

シクロピリモレート

はじめに

シクロピリモレート（サイラ[®]）は三井化学アグロが創製し、全国農業組合連合会と共同で開発を進めているフェノキシピリダジン系の新規除草活性成分である。本化合物は、水稻に対して高い安全性を有し、一年生、多年生の広葉雑草、カヤツリグサ科雑草に有効であり、長期残効性を有する。雑草に対しては白化作用を示し、新規な作用機構を有することが確認されており、同じ白化作用を有する4-HPPD阻害剤との混合で飛躍的な相乗効果を示す。現在国内で発生・蔓延しているALS阻害剤の抵抗性雑草にも有効であり、一発剤、中後期剤としていくつのかの混合剤を開発してきている。

本稿ではシクロピリモレートの生物活性の特徴を中心に紹介する。

1. 開発の経緯

サイラ[®]は後で詳細を述べる相乗効果を利用し、ピラゾレートとの混合剤について、公益財団法人日本植物調節剤研究協会（以下、植調協会と省略）を通じ2006年よりSW-064-1kg粒の試験を開始（2019年9月20日に農薬登録取得）。その後、サイラ[®]とピラゾレートに加えフェントラザミド（MIH-111-1kg粒, MIH-122FL, MIH-123 ジャンボ）、プロピリスルフロン（MIH-141-1kg粒, MIH-142FL, MIH-143 ジャンボ）、トリアファモン

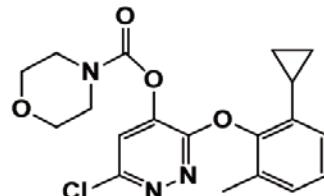
（MIH-161-1kg粒 [HSW-1501], MIH-162FL[HSW-1502], MIH-163 ジャンボ）を配合した一発剤それぞれの適用性試験を実施し、実用性が確認されている。また、テフリルトリオニンとの相乗効果を利用したMIH-164-1kg粒について2016年より試験を開始し、中後期剤として湛水散布もしくはごく浅水散布で適用可能であることが確認されている。これら混合剤は2019年10月9日に農薬登録を取得している。

2. サイラ[®]の一般名・学名及び化学構造

一般名：シクロピリモレート

(cyclopyrimorate)

化学名 (IUPAC) : 6-クロロ-3-(2-クロプロピル-6-メチルフェノキシ)ピリダジン-4-イル=モルフォリン-4-カルボキシラート



分子量：389.83

3. 物理化学的特性及び安全性

性状：白色結晶粉末

融点：114.0°C

蒸気圧： $< 1.0 \times 10^{-5}$ Pa

三井化学アグロ株式会社
研究開発本部 開発部

門谷 淳二

水溶解度：11.9ppm (20°C)

n-オクタノール／水分配係数：

LogPow=3.3

急性経口毒性：

ラット LD₅₀ > 2,000mg/kg

急性経皮毒性：

ラット LD₅₀ > 2,000mg/kg (♂, ♀)

魚類急性毒性：

コイ LC₅₀ 6.9mg/L (96hr)

ミジンコ急性遊泳阻害：

オオミジンコ EC₅₀ > 13mg/L (48hr)

藻類生長阻害：

緑藻 ErC₅₀ 6.1mg/L (72hr)

4. 作用機構

サイラ[®]は、雑草の根部、茎葉基部より吸収され、新葉に白化作用を引き起こすことで枯死に至らしめる。白化作用を示す除草剤の作用点としては、これまでに、PDS阻害剤、4-HPPD阻害剤、DOXP synthase 阻

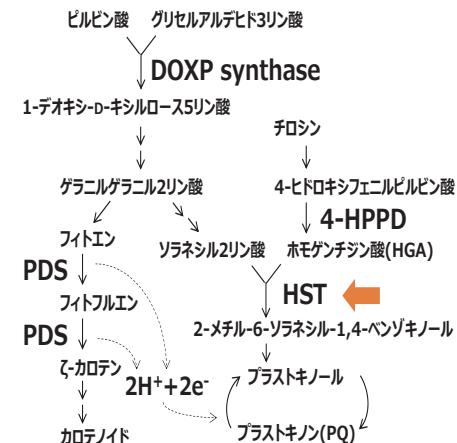
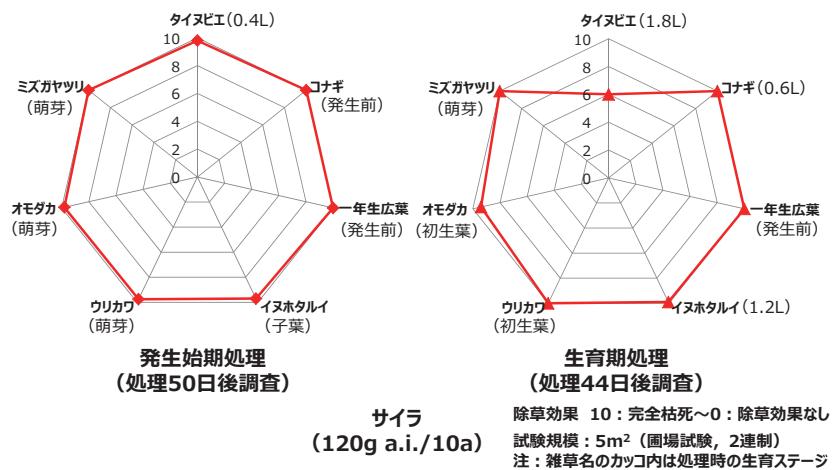


図-1 カロテノイドとプラストキノンの生合成経路



害剤が知られているが、本剤はこれらとは異なり新規作用点であるプラストキノン合成経路の homogentisate solanesyltransferase (HST) を阻害することが明らかにされている（図-1）。

5. 生物活性

(1) 殺草スペクトラム

サイラ®は雑草発生前～発生始期処理では、タイヌビエを含む一年生雑草及びイヌホタルイ、ミズガヤツリ、ウリカワ、オモダカに高い効果を示し、雑草生育期処理ではタイヌビエを除く草種に高い除草効果を示した（図-2）。また、新規な作用機構の白化剤であるので、ALS 阻害剤の抵抗性雑草に対しても有効であることが確認されている（図-3）。

(2) 土壤中移動性（縦浸透）

植調協会で2010年に実施された作3試験の結果、沖積重埴土では0～1cm、洪積壤土では0～2cmに局在することが確認されている（試験データ省略）。

(3) 流亡条件下での除草効果

薬剤処理後の田面水が流亡する条件

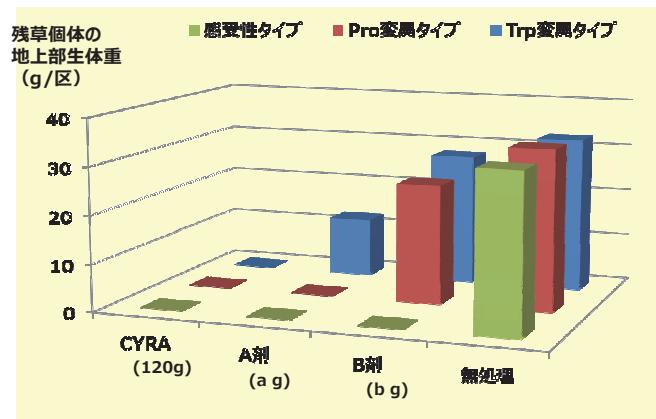


図-3 サイラの ALS 阻害剤抵抗性イヌホタルイに対する除草効果

下において、サイラ®は安定した除草効果を示すことが確認されている（図-4）。

(4) 残効性

植調協会で2010年に実施された作2試験の結果、コナギ、ホタルイに対して41日以上の残効が確認された（表-1）。また、各種雑草に対して圃場において50日以上の残効を確認してい

る（図-2）。圃場においては、田面水は縦浸透（漏水）や横移動があるが、上記(2), (3)で示した条件での効果の安定性が残効性に寄与していると推察される。

(5) 水稲に対する安全性

サイラ®は移植水稻に対して高い安全性を有し（図-5）、一部のトリケトン系4-HPPD阻害剤が感受性を示

表-1 作2試験（残効性）2010年 植調研究所

薬量 g a.i./10a		抑草率 (%)					残効期間 (50%抑草)	
		5日	10日	20日	30日	40日		
サイラ	120	コナギ	99	99	99	99	70	41日以上
		ホタルイ	99	99	99	99	70	41日以上
A剤	40	コナギ	99	99	50	40	0	21～30日
		ホタルイ	99	97	50	30	0	21～30日
B剤	9	コナギ	95	95	70	50	0	31～40日
		ホタルイ	100	100	70	50	0	31～40日

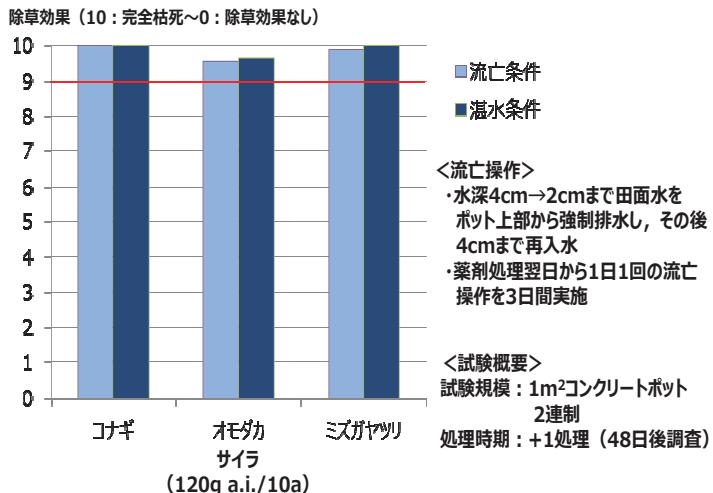


図-4 サイラの流亡条件下での除草効果

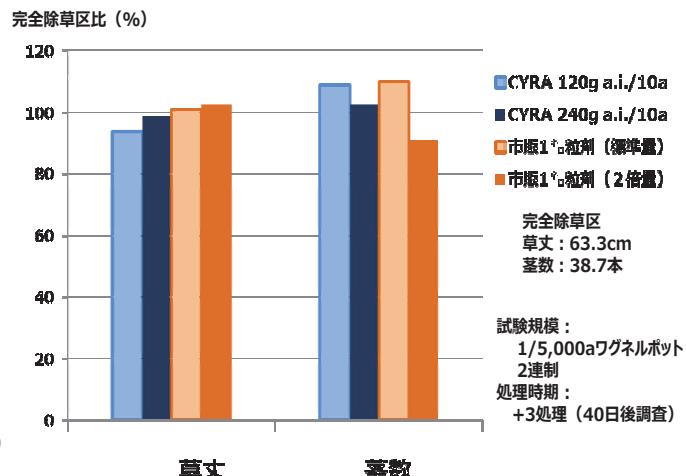


図-5 サイラ移植水稻に対する安全性

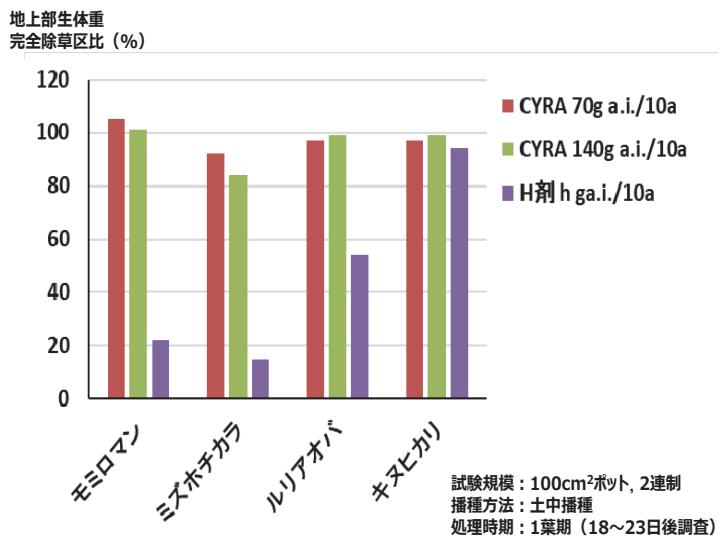


図-6 サイラの水稻に対する安全性

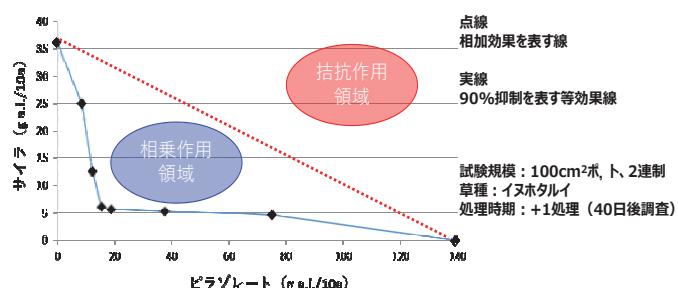
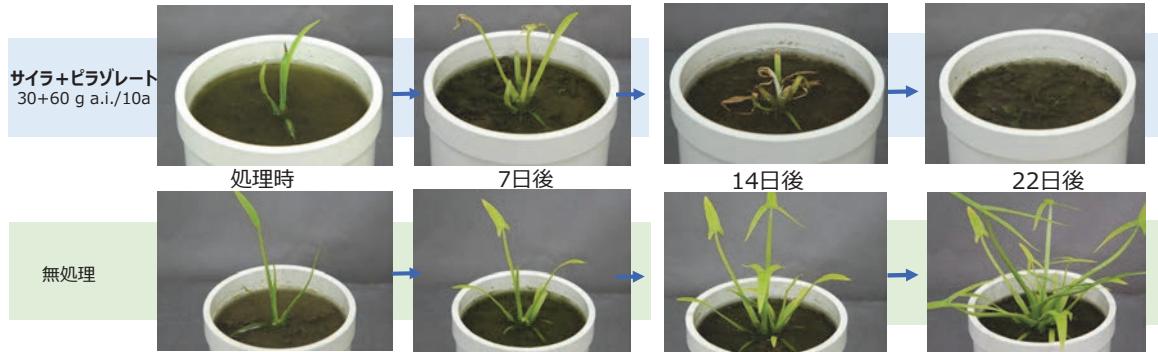


図-7 サイラとピラゾレートの混合効果



・試験規模：1/5000aワグネルポット（温室内試験）・処理時期：オモダカ本葉3葉期

図-8 サイラ + ピラゾレート混合剤の作用発現

除草効果 (10 : 完全枯死～0 : 除草効果なし)

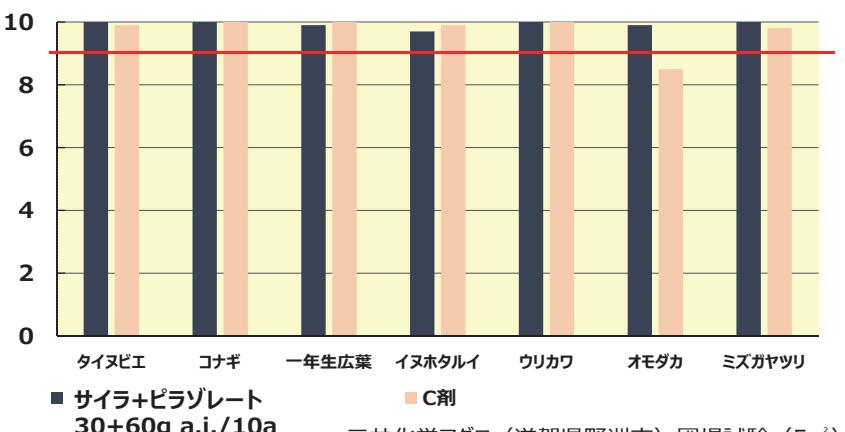
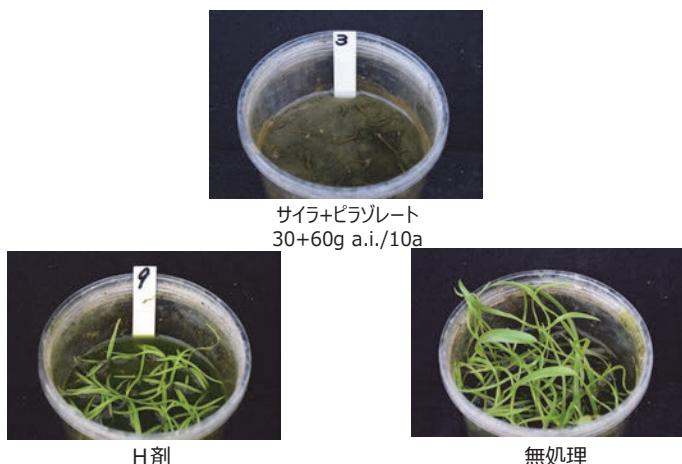
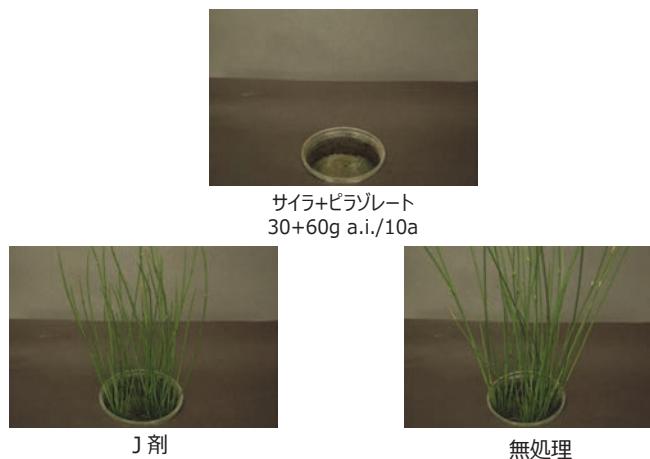


図-9 サイラ + ピラゾレート混合剤の除草効果



三井化学アグロ（滋賀県野洲市）温室内ポット試験 (2015年)
播種 : 2015年11月19日, 処理 (2葉期) : 12月4日,撮影 : 1月14日 (処理41日後)

図-10 サイラ + ピラゾレートのALS阻害剤抵抗性コナギ (Pro₁₉₇変異)に対する効果

三井化学アグロ（滋賀県野洲市）温室内ポット試験 (2015年)
播種 : 2015年4月20日, 処理 (2葉期) : 4月22日,撮影 : 6月3日 (処理42日後)

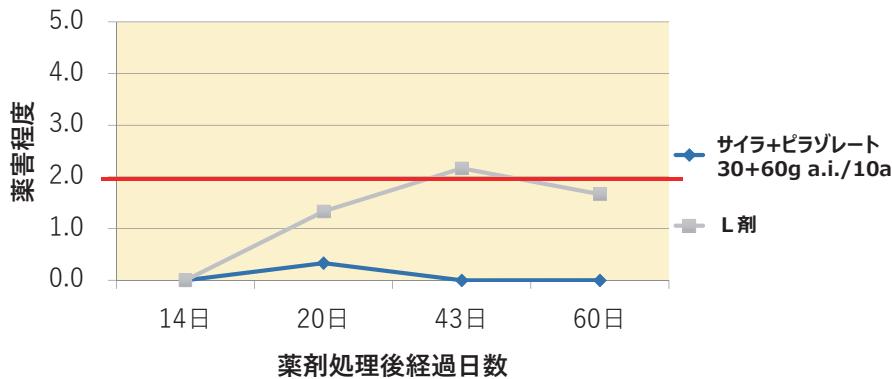
図-11 サイラ + ピラゾレートのALS阻害剤抵抗性イヌホタルイ (Trp₅₇₄変異)に対する効果

す品種に対しても高い安全性を有することを確認している(図-6)。

(6) 相乗効果

水稻用除草剤の有効成分のうちのいくつかの組み合わせは、相乗効果があることが知られているが、サイラ®は特に4-HPPD阻害剤と高い相乗効果を示す。具体例として4-HPPD阻害剤のひとつであるピラゾレートとの相乗効果を千坂の方法により等効果線で示すと図-7の通りであり、この高い相乗効果を利用した混合剤が1.で記したSW-064-1kg粒である。ピラゾレートとの混合剤の作用発現は処理後に発生する新葉の黄化・白化から全体枯死に至る経過をたどり(図-8)，各種雑草(図-9)，さらにはALS阻害剤抵抗性のコナギ(Pro₁₉₇変異バイオタイプ)，イヌホタルイ(Trp₅₇₄変異バイオタイプ)に対しても高い効果を示す(図-10, 11)。また、移植水稻に対して、移植当日処理でも高い安全性を有する(図-12)。

4-HPPD阻害剤のテフリルトリオンとの等効果線は図-13に示す通りであり、この高い相乗効果を利用した混合剤が1.で記したMIH-164-1kg粒である。テフリルトリオンとの混合剤の作用発現は同様に、処理後に伸長する新葉に白化作用を引き起こしその後個体全体の枯死に至る(図-14)。相乗効果は生育の進んだ雑草に対する殺草葉齢限界の向上として現れる。その一例



薬害程度 : 0 = 無、1 = 微、2 = 中、4 = 大、5 = 甚大 (許容範囲は2.0以下)

【試験概要】
 場所 : 全農 営農・技術センター (神奈川県平塚市)
 試験規模 : 2.25m² (圃場試験)
 供試品種 : コシヒカリ
 代かき : 2013/4/22
 水稲移植 : 2013/4/25
 薬剤処理 : 2013/4/25 (移植当日)

図-12 サイラ + ピラゾレートの移植水稻に対する安全性

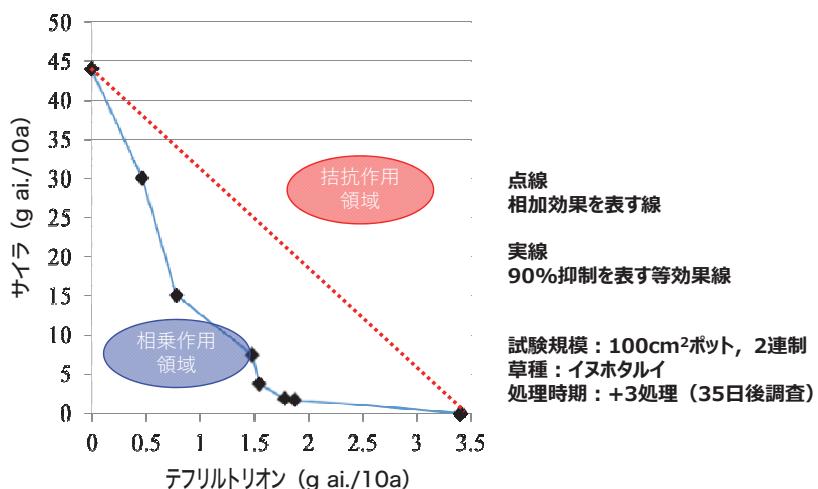


図-13 サイラとテフリルトリオンの混合効果

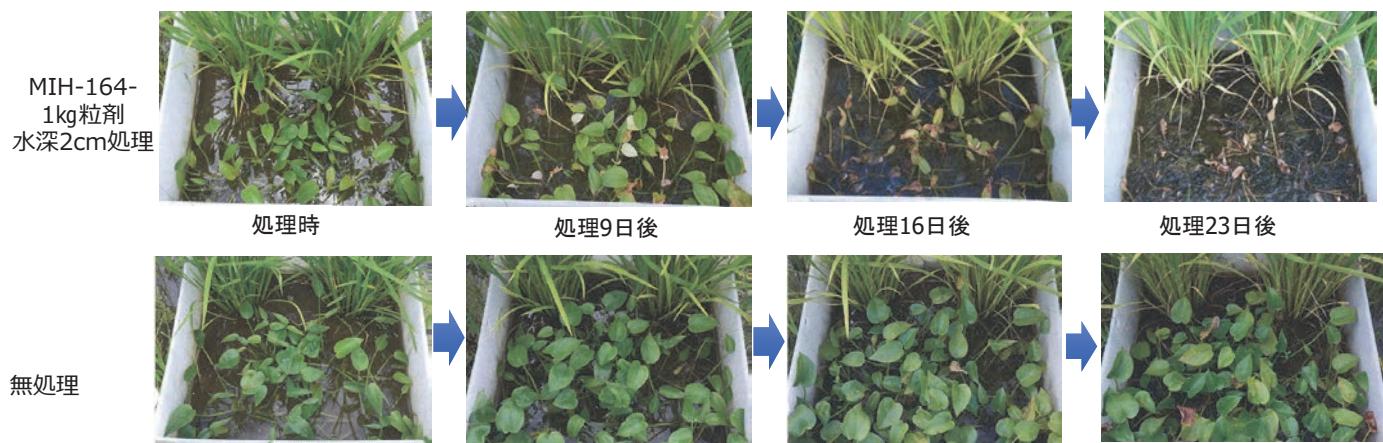


図-14 サイラ + テフリルトリオン混合剤 (MIH-164-1kg粒剤) の作用発現 (コナギ)

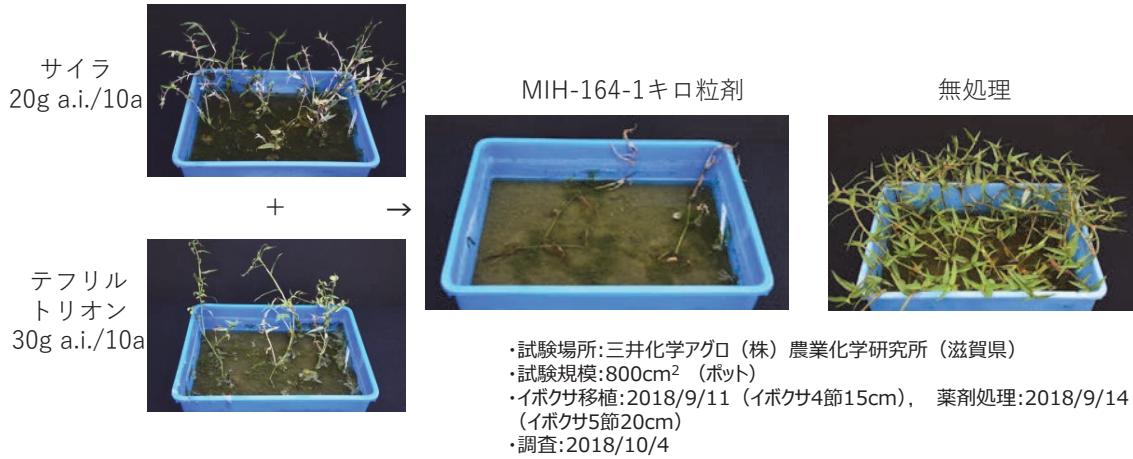


図-15 サイラ + テフリルトリオンの混合発現効果

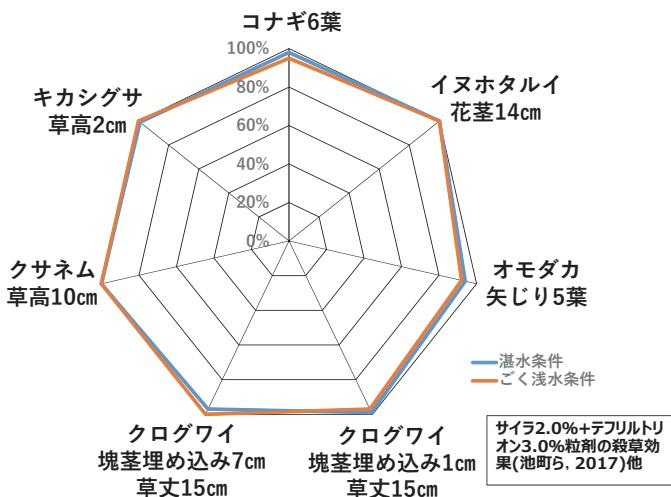


図-16 サイラ + テフリルトリオン混合剤の湛水条件、ごく浅水条件での除草効果

を図-15に示す。また、各種雑草に対して湛水条件とともに、ごく浅水条件においても同様な高い効果を示すことが確認されている（図-16）。

6. おわりに

サイラ®（シクロピリモレート）は、新規な作用点を有する除草剤であり、その特徴である4-HPPD阻害剤との高い相乗効果を利用した混合剤は、交差抵抗性を示す各種ALS阻害剤抵抗性雑草に対しても有効である。また、

水稻に対する高い安全性を有することより、水稻作における雑草防除の新たな防除ツールとして期待できるので、その普及を通じて貢献していきたい。

参考文献

- 安藤卓也ら 2018. 日本雑草学会第57回大会講演要旨集 42.
- 千坂英雄 1975. 雜草研究 19, 72-77.
- 池町健太ら 2017. 日本雑草学会第56回大会講演要旨集 34.
- 門谷淳二ら 2017. 日本農薬学会第42回大会講演要旨集 52.
- 門谷淳二 2019. 第36回農薬生理活性研究会シンポジウム 33-36.
- 北原克也ら 2018. 日本雑草学会第57回大会

会講演要旨集 43.

Shino, M., et al. 2018. J. Pestic. Sci. 43(4), 233-239.

田丸洋ら 2017. 日本雑草学会第56回大会講演要旨集 33.

Tamaru, H. et al. 2017. The 26th Asian-Pacific Weed Science Society Conference 190.

吉野康佑ら 2017. 日本雑草学会第56回大会講演要旨集 32.

財団法人日本植物調節剤研究協会 2010. 平成22年度夏作関係除草剤 作用性・適用性判定試験総合要録（水稻編）469-471, 472-474.