

新登録薬剤紹介

新規非選択性除草剤：グリホサートカリウム塩43%液剤 (商品名：タッチダウン®iQ)

シンジェンタ ジャパン(株) 研究部 中央研究所 杉山 稔

1. はじめに

グリホサートカリウム塩43%液剤(以下、本剤)は、英国Zeneca Agrochemicals社(現Syngenta Crop Protection社、スイス国)によって開発された非選択性吸収移行型除草剤である。本剤は、先に世界主要諸国において農薬登録され広く実用に供されているグリホサートトリメシウム塩(日本での商品名：タッチダウン®)の効果を更に改善するため、グリホサートを含有する新規化合物として1998年より開発が開始され、既に世界各国で登録されている。日本ではZK-122液剤の試験名で、2000年より(財)日本植物調節剤研究協会を通じて各作物・分野における適用性

試験を開始し、2003年11月10日に非農耕地分野での登録(商品名：タッチダウン®iQ)を取得した後に、水稻耕起前、水田畦畔、休耕田、小麦耕起前、果樹園(かんきつ、りんご、なし、ぶどう)の下草、野菜類(だいこん、キャベツ、はくさい)の耕起前および草地更新等への適用拡大申請を行い、2005年6月1日に食用登録を取得した。

2. 構造・物理化学性・安全性

本剤の有効成分および製剤の物理化学性と安全性を図-1に示す。本剤は、土壤に接触すると土壤粒子への吸着等により速やかに不活性化

<原体>

化学名：カリウム=N-(ホスホノメチル)グリシナート

一般名：グリホサートカリウム塩
(glyphosate-potassium)

分子式：C₃H₇NO₅PK

分子量：207.2

蒸気圧：<1×10⁻⁵Pa (20°C)

<製剤>

商品名：タッチダウン®iQ

試験名：ZK-122 液剤

有効成分：グリホサートカリウム塩 43%

外観：暗褐色澄明水溶性液体

比重：1.36 (20°C)

pH：4.6

<製剤の安全性>

魚毒性：コイ LC₅₀(96hr)：24mg/L, ミジンコ LC₅₀(48hr)：5.3mg/L, 藻類 E_bC₅₀(0-72hr)：2.36mg/L

人畜毒性：急性経口毒性(ラット LD₅₀)：>5000mg/kg, 急性経皮毒性(ラット LD₅₀)：>5000mg/kg

刺激性：皮膚/なし, 眼/軽度

有用生物への影響：ミツバチ、カイコ、ヤマトクサカゲロウ、クモ類、テントウムシ、捕食性ダニ、寄生バチならびにオサムシ類に対して影響なし

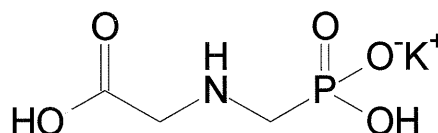


図-1 グリホサートカリウム塩43%液剤の物理化学的性状および安全性

されるため、土壌や地下水を通じて周辺の作物などへ影響を与える可能性はきわめて低い。また、土壌中の微生物によって容易に分解されるため、環境等におよぼす影響も小さいと考えられる。

4. 製剤の特徴および作用特性

＜グリホサートカリウム塩の特徴＞

既存のグリホサート製剤では、物理化学的に安定性が高いグリホサート塩が用いられているが、塩基の種類によってその物理性は異なる。

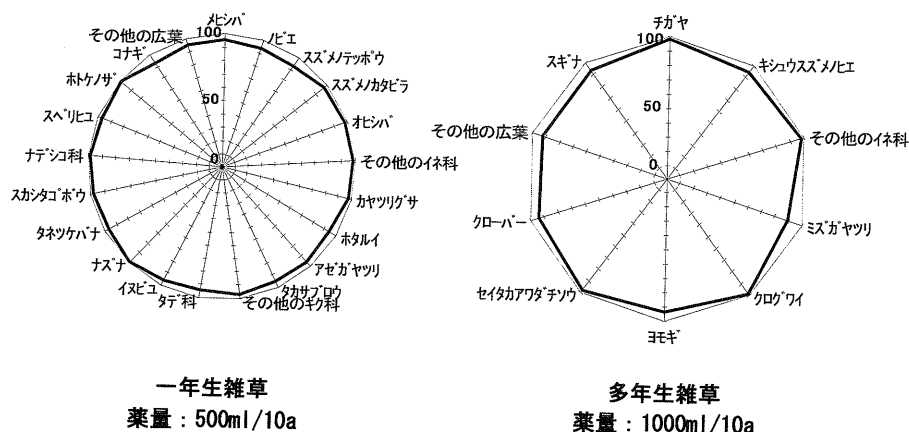


図-2 グリホサートカリウム塩43%液剤の草種別効果
(日本植物調節剤研究協会委託試験成績より、2000-2003年)

3. 作用機構

本剤の活性本体はグリホサートであり、対象とする植物の茎葉部分から速やかに体内に吸収される^{1, 3, 6, 7)}。植物体内へ移行した活性成分は主に篩管内の同化物質の転流によって植物体地下部および地上部の生長部位へ移行し、植物の芳香族アミノ酸生合成の過程であるシキミ酸経路において、5-エノールピルピルシキミ酸-3-リン酸 (EPSP) の合成に参与するEPSP合成酵素の働きを阻害する。その結果、植物の生育に必要なチロシン、フェニルアラニンあるいはトリプトファンなどのアミノ酸が合成されず、植物体全体が枯死に至る^{2, 9)}。この殺草作用は非選択的であり、一年生および多年生の幅広い草種に対して効果を発揮する(図-2)。

本剤に用いられるグリホサートカリウム塩は水溶解性が極めて高く(図-3)、高濃度のグリホサートを安定して製剤化することが可能となった。

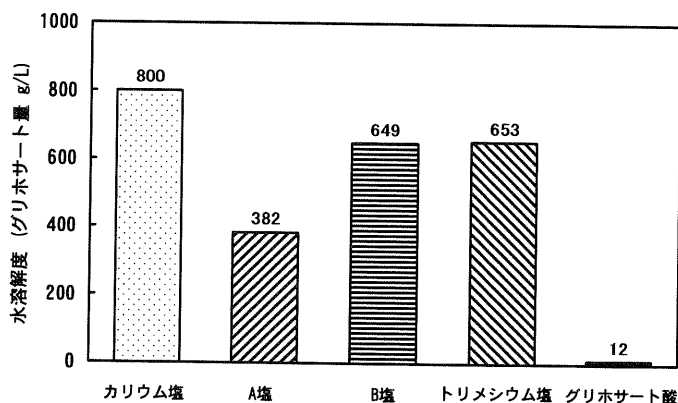


図-3 異なるグリホサート塩の水溶解性
(Syngenta Crop Protection社 英国ジェロッツヒル研究所、2000年)

＜界面活性剤技術＞

グリホサート剤はその活性成分が植物体表面のクチクラを透過して吸収されることによって生物活性を示すが、その過程において界面活性

表-1 グリホサートカリウム塩43%液剤の植物体葉面における付着性
(シンジェンタ ジャパン株式会社 中央研究所, 2005年)

供試草種	葉面の形態	薬液の接触角(度)	
		グリホサートカリウム塩 液剤 100倍希釈液	対照グリホサートA剤 100倍希釈液
シロザ	新葉には粉状毛を有し 撥水性が高い	59.7	70.8
ツユクサ	滑らかでワックス層 で覆われる	46.0	63.3
チガヤ	短い毛を有し硬い クチクラで覆われる	65.6	105.2
セイタカ アワダチソウ	微細な凹凸があり ざらつく	56.5	54.5

材料：生育盛期個体の完全展開葉、処理量：5 μ l
測定装置：協和界面科学株式会社製 Model: CA-X
反復：5

剤が非常に重要な役割を持つことが多くの研究で明らかにされている¹⁰⁾。本剤では、ノニオン系およびカチオン系の界面活性剤を用いた独自の技術により、グリホサートを効率良く植物体に吸収移行させることを可能にした。

ノニオン系界面活性剤は、植物体表面に到達した薬液の付着性および濡れ性を高める機能を有する。グリホサートの植物体への吸収は、薬液の付着量および付着状態の影響を受けることが明らかとなっているが^{3, 4, 5)}、本剤は、シロザ (*Chenopodium album*)、ツユクサ (*Commelina communis*)、チガヤ (*Imperata cylindrica*)、セイタカアワダチソウ (*Solidago altissima*) など様々な表面構造の植物体に安定して付着する (表-1)。

隙を通過することができるが、クチクラは負に帯電しているために、カチオンによりその透入が促進される⁸⁾。しかしながら、一般的にカチオン系界面活性剤は植物細胞に対する刺激性が高く、薬液が付着した部位の細胞が破壊されることによって、活性成分の吸収が阻害される可能性があること

考えられる。これらのことから、本剤では植物細胞への影響が少ない界面活性剤を用いることにより、活性成分は速やかに、かつ、継続的に吸収されるように設計されている。

既述の通り、本剤は水溶解性が極めて高いグリホサートカリウム塩の採用により、製剤中の活性成分の高濃度化を実現するとともに、優れた界面活性剤技術によってその植物体への吸収および移行性を高めている。スギナ (*Equisetum arvense*) を用いた移行性試験においても、処理1時間後には処理された活性成分の79.9%が吸収され、その後も継続した吸収が観察された。また、植物体内での効率的な移行も確認された (表-2、写真-1)。

表-2 スギナにおけるグリホサートの吸収および移行
(Syngenta Crop Protection社 英国ジェロツツヒル研究所, 2003年)

	グリホサートの吸収および移行率 (対処理量%)			
	処理後経過時間			
	1時間	6時間	24時間	72時間
植物体への吸収率	79.9	86.3	87.9	90.0
処理部位以外への移行率	2.6	3.2	7.6	17.1

植物体の表面は疎水性のクチクラで覆われ、親水性のグリホサートがクチクラを透過するためには、カチオン系界面活性剤の役割は重要である。クチクラを構成するクチン単位の間にはごく微細な分子間空隙があり、水分子や親水性の物質はわずかながらこの空

供試植物：スギナ (ポット栽培；処理時草丈約25cm)
供試剤：グリホサートカリウム塩43%液剤 (25倍希釈液)
グリホサートの標識：¹⁴C-グリホサートを用いて1 μ lの薬液あたり1.5KBqとなるよう調整
処理方法：マイクロシリンジで植物体の地上部葉鞘の20箇所に0.2 μ lずつ処理
測定：処理後所定時間後に植物体を0.1M塩酸とメタノールの等量混合液で洗浄し、試料中の¹⁴Cをサンプルオキシダイザーで回収してシンチレーションスペクトロメーターで測定
(地下部の土壌はよく洗い流し、処理部位と他の部位は別々に測定)
反復：4

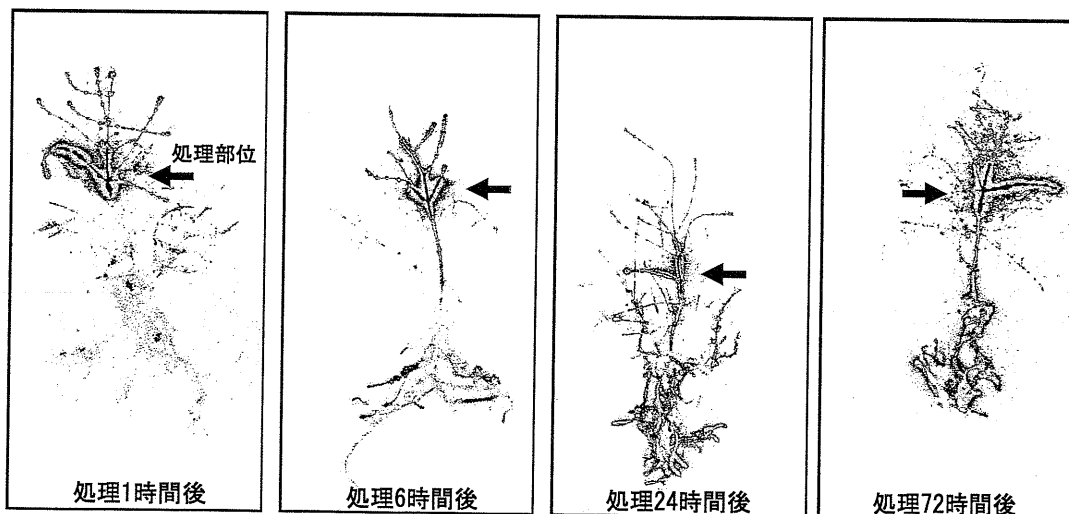


写真-1 スギナにおけるグリホサートの吸収および移行
(Syngenta Crop Protection社 英国ジェロツツヒル研究所, 2003年)

供試植物：スギナ（ポット栽培；処理時草丈約25cm）

供試剤：グリホサートカリウム塩43%液剤（25倍希釈液）

グリホサートの標識： ^{14}C -グリホサートを用いて1 μl の薬液あたり1.5KBqとなるよう調整

処理方法：マイクロシリンジで植物体の地上部葉鞘の20箇所にも0.2 μl ずつ処理

オートラジオグラフィー処理：処理後所定時間後に植物体を0.1M塩酸とメタノールの等量混合液で洗浄した後実施

<耐雨性>

ポット栽培のシロザ (*Chenopodium album*) を用い、本剤および対照剤を等しいグリホサート投下量で処理し、2時間後に約8.3mm/hrの人工降雨処理を行って耐雨性を検討した。供試剤は、

無降雨条件では同等の高い除草効果を示したが、本剤が降雨処理区においても十分な除草効果を示したのに対して、対照剤では降雨処理による明らかな効果の低下がみられた。よって、本剤はその界面活性剤機能に由来すると考えられる優れた耐雨性を有すると考察された(図-4)。

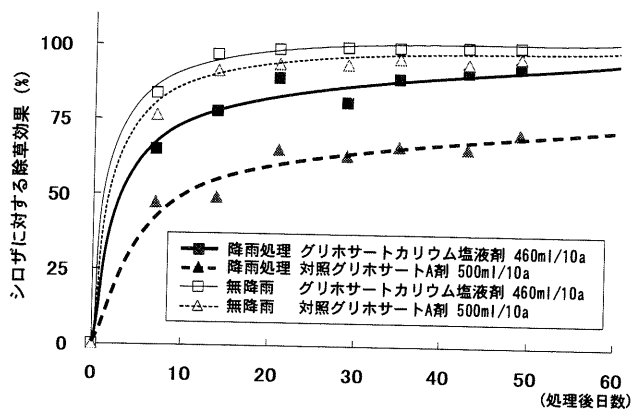


図-4 薬剤処理後の降雨がグリホサートカリウム塩43%液剤の除草効果におよぼす影響
(シンジェンタ ジャパン株式会社 中央研究所, 2005年)

<異なる発生密度の雑草に対する除草効果>

自然発生のノビエ (*Echinochloa spp.*) を用いて、発生密度が3900-5600本/ m^2 の高密度発生区および100-150本/ m^2 の低密度発生区における除草効果を比較した。本剤は、高密度条件区においても低密度条件区に劣らない効果発現速度と除草効果を示し、草冠の重なり合い

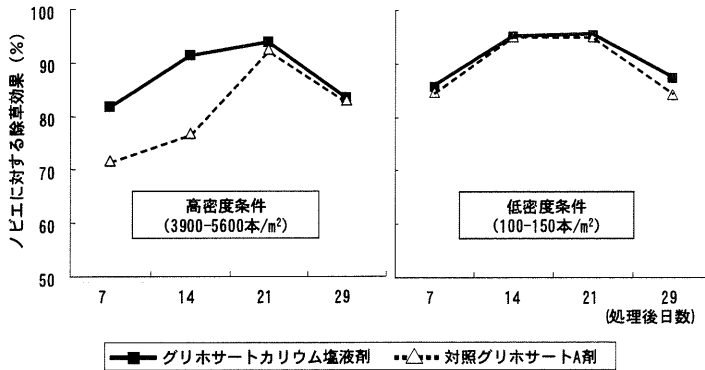


図-5 異なる発生密度のノビエに対するグリホサートカリウム塩43%液剤の除草効果
(シンジェンタ ジャパン株式会社 中央研究所, 2005年)

により植物体全体への薬剤の均一な付着が難しい条件においても、安定して高い除草効果が得られることが示された(図-5)。

5. おわりに

以上述べてきたように、本剤は優れた物理化学性をもつグリホサートカリウム塩による活性成分の高濃度化とノニオン系およびカチオン系を配合した独自の界面活性剤技術によって、グリホサートを効率的に植物に吸収・移行させることを実現した新規のグリホサート剤である。植調協会委託試験などの結果から、本剤は処理後3-7日で効果の発現を示し、約60日間の抑制効果があると考えられる。非農耕地から食用作物まで、幅広い登録をもつ本剤が、より多くの場面で活用されることを期待する。

参考文献

- 1) Davison, J. G. (1972): The response of 21 perennial weed species to glyphosate. Proc. 11th Br. Weed Control Conf. 1, 11-16
- 2) 伊藤操子 (1993): 雑草学総論. 養賢堂, pp. 184-185
- 3) Li, J., R. J. Smeda, B. A. Sellers and W. G. Johnson (2005): Influence of formulation and glyphosate salt on absorption and translocation in three annual weeds. Weed Sci. 53, 153-159
- 4) Nalewaja, J. D. (2004): Optimizing glyphosate efficacy via application technology. 7th International Symposium on Adjuvants for Agrochemicals (Abstr.), 172-175
- 5) Ryerse, J. S., R. A. Downer, R. D. Sammons and P. C. C. Feng (2004): Effect of glyphosate spray droplets on leaf cytology in velvetleaf (*Abutilon theophrasti*). Weed Sci. 52, 302-309
- 6) Sandberg, C. L., W. F. Meggitt and D. Penner (1980): Absorption, translocation and metabolism of ¹⁴C-glyphosate in several weed species. Weed Res. 20, 195-200
- 7) Sprankle, P., W. F. Meggitt and D. Penner (1975): Absorption, action, and translocation of glyphosate. Weed Sci. 23, 235-240
- 8) 高井康雄, 早瀬達郎, 熊沢喜久雄 (1976): 植物栄養土壌肥料大事典. 養賢堂, pp. 180-182
- 9) 竹松哲夫 (1982): 除草剤研究総覧. 博友社, pp. 606-608
- 10) 辻 孝三 (1990): Formulation chemistry and technology. 日本農薬学会誌 15 (別), 722-735