

ピリミスルファン粒剤(ベストパートナー)の溶出制御技術

クミアイ化学工業(株) 製剤技術研究所 植物制御剤研究室 平岡 学

1. はじめに

新規水稲用除草剤ピリミスルファンは、株式会社ケイ・アイ研究所で合成され、クミアイ化学工業株式会社およびイハラケミカル工業株式会社が開発した幅広い雑草種に低用量で優れた除草効果を示す水稲用除草剤である。

ピリミスルファンは一発処理剤である「ベストパートナー[®]」剤の中の唯一の有効成分であり、「ベストパートナー[®]」剤は単一成分による雑草防除が可能な画期的な水稲用除草剤である。水稲用除草剤は水田に散布されるため、有効成分が漏水や落水などの水変動に影響を受けて除草効果が不安定になりやすい。しかし、「ベストパートナー[®]」剤は製剤技術を駆使したハイブリッド・リリース技術を用いることで、水変動に強くピリミスルファンの効果を効率よく発揮し、更に水稲安全性も高い製剤となっている。

本稿では、「ベストパートナー[®]」剤で用いられているハイブリッド・リリース技術を主とした製剤の設計、開発について概説する。

2. ピリミスルファンの物理化学性

製剤設計にあたっては、まず有効成分の物理化学性の把握が重要である。製剤設計にあたっての重要なファクターであるピリミスルファンの物理化学性を表-1に示した。ピリミスルファンの物理化学性で特徴的なのは水溶解度が高い

表-1 ピリミスルファンの物理化学性

融点：98.8℃			
水溶解度：114ppm (pH5, 20℃)			
オクタノール/水分配係数 logPow：0.52 (pH7)			
土壌吸着係数			
土壌A	34	土壌B	52
土壌C	34	土壌D	64

ことと土壌吸着性が低いことである。このような特徴を持つ有効成分は発生深度の深い多年生雑草に対しても高い効果を発揮すると考えられるが、一方でオーバーフローや漏水などの水変動条件において効果変動しやすいという課題がある。

3. 除草剤有効成分の水田における挙動

水田に処理された有効成分は以下のような挙動を示すと考えられる。すなわち粒剤などの形で処理された有効成分は圃場水に溶出し土壌表面で処理層を形成するが、一部圃場水に溶解(懸濁)した有効成分は降雨などの影響により、水田系外へ流出することがある。特に水溶解度の高い有効成分は、系外に流出することで効果低減のリスクが高まる可能性がある。また、土壌吸着性が低い有効成分は漏水などの影響で成分が土壌下方へ移行し、土壌表面の成分濃度が低下するとともに水稲の根部から吸収されるリスクが高まり生育に影響を及ぼす可能性がある。

ピリミスルファンは、水稻用除草剤としては比較的水溶解度が高く土壌吸着性も低いため、このような環境要因による影響を受ける可能性があると思定される。そのため本剤の商品化にあたっては、化合物の効力を最大限に発揮させるため、薬剤処理後の圃場水中の適正な有効成分濃度を長期間維持する溶出制御技術の確立を目指した。

4. 最適溶出パターンの把握

ピリミスルファンの最適溶出パターン、つまり水田に散布された製剤からピリミスルファンがいつ、どれくらいの量が溶出すれば必要とされる除草効果が得られ、かつ水稻への安全性を担保できるのかを把握するための実験を行なった。

4.1. 水稻安全性の検討

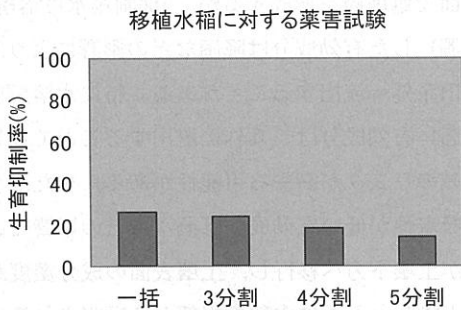
水稻安全性の検討のために一定の薬量を処理方法を変えて移植水稻に対する薬害を確認した(図-1)。具体的には1/5000aポットを用い10g a.i./10aの処理薬量を2g a.i. × 5回、4g

a.i. + 2g a.i. × 3回(計4回処理)、6g a.i. + 2g a.i. × 2回(計3回処理)の条件で分割処理して、一括処理と比較検討した。一括処理は移植5日後に10g a.i.を処理し、分割処理は1回目の処理を一括処理と同じ移植後5日後に行い、2回目以降は3日おきに行った。処理20日後に観察調査を行った結果、分割回数が増えるほどすなわち初期(移植5日後)の投下薬量が少ないほど、薬害が軽くなる傾向が認められた。

4.2. 除草効果の検討

除草効果についても第4.1.項と同様の分割処理による試験を行い、コナギ、イヌホタルイ、タイヌビエ、イヌホタルイに対する除草効果を確認した(図-2にタイヌビエの結果を示す)。具体的には2.5g a.i./10aの処理薬量を0.5g a.i. × 5回、1.0g a.i. + 0.5g a.i. × 3回(計4回処理)、1.5g a.i. + 0.5g a.i. × 2回(計3回処理)の条件で分割処理して、一括処理と比較検討した。一括処理は対象草種の2.5葉期に

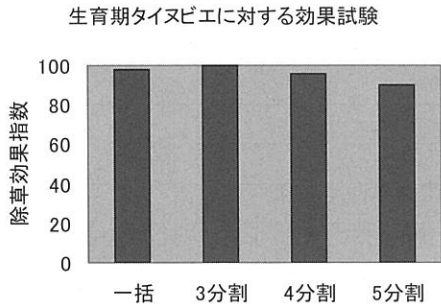
移植	+5	+8	+11	+14	+17
①一括処理	★	(10g a.i./10a)			
②3分割処理	●	○	○	(6 + 2 + 2g a.i./10a)	
③4分割処理	◎	○	○	○	(4 + 2 + 2 + 2g a.i./10a)
④5分割処理	○	○	○	○	○ (2 + 2 + 2 + 2 + 2g a.i./10a)



【試験条件】
 供試植物: イネ 品種'金南風'
 (Oryza sativa L. cv. Kinmaze)
 供試土壌: 砂質埴壤土(沖の谷土)
 調査方法: 処理20日後に観察調査
 (指数 0=薬害なし~100=完全枯死)
 試験規模: 1/5,000aポット 2反復

図-1 水稻安全性の検討

タイヌビエ処理時期	2.5L	+3	+6	+9	+12
①一括処理	★ (2.5g a.i./10a)				
②3分割処理	●	○	○	(1.5 + 0.5 + 0.5g a.i./10a)	
③4分割処理	◎	○	○	○	(1.0 + 0.5 + 0.5 + 0.5g a.i./10a)
④5分割処理	○	○	○	○	○ (0.5 + 0.5 + 0.5 + 0.5 + 0.5g a.i./10a)



【試験条件】

供試植物: タイヌビエ
 供試土壌: 埴壤土(菊川水田土)
 調査方法: 処理40日後に観察調査
 (指数 0=効果なし~100=完全枯死)
 試験規模: 1/5,000aポット 2反復

図-2 除草効果の検討

2.5 g a.i. を処理し、分割処理は1回目の処理を一括処理と同じ対象草種の2.5葉期に行い、2回目以降は3日おきに行った。分割回数が多い場合は、目的とする効果を得るまでの時間が長くなる傾向にあった。また、タイヌビエ、ミズガヤツリに対しては、分割処理では一括処理に比べて明らかに効果は低下した。最終的な効果、および効果が得られるまでの時間の両面から、初期に必要な投下薬量を考えると、最も効果の変動が大きかったタイヌビエで2g a.i./10a

程度と考えられた。5 g a.i. /10aでの製剤を考えた場合には、総薬量の50%程度(2.5 g a.i. /10a)を初期(散布約1日後)に速やかに溶出させ、残り50%を徐々に溶出させることが必要と考えられた。

4.3. 水変動時の水中濃度の検討

水変動時のピリミルスルファンの水中濃度についても検討を行った(図-3)。具体的には5g a.i./10aの処理薬量を1g a.i. × 5回、3g a.i. +

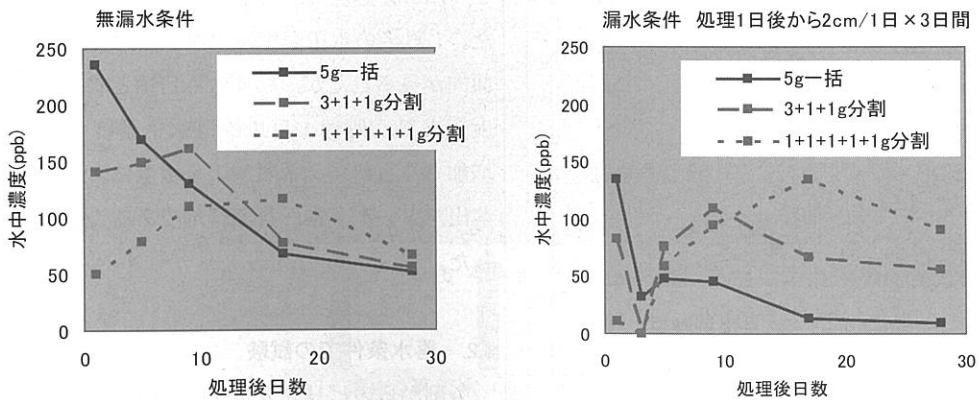


図-3 水変動時の水中濃度の検討

1 g a.i. × 2 回 (計 3 回処理) の条件で分割処理して、一括処理と比較検討した。分割処理は 1 回目の処理を一括処理と同日に行い、2 回目以降は 3 日おきに行った。処理 1 日後から 2cm/1 日の条件で 3 日間漏水操作を行い、処理方法とピリミスルファンの水中濃度の関係を調べた。その結果、一括処理した場合には漏水後に速やかに水中濃度の低下が認められるが、分割処理することで処理 4 週間後でも十分な水中濃度が確保されていた。

5. 製剤の溶出設計

第 4 項の試験結果より、水稻安全性確保と生育期処理における十分な除草効果の担保から処理 1 日後および処理 2 ~ 3 日目以降に目標となる水中濃度を確認した。つまり、葉量 5 ~ 6.7 g a.i./10a であれば、その半量程度を 1 日後に溶出させ残りを徐々に溶出させることでピリミスルファンの能力を最大限に発揮できると言える。

このことは製剤処理後の時間を横軸に取り、ピリミスルファンの水中濃度を縦軸に取った水中濃度の曲線 (溶出パターン) でモデル化することができる (図-4)。非制御型製剤の場合には、1 日後の水中濃度が高いため葉害の懸念が

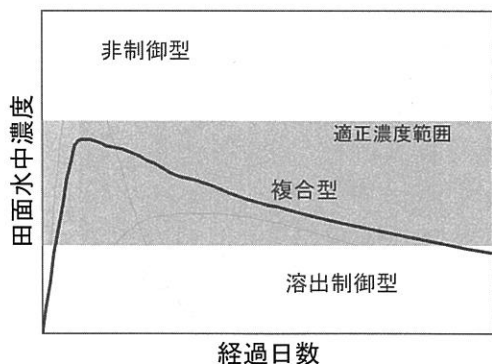


図-4 ピリミスルファンの溶出パターン

あり、また漏水や落水などの環境下では経時的に水中濃度が下がり続けて残効が短くなる。一方で溶出制御型製剤では、後半の残効は延びるものの 1 日後の水中濃度が足りずに効果不足となる。最適な溶出パターンは、1 日後に効果に必要な量を溶出し、その後溶出を制御し、最適溶出濃度を長期間にわたって担保するようなパターンである。

6. 製剤の性能評価

最適溶出パターンを目標として製剤検討を行い、複数の製剤技術を組み合わせた「ハイブリッド・リリース技術」を用いることにより、目標とした溶出パターンが得られる 1 キロ粒剤を完成させた。この 1 キロ粒剤の性能を評価する目的で、実際の圃場で起こりうる変動要因を想定した種々の条件で期待される性能を発揮するか調べた。

6.1. 水温による影響試験

実際の圃場では処理時期や地域により水温が異なるため、水温の影響を調べた (図-5)。具体的には、10℃、20℃、30℃の各温度に設定した水 700mL を入れた 1L シャーレ中に粒剤を 17.5mg 処理し、経時的に水中濃度を測定した。1 日後の水中濃度は水温が高い程高くなる傾向が見られたが、いずれも目標とする水中濃度であり、処理 1 日以降は水中濃度の経時的増加も見られた。本試験より水温によらず最適溶出パターンが得られる製剤であることを確認した。

6.2. 落水条件での試験

製剤からのピリミスルファンの再溶出性を確認するために落水条件での試験を行った (図

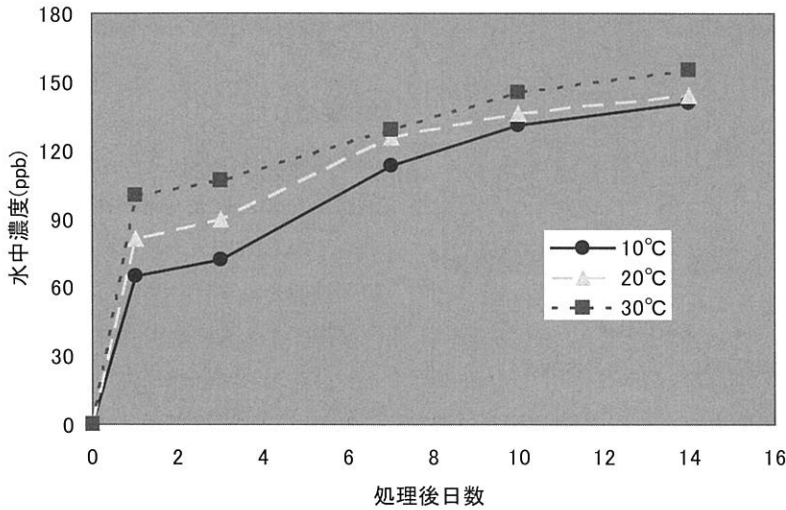


図-5 水温別の水中溶出性

-6)。具体的には、700mLの水を入れた1Lシャーレに粒剤を処理し、処理3日後(または7日後)にアスピレーターを用いて水を全量吸い出した後に再入水を行って水の入れ替え前後で経時的に水中濃度を測定した。水中濃度は再入水1日後には10~20ppbとなり、再入水7

日後には40ppbとなっていた。以上より極端な落水があった場合でも有効成分が再溶出することを確認した。

6.3. 実際の圃場での試験

実際の圃場に処理し、圃場水濃度を経時的に

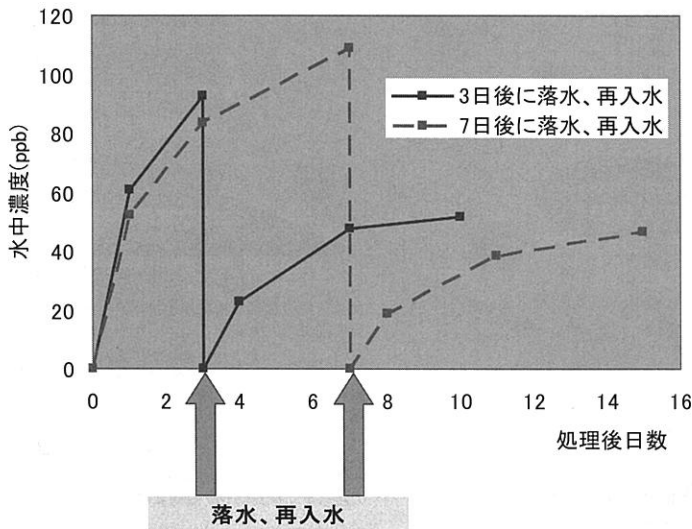


図-6 落水後の再溶出性

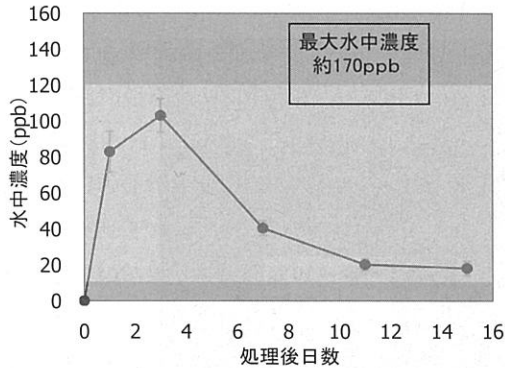


図-7 実圃場における圃場水濃度

測定することで溶出パターンを確認した(図-7)。その結果、最適溶出濃度を14日間保持しており、実際の圃場でも目的とする溶出が得られる事を確認した。

前述のモデル試験や、実際の圃場での試験でも目標とした溶出パターンが得られることを確認し、複数の製剤技術を組み合わせた「ハイブ

リッド・リリース技術」を用いたベストパートナー1キロ粒剤が完成した。

7. おわりに

我々はピリミスルファンの特徴を最大限に発揮するために、その最適溶出パターンを把握し、その溶出パターンを再現することができる製剤技術を組み合わせたハイブリッド・リリース技術により最適溶出パターンの製剤化に成功した。ところでピリミスルファン以外の有効成分についてもそれぞれ最適溶出パターンが存在し、また複数の有効成分を含む製剤の場合、有効成分ごとに異なる溶出パターンが必要になってくると思われる。今回開発したハイブリッド・リリース技術の考え方は多くのケースで応用可能と思われ、今後も有効成分をより有効に活用していくために研究を続けていきたい。

雑草・病害・害虫の写真 15,000点と解説を 無料公開

病害虫・雑草の情報基地として
インターネットで見られます。
ご利用下さい。



Please access
boujo.net

<http://www.boujo.net/>

病害虫・雑草の情報基地

検索



電子ブックで公開

日本植物病害大事典

農業分野で重要な植物病害を写真と解説で約6,200種収録した最大の図書を完全公開。(1,248ページ)

日本農業害虫大事典

農作物、花卉、庭木、貯蔵植物性食品を含む、害虫1,800種を専門家により、写真と解説で紹介した大事典を完全公開。(1,203ページ)

三雑草図鑑

水田・水路・湿地から畑地・果樹園・非農耕地に発生する483余種の雑草を幼植物から成植物まで生育段階の姿で掲載。(192ページ)

全国農村教育協会

〒110-0016 東京都台東区台東1-26-6
<http://www.zennokyo.co.jp>