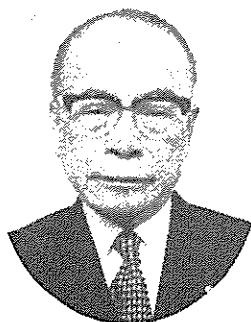
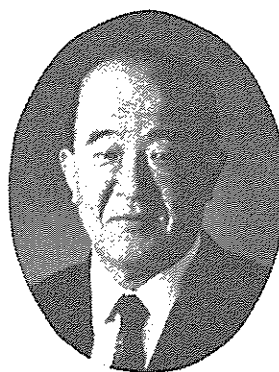


## 高活性水田用除草剤

研究者 竹松 哲夫 植物科学研究所 所長  
開発企業 辻 薫 株式会社トクヤマ 代表取締役社長  
(推薦者 木田 泰次 株式会社トクヤマ つくば研究所 所長)



竹松 哲夫 氏



辻 薫 氏

### 1. 技術の背景

今後の地球上の人口増加に伴う穀物必要量の増加に対して、耕地面積はそれほど増加せず、人類は限られた耕地での食糧増産のために、科学と技術を駆使して省力的で高効率の農業生産を行っていく必要がある。

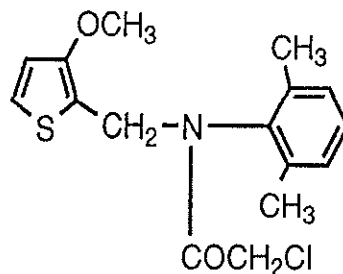
除草剤は今日まで 600種以上のものが開発され、農業生産において重労働とされてきた除草作業の省力化により生産性の向上に貢献するとともに、雑草の防除による農作物の収量、品質の確保に大きく貢献してきた。特に近年は地球環境保全の観点から、より省資源的で自然環境に影響の少ない除草剤が強く望まれている。

## 2. 技術の概要

本技術は、チオフェン骨格を有する新規クロロアセトアミド系化合物（一般名をテニルクロールと命名）を有効成分とする水田用除草剤に関するものである。（表1参照）テニルクロールは、3-メトキシ-2-ホルミルチオフェンと2,6-キシリジンを脱水縮合して得られるシッフ塩基化合物とクロロアセチルクロリドとの反応により合成される。低薬量で優れた除草効果を示し、しかも低毒性で発癌性や催奇形性も無く、環境残留性も低いことが確認されている。除草活性としては、強害雑草であるノビエをはじめ、カヤツリグサ、コナギ、キカシグサ、アゼナなどの水田一年生雑草及びマツバイに高い効果を示し、混合基剤として、広葉雑草に効果を示す種々の有効成分と組み合わせることで広範囲に活用できる。製剤についても、粒剤、フロアブル剤など様々な剤型への製剤化が可能である。

表1. テニルクロールの名称、化学構造及び物性

化学名:	2-クロロ-N-(3-メトキシ-2-チオール)-2',6'-ジメチルアセトアミド*	
一般名:	テニルクロール (Thenylchlor)	
商品名:	アルハーブ <sup>®</sup> (Alherb)	
試験名:	NSK-850	
構造式:	右記式	
分子式:	C <sub>16</sub> H <sub>18</sub> ClNO <sub>2</sub> S	
分子量:	323.8	
外観:	白色固体	
比重:	1.19 (25℃)	
融点:	72~74℃	
蒸気圧:	2.8 × 10 <sup>-5</sup> Pa (25℃)	
溶解度 (20℃, g/l):	水 0.011、	アセトン 484、アセトニトリル 956、 ベンゼン 429、メタノール 148、n-ヘキサン 28
分配係数 (n-ヘキサン/水):	3.53 (25℃)	



本技術は、以下の重要な技術的課題を解決したことにより完成したものである。

- ① スクリーニングにより見出したベンジルアミン誘導体の活性をよりどころとして、関連化合物の合成、活性検定を繰り返し、アセトアミド系化合物にターゲットを絞った。さらに種々合成したハロアセトアニリドの中から、水稻には安全であり、ノビエをはじめとする数多くの水田雑草に対して高い除草活性を示すテニルクロールを発見した。
- ② 原料となる 3-メトキシチオフェンの製造について、工業的に入手し難い原料を用い、複雑かつ危険であった合成工程を詳細に検討し、工業的に実施可能な新規製法を確立した。
- ③ 3-メトキシ-2-ホルミルチオフェンと 2,6-キシリジンとを脱水縮合して得られる Schiff 塩基化合物を、工業的に使用可能な反応試剤及びクロロアセチルクロリドと反応させ、高収率でテニルクロールを得るという新規製法を確立した。(図1参照)

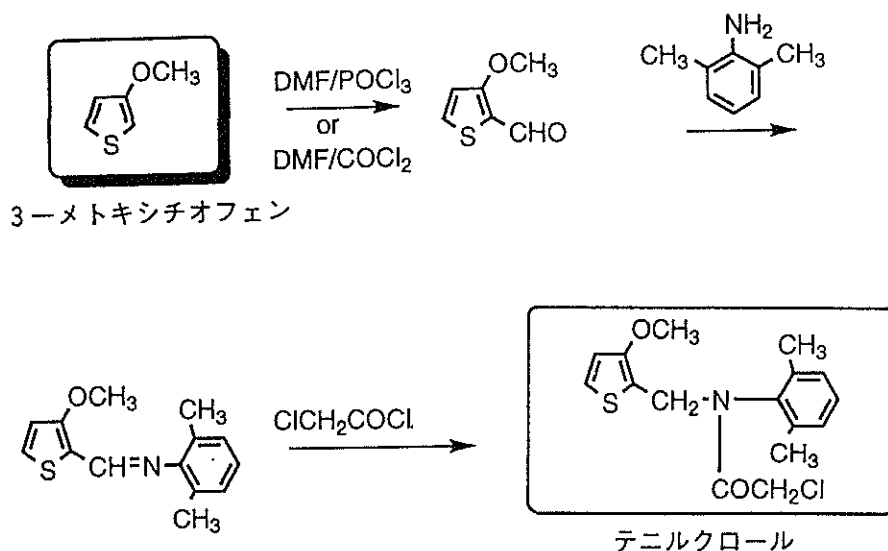


図1. テニルクロールの製法

④ 除草活性を既存のクロロアセトアミド系水田用除草剤であるブタクロール及びプレチラクロールと比較した結果、2～5倍の活性を有し、哺乳動物や環境生物等に対する毒性試験においても低毒性で発癌性や催奇形性も無いことを確認した。（表2参照）さらには作物中にも残留せず、施用後も土壤中の微生物により代謝分解されるので、安全で環境への負荷も小さいことが判明した。

本水田用除草剤テニルクロールは、「アルハーブ粒剤」という商品名で1993年4月に農薬登録され、同時に各種成分と混合した除草剤の販売が開始された。（写真1参照）

表2. テニルクロールの急性毒性

供試生物	投与方法	毒性値 (LD <sub>50</sub> またはLC <sub>50</sub> )
ラット	経口 経皮	LD <sub>50</sub> >5000mg/kg LD <sub>50</sub> >2000mg/kg
マウス	経口 経皮	LD <sub>50</sub> >5000mg/kg LD <sub>50</sub> >2000mg/kg
ウズラ	経口	LD <sub>50</sub> >2000mg/kg
ミツバチ	-	LD <sub>50</sub> >100μg/匹
ミミズ	-	LC <sub>50</sub> >1000ppm/土



写真1. テニルクロールを含有する除草剤

### 3. 効果

本技術は、水田用除草剤として高い除草活性を示し、水性懸濁液として水中拡散性も優れている。少量の散布で高い効果が得られ、散布の作業も軽減できることから、作業時間、作業量とも大幅な短縮が可能となった。また、毒性試験と環境特性試験の結果、安全で環境に優しい除草剤として実証されている。これまでに商品名「クサメッツフロアブル」「ワンベストフロアブル」の2剤が商品化され、販売実績を着実に伸ばしてきている。