

2.4.2 代表的特許

製剤分野の代表的な特許としては、農作業の省力化や環境を配慮した新剤型や処理方法の技術開発に注目し、62 件を選抜した。

(1) 発明の課題と成果

選抜した 62 件の特許について、表 2.4.2-1 には製剤の種類と目的の件数一覧を、また、表 2.4.2-2 には製剤の種類と目的を示した。

製剤の開発の方向は、効力の向上、安全性の向上、省力化などが主眼である。具体的には、剤型としては水性剤、粒剤、放出制御剤、混合剤などの開発に力が入れられており、包装に関しては、そのまま、水に溶かせる水溶性包装などが開発の対象となっている。

水性製剤としては、主にフロアブル、濃厚エマルジョンがあり、おのおの固体あるいは液体化された農薬原体を水中に懸濁分散あるいは乳化分散した製剤であり、水で希釈して散布される。水和剤のような粉塵飛散の問題がなく、作業への安全性が高いなどの優れた特徴を持っているため、多くの農薬で開発・上市されている。

フロアブルに関しては、保存安定性、分散安定性、低粘度であることなどが達成された特許が数多く出願されている（特公平 7-116001、特許 2674153、特開平 10-279410、特開平 11-349412）。また、比較的加水分解性の高いスルホニルウレア系除草活性化合物についてもフロアブル製剤の特許が出願されている（特開 2000-95620）。さらに近年、除草剤のフロアブルで省力化を目的として、フロアブル剤を水に希釈することなく水田に直接散布する方法が開発・実用化されている（特公平 7-47522、特開平 10-287503、特開平 10-316503、特開 2000-159603）。

乳剤と比較して多くの利点を有する濃厚エマルジョンに関しても、多くの特許が出願されているが、中でもピレスロイド系殺虫剤の製剤が多い（特公平 6-76281、特公平 7-106963）。一般にピレスロイド系殺虫剤に認められる粘膜刺激性が軽減されるという。

また、フロアブルと濃厚エマルジョンを混合したサスポエマルジョンと呼ばれる製剤（特許 2593886、特公平 7-108842）や、非常に細かい油状粒子を水に分散させた透明な液体のマイクロエマルジョン製剤（特許 3011724、特許 2919952、特許 2631053）も開発されている。しかし、マイクロエマルジョン製剤は農業分野での実績が少なく、生物活性、安全性面での特徴がまだ十分には把握されていない。

粒状化製剤技術の代表である顆粒水和剤は、水和剤の水希釈時の粉塵を防止するために開発された製剤で、水中に投入すると容易に崩壊、分散する。粉立ちがなく、作業への安全性が高いなどの特徴を持ち、かなり開発・上市が進んでいる。水中崩壊性および水中分散性が優れた各種農薬の顆粒水和剤に関する特許が各社から出願されている（特許 2515124、特許 2813213、特許 2677702、特公平 8-5764、特許 2969475、特許 2931869、特開平 10-279403、特開平 11-49604、特開 2000-204001）。また、従来の技術では難しいとされていた、低融点の農薬活性化合物の顆粒水和剤も開発されている（特開 2000-204003、特開 2000-72602）。この他、農薬活性成分を含むマイクロカプセル凝集物と、非封入の農薬活性成分を組み合わせた水分散性粒剤（特公平 6-11682）や農薬活性成分、高沸点芳香族有機溶剤、およびポリビニルアルコールを含有する水乳化性顆粒（特許 2955109）製剤が開発されている。また、粒剤では 10 アール当たり 3 kg の施用が広く普及していたが、

その重量を減らし、農作業を軽減、省力化する目的で、10 アール当たり 1 kg 施用する 1 kg 粒剤の開発・普及が進んでいる。従来は水田用除草剤（特公平 6-47523、特公平 6-8242、特開平 11-269016）が主であったが、最近は殺菌剤や殺虫剤においても 1 kg 粒剤の開発が活発化している。

放出制御製剤の代表であるマイクロカプセルは、農薬を高分子膜で被覆した、直径が数ミクロンから数百ミクロンの微小球を水中に分散したスラリー製剤が主であり、水で希釈して散布される。残効性の向上、人畜に対する毒性、刺激性の軽減、魚毒性の軽減などの特徴を有し、従来、防疫用およびシロアリ防除用途に使用されてきたが、農業分野等への適用を目指しても精力的に開発が進められている。例えば、有機燐系殺虫剤（特公平 5-17882、特公平 6-92282）、ピレスロイド系殺虫剤（特公平 6-76286）、およびクロロニコチニル系殺虫剤（特開 2000-95621）等がある。ピレスロイド系殺虫剤は一般に魚毒性が高く、そのために水田を対象とした害虫に適用するのは困難であった。しかし、マイクロカプセル化技術を応用し、効力を維持しつつ魚毒性を軽減した製剤の開発が可能となっている。また、乳化剤を用いずに、粒径が容易に制御できる新規なカプセル化農薬製剤の製造方法も開発されている（特開 2000-143407）。

また、近年コーティングにより農薬有効成分の溶出を制御する被覆型農薬粒剤（コーティング剤）が開発されている（特開平 11-236301、特開 2000-128705、特開 2000-186004）。その他の放出制御技術としては、粒状発泡体にスルホニルウレア系除草剤を担持させた粒剤（特許 2508012）、液体状農薬有効成分を吸油した粉体の表面に、疎水性微粉体を付着、固定化または成膜化させた製剤（特公平 7-20843）、非晶質シリカを含有する簡便な徐放性農薬粒剤（特許 3045649）、および農薬活性成分、エステル系疎水性物質、無機系希釈担体を含有する徐放性農薬製剤（特開 2000-26206）等が開発されている。

さらに、生分解性ポリマーを利用した徐放性製剤も開発されている（特許 2957788、特開平 11-286402）。

水口施用や畦畔散布などの省力散布剤に応用が広がっている製剤として、最近、水面浮上性粒状製剤（水面展開剤）が開発されている。この製剤は、水田に施用後いったん沈み、水溶性の担体が水に溶解すると再び水面に浮上し、有効成分を含む溶液が水面上を拡散展開する性質を持っている。殺虫剤を中心として、農薬活性成分の水面浮上率の向上、水面展開性の改良などが達成された製剤が数多く開発されている（特公平 8-5763、特許 2602691、特許 2849534、特許 2970865）。

同じように農作業の省力化を目指した製剤としてジャンボ剤やパック剤が開発されている。ジャンボ剤とは比較的新しいネーミングであるがその内容は“水田用除草剤の投げ込み剤”とされている（水田用殺虫剤や殺菌剤の投げ込み剤はジャンボ剤と言われていない）。

1 個 50 グラム程度の球状、円柱状、その他の塊状の除草剤の製剤で、水中で拡散、展開が容易なように設計されている。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（特許 2924071、特許 2980959）、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（特許 2980959）、および水面展開性、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（特開平 11-315004、特開 2000-119108）などが開発されている。水溶性包装体の場合、直接農薬に触れないことも利点である。

表 2.4.2-1 製剤の種類と目的の件数一覧表

目的 製剤の種類	水性化			粒状化			放出制御			省力化		
	'85	'90	'95	'85	'90	'95	'85	'90	'95	'85	'90	'95
フロアブル	*	*	*									
濃厚エマルジョン	*	*										
マイクロエマルジョン	*	*										
サスポエマルジョン	*	*										
顆粒水和剤				*	*	*						
1 kg 粒剤				*	*	*						
マイクロカプセル							*	*	*			
コーティング剤									*			
水面展開剤										*	*	*
ジャンボ剤										*	*	*
バック剤										*	*	*
その他				*	*		*	*	*	*	*	*

注：＊は1件の特許を表す

表 2.4.2-2 製剤の種類と目的 (1/4)

目的 製剤の種類	水性化	粒状化	放出制御	省力化
	・特公平 7-47522 86.10 東ソー ・特公平 7-116001 87.04 クミアイ化学工業 ・特許 2674153 88.11 住友化学工業 ・特開平 10-316503 97.02 北興化学工業			

表 2.4.2-2 製剤の種類と目的 (2/4)

製剤の種類 \ 目的	水性化	粒状化	放出制御	省力化
フロアブル (続き)	・特開平 10-279410 97.02 田薬品工業 ・特開平 10-287503 97.02 北興化学工業 ・特開平 11-349412 98.06 エスディーエスバイ オテック ・特開 2000-95620 98.09 日産化学工業 ・特開 2000-159603 98.11 三共			
濃厚エマルジョン	・特公平 6-76281 86.01 住友化学工業 ・特公平 7-106963 90.02 (優) ヘキスト			
マイクロエマルジョン	・特許 3011724 88.02 (優) ヘキスト ・特許 2919952 90.11 北興化学工業 宇部興産 ・特許 2631053 91.02 (優) ロースプーラン			
サスポエマルジョン	・特許 2593886 86.09 (優) ヘキスト ・特公平 7-108842 91.03 (優) ロースプーラン			
顆粒水和剤		・特許 2515124 87.08 塩野義製薬 ・特許 2677702 89.08 (優) ヘキスト ・特許 2813213 89.10 トクヤマ ・特公平 8-5764 90.02 (優) ヘキスト ・特許 2969475 90.11 北興化学工業		

表 2.4.2-2 製剤の種類と目的 (3/4)

製剤の種類 \ 目的	水性化	粒状化	放出制御	省力化
顆粒水和剤 (続)		・特許 2931869 94.11 北興化学工業 ・特開平 10-279403 97.02 武田薬品工業 ・特開平 11-49604 97.05 日本バイエルアグ ロケム ・特開 2000-72602 98.08 日産化学工業 ・特開 2000-204001 99.01 北興化学工業 ・特開 2000-204003 99.01 日産化学工業		
1 kg 粒剤		・特公平 6-47523 85.12 三井東圧化学 ・特公平 6-8242 86.01 クミアイ化学工業 ・特開平 11-269016 98.03 クミアイ化学工業		
マイクロカプセル			・特公平 5-17882 85.12 呉羽化学工業 ・特公平 6-92282 86.01 住友化学工業 ・特公平 6-76286 86.03 住友化学工業 ・特開 2000-95621 98.07 住友化学工業 ・特開 2000-143407 98.09 大日本インキ化学 工業	
コーティング剤			・特開平 11-236301 98.02 チッソ ・特開 2000-128705 98.10 住友化学工業 ・特開 2000-186004 98.12 日本バイエルアグ ロケム	

表 2.4.2-2 製剤の種類と目的 (4/4)

製剤の種類 \ 目的	水性化	粒状化	放出制御	省力化
水面展開剤				・特公平 8-5763 86.07 三井東圧化学 ・特許 2602691 87.04 武田薬品工業 ・特許 2849534 93.09 三井東圧化学 ・特許 2970865 96.01 北興化学工業
ジャンボ剤				・特許 2924071 89.04 住友化学工業 ・特許 2980959 89.09 石原産業 ・特開平 11-315004 98.03 日本バイエルアグロケム ・特開 2000-119108 98.08 三共
バック剤				・特許 2957751 90.06 三共 ・特開平 5-78207 91.02 日本化薬 ・特許 2860920 91.09 北興化学工業 ・特開平 11-310503 98.02 三共
その他		・特公平 6-11682 86.07 (優) モンサント ・特許 2955109 91.02 (優) ヘキスト	・特許 2508012 86.04 日産化学工業 ・特公平 7-20843 88.03 北興化学工業 ・特許 2957788 91.12 信越化学工業 ・特許 3045649 94.11 北興化学工業 ・特開平 11-286402 93.03 三井化学 ・特開 2000-26206 98.05 三井化学	・特許 2945076 90.05 保土谷化学 東邦化学 ・特許 2999535 90.09 保土谷化学 宮城化学工業 富士カプセル ・特許 2764155 92.06 三井化学 ・特開平 11-246317 98.03 三井化学 科研製薬