

マイクロカプセル化農薬の現状と今後の展望

住友化学工業株式会社農業科学品研究所 **おお 大** **つば 坪** **とし 敏** **ろう 朗**

はじめに

マイクロカプセルとは、有効成分（芯物質）を膜物質中に内包した粒径が数 μm から数百 μm の微小球をさす（図-1）。マイクロカプセルには、有効成分の保存容器としての機能あるいは徐放化機能などがあるため、医薬、化粧品、香料、食品、記録表示材料などの分野において盛んに応用開発が進められてきている。平素我々が何気なく使用しているノンカーボン紙や食材料としての人工イクラはマイクロカプセル化技術を応用した代表的な製品例であろう。

農薬分野におけるマイクロカプセル化技術の研究は、PENNWALT（現 ATOCHEM）により開始されたが、その目的はメチルパラチオンの毒性の軽減であった。その後本技術は、フロアブル剤や粒状水和剤、徐放性粒剤などとともに新規機能性製剤の一翼を担うまでに発展してきている。本報告においては、このように現在注目を浴びている農薬のマイクロカプセル化技術の最近の動向を、農薬をマイクロカプセル化する意義、マイクロカプセルの機能を制御する要因、及び最近の研究・開発の動向、の三つの観点から簡単に紹介したい。

I 農薬をマイクロカプセル化する意義

マイクロカプセル化の方法については多くの教科書が刊行されているが、一般的に化学的方法、物理的方法、物理化学的方法、機械的方法などに区分できる（近藤ら、1977）。農薬のマイクロカプセル化には原則としていずれの方法も適用可能と考えられる。しかし、通常用いられているのは、化学的方法に分類される界面重合法及び In-Situ 法、あるいは物理化学的方法の一種であるコアセルベーション法である。中でも In-Situ 法と界面重合法は、マイクロカプセルの膜厚と粒径の制御が比較的容易であるため特によく用いられている。それぞれの方法で調製されたマイクロカプセル化農薬は粒子の沈降を防止するための増粘剤、凍結防止剤、防腐剤などを添加して懸濁型製剤（Capsule Suspension: CS）にされるのが通常である。

このようなマイクロカプセルの製造工程は、乳剤や水

New Trends of Microencapsulated Pesticide. By Toshiro OHRSUBO

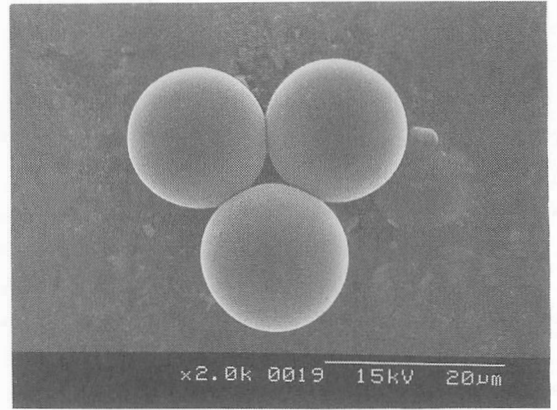


図-1 MEPマイクロカプセルの電子顕微鏡写真

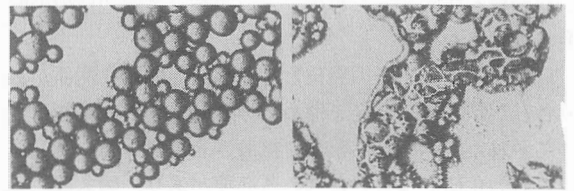


図-2 ゴキブリの接触により破壊を受けた MEP マイクロカプセル (S. Tsuda et al.: J. Pesticide Sci. 12, 23 (1987) より)

和剤のような既存の製剤の場合と比較してやや煩雑になるため、その製造コストは一般にやや割高になる。農薬ビジネスを取り巻く昨今の厳しい状況の中で、それでもなおかつマイクロカプセル化農薬が注目を浴び、精力的に研究され続けているのは、マイクロカプセルが他の剤型では得難い種々の優れた特性を示すからである。

すなわち、農薬をマイクロカプセル化すると第一に初期効力及び残効性の向上、またそれに伴う散布薬量の低減効果が期待される。これらの効果を発現させるべく検討をする場合には、マイクロカプセル化農薬を医薬分野における研究と同様に徐放化製剤としてとらえることが多い。しかし、近年では外部に薬剤を漏らさない保存容器としての機能をうまく利用し、対象害虫がマイクロカプセルに接触したときのみ破壊し、その結果薬剤が膜外に放出され効力を発現する、いわゆる破壊型のマイク

ロカプセル剤の研究がされてきている (図-2)。

また、保存容器としての側面と徐放化機能をうまくバランスした設計をすることにより、人畜に対する毒性や魚毒性の軽減、刺激性の軽減、薬害の軽減、耐雨性の向上、原体の安定化、揮散による原体消失の抑制、臭気のマスキング、液体の固型化などが可能と考えられており、それぞれの効果にターゲットを絞った種々の報告がされてきつつある。

ところで近年、農薬の安全性に対する規制が厳しくなるとともに、より高性能な薬剤の開発が求められてきている。しかし、このような要求を満たす新しい化合物が発明される確率が年々低下しつつあることは否めない。したがって、製剤の技術により新規化合物の欠点をカバーしたり、あるいは既存化合物に新しい特徴を付与しその性質を改良することが今後ますます重要になると考えられる。このような化合物の性質を改良する上でも、マイクロカプセルの持つ数々の特徴は非常に魅力深く有用なものと考えられる。

II マイクロカプセルの効果制御する要因

上述のように、農薬をマイクロカプセル化することにより、種々の有益な特徴の発現が期待される。しかし、これらの特徴は最適な粒子設計をして初めて発揮されるものである。

マイクロカプセルの特性を変える主な要因としては、製法、膜物質の種類、粒径、膜厚などが挙げられる。なかでも粒径と膜厚がその特性に及ぼす影響は大きいいため、その関係については詳細な基礎検討がされてきている。

まず、魚に対する毒性、哺乳動物に対する急性経口毒性を制御するパラメーターはマイクロカプセルの粒径(D)と膜厚(T)の積、すなわち $D \times T$ であることが判明している。そして、この値が大きくなるほど魚毒性あるいは急性経口毒性が低下することが示されている。同時に $D \times T$ は、有効成分が膜内を拡散し、膜外に放出される速度を制御するパラメーターであることが明らかになっている。すなわち、マイクロカプセルの毒性軽減効果は、薬剤の膜外への溶出を抑制することにより発現されると推定されている (OHTSUBO et al., 1989)。

徐放型の作用機構を持つマイクロカプセルの効力を制御する要因についての報告は、筆者の知る限りにおいてはまだない。しかし、 $D \times T$ が放出速度を制御するパラメーターである以上、 $D \times T$ と効力の間には、なんらかの相関があるものと予測されよう。今後の研究の進展が期待される場所である。

一方、破壊型のマイクロカプセル剤に関しては、マイクロカプセルの破壊挙動が材料力学における中空肉薄球の破壊の理論を応用することにより説明されることが明らかになっている。そして、粒径(D)と膜厚(T)の比(D/T)がマイクロカプセルの強度パラメータであり、この比が大きくなるほどマイクロカプセルが破壊を受けやすくなることが証明されている (OHTSUBO et al., 1991 b)。また、害虫の種類が異なればマイクロカプセルと接触した際にマイクロカプセル粒子に加わる力が異なるため、初期効力と適度な残効性を同時に獲得するためには、対象害虫ごとにD/Tを最適な範囲に調節する必要があると予測されている (OHTSUBO et al., 1987)。

また、薬害及び耐雨性を制御するパラメータは膜厚であり、膜が厚くなるほど薬害は軽減され、逆に膜が薄くなるほど耐雨性は向上することが報告されている (OHTSUBO et al., 1991 a)。しかし、なぜ膜厚が関与するのかについての明確な解答はいまだ得られておらず、今後の検討課題として残されている。

III 最近の農薬のマイクロカプセルの研究

・開発状況

防疫薬分野などを含んだ広義の意味での世界の農薬分野において、これまでに約40種類のマイクロカプセル剤が上市されている (辻, 1993)。しかし、殺菌剤へ応用例はほとんどなく、除草剤への応用例もわずかである。つまり、害虫の防除を目的として薬剤をマイクロカプセル化した製品が圧倒的に多い。

日本市場に限ると、これまでのマイクロカプセルの開発は若干の例外を除いて防疫薬や防蟻剤の分野を中心に行われてきたようである。

例えば、ゴキブリの防除用の残留噴霧剤としては、以下の2剤が上市されている。

ゴキブリ用スミチオン MC

有効成分: MEP 20% 住友化学

ダイアジノンマイクロカプセル剤

有効成分: ダイアジノン 23% 日本化薬

また、シロアリ防除用土壌処理剤としては以下の3剤が既上市である。

カレート MC

有効成分: MEP 20% 住友化学

カヤタック MC

有効成分: クロルピリフォス 25% 日本化薬

レントレクマイクロカプセル

有効成分: クロルピリフォス 20% ダウ・ケミカル日本

これらの分野においては効力ができるだけ長期間持続することが望まれるため、薬剤に残効性を付与することを主たる目的としてマイクロカプセル剤が開発されたと考えられる。

また、防虫合板用の殺虫剤として、ランバートMC(有効成分:MEP 20%)が住友化学より上市されているが、この剤は合板中での有効成分の安定性の向上を目的としている。

一方、国内の農業分野を対象としたマイクロカプセル剤の研究も、最近は上市を意識したものが増えてきている。

その中で、昨年春にはイネミズゾウムシの防除を目的としてエンバーMC(有効成分:ペリメトリン 10%)が住友化学より上市された。これは国内で農業用殺虫剤として本格的に上市された初めてのマイクロカプセル剤である。同薬剤は田植前日あるいは当日に稲育苗箱中に散布処理するが、速効性及び残効性を兼ね備えた薬剤に設計されている。

同じく水稲分野でカメムシ防除を目的としたMEPマイクロカプセル剤の空中散布用薬剤としての実用化検討が行われ、試験成績が報告されているが、早期の上市が期待される(市川ら, 1993)。空中散布剤としては、MEP/BPMC混合マイクロカプセル剤についても実用化試験が開始されており、カメムシとウンカに対しての試験成績が報告されている(小山, 1994)。

また、エトフェンプロックスのマイクロカプセルを産業用無人ヘリコプター(RC)から散布し、ハクサイのコナガ、アオムシ、アブラムシなどを防除する試みも行われている(中込ら, 1994)。

また、最近の特徴的な動きとして、マイクロカプセル化薬剤を用いた二次加工製品群の開発研究が挙げられる。

例えば、MEPマイクロカプセルを含有したゴキブリ用の毒餌剤が上市されているし、様々なネズミの忌避剤をマイクロカプセル化し、それを混合した塗料の研究、あるいはそれを練り込んだ電線被覆用樹脂の検討開発が各方面で行われている(倉田ら, 1993)。

一方、基礎研究に目を向けると、マイクロカプセルの

製造コストの削減を目指したものや、膜物質の素材そのものに特徴を付与する検討がされつつある。

前者の例としては、乳剤の中に水と反応して高分子膜を生成するモノマーを混合しておくことにより、水で希釈後噴霧し風乾するまでの間に界面重合反応を起こさせ、マイクロカプセル化する試みがある(小島, 1992)。また、後者の例としては、温度の変化により側鎖の構造が変わる高分子材料を膜剤として用い、温度にตอบสนองして薬剤放出特性を変えるマイクロカプセル剤を創製する試みが挙げられる(GREEN et al., 1990)。

これからは、このような新たな視点からマイクロカプセル化技術を見直した研究も今まで以上に進んでゆくものと考えられる。

おわりに

以上、農業のマイクロカプセルの最近の動向について簡単に紹介をしてきた。環境により優しい農業の開発がこれまで以上に望まれてくるであろう状況の中で、多くの優れた特徴を持つマイクロカプセル化技術にかけられる期待はますます高まっていくものと予想される。本分野における研究が今後より一層進展し、その成果が時代を先取りした新製品の開発として実ってゆくことを期待したい。

引用文献

- 1) GREEN, L. et al. (1990): Briton Crop Protection Conf. -Pests & Diseases-6C-11, p. 593.
- 2) 市川良平ら(1993):平成4年度農林水産航空技術合理化試験成績書, 農水協, 東京, pp. 21~47.
- 3) 小嶋慎也(1992):第15回MC研究会予稿集.
- 4) 近藤保・小石真純(1977):マイクロカプセル—その製法・性質・応用, 三共出版, 東京.
- 5) 小山正一(1994):平成5年度農林水産航空事業受託試験成績書, 農水協, 東京, pp. 97~103.
- 6) 倉田三男ら(1993):特開平5-907(日本化薬).
- 7) 中込曄雄ら(1994):平成5年度産業用無人ヘリコプター受託試験成績書, 農水協, 東京, pp. 42~43.
- 8) OHTSUBO, T. et al. (1987): J. Pesticide Sci. 12: 43
- 9) ————et al. (1989): ibid. 14: 235
- 10) ————et al. (1991a): ibid. 16: 413
- 11) ————et al. (1991b): Polymer 32: 2395
- 12) 辻孝三:統医薬品の開発第18巻農薬の開発, 広川書店, pp. 102~123.