

水面展開剤の現状と今後の展望

日本化薬株式会社上尾研究所

たか
高はし
橋いわお
巖

は じ め に

農薬は水面展開剤からスタートしたと言ってもよく、江戸時代にウンカ類の防除に動植物油を水田に注入して使用したことから始まり、明治時代にはそれが石油に変わり、1904年には除虫菊浸出石油が実用化されるに至った。この時代は界面活性剤の発達がなかったため、水で希釈できないので、薬害の点から葉面への接触を避け、水面に注油するしかなかったと思われる。

その後、BHC、ダイアジノン、イソキサチオンなどの油剤が開発された。油剤は界面活性剤が一般的に使用されるようになって、乳剤に置き変わり、さらに粒剤などの製剤技術が発達し、マイナーな製剤となった。

近年、日本に侵入した害虫イネミズゾウムシが水中でも活動することから、田面に効率よく活性成分を供給して防除効率を上げるような粒剤が新しい水面展開型粒剤として出現し、さらにその性質を利用して、省力性を追求した投げ込み剤に発展している。この動向から、今後の製剤の方向性の一つが、活性成分を効率的にターゲットに供給する PDS (Pesticide Delivery System) と省力性の追求であることが示唆される。このような観点から、殺虫剤を中心に水面展開剤の現状を省み、除草剤を中心に今後の展開剤を展望してみた。

I 水面展開型油剤

従来の水面展開剤は油剤であった。水面に活性成分を高濃度に分配させ、土壤吸着を少なくして水中に活動範囲の一部を有するイネミズゾウムシ、イネゾウムシを防除するためのイソキサチオン油剤(カルホス展開剤)、稲葉鞘部への吸収やガス効果を高めてニカメイチュウ、ウンカ類などを防除するダイアジノン油剤などが開発された。散布機などを使用せず、水面に滴下する簡便性が強調されたが、反面、滴下と同時に薬剤全量が水面に展開するため、一時的、部分的に薬剤が高濃度にイネに接触・付着し、薬害がしやすい欠点があり、幅広い農薬成分に利用しにくかった。最近開発登録された油剤にはエトフェンプロックス油剤(トレボンサーフ)があり、医療用点滴器具を利用して薬剤を水面に滴下する方法や、

ボトルから滴下する方法が開発された。

II 水面展開型粒剤の開発

従来、水面施用殺虫粒剤は地上部の害虫を防除するのが目的であったので、活性成分の水溶性が高く浸透移行性が高いカルタップ粒剤、PHC 粒剤などや蒸散性が高くガス効果の強いダイアジノン粒剤、エチルチオメトン粒剤などが普及され、水溶性が低く蒸散性も低い活性成分は粒剤になりにくかった(関口ら, 1988)。

また、水面展開剤と同様に土壤の接触を避けるために古くから浮遊性粒剤が研究され(関口ら, 1991)、数多くの特許公報でその技術が開示されているが、ワックスや吸油性樹脂を使用したりして浮遊させるために、浮遊した粒状物の一部が水面上に出て帆掛け船のようにたちまち風下に集まってしまうこと、活性成分を吸収したまま十分放出せずに効力が期待値まで出なかったこと、コスト的に高くなることなどから、実用化には至らなかった。

1976年に水中を活動範囲の一部とする害虫イネミズゾウムシが日本に侵入し、年々地域を拡大して重要害虫になり、これを防除する薬剤が必要となった。このための育苗箱用粒剤と並行して水面施用粒剤の開発の要望が強くなり、活性成分が田面水に多く分配する粒剤の研究がされ、水面展開型のシクロプロトリン粒剤(シクロサルU 粒剤²⁾やエトフェンプロックス粒剤(トレボン粒剤)などが開発された。シクロプロトリン粒剤は水溶性の原材料を加水混練して造粒し、乾燥したものを空粒としてこれに活性成分を含む油状物質を吸着して製造される。この製剤は細かい空気を粒状物のなかに取り込み、これを浮上力とした水面浮上型粒剤で、散布するといった土壌表面まで沈むが、比重の大きい水溶性キャリアが溶け出すにしがたい、徐々に油状物質とともに水面に浮上し、水面ではじけるように油状物を拡散させる。シクロプロトリンをダイアジノン粒剤のような沈降型粒剤にしてイネミズゾウムシの効力を比較したところ、半分の活性成分量でも水面浮上型粒剤の方が優る効力が得られた(表-1)。一方、エトフェンプロックス粒剤は粒状物は散布後沈降したままであるが、粒剤中の活性成分を含む油状物の比重を1以下にして油状物が徐々に浮上してきて水面に展開するようにしてある。

表-1 シクロプロトリン粒剤のイネミズゾウムシに対する効果

薬剤	薬量 (kg/10a)	50 株当たり生息成虫数				株当たり 幼虫数
		散布 前日	1 日 後	3 日 後	6 日 後	
2% 粒剤 (水面浮上型)	1	102	1	3	1	4.4
	2	92	0	1	0	2.3
	4	151	3	0	1	0.4
2% 粒剤 (沈降型)	2	67	7	23	32	3.9
BPMC・PHC 市販粒剤(沈降型)	4	58	7	0	13	5.0
無処理	—	85	140	142	170	16.8

油状物質が水面で効率よく展開するには、その物理的性質が大きく関与し、粘度が低く、比重が小さいほうが展開しやすいが、最も重要なのは水との親和性である。親水性のほとんどない石油系などの溶剤のみでは単分子の薄い油膜が広がるだけで、余剰分は油滴のまま浮遊し、薬害や不均一拡散による効力のふれの原因となる。界面活性剤を上手に利用して適度の親水性を与えることにより、たとえば、油状物質の比重が水より大きくても全体に様に展開させることができる。

シクロプロトリン粒剤は当初イネミズゾウムシを防除するために開発されたが、使用するうちにイネドロイムシにも十分防除効果があり、ツマグロヨコバイにもある程度の効力があるらしいことが、現地情報として伝わってきた。

シクロプロトリンが浸透移行性も蒸散性も極めて低い活性成分なので、粒剤はイネドロイムシのように地上部のみを行動範囲とする害虫には十分な防除効果を示すはずがないと判断されていた。現地情報の信憑性を確かめるために渡部らはイネドロイムシの行動の観察や効力についての研究をした結果、作用機作を解明するための知見を得たので紹介する(渡部ら、1989)。

渡部らはイネドロイムシ成虫の葉上での行動を長時間観察し続け、成虫が摂食行動や交尾行動などで株内を移動する際に、水際部まで歩行しながら降りてきて水面まで来たことを感じると、反転して再び茎葉を上方に移動する行動をとることを確認した。この行動が防除効力に関係しているかを水際葉鞘部のシクロプロトリンの付着量と接触殺虫活性濃度の比較で検討したが、両者にかんがりの開きがあり、影響ないかに思われた。さらに粒剤を処理した区で観察してみると、水際から上方に移行した成虫は時間の経過とともに脚部が麻痺して水面に落下

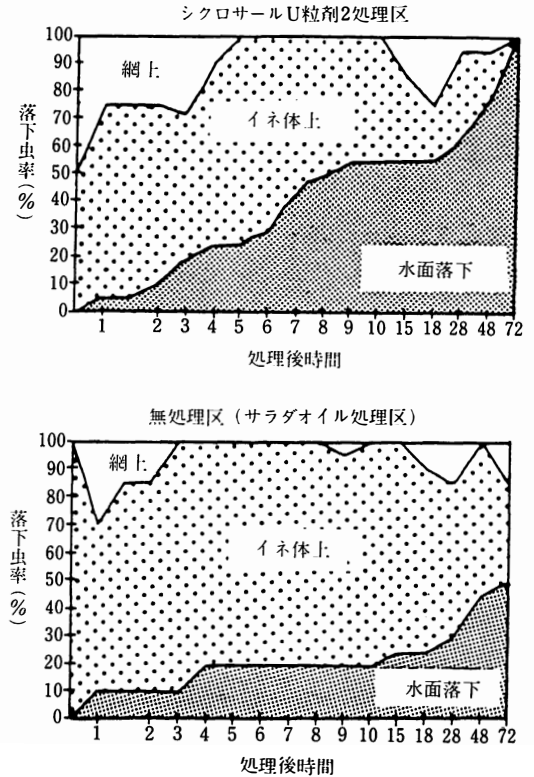


図-1 薬剤処理後のイネドロイムシ成虫の分布

し、水面の活性成分で死亡することがわかった。接触による脚部麻痺濃度は殺虫活性濃度よりかなり低く、水際まで下りたときに水面や水際葉鞘部付着のシクロプロトリンに触れ、時間とともに脚部が麻痺し、水面に落下することが想定された。

このような知見から、水田状態のバットを作り、ネットで囲ってこの中に一方にはシクロプロトリン粒剤 1.5 kg/10 a を処理し、他方にはサラダオイルを水面に流し込んでイネドロイムシの越冬成虫を放虫し、ネット上、稲体上、水面落下の虫数を調査したところ、3 日後にはサラダオイル区では約 50% が落下、粒剤区では 100% が水面に落下して死亡していた(図-1)。

シクロプロトリン粒剤は各県農業試験場のイネドロイムシの圃場試験でも十分な防除効果を示し、適用害虫として登録された。また、現地情報のツマグロヨコバイの密度低下も同様の作用機作が想像される。

以上のように、自然現象には種々な要因がからむことから、薬剤がどのような有害生物を防除できるかを実験室の結果からだけでは単純に決めつけられないことが多く、特に水面展開剤のような Site-Specific な製剤は実際に使用して、調査の枠を広げることによって新たな展

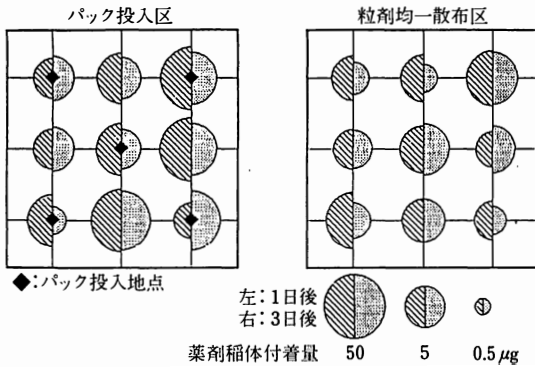


図-2 シクロパック粒剤投入による有効成分の展開状況 田
(1991 新潟県長岡市)

植: 5月3日, 薬剤処理: 5月29日, 1.5 kg/10 a

開に発展する可能性がある。

III 水面展開型粒剤を利用した投げ込み剤

前述のシクロプロトリン粒剤が水面に浮上して活性成分を水面に展開させることから、不均一に処理しても全体的な防除効力は変わらないと推定し、この粒剤を水溶性フィルムで包装して（以下、包装したものをパック剤と記す）、10 a に 10 個を水田に投げ込む方法が開発された。図-2 は均一散布とパック剤の投げ込み処理の稲体に付着したシクロプロトリンの濃度分布であるが、その分布に大差なく、実用的であった（榎井, 1992）。また、各県農業試験場のパック剤の試験結果も効力、薬害ともに良好であり、10 a 当たりの散布時間の短縮、散布器具などを必要としないための手間の削減、直接粒剤を手に触れないための清潔さなど長所が多いことも確認された（那波, 1992）。

現在、投げ込み剤として使用されているのはシクロプロトリン粒剤とシクロプロトリン・NAC 粒剤の 2 剤のみである。今後の製剤・施用法の方向には農業の省力化と PDS を考慮した活性成分の効率的活用が挙げられ、投げ込み剤はその方向にマッチした薬剤の一つであることから、さらに多数の薬剤が開発されることが望まれている。

IV 水面展開剤の今後の展望

水面展開剤には液剤を水面に展開させるタイプと、活性成分を固形剤に担持させて水面に展開させるタイプに大別でき、さらにこれらを水溶性フィルムで包装体にして投げ込み剤にしたものがある。この分野は従来、殺虫剤から発展してきたが、近年、省力化薬剤の研究は滴下用液剤、投げ込み剤とも、むしろ、薬害の点で難しいと

思われる除草剤分野で活発であり、成功すればその技術を殺虫剤、殺菌剤などに応用することは難しくない。

除草剤の滴下用液剤は植代時の稲のない時期に処理するオキサジアゾン乳剤（ロンスター乳剤）に始まり、薬剤の表面張力をコントロールして薬滴が葉面に触れても水面に転げ落ちることで薬害を回避し、稲がある時期に使用できるピリプカルブ・プロモブチド・ベンゾフェナップ水和剤（シーゼットフロアブル）に発展し、さらに、このような方向の新しい薬剤が続いている。

シクロプロトリン粒剤の開発と時期を同じくして日本植物調節剤協会は除草剤の投げ込み剤（ジャンボ剤）を研究し、現在、協会の指導のもとに各社がいろいろなタイプのジャンボ剤を検討している。ここ数年、多数の特許が出願され毎月のように数件が公開特許公報に掲載されている。筆者が検索した範囲では（漏れもあると思うが）、公開制度が始まった 1971 年より 1991 年 4 月までに公開された投げ込み剤に関する特許は 5 件に満たなかったが、1991 年 5 月から 1994 年 2 月までの 3 年間弱に実に 16 社から 70 件と多くの特許が公開されている。殺虫剤、殺菌剤も散見されるが、大半が除草剤を念頭に置いた出願であり、剤型、形状、保存中の発泡抑制、活性成分の安定化、水面展開性の向上、落下地点の局在性回避、内容物の比重コントロール、活性成分を限定したものなど内容が多岐にわたる。また、おのおのが広い請求範囲を有する場合が多いので内容の分類が複雑になり、掲載は控えた。年度別出願件数や内容から推測すると、各社は 1990 年ごろから研究を始め、1991～92 年に積極的に基礎研究を行い、現在は開発研究に進んでいることがわかる。出願から公開までの 1.5 年間でブラックボックスになっているため、他社がどこまで研究を進めているかわからないことなどから、特許性をあまり考えずに競うように出願したために件数が多くなったのであろうが、そのほとんどは特許防衛としての役割のみで、多分、特許登録はもちろん審査請求する件数さえ非常に少ないと思われる。出願件数だけでも各社がいかに力を入れて開発研究を行っているかがわかるが、出願内容からその剤型は、①発泡性錠剤で、水面に浮上して、あるいは水中で発泡しながら、活性成分を水中に拡散させるもの、②発泡性の粒状物、粉状物などを水溶性包装材で包装体にしたもの、③水面展開性、水中分散性の粒状物、粉状物などを水溶性包装材で包装体にしたもの、④水面展開性、乳化性の液状物、ゲル状物を水溶性包装材で包装体にしたもの、⑤その他に大別でき、発泡製剤に関するものが過半数を占める。なお、ここでいう水溶性包装材は水溶性の袋、ボトル、カプセルなどである。

それぞれに水中での活性成分の均一拡散を考えた技術が盛り込まれているが、成功するかどうかの最大の鍵はコストにかかっており、今後の研究が待たれる。

除草剤の投げ込み剤で最も注意するのは薬害につながる活性成分の水中での不均一分布であり、水面展開型の製剤では水面でいかに大きく展開させ、展開した活性成分をいかに速やかに水中に拡散させて、風による偏りをなくすかが重要である。

いくつかのジャンボ除草剤が登録され、普及される日はそう遠くないと思われるが、普及に当たっては漏水の激しい水田や、土壌がむき出しになっている水田、あるいは表層剝離や藻で覆われている水田などは避けなければならない。十分に水管理のできる水田から慎重に進めるべきである。ただ、薬害を心配するあまり、開発を躊躇してはせっかくのユーザーの希望する優れた技術が活かされないばかりか、次の技術が生まれてこないのも事実である。水管理をきちっとできる水田から繊細にかつ大胆に普及させることにより、大きなトラブルはなく、必ず農家に喜ばれるジャンボ剤が誕生するものと確信する。また、成功させるためには均一拡散を阻害する藻や表層剝離を防除するためのジャンボ剤など周辺技術の開発も重要となる。

以上に、近い将来の展望として水面展開剤に関係があり各社が精力的に開発を進めているジャンボ除草剤について触れた。水面を、薬剤を拡散させる媒体としてとらえる省力化研究はさらに進める必要があり、例えば、それぞれの活性成分を、大きく水面展開する液状やゲル状にし、水溶性包装体にすることなど、薬剤処理時期別に殺虫剤、殺菌剤、除草剤を同時に簡便に処理する製剤を開発すること、もっと実現可能な方法として投げ込み用単剤を品揃えして、一緒に投げ込むようにすることなど

ができれば革命的な省力化技術となるであろう。

おわりに

水面展開剤について展望する機会を得て、このような Site-Specific な製剤はこれからの製剤研究では重要になってくるだろうと再認識した。必要な場所に、必要なだけ薬剤を供給するいわゆる DDS (Drug Delivery System) を医薬と農薬と比較してみると、体内というクローズな条件と圃場というオープンな条件、かけられるコストの違い、使用できる原材料の違いなど大きな差があり、必ずしも同レベルでは考えられないが、活性成分を作用点に効率よく供給する考え方は同じであり、環境問題、コスト低減、製剤の付加価値向上などの観点からも、ますます PDS を思考した研究が重要になってくる。

また、製剤研究に従事する者にとって新規活性成分が出にくくなっている昨今、既存の活性成分をいかに時代の要請、つまり、食糧確保を図りながらの環境保全や高齢化社会に対応する省力化など、にマッチした製剤・施用法にしていくかを常に考えなければならない。

確実に製剤研究の価値は高まっており、それに応えるためにも、各社の製剤関係者が力を合わせて次世代に残す技術を作り上げる必要がある。

引用文献

- 1) 榊井昭夫(1992): 平成4年度水稲・畑作病害虫防除研究会シンポジウム講演要旨: 47~51.
- 2) 那波邦彦(1992): 平成4年度水稲・畑作病害虫防除研究会シンポジウム講演要旨: 36~46.
- 3) 関口幹夫ら(1988): 特公昭 63-30281.
- 4) 関口幹夫ら(1991): 日本農薬学会誌 16(2): 325~334.
- 5) 渡部哲夫ら(1989): 日本応用動物昆虫学会第33回大会講演要旨集: 206.

新しい「植物防疫」専用合本ファイル

本誌名金文字入・美麗装幀

本誌 B5 判 12 冊 1 年分が簡単にご自分で製本できる。

- ①貴方の書棚を飾る美しい外観。 ②穴もあけず糊も使わず合本できる。
- ③冊誌を傷めず保存できる。 ④中のいずれでも取外しが簡単にできる。
- ⑤製本費がはぶける。 ⑥表紙がビニールクロスになり丈夫になった。

改訂定価 1 部 720 円 送料 390 円

ご希望の方は現金・振替で直接本会へお申込み下さい。

