

除草剤の混合施用における相互作用

筑波大学 応用生物化学系 李 度 鎮

1. はじめに

栽培地において作物と同様に太陽エネルギーを利用し、炭素同化作用を行うにもかかわらず、植物分類学的ではなく人間の好みによって栽培植物と区別される雑草は農業生産活動とともに存在してきた。これら植物種間あるいは種内間における特定の植物、すなわち雑草の選別防除及び管理に重要な役割を發揮しているのが除草剤の選択性である。また、現在では除草剤の選択性をさらに拡大するため遺伝子工学的手法による作物への薬剤耐性付与技術も応用している¹⁾。植物の生態、生理・生化学的特性や製剤技術の利用による優れた選択性除草剤においても単剤では限られた雑草種のみ有効であり、種々の雑草に対しては完全ではないことから、殺草スペクトラムの拡大に様々な作用性をもつ2種類以上の混合薬剤が用いられる²⁾。また、作物のみにおける薬害軽減のために薬害軽減剤（解毒剤, antidote, safener, protectant, antagonist）の前処理（種子粉衣処理等）も利用している⁹⁾。このような研究および実用例は数多く挙げられるが、日本、韓国等では混合剤（package mixtures）、広い栽培面積システムであるアメリカ等では混合剤の他に現地での混合処理（tank mixture treatments）や薬害軽減剤の前処理が利用されている。ここでは、混合施用（以下は混合

剤、混合処理、薬害軽減の前処理も含む意味として扱う）における薬剤の作用点（標的酵素）あるいは植物体内での薬剤間相互作用機構について概説する。

2. 混合効果検定法

混合剤の利用が増えつつある状況を考えると試験目的に適確した混合作用の評価・解析方法等の確立が必要である²⁾。混合作用評価法^{4, 7, 12~14)}のうち、Colby法^{7, 14)}とIsobole法⁴⁾については簡単に整理してみた。

- Colby法は、2剤でも3剤でも処理した単剤の効果から計算した理論的期待値と混合処理効果の観察値との関係を利用した評価法である。長所は混合処理結果が簡単に計算でき、薬剤間の混合効果や相互作用パターンが素早く判断できることだが、単純化しすぎ分散量が考慮されてないため理論的期待値の算出で問題が生ずる場合がある。
- Isobole（等効果線）法の原理や留意点については、千坂⁴⁾の総説にも詳細に言及されているので参照されたい。処理区を十分に設けた試験結果からは正確な相互作用の判断が可能であり、両薬剤の最適な混合比が算出できる特徴をもつが、活性を有する混合薬剤の単独処理における同等な抑制率（例えばそれぞれの I_{10} あるいは I_{90} ）の薬量が求めにくい場合がある。他に

も幾つかの混合施用の相互作用評価法が知られており、Nash¹²⁾は additive model と multiplicative model に分類し、各評価法の特徴や留意点について概説している。

3. 相互作用機構

混合施用には、除草剤間あるいは除草剤と非除草剤間の場合がある。前者の例として殺草スペクトラムの拡大を目的とした混合剤の登録が

表－1 混合施用において示される特性

特 徴	・ 共力的効果による殺草効果の向上 ・ 一年生・多年生雑草同時防除による殺草スペクトラムの拡大 ・ 散布回数の減少による労力節減と農業生産費用の低減 ・ 選択性増加による作物薬害軽減効果
利 点	・ 茎葉・土壌同時処理効果による適用条件の拡大 ・ 処理時期・残効期間の拡大 ・ 薬剤価格の低減化 ・ 散布量減少による環境負荷低減 ・ 取扱い容易及び処理簡単 ・ 抵抗性雑草種出現の防止あるいは遅延 ・ 選択性増加による適用作物の拡大
そ の 他	・ 既存薬剤の利用により農業開発に役立つ ・ 作用機構研究に役立つ ・ 薬剤の特許期限の延長による利用性拡大
問 題 点 (可能性)	・ 選択性中の低下 ・ 生産価額の上昇 ・ 環境負荷の増加
作 用	・ 相乗作用 (synergism) : 2 剤あるいはそれ以上の化合物間混合した場合、混合薬剤間の共力作用により各々の薬剤の単独作用よりも増加し発現された作用 ・ 相加的作用 (additive action) : 各々の単独作用そのまま維持し混合施用してもお互いに影響しないものの、類似効果を示す作用 ・ 拮抗作用 (antagonism) : 各々の薬剤の単独作用より混合した場合の効果が低く発現される作用

国内市販除草剤の50%以上に達している。後者では、国内での研究・実用例は少ないものの、除草剤と殺虫剤、除草剤と殺菌剤及び除草剤と補助化合物(共力剤、薬害軽減剤、サーファクタント、extender等)との混合施用(研究例も含む)が知られている。広い意味での薬剤間混合施用において期待される特性をまとめたのが表－1である^{3, 4, 9)}。相互作用には相乗作用、相加作用及び拮抗作用等が含まれるが、多様な作用性をもつ薬剤間の混合施用によって、殺草効果の向上やスペクトラムの拡大、散布労力節減、薬害軽減効果等が大きな特徴として挙げられる。また、近年話題にもなっている抵抗性雑草出現の防止あるいは遅延における効果は単剤の連用処理に比べ大きいと思われる。

1) 相乗作用 (synergism)

① 除草剤間の相互作用

除草剤間の相互作用による殺草活性は、薬剤間の生理・生化学的作用の増減により示されるが、相乗・拮抗作用のいずれにおいても双方薬剤の浸透、吸収、移行及び代謝(活性化、不活性化)を変動させることによって発現するケースが多い^{3, 9)}。しかし、スルホニルウレア系除草剤抵抗性的大豆に thifensulfuron と imazethapyr を混合施用すると相乗作用によって薬害の増大が観察され、両剤間ではお互いの吸収、移行及び代謝等には影響しない他機構の存剤が報告されている²⁰⁾。即ち、この薬害は同一作用点(ALS)における両薬剤間の相乗作用によるものと考えられる。また、植物代謝系の同じ生理的プロセスにおける相乗作用としてアミノ酸生成に関与する酵素であるアセトラクテート合成酵素(ALS)と5-エーノルビルビンシキミ酸-3-リン酸(EPSP)合成酵素の阻害がある。実際、glyphosate(EPSP

合成酵素阻害)とimidazoline (ALS阻害)との混合施用では相乗作用による薬剤低量化が報告されている²⁴⁾。

② 補助剤との相互作用

アキノエノコログサに対するアトラジンとtridiphaneの混合施用では、植物体内におけるアトラジンの不活性化にかかわるグルタチオンS転移酵素の活性がtridiphaneによって阻害されることによりグルタチオン抱合が減少し相乗作用を示す⁶⁾。また、薬剤の作用点外もしくは植物体外で起こる相乗作用としては土壤中でEPTCの分解を抑制し、殺草効果を高める⁵⁾。すなわち、これらの効果は植物体内外における活性成分の存在期間を延ばすことによって植物への吸収や作用部位との結合の機会を増やす作用により発現するものと思われる。大豆畑におけるイチビやアメリカアサガオの防除にchlorimuronを用いるが、それに非イオン性サーファクタントと28%の窒素(ウレアとアンモニア態窒素に含有されるもの)を添加処理すると薬剤の吸収・移行が増加し殺草効果が増大すると報告されている²²⁾。また、グルホシネート・DCMU混合剤における作用発現はグルホシネートによって遅くなるが、それにサーファクタントWKを加用して処理するとDCMUの光合成阻害作用が強められ効果発現の早期化や効

力増加が示される²¹⁾。その他にも薬剤の解毒にかかわるチトクロムP-50酸素添加酵素活性を阻害するABT, PBO, tetcyclacis, metyrapone等の化合物による共力作用がある(表-2)。

③ 殺虫剤との相互作用

除草剤と殺虫剤との混合施用例には、植物体内においてアリルアシルアミダーゼによって解毒あるいは活性化される除草剤プロパニル、ナプロアニリド、クロメプロップ等とカーバメート系殺虫剤(MTMC, NAC等)と混合した場合、殺虫剤が除草剤の加水分解を妨げることにより、それらの殺草活性を増減させる^{15, 16, 17)}。トウモロコシにおける除草剤プリミスルフロンの殺虫剤マラチオンとの相互作用には、マラチオンによるプリミスルフロンの代謝阻害が原因であり、この代謝阻害はプリミスルフロンの水酸化に關与するチトクロムP-450依存酸素酸化酵素活性の抑制が關連している¹⁸⁾。また、プリミスルフロンの殺虫剤Terbufosとの相乗作用によるトウモロコシの薬害は、プリミスルフロンの代謝を促進するMON-13900によって軽減されることも報告されている¹⁹⁾。

④ 殺菌剤との相互作用

酸アミド系除草剤mefenacetと殺菌剤edifenphosとの混合処理における相乗作用は、殺菌剤による加水分解酵素アミダーゼ活性

表-2 各種阻害剤

化 合 物	作 用
1-aminobenzotriazole (ABT)	チトクロムP-450依存酸素添加酵素活性阻害
Piperonyl butoxide (PBO)	チトクロムP-450依存酸素添加酵素活性阻害
tetcyclacis	チトクロムP-450依存酸素添加酵素活性阻害
metyrapone	チトクロムP-450依存酸素添加酵素活性阻害
Tridiphane	グルタチオンS転移酵素活性阻害
Extender (dietholate)	土壌中EPTCの分解抑制
carbamate 殺虫剤 (terbufos, carbaryl等)	加水分解酵素アリルアシルアミダーゼ活性阻害
Tributyl phosphate	加水分解酵素エステラーゼ活性阻害
Triphenyl phosphate	加水分解酵素エステラーゼ活性阻害

の阻害が要因となっている¹⁰⁾。

以上のように混合施用による相乗作用は、植物体内への除草剤の吸収、移行増加や解毒あるいは分解代謝にかかわる酵素の活性を阻害し、活性成分を如何に多く体内に留めるかによって強く発現するものと考えられる。

2) 拮抗作用 (antagonism)

拮抗作用は、2剤あるいはそれ以上の化合物間混合した場合、それぞれの単独処理効果より少ない効果を示すもので、この作用は作物においてのみ望まれる^{3, 9)}。

- 生化学的拮抗作用 (biochemical antagonism) は、除草剤の吸収・浸透や移行の阻害あるいは代謝的な不活性化や隔離の促進によって作用点に届く除草剤の活性成分量を減らす化合物との相互作用である。
- 化学的拮抗作用 (chemical antagonism) は、拮抗剤が除草剤と化学的に反応し、作用点に届く除草剤の活性成分量を減らしその効力をなくすか減少させる化合物との相互作用である。
- 競合的拮抗作用 (competitive antagonism) は、拮抗剤が除草剤の作用点 (標的酵素等) で競合し、作用点における除草剤の結合を妨げ本来の作用を減少、軽減させる化合物との相互作用である。
- 生理的拮抗作用 (physiological antagonism) は両剤が反対の生理学的効果をもつことによってお互

いの作用を妨害する相互作用が知られている。

① 除草剤間の相互作用

2,4-Dと2,4,6-Tをトマトに茎葉処理したところ、拮抗作用による生育抑制軽減効果がHoffmann⁸⁾によって見出された以来、薬害軽減剤の概念が作物保護のため導入され、実用化されている。

ある条件で発現するイネに対するベンスルフロンメチルの薬害にチオカーバメート系除草剤の軽減効果が見出された²⁷⁾。そして、チオカーバメート系除草剤ジメピペレートは、作用性を異にする数種除草剤との混合処理においてイネの生育抑制軽減作用を示す^{28, 29)}。また、数種除草剤 (ベンスルフロンメチル、ピリブチカルブ、オキシフルオルフェン、ビフェノクス、クロメプロップ) によるイネ幼苗の生育抑制におけるジメピペレートの軽減機構としては、除草

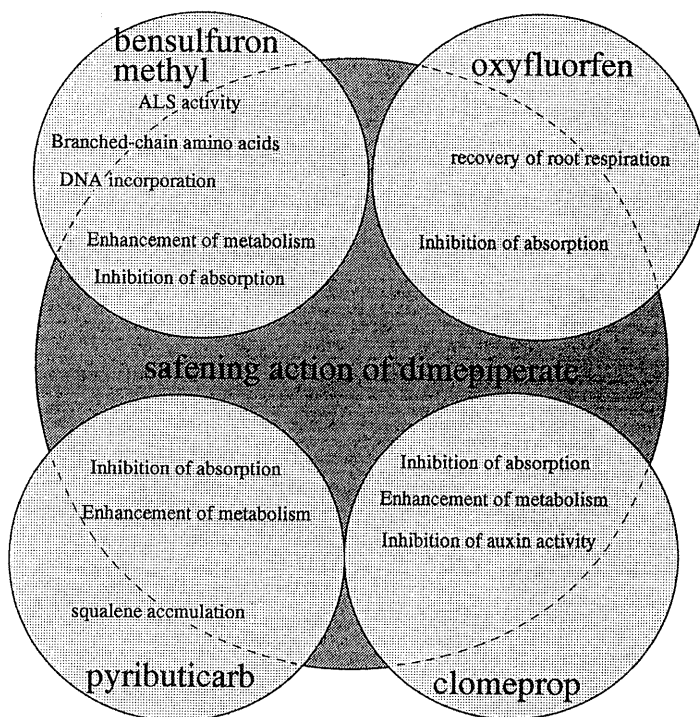


図-1 数種除草剤によるイネ幼苗の生育抑制に対するジメピペレートの軽減作用

表-3 主要作物における薬害軽減剤と対象除草剤

主要作物	薬害軽減剤	除草剤
イネ	dimepiperate	bensulfuron methyl
	daimuron	bensulfuron methyl
	fencloirim	pretilachlor
	methoxy phenone	thiobencarb
	BCS	thiobencarb
トウモロコシ	naphthalic anhydride	EPTC, butylate, vernolate, imazethapyr, imazaquin, clomazone, metsulfuron methyl, bentazon
	naphthalic acid	bentazon
	oxabetrinil	imazaquin, imazethapyr, metsulfuron methyl
	dichlormid	metolachlor, acetolachlor, EPTC, butylate, vernolate, imazaquin
	cyometrinil	alachlor, metolachlor
	BAS-145138	metazachlor, acetochlor, thiameturon, chlorimuron ethyl, chlorsulfuron
	MG-191	EPTC, acetochlor
	CGA-154281	metolachlor, acetochlor, primisulfuron, chlorsulfuron
	fluxofenim	dimethenamid
	furilazole	imazethapyr, imazaquin, EPTC, metolachlor
	benoxacor	metolachlor
	flurazole	metazachlor, imazethapyr, imazaquin
コムギ	dichlomid	triallate
	MON-5500	triallate
	R-29148	triallate
	fenchlorazol-ethyl	fenoxaprop-ethyl
	mefenpyr	fenoxaprop-ethyl
	fluxofenim	dimethenamid
ソルガム	naphthalic anhydride	metolachlor, bentazon
	dichlomid	sethoxydim, imazaquin, metolachlor
	cyometrinil	metolachlor, bentazon
	oxabetrinil	metolachlor, imazaquin
	flurazole	alachlor, metazachlor, imazaquin
	BAS-145138	metazachlor
	benoxacor	metolachlor
	MG-191	EPTC, acetochlor
	fluxofenim	dimethenamid
エンバク	MG-191	EPTC
オオムギ	fenchlorazol-ethyl	fenoxaprop-ethyl
タバコ	activated carbon	chlorimuron, imazaquin
キュウリ	naptalam	chlolanben

・研究・開発段階を含む。

剤の植物体内への吸収抑制および体内に入った除草剤の不活性化化合物生成への解毒代謝促進であることが明らかになっている²⁹⁾。さらに、薬剤によって異なるが、植物代謝系の阻害からの直接的あるいは二次的な回復が行われることによって発現する生化学的拮抗作用によって薬害軽減作用が発現したと考えられる²⁹⁾(図-1)。また、ベンスルフロンメチルとダイムロンとの混合処理によるイネにおける薬害軽減作用は、ジメピペレート的作用とは異なり根部でのベンスルフロンメチルの不活性化が主要因であると考えられる^{29, 30)}。diclofop-methyl にオキシシン作用をもつ化合物、2,4-D, MCPB を同時に散布すると吸収抑制や diclofop-acid への加水分解の阻害と不活性抱合反応が促進される拮抗作用によって薬害軽減効果が認められる^{11, 28)}。

② 補助剤との相互作用

様々な除草剤の使用場面においてさらに選択性を高め作物の薬害を防ぐために混合施用する薬害軽減剤は多く開発されているが、大半はイネ科作物の薬害軽減を目的とした発芽前処理剤(種子粉衣処理用)であり、発芽後処理除草剤用の薬害軽減剤は少ない(表-3)。薬害軽減剤は、先に述べた各種拮抗作用の複合的作用により薬剤の吸収、移行抑制や薬剤の解毒代謝促進作用等が関与し、活性体の作用部位への到達量を減少させる作用をする。また、薬害軽減剤の処理における解毒・代謝には薬剤の不活性化にかかわる薬物酸化酵素であるチトクロムP-450 酸素添加酵素(P-450)及びグルタチオンレベルの増加やグルタチオンS転移酵素(GST)の関与が知られている⁹⁾。

強還元状態の土壌における脱塩素チオベンカーブの多量生成が水稻矮化症の原因となるが、

土壌中脱塩素反応抑制剤(BCS, methoxyphenoxy)との混合施用により薬害軽減効果を果たしている例もある²³⁾。

③ 殺虫剤との相互作用

除草剤と殺虫剤との混合施用には、殺草活性増加への相乗作用性が多く知られているが、アトラジン的大豆への吸収抑制作用に起因する diazinon, disulfoton との混合施用では拮抗作用を示す²⁶⁾。

以上のように薬剤間の相互作用には、相乗作用、相加作用及び拮抗作用等の様々な作用が含まれるが、理想的な混合施用効果を言えば、作物では拮抗作用、雑草では相乗作用が発現され、作物保護と同時に殺草活性向上による選択性の増幅である。

4. お わ り に

近年話題になっている環境保存型農業への化学物質の低投入化及び水稻直播栽培への転換に伴う雑草発生時期や発生種と水稻の生育時期等を考慮すれば、雑草種発生予察手法の導入による薬剤選別施用技術の開発が望まれる。雑草害の評価による経済的雑草防除水準や薬害の回復、許容水準を確立し、混合施用の有効利用が当面の課題である。また、相互作用機構の解明による合理的な混合母剤の発掘や新規化合物の開発への寄与が期待される。

(現：農業研究センター水田雑草研究室)

引 用 文 献

- 1) 與語靖洋 1996. 植物防疫 50(5) 200-204.
- 2) 杉山 浩 1990. 第12回夏季研究会テキスト. 日本雑草学会 p. 23-32.
- 3) Hatzio K.K. and D. Penner 1985. Adv. Weed Sci. Vol., 1, 1-63.

- 4) 千坂英雄 1986. 雑草研究 31, 91-95.
- 5) Obrigawitch T., F.W. Roeth, A. R. Martin and R.G. Wilson 1982. Weed Sci. 30, 417-422.
- 6) Boydston R.A. and F.W. Slife 1987. Weed Sci. 35, 103-108.
- 7) Colby S.R. 1967. Weeds 15 (1) 20-22.
- 8) Pallos F.M. and J.E. Hoffmann 1978. Chemistry and action of herbicide antidotes. pp171.
- 9) Hatzios K.K. and R.E. Hoagland 1989. Crop safeners for herbicides. pp400.
- 10) Delvine M, S.O. Duke and C. Fedtke 1993. Physiology of herbicide action. p356-394.
- 11) Barnwell P., A.H. Cobb 1994. Pestic. Sci. 41, 77-85.
- 12) Nash R.G. 1981. Weed Sci. 29, 147-155.
- 13) Drury R.E. 1980. Weed Sci. 28, 573-579.
- 14) Flint J.L., P.L. Cornelius and M. Barrett 1988. Weed Tech. 2, 304-309.
- 15) Wongwattana C., U. Suwaunnamek and K. Ishizuka 1990. Weed Res. Japan. 35, 169-174.
- 16) Hirase K., S. Matsunaka 1991. Pesti. Biochem. Physiol. 41, 82-88.
- 17) 高沢良夫 1981. 植物の化学調節 16, 51-63.
- 18) Kreuz K. and R. Fonne-Pfister 1992. Pesti. Biochem. Physiol. 43, 232-240.
- 19) Frazier T.L. and S.J. Nissen 1994. Weed Sci., 42, 168-171.
- 20) Simpson D.M., E.W. Stoller 1996. Weed Sci. 44, 209-214.
- 21) 小島修一・山岸秀樹・保坂秀夫・徐 錫元 1996. 農薬学会講演要旨 p72.
- 22) Fielding R.J., E.W. Stoller 1990. Weed Tech 4, 264-271.
- 23) 山田忠男 1980. 化学と生物 18 (9) 605-606.
- 24) Kirkwood R.C. 1991. Target sites for herbicide action. p169-188.
- 25) Shimabukuro R.H. 1991. 植物の化学調節 26 (1) 43-50.
- 26) Penner D. 1974. Agron. J. 66, 107-109.
- 27) Yuyama T., P.B. Sweetser, R. C. Ackerson and S. Takeda 1986. Weed Res., Japan 31 (2) 164-170.
- 28) 池田 芳・菅谷清志 1989. 雑草研究 34 (1) 37-46.
- 29) 李 度鎮 1996. 雑草研究 41 (3) 103-109.
- 30) 西坂 陸・中原志郎・小柳 弘 1991. 雑草研究 36 (別) 84-85.

水田雑草の生態と防除 —水稲作の雑草と除草剤解説—

宮原益次／著

A5判 定価3,090円(税込)

水田雑草の発生特性、雑草害について著者40年の知見を網羅。さらに水田における合理的で省力的・低コストの雑草防除について解説。

全国農村教育協会

〒110 東京都台東区台東1-26-6(植調会館)
Tel.03-3833-1821 Fax.03-3833-1665