

農薬製剤のエビデンス — 農薬製剤剤型の解説 —

原体の物理的特性からの最適剤型選抜について

日本曹達株式会社 農業化学品事業部
農業化学品開発グループ

鈴木 雅博 m.suzuki@nippon-soda.co.jp

はじめに

殺菌、殺虫、除草の農薬活性物質(農薬原体)は、そのままでは散布することは出来ず、使用しやすい形に加工する必要がある。加工品の代表的な製剤剤型として、水に希釈して使用するタイプでは、水和剤(Wettable Powder, WP)、顆粒水和剤(Water Dispersible Granule, WDG)、フロアブル剤(Suspension Concentrate, SC)、乳濁剤(Emulsion in Water, EW)、乳剤(Emulsifiable Concentrate, EC)があり、そのままの形で使用するタイプでは、粒剤(Granule, G)、粉剤(Dust, D)がある。

しかし、農薬活性物質は、その物理化学的性質(融点、溶解度等)によって製造可能な剤型が限られている。剤型は生物活性に影響を与える場合が多いため、最適剤型の選抜は農薬開発における最も重要な研究の一つである。今回は、種々の剤型について概説するとともに、物理化学的性質に基づいた剤型選抜のフローおよび剤型が原体の挙動等に及ぼす影響について述べる。

農薬製剤の製造方法

農薬製剤は、一般的には、ジェットミル等の乾式粉碎、ビーズミル等の湿式粉碎、溶解、乳化、造粒等により製造される。散布液中では、水和剤と顆粒水和剤は3-10 μ m程度の粒子径に、フロアブル剤は1-3 μ m程度の粒子径に、乳剤や乳濁剤では0.1-1 μ m程度の乳化粒子径になるように調整されている。

各種剤型に加工する際に求められる農薬活性物質の物理化学的性質

水和剤、顆粒水和剤、フロアブル剤に加工するには、農薬活性物質の融点が高いことが求められ、乳剤、乳濁剤では非極性溶媒に対する溶解度が高いことが条件となる。また、フロアブル剤では水への溶解度が低いことが農薬活性物質の条件となる。

各種剤型が葉面上の農薬活性物質の挙動に与える影響

農薬活性物質の葉面上での挙動と各種剤型との関係を以下に記す。これらは様々な試験データや技術情報から得られた一般論であるが、参考のため試験データの一部を紹介する。特に影響を与える要因として、葉面上での農薬活性物質の粒子径や製剤中に使用している界面活性剤の種類がある。

光分解	(遅い) 水和剤, 顆粒水和剤 > フロアブル剤 > 乳剤, 乳濁剤 (速い)
揮散性	(遅い) 水和剤, 顆粒水和剤 > フロアブル剤 > 乳剤, 乳濁剤 (速い)
表面付着量	(多い) 水和剤, 顆粒水和剤 > フロアブル剤 > 乳剤, 乳濁剤 (少ない)
内部浸透量	(多い) 乳剤, 乳濁剤 > フロアブル剤 > 水和剤, 顆粒水和剤 (少ない)
耐雨性	(良い) フロアブル剤 > 水和剤, 顆粒水和剤 > 乳剤, 乳濁剤 (悪い)

試験データの例

例 1) A 殺菌剤のシャーレ上での光分解

A 剤の水和剤、フロアブル剤、および乳剤を調製し、農薬活性物質の濃度が200ppmになるように調整した溶液を ϕ 9 cmのシャーレに2ml滴下し、均一になるように広げて風乾し、太陽光を照射して6時間後の残存率を測定したところ、下記の結果が得られた。

農薬活性物質の残存率 水和剤 75% > フロアブル剤 36% > 乳剤 12%

例 2) B 殺虫剤のみかん葉への付着量

B 剤の水和剤, フロアブル剤, および乳剤を調製し, 農薬活性物質の濃度が 100ppm になるように調整した散布液を, みかん葉(旧葉)に処理し(展着剤ラビデン SSS 5000 倍加用), みかん葉に付着した農薬活性物質の量を測定したところ, 散布直後の葉面付着量は下記のようなであった。

農薬活性物質の付着量 水和剤 $1.40 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ > フロアブル剤 $0.83 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ > 乳剤 $0.27 \mu\text{g}/\text{cm}^2$

例 3) C 殺菌剤の耐雨性

C 剤の顆粒水和剤, フロアブル剤, および乳濁剤を調製し, 農薬活性物質の濃度が500ppmになるように調整した溶液を小麦葉にマイクロシリンジで100 μl 滴下し風乾した。つぎに小麦葉を水平面から30度の角度保ち, 人工降雨装置を用いて1時間に30mmの降雨処理を施し, 残存率を測定したところ, 下記の結果が得られた。

農薬活性物質の残存率 フロアブル剤 66% > 顆粒水和剤 19% > 乳濁剤 2%

各種剤型が生物活性へ及ぼす影響

以下に生物活性と各種剤型との一般的な関係を以下に示す。なお, 本傾向に関しては, 外的要因が影響していない場合であって, 主な要因としては葉面上での農薬活性物質の粒子径である。

病斑の拡大阻止活性 (高い) 乳剤, 乳濁剤 > フロアブル剤 > 水和剤, 顆粒水和剤 (低い)
残効活性 (高い) 水和剤, 顆粒水和剤 > フロアブル剤 > 乳剤, 乳濁剤 (低い)

最適剤型の選抜方法

上記の各種剤型/農薬活性物質の挙動/生物活性の関係より, 「最適剤型選抜フロー」, 及び, 「最適剤型選抜一般例」を文末に掲載した。最適剤型製造フローでは農薬活性物質によっては製剤化不可能という結果になるものもあるが, あくまで一般的な手法によるフローである。製剤技術の進歩により現状では全く製剤化不可能という農薬活性物質はほとんど存在していない。

特殊な製剤化技術

近年の製剤化技術の向上により, 従来の技術では不可能であった農薬活性物質の製剤化, または葉面上での農薬活性物質の挙動の改良, 生物活性の向上, 薬害軽減等が可能になっている。以下に近年の特殊な製剤化技術の一例を示す。

例 1) 製剤化が容易でない農薬活性物質の水剤剤(WP)化

農薬活性物質の融点が50°C以下で, 非極性溶媒への溶解度が低い場合は, 最適剤型選抜フローでは製剤化不可能と判断されるため, 農薬活性物質を加熱により液体にして, 吸油能の高い単体(酸化珪素, 珪藻土等)に吸着させ粉末化することにより製剤化する。

例 2) 乳剤への耐雨性の付与

最適剤型選抜フローでは乳剤は耐雨性が悪いと判断される。農薬活性物質の性質から乳剤(EC)しか製造できないと考えられるときは, 耐雨性を付与するため, 下記の技術が使用される場合がある。

(1) 疎水性展着剤(Adjuvant)を添加することにより, 希釈液を散布後, 葉面上で水分が蒸散する際に疎水性展着剤が膜を生成し, 耐雨性が改善される。

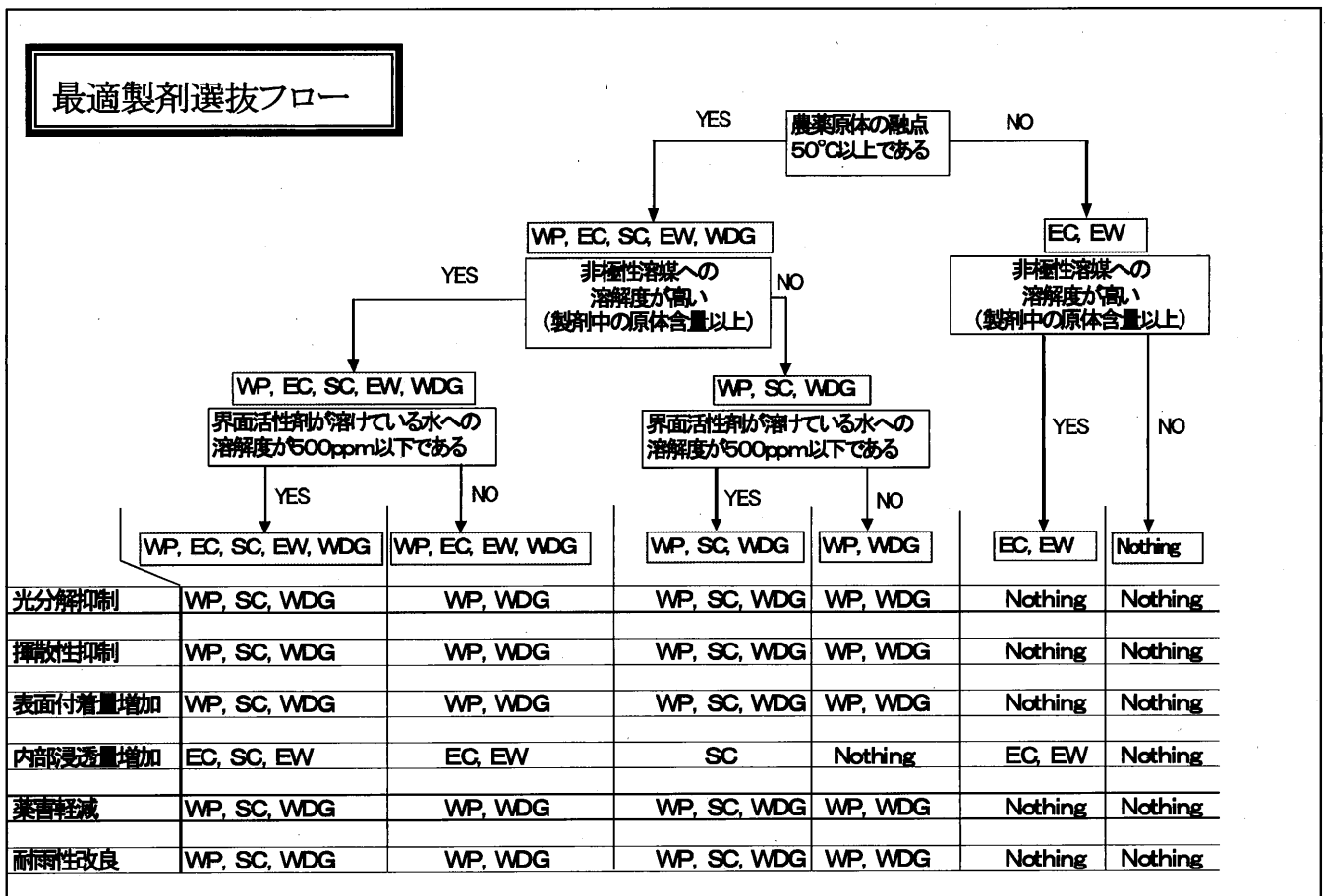
(2) 乳剤の調製に極性溶媒のみを使用することにより, 希釈時に極性溶媒が水に溶け, 農薬活性物質がフリーの状態になり結晶化する。希釈する前は乳剤(EC)であるが, 希釈液中, あるいは散布後の葉面上では農薬活性物質はフロアブル剤(SC)の挙動を示し, 耐雨性が改良される。

例3) 固形化乳剤

生物効果の観点からは乳剤(EC)が優れるけれども、農業現場では顆粒水和剤(WDG)の方が好まれる場合がある。このときは、揮散しにくい高沸点溶媒に農薬活性物質と界面活性剤を溶解し、吸油能の高い単体(酸化珪素、珪藻土等)に吸着させ粉末化した後、顆粒水和剤を製造する。希釈する前は顆粒水和剤(WDG)であるが、希釈液中、あるいは散布後の葉面上では農薬活性物質は乳剤(EC)の挙動を示す。

おわりに

今回は、各種剤型/農薬活性物質の挙動/生物活性の関係より、最適剤型選抜フローを示したが、最適剤型選抜フローはあくまでも一般的な考えのもとで作成したフローである。近年、製剤技術力の向上により、一般的な概念を打ち砕いて製剤化することも可能になっており、最適な製剤処方を組むことによって農薬活性物質の葉面上での挙動改善、並びに、生物試験における効力向上、薬害軽減をも可能にしている。



最適剤型選抜一般例

	原体含量	原体融点	ソルベツソ200への溶解度	5%界面活性剤水溶液への溶解度
例1	20%	100℃	>40%	800ppm
例2	20%	40℃	>50%	200ppm

