

フェンキノトリオン

クミアイ化学工業株式会社
研究開発本部開発推進部

永松 敦

はじめに

フェンキノトリオン（ブランドネーム：エフィーダ®，EFFEEDA®）はクミアイ化学工業（株）が創製した新規の除草剤である。本剤は既存のトリケトン系 4-HPPD 阻害剤の影響が大きい新規需要米向け品種を含めた幅広い水稲品種に高い安全性を有し、広範囲の草種に対して安定した除草効果を示すことを特長とする。

本剤はフェンキノトリオン 1 キロ粒剤 (KUH-110) として、2011 年から公益財団法人日本植物調節剤研究協会を通じた水稲用除草剤としての公的委託試験を開始、2018 年 2 月に国内農業登録された。その後も本剤を含む混合剤を開発し、水稲初・中期一発処理除草剤として、ピリミノバックメチル・フェンキノトリオン混合剤「バルーガ®」(KUH-121)、ピラクロニル・ピリミノバックメチル・フェンキノトリオン混合剤「エンペラー®」(KUH-151)、ピリミスルファン・フェノキサスルホン・フェンキノトリオン混合剤「ベッカク®」(KUH-161)、トリアファモン・フェンキノトリオン混合剤「プライオリティ®」(KUH-162)、中・後期処理除草剤としてシメトリン・ピリミスルファン・フェンキノトリオン「ツイゲキ®」(KUH-163) が農業登録された。

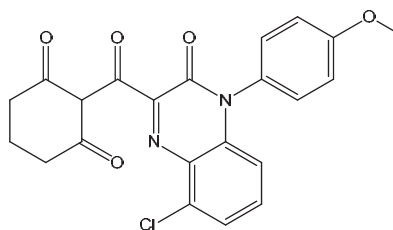
本報ではフェンキノトリオンの水稲用除草剤としての生物活性について紹介する。

1. 名称および化学構造

一般名：フェンキノトリオン
(ISO 名：fenquinotrione)

化学名 (IUPAC)：2-[8-クロロ-3,4-ジヒドロ-4-(4-メトキシフェニル)-3-オキソキノキサリン-2-イルカルボニル]シクロヘキサン-1,3-ジオン

構造式：



分子式：C₂₂H₁₇ClN₂O₅

分子量：424.83

2. 物理化学性、安全性

性状：淡黄色粉末

融点：251.3°C

蒸気圧：2.9×10⁻⁷Pa (25°C)

水溶解度：17.3 mg/L (純粋, 20°C)

人畜毒性：

経口：ラット LD₅₀ > 2,000 mg/kg

経皮：ラット LD₅₀ > 2,000 mg/kg

魚毒性：

オオミジンコ EC₅₀(48h) > 75 mg/L

コイ LC₅₀(96h) > 100 mg/L

3. 作用機構および殺草作用症状

フェンキノトリオンはオキソキノキサリン骨格を特徴とするトリケトン系除草剤であり (玉井ら 2014), 4-ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ (4-HPPD) を作用点とする白化型除草剤である (山本ら 2015a)。発生前のイヌホタルイに本剤を処理した場合、イヌホタルイは白化症状を呈しながら 1 葉期程度まで伸展した後、処理後 20 日程度までに効果が完成し、枯死に至る (図-1)。

4. 生物活性

(1) 殺草スペクトラム

フェンキノトリオンの各雑草種に対

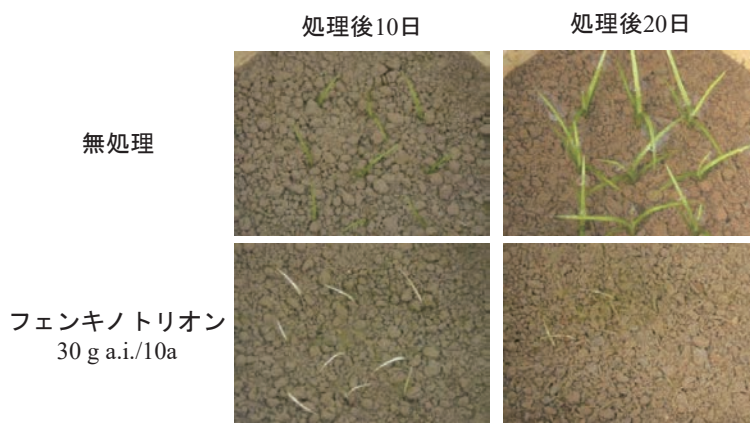


図-1 発生前処理におけるイヌホタルイに対する作用症状

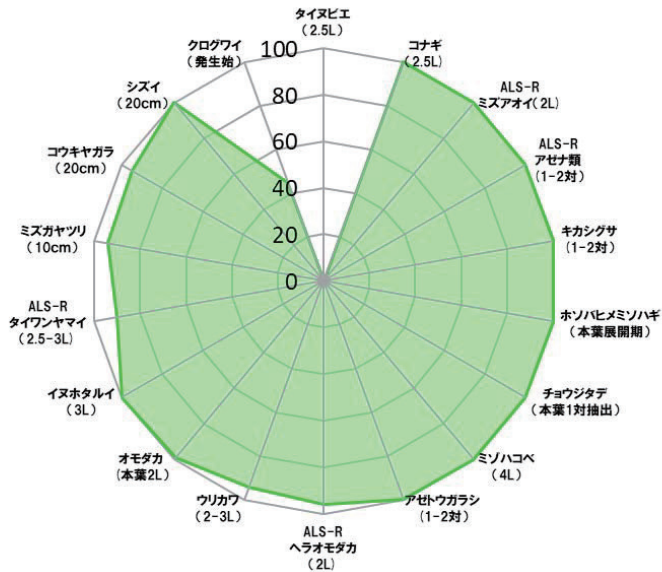


図-2 フェンキノトリオン 30 g a.i./10a の殺草スペクトラム
 除草効果は観察調査指数 (0; 効果なし~ 100; 完全枯死) で示した。

する基礎活性を温室内ポット試験において確認した。フェンキノトリオンは 30ga.i./10a の投下薬量で、発生前および生育期のイヌホタルイなどのカヤツリグサ科雑草やコナギ、アゼナ類などの水田広葉雑草に対して高い基礎活性を示した (小林ら 2014) (図-2)。

フェンキノトリオンはノビエ、クログワイを除く、幅広い殺草スペクトラムを有することが示唆された。

(2) 除草効果

フェンキノトリオンのコナギ、イヌホタルイおよびオモダカに対する葉齢別の除草効果を温室内ポット試験で

確認した。フェンキノトリオンは 30g a.i./10a の薬量で、2 葉期から 4 葉期のイヌホタルイおよびコナギ、発生時から矢尻葉 1 葉期のオモダカといった高葉齢の個体を含む雑草種に対して高い除草効果を示し、10 g a.i./10a の薬量でも同様に高い除草効果を示し

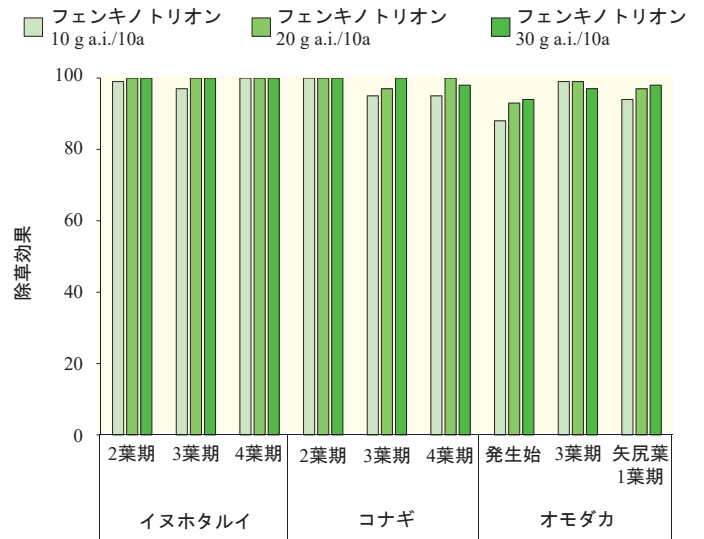


図-3 フェンキノトリオンの葉齢別のイヌホタルイ、コナギおよびオモダカに対する除草効果
 除草効果は観察調査指数 (0; 効果なし~ 100; 完全枯死) で示し、イヌホタルイは処理後 50 日、コナギは処理後 29 または 30 日、オモダカは処理後 45 日の調査結果を示した。

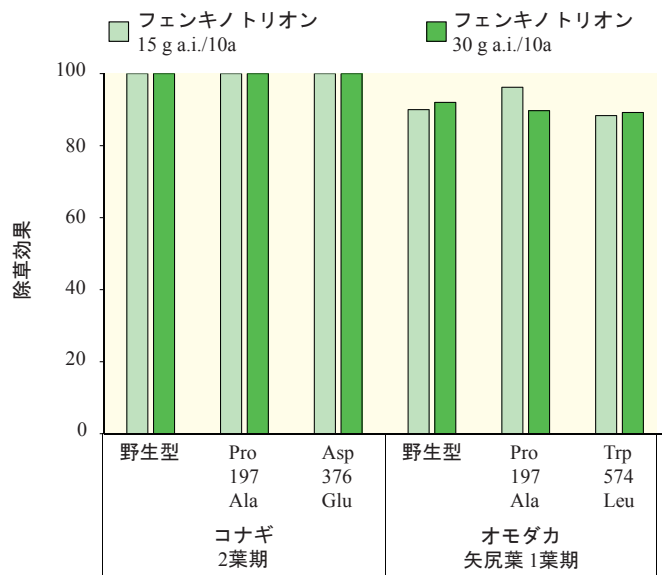


図-4 フェンキノトリオンのアセト乳酸合成酵素 (ALS) 阻害型除草剤抵抗性バイオタイプのコナギおよびオモダカに対する効果
 除草効果は観察調査指数 (0; 効果なし~ 100; 完全枯死) で示し、処理後 29 または 30 日の調査結果を示した。Pro197Ala, Asp376Glu および Trp574Leu は、供試系統におけるシロイヌナズナ ALS タンパク質のアミノ酸配列を基準としたアミノ酸置換を示し、コナギについては ALS1 上のアミノ酸置換である。

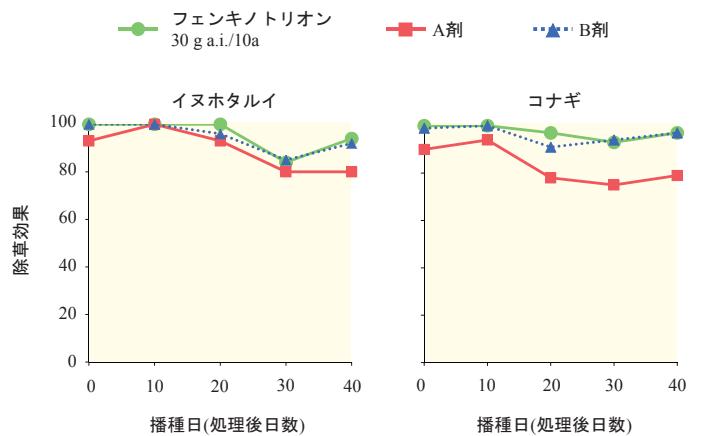


図-5 フェンキノトリオンのイヌホタルイおよびコナギに対する残効
 イヌホタルイおよびコナギ種子を薬剤処理当日、処理後 10 日、20 日、30 日および 40 日に経時的に土壌表面に播種し、それらの播種したイヌホタルイおよびコナギに対する除草効果を評価した。除草効果は観察調査指数 (0; 効果なし~ 100; 完全枯死) で示し、それぞれ播種後 30 日の調査結果を示した。

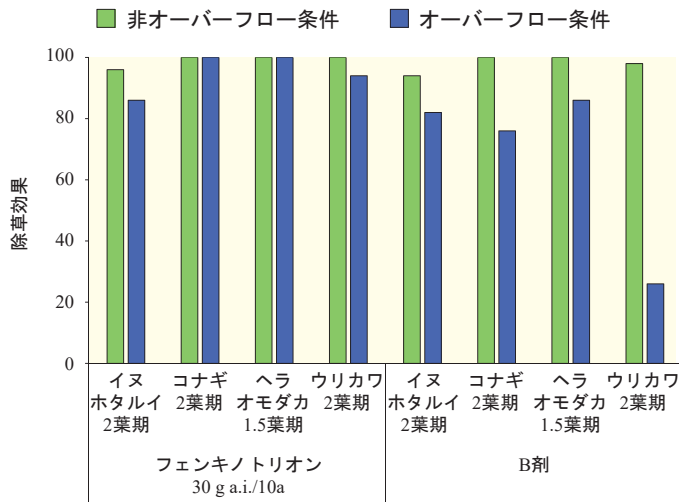


図-6 オーバーフロー想定条件におけるフェンキノトリオンの除草効果
オーバーフロー条件では、湛水深4cmの状態から2cmの水を除去した後、再度入水し湛水深を4cmとする操作を一日一回、薬剤処理翌日から連日3日間行った。非オーバーフロー条件では湛水深4cmの状態を維持した。除草効果は観察調査指数（0；効果なし～100；完全枯死）で示し、処理後43日の調査結果を示した。

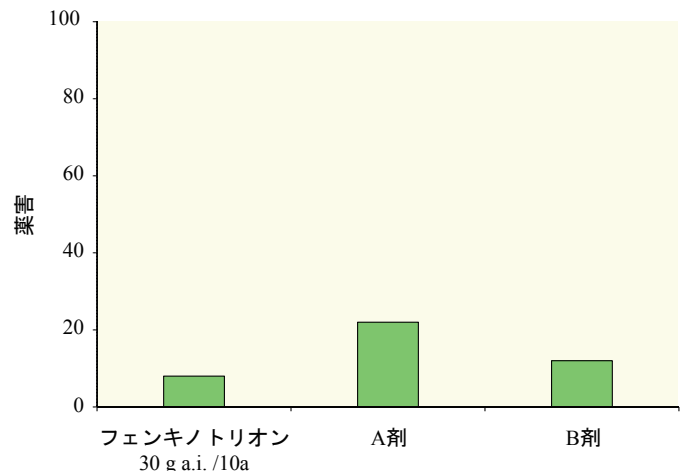


図-7 フェンキノトリオンの浅植え条件における移植水稻に対する葉害
移植時の水稻は2葉期、移植深度は1cmとし、薬剤を移植直後に処理した。葉害は観察調査指数（0；葉害なし～100；完全枯死）で示し、処理後31日の調査結果を示した。

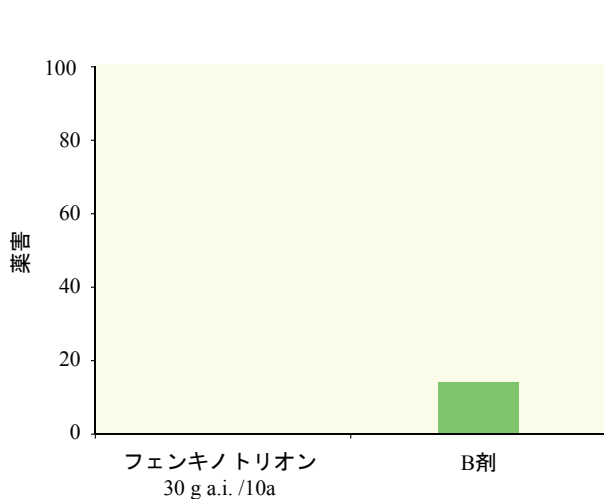


図-8 フェンキノトリオンの漏水条件における移植水稻に対する葉害
移植時の水稻は2葉期、移植深度は2cmとし、薬剤を移植直後に処理した。湛水深4cmの状態から一日に湛水深1cm分の漏水を薬剤処理の翌日から連日10日間生じさせた。葉害は観察調査指数（0；葉害なし～100；完全枯死）で示し、処理後31日の調査結果を示した。

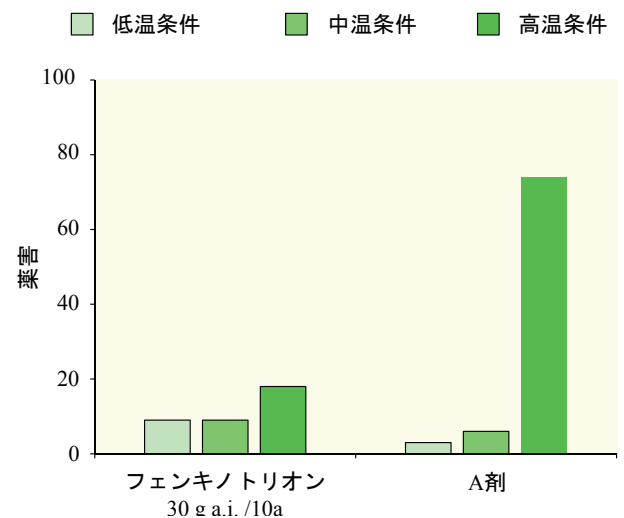


図-9 異なる気温条件におけるフェンキノトリオンの移植水稻に対する葉害
移植時の水稻は2葉期、移植深度は3cmとし、薬剤を移植直後に処理した。低温条件における平均気温は16℃、中温条件における平均気温は22℃、高温条件における平均気温は28℃だった。葉害は観察調査指数（0；葉害なし～100；完全枯死）で示し、処理後15日の調査結果を示した。

た（図-3）。また、アセト乳酸合成酵素（ALS）阻害型除草剤に対して抵抗性を示すバイオタイプに対しても、野生型に対する効果と同等の効果を有することを確認した（図-4）。

(3) 残効

フェンキノトリオンのコナギおよ

びイヌホタルイに対する残効を温室内ポット試験で確認した。薬剤処理後、10日、20日、30日、40日にコナギおよびイヌホタルイの種子をポットの土壌表面に追い播きし、残効を評価した。フェンキノトリオンは30 g a.i./10aの薬量で、薬剤処理後40日

までに播種したコナギおよびイヌホタルイに対して対照剤同等以上の効果を示した（図-5）。

(4) 除草効果に対するオーバーフローの影響

除草剤の薬効・葉害には、降雨による田面水のオーバーフローや気温など

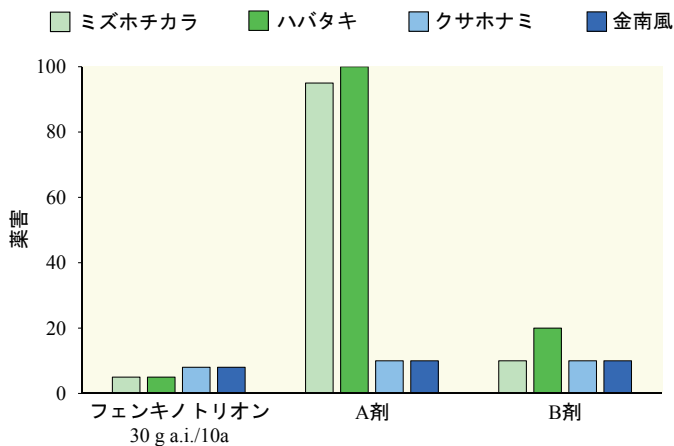


図-10 フェンキノトリオンのトリケトン系4-ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ阻害型除草剤高感受性品種に対する1葉期処理における薬害
ミズホチカラおよびハバタキは高感受性品種、クサホナミおよび金南風は低感受性品種とされる。薬害は観察調査指数(0; 薬害なし~100; 完全枯死)で示し、処理後26日の調査結果を示した。

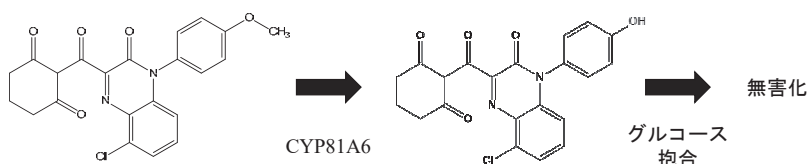


図-11 イネにおけるフェンキノトリオンのCYP81A6を介した代謝経路

の気象要因、雑草や作物の発生深度や移植深度、下方漏水(リーチング)などの様々な環境変動要因が影響する。そこでフェンキノトリオンの除草効果に対するオーバーフローの影響を温室内ポット試験にて確認した。フェンキノトリオンは30 g a.i./10 aの薬量で、3日間で6 cm(2 cm/日)のオーバーフローを想定した条件において、対照剤と比較して効果変動は小さく、安定した除草効果を示した(図-6)。

(5) 移植水稻に対する薬害と環境変動要因の影響

移植水稻(品種:金南風)に対する薬害をポット試験で検討した。フェンキノトリオンは30 g a.i./10aの薬量で、一般的に除草剤の薬害が強くなる浅植え条件(移植深度1 cm)において水稻安全性は良好であった(図-7)。また、圃場での田面水の下方漏水を想定し、10日間で10 cm(1 cm/日)の漏水を生じさせたモデル試験でも、高い水稻安全性を示した(図-8)。

ファイトロンを用い、西南暖地の普通期栽培を想定した高温条件、寒冷地を想定した低温条件、その中間の中温条件での薬害モデル試験では、フェンキノトリオンの薬害は温度条件によって変動したが、いずれの温度条件においても対照剤同等以上の安全性を示した(図-9)。

(6) トリケトン系4-HPPD阻害型除草剤高感受性品種に対する作物安全性

新規需要米品種の中にトリケトン系の4-HPPD阻害型除草剤に高感受性を示す品種が存在することが明らかとなっている(渡邊ら2010)。フェンキノトリオンもトリケトン系に分類されることから、ポット試験においていくつかの4-HPPD阻害型除草剤高感受性品種に対する作物安全性を検討した。その結果、フェンキノトリオンはこれらの品種に対しても低感受性品種と同等の高い安全性を示した(図-10)。

このようなフェンキノトリオンのイネに対する安全性要因を分子生物学的

手法により検証した。イネ幼苗におけるフェンキノトリオン代謝試験の結果、フェンキノトリオン脱メチル体およびそのグルコース抱合体が検出されたことから、酸化反応を触媒する解毒代謝酵素Cytochrome P450の関与が示唆された。イネにおいて薬剤代謝に関わるCytochrome P450としてCYP81A6が知られている(G. Pan et al. 2006)。そこで、まず日本晴を用いてCYP81A6の遺伝子発現が抑制されたイネを作出し、野生型とのフェンキノトリオンに対する感受性比較を行った。その結果、CYP81A6発現抑制イネでは野生型と比較してフェンキノトリオンに対する感受性が高まった。そこで、大腸菌発現系によってリコンビナントCYP81A6タンパク質の機能を解析したところ、CYP81A6はフェンキノトリオンの脱メチル化に関与することが明らかとなった。これらのことから、フェンキノトリオンは植物体内でCYP81A6によって酸化的脱メチル化され、脱メチル体が速やかにグルコース抱合されることで、高い作物安全性を示すと考えられた(山本ら2015b)(図-11)。一方、CYP81A6がイネに普遍的に存在し、機能しているかを様々な品種を用いて確認した。CYP81A6遺伝子のコーディング領域の塩基配列は日本晴、トリケトン系4-HPPD阻害型除草剤高感受性品種であるハバタキ、モミロマン、ミズホチカラ、低感受性品種であるクサホナミ、さらにインディカ種であるカサラスのいずれにおいても完全に一致した。ま

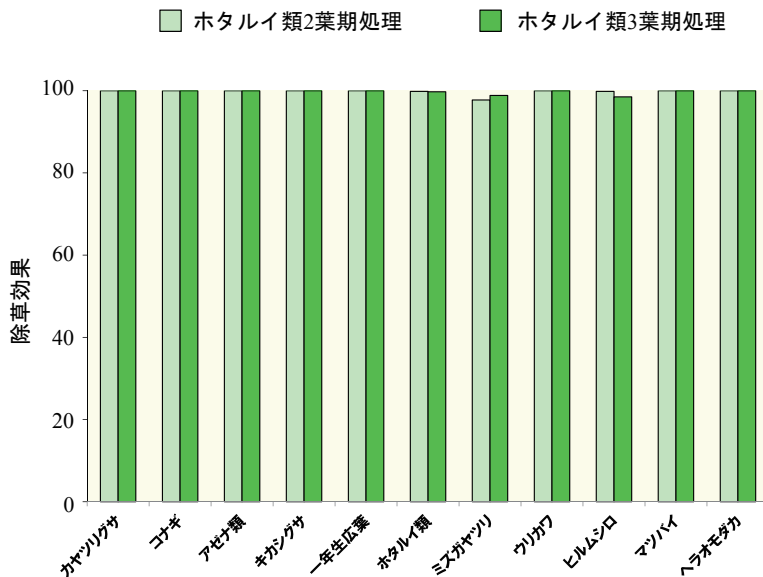


図-12 KUH-110-1kg 粒 (フェンキノトリオン 3.0%) の日植調委託試験における水田雑草に対する除草効果
 数値は 2012～13 年に実施された適 2 試験成績から求めた除草効果の平均値を示す。除草効果は「100 - (残草量の無処理区比%)」として示し、残草量 t は 0.1% として計算した。

た、各種イネにおける *CYP81A6* 遺伝子の発現量解析をリアルタイム RT-PCR 法により行ったところ、上記のいずれの品種においても、日本晴と同等以上の発現量を示した。以上の結果から、*CYP81A6* はイネにおいて普遍的に存在し、発現しており、フェンキノトリオンはイネに対して品種等を問わず安全性を有することが示唆された (山本ら 2015c)。

(7) 圃場試験 (日植調委託試験)

2012 年、2013 年に日植調委託試験にてフェンキノトリオン 3.0% 粒剤 (KUH-110-1kg 粒) の適用性試験を実施した。KUH-110-1kg 粒は、ホタルイ類 2 葉期および 3 葉期処理にて、各種一年生雑草およびマツバイ、ホタルイ類に対して高い除草効果を示した

(図-12)。水稲に対する薬害程度は、無または微と高い水稲安全性が認められ、水稲用除草剤の混合母剤として適用性を有すると判定された。

おわりに

以上の水稲用除草剤としての作用特性の検討から、フェンキノトリオンは ALS 阻害剤抵抗性雑草を含めた草種に対して有効な幅広い殺草スペクトラムと、一発処理除草剤の混合母剤として十分な残効と高葉齢の雑草に対する高い除草効果に加えて、環境変動要因や水稲品種によらず高い作物安全性を有する優れた有効成分である。

今後は、フェンキノトリオンの特性が理解され、各分野の雑草防除に活用

いただけるよう普及活動に努めていく。

引用文献

- 小林方美ら 2014. 新規除草剤フェンキノトリオンに関する研究 (第 2 報) - 水稲用除草剤としての特性 - . 日本農薬学会大会講演要旨集 39, 76
- Pan, G. *et al.* 2006. Map-based cloning of a novel rice cytochrome P450 gene *CYP81A6* that confers resistance to two different classes of herbicides. *Plant Mol. Biol.* 61, 933-943.
- 玉井龍二ら 2014. 新規除草剤フェンキノトリオンに関する研究 (第 1 報) - 合成及び構造と活性 - . 日本農薬学会大会講演要旨集 39, 128
- 渡邊寛明ら 2010. 飼料用イネや米粉等の新規需要米向け多収水稲品種の 4-HPPD 阻害型水稲除草剤に対する感受性. 日本作物学会講演要旨集 229, 32-33
- 山本峻資ら 2015a. 新規除草剤フェンキノトリオンの作用機構. 日本農薬学会大会講演要旨集 40, 145
- 山本峻資ら 2015b. 新規除草剤フェンキノトリオンのイネに対する安全性 (1). 日本農薬学会大会講演要旨集 40, 146
- 山本峻資ら 2015c. 新規除草剤フェンキノトリオンのイネに対する安全性 (2). 日本農薬学会大会講演要旨集 40, 147
- 財団法人 日本植物調節剤研究協会 2012. 平成 24 年度夏作関係 除草剤 作用性・適用性判定 試験成績総合要録 (水稲編)
- 財団法人 日本植物調節剤研究協会 2013. 平成 25 年度夏作関係 除草剤 作用性・適用性判定 試験成績総合要録 (水稲編)