

農薬製剤について

日本曹達株式会社 小田原研究所 製剤研究部

1. はじめに

近年、世界的に貧困に終止符を打ち、地球を保護し、すべての人が平和と豊かさを享受できるようにすることを目指す普遍的な行動が求められています。農薬においては、人体や環境に対してリスクのより低いものへの転換が進められており、このような点から製剤の役割は更に重要になっています。

有効成分（または農薬原体）はそのままでは使用できず、製剤化された農薬が消費者に届けられます。農薬は、工業製品であり、効果・使いやすさ・安心・安全だけではなく、経済性も伴わなければなりません。

有効成分を人に、電車を作物に例えるならば、製剤はプラットホームのようなものであります。電車とプラットホームの間に段差や隙間があるならば簡単には乗り込めないように、有効成分も適当な加工がなされなければ作物に適切に届けられません。本稿では、最新動向を鑑みながら、農薬における製剤の役割と剤型やその特徴を紹介します。

2. 製剤の役割と製剤設計

農薬の製剤は、次のような役割を担っています。

①少量の有効成分を広範囲かつ均質に広げる。②有効成分の効力を最大限に引き出す。③有効成分の弱点を補う。④作業者の安全性を高める。⑤環境負荷を減らす。⑥作業性を改善、省力化する。⑦機能を付与し、適用範囲を拡げる。

製剤化することで、少量の有効成分を鉱物で嵩増ししたり、水で希釈したりすることで、広範囲に分布させることができます。

また、様々な副資材を配合することによって作物

や病害虫への取り込みが向上し、農薬の削減につながります。農薬の削減は環境負荷を軽減し、作業者の安全性を高めます。更に、取り扱いやすくなることで、作業者への負担も減らすことができます。

農薬を生かすのも殺すのも製剤であり、農産物の生産性を上げるには切り離せない存在です。実際の製剤設計では、まず初めに剤型を選択し、続いて処方と製造法を決定します。あるひとつの有効成分に対して、すべての剤型を適用できるわけではありません。化学農薬では、第一に有効成分の物理化学的性質を考慮して、適した剤型を選択します。

例えば、水中で容易に加水分解するならば水性製剤化は困難であることが多く、水和剤や乳剤となります。融点が低ければ有効成分を固体として維持することが難しく、乳剤や液剤への製剤化を優先して試みます。

また、対象作物の性状や慣行から剤型選択がなされることもあります。例えば、葉が繁茂し、枝葉が高所にある果樹では、汚れが少ない顆粒水和剤やフロアブル剤が多く使われ、水稻では、畦畔などから直接使用できる粒剤やジャンボ剤が多く使われます。ハウス等の閉鎖した空間で栽培する施設作物には、くん煙剤も選択肢の一つになります。

剤型が決定されると、次に処方と製造法が検討されます。処方検討では、効力を安定化させる目的で、農薬原体の粒子径を最適なものにします。一般的に、細かければ速効性に富み、粗ければ残効性に富んだ製剤が得られます。更に、ほとんどの製剤には界面活性効果を持つ資材が使われており、これら最適な資材を選抜することで効力を安定化させるだけでなく、物理化学的性質の安定化にも寄与します。ただし、安全性が認められた資材を使って処方を構築す

る必要があります。

処方構築するには同時に製造法を考慮することが不可欠であり、いかに優れた処方を構築しても、安価でかつ大量に生産できなければ意味がありません。例えば、生産時の発熱は物理化学的性状の劣化を引き起こすだけでなく、生産性の低下にも繋がりがねません。

剤型や製剤技術は、日々改良が重ねられ、新たな機能を付与した新製剤が開発されています。新製剤は、旧製剤とは異なる施用法を採用できたり、適用作物を拡大できたりすることで新農薬を開発するよりも低コストで新農薬に匹敵する効果が得られます。いくつか例を挙げますと、ムッシュボルドー DF はボルドー液を固形化し、効力は変わらずに取り扱いを容易にした顆粒水和剤です。アベイル粒剤は有効成分の溶出性をコントロールすることで、速効性と残効力を兼ね備えた防除効果が最適化された粒剤です。

3. 剤型ごとの特徴

製剤は形状や性能の違いから剤型が分類され、国内においては「農薬の種類について（昭和 57 年 1 月 20 日付 56 農蚕 8702 号農蚕園芸局長通知）」で定義されています。剤型の違いに応じて、試験方法が規定されており、これにより有効成分や効果の安定性などが担保されます。国内で規定されている剤型と国際的な剤型は必ずしも一致せず、国際的な定義は、国際農薬分析協議会（CIPAC）が定めた基準を用いているケースが多く、アルファベット 2 字で表される分類コードの数が国内の分類を上回っています。これらを比較しながら、代表的な製剤の剤型ごとの特徴について国際分類にしたがって報告します（表1）。

Wettable powder（WP、水和剤）：水に分散させサスペンション（懸濁液）として使用する粉状の製剤です。

一般に、鉱物質の増量剤と水との馴染みや水中での分散を保つための界面活性剤等を含み、粒径が 4～7 μ m 程度である粉状の製剤です。その特徴は、有効成分含量が比較的高く、容易に水に馴染みやすくなっています。更に、混合・粉碎のみで安価に製造できることも利点であります。一方で、嵩高く、粉塵の発生があることから、輸送効率や人体への安

全性の点で難点があります。当社では、関連会社の（株）ニッソーグリーンより、食品添加物のフマル酸を有効成分とした芝用殺菌・殺藻剤であるアルテリア水和剤や微生物を有効成分としたマスタピース水和剤等の環境に配慮した農薬を上市しています。

Water dispersible granule（WG、顆粒水和剤）：水に分散または崩壊させて使用する顆粒製剤です。

一般に、鉱物質の増量剤と水への崩壊しやすさや水中での分散を保つための界面活性剤等を含み、粒度が 0.5～1 mm 程度である粒状の製剤です。外観は WP を顆粒化したように見えますが、水への分散や崩壊を助けるために多くの界面活性剤が添加されており、製造には粉碎による微粒化に加えて造粒が必要であることから、WP に比べて高価になります。一方で、粉立ちが少なく、計量しやすいことから作業者の大きなメリットになっています。

国内において、水混練・スクリーン押出・流動床乾燥を経て製造することが主流ですが、有効成分の安定性、物理化学的性状および生産コストを考慮して様々な造粒方法が取り入れられています。当社には、ムッシュボルドー DF があります。

Water soluble granule（SG、水溶性粒剤）：水に溶解後、有効成分の水溶液として使用する顆粒の製剤で、水に不溶な不活性成分を含みます。

水溶性の有効成分、増量剤および界面活性剤を主な成分とすることで、水に希釈した水溶液として使用します。ほとんどの製剤は水希釈時に着色し、誤用や誤飲の防止策を施しています。

モスピラン顆粒水溶剤やビーナイン顆粒水溶剤は既製品の水溶性粉剤を改良して、より安全性を向上させています。

Soluble concentrate（SL、液剤）：水に希釈後、有効成分の水溶液として使用する澄んだ液状製剤で、水に不溶な不活性成分を含みます。

水溶性の有効成分を水や水溶性溶媒に溶解して製造される液状製剤です。有効成分が完全に溶解することから植物体の表面を均一に覆うことができる反面、雨で流亡する恐れがあることから、植物体への浸透性や固着性を高める工夫がなされています。モスピラン SL 液剤やアルファード液剤があります。

表1. 剤型と概念図

剤型名	乳剤		液剤		粉剤	粒剤	油剤	くん煙剤	水和剤				水溶性		
	EC	EW	ME	SL	DP	GR	OD	FU	SC	FS	SE	WG又はDF	WP	SG	
Emulsifiable concentrate	Emulsion, oil in water	Micron emulsion	Soluble concentrate	Dustable powder	Granule	Oil dispersion	Smoke generator	Suspension concentrate (Flowable concentrate)	Flowable concentrate for seed treatment	Suspension emulsion	Water dispersible granule (Dry flowable)	Wettable powder	Water soluble granule		
物理化学的性状	透明液体	乳白色液体	透明液体	透明液体	微粉	粒状	粘濁性懸濁液	タブレット	粘濁性懸濁液	粘濁性懸濁液	粘濁性懸濁液	粒状	微粉	顆粒	
構造概念図															
施用方法	水希釈	水希釈	水希釈	水希釈	散粒	散粒	水希釈	発煙	水希釈	塗布他	水希釈	水希釈	水希釈	水希釈	
施用時の原体	分散固体粒子 (<1μm)	乳化粒子 (<1μm)	乳化粒子 (<0.1μm)	溶解	分散固体粒子 (<20μm)	-	分散固体粒子 (約2μm)	分散固体粒子 (1~5μm)	分散固体粒子 (約2μm)	分散固体粒子 (約2μm)	乳化粒子 (14μm) 分散固体粒子 (約2μm)	分散固体粒子 (3~10μm)	分散固体粒子 (3~10μm)	溶解	
散布液概念図					-	-		-	-	-					
当社製品例	ナブ乳剤 トリミル乳剤	スチート乳剤 A-M乳剤	スチート乳剤 A-M乳剤	スチート乳剤 A-M乳剤	スチート乳剤 A-M乳剤	PA'1体粒剤 モビ'ラ粒剤	オイル	モビ'ラ粒剤 トリミル粒剤	ピ'シコ乳剤 ダ'コ乳剤	-	-	ム'ジ'乳剤	トリ'グ'乳剤 PA'1乳剤	モビ'ラ乳剤 ピ'シコ乳剤	

Suspension concentrate (SC、FL、フロアブル、ゾル)：液体中に有効成分が安定なサスペンションになっている製剤です。水に希釈して使用します。

国内登録では、WP や WG と同じ水和剤に定義されています。水に溶けにくい有効成分を $2\mu\text{m}$ 程度に微粒化して分散させた製剤です。生物効果の側面では速効性と残効性のバランスがとれた製剤になることが多いです。製剤は水をベースとしており、人体に対して安全性が高く、環境に対する負荷も少ないことから、優先的に製剤開発が進められます。一方で、水に希釈した際の分散安定性に加え、製剤中の沈降防止や保存安定性などの課題が多く、複雑な処方（粘度調整剤・界面活性剤・防腐剤等）となっています。また、ピーズミルによる湿式粉碎で製剤が生産されることから、界面活性剤選抜の良否が粉碎効率に大きな影響を与えます。当社が開発した新規有効成分（ピカルブトラゾクス、アシノナピル、イプフルフェノキン）は、すべてフロアブル剤のラインナップを有しています。

Dustable powder (DP、粉剤)：散粉するのにふさわしい流動性を持った粉末製剤です。

DP の定義は $45\mu\text{m}$ 以下のものが 95% 以上であるが、実際には散布の均一性を高めるために粉剤の粒径は $10\mu\text{m}$ 程度となっています。直接散粉することから複数の有効成分を含んだ製剤が開発されています。物性改良剤や帯電防止剤等を配合することで、流動性や分散性を改良し、有効成分のドリフトを抑えています。粉剤は国内の水稲分野で多く使われており、粒径 $10\mu\text{m}$ 以下のものが 20% 以下、平均粒径が $20\mu\text{m}$ 以上のものをドリフトレス粉剤 (DL) と定義して、国内では異なる剤型に分類しています。

Granule (GR、粒剤)：使用に適性した粒径範囲に規定した流動性のある固体製剤です。

GR は、製剤そのものを直接散布する剤型であり、 $300 \sim 1,700\mu\text{m}$ の粒度を有します。粒剤は水田での水面施用や育苗箱処理、畑での土壌混和等の方法で施用されます。粒剤は、結合剤、崩壊剤、分散剤、増量剤で構成され、必要に応じ放出制御剤、薬害低減剤、有効成分の分解防止剤などを加えます。アベイル粒剤やモスピラン粒剤は有効成分の放出制御を付与した粒剤です。

国内において、粉剤のドリフトや散粒時の均一性を改善した DP と GR の中間粒度の粉粒剤も定義されています。

Oil dispersion (OD、オイルディスパーション、油剤)：水と混和しない液体の中に、有効成分が安定なサスペンションになった製剤で、他の有効成分が溶けている場合があります。そのまま、または水に希釈して使用します。

OD は、加水分解しやすい有効成分を液体製剤化することができ、オイル連続相が効力増強剤として働きます。外観はフロアブル剤と似ていますが、有効成分が分離しやすく、水に希釈して使用する際にも有効成分の分散やオイルの乳化を保つことが難しいため、資材の選抜や製造方法に注意が必要です。

Smoking agent (FU、くん煙剤)：燃焼により有効成分が煙状に発生するもので、通常は固体の可燃性製剤です。

くん煙剤とは、加熱によって有効成分を煙状の微細な粒子として空中に拡散し、作物の表面に付着させ、あるいは病害虫に直接接触・吸入させて効力を発揮させる製剤を言います。くん煙粒子は、 $1 \sim 5\mu\text{m}$ と散布液の粒子約 $50\mu\text{m}$ に比べて小さく、ムラなく防除できます。また、散布設備が必要なく、人体に接することもないので、施設作物への施用では省力性や安全性が高い製剤です。

Flowable concentrate for seed treatment (FS、種子処理用フロアブル剤)：そのまま、または希釈して種子処理に使用する安定なサスペンション製剤です。

種子処理は、播種前に行う施用プロセスであり、健全な育苗と植物が持つポテンシャルを最大化します。農薬の使用量を低減でき、環境負荷を軽減すると同時に、農家にとって初期段階の散布作業がなくなり、時間とお金を節約できます。しかしながら、発芽阻害や粉塵発生など克服しなければならない課題も多い製剤です。種子処理剤は、通常の散布剤を改良した製剤とみなすことができます。例えば、種子処理用フロアブル剤は、フロアブル剤に色素や結着剤等が加えられています。

表 2. 展着剤の成分分類

有効成分の系統		湿展性	浸透性	分散性	可溶化力	固着性	懸垂性	展着剤名
非イオン	POE アルキルフェニルエーテル	◎	○	○	○	○	○	ダイコート
	POE アルキルエーテル	◎	◎	○	◎	○	○	ラビデン 3S
	PEG アルキルエーテル	○	△	△	○	○	(△)	
	POE 脂肪酸エステル	○ ◎	○	△	○		△	ラビデン 3S
	POE 脂肪酸エステル			△	△	○		
	POE ヘキシタン脂肪酸エステル	○	◎	○	◎	○	○	
	ソルビタン脂肪酸エステル	◎	◎	○	◎	○	○	
	シリコーン	◎	○	○	○			
陰イオン	ナフチルメタンスルホン酸塩			◎	○	○	◎	
	アルキルスルホコハク酸塩	○ ◎	◎	○			△	ダイコート ラビデン 3S
陽イオン	テトラアルキルアンモニウム塩	○	◎	○	○	◎		
その他	パラフィン					◎		
	D-ソルビット							

Emulsifiable concentrate (EC、乳剤)：水に希釈後、エマルションとして使用する均質な液体製剤です。

水に混じりあわない溶媒に有効成分を溶解して製造される透明な液状製剤です。水に希釈して使用する際に有効成分が溶解した1 μ m以下の乳化微粒子となり、牛乳の様な乳白色となります。粒径が細かく、溶媒が植物体への取り込みを促進することから、速効性に優れる一面を持っています。多くは臭気があり、引火性の液体であることから、取り扱いに難があり、また、環境負荷の観点から国際的に規制が強まっています。

Emulsion、oil in water (EW、水性エマルション)：水相中で微細な小球体の有機相に有効成分が溶解している、不均質な溶液からなる液体製剤です。

EWは、水に不溶な有効成分を乳化剤の添加により水中で微粒子として乳化、分散させた濃厚な水中油型(O/W)の製剤です。製剤は、水をベースとしていることから乳剤と比較して安全性が高い一方で、水と油の関係から熱学的に不安定であり、製品の有効期限内の乳化安定性を保つことが必要です。そのために、乳化剤の他に粘度調整剤や比重調整剤を配合しています。

Micro emulsion (ME、マイクロエマルション)：そ

のまま、または水に希釈して使用する溶媒および水を含んだ透明または半透明の液体で、希釈したマイクロエマルションは一般的なエマルションの形をしています。

希釈液のマイクロエマルションは、ミセル0.1 μ m以下でEWよりも小さく、透明な液体です。界面活性剤が多く使われ、有効成分濃度が低くなる傾向にあり、環境に配慮した溶媒を使うことで安全性が高い製剤を得られます。

微量散布剤：剤型名ではありませんが、国際分類では、“専用器具でできるように調製された製剤”としてUltra-low volume suspension (SU)、Ultra-low volume liquid (UL)と定義されています。国内では、“空中散布用に調製された製剤”として定義され、通常の散布剤のコードに液剤散布(S)、液剤少量散布(LV)、および微量散布(ULV)を付加して表します。

ドリフト低減や広範囲の均一性確保に課題があり、航空機の種類や対象作物に応じて展着剤が選抜され、加用されています。バッテリーと薬液積載量が制限される産業用マルチローター(ドローン)散布においては、施用法を考慮した製剤開発が望まれます。

4. その他

Adjuvant（機能性展着剤、効力増強剤等）：農薬の成分のうち、有効成分以外の様々な不活性補助材料です。

アジュバントは剤型ではありませんが、製剤の性質に大きなインパクトを与えることから、取り上げます。

アジュバントは有効成分の効果を増強したり、製剤のパフォーマンスを改善するために、添加される不活性物質であり、界面活性剤や水溶性の高分子が広く使用されています。あらかじめ製剤に配合されたビルドインタイプと水希釈する際に混ぜられるタンクミックスタイプがあり、ドリフト低減・付着性・湿潤性・固着性及び浸透性を付与することで、収量増加、防除コスト抑制、環境負荷低減や残留農薬低減をもたらすと考えられます。

ラビデン 3S は多くの農薬との混用性が良く消泡性があり、ダイコートは薬液の付きにくい農作物に

特化しています（表2）。

生物農薬：

微生物農薬は、化学農薬と比較して保存安定性に劣るものが多く、大量生産することは容易ではありません。生菌安定性を担保するために、剤型が限定されたり、有効期限が短かったりします。

当社では関連会社の（株）ニッソーグリーンより、アグロケア水和剤やマスタピース水和剤を上市しています。

5. おわりに

総合的病害虫・雑草管理の観点から化学農薬の削減が予想される中で、化学農薬を対象とした製剤に限定されることなく、より高い製剤技術が要求されています。本稿で紹介した製剤技術は、製剤の基礎をなすものであり、日々発展を遂げる製剤技術に関する理解に繋がれば幸甚です。