

リレー連載

農薬製剤・施用技術の最新動向①

農薬製剤の役割とその重要性

製剤技研

辻 孝三 (つじ こうぞう)

リレー連載にあたって

今回、日本農薬学会の農薬製剤・施用法研究会が中心となり、「農薬製剤・施用技術の最新動向」について本誌上でリレー連載を行うことになりました。

農薬製剤・施用法研究会は昭和56年に発足し、毎年農薬製剤・施用法シンポジウムを開催し本年で第36回を迎えます。シンポジウムでは、農薬企業、副資材メーカー、製剤機械メーカー、散布機メーカーその他から、最近では300名以上の方に参加していただき、技術発表、海外情報の紹介、ポスターセッション、その他で活発な情報交換を行い、製剤・施用技術の向上・発展に努めてまいりました。

今回のリレー連載では、本誌の読者で農薬製剤・施用技術を専門にしておられない方々にも製剤・施用技術についてご理解いただくため、わかりやすく解説していきますのでご期待いただきたいと思います。

リレー連載の第1回として「農薬製剤の役割と重要性」について執筆させていただきました。

はじめに

農薬原体は、実際の場面では、そのままでは使用することができないので、製剤に加工されて使用される。したがって農薬製剤は、最終商品であり、①効力、②保存安定性、③安全性、④使いやすさ、⑤作りやすさ、⑥コスト等あらゆる点で、満足のいくものでなければ実用化できない。そのため現在、製剤は表-1に示すような種々の役割を持っている。すなわち、製剤はまず農薬（有効

成分）を容易に使用できるようにし、農薬の効力を最大限に発揮させ、農薬の短所をカバーし、安全性を高め、環境負荷を低減し、農作業を省力化し、農薬に新しい機能を与えて用途拡大する、等の働きをする（辻、2005；2006；2012 a；2012 b；2013；2014）。

このような農薬（有効成分）と農薬製剤との関係は、新郎と新婦の関係とすることができる。すなわち新郎である農薬が社会で十分に活躍できるように新婦である製剤が支えていく関係とすることができる（辻、2006）。

この役割は、農業分野からの要望の増加や変化に対応して、ますます大きくなり、かつ重要になっている。これらの役割の内容について、さらに説明する。

I 製剤の第一の役割は、農薬を実際に使用できる形にすること

農薬は、通常10a当たり数百mg～数百gの有効成分で効力を発揮する。しかし、このような少量の農薬を広範囲の圃場に均一に散布することは、非常に難しいので、有効成分を適当な希釈剤で希釈して散布する量を多くし、少量の有効成分を広い圃場に均一に散布しやすい形に加工している。これが農薬製剤である（辻、2012 b；2013）。

しかし後でも述べるように、希釈すると言っても、単純な作業ではなく、その方法には種々の技術や工夫が必要である。

農薬の希釈の方法としては、農薬の有効成分をクレーなどの鉱物質の微粉と混合し、そのまま散布する方法（粉剤）、農薬を含んだ鉱物質の顆粒を作り、そのまま散布する方法（粒剤）、農薬を有機溶媒に溶解し乳化剤を加え、それを水で希釈して乳化液を作って散布する方法（乳剤）、農薬を鉱物質微粉と混合し分散剤を加え、それを水中に分散した後散布する方法（水和剤）、さらに農薬を乳化剤または分散剤を用いて水の中に乳化または懸

Role of Pesticide Formulation and Its Importance. By Kozo Tsuji

（キーワード：希釈、製剤設計、効力、安全性、省力化、PDS、新規製剤、放出制御技術、標的指向化技術、剤型別生産量）

表-1 農薬製剤の役割

1) ごく少量の農薬を希釈して広い田や畑に均一に散布できるようにする。
2) 農薬の効力を最大限に発揮させる。
3) 農薬の短所をカバーする。
4) 使用者安全性を高める。
5) 環境負荷を低減する。
6) 作業性を改善, 省力化する。
7) 既存剤に新しい機能を与え用途拡大する。

濁させ、そのまままたは使用時に水で希釈して散布する方法(エマルジョン製剤, 懸濁剤またはフロアブル製剤)等がある。

ここで基本となる主な製剤技術は、粉碎、混合、溶解、分散(乳化、可溶化、懸濁)、造粒等である。これらの技術も種々の進歩と工夫があり、高度な要望にも応えられる製剤が作られている。

II 農薬製剤の役割の拡大

最近では低薬量で効果を発揮し、人畜や作物に対する安全性が高く、環境負荷が小さい農薬が求められており、新規農薬の構造が複雑化するとともに、人畜や環境に対する安全性試験の項目が増加し、新しい候補化合物を見いだすスクリーニング確率が非常に低下している。それに伴って、新規農薬の開発費が非常に増大し、開発期間も長期化している。一方では農薬の低コスト化も求められている(辻, 2012 b; 2013)。

さらに国内では農業従事者の減少、そして高齢化、婦人化あるいは兼業化が進行し、病虫害防除作業の軽減が求められ、省力化や軽作業化が要望されている。

このような要望に応えることは、農薬原体のみでは困難であり製剤と施用技術の役割が大きくなる。表-1に示した製剤の役割の2)～7)が重要になり、製剤技術と施用技術に大きな期待が寄せられている。そして、安全性の向上、効力向上や省力化、軽作業化を重視した新規製剤および施用技術の開発努力がなされている。

例えば製剤によって農薬の短所をカバーすることができるので、新規農薬のスクリーニング確率の向上にも、製剤は大きな貢献をする。すなわち、すべての点で全く問題のない候補化合物を見いだすことは、非常に難しくなっている。非常に有望な化合物を見いだされても、その化合物が何らかの問題点を持っている場合がある。その問題点が製剤によって解決できれば、その化合物を実用化まで進めることが可能になる。具体的には、製剤の

剤型や処方、製剤法を工夫することによって、効力、物理化学的安定性、薬害、人畜毒性、魚毒性などの点での農薬の短所を改良することができる。また、製剤の工夫により、作業者への曝露やドリフト等を減少させることも可能である。

作業性の改善、省力化でも製剤および施用技術は大きな力を発揮する。例えば、放出制御技術を応用して散布回数を減らしたり、製剤の改良により軽量化、少量化もでき、田に入らずに畦畔から散布することも可能になる。

また製剤により既存薬剤にある種の機能を付与して、その適用分野を拡大することは、新規原体のスクリーニング確率が低下している現状において、非常に意義のあることである。すなわち製剤を工夫することによって、その農薬が今まで使用できなかった分野にも使用できるようにすることは、その分野に新しい農薬を一つ開発するのと同じ価値を持っている。そのうえ開発費が安く済み、開発期間も短くなる利点がある。フェニトロチオンのマイクロカプセル化により、フェニトロチオンが土壌中でも安定になり、シロアリ防除に用いることができるようになったことは、その一例である。このように製剤は、農薬の開発において多くの点で重要な役割をはたすことがわかる。

III 製剤設計の重要性

(辻, 2006 ; 2012 b ; 2013 ; 2014)

上記のような製剤の役割を達成するためには、製剤設計が非常に重要になる。

まず目的に応じて、剤型、処方、製剤法、製剤物性等をどのようにすればよいかを検討する。

効力は剤型、製剤処方やその物性に依存するので、適切な製剤設計を行い、これらを最適化する必要がある。極端な場合には製剤の仕方によって生物効力が発現しない場合もある。製剤設計はその農薬が実用化できるかどうかを左右するので、十分な検討が必要である。

その第一段階は、剤型の選択である。農薬の生物効果は剤型によってかなり変化するが、一つの農薬原体を取り上げた場合、すべての剤型が製剤できるわけではない。その原体の持つ物理化学的性質、生化学的性質を考慮して、最も適した剤型を選択する必要がある。例えば、有機溶媒への溶解度が低いときには乳剤の製剤は困難となり、水和剤やフロアブルが適した剤型となる。水中で容易に加水分解される原体では、水を媒体とするフロアブル製剤やエマルジョン製剤等に製剤することは困難な場合が多い。また、微生物分解を受けやすい原体は、土

壤施用される粒剤に製剤すると、十分な効力が発現されない。さらに、使用対象の種類によっても剤型が決まることが多い。たとえば、水田用除草剤には粒剤が、果樹には水和剤が用いられることが多い。いずれにしても、製剤検討を行う前に、農薬原体の物性を十分に把握して、最も適した剤型を選択する。後に述べるように、最近の傾向としては、安全性面や取り扱いやすさから水性製剤や顆粒状の製剤が増加している。

次は最適な製剤処方と製剤法の決定である。同じ剤型であってもその製剤処方や製造法によって製剤物性も変化し、生物効力や保存安定性、取扱い性、安全性、コスト等が影響を受ける。一般的に原体の粒径が細かいほど、初期の生物効力は向上するが、残効性や薬害、安全性の点からは、粒径は細かすぎると好ましくないこともあり、最適粒径を決める必要がある。これらのすべての点を考慮して製剤が開発され、農薬が実用化されることになる。

最近では製剤に対する期待が高まり、種々の機能を付与することが要望され、製剤設計の点で、かなり高度な技術を用い、種々の工夫が施されている場合が多くなっている。

またさらに、農薬送達システム (Pesticide Delivery System, PDS) の「必要なときに、必要な場所に、必要な量の農薬を送達するという理念」を考慮しておくことも重要である。PDS は、医薬分野における薬物送達システム (Drug Delivery System, DDS) の考え方と類似しているとは言え、表-2 に示すように、その実用化の観点からは、DDS より極めて難しい。

現在のほとんどの農薬製剤では、運搬する媒体がないので、運搬は施用技術に依存する必要がある。田植え同時処理、側条施用、育苗箱処理等標的の近くに施用する技術が開発されている。また環境や標的の刺激にตอบสนองして農薬を放出する刺激応答性製剤や類似の機能を持った施用技術の開発も行われつつある。

このように新規製剤とそれに合った施用技術を開発す

表-2 PDS と DDS の比較

	PDS	DDS
対象系の状態	開放系	閉鎖系
環境条件	変化が大	一定 (体内)
材料・技術の制約	高価なものは使えない	比較的高価なものでも使える
運搬媒体	なし	あり (血液, 体液)
環境への影響	あり	なし

ることによって、少しでも PDS に近づく技術開発が望まれる。そのためには放出制御技術や標的指向化技術の開発が重要である。

IV 新規製剤の開発

前述の製剤の役割 2) ~ 7) を達成すべく、既存製剤の問題点を解決して新規製剤の開発がなされている (表-3)。また一般的に製剤・施用技術に求められる要望と、それに対応した新規製剤・施用技術を表-4 に示す (辻, 2005; 2006; 2012 a; 2012 b; 2013; 2014)。

主な改良点は、①有機溶媒を用いた製剤を水性化することによる毒性、薬害の軽減および非危険物化、②微粉体制剤の粒状化や水溶性包装あるいは水中分散化による粉塵吸入の防止、③粉剤で微粒子部分を取り除くことによるドリフト防止、④放出制御技術による製剤の機能化、⑤施用量の減少や畦畔からの施用技術による省力化、軽量化、⑥標的指向化である。

すなわち、乳剤は溶剤の毒性が問題となり、最も安全な媒体である水を使ったエマルジョン製剤やマイクロエマルジョン製剤が実用化された。また、水和剤は水希釈時の粉塵が作業者の健康に悪い影響を与えるので、粉立ちを防ぐために、農薬を水に分散したフロアブル製剤や粒状化した顆粒水和剤に変わっていき、水溶性包装も行われた。また、粉剤のドリフトが問題となったため、担体から微粒子部分を取り除いて、DL 粉剤が実用化されてきたが、最近では微粒剤 F が見直されている。

さらに粒剤では今まで 10 a 当たり 3 kg の施用が行われていたが、その重量を減らし、農作業を軽減、省力化する目的で、10 a 当たり 1 kg 施用する 1 キロ粒剤が普

表-3 既存製剤の問題点と解決方法および新規製剤

既存製剤	問題点	原因	解決方法	新規製剤
乳剤	毒性 薬害 危険物	有機溶剤	水性化	エマルジョン製剤 マイクロエマルジョン製剤 フロアブル製剤
			固形化	固形乳剤, ゲル製剤
			無溶剤化	高濃度乳剤
水和剤	粉塵	微粉体	水中分散 粒状化 包装改良	フロアブル製剤 顆粒水和剤 水溶性包装
粉剤	ドリフト	微粉体	微粒子除去 微粒状化	DL 粉剤 微粒剤 F
粒剤	重量	3 kg/10 a	高濃度化	1 キロ粒剤

表-4 製剤・施用技術に求められる要望と新規製剤・施用技術

要望	解決方法	新規製剤・施用技術
水性化		フロアブル製剤, エマルジョン製剤
粒状化		顆粒水和剤
微粒子除去 (ドリフト防止)		DL 粉剤, 微粒剤 F
高濃度化		1 キロ粒剤
放出制御		放出制御製剤 (マイクロカ プセル製剤, 粒剤)
標的指向化		刺激応答性製剤, 育苗箱処 理, 種子処理, 田植同時処 理, 液剤少量散布
効力向上 安全性向上 省力化	希釈時の粉塵防止	水溶性包装, 顆粒水和剤, フロアブル製剤
	畦畔散布	ジャンボ剤, フロアブル原液湛水散布
	水口施用	水面展開剤, フロアブル原液湛水散布
	田植同時処理	田植同時粒剤散布機, 田植同時液剤散布機
	育苗箱処理	長期残効型箱施用粒剤
	種子処理	種子処理
	農薬・肥料の同時処理	農薬入り肥料, 側条施肥機による処理
	空中散布	有人および無人ヘリコプタ ー防除

及している。また、省力化、安全性向上、効力向上を目的として、マイクロカプセル製剤などの放出制御製剤が開発されている。

さらに、農作業の省力化のために、田に入らずに畦畔から散布できる製剤として原液散布フロアブル製剤やジャンボ剤が実用化されている。また粒剤で水面上を展開して水面に棲息している害虫を効率よく防除するための水面浮上性粒剤が実用化された。油剤で水面を展開するサーフ剤も実用化されている。また育苗箱処理用として長期残効型箱施用粒剤がある。これらは標的指向性製剤とすることができる。さらに省力化のために10 a 当たり250 g を施用する250 g 豆つぶ剤が実用化されている。

今後もさらに新しい製剤が開発されるものと考えられる。

V 剤型別生産量の推移 (辻, 2005 ; 2014)

剤型別生産量の推移を図-1 に示すが、上記のような農業分野の状況の変化に対応して、製剤、施用技術が変化してきたことが如実に表れている。

総生産量を見ると、固体製剤の比率が非常に高い。最初は粉剤の生産量が最も多かったが、1985 年以降は、粒剤が粉剤を抜いて最も多くなっている。総生産量は1974 年の747 千t をピークにして毎年減少の一途をたどっており、2015 年度では243 千t とピーク時の約1/3 になっている。その減少は、減反により農薬の使用量が減少したこと、さらに農薬の高性能化や使用剤型の変化によって、単位面積当たりの製剤の使用量が減少したためである。その中で特に粉剤の減少が大きい。粉剤は1969 年には393 千t で最大となったが、現在は約28 千t で全農薬の11% に減少した。この原因としては、粉剤のドリフトによる作業員および環境に対する安全性の問

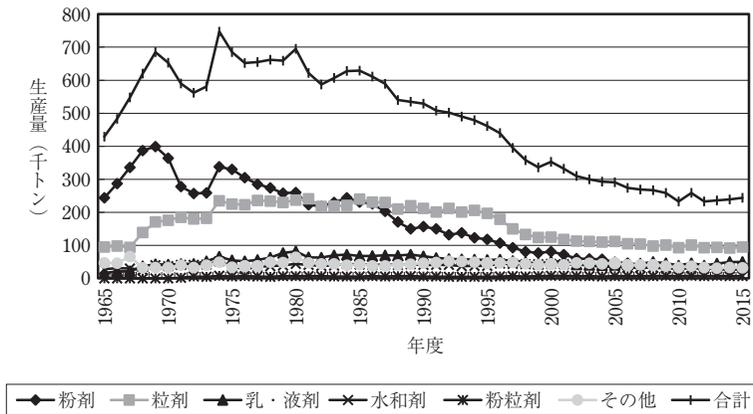


図-1 剤型別生産量の推移

題、育苗箱処理の普及による粉剤散布の減少、散布の重労働性、嵩高さによるコスト高、およびウンカなど粉剤の標的害虫の発生減少等が考えられる。

粒剤は、1985年の240千tをピークにして、1995年から100千t台に減少した。これは水田用除草剤が3キロ粒剤から1キロ粒剤へ移りつつあること、さらに原液湛水散布フロアブル製剤やジャンボ剤の普及によるものである。

水和剤および乳・液剤も徐々に減少しているが、水和剤および乳・液剤は全農薬生産量に対する割合が大きくなっている。これは粉剤、粒剤を主体とする水稲農薬が大きく減少したために、水和剤や乳剤を主体とする果樹、野菜用の農薬の割合が高くなったことによるものである。

おわりに

以上述べてきたように、農業に対する社会的要求が厳しくなっていく中で、製剤、施用技術は農業分野において非常に大きな役割をはたしていることがわかる。そして近年さらに安全性の向上、省力化、効力向上を目的として、種々の新しい製剤技術や施用技術が開発されつつある。

特に高度の放出制御技術、界面化学技術、センサー技術、標的指向化技術などが進歩して、種々の新しい技術開発が進行し、それに伴って農薬製剤・施用技術でもPDSの理念を実現し、人間と環境も含めた安全性の向上、省力化、効力向上を考え、今後さらに種々の高度の機能性製剤や施用技術の開発が期待される。

また、種々のスマート材料が開発され、それらを利用して、自ら標的を検知（センサー機能）し、必要な農薬を選択（プロセッサ機能）し、放出するような機能（アクチュエーター機能）を持ったスマート製剤や同様の機能を持った施用技術ができれば、農薬の施用は、環境負荷が少なく、非常に省力的でかつ安全、効率的なものになると考えられる。

このリレー連載では、今後個々のテーマについて、わかりやすく解説されるのでご期待いただきたい。

引用文献

- 1) 辻 孝三 (2005): 今月の農業 4月号: 68 ~ 77.
- 2) ——— (2006): 農薬製剤はやわかり一製剤でこんなことができる—, 化学工業日報社, 2006, p.3 ~ 9, 29 ~ 31.
- 3) ——— (2012 a): 第27回報農会シンポジウム, 植物保護ハイビジョン—2012 (平成24年9月25日), p. 53 ~ 64.
- 4) ——— (2012 b): 第32回農薬製剤・施用法シンポジウム, S3 (平成24年9月28日), p.31 ~ 41.
- 5) ——— (2013): 日本農薬学会誌 38 (2): 205 ~ 211.
- 6) ——— (2014): 粉体技術 6 (5): 15 ~ 20.