

水稲除草剤メタゾスルフロンの特性と最近の開発・普及状況

日産化学株式会社
農業化学品事業部
企画開発部

佐伯 学

はじめに

食糧生産現場において、除草剤が生産者を過酷な草むしりから解放したことは周知の事実であるが、近年ではその除草剤としての性能のみならず、高い安全性および低環境負荷がSDGsの観点からも益々重要な要素となっている。除草剤の中でもアセト乳酸合成酵素（ALS）阻害剤はその高い安全性と優れた効果から全世界で多種多様な化合物が創製・開発され、日本の水稲栽培においても広く普及している。

メタゾスルフロンは、日産化学株式会社が2000年代初頭に見出した新規スルホニルウレア系化合物のALS阻害剤である。ヘクタール当たりの必要量は60～120gの低薬量で、ノビエを含む各種一年生雑草および多年生雑草に対して高い除草効果を示す。また移植水稲および直播水稲に対する優れた安全性に加え、哺乳動物や各種環境生物に対して高い安全性を有することが確認されている。雑草地上部の生育を抑制・枯死させるだけでなく、雑草の根部にも強く作用することで多年生雑草も確実に防除することができ、近年問題となっているALS阻害剤抵抗性雑草に対しても優れた除草効果を発揮することが特長となっている（佐伯ら2016）。

メタゾスルフロンは「アルテア®」として2013年より日本国内での販売が開始され、本剤を配合した各種一発処理除草剤および中・後期処理除草剤

が水稲生産現場で広く使用されている。海外においては2012年に韓国で販売が開始され、現在は中国、台湾、ベトナム、バングラデシュでも各種製品が販売されている。

1. 物理化学的性状と安全性

メタゾスルフロンの化学構造式を図-1に、物理的・化学的性質を表-1に示した。適度な水溶解度により田面水に拡散しやすい特徴を有し、薬剤処理後の圃場全体に速やかに有効成分が行き

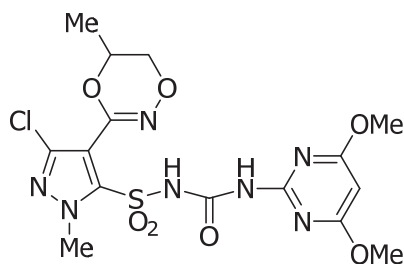


図-1 メタゾスルフロンの化学構造式

渡ることによって安定した除草効果を発揮する。

メタゾスルフロンの安全性試験結果を表-2に示した。各種哺乳動物や環境生物に対して、極めて高い安全性を有することが確認されている。

2. 作用機作

各種植物から抽出したALSに対する酵素阻害活性試験を実施したところ強い阻害活性が確認されたことから、メタゾスルフロンの作用機作はALS阻害であると考えられ、HRACグループ2に分類されている。雑草は分岐鎖アミノ酸の生合成が阻害された結果、枯死に至る。またメタゾスルフロンは、ALS阻害剤抵抗性および感受性のオモダカのALSを用いた阻害活性試験において同等の活性を示した（図-2）（H. Kobayashi *et al.* 2008）。

表-1 物理的・化学的性質

一般名 化学名（IUPAC名）	メタゾスルフロン 1-〔3-クロロ-1-メチル-4-[(5RS)-5,6-ジヒドロ-5-メチル-1,4,2-ジオキサジン-3-イル]ピラゾール-5-イルスルホニル〕-3-[(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)尿素]
開発コード	NC-620
CAS No.	868680-84-6
分子式	C ₁₅ H ₁₈ ClN ₇ O ₇ S
分子量	475.86
外観・臭気	白色結晶性固体、無臭
密度	1.49 g/cm ³ (20℃)
融点	175.5～177.6℃（分解）
水溶解度	33.3 mg/L（蒸留水、pH6.4, 20℃）
蒸気圧	7.0×10 ⁻⁸ Pa (25℃)
解離定数（pKa）	3.4 (20℃)
オクタノール／水分配係数（log P _{ow} ）	-0.35 (pH7, 25℃)

表-2 メタゾスルフロン安全性試験結果

試験名	供試生物	結果
急性経口毒性	ラット	LD ₅₀ >2000 mg/kg
急性経皮毒性	ラット	LD ₅₀ >2000 mg/kg
急性吸入毒性	ラット	LC ₅₀ >5.05 mg/L
皮膚刺激性	ウサギ	刺激性なし
目刺激性	ウサギ	軽微刺激性
変異原性	Ames 試験	陰性
	小核試験	陰性
魚類急性毒性	コイ	LC ₅₀ >95.1 mg/L
急性遊泳障害	オオミジンコ	EC ₅₀ >101 mg/L
生態毒性	セイヨウミツバチ	LD ₅₀ >100 μg/頭 (経口, 接触)
	コウリンウズラ	LD ₅₀ >2000 mg/kg (経口)
	ミミズ	LC ₅₀ >1000 mg/kg

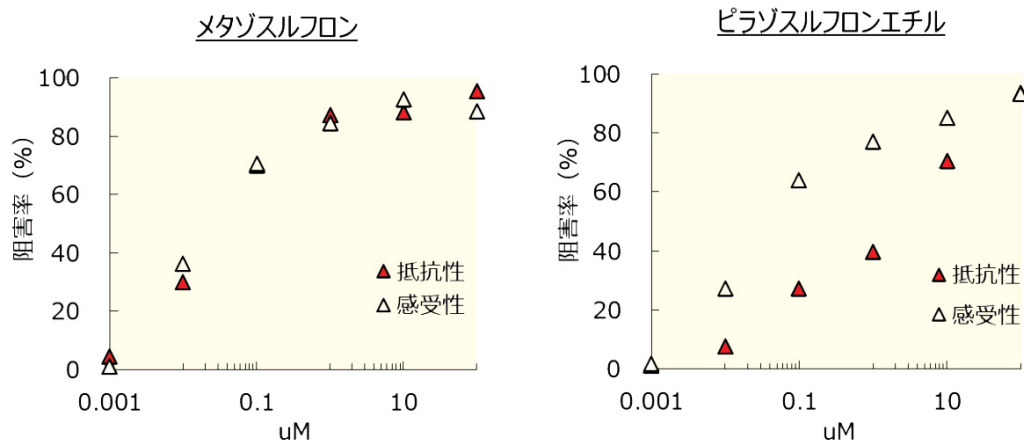


図-2 スルホニルウレア感受性 (SU-S) およびスルホニルウレア抵抗性 (SU-R) オモダカから抽出した ALS に対するメタゾスルフロンおよびピラゾスルフロンエチルの酵素阻害活性
ALS 活性は Westerfield 法 (1945) の改良法で測定した。温室で栽培した埼玉県産 SU-S オモダカおよび岩手県産 SU-R オモダカを用いた。アセトインの蓄積は 530 nm の吸光度から測定しアセトイン蓄積に基づいて ALS 阻害率を計算した。

このことは作用点抵抗性個体に対して
も効果を発揮することを示し、実際の
雑草に対する温室および圃場における
除草活性試験においても、感受性／
抵抗性の両方の雑草に高い効果を有す
ることが確認されている (矢野哲彦ら
2012)。

3. 水稻用除草剤としての 特性 (特長)

メタゾスルフロンの除草活性を図
-3 に示した。メタゾスルフロンはノ
ビエを含む各種一年生雑草に加えて、
クログワイ、オモダカなどの多年生雑
草に対しても高い除草活性を示し、幅
広い殺草スペクトラムを有することが

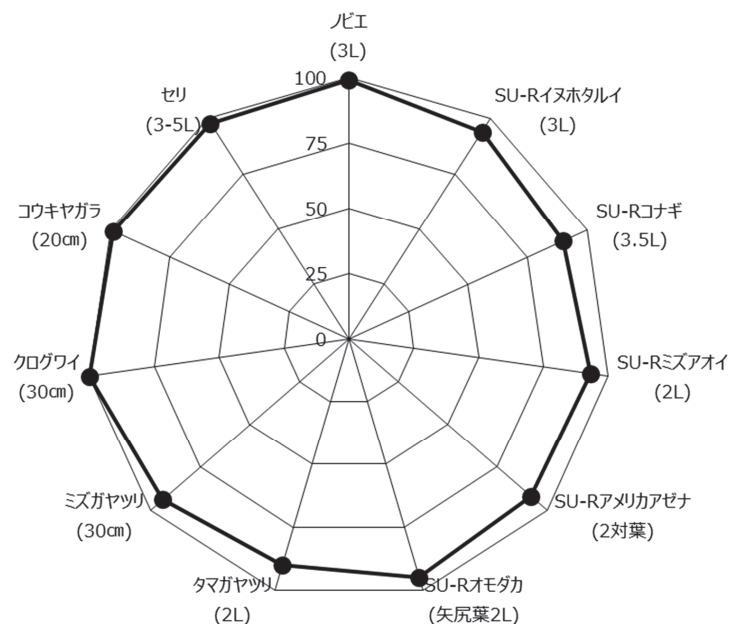


図-3 メタゾスルフロン (100 g a.i./ha) の主要水田雑草に対する除草活性
観察評価 (0 = 影響なし ~ 100 = 完全枯死) () 内は処理時葉齢

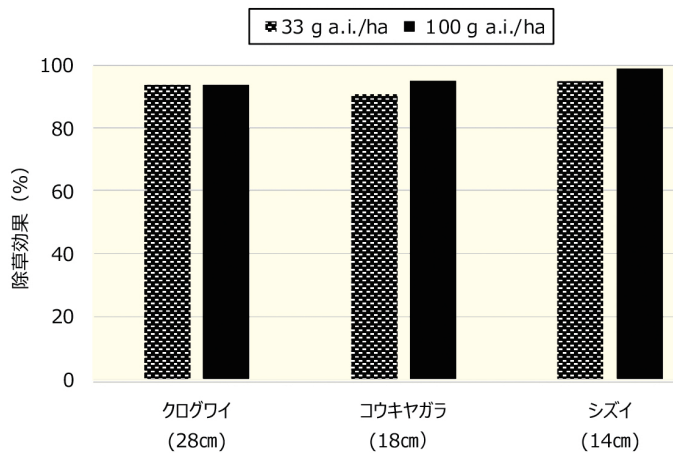


図-4 メタゾスルフロンの多年生カヤツリグサ科雑草に対する除草活性
散布後 34～56 日目に観察評価 (0 = 影響なし～100 = 完全枯死) () 内は処理時葉齢

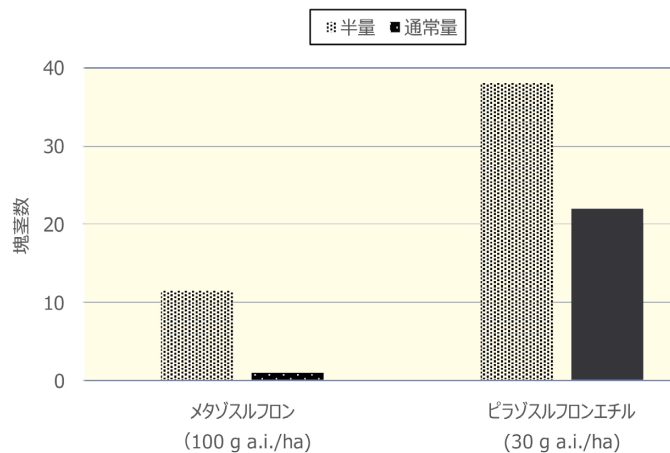


図-5 メタゾスルフロンのクログワイ塊茎形成抑制効果
発生前処理 移植後 96 日目の塊茎数

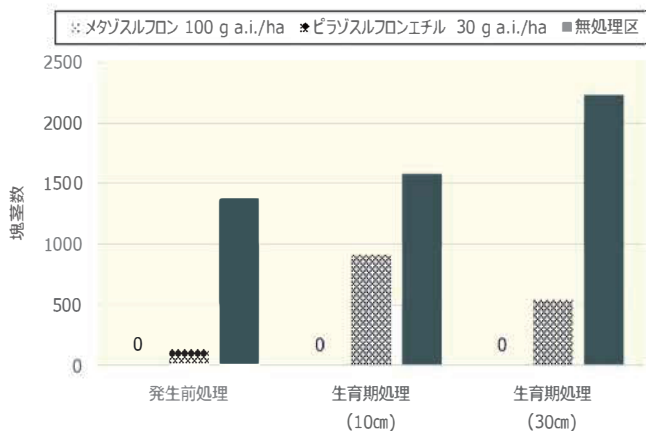


図-6 メタゾスルフロンのシズイ塊茎形成抑制効果
移植後 154 日目の塊茎数

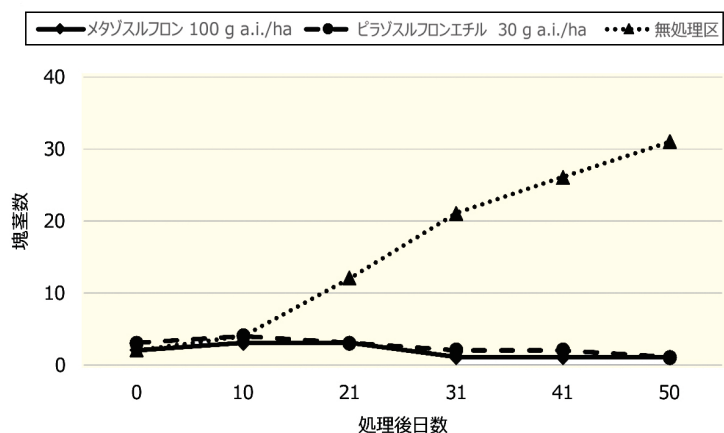


図-7 メタゾスルフロンのコウキヤガラ分株形成抑制効果
処理時葉齢は草丈 30cm

確認されている。さらに、近年問題となっているALS阻害剤抵抗性雑草に対しても除草効果が高いことが分かっている(矢野哲彦ら 2012; T. Miyazaki *et al.* 2012)。

クログワイやシズイ、コウキヤガラといった多年生カヤツリグサ科雑草は、塊茎からの発生が長期にわたることや発生深度が深いことなどから、水田雑草の中でも防除が困難な雑草として挙げることができるが、メタゾスルフロンは特に多年生カヤツリグサ科雑草に対する除草効果に優れている(図-4)。そこで更に詳細に検討した結果、メタゾスルフロンは、クログワイおよびシズイの塊茎形成(図-5、図

-6) やコウキヤガラに分株形成(図-7)を抑制する効果に優れていることが確認され、これらの雑草の圃場内密度を低下させ、翌年の発生を減らすことのできる薬剤であると考えられた(矢野哲彦ら 2013; 石松純ら 2014)。

一方、水稻に対する安全性に関しては、これまでの公的試験における評価および生産現場における移植水稻や直播水稻での使用において、生育に影響を及ぼす事例は非常に少ないことから、メタゾスルフロンの水稻安全性は非常に高く、水稻と雑草間で高度な選択性を有することが明らかとなっている。

4. 最近の開発・普及状況

メタゾスルフロンは2013年の国内販売開始以来、多くの指導機関・販売会社・農薬メーカー・生産者に支えられることで普及が進み、2020年には国内延べ40万ヘクタールの普及面積に達した。

これまで各種水稻用除草剤製品の有効成分として利用され、「シグナス[®]」、「ディオール[®]」、「天空[®]」、「流星[®]」などの一発処理剤では1キロ粒剤、フロアブル剤、ジャンボ剤、エアー粒剤、顆粒水剤など多彩な製剤により水稻生産現場で使用されている。特に顆粒

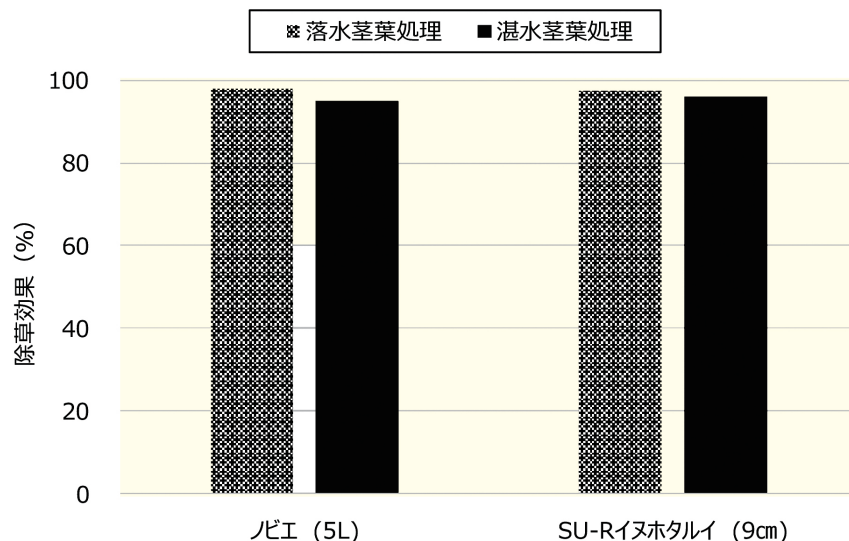


図-8 アレイル SC の除草活性 (2018 年宮城県大崎市圃場試験)
落水処理は散布前に田面水を排水し 7 日間落水を維持 () 内は処理時葉齢
散布後 52 日目に観察評価 (0 = 影響なし ~ 100 = 完全枯死)

水和剤は投下製剤量が 80g/10a と少量であり、水口処理では入水時間 15 分で薬剤処理が可能なことから、省力かつ環境負荷も少ない除草が可能となっている。水稻生育期の雑草を防除する中・後期処理剤では 1 キロ粒剤、ジャンボ剤、エアー粒剤で水面処理が可能な「レプラス[®]」, 「ゲパード[®]」や茎葉処理剤として「アレイル[®]」が販売されている。

「アレイル[®]」はメタゾスルフロンおよびハロスルフロンメチルを有効成分とする茎葉処理剤である。両成分ともに一発処理剤や中・後期処理剤として多くの製品が販売されているように、田面・水面に落ちた成分も除草効果に寄与するため、降雨の影響を受けにくい、落水の有無に関わらず散布が可能(図-8)(古橋孝将ら 2021)、田面が水稻に覆われる前に散布すれば後発生も抑制できる、などの特長を有する。

おわりに

メタゾスルフロンは開発当初の(財)日本植物調節剤研究協会による公的試験および上市以降の水稻生産現場において、高い除草効果および水稻に対する高い安全性が評価され、多くの場面で使用されている。各種ALS阻害剤抵抗性雑草に対する優れた除草効果や、難防除の多年生カヤツリグサ科雑草に対する地上部と地下部の双方への除草効果を有し、茎葉処理剤としての適用性など、ユニークな特性を有した新しいスルホニルウレア系除草剤であり、水稻栽培における雑草防除の一助となっている。今後もメタゾスルフロンが国内および世界の食糧生産に一層貢献できるよう、更なる製品開発を進めていく。

引用文献

- H. Kobayashi, K. Nakahira, M. Saeki, Y. Nakaya, Y. Tamada and K. Morimoto 2008. 4th Pan Pacific Conference on Pesticide Science, p49.
- 矢野哲彦, 佐伯学, 小林弘, 玉田佳丈, 中屋潔彦, 森本勝之 2012. 日本雑草学会第 51 回大会講演要旨集, p21.
- T. Miyazaki, T. Yano, M. Saeki, H. Kobayashi, Y. Nakaya, Y. Tamada and K. Morimoto 2012. The Proceeding of the 6th International Weed Science Congress, p47.
- 矢野哲彦, 遠藤利治, 宮崎隆雄, 石松純, 鈴木宏一 2013. 日本雑草学会第 52 回大会講演要旨集, p19.
- 石松純, 宮崎隆雄, 矢野哲彦 2014. 日本雑草学会第 53 回大会講演要旨集, p33.
- 佐伯学, 矢野哲彦, 中屋潔彦, 玉田佳丈 2016. 日本農業学会誌 41(2), 175-181.
- 古橋孝将, 斉藤直樹, 小林弘, 佐伯学, 矢野哲彦 2021. 日本雑草学会第 60 回大会講演要旨集, p49.