

水稲用および畑作用新規除草剤 メソトリオン

シンジェンタジャパン(株) 開発本部 中央研究所 榎吉寿夫

1. はじめに

メソトリオン(委託試験コード: SYJ-104)は、Syngenta Crop Protection社(スイス国)によって開発された2-ベンゾイルシクロヘキサン-1,3-ジオン系(トリケトン系とも呼ばれる)化合物であり、4-ヒドロキシフェニルピルビン酸デヒドロゲナーゼ(HPPD)阻害を作用点とする白化型の除草剤である。本剤は海外では2001年の上市以降、とうもろこし用除草剤として世界各国のとうもろこし栽培に広く普及している。日本においては、2002年からとうもろこし用除草剤として(財)日本植物調節剤研究協会を通じて適用性試験を開始し、2010年に農薬登録を取得した。また、2004年からは水稲用除草剤として適用性試験を開始した。水田雑草防除においては、プレチラクロールとの組み合わせを基幹とした様々

な混合製剤開発に応用可能で、プレチラクロールとの2種混合剤、それにピラゾレートを加えた3種混合剤、またはピリフタリドやスルホニルウレア系薬剤を加えた4種混合剤などの6剤が2010年に登録を取得するに至っている(表-1)。

2. 化学構造, 物理化学性および安全性

一般名:	メソトリオン (mesotrione)
分類:	トリケトン系
化学名:	2-(4-メシル-2-ニトロベンゾイル)シクロヘキサン-1,3-ジオン
性状:	淡黄色固体
融点:	165.3°C
蒸気圧:	5.7 x 10 ⁻⁶ kPa[20°C]
水溶解度:	0.16g/l(蒸留水), 4.8 g/l(pH4.8), 15 g/l(pH6.9)[20°C]
logP/Koc:	0.11(蒸留水)/109
土壌中半減期:	6-27日(DT ₅₀)
人畜毒性:	普通物
	[ラット経口毒性: ♂♀ >2000mg/kg]
魚毒性:	A類相当(旧分類として)
	[コイ LC ₅₀ (96hr) = >97mg/L, ミジンコ EC ₅₀ (48hr) = 900mg/L]

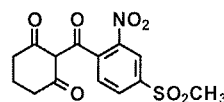


表-1 2010年に新規農薬登録されたメソトリオン単剤およびメソトリオンを含む混合剤

登録月日	有効成分(成分量%)	商品名	登録作物
5月19日	メソトリオン(9.1)	カリスト	とうもろこし 飼料用とうもろこし
	ピリフタリド(1.5)・プレチラクロール(4.5)・ ペンシルフロメチル(0.75)・メソトリオン(0.5)	アピロトップMX1キログラム75	移植水稲
	ピリフタリド(1.2)・プレチラクロール(4.6)・ ペンシルフロメチル(0.51)・メソトリオン(0.9)	アピロトップMX1キログラム51	
	プレチラクロール(4.2)・メソトリオン(0.6)	マキシ-1MX1キログラム	
5月26日	ピリフタリド(1.5)・プレチラクロール(4.5)・ ペンシルフロメチル(0.75)・メソトリオン(0.5)	アピロキリオMX1キログラム75	移植水稲
	ピリフタリド(1.2)・プレチラクロール(4.6)・ ペンシルフロメチル(0.51)・メソトリオン(0.9)	アピロキリオMX1キログラム51	
	ピラゾレート(12)・プレチラクロール(4.5)・メソトリオン(0.9)	カミオンMX1キログラム	
12月22日	ピラゾレート(12)・プレチラクロール(4.5)・メソトリオン(0.9)	カミオンMX1キログラム	

3. メソトリオンの創製の経緯と作用機構

＜創製の経緯＞

メソトリオンは、植物が分泌する天然の植物活性成分(アレロケミカル)の構造を模して新たな除草剤を作出する試みのなかから見出された化合物である。1970年代後半に一人の研究者が、オーストラリア原産のフトモモ科マキバブラシノキ属の常緑低木 *Callistemon citrinus* [国内には同属の *C. speciosum* (ブラシノキ) や *C. rigidus* (マキバブラシノキ) などがある] の樹下では雑草が少ないことに着目し、樹下の土壌および *C. citrinus* 葉から抽出された画分から、アレロケミカルとして leptospermone を分離同定した¹⁾(図-1)。この物質は感受性植物の新展開葉を白化させる活性を有し²⁾、構造修飾の過程でこの活性発現にトリケトン構造が重要であることがわかった³⁾。構造最適化の過程で、ベンゾイル

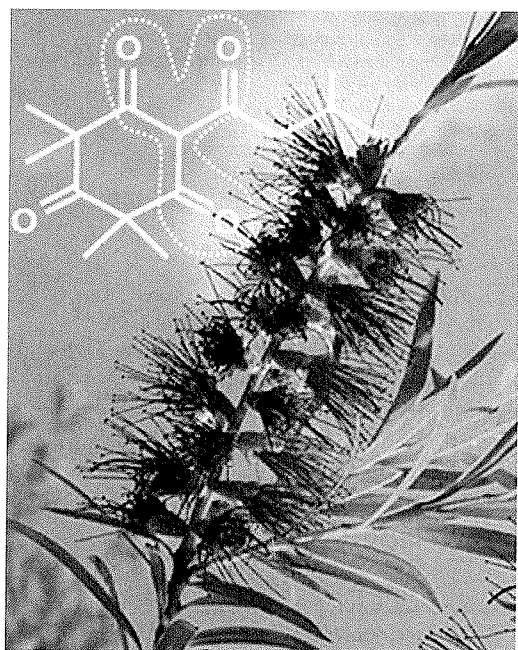


図-1 ブラシノキとアレロケミカル
Leptospermone
(破線部分：トリケトン構造)

基の2,4位置換によって大幅な活性向上が可能であることが特定され⁴⁾、海外では、スルコトリオン(商品名 MIKADO, Zeneca 社, とうもろこし・さとうきび用)が1990年に、メソトリオン(商品名 CALLISTO, Syngenta 社, とうもろこし用)が2001年に実用化・上市された。

＜作用機構＞

メソトリオンは植物の茎葉・根部から吸収され、木部・篩部いずれの経路でも移行性が高い。その作用点はアレロケミカルの leptospermone と同様に、植物の必須酵素の一つ、HPPD 阻害であり、植物に特有なプラストキノンの生成を抑制する。プラストキノンはカロチノイド系色素合成経路のフィトエン不飽和化酵素(PDS)の補酵素として働き、不飽和化の過程で生じた電子の受け渡しを担っており、HPPD 阻害によるプラストキノンの欠乏は間接的に PDS を阻害し、カロチノイド系色素の生合成阻害を引き起こす^{5,6)}。葉緑体を光過酸化による分解から守っていたカロチノイド系色素が減少することで、光合成色素全体の減少が促進され、最終的に植物は白化を呈して枯死に至る。

4. とうもろこし用除草剤としての特性

メソトリオンは、10～15g ai(有効成分、以下同義)/10aの茎葉処理で多くの一年生広葉雑草に加えて、一年生イネ科雑草数種に対して90%以上の高い効果を示した(表-2)。また、15～20g ai/10aで高い土壌処理効果を示した。本剤を15g ai/10aで茎葉処理した場合、シロザ、ヒユ類およびメヒシバに対して、それぞれ7葉期、5葉期、3.2葉期まで高い効果を示した。土壌処理では、メヒシバに対して処理後約1ヵ月間新たな出芽を80%以上抑制する残効性を示した。

表－２ メソトリオンの畑地雑草に対する効果（茎葉処理）

殺草効果：++++(90%以上), +++(80～89%), ++(50～79%)

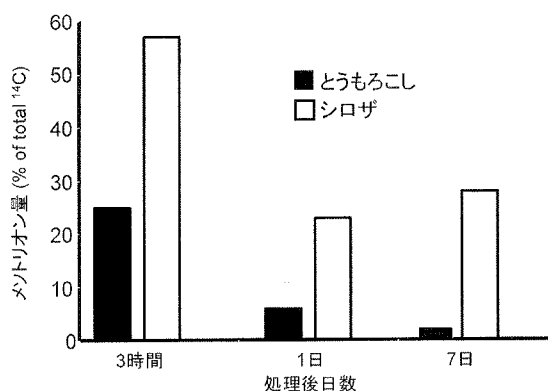
(2002～2005年 社内・公的試験)

草種	メソトリオンの処理量および殺草効果			
	10g ai/10a	試験数	15g ai/10a	試験数
イチビ	++++	1	++++	1
エノキグサ	++++	3	++++	2
アオゲイトウ	++++	6	++++	7
イヌビユ	++++	4	++++	4
アメリカセンダングサ	++++	1	++++	1
シロザ	++++	17	++++	17
ザクロソウ	++++	2	++++	2
サナエタデ	++++	3	++++	1
イヌタデ	++++	5	++++	7
タニソバ	++	4	++++	4
オオイヌタデ	++++	4	++++	4
ハルタデ	++	4	++	4
スベリヒユ	++	10	++	10
イヌホオズキ	++++	1	++++	1
ナズナ	++++	4	ND	0
イヌガラシ	++++	1	++++	1
スカシタゴボウ	++++	5	++++	5
ハコベ	++++	13	++++	14
ノビエ	+++	21	++++	19
メヒシバ	++++	10	++++	11
スズメノカタビラ	+++	1	++++	1

とうもろこしは生化学的にメソトリオンを体内で解毒する作用を有し(図－2), その代謝経路にシトクロム P450 が関与していることが明らかにされている。圃場においても登録された薬量および処理時期でとうもろこしの主要品種に対して高い安全性を示した。

5. 水稲用除草剤としての特性

圃場試験において、メソトリオンの5～20g ai/10aは雑草発生前およびノビエ3葉期処理でイヌホタルイ、コナギおよびアゼナ類に対して高い効果を示し、スルホニルウレア系除草剤抵



図－２ とうもろこしとシロザの解毒代謝能力の違い

(Syngenta Jealott's Hill International Research Center)

抗性(SU-R)生物型に対しても有効であることが確認された。多年生草種に対しては、ポット試験において本剤(6～9g ai/10a)は、発生前および発生後処理でミズガヤツリに高い効果を示し、クログワイ、ウリカワおよびオモダカに対して

も高活性を認めた。ポット試験において、本剤(6g ai/10a)は、イヌホタルイに対して発生前～3.3葉期処理で、コナギに対しては発生始期～3.5葉期処理でそれぞれ高い効果を示した(図-3および図-4)。同系統の既存混合剤との比較が

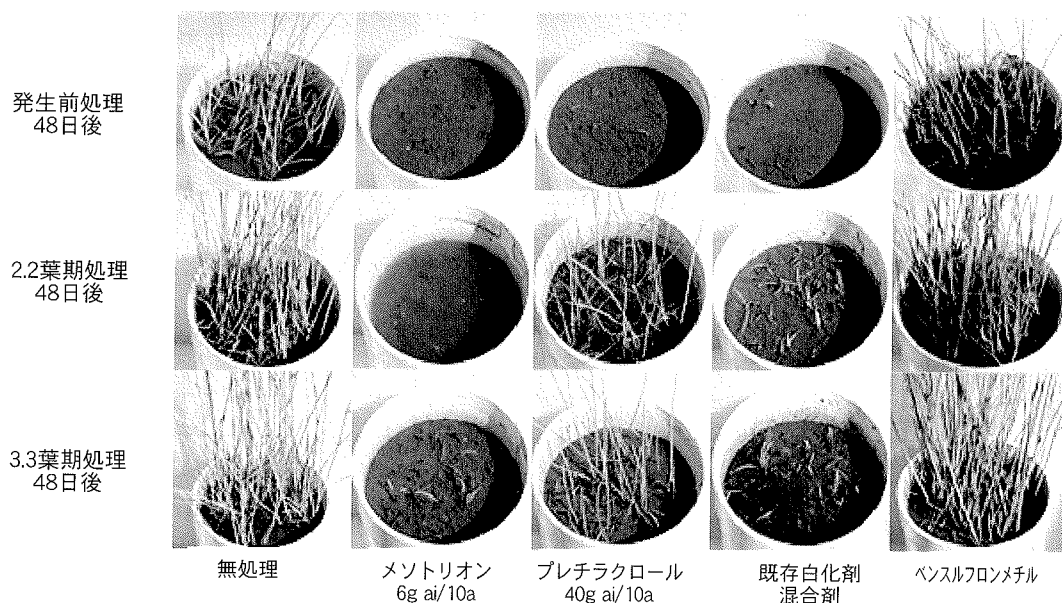


図-3 メソトリオンのスルホニルウレア系薬剤抵抗性イヌホタルイに対する効果(2006年 社内ポット試験)



図-4 メソトリオンのスルホニルウレア系薬剤抵抗性コナギに対する効果(2006年 社内ポット試験)

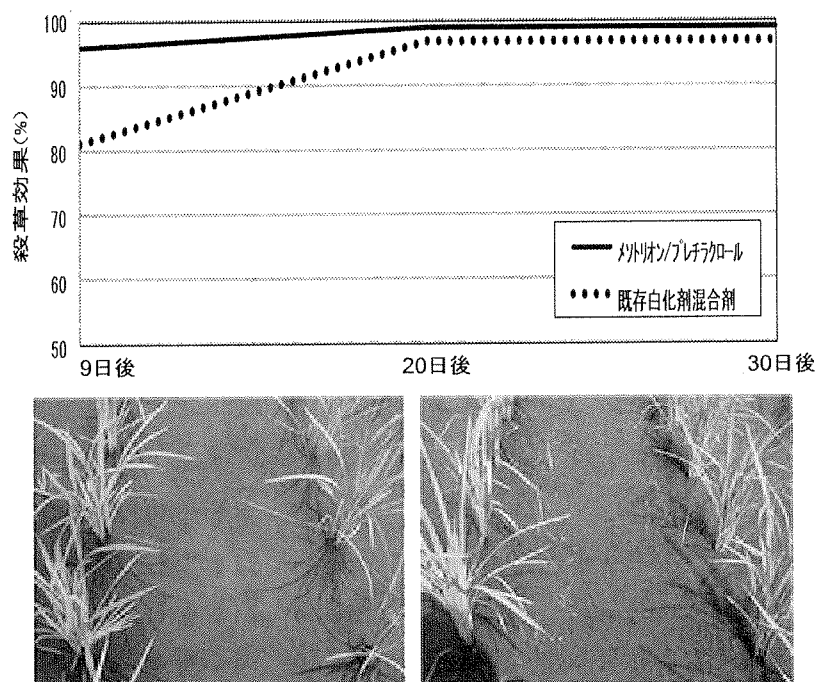
ら、本剤は既存の HPPD 阻害型除草剤に比べて発生後の効果に優れることが示唆された。

圃場試験において、本剤(5～9g ai/10a)は移植水稻に対して高い安全性を示した。本剤は根部からイネ体内へ過度に吸収・取り込みが起る場合に、一過性の白化薬害を示す可能性が示唆されたが、田面水の下方移動がある条件でも薬害症状は観察されず、実用場面での安全性は高いと推察された。

また、メソトリオンとプレチラクロールとの混用は、主要な水田雑草に対して有効であることが圃場およびポット試験で確認された。この組み合わせはそれぞれの殺草スペクトルを補完するだけではなく、多年生雑草に対しての相乗的な効果も示唆された。さらに、ノビエ、イヌホタルイおよびコナギに対して、同系統の既存混合剤に優る効果発現の速さを示した(図－5)。

6. おわりに

メソトリオンは、2001年にドイツで最初に上市されて以来40カ国で農薬登録され、現在、本剤を含有する製品は全世界の延べ1600万ha以上のとうもろこし栽培で使用されている。国内においても、本剤は1)とうもろこし栽培における主要な雑草に対して幅広い殺草スペクトルを示す、2)雑草の出芽前から生育にかけて効果が高く、3)特に生育の進んだ広葉雑草に対して卓効を示す、4)作物安全性も高いなど、我が国においても新規のとうもろこし用除草剤として有用であることが確認された。一方水田においても、1)一年生カヤツリグサ科雑草、広葉雑草および一部の多年生雑草にわたる幅広い水田雑草に対して有効である、2)雑草の発生前から発生後高葉齢にかけて幅広い処理時期で効果が高い、3)水稻に対して安全性が高いなど、水稻



図－5 メソトリオンとプレチラクロールとの混用のイヌホタルイに対する効果 (2007年 社内圃場試験)

用除草剤としても有用性が高いことが明らかとなった。

HPPD 阻害型の除草剤は、とうもろこしもしくは水稻のどちらか一方で使用されており、トリケトン系除草剤は主にとうもろこし用として使用されてきた。以上のとおり、メソトリオンはとうもろこしに加えて水稻に対しても適用可能なトリケトン系の HPPD 阻害型除草剤である。

参考文献

- 1) Hellyer, R.O. (1968): The occurrence of b-triketones in the steam-volatile oils of some myrtaceous Australian Plants, Aust. J. Chem., 21, 2825
- 2) Gray, R., et al: 1-Hydroxy-2-(alkylketo)-4,4,6,6-tetramethylcyclohexene-3,5-diones. USP 4, 202, 840
- 3) Michaely, W.J., et al: 2-(2-substituted benzoyl)-1,3-cyclohexanediones. USP 4,780, 127
- 4) Lee, D.L., et al (1997): The discovery and structural requirements of inhibitors of p-hydroxyphenylpyruvate dioxygenase. Weed Sci., 45, 601
- 5) Mayer, M.P., et al (1990): Quinone compounds are able to replace molecular oxygen as terminal electron acceptor in phytoene desaturation in chromoplasts of *Narcissus pseudonarcissus* L. European. J. Biochem., 191, 359
- 6) Prisbylla M.P. et al (1993): The novel mechanism of action of the herbicidal triketones. Proc. Brighton Crop Protection Conference – Weeds 2, 731
- 7) 山下修・榎吉寿夫・阪上和久・森島靖雄 (2009): 新規除草剤メソトリオンに関する研究 第1報 トウモロコシ用畑作除草剤としての作用特性. 日本雑草学会第48回講演会講演要旨, 13
- 8) 杉山稔・山下修・榎吉寿夫・富岡淳志・森島靖雄・Ruediger KOTZIAN (2009): 新規除草剤メソトリオンに関する研究 第2報 水田用除草剤としての作用特性. 日本雑草学会第48回講演会講演要旨, 14
- 9) 榎吉寿夫・杉山稔・山下修・富岡淳志・阪上和久・森島靖雄 (2009): 新規 HPPD 阻害型除草剤 ‘メソトリオン’ 畑作および水田における作用特性. 第26回農薬生物活性研究会シンポジウム講演要旨集, 21-24

カヤツリグサ科入門図鑑

谷城 勝弘

A5変形判 定価2,940円(税込)

ごく普通に見られる約200種を取り上げ、大きな写真、ていねいな写真説明でわかりやすく解説します。

- | | |
|-----|---------------|
| 第1部 | カヤツリグサ科の形 |
| 第2部 | カヤツリグサ科200種 |
| 第3部 | カヤツリグサ科の生える環境 |
| 第4部 | 標本でみるカヤツリグサ科 |

全国農村教育協会

〒110-0016 東京都台東区台東1-27-11

TEL03-3839-9160 FAX03-3839-9172

<http://www.zennokyo.co.jp>