

（課題名）安全で環境負荷の少ない国産水稲用除草剤の開発・実用化

（企業名）クミアイ化学工業株式会社

（統括責任者）石原 英助（クミアイ化学工業株式会社代表取締役専務研究開発本部長）

（研究代表者）井沢 典彦（クミアイ化学工業株式会社生物科学研究所長）

1 研究開発の概要

- ・日本の最重要作物である米の安定的生産のためには、水稲の有害雑草の防除が不可欠である。そのために選択的かつ低薬量でノビエを始めとする水稲雑草を防除でき、安全性が高く環境負荷が少ない除草剤が生産現場でも強く望まれている。また、これまでノビエに効果の高い薬剤が開発されているが、土壌条件や水変動条件などの環境変動要因により十分な防除に至らないため、追加の除草が必要となる場合がある。そこで、これまでの社内研究において見出したノビエに有効で環境変動要因に左右されにくい性能をもつ機能性化合物フェノキサスルホン（以下、社内コード名 KIH-1419 と表記）を活用して、実圃場における適用性（雑草の防除効果、作物・非標的生物への安全性、環境への影響）、他剤との混合剤化、人畜に対する安全性把握研究、環境科学的研究、作用機構解明研究、使用者に求められる製剤・施用法研究など、広範な総合的研究を行い、外部機関における客観的評価試験により農薬登録に資する成績を取得することで、雑草防除効果に優れ、食の安全・安心の確保、環境負荷の低減に貢献する製品の開発・実用化検討を行った。
- ・ノビエを中心とした幅広い水田雑草に有効で、環境や水変動により効果が左右されにくい有効成分の開発を目指し、種々の化合物の合成検討を行い、温室および小規模圃場での性能評価スクリーニング、初期安全性・環境リスク評価を行った結果、機能性化合物 KIH-1419 を選抜した。これまでの研究から KIH-1419 は水稲用除草剤としての優れた特性を有することが明らかとなっているが、実圃場における適用性（雑草の防除効果、作物・非標的生物への安全性、環境への影響）、他剤との混合剤化、人畜に対する安全性把握研究、環境科学的研究、作用機構解明研究、使用者に求められる製剤・施用法研究など、農薬としての実用化する上で、達成すべき課題が多く残されていた。そこで本委託研究においては、KIH-1419+ピリミスルファン混合剤（KIH-1419 を 10～20g、ピリミスルファンを 5g 含む 1 キロ粒剤：本剤は水稲の全栽培期間に亘り長期間、難防除雑草を含む幅広い有害雑草を 2 有効成分のみで防除でき、2 有効成分という特長により、近年取り組む地域が拡大している減農薬栽培を希望する生産者のニーズに対応することが可能である。）並びに KIH-1419+ベンスルフロンメチル+プロモブチド混合剤（KIH-1419 を 10～20g、ベンスルフロンメチルを 5.1g（または 7.5g）プロモブチドを 90g 含む 1 キロ粒剤：本剤は最も使用実績のあるベンスルフロンメチルならびにプロモブチドとの混合により、水稲の全栽培期間に亘り長期間、幅広い有害雑草を防除でき、SU（スルホニルウレア系）除草剤抵抗性雑草の中でも特に問題化しているホタルイやコナギに高い効果を有し、気象および土壌条件の変動にも比較的安定した効果を持つことから、これらが問題となる地域のニーズに対応することが可能である。）に関して自社内で総合的な試験研究を行うとともに、外部機関における客観的評価試験を併せて行うことで、農薬登録に求められる試験成績を取得して、食の安全・安心の確保、環境負荷の低減に貢献する製品開発を行った。

2 成果の概要

・製剤処方および施用法の確立

ピリミルスルファン混合剤は、ピリミルスルファンを徐放化し、KIH-1419 およびピリミルスルファン各々に最適な溶出パターンを示す処方を選抜した。ベンスルフロロンメチル+ブロモブチド混合剤については、湿式微粉碎法により KIH-1419 原体の平均粒径を 1 μ m 以下とすることで初期溶出向上を図った処方を選抜した。施用法については、特に散布作業の省力化のため畦畔からの散布で全体に有効成分を拡散させる製剤開発を進め、実圃場試験で良好な拡散性を示す豆つぶ剤を完成させた。



・製造法の確立

1 キロ粒剤の製造では湿式微粉碎法を確立し、パイロット試験の結果から現有設備での製造が可能であることを確認した。さらに、粒剤および豆つぶ剤までの最終製品に至る生産能力は既存製品と同等と想定され、工業化が十分に可能と判断した。

・薬効薬害試験

KIH-1419 はヒエに対して既存対照剤よりも生育期処理（2.5～3 葉期）で高い除草効果を示し、基本性能に優れていることを実証した。さらに不良環境条件下においても安定した効果を示すことが確認された（表-1）。

表-1 KIH-1419+ピリミルスルファン混合剤の落水条件下における適用性検討

供試植物			タイムピエ	コナギ	イヌホタルイ	一年生広葉 (アゼナ類)	ミズガヤツリ	ウリカワ	イネ	
処理時葉齢			2.5葉期	1.2-2葉期	2.1葉期	1対期	草高10cm	1-1.4葉期	3.1-3.5葉期	
供試薬剤	水変動 条件	薬量 /10a	+41*	+41*	+41*	+41*	+41*	+41*	+18*	+29*
KUH-081-1kg粒	無落水	1kg	●	●	●	●	○	◎	◎	◎
	落水		●	●	◎	◎	◎	○	◎	◎
KUH-081-0.25kg粒	無落水	250g	●	●	●	◎	●	◎	◎	◎
	落水		●	●	◎	○	◎	◎	◎	◎
トップガンL250グラム	無落水	250g	●	●	○	●	△	◎	◎	◎
	落水		●	●	○	●	△	●	◎	◎
ダブルスターSB1キロ粒剤	無落水	1kg	◎	◎	●	◎	○	◎	◎	◎
	落水		◎	◎	◎	◎	△	◎	◎	◎

表記 除草効果 ●：100～98, ◎：97～90, ○：89～80, △：79～60, ×：59～0
薬害 ●：0～5, ◎：6～19, △：20～29, ×：30～0 (%)

供試薬剤 KUH-081-1kg粒 (KIH-1419+ピリミルスルファン：2+0.5%)

KUH-081-0.25kg粒 (KIH-1419+ピリミルスルファン：8+2%)

水条件 落水：処理後4日、7日、11日目に水深8cmより4cmまで落水させた。

試験場所：2009年度 菊川圃場普通期栽培 処理時期：ノピエ2.5葉期処理

*：+41は薬剤処理後41日目、+18、+29は各々薬剤処理後18、29日目に調査したことを表わす。

物理化学的特性として水溶解度が小さいために、降雨等による田面水のオーバーフロー条件でも高い安定性を示し、実際に水田外への流亡も低い傾向であった。

全国に広がっているスルホニルウレア系除草剤に抵抗性を示すアゼナやコナギに対して、KIH-1419 が卓効を示すことを確認した。KIH-1419 だけでは効果が限定的となるホタルイに対しては、ピリミルスルファンやブロモブチドの混合によって安定した効果を示し、両混合剤が水稻一発剤として優れた性能を有することが明らかとなった。両混合剤の公的機関による薬効薬害試験(適

【民間実用化研究促進事業（平成19～21年度）研究成果の概要】

用性Ⅰ、適用性Ⅱ試験）を北海道から九州の各試験地で3年に亘り、ピリミスルファン混合剤13ヶ所、ベンスルフロンメチル+ブロムブチド混合剤40ヶ所で実施した。ほとんどの試験で対照剤に優る良好な結果を得た（表-2）。各種土壌条件（黒ボク土、砂壤土）での作用性が明確となった。

表-2 KIH-1419+ピリミスルファン混合剤の公的試験結果（2009年度 適用性Ⅱ試験）

試験場所	処理時期	除草効果						薬害
		ピエ	コナキ/ミズアオイ	他広葉	ホトイ	ミスガヤツリ	ウリカワ	
植調北海道試験地	+3	●	●	●	●	-	●	微
	ピエ2.5L	●	○	●	●	-	●	無
	ピエ3L	●	●	●	◎	-	△	無
対照)トップガンGT1キロ粒剤75	+3	●	○	●	●	-	○	微
植調古川試験地	+3	●	●	●	○	●	□	微
	ピエ2.5L	□	●	●	○	●	○	無
	ピエ3L	□	●	●	○	◎	●	無
対照)トップガンフロアブル	ピエ3L	x	●	●	●	△	□	無
植調新潟試験地	+3	●	●	●	●	●	○	微
	ピエ2.5L	●	●	●	●	●	●	無
	ピエ3L	●	●	●	●	●	●	無
対照)コウウンキロ粒剤	ピエ2.5L	●	●	●	●	○	●	無
植調牛久試験地	+3	●	●	●	●	●	○	微
	ピエ2.5L	●	●	●	●	●	◎	無
	ピエ3L	●	●	●	●	◎	□	無
対照)トップガンフロアブル	ピエ3L	●	●	●	●	□	□	無
植調京都試験地	+3	●	●	●	●	●	○	無
	ピエ2.5L	●	●	●	●	●	△	無
	ピエ3L	●	●	●	●	●	△	無
対照)リホルーキロ粒剤	ピエ3L	●	●	○	●	●	x	無
植調福岡試験地	+3	●	●	●	●	●	◎	無
	ピエ2.5L	□	●	●	●	○	●	無
	ピエ3L	x	●	●	●	●	●	無
対照)リホルーキロ粒剤	+3	○	●	●	●	◎	●	無

除草効果：●=残草なし、◎=1～2%残草、○=3～5%残草、□=6～10%残草、△=11～20%残草、x=20%以上残草

薬害：無・薬害なし、微・症状は認められるが回復し減収しないと推定されるもの。

小・症状が認められ、減収5%以下と推定されるもの。

・安全性評価および水産・有用生物影響試験

安全性評価ならびに水産・有用生物影響評価に関して、登録申請に必要な19項目の外部GLP試験および社内基礎データを開発計画どおり取得した。平成22年末の登録申請に向け、全ての試験成績を取得予定。現時点まで登録申請に支障となる問題はない。本事業で導入したフローサイトメーターによる藻類影響評価ならびに遺伝毒性試験解析手法を構築して効率的な評価系を完成させた。これらの手法は評価期間の短縮にも大きく貢献した。

・生体内運命・残留試験

環境科学に関する3年に亘る評価項目について、外部GLP対応試験を実施した。試験結果は登録保留基準を満たすデータであり、特に登録上で支障となる結果は得られていない。平成22年末の登録申請に向け、全ての試験成績を取得予定。

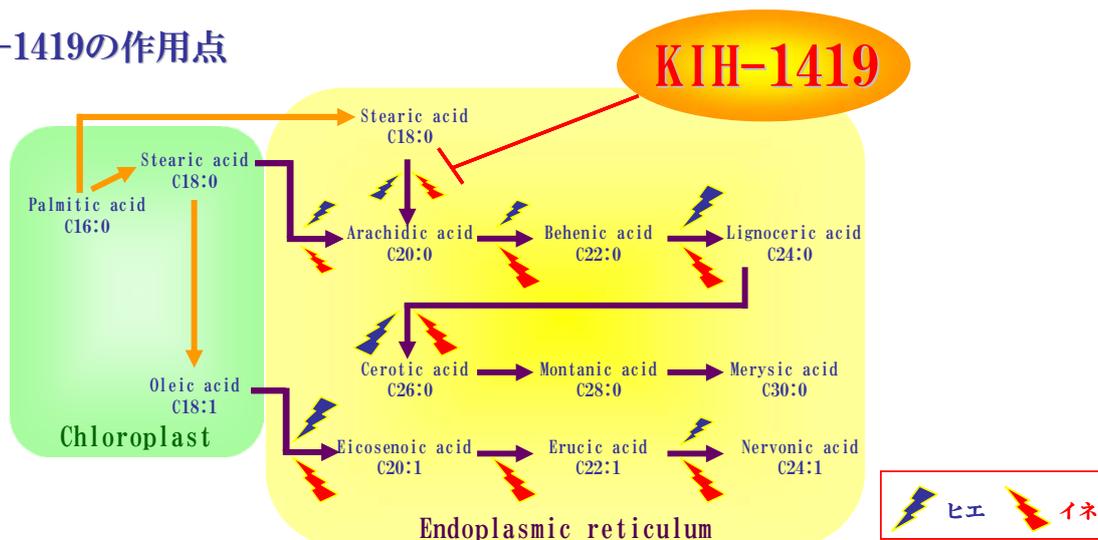
・作用機構説明

KIH-1419の作用点がヒエの超長鎖脂肪酸伸長酵素系（VLCFAE）であることを酵素レベルで確認するとともに、イネおよびシロイヌナズナのゲノム情報を利用して遺伝子を特定した。KIH-1419は、本酵素の活性中心に存在するシステイン残基のSH基と反応することが示唆された。この反応の反応速度定数を組換え酵母を材料にして求めたところ、強力なSH基阻害剤として知られている殺菌剤の反応速度定数と同程度の値であった。植物には複数のVLCFAEが存在し、それぞれが生理的に重要な役割を担っていると考えられることから、雑草がKIH-1419に対する抵抗性を獲得するためには、これらのすべてのVLCFAEが薬剤抵抗性になる必要がある（図-1）。このようなことが起こる確率は極めて低く、KIH-1419に抵抗性となる雑草は発生しにくいと考えられる。



図-1 KIH-1419の作用機構

KIH-1419の作用点



3 成果を踏まえた今後の事業化の見通しについて

- ・本剤の適用分野である初・中期一発処理剤の市場は約 405 億円（日本植物調節剤研究協会平成 21 年統計）であり、平成 12 年以降ほぼ一定の水準で推移している。水稲一発処理剤は水稲分野において省力化に最も貢献する除草剤であり、今後もほぼ同等の市場規模を維持すると予想している。
- ・水稲用除草剤の有効成分としての KIH-1419 は、低薬量でも広い殺草スペクトラムを示し、水稲への安全性が高く、長期間安定した効果を維持するといった既存剤と比較しても非常に高い性能を有している。本化合物を含む物質特許は外国主要国で特許登録され、日本でも特許登録されると判断されるため、国内外での独占的な実施が可能である。また、本有効成分の性能を最大限に引き出す製剤検討を行い、安全で環境負荷が少なく、省力性の高い製品販売を計画している。
- ・具体的には本剤を有効成分として含有する水稲初中期一発除草剤（KIH-1419+ベンスルフロンメチル+プロモブチド混合剤および KIH-1419+ピリミスルファン混合剤）を日本の水稲用農薬の半分以上を販売する全農系統ルートにて農協を通じ農家に販売を行う。当社は、全農との売買契約に基づき系統ルートの全農本店、全農各都道府県本部／経済農業協同組合連合会、各農業協同組合に対し、本社営業本部（東京都台東区）、全国 7 支店が販売・普及活動を行い、少ない期間でのシェアの最大化が可能である。
- ・以上より KIH-1419+ベンスルフロンメチル+プロモブチド混合剤および KIH-1419+ピリミスルファン混合剤は、それぞれ市場規模（売上金額）の約 4%、普及面積では 7 万 ha を確保できるものと予想している。上市 1 年目に最大値の 25%、2 年目に 75%、3 年目に 100%に達すると予想している。

4 問い合わせ先

クミアイ化学工業株式会社生物科学研究所長 井 沢 典 彦

TEL : 0537-35-3159

FAX : 0537-36-3769

e-mail address : no-izawa@kumiai-chem. co. jp

URL : <http://www.kumiai-chem. co. jp/index. html>