</sub>N<sub>3</sub>O<sub>4</sub>S

分子量：391.32

性状：白色固体

融点：130.7 °C

水溶解度：3.49 mg/L (20 °C)

蒸気圧：2.4×10<sup>-6</sup> Pa (25 °C)

土壌吸着性： $K_{\text{FOC}}^{\text{ads}} = 38-66$  (日本土壌条件 25 °C),  $K_{\text{FOC}}^{\text{ads}} = 57-114$  (米国土壌条件 25 °C)

人畜毒性：

急性経口毒性

ラット♀ LD<sub>50</sub> >2,000 mg/kg

急性経皮毒性

ラット♂♀ LD<sub>50</sub> >2,000 mg/kg

魚毒性：96hLC<sub>50</sub> >3,750 µg/L (コイ), >2,800 µg/L (ブルーギル), >2,100 µg/L (ニジマス)

### (2) 作用機構および殺草作用症状

ピロキサスルホンの作用機構は、超長鎖脂肪酸伸長酵素阻害 (HRAC 分類グループ 15) に分類され、植物表皮のワックス層や細胞膜を構成するスフィンゴ脂質等の主成分である超長鎖脂肪酸 (Very-Long-Chain Fatty Acid, VLCFA) の生合成を触媒する酵素、超長鎖脂肪酸伸長酵素 (Very-Long-Chain Fatty Acid Elongase, VLCFAE) を阻害する。また、植物の小胞体には複数の VLCFAE が存在しているが、ピロキサスルホンは C18:0 → C20:0, C20:0 → C22:0, C22:0 → C24:0, C24:0 → C26:0 ならびに C26:0 → C28:0 の複数の各伸長反応を低濃度にて阻害する (Tanetani *et al.* 2009)。本剤を処理した感受性植物は、VLCFA の生合成が阻害されることで、細胞分裂や伸長が抑制され、出すくみや生育抑制といった作用症状を示しながら、最終的には枯死に至る。

### (3) 生物活性

ピロキサスルホンは、既存の同作用機構の化合物と比較して低用量で、一年生のイネ科雑草、カヤツリグサ科雑草、広葉雑草に対して、発生前土壌処

表-1 ピロキサスルホンの発生前土壌処理による主な畑作雑草に対する除草効果  
Yamaji *et al.* 2014 から抜粋

ピロキサスルホン薬量 (g a.i./10a)	雑草名
1.6	イヌビエ, エノコログサ, キンエノコロ, メヒシバ, オオクサキビ, オヒシバ
3.2	メリケンニクキビ, セイバンモロコシ, ナルコビエ, アオゲイトウ
6.3	キハマスゲ, シロザ, イヌホオズキ, サナエタデ
12.5	イチビ, マルバアメリカアサガオ

理で幅広い殺草スペクトラムを示す特徴を有す。温室内ポット試験の結果、1.6 g a.i./10a でイヌビエやエノコログサを含むイネ科雑草6草種に対して達観90%以上の除草効果を示し、3.2 g a.i./10a 以上では、アオゲイトウ、イチビ、キハマスゲ等の広葉雑草やヤツリグサ科雑草に対しても90%以上の効果を示した(表-1)。また、ピロキサスルホンは、ダイズ、コムギ、トウモロコシといった主要畑作物に加え、ヒマワリ、乾燥豆類(レンズマメ、ヒヨコマメ)に対して播種前～発芽後生育期処理で高い安全性を示す。また、処理時期や方法は限定されるものの、ラッカセイ、バレイショ、タマネギといった作物に対しても高い安全性を示し、近年ではこれらの作物でも使用されている(Geier *et al.* 2006, Sikkema *et al.* 2008, Knezevic *et al.* 2009, Walsh *et al.* 2011, Olson *et al.* 2011, Boydston *et al.* 2012, Yamaji *et al.* 2014, Zandstra *et al.* 2018)。この作物安全性の高さによる、適用作物および処理時期の広さは、本化合物の特徴の一つとなっている。

## 2. 北海道コムギ作用除草剤 キタシーブ®フロアブル

### (1) キタシーブ®フロアブルの概要

キタシーブ®フロアブル(開発コー

ド:KUH-165)は、ピロキサスルホン・7.4%, ジフルフェニカン・7.4%の2成分を含有する、北海道コムギ作用土壌兼茎葉処理除草剤である。本剤は、2020年に農薬登録(登録番号第24415号)され、2021年より北海道にて販売開始された。本剤は、北海道コムギ作において防除対象となる、スズメノカタビラ、イヌカミツレ、ハコベ、スカシタゴボウ、コヌカグサ(種子発生)等の一年生イネ科・広葉雑草に対して、持続的且つ安定した除草効果を示す高性能剤であり、コムギに対する安全性も高い。本剤の実用薬量は80-100 ml/10aであり、使用時期はコムギ播種後からコムギ3葉期まで(雑草の発生前から発生始期まで)、使用方法は雑草茎葉散布又は全面土壌散布である。

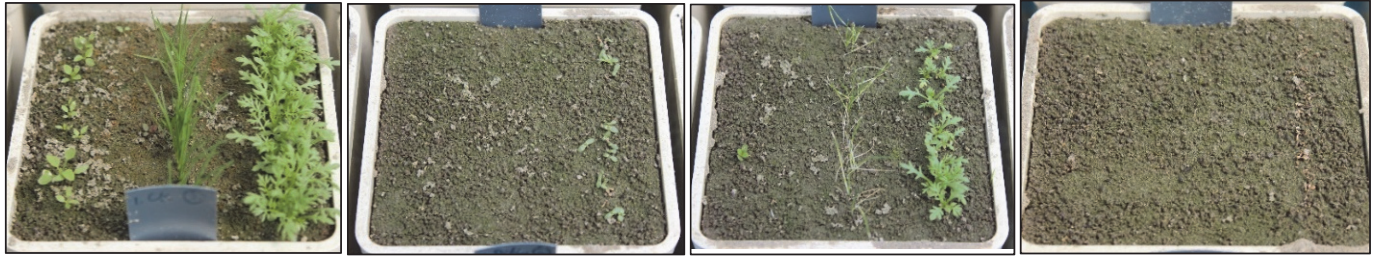
### (2) 各有効成分の特長と混合相性

キタシーブ®フロアブルの有効成分のうち、ピロキサスルホンは一年生イネ科雑草を中心に一部の広葉雑草も加えて高い除草効果および効果持続性を示す。一方、ジフルフェニカン(作用機構:カロテノイド生合成経路のフィトエン不飽和化酵素(PDS)阻害, HRAC分類グループ12)は、広葉雑草を中心に発生前～発生始期に高い除草効果を示す。これら異なる特徴を持つ2つの有効成分の混用により、殺草スペクトラムの拡充および除草効果の

増強が期待され、実際に同事象を確認している。温室内ポット試験にて、コハコベ、スズメノカタビラ、イヌカミツレに対する発生前処理の効果を確かめたところ、各単剤では残草が認められたが、混用により何れの草種も完全枯殺し(図-1)、コハコベおよびスズメノカタビラに対する効果においては、Colby期待値法(Colby 1967)による相加～相乗的効果向上を示した(図-2)。

### (3) 北海道コムギ作を想定した適用性

キタシーブ®フロアブルの北海道コムギ作の主要雑草に対する、発生前処理および発生始期処理時の除草効果および効果持続性を、温室内ポット試験で確認した。本剤は発生前～2葉期のスズメノカタビラ、発生前～本葉1対葉期のコハコベ、発生前～子葉期のイヌカミツレに対して極大効果を示し、いずれの草種に対しても市販剤A剤と同等以上の除草効果を示した(図-3)。また、本剤は処理42日後に播種したスズメノカタビラ、処理21日後に播種したイヌカミツレに対して高い除草効果を示し、市販剤A剤と同等以上の残効性を示した(図-4)。さらに、北海道コムギ作の難防除雑草である、多年生イネ科雑草コヌカグサ(レッドトップ)の地下茎に対して、本剤は、実用薬量の80-100ml/10a



無処理

ピロキサスルホン  
8 g a.i./10a

ジフルフェニカン  
8 g a.i./10a

ピロキサスルホン  
+  
ジフルフェニカン  
8+8 g a.i./10a

図-1 ピロキサスルホンとジフルフェニカンの混用時の除草効果 (処理後 16 日)

クミアイ化学工業 (株) 温室内 (静岡県菊川市) ポット試験 (畑壤土)。供試草種: コハコベ (左), スズメノカタビラ (中), イヌカミツレ (右)。

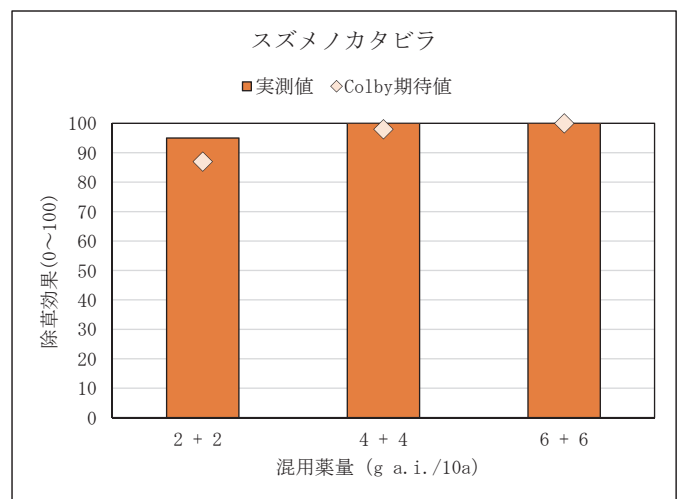
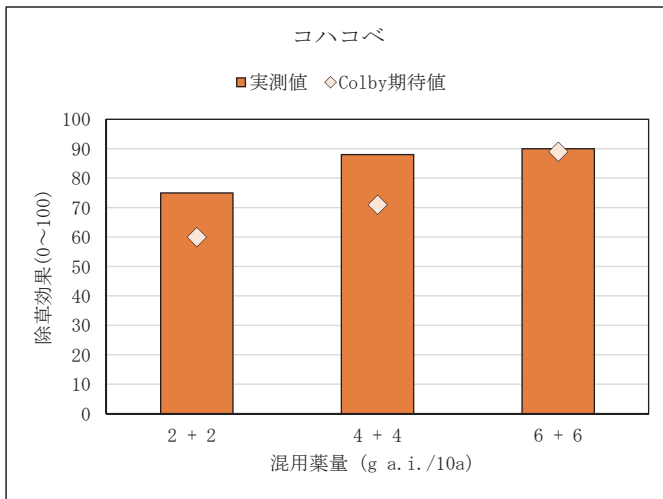


図-2 ピロキサスルホンとジフルフェニカンの混用時の発生前処理におけるコハコベおよびスズメノカタビラに対する効果

クミアイ化学工業 (株) 温室内 (静岡県菊川市) ポット試験。除草効果は観察調査指数 (0: 効果なし~ 100: 完全枯死) で示し、処理後 34 日の調査結果を示した。

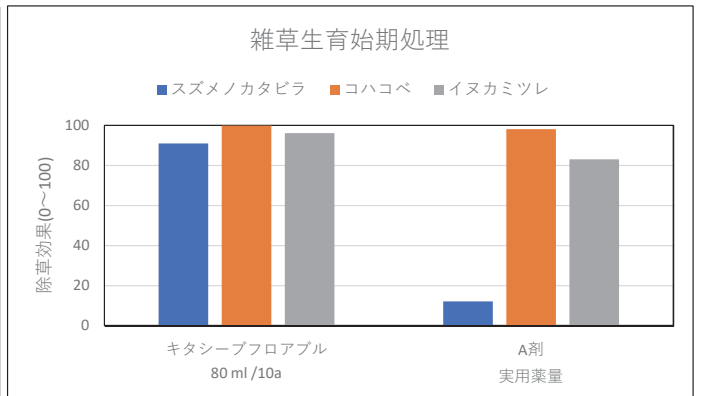
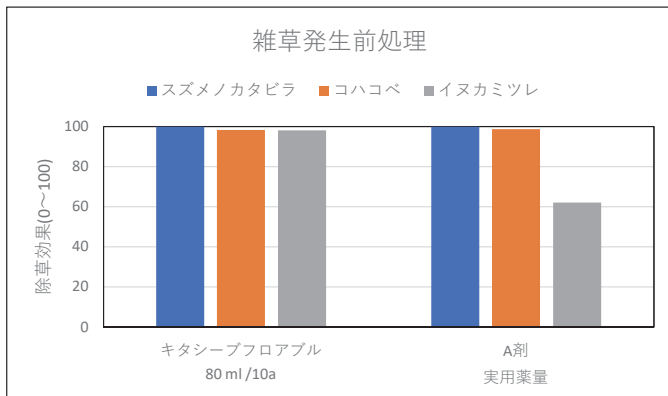


図-3 北海道コムギ作主要雑草に対する処理時期別の除草効果

クミアイ化学工業 (株) 温室内 (静岡県菊川市) ポット試験。

雑草発生前処理は、雑草の葉齢が、スズメノカタビラ 2 葉期、コハコベ本葉 1 対葉期、イヌカミツレ子葉期時に行った。除草効果は、観察調査指数 (0: 効果なし~ 100: 完全枯死) を示し、発生前処理試験では、スズメノカタビラとコハコベは処理後 35 日、イヌカミツレは処理後 30 日の調査結果、発生前処理では、スズメノカタビラは処理後 46 日、コハコベは処理後 47 日、イヌカミツレは処理後 36 日の調査結果を示した。

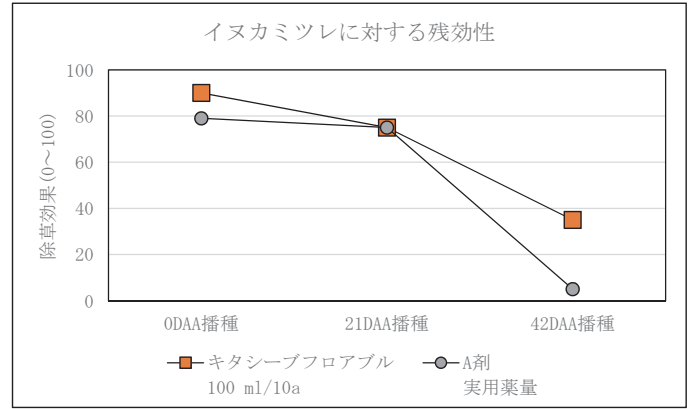
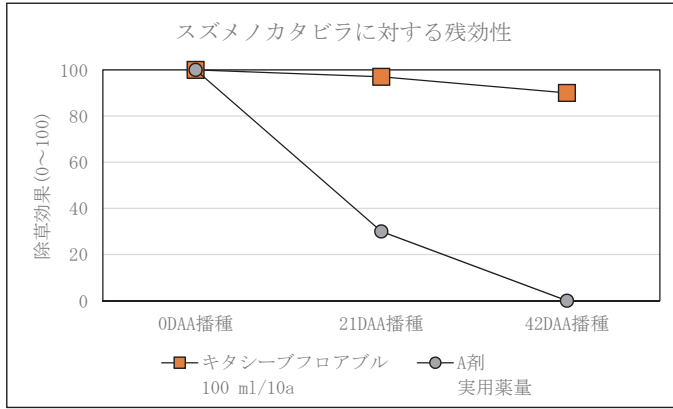


図-4 スズメノカタビラ、イヌカミツレに対する残効性（薬剤処理後、所定日に各草種を播種した）  
クマイ化学工業（株）温室内（静岡県菊川市）ポット試験。除草効果は観察調査指数（0:効果なし～100:完全枯死）を示し、処理後65日の調査結果を示した。

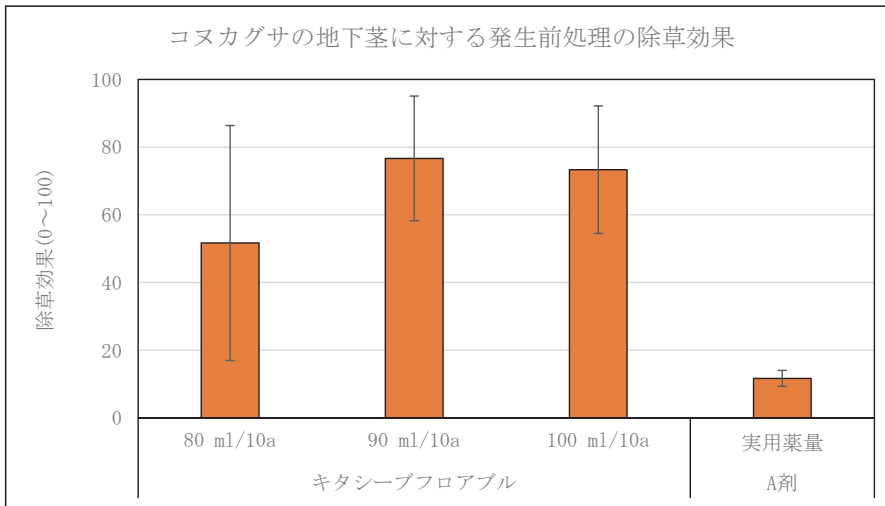


図-5 上左：コヌカグサとその地下茎，上右：切断した地下茎の節間からの再生，  
下：コヌカグサの切断した地下茎に対する発生前処理の除草効果  
クマイ化学工業（株）温室内（静岡県菊川市）ポット試験。除草効果は観察調査指数（0:効果なし～100:完全枯死）を示し、処理後31日の調査結果を示した（エラーバー：標準偏差3反復）

で、市販剤A剤に優る抑制効果を示した（図-5）。

本剤のコムギ安全性を、温室内ポット試験で確認した。その結果、北海道のコムギ品種キタノカオリ、きたほなみ、きたもえ、ゆめちから、はるきらり、ハルユタカに対し、本剤の実用上限薬量（100ml/10a）の倍薬量で、出芽前および生育期処理いずれにおいても、コムギ薬害（生育抑制と白化）は軽微であった（図-6）。

本剤の圃場条件下での適用性を、2017～2018年の北海道斜里町、幕別町、富良野市、栗山町の圃場にて評価した。斜里町で実施した雑草発生前処理では、スズメノカタビラに対して市販剤A剤に優る効果が、栗山町で実施した雑草発生始期処理では、スズメノカタビラに対して市販剤A剤に優り、イヌカミツレ、コハコベ、コヌカグサ（種子発生）に対して市販剤A剤と同等の高い効果が認められた（図-7）。また、斜里町、幕別町、富良野市で実施した出芽前および生育期処理では、コムギに対する初期薬害はいずれも市販剤A剤と同等であった（図-8）。

これらの多くの温室内ポット試験および現地圃場試験において薬効・薬害を検討した結果から、キタシーブ®フロアブルは北海道コムギ用除草剤とし

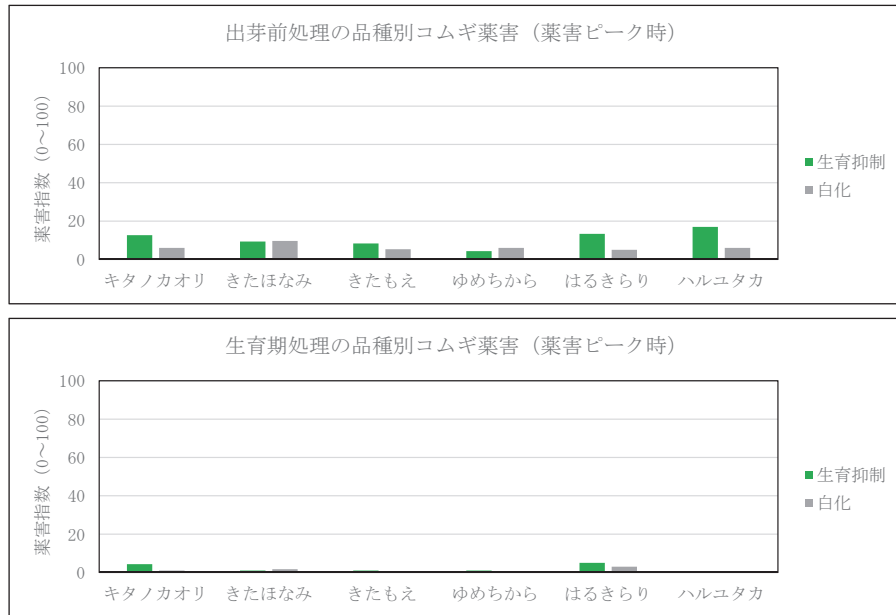


図-6 北海道のコムギ品種に対するキタシーブフロアブル 200 ml/10a 処理のコムギ葉害 (上：出芽前処理, 下：生育期処理 (コムギ 1 葉期時処理))

クミアイ化学工業 (株) 温室内 (静岡県菊川市) ポット試験。葉害指数は観察調査指数 (0: 葉害なし ~ 100: 完全枯死) を示し, 出芽前処理では処理後 7 日の調査結果, 生育期処理では処理後 14 日の調査結果を示した。葉害指数 20 以上は許容外の葉害を示す。

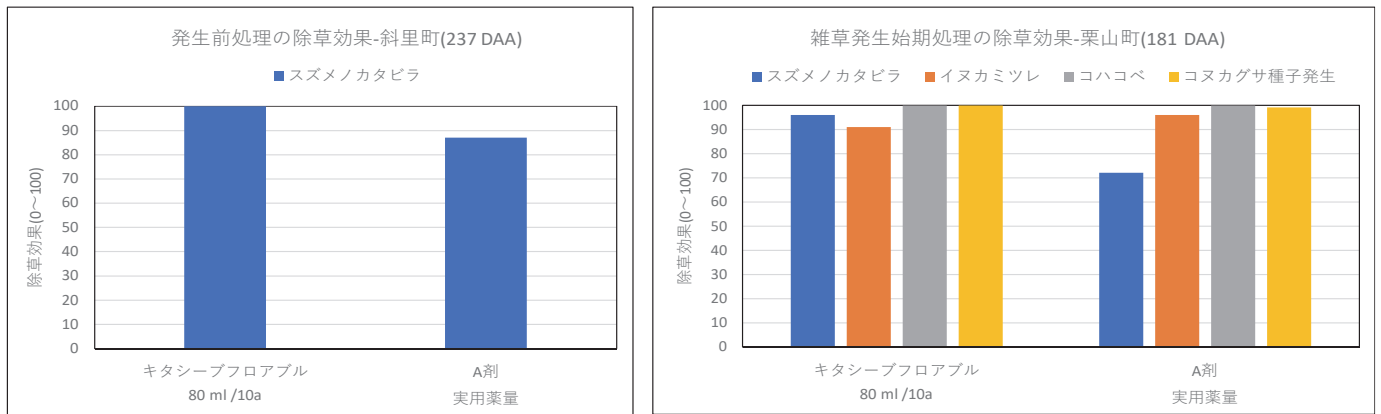


図-7 北海道現地圃場試験の除草効果評価結果

2017 年 北海道現地圃場 (斜里町), クミアイ化学工業 (株) 圃場 (栗山町) で実施。除草効果は観察調査指数 (0: 効果なし ~ 100: 完全枯死) を示す。

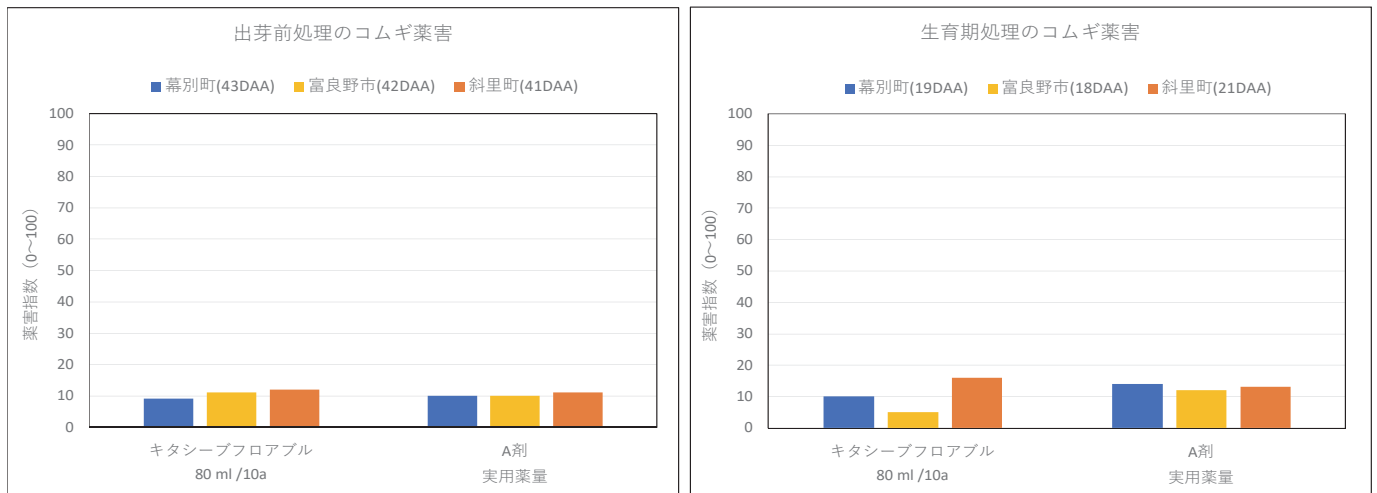


図-8 北海道現地圃場試験のコムギ安全性評価結果

2017 年 現地圃場 (幕別町, 富良野市, 斜里町) で実施。葉害指数は観察調査指数 (0: 葉害なし ~ 100: 完全枯死) を示し, 調査時期は表中記載の処理後日数 (DAA) に準じる。葉害指数 20 以上は許容外の葉害を示す。

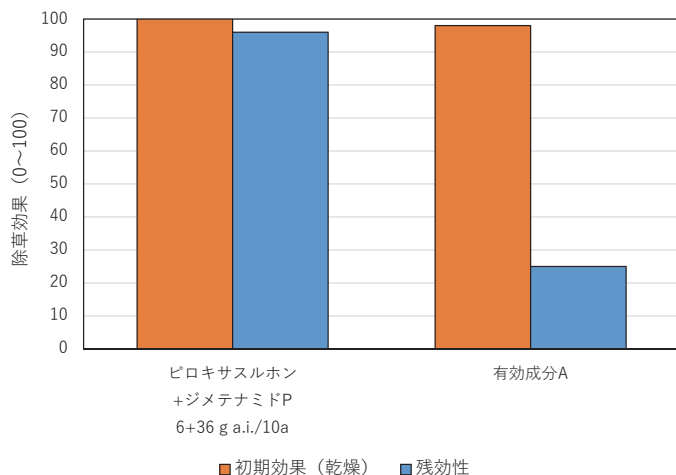


図-9 ピロキサスルホンとジメテナミドPの混用によるイヌビエに対する除草効果と残効性  
クミアイ化学工業(株) 温室内(静岡県菊川市)ポット試験。乾燥条件は薬剤処理後底面給水を制限し、ポット表面が常に乾燥するよう管理した。除草効果は、観察調査指数(0:効果なし~100:完全枯死)を示し、処理後33日の調査結果を示した。残効性は処理後32日に土壌表層にイヌビエ種子を播種し、播種後16日の観察調査指数(0:効果なし~100:完全枯死)を示した。有効成分Aは有効成分Aを単一有効成分とする国内ダイズ作市販剤を用いた。

表-2 クリアシーブ乳剤の殺草スペクトラム

薬量 (/10a)	一年生イネ科雑草						一年生広葉雑草												
	イヌビエ	オヒシバ	メヒシバ	エノコログサ	カズミソ	アゼガヤ	アオゲイトウ	ホオズキ	ヒロハフウリン	イヌホオズキ	シロサ	オオイヌタテ	スベリヒユ	エノキグサ	センダングサ	アメリカ	イチビ	ツユクサ	アサガオ類
500ml	◎	◎	◎	◎	◎	◎	◎	◎	◎	◎	◎	◎	◎	◎	◎	◎	◎	◎	○
400ml	◎	◎	◎	◎	◎	◎	◎	◎	◎	◎	◎	◎	◎	◎	-	◎	-	△	
300ml	◎	◎	◎	◎	◎	◎	◎	◎	◎	◎	○	◎	○	-	○	△	△		

◎: 極大, ○: 有効, △: やや不十分な効果, -: 評価データなしを示す  
いずれの雑草も発生前処理時の効果

て高い適用性を有することが明らかになった。

### 3. ダイズ作用除草剤 クリアシーブ® 乳剤

#### (1) クリアシーブ® 乳剤の概要

クリアシーブ® 乳剤(開発コード: KUH-209)は、ピロキサスルホン・1.2%、ジメテナミドP・7.2%、リニュロン・9.6%の3成分を含有する、ダイズ用土壌処理除草剤である。本剤は、2023年2月8日に農薬登録(登録番号第24739号)されている。本剤は、ダイズ播種後出芽前(雑草発生前)の全面土壌散布で、幅広い一年生

雑草に対して高い効果を示す。また、各有効成分の投下薬量は、実用薬量500ml/10aあたりで、ピロキサスルホンが6g a.i./10a、ジメテナミドPが36g a.i./10a、リニュロンが48g a.i./10aと、国内のダイズ用土壌処理剤の中では比較的少なく、環境負荷が小さいことが特徴である。

#### (2) 各有効成分の特長と混合相性

クリアシーブ® 乳剤は、イネ科雑草やアオゲイトウに対して高い効果を示すピロキサスルホンとジメテナミドP(作用機構: VLCFAE 阻害, HRAC 分類グループ15)、幅広い広葉雑草に対して高い効果を示すリニュロン(作用機構: PSII セリン 264 バインダー阻

害, HRAC 分類グループ5)を含み、幅広いダイズ作一年生雑草に対して高い効果を示す。また、ピロキサスルホンとジメテナミドPは、同じ作用機構で殺草スペクトラムも類似するが、物理化学性の異なる両化合物の混用により、効果が低下しやすい土壌表面乾燥条件下での効果安定化や、残効性の向上を示す(図-9)。

#### (3) ダイズ作適用性

クリアシーブ® 乳剤は、イヌビエ、オヒシバ、メヒシバなどの一年生イネ科雑草や、アオゲイトウ、ヒロハフウリンホオズキ、スベリヒユ、エノキグサなどの一年生広葉雑草など、ダイズ作で発生する一年生雑草に対して、発生前土壌処理で高い効果を示し、幅広い殺草スペクトラムを有す(表-2)。

日本の主なダイズ作地域では、播種時期が梅雨時期と重なり、土壌処理剤の効果に影響することがある。また、国内のダイズ作圃場の多くが水稲転換畑であり、前述同様に降雨が重なると、一般的に土壌処理剤の薬害が生じやすい。このような処理後に多雨が生じた際にも、本剤は安定した効果と残効性、ならびにダイズに対する高い安全性を示すことが、処理後の多雨を想定した各種温室内ポット試験の結果から明らかになっている。多雨条件下(薬剤処理後10日間以内の25mmおよび100mmの人工降雨条件)での、本剤のイヌビエに対する効果を確認したところ、本剤の効果は市販剤と同等以上であった(図-10)。また、多雨

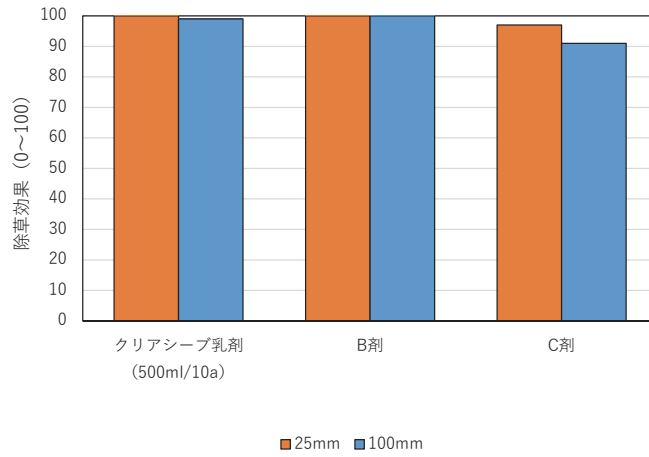


図-10 クリアシーブ乳剤の降雨量の違いによるイヌビエに対する除草効果

クミアイ化学工業（株）温室内（静岡県菊川市）ポット試験（埴壤土）。処理後10日間の積算降雨量が25mm, 100mmとなるように処理後3, 5, 7, 10日に人工降雨処理を行った。除草効果は、観察調査（0=効果なし~100=完全枯死）指数を示し、処理28日後の調査結果を示した。

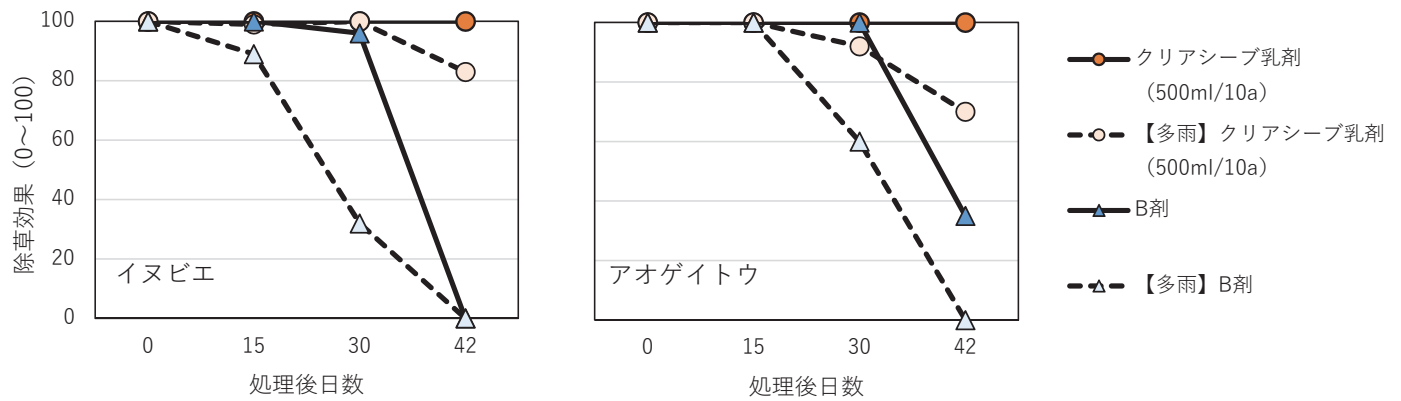


図-11 クリアシーブ乳剤のイヌビエ、アオゲイトウに対する残効

クミアイ化学工業（株）温室内（静岡県菊川市）ポット試験（埴壤土）。薬剤処理直後、15日後、30日後、42日後に土壌表層にイヌビエ、アオゲイトウを播種し、播種20日後に観察調査を行った。除草効果は観察調査指数（0=効果なし~100=完全枯死）を示す。通常降雨条件は薬剤処理直後に2mmの人工降雨処理を、多雨条件は薬剤処理直後、処理9日後、26日後に各20mmの降雨処理を行った。

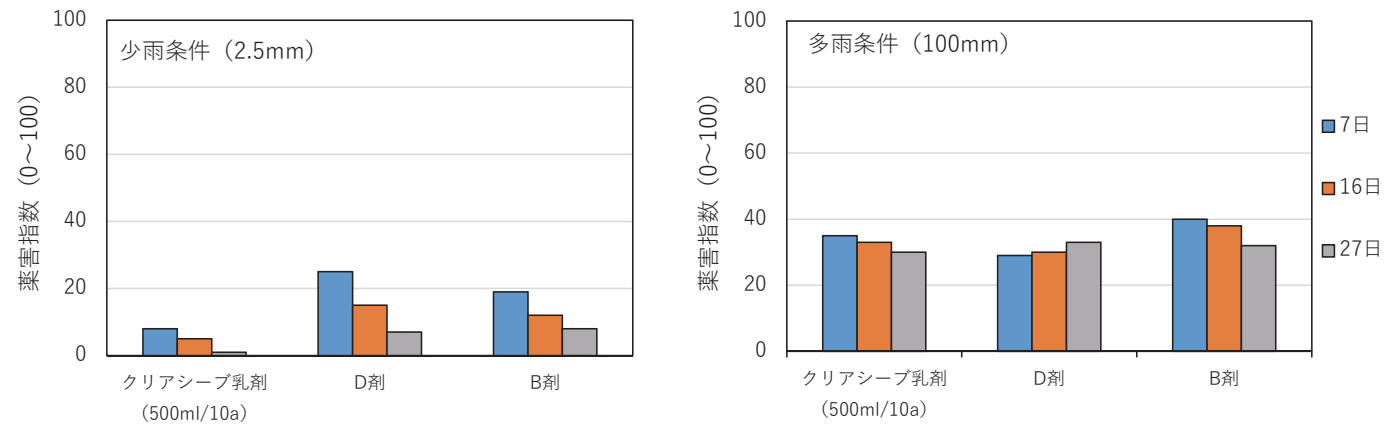


図-12 クリアシーブ乳剤のサイズに対する降雨量別の安全性

クミアイ化学工業（株）温室内（静岡県菊川市）ポット試験（砂質埴壤土、品種：フクユタカ）。通常降雨条件では、処理直後に2.5mmの人工降雨処理を、多雨条件では、処理直後、3日後、6日後、8日後、10日後に各20mmの人工降雨処理を行った（計100mm）。薬害指数は処理後7日、16日、27日の観察指数（0=影響なし~100=完全枯死）を示した。薬害指数20以上は許容外の薬害を示す。

表-3 クリアシーブ乳剤 (500ml/10a) の日植調委託試験 (2020-2022 年実施) 結果

委託年度	試験事例数	薬害程度	除草効果	効果が高いと判定された草種
2020年	4	無 (10) 微 (3)	極大 (12) 大 (1)	イヌビエ, オヒシバ, メヒシバ, エノコログサ, アゼガヤ, スズメノカタビラ, イヌビユ, ホソアオゲイトウ, ヒロハフウリンホオズキ, イヌホオズキ, エノキグサ, スベリヒユ, シロザ, イヌタデ, タニソバ, ハコベ, ナズナ, カヤツリグサ, タカサブロウ, ザクロソウ, ツユクサ
2021年	6	小 (0)	中 (0)	
2022年	3	中 (0) 大 (0)	小 (0)	

条件下での本剤のイヌビエ, アオゲイトウに対する残効性を確認したところ, 本剤の残効性は通常の降雨管理条件よりも低下したものの, その低下幅は市販剤 B 剤と比較して小さく, 本剤は安定した効果を示した (図-11)。さらに, 多雨条件下 (処理後 10 日間で 100mm の人工降雨) での本剤のダイズ薬害を確認したところ, 本剤の多雨条件下でのダイズ薬害は, 通常降雨条件 (処理直後 2.5mm の人工降雨) と比較して助長される傾向はあるものの, その程度は市販剤と同程度であった (図-12)。

2020-2022 年に実施した日植調委託圃場試験では, 本剤は, 薬量 300-500ml/10a において幅広い草種に対して高い効果を示した。また, ダイズ安全性については, 軽微な影響が 3 事例見られたが, 減収を伴う薬害は認められなかった (表-3)。

これらの多くの温室内ポット試験および現地圃場試験において薬効・薬害を検討した結果から, クリアシーブ® 乳剤はダイズ作において高い適用性を有することが明らかになり, また, 近年多発する突発的な大雨や長雨などの環境変動条件下においても, 安定した

効果が期待できる。

## おわりに

日本国内の畑作穀物作付面積は, 水稲作付面積と比較して依然として小さいが, 昨今の気候変動や海外情勢を背景とした食料安全保障の強化のため, 今後は畑作物生産量の増加が求められていく。今後も, アクシーブ® の特徴を活用した混合剤開発を精力的に進め, 雑草防除の観点から, 国内の畑作物の単収増加に貢献できるように努めていきたい。

## 引用文献

Boydston R.A., Felix J. and Al-Khatib K. 2012. Preemergence Herbicides for Potential Use in Potato Production. *Weed Technol.* 26, 731-739.

Colby, S.R. 1967. *Weeds*, 15 20-22.

Geier P.W., Stahlman P.W. and Frihauf J.C. 2006. KIH-485 and S-metolachlor efficacy comparisons in conventional and no-tillage corn. *Weed Technol.* 20, 622-626

Knezevic S.Z., Datta A., Scott J. and Porpiglia P.J. 2009. Dose-Response Curves of KIH-485 for Preemergence Weed Control in Corn. *Weed Technol.* 23, 34-39.

Nakatani M., Yamaji Y., Honda H. and Uchida Y. 2016. Development of the novel pre-emergence herbicide pyroxasulfone. *J. Pestic. Sci.* 41, 107-112.

Olson B.L.S., Zollinger R.K., Thompson C.R., Peterson D.E., Jenks B., Moechnig M., and Stahlman P.W. 2011. Pyroxasulfone with and without Sulfentrazone in Sunflower (*Helianthus annuus*). *Weed Technol.* 25, 217-221.

Sikkema S.R., Soltani N., Sikkema P.H. and Robinson D.E. 2008. Tolerance of Eight Sweet Corn (*Zea mays* L.) Hybrids to Pyroxasulfone. *Hort. Science* 43, 170-172.

Tanetani Y., Kaku K., Kawai K., Fujioka T. and Shimizu T. 2009. Action mechanism of a novel herbicide, pyroxasulfone. *Pestic. Biochem. Physiol.* 95, 47-55.

Walsh M.J., Fowler T.M., Crowe B., Ambe T. and Powles S.B. 2011. The potential for pyroxasulfone to selectively control resistant and susceptible rigid ryegrass (*Lolium rigidum*) biotypes in Australian grain crop production systems. *Weed Technol.* 25, 30-37.

Yamaji, Y. *et al.* 2014. Weed control efficacy of a novel herbicide, pyroxasulfone. *J. Pestic. Sci.* 39, 165-169.

Zandstra B. and Phillipppo C. 2018. The final word in onion weed control. 58<sup>th</sup> WSSA Abstracts 332.