

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

(2) ラットにおける代謝試験 (代謝物の同定)

(資料 No.M-02)

試験機関：チバガイギー社 (スイス国)

報告書作成年：1992年 [GLP 対応]

試験目的：本試験は先の試験 (資料 No.M-01) の試料を用いて、尿、糞および胆汁中の主要な代謝物を同定することを目的として実施した。

供試標識化合物：

① 標識シプロジニル

② 標識シプロジニル

標識位置の設定理由：

供試動物： Tif:RAIf 系ラット、雄約 7 週齢 (G1 群のみ約 8 週齢)、雌約 9 週齢
体重 雌雄とも約 200g (G1 群は 250g)

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

方 法 :

試料採取 ; 資料 No.M-01 の試験で得られた下表の試料を代謝物の検討に供した。

試験群	投与量 (mg/kg)	投与回数	供試標識化合物の標識位置	動物数	採取試料	試料採取時期
B1	0.5	単回		雌雄各 5	尿 糞	投与 0~48 時間後
C1		反復		雌雄各 5	尿 糞	投与 0~48 時間後
D1	100	単回		雌雄各 5	尿 糞	投与 0~24 時間後 投与 0~48 時間後
D2				雌雄各 5	尿 糞	投与 0~48 時間後
G1				雄 5	胆汁	投与 0~48 時間後

分析方法 ; 尿、糞の抽出液および胆汁中に含まれる放射能については直接、糞の抽出残渣に含まれる放射能は燃焼法により LSC で測定した。

尿試料中の代謝物は HPLC で分析した。

糞中の代謝物は HPLC で分析した。

胆汁中の代謝物は直接 HPLC で分画および精製した。

各代謝物は TLC、MS および NMR によって同定した。

結 果 : 尿、糞および胆汁中の代謝物画分の分布を表 1 に示す。

尿中では、主要な代謝物として、
出された。その他に

が認められた。

糞中では、親化合物[A] が認められた。

胆汁中では

が認められた。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表 1 尿、糞および胆汁中の代謝物画分（投与量に対する割合、%TAR）

標識位置										代謝物の 同定		
投与群		B1 (0.5mg/kg、単回 経口投与)		C1 (0.5mg/kg、反復 経口投与)		D1 (100mg/kg、単回 経口投与)		G1 (100mg/kg、単回 経口投与)			D2 (100mg/kg、単回 経口投与)	
		雄	雌	雄	雌	雄	雌	雄	雌		雄	雌
尿中の 代謝物 画分												
	合計											
糞中の 代謝物 画分												
	合計											
胆汁中の 代謝物 画分												
	合計											
総回収率		64.8	69.2	73.1	67.0	69.8	72.0	80.2	75.1	76.5		

n.a.: 分析せず、 t: 痕跡

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

推定代謝経路を図に示す。

用量、投与回数および性別の違いによって生成する代謝物および代謝経路について差はないものと考えられる。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

図 ラットにおける推定代謝経路（申請者作成）

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

(3) ラットにおける代謝試験 (吸収及び分布)

(資料 No.M-03)

試験機関：チバガイギー社 (スイス国)

報告書作成年：1996年 [GLP 対応]

供試標識化合物：

標識シプロジニル

供試動物： Tif:RAIf系ラット 雌雄各 27匹

投与時体重約 200g (雄 7 週齢、雌 9 週齢)。

標識位置の設定理由：

試験方法：

試験群； 下表に示す 6 試験群を設けた。

試験群	動物数	投与量 (mg/kg)	試料採取	試験項目
E1	雌雄 3	0.5	投与 0.25、0.5、1、2、4、8、12、24 および 48 時間後	血中動態
E2	雌雄 3	100	投与 0.25、0.5、1、2、4、8、12、24 および 48 時間後	
F1	雄 12	0.5	投与 0.5、2、10.5 および 24 時間後	組織内分布
F2	雄 9	100	投与 12、19 および 30 時間後	
F3	雌 12	0.5	投与 1.0、2.5、22 および 40 時間後	
F4	雌 9	100	投与 8、40 および 72 時間	

投与方法； 供試標識化合物をポリエチレングリコール 200/エタノール/水 (2/1/1、
v/v/v) 溶液に溶解させて 0.5mg/kg (低用量)または 100mg/kg (高用量)を投与した。
高用量については、供試標識化合物を非標識化合物で希釈し、比放射能を 3.4 または
3.5 μ Ci/mg とした。また、投与時は胃ゾンデを用いて動物当たり 0.8mL の容量を単回
経口投与した。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

試料採取； 血中濃度の測定に使用した血液試料は、尾静脈より採取した。

組織内分布では、以下の臓器および組織を採取し放射能濃度を測定した。

全血、血漿、脳、肺、心臓、肝臓、脾臓、腎臓、脂肪（腹部）、甲状腺、卵巣、子宮、精巣、筋肉（骨格）、骨、および残りの体組織（カーカス）

総放射能の測定； 液体試料は直接、固体試料はサンプルオキシダイザーで燃焼または組織溶解剤で溶解した後、LSC で試料中に含まれる放射能を測定した。

試験結果：

血中動態； 表 1 に血中濃度の推移および血中パラメーター、図 1 に血中濃度の推移を示す。

低用量群 (0.5mg/kg) における T_{cmax} は、雄で 0.5 時間、雌で 1 時間であった。 C_{max} は雄で 0.08ppm、雌で 0.47ppm であった。半減期 ($t_{1/2}$) は雄で 0.5 時間、雌で 1 時間であった。0~48 時間の AUC は、雄で $0.6\mu\text{g}\cdot\text{hr/g}$ 、雌で $5.9\mu\text{g}\cdot\text{hr/g}$ となった。

高用量群 (100mg/kg) における T_{cmax} は、雄で 12 時間、雌で 8 時間であった。 C_{max} は、雄で 8.96ppm、雌で 3.49ppm であった。半減期 ($t_{1/2}$) は、雄で 7 時間、雌で 28 時間であった。0~48 時間の AUC は、雄で $147.2\mu\text{g}\cdot\text{hr/g}$ 、雌で $107.5\mu\text{g}\cdot\text{hr/g}$ であった。

低用量群雄を除いて、 T_{cmax} の前後にもう一つピークがあり（低濃度では T_{cmax} の後、高濃度では T_{cmax} の前）、また、いずれも二相性の減衰を示すことから、腸肝循環が示唆された。

表 2 に試験群 E1(低用量、血中動態試験)と試験群 F1 および F3 (低用量、組織内分布試験) において測定された血中濃度の比較を示す。

E1 群(雄)の血中濃度は、F1 群(雄)と比較して顕著な差は認められなかったが、E1 群(雌)の血中濃度は、F3 群(雌)と比較して最高で約 17 倍高かった。一方、E1 群(雄)の血中濃度は、F3 群(雌)とほぼ同じ範囲にあり、雌雄差はないものと考えられる。したがって、E1 群(雌)のみが他の群と比較して高い血中濃度を示していると考えられ、血中動態試験の低用量群でみられた血中濃度および AUC に関する雌雄差は偶発的なものと考えられる。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表 1 血中濃度および血中パラメーター

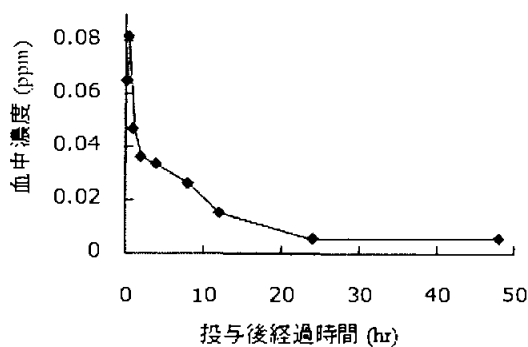
投与群		血中濃度(ppm)			
		E1 群 (0.5mg/kg、単回経口投与)		E2 群 (100mg/kg、単回経口投与)	
		雄	雌	雄	雌
投与後 の時間 (hr)	0.25	0.0652	0.1959	1.779	1.097
	0.5	0.0817	0.1926	3.095	1.963
	1	0.0471	0.4667	3.704	2.963
	2	0.0365	0.2418	3.641	2.874
	4	0.0339	0.1645	2.921	2.315
	8	0.0265	0.2525	4.349	3.485
	12	0.0156	0.2109	8.955	3.184
	24	0.0057	0.0911	1.618	2.345
	48	0.0055	0.0213	0.867	0.945
Cmax (ppm)		0.082	0.467	8.955	3.485
Tcmax (hr)		0.5	1	12	8
Tcmax _{1/2} (hr)		1	2	19	36
半減期 (hr)*		0.5	1	7	28
AUC _{0-48hr} (μg·hr/g)		0.6	5.9	147.2	107.5
AUC _{0-168hr} (μg·hr/g)		—	—	232.9	208.8

— : 測定せず

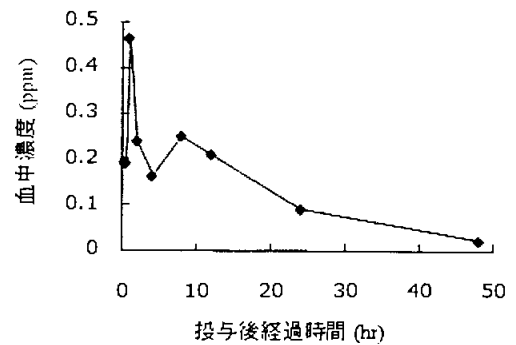
* : 申請者が算出 (半減期 ($t_{1/2}$) = Tcmax_{1/2} - Tcmax とした)

図 1. 血中濃度の推移

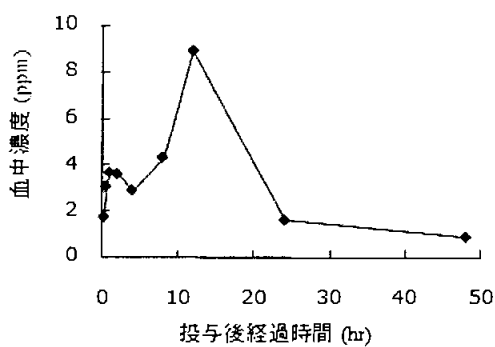
E1 群 雄 ; 低用量 (0.5mg/kg)



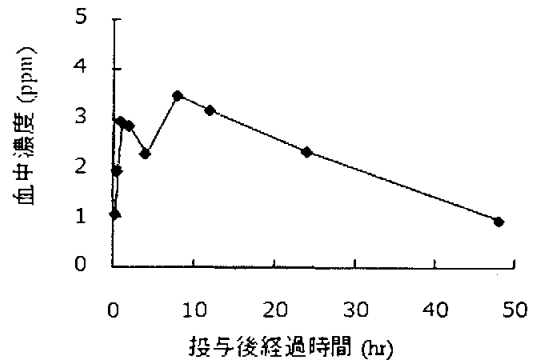
E1 群 雌 ; 低用量 (0.5mg/kg)



E2 群 雄 ; 高用量 (100mg/kg)



E2 群 雌 ; 高用量 (100mg/kg)



本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表2 血中濃度の推移（血中動態試験群と組織内分布試験群の比較）

投与後の 時間(hr)	血中濃度 (ppm)			
	E1 群 (血中動態試験)	F1 群 (組織内分布試験)	E1 群 (血中動態試験)	F3 群 (組織内分布試験)
	低用量、雄	低用量、雄	低用量、雌	低用量、雌
0.5	0.082	0.104	0.193	n.a.
1.0	0.047	n.a.	0.467	0.065
2.0	0.037	0.027	0.242	n.a.
2.5	0.036 ^{a)}	n.a.	0.225 ^{a)}	0.020
10.5	0.019 ^{a)}	0.012	0.223 ^{a)}	n.a.
22.0	0.007 ^{a)}	n.a.	0.105 ^{a)}	0.006
24.0	0.006	0.008	0.091	n.a.
40.0	0.003 ^{a)}	n.a.	0.045 ^{a)}	0.004

a) : グラフから算出 n.a. : 該当せず

組織内分布 ; 低用量群 (0.5mg/kg) における組織内分布を表3に、高用量群 (100mg/kg) における組織内分布を表4に示す。

低用量群では雌雄とも腎臓、肝臓、肺および甲状腺において他の組織と比較して放射能濃度が高く、投与 0.5 または 1 時間後における濃度は 0.163~1.978ppm であった。高用量では雌雄とも腎臓、肝臓、脂肪および甲状腺で放射能濃度が高く、投与 8 または 12 時間後における濃度は 8.604~50.958ppm であった。

組織および臓器中における放射能の半減期を表5に示す。

殆どの組織および臓器中において、二相性の一次反応に従って放射能が消失した。低用量では、第一相の半減期は 0.3~2 時間であった。第二相の半減期は 5~17 時間であった。

高用量では、雌は雄に比べて半減期が長く、第一相の半減期は雄では 4~8 時間であったのに対して、雌では 8~16 時間であった。第二相の半減期は雄で 20~103 時間、雌で 30~411 時間であった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表3 低用量群 (0.5mg/kg) における組織内分布

試験群 投与後の 時間(hr)	F1 群 (雄)				F3 群 (雌)			
	0.5	2.0	10.5	24.0	1.0	2.5	22.0	40.0
血液	0.1043 (1.18)	0.0265 (0.32)	0.0124 (0.16)	0.0781 (1.02)	0.0649 (0.74)	0.0197 (0.23)	0.0057 (0.07)	0.0043 (0.05)
骨	0.0313 (0.65)	0.0074 (0.17)	0.0037 (0.09)	0.0288 (0.69)	0.0138 (0.29)	0.0071 (0.15)	0.0033 (0.08)	<0.0012 (0.02)
脳	0.0292 (0.05)	0.0032 (<0.01)	0.0010 (<0.01)	<0.0009 (<0.01)	0.0118 (0.02)	0.0045 (<0.01)	<0.0008 (<0.01)	0.0008 (<0.01)
脂肪(腹部)	0.2080 (4.33)	0.0904 (2.04)	0.0172 (0.42)	0.0059 (0.14)	0.1018 (2.13)	0.1617 (3.43)	0.0155 (0.35)	0.0026 (0.06)
心臓	0.0698 (0.05)	0.0146 (0.01)	0.0064 (<0.01)	0.0023 (<0.01)	0.0569 (0.04)	0.0154 (0.01)	0.0024 (<0.01)	0.0018 (<0.01)
腎臓	0.4398 (0.73)	0.0871 (0.14)	0.0568 (0.10)	0.0190 (0.03)	0.4766 (0.63)	0.1759 (0.28)	0.0238 (0.04)	0.0177 (0.03)
肝臓	0.6654 (4.58)	0.1474 (1.17)	0.1030 (1.05)	0.0441 (0.51)	0.3770 (2.34)	0.1903 (1.18)	0.0466 (0.48)	0.0415 (0.38)
肺	0.9403 (1.11)	0.0326 (0.04)	0.0112 (0.02)	0.0039 (<0.01)	0.1629 (0.17)	0.0353 (0.03)	0.0040 (<0.01)	0.0021 (<0.01)
筋肉	0.0375 (3.05)	0.0068 (0.60)	0.0032 (0.30)	0.0012 (0.12)	0.0223 (1.82)	0.0075 (0.62)	0.0013 (0.12)	0.0008 (0.07)
脾臓	0.0409 (0.02)	0.0120 (<0.01)	0.0066 (<0.01)	0.0034 (<0.01)	0.0360 (0.02)	0.0159 (<0.01)	0.0043 (<0.01)	0.0033 (<0.01)
精巣	0.0343 (0.06)	0.0146 (0.02)	0.0039 (<0.01)	0.0013 (<0.01)				
卵巣								
甲状腺	1.9782 (<0.01)	0.0692 (<0.01)	<0.0567 (<0.01)	<0.0532 (<0.01)	0.1710 (<0.01)	0.0454 (<0.01)	<0.0521 (<0.01)	<0.0291 (<0.01)
子宮					0.0625 (0.01)	0.0184 (<0.01)	0.0034 (<0.01)	<0.0022 (<0.01)
組織の合計	(15.83)	(4.53)	(2.15)	(2.52)	(8.21)	(5.95)	(1.14)	(0.62)
カーカス	0.1073 (15.46)	0.0203 (2.93)	0.0289 (4.20)	0.1055 (15.52)	0.0870 (12.78)	0.0248 (3.66)	0.0183 (2.75)	0.0074 (1.04)

- ・表中の数値は放射能濃度(ppm)、括弧内は投与量に対する割合(%TAR)を示す。
- ・組織中および器官中の残留は血液、骨、筋および脂肪が体重に対しそれぞれ6%、11%、43%および11%であると仮定して計算した。ヘマトクリット値は0.4として計算した。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表4 高用量群 (100mg/kg) における組織内分布

投与群	F2 群 (雄)			F4 群 (雌)		
	12.0	19.0	30.0	8.0	40.0	72.0
投与後の時間(hr)	12.0	19.0	30.0	8.0	40.0	72.0
血液	5.153 (0.37)	1.900 (0.13)	1.087 (0.08)	5.312 (0.34)	0.982 (0.06)	0.750 (0.05)
骨	1.3983 (0.18)	0.520 (0.07)	0.241 (0.03)	1.442 (0.17)	0.236 (0.03)	0.130 (0.02)
脳	0.328 (<0.01)	0.101 (<0.01)	0.064 (<0.01)	1.355 (0.01)	0.070 (<0.01)	0.049 (<0.01)
脂肪 (腹部)	12.826 (1.69)	3.174 (0.41)	2.073 (0.29)	50.958 (5.96)	2.648 (0.30)	0.188 (0.02)
心臓	2.372 (<0.01)	0.758 (<0.01)	0.390 (<0.01)	3.517 (0.01)	0.402 (<0.01)	0.205 (<0.01)
腎臓	19.257 (0.17)	6.106 (0.05)	2.452 (0.02)	33.235 (0.29)	2.847 (0.02)	1.904 (0.02)
肝臓	24.698 (1.36)	13.113 (0.85)	7.707 (0.51)	35.452 (1.45)	7.812 (0.35)	4.154 (0.21)
肺	4.374 (0.03)	1.487 (<0.01)	0.589 (<0.01)	7.033 (0.04)	0.520 (<0.01)	0.266 (<0.01)
筋肉	0.945 (0.49)	0.342 (0.17)	0.184 (0.10)	1.437 (0.66)	0.187 (0.08)	0.084 (0.04)
脾臓	1.664 (<0.01)	0.853 (<0.01)	0.546 (<0.01)	2.625 (<0.01)	0.630 (<0.01)	0.386 (<0.01)
精巣	1.235 (0.02)	0.422 (<0.01)	0.172 (<0.01)			
卵巣						
甲状腺	11.072 (<0.01)	5.402 (<0.01)	3.053 (<0.01)	8.604 (<0.01)	1.937 (<0.01)	1.680 (<0.01)
子宮				5.024 (<0.01)	0.462 (<0.01)	0.155 (<0.01)
組織の合計	(4.32)	(1.70)	(1.03)	(8.96)	(0.84)	(0.35)
カーカス	6.035 (4.99)	3.374 (2.65)	1.578 (1.37)	7.739 (6.14)	1.544 (1.17)	0.457 (0.36)

- ・表中の数値は放射能濃度(ppm)、括弧内は投与量に対する割合(%TAR)を示す。
- ・組織中および器官中の残留は血液、骨、筋および脂肪が体重に対しそれぞれ6%、11%、43%および11%であると仮定して計算した。ヘマトクリット値は0.4として計算した。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表 5 組織および臓器中における放射能の半減期

試験群 用量 (mg/kg)	F1 群(雄)		F2 群(雄)		F3 群(雌)		F4 群(雌)	
	低用量(0.5)		高用量(100)*		低用量(0.5)		高用量(100)	
消失相	第一相	第二相	第一相	第二相	第一相	第二相	第一相	第二相
血液	0.8	7.8**	4.9	103.1	0.9	16.9	13.1	411.1
骨	0.7	8.5**	4.9	40.3	1.6	17.5	12.3	52.1
脳	0.5	5.3	4.1	63.2	1.1	n.a.	7.5	96.9
脂肪 (腹部)	1.2	5.8	3.5	20.3	n.a.	6.3 ^{a)}	7.9	29.7
心臓	0.7	8.3	4.3	49.8	0.8	12.0	10.2	72.2
腎臓	0.6	9.9	4.2	55.3	1.0	11.2	9.0	248.1
肝臓	0.7	12.5	7.7	41.1	1.5	16.9	14.7	55.8
肺	0.3	7.3	4.5	57.0	0.7	9.2	8.5	231.9
筋肉 (骨格筋)	0.6	9.0	4.8	46.3	1.0	7.7	10.9	70.1
卵巣	n.a.	n.a.	n.a.	n.a.	1.1	n.a.	7.9	64.6
血漿	0.7	7.5	3.6	25.6	0.8	10.8	8.0	39.9
脾臓	0.8	12.3	7.3	61.8	1.3	16.3	15.5	181.9
精巣	1.2	6.5	4.5	32.4	n.a.	n.a.	n.a.	n.a.
甲状腺	0.3	n.a.	6.8	62.3	0.8	n.a.	14.9	101.0
子宮	n.a.	n.a.	n.a.	n.a.	0.9	8.0	9.3	42.7

* : 資料 No.M-01 より投与 168 時間後の数値を引用して半減期を算出した。

** : 24 時間後の値を除いて、申請者が算出した。

n.a. : 計算せず

a) : 一相性一次反応に基づいて算出

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

(4) ラットにおける代謝運命 (代謝物の同定)

(資料 No.M-04)

試験機関：チバガイギー社 (スイス国)

報告書作成年：1996年 [GLP 対応]

供試標識化合物：

標識シプロジニル

標識位置の設定理由：

供試動物： Tif:RAIf系ラット (約7週齢、約200g)、1群雄3匹

方法：

投与方法； 供試標識化合物 100mg/kg をポリエチレングリコール 200/エタノール/水 (2/1/1 v/v/v) に溶解し、胃ゾンデを用いて単回経口投与した。

試料採取； 投与12時間後までの尿を採取し、投与12時間後に屠殺し、血液、肝臓および腎臓を採取した。

分析方法； 試料中の放射能については、液体試料は直接、固体試料は燃焼法により LSC で測定した。

尿中、肝臓および腎臓の抽出液中の代謝物画分を TLC、HPLC、MS および HVE により分析した。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

結 果：

投与 12 時間後の放射能分布を表 1 に示す。12 時間後までに約 17%TAR が尿中へ排泄された。肝臓および腎臓での残留量は、それぞれ 10.66ppm および 6.20ppm であった。

表 1 投与 12 時間後の残留放射能 [3 匹の平均値]

組織等	組織中濃度 (親化合物換算値)	
	ppm	%TAR
血液	1.59	0.05
肝臓	10.66	0.53
腎臓	6.20	0.05
尿	測定せず	16.96

肝臓、腎臓および尿中から検出された代謝物を表 2 に示す。

肝臓での主要代謝物は で、腎臓および尿中での主要代謝物は、

であった。代謝物 は、尿中で %TAR 検出されたが、その他の同定された代謝物は、%TAR 未満であった。

ラットにおける推定代謝経路を図 1 に示す。

シプロジニルは

によって代謝されると考えられる。その他、

への代謝も認め

られた。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

図 ラットにおける推定代謝経路

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

2. 植物体内運命試験

(1) 小麦における代謝試験

(資料 No.M-05)

試験機関：チバガイギー社（スイス国）

報告書作成年：1992年 [GLP 対応]

供試標識化合物：

標識シプロジニル

標識位置の設定理由：

試験方法：

供試作物；小麦（品種；Besso）

1990年4月26日に播種

処理方法；50%水和剤に製剤した供試標識化合物を下表の通り処理した。

	処理時期	処理量(g a.i./ha)
1回目	播種後47日（6～8葉期）	750
2回目	播種後69日（出穂期）	500

試料採取；1回目の散布1時間後、2回目の散布2時間後、2回目の散布19日後（乳熟期）および2回の散布後41日（成熟期）に生育時期に応じて茎葉、麦藁、穂、籾殻、種実に分けて植物試料を採取した。また、同じ時期に土壌試料を0～5cm、5～10cm、10～20cmおよび20～30cmの各層に分けて採取した。

分析方法；植物試料および土壌試料は、ホモジナイズ後、

抽出した。

各試料中の放射能は直接または燃焼法によりLSCで測定した。

抽出液中の代謝物画分はTLCで分析した。また、植物試料中の水溶性の代謝物画分は
の分析を行った。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

結果：各試料中の放射能分布を表1に示す。

乳熟期の茎葉、籾殻および種実における総残留放射能(TRR)はそれぞれ 5.261、4.597 および 0.097ppm であった。また、各植物部位における 58.6~76.2%TRR が抽出性放射能であった。

成熟期の麦藁、籾殻および種実における TRR は、それぞれ 14.932、6.847 および 0.107ppm であった。また、各植物部位における 49.2~60.6%TRR が抽出性放射能であった。

土壌中では、いずれの試料採取時期においても 0~5cm の表層における放射能濃度が高く、TRR は 0.525~0.808 であった。

表 1. 放射能分布

採取時期	試料	TRR (ppm)	抽出性放射能				非抽出性放射能		回収率 (%TRR)	
							%TRR	ppm		
1回目散布 1時間後	茎葉	11.864					0.8	0.095	96.4	
	土壌 0-5cm	0.391					6.3	0.025	98.6	
2回目散布 2時間後	茎葉	7.546					10.1	0.762	97.4	
	穂	3.966					1.6	0.063	91.5	
	土壌	0-5cm	0.525					33.3	0.175	100.0
		5-10cm	0.031					n.a.		—
		10-20cm	0.004					n.a.		—
		20-30cm	<0.001					n.a.		—
2回目散布 19日後 (乳熟期)	茎葉	5.261					32.8	1.726	96.4	
	籾殻	4.597					37.6	1.728	96.2	
	種実	0.097					24.4	0.024	100.6	
	土壌	0-5cm	0.596					36.8	0.219	100.5
		5-10cm	0.100					n.a.		—
		10-20cm	0.007					n.a.		—
		20-30cm	0.002					n.a.		—
2回目散布 41日後 (成熟期)	麦藁	14.932					45.2	6.749	94.4	
	籾殻	6.847					48.9	3.348	99.4	
	種実	0.107					45.3	0.048	105.9	
	土壌	0-5cm	0.808					48.2	0.389	100.3
		5-10cm	0.054					n.a.		—
		10-20cm	0.007					n.a.		—
		20-30cm	<0.001					n.a.		—

n.a. : 分析せず、— : 該当せず

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

各試料中の代謝物画分の分布を表 2-1 および 2-2 に示す。

1 回目散布 1 時間後および 2 回目散布 2 時間後の茎葉部では、親化合物[A]の割合が多く、70.2~94.3%TRR であった。

2 回目散布 19 日後(乳熟期) および 2 回目散布 41 日後(成熟期) の茎葉部、麦藁、籾殻および種実では、親化合物の割合が 4.3~16.7%TRR であった。代謝物として

が確認されたがいずれも %TRR 未満であった。麦藁における水溶性の代謝物画分は、

と考えられる。

0~5cm の土壌層では、親化合物[A]の割合が 36.2~85.5%TRR であった。代謝物として が確認されたが、 %TRR 未満であった。

表 2-1 代謝物画分の推移 (1回目散布直後、2回目散布直後および乳熟期)

試料採取時期	1回目散布1時間後			2回目散布2時間後			2回目散布19日後(乳熟期)					
	茎葉部	土壌(0~5cm)	TRR	茎葉部	土壌(0~5cm)	TRR	茎葉部	土壌(0~5cm)	TRR	穀殻	土壌(0~5cm)	TRR
TRR (ppm)	11.864	0.391		7.546	0.525		5.261		4.597		0.596	
代謝物画分	%TRR	ppm		%TRR	ppm		%TRR	ppm	%TRR	ppm	%TRR	ppm
親化合物[A]	94.3	11.188	85.5	70.2	5.297	54.6	10.7	0.563	9.4	0.432	50.2	0.299
未分離画分	1.3	0.154	1.6	9.6	0.724	3.9	17.1	0.900	15.6	0.717	3.6	0.021
非抽出性残渣	0.8	0.095	6.3	10.1	0.762	33.3	32.8	1.726	37.6	1.728	36.8	0.219
合計	96.4	11.437	94.2	95.8	7.229	100.0	93.1	4.898	96.2	4.422	100.5	0.599

n.d. : 検出されず

表 2-2. 代謝物画分の推移 (成熟期)

試料採取時期	2 回目散布 41 日後 (成熟期)							
	麦 藪		粉 殻		種 実		土 壌 (0~5cm)	
試料部位	TRR (ppm)	%TRR	ppm	%TRR	ppm	%TRR	ppm	%TRR
代謝物画分	14.932		6.847		0.107		0.808	
親化合物[Λ]	4.3		5.4		16.7		36.2	
未分離画分	12.5		13.8		18.9		3.9	
非抽出性残渣	45.2		48.9		45.3		48.2	
合計	93.0		98.2		86.7		100.3	

n.d. : 検出されず

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

(2) 小麦における代謝試験

(資料 No.M-06、07、08)

試験機関：チバガイギー社（スイス国）

報告書作成年：1994年、1995年、1996年 [GLP 対応]

供試標識化合物：

標識シプロジニル

試験方法：

試料；資料 No.M-05 で採取した成熟期の小麦および土壌試料を用いて代謝物および代謝経路をさらに検討した。

分析方法；麦藁中の放射能画分は、下図にしたがって分画した。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

各試料中の放射能は、直接または燃焼法により LSC で測定し、代謝物は TLC、NMR および MS で同定した。

結果：麦藁の抽出画分における放射能の分布を表 1 に示す。

麦藁中の抽出性放射能の割合は 78.1%TRR、非抽出性放射能の割合は 12.2%TRR であった。

表 1. 麦藁中の放射能分布

TRR (ppm)		14.932	
画 分		%TRR	濃度(ppm)
抽出性放射能			
抽出残渣 (R ₂)		12.2	1.792
総回収率		90.3	13.483

収穫期における各試料中の代謝物画分の分布を表 2 に示す。

親化合物[A]の麦藁、籾殻および種実における割合は、それぞれ 6.7%TRR、5.4%TRR および 20.4%TRR であった。代謝物として

が確認されたが、いずれも %TRR 未満であった。土壌中(0~5cm 層)では親化合物[A]が 37.6%TRR 代謝物が %TRR、が %TRR 確認された。

シプロジニルの小麦における推定代謝経路を図 1 に示す。

シプロジニルの小麦における主要な代謝経路は、

と考えられる。

その他に以下の代謝経路が想定される。

土壌中では、

が

主要な代謝経路であると考えられる。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表2 成熟期の小麦および土壌における代謝物画分の分布

試料	麦藁		籾殻		種実		土壌 (0~5cm層)	
	TRR (ppm)		6.847		0.107		0.808	
代謝物画分	%TRR	ppm	%TRR	ppm	%TRR	ppm	%TRR	ppm
親化合物[A]	6.7	1.000	5.4	0.370	20.4	0.022	37.6	0.304
¹⁴ C-デンプン ⁵⁾	n.a.	n.a.	n.a.	n.a.	15.0	0.016	n.a.	n.a.
未分離	17.5	2.613	13.8	0.945	8.8	0.009	19.5	0.158
非抽出性	12.2 ^{a)}	1.822 ^{a)}	48.8	3.341	6.3 ^{b)}	0.007 ^{b)}	7.3 ^{a)}	0.059 ^{b)}
合計	99.3	14.827	98.2	6.724	86.1	0.092	88.4	0.714

a) : 後の残渣中の放射能

b) : 後の残渣中の放射能

n.d. : 検出されず

n.a. : 分析せず

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

図 1. シプロジニルの小麦における推定代謝経路

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

(3) 小麦における代謝試験

(資料 No.M-09)

試験機関: チバガイギー社 (スイス国)

報告書作成年: 1992 年 [GLP 対応]

供試標識化合物: 標識シプロジニル

標識位置の設定理由:

試験方法:

供試作物; 小麦 (品種: Besso)

温室内試験では、土壌を詰めたポット (8cm×8cm×6.5cm) に種子 5 粒を播種し、38 日間屋外で栽培した後、温室内に移し、供試標識化合物を散布した。圃場試験では、2m×2m の区画に播種し、成熟期まで屋外で栽培した。

処理方法; 供試標識化合物を下表の通り処理した。

試験	処理回数	処理時期	処理量(g a.i./ha)
温室内試験	1 回	5~6 葉期(草丈 30~40cm)	750
圃場試験	1 回目	播種 47 日後 (6~8 葉期)	750
	2 回目	播種 69 日後 (出穂期)	500

試料採取; 下表の通り各試料を採取した。

試験	採取時期	採取試料
温室内試験	散布 1 時間後、散布 1、4、14 および 25 日後	茎葉部、根部および土壌
	散布 35 日後	麦藁、穂および土壌
圃場試験	1 回散布 1 時間後	茎葉部および土壌
	2 回散布 2 時間後 (1 回目散布 22 日後)	麦藁、穂および土壌
	2 回散布 19 日後(乳熟期、1 回目散布 41 日後)	麦藁、籾殻、子実および土壌
	2 回散布 41 日後(成熟期、1 回目散布 63 日後)	麦藁、籾殻、子実および土壌

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

分析方法； 温室内で栽培した小麦は地上部と根部に分け、地上部は
洗淨液をプールした。洗淨後の植物試料を
抽出した。根部は洗淨して土壤を除去
し、液体窒素で凍結粉碎した。小麦の収穫後にポットから採取した土壤
試料は
抽出した。
圃場で栽培した小麦は生育時期に応じて茎葉、麦藁、穂、籾殻、種実に分け、
抽出した。圃場から採取し
た土壤試料は、0～5cm、5～10cm、10～20cm および 20～30cm の層に分
けて温室内で採取した土壤と同様に抽出した。
各試料中の放射能は、直接または燃焼法により LSC で測定した。
代謝物は TLC で分析した。

結果： 温室内栽培の小麦および土壤における放射能分布を表 1 に示す。

小麦における茎葉または麦藁の総残留放射能 (TRR) は、2.353～11.394ppm であ
った。抽出性放射能の割合は、90.6～100.0%TRR であった。放射能は主に植物表
面に分布しており、その割合は 51.1～97.5%TRR であった。また、非抽出性放射能
の割合は 0～9.5%TRR であった。

穂における TRR は、0.059ppm で、抽出性放射能の割合は 75.4%TRR、非抽出性放
射能の割合は 24.6%TRR であった。

土壤における TRR は 0.122～0.160ppm、抽出性放射能の割合は 45.8～99.4%TRR
であった。非抽出性放射能の割合は時間の経過とともに増加し、0.6～64.2%TRR
であった。

圃場栽培の小麦および土壤における放射能の分布を表 2 に示す。

小麦における茎葉または麦藁の TRR は、4.475～14.910ppm であった。また、籾
殻における TRR は 8.245～9.138ppm であった。種実における TRR は、茎葉、麦
藁および籾殻と比較して低く、0.160～0.220ppm であった。

茎葉または麦藁における抽出性放射能の割合は、46.9～93.6%TRR であった。
非抽出性放射能の割合は時間の経過とともに増加し、その割合は 0.4～47.6%TRR
であった。籾殻における抽出性放射能の割合は、45.8～56.1%TRR、非抽出性放射
能の割合は 35.6～47.7%TRR であった。また、種実における抽出性放射能の割合は、
39.8～55.3%TRR、非抽出性放射能の割合は 34.4～57.8%TRR であった。

土壤中では 0～5cm 層の TRR は 0.367～0.787ppm であった。抽出性放射能の割合
は 33.0～66.5%TRR、非抽出性放射能の割合は、28.9～62.6%TRR であった。5～
10cm の土壤層における TRR は、0.018～0.075ppm であった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

圃場栽培の小麦における代謝物画分の推移を表 3 に、土壌における代謝物画分の推移を表 4 に示す。

生育初期の植物では、親化合物[A]の割合は 77.2～91.7%TRR であったが、成熟期あるいは乳熟期には、親化合物[A]の割合が徐々に減少し、その割合は 4.4～12.7%TRR であった。代謝物として

が検出されたが、いずれも %TRR 未満であった。

圃場の土壌中(0～5cm 層)においても主に親化合物[A]が検出され、その割合は 24.7～83.5%TRR であった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表 1. 放射能分布 (温室内試験)

採取時期	試料	TRR (ppm)		抽出性放射能			非抽出放射能	回収率 (%TRR)	
				表面残留放射能	組織内放射能				抽出性放射能の合計
散布 1 時間後	茎葉	9.967	%TRR	97.5			100.0	100.0	
			ppm	9.718			9.967		0
	根部	0.186	%TRR	n.a.			n.a.	-	
			ppm	n.a.			n.a.		n.a.
	土壌	0.160	%TRR	-			99.4	100.0	
			ppm	-			0.159		0.001
散布 1 日後	茎葉	7.945	%TRR	91.2			99.7	99.9	
			ppm	7.246			7.921		0.016
	根部	0.064	%TRR	n.a.			n.a.	-	
			ppm	n.a.			n.a.		n.a.
	土壌	0.148	%TRR	-			98.1	100.0	
			ppm	-			0.145		0.003
散布 4 日後	茎葉	11.394	%TRR	87.2			99.7	100.2	
			ppm	9.936			11.360		0.057
	根部	0.121	%TRR	n.a.			n.a.	-	
			ppm	n.a.			n.a.		n.a.
	土壌	0.125	%TRR	-			91.7	100.1	
			ppm	-			0.115		0.011
散布 14 日後	茎葉	4.775	%TRR	75.9			97.6	100.1	
			ppm	3.624			4.660		0.119
	根部	0.277	%TRR	n.a.			n.a.	-	
			ppm	n.a.			n.a.		n.a.
	散布 25 日後	茎葉	2.353	%TRR	54.1			94.6	100.1
				ppm	1.273			2.226	
根部		1.033	%TRR	n.a.			n.a.	-	
			ppm	n.a.			n.a.		n.a.
土壌		0.155	%TRR	-			59.7	100.0	
			ppm	-			0.093		0.062
散布 35 日後	麦藁	2.471	%TRR	51.1			90.6	100.1	
			ppm	1.263			2.239		0.235
	穂	0.059	%TRR	n.a.			75.4	100.0	
			ppm	n.a.			0.044		0.015
	根部	0.600	%TRR	n.a.			n.a.	-	
			ppm	n.a.			n.a.		n.a.
	土壌	0.122	%TRR	-			45.8	100.0	
			ppm	-			0.056		0.078

- : 該当せず、n.a. : 分析せず

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表 2. 放射能分布 (圃場試験)

採取時期	試料	TRR (ppm)	抽出性放射能			非抽出放射能	回収率 (%TRR)
			%TRR	抽出性放射能の合計			
1回散布 1時間後	茎葉	6.745	%TRR		93.6	0.4	94.0
			ppm		6.313	0.027	
	土壌 (0~5cm)	0.297	%TRR		91.3	6.3	97.6
			ppm		0.271	0.019	
2回散布 2時間後	麦藁	9.138	%TRR		89.8	6.1	95.9
			ppm		8.206	0.557	
	穂	4.548	%TRR		107.3	1.8	109.1
			ppm		4.880	0.082	
	土壌 (0~5cm)	0.463	%TRR		66.4	28.9	95.3
			ppm		0.307	0.134	
	土壌 (5~10cm)	0.018	n.a.				—
	土壌 (10~20cm)	0.003	n.a.				—
土壌 (20~30cm)	<0.001	n.a.				—	
2回散布 19日後 (乳熟期)	麦藁	4.475	%TRR		62.1	35.5	97.6
			ppm		2.779	1.589	
	籾殻	9.138	%TRR		56.1	35.6	91.7
			ppm		5.126	3.253	
	種実	0.160	%TRR		55.3	34.4	89.7
			ppm		0.088	0.055	
	土壌 (0~5cm)	0.787	%TRR		66.5	31.5	98.0
			ppm		0.523	0.248	
土壌 (5~10cm)	0.074	n.a.				—	
土壌 (10~20cm)	0.010	n.a.				—	
土壌 (20~30cm)	0.006	n.a.				—	
2回散布 41日後 (成熟期)	麦藁	14.910	%TRR		46.9	47.6	94.5
			ppm		6.993	7.097	
	籾殻	8.245	%TRR		45.8	47.7	93.5
			ppm		3.776	3.933	
	種実	0.220	%TRR		39.8	57.8	97.6
			ppm		0.088	0.127	
	土壌 (0~5cm)	0.367	%TRR		33.0	62.6	95.6
			ppm		0.121	0.230	
土壌 (5~10cm)	0.075	n.a.				—	
土壌 (10~20cm)	0.005	n.a.				—	
土壌 (20~30cm)	<0.001	n.a.				—	

— : 該当せず、n.a. : 分析せず

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表 3. 小麦における代謝物の推移（圃場試験）

採取時期		1 回散布	2 回散布					
		1 時間後	2 時間後	19 日後(乳熟期)		41 日後(成熟期)		
試料		茎 葉	麦 藁	麦 藁	籾 殻	麦 藁	籾 殻	種 実
TRR (ppm)		6.745	9.138	4.475	9.138	14.910	8.245	0.220
親化合物[A]	%TRR	91.7	77.2	12.7	10.2	4.4	5.8	10.0
	ppm	6.185	7.055	0.568	0.932	0.656	0.478	0.022
未分離画分	%TRR	0.9	5.0	13.4	19.9	7.0	16.7	n.a.
	ppm	0.061	0.457	0.600	1.818	1.044	1.377	n.a.
非抽出性画分	%TRR	0.4	6.1	35.4	35.6	47.6	47.7	57.8
	ppm	0.027	0.557	1.584	3.253	7.097	3.933	0.127
回収率	%TRR	93.0	93.4	93.8	91.8	90.8	93.5	67.8

n.d. : 検出されず、n.a. : 分析せず、

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表 4. 土壌中 (0~5cm 層) における代謝物の推移 (圃場試験)

採取時期		1 回目散布		2 回目散布		
		1 時間後	22 日後	19 日後 (乳熟期)	41 日後 (成熟期)	
TRR (ppm)		0.297	0.463	0.787	0.367	
(親化合物[A])	%TRR	83.5	56.5	55.2	24.7	
	ppm	0.248	0.262	0.434	0.091	
未分離画分	%TRR	3.3	4.4	4.8	1.8	
	ppm	0.010	0.020	0.038	0.007	
非抽出残渣	%TRR	6.3	28.9	31.5	62.6	
	ppm	0.019	0.134	0.248	0.230	
回収率		%TRR	93.1	89.8	91.5	90.9

n.d. : 検出せず

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

(4) トマトにおける代謝試験

(資料 No.M-10)

試験機関：チバガイギー社（スイス国）

報告書作成年：1992年〔GLP 対応〕

供試標識化合物：

標識シプロジニル

標識位置の設定理由：

試験方法：

供試作物；トマト（品種：Roter Gnom）

土壌を詰めた容器(47×30×25cm) 3 個に播種 2 週間後のトマト苗を容器当り 1 本移植し温室で栽培した。

処理方法；水和剤に調製した供試標識化合物を、果実の直径が約 2cm (播種後 10.5 週) に成長した時点で、1 回散布し、さらに 28 日後に 2 回目の散布を行った。供試標識化合物の 1 回当たりの処理量は 1.125kg a.i./ha で、2 回の総処理量は 2.25kg a.i./ha であった。

試料採取；下表に示す。

採取時期	採取試料
1 回目散布 1 時間後	葉および果実
1 回目散布 28 日後	葉
2 回目散布 1 時間後	葉および果実
2 回散布 14 日後 (成熟時)	茎葉部および果実

分析方法；葉および果実の表面は、
茎葉を

洗浄し、洗浄後の葉、果実および非洗浄の
抽出した。

各洗浄液または抽出液中の放射能は
直接、抽出残渣中の放射能は燃焼法により、LSC で測定した。代謝物の同定は TLC、
HPLC または NMR および MS を用いて行った。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

結果：トマトにおける放射能分布の推移を表1に示す。

抽出性放射能の割合はいずれの採取時期においても高く、94.6～101.7%TRRであった。

抽出性放射能は散布直後には主に葉または果実の表面に分布しており、時間の経過とともに組織内放射能の割合が増加した。

一方、非抽出性放射能の割合は、0～6.3%TRRであった。

表1. 放射能分布

採取時期	試料	TRR (ppm)	抽出性放射能				非抽出性放射能	回収率 (%TRR)
			表面残留放射能*	組織内放射能		抽出性放射能の合計		
1回目散布 1時間後	葉	400.074	%TRR	67.2		99.9	0.1	100.0
			ppm	268.850		399.674	0.400	
	果実	19.999	%TRR	87.5		100	n.d.	100.0
			ppm	17.499		19.999	n.d.	
1回目散布 28日後	葉	143.234	%TRR	32.7		94.6	5.4	100.0
			ppm	46.838		135.5	7.735	
2回目散布 1時間後	葉	307.413	%TRR	63.8		100	n.a.	100.0
			ppm	196.129		307.413	n.a.	
	果実	14.233	%TRR	48.3		98.5	1.5	100.0
			ppm	6.875		14.02	0.213	
2回目散布 14日後 (成熟期)	茎葉	72.734	%TRR	n.d.		101.7	6.3	108.0
			ppm	n.d.		73.971	4.582	
	果実	5.017	%TRR	19.6		100.3	3.3	103.6
			ppm	0.983		5.032	0.166	

n.a. : 分析せず、n.d. : 検出されず

代謝物画分の分布を表2に、成熟期における代謝物画分 のセルラーゼ分解後の代謝物画分の分布を表3に示す。

セルラーゼ加水分解前の分析において、親化合物[A]の他に が同定された。いずれの試料においても親化合物[A]の割合が高く、60.8～96.7%TRRであった。一方、 の割合は、 %TRRであった。成熟期の茎葉および果実の試料から得られた代謝物画分 を含む水相をセルラーゼで加水分解したところ、代謝物 が同定された。配糖体も含めて は成熟期の茎葉で %TRR、果実で %TRRであった。 の配糖体の割合は %TRRであった。

トマトにおけるシプロジニルの推定代謝経路を図1に示す。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表 2. 代謝物画分の分布

採取時期	1 回目散布			2 回目散布				
	1 時間後		28 日後	1 時間後		14 日後 (成熟期)		
試料	葉	果実	葉	葉	果実	茎葉	果実	
TRR (ppm)	400.074	19.999	143.234	307.413	14.233	72.734	5.017	
親化合物[A]	%TRR	96.2	96.7	60.8	86.1	90.1	71.1	63.2
	ppm	384.871	19.339	87.086	264.683	12.824	51.714	3.171
未分離	%TRR	3.6	3.4	18.5	8.1	5.7	8.8	18.3
	ppm	14.403	0.680	26.498	24.900	0.811	6.401	0.918
非抽出性残渣	%TRR	0.1	n.d.	5.4	n.a.	1.5	6.3	3.3
	ppm	0.400	n.d.	7.735	n.a.	0.213	4.582	0.166
合計	%TRR	99.9	100.1	100.1	100.1	100.2	107.8	103.8

n.d. : 検出されず、n.a. : 分析せず

表 3. 成熟期の代謝物画分

分解後の代謝物画分の分布

採取時期	2 回目散布 14 日後 (成熟期)	
	茎 葉	果 実
試 料		

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

図 1. トマトにおける推定代謝経路

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

(5) トマトにおける代謝試験

(資料 No.M-11)

試験機関：チバガイギー社（スイス国）

報告書作成年：1992年 [GLP 対応]

供試標識化合物： 標識シプロジニル

標識位置の設定理由：

試験方法：

供試作物；トマト（品種：Roter Gnom）

土壌を詰めた容器(47×30×25cm) 3 個に播種 2 週間後のトマト苗を容器当り 1 本移植し温室で栽培した。

処理方法；水和剤に調製した供試標識化合物を、果実の直径が約 2cm（播種後 10.5 週）に成長した時点で、1 回散布し、さらに 28 日後に 2 回目の散布を行った。供試標識化合物の 1 回当たりの処理量は 1.125kg a.i./ha で、2 回の総処理量は 2.25kg a.i./ha であった。

試料採取；下表に示す。

採取時期	採取試料
1 回目散布 1 時間後	葉および果実
1 回目散布 28 日後	葉
2 回目散布 1 時間後	葉および果実
2 回散布 14 日後（成熟時）	茎葉部および果実

分析方法；葉および果実の表面は、
の茎葉をそれぞれ

洗浄し、洗浄後の葉、果実および非洗浄
抽出した。

各洗浄液または抽出液中の放射能は直接、抽出残渣中の放射能は燃焼法により、LSC で測定した。代謝物の同定は TLC を用いて行った。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

結果：トマトにおける放射能分布を表1に示す。

抽出性放射能の割合はいずれの採取時期においても高く、92.3～100.0%TRRであった。
抽出性放射能は散布直後には主に葉または果実の表面に分布しており、時間の経過とともに組織内放射能の割合が増加した。

一方、非抽出性放射能の割合は0～7.8%TRRであった。

表1. 放射能分布

採取時期	試料	TRR (ppm)	抽出性放射能			非抽出性放射能	回収率 (%TRR)
			表面残留放射能*	組織内放射能	抽出性放射能の合計		
1回目散布 1時間後	葉	315.977	%TRR	70.2		99.9	100.0
			ppm	221.816		315.661	
	果実	19.755	%TRR	73.9		100.0	100.0
			ppm	14.599		19.755	
1回目散布 28日後	葉	149.996	%TRR	30.6		92.3	100.1
			ppm	45.899		138.447	
2回目散布 1時間後	葉	395.394	%TRR	66.4		98.5	100.0
			ppm	262.542		389.464	
	果実	11.164	%TRR	55.2		98.6	100.0
			ppm	6.163		11.008	
2回目散布 14日後 (成熟期)	茎葉	112.376	%TRR	n.d.		93.5	99.5
			ppm	n.d.		105.071	
	果実	6.698	%TRR	19.9		98.6	102.8
			ppm	1.333		6.604	

*：アセトン/水 (1/1) で表面洗浄し、洗浄液中の放射能を測定

n.a.：分析せず、n.d.：検出されず

トマトにおける代謝物画分を表2に示す。

いずれの試料においても親化合物[A]の割合が高く、62.5～96.2%TRRであった。

その他に代謝物が同定されたが、その割合は %TRR であった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表2 代謝物画分の推移

採取時期	1回目散布			2回目散布				
	1時間後		28日後	1時間後		14日後(成熟期)		
試料	葉	果実	葉	葉	果実	葉	果実	
TRR (ppm)	315.977	19.755	149.996	395.394	11.164	112.376	6.698	
親化合物[A]	%TRR	96.2	94.8	62.9	87.0	87.2	65.5	62.5
	ppm	303.970	18.728	94.347	343.993	9.735	73.606	4.186
未分離画分	%TRR	3.6	5.1	15.5	6.7	5.6	13.4	13.3
	ppm	11.375	1.008	23.249	26.491	0.625	15.058	0.891
非抽出性残渣	%TRR	0.0	0.0	7.8	1.5	1.4	6.0	4.2
	ppm	0.000	0.000	11.700	5.931	0.156	6.743	0.281
合計	%TRR	99.9	100.0	100.1	100.1	100.0	99.3	102.2

n.d. : 検出されず、 n.a. : 分析せず

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

(6) りんごにおける代謝試験

(資料 No.M-12、13、14)

試験機関：チバガイギー社（スイス国）

報告書作成年：1993年、1994年、1996年[GLP対応]

供試標識化合物： 標識シプロジニル

標識位置の設定理由：

試験方法：

供試植物；りんご（品種：ゴールドデンデリシャス）、樹齢 約 5 年

処理方法； 供試標識化合物を水和剤に調製し、屋外のりんごに 75mg a.i./樹（50g a.i./100L の散布液を 1 樹当り 150mL）の薬量で 3 回葉面散布した。 散布間隔は 1 回目の散布約 8 週後に 2 回目の散布、2 回目の散布約 5 週後に第 3 回目の散布を行った。

試料採取；下表の通り採取した。

採取回数	採取時期	採取試料
1	1 回目散布 2 時間後	葉 (5 枚/樹)
2	2 回目散布 1 時間後	葉 (5 枚/樹)
3	3 回目散布 1 時間後	葉 (5 枚/樹)
4	3 回目散布 61 日後 (成熟期)	全葉、全果実

分析方法；1～3 回目の採取時に収穫した葉、および成熟期に収穫した果実については、表面を洗浄し、洗浄液中の放射能を測定した。成熟期に収穫した葉については

抽出し、

残渣中の放射能を非抽出性放射能とした。

また、 洗浄した後の果実については、果皮と果肉に分けてそれぞれ

抽出し、

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

抽出後の残渣中の放射能を非抽出性放射能とした。

なお、果皮の抽出残渣について、

植物組織中への放射能の取込

みを検討した。

各抽出液中の放射能については直接 LSC で、抽出残渣中の放射能については、燃焼法により LSC で測定した。

結果：試料中の放射能分布を表 1 に示す。

1～3 回目に採取した葉における TRR は、129.629～158.122ppm で、68.7～92.5%TRR が葉の表面に分布していた。

成熟期に採取した果皮、果肉、全果実および葉における TRR は、それぞれ 3.461、0.173、0.798 および 49.324ppm であった。

果皮、果肉、全果実および葉における非抽出性放射能の割合は、それぞれ 46.4、11.0、38.9 および 22.6% TRR であった。

表 1. 試料中の放射能分布

採取時期	試料	TRR (ppm)	抽出性放射能				非抽出性放射能	総回収率 (%TRR)
			表面残留放射能			抽出性放射能合計		
1 回散布 2 時間後	葉	158.122	%TRR	92.5		92.5	n.a.	92.5
			ppm	146.263		146.263	n.a.	
2 回散布 1 時間後	葉	129.629	%TRR	86.3		86.3	n.a.	86.3
			ppm	111.870		111.870	n.a.	
3 回散布 1 時間後	葉	138.629	%TRR	68.7		68.7	n.a.	68.7
			ppm	95.238		95.238	n.a.	
3 回散布 61 日後 (成熟期)	果皮	3.461	%TRR	n.a.		45.7	46.4	92.1
			ppm	n.a.		1.582	1.606	
	果肉	0.173	%TRR	n.a.		84.3	11.0	95.3
			ppm	n.a.		0.146	0.019	
	全果実	0.798	%TRR	2.7		54.0	38.9	92.9
			ppm	0.022		0.431	0.310	
	葉	49.324	%TRR	n.a.		72.6	22.6	95.2
			ppm	n.a.		35.809	11.147	

n.a.: 分析せず、*: メタノールで抽出

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

代謝物画分の推移を表 2 に示す。

各試料中の主要な画分は遊離体の親化合物 [A] でその割合は、9.7～12.1%TRR であった。また、親化合物 [A] の配糖体([A-2]) が %TRR 検出された。

代謝物として が同定され

たが、いずれも %TRR 未満であった。

果皮における抽出残渣の分画結果を表 3 に示す。

抽出した後も %TRR が抽出されなかった。

表 2. 成熟期のりんごにおける代謝物画分

採取時期	成熟期 (最終散布 61 日後)							
試料	葉		果皮		果肉		果実全体*	
TRR (ppm)	49.324		3.461		0.173		0.798	
画分	%TRR	ppm	%TRR	ppm	%TRR	ppm	%TRR	ppm
親化合物[A]	12.1	5.968	9.7	0.336	11.2	0.019	11.0	0.088
未分離画分	15.7	7.744	7.8	0.270	23.8	0.041	10.4	0.083
非抽出性残渣	22.6	11.147	46.4	1.606	11.0	0.019	38.9	0.310
合計	94.6	46.661	91.9	3.181	91.0	0.157	90.6	0.723

n.d. : 検出されず * : 果実表面における親化合物を含む

表 3. 成熟期のりんご果皮の抽出残渣中における放射能画分

画分	%TRR	ppm
最終抽出残渣	53.6	1.855
親化合物 [A]	1.6	0.055

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

りんごにおける推定代謝経路を図1に示す。

りんごにおける主要代謝経路は以下の通り推定された。

図 1.りんごにおける推定代謝経路

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

(7) ばれいしょにおける代謝試験

(資料 No. M-15)

試験機関：チバガイギー社 (スイス国)

報告書作成年：1996年 [GLP 対応]

供試標識化合物：

標識シプロジニル

標識位置の設定理由：

供試植物：ばれいしょ (品種名: Bintje)

2 個の容器 (1200×80×80cm) に土壌を充填し、1994 年 4 月 12 日に各容器に 2 列
3 個ずつ、合計 12 個の種いもを植付け、温室内で栽培した。

試験方法：

処理方法；供試化合物を水和剤に調製後、水で希釈して 1 回当たり 560g a.i./ha、合計 3 回散布した。1 回目の処理は 5 月 26 日 (植付けから 45 日後)、2 回目は 6 月 14 日 (1 回目処理から 9 日後)、3 回目は 7 月 4 日 (2 回目処理から 20 日後) とした。

試料採取；1 回目および 3 回目の処理後に各植物について 5 枚の葉を採取した。

3 回目の処理後に各植物について 2 個の塊茎を採取した。成熟期 (7 月 18 日、
3 回目処理 14 日後) に残りの茎葉および塊茎を収穫した。

3 回目の処理後(7月4日) および成熟期 (7月18日) に 0~20 cm および 20~30cm
の土壌層から土壌試料を採取した。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

分析方法；葉、茎葉および塊茎の各試料を液体窒素下でホモジナイズし、試料の一部を燃焼させて LSC により各試料中の総残留放射能 (TRR) を測定した。

ホモジナイズした葉、茎葉および塊茎の各試料の一部について
放射能を LSC で測定し、TLC で代謝物を分析した。

成熟期の塊茎 (皮および皮を除いた部位) の抽出残渣の一部については

放射能を LSC で測定した。

土壌試料については風乾後、ホモジナイズして一部を燃焼後 LSC で TRR を測定した。また、0~20cm の層から採取した土壌試料について、
抽出液中の放射能を LSC で測定し、代謝物を TLC で分析した。

結 果：

放射能分布；1 回目の処理後、3 回目の処理後および成熟期 における各試料中の放射能分布を表 1 に示す。

葉または茎葉における TRR は 25.939~64.588ppm であった。いずれの採取時期においても抽出性放射能の割合が高く、抽出された放射能の割合は %TRR であった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

塊茎における TRR は葉および茎葉と比較して低く、0.045～0.093ppm であった。

抽出された放射能の割合は %TRR であった。

非抽出性放射能の割合は茎葉と比較して高く、27.4～32.9%TRR であった。

土壌中における TRR は 0～20cm 層で 0.329～0.886ppm、20～30cm 層では 0.031

～0.080ppm であった。 0～20cm 層の土壌試料について

抽

出された放射能の割合は %TRR、非抽出性放射能の割合は、29.1～

48.0%TRR であった。

成熟期の塊茎(皮および皮を除く部位) の抽出残渣

の放射能分布を表 2 に示す。

蛋白画分には、0.8～5.4%TRR、澱粉画分には、5.3～14.6%TRR の放射能分布が認められた。

表 1 放射能分布

採取時期	試料	TRR (ppm)*	抽出性放射能				非抽出性放射能		回収率 (%TRR)
							%TRR	ppm	
1回目 処理の 1時間後	葉	27.158					0.2	0.054	95.7
3回目 処理の 1時間後	葉	64.588					4.0	2.584	112.1
	塊茎(全体)	0.045					27.4	0.012	108.5
	土壌(0～20cm)	0.329					29.1	0.096	105.3
	土壌(20～30cm)	0.080	n.a.						
成熟期	茎葉	25.939				1.271	9.8	2.542	100.6
	塊茎(皮)	0.093				0.008	31.2	0.029	90.3
	塊茎(皮を除く)	0.065				0.001	32.9	0.021	104.0
	土壌(0～20cm)	0.886				0.021	48.0	0.425	92.1
	土壌(20～30cm)	0.031	n.a.						

*: 親化合物換算値、

n.a.: 分析せず

表 2 塊茎の抽出残渣における加水分解後の放射能分布

採取時期	試料	抽出残渣 ¹⁾	%TRR				抽出残渣 ²⁾
			沈殿(蛋白画分)		上澄み液		
					沈殿(グルコサゾン)	上澄み液	
成熟期	塊茎(皮)	31.2	5.4	2.6	5.3	4.9	12.8
	塊茎(皮を除く)	32.9	0.8	1.5	14.6	8.5	2.3

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

各採取時期の葉、茎葉、塊茎および土壌試料中の代謝物画分の推移を表 3-1 および表 3-2 に示す。

葉または茎葉における主要な画分は、親化合物[A]であり、42.3～92.3%TRR であった。代謝物として

が検出された。これらの中で、
%TRR 検出されたが、その他は、いずれも %TRR 未満であった。

3 回目処理 1 時間後に採取した未成熟の塊茎では、親化合物 [A]と未同定画分 との混合物が %TRR 検出された。代謝物として

が検出された。これらの中で、
%TRR (ppm) 検出された。また、
の混合物が %TRR (ppm) 検出された。その他は、いずれも %TRR 未満であった。

成熟期の塊茎(皮) では、親化合物[A]は検出されなかった。代謝物として

が検出されたが、いずれも %TRR 未満であった。
成熟期の塊茎(皮を除く) においても親化合物[A]は検出されなかった。代謝物として
が検出された。これらの中で、
代謝物 が %TRR (ppm) 検出されたが、その他は、いずれも %TRR 未満であった。

土壌中(0～20cm 層)では、親化合物[A]の割合が 32.9～62.4%TRR であった。

代謝物として が検出され、その割合は %TRR であった。

推定代謝経路を図 1 に示す。

同定された代謝物から以下の代謝経路が推定された。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表 3-1 代謝物画分の推移 (1 および 3 回処理後)

試料採取時期	1 回目処理 1 時間後		3 回目処理 1 時間後					
	葉 部		葉 部		塊 茎		土 壌 (0~20cm)	
TRR (ppm)	27.158		64.588		0.045		0.329	
代謝物画分	%TRR	ppm	%TRR	ppm	%TRR	ppm	%TRR	ppm
親化合物[A]	92.3	25.067	83.6	53.996	2.8	0.001	62.4	0.205
未分離画分	0.7	0.190	4.4	2.842	7.3	0.003	1.5	0.005
非抽出性残渣	0.2	0.054	4.0	2.584	27.4	0.012	29.1	0.096
合計	95.7	26.017	112.1	72.403	108.3	0.049	105.3	0.346

n.d. : 検出されず

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表 3-2 代謝物画分の推移 (成熟期)

試料採取時期	成熟期 (3回目処理 14日後)							
	茎葉部		塊茎 (皮)		塊茎 (皮を除く)		土壌 (0~20cm)	
試料部位	25.939		0.093		0.065		0.886	
TRR (ppm)	25.939		0.093		0.065		0.886	
代謝物画分	%TRR	ppm	%TRR	ppm	%TRR	ppm	%TRR	ppm
親化合物[A]	42.3	10.972	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	32.9	0.291
未分離画分	6.9	1.790	2.5	0.002	4.8	0.003	2.8	0.025
非抽出性残渣	9.8	2.542	31.2	0.029	32.9	0.021	48.0	0.425
合計	99.9	25.913	90.3	0.084	104.1	0.068	92.1	0.816

n.d. : 検出されず

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

図 1. シプロジニルのばれいしょにおける推定代謝経路

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

(8) ばれいしょにおける代謝試験

(資料 No. M-16)

試験機関：チバガイギー社 (スイス国)

報告書作成年：1996年 [GLP 対応]

供試標識化合物： 標識シプロジニル

標識位置の設定理由：

供試植物：ばれいしょ (品種名: Bintje)

2 個の容器 (1200×80×80cm) に土壌を充填し、1994 年 4 月 12 日に各容器に 2 列、3 個ずつ、合計 12 個の種いもを植付け、温室内で栽培した。

試験方法：

処理方法；供試化合物を水和剤に調製後、水で希釈して 1 回当たり 560g a.i./ha として合計 3 回散布した。1 回目の処理は 5 月 26 日 (植付けから 45 日後)、2 回目は 6 月 14 日 (1 回目処理から 9 日後)、3 回目は 7 月 4 日 (2 回目処理から 20 日後) に処理した。

試料採取；1 回目および 3 回目の処理後に各植物について 5 枚の葉を採取した。

3 回目の処理後に各植物について 2 個の塊茎を採取した。成熟期 (7 月 18 日、3 回目処理 14 日後) に残りの茎葉および塊茎を収穫した。3 回目の処理後 (7 月 4 日) および成熟期 (7 月 18 日) に 0~20 cm および 20~30cm の土壌層から土壌試料を採取した。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

分析方法；葉、茎葉および塊茎の各試料を液体窒素下でホモジナイズし、試料の一部を燃焼させて LSC により各試料中の総残留放射能 (TRR) を測定した。

ホモジナイズした葉、茎葉および塊茎の各試料の一部について
抽出後、抽出液中の放射能を LSC で測定し、TLC で代謝物を分析した。

成熟期の塊茎 (皮および皮を除いた部位) の抽出残渣の一部については

放射能を LSC で測定した。

土壌試料については風乾後、ホモジナイズして一部を燃焼後 LSC で TRR を測定した。また、0~20cm の層から採取した土壌試料について、

抽出後、抽出液中の放射能を LSC で測定し、代謝物を TLC で分析した。

結 果：

放射能分布；1 回目の処理後、3 回目の処理後および(成熟期における各試料中の放射能分布を表 1 に示す。

葉または茎葉における TRR は 23.785~26.162ppm であった。いずれの採取時期においても抽出性放射能の割合が高く、抽出された放射能の割合は %TRR であった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

塊茎における TRR は葉および茎葉と比較して低く、0.057~0.092ppm であった。

抽出された放射能の割合は %TRR であった。また、非抽出性放射能の割合は 46.3~56.9%TRR であった。

土壌中における TRR は 0~20cm 層で 0.319~0.672ppm、20~30cm 層では 0.004~0.011ppm であった。0~20cm 層の土壌試料について、抽出された放射能の割合は %TRR、非抽出性放射能の割合は、37.0~52.0%TRR であった。

成熟期の塊茎(皮および皮を除く部位) の

放射能分布を表 2 に示す。

蛋白画分に 2.4~11.3%TRR、澱粉画分に 11.9~26.5%TRR の放射能分布が認められた。

表 1 放射能分布

採取時期	試料	TRR (ppm)*	抽出性放射能				非抽出性放射能		回収率 (%TRR)
							%TRR	ppm	
1回目 処理の 1時間後	葉	23.785					0.2	0.048	106.6
3回目 処理の 1時間後	葉	26.162					4.1	1.073	102.8
	塊茎(全体)	0.057					46.3	0.026	108.0
	土壌(0~20cm)	0.319					37.0	0.118	114.2
	土壌(20~30cm)	0.004	n.a.						
成熟期	茎葉	24.724					9.7	2.398	107.5
	塊茎(皮)	0.092					48.2	0.044	93.4
	塊茎(皮を除く)	0.091					56.9	0.052	96.2
	土壌(0~20cm)	0.672					52.0	0.349	105.7
	土壌(20~30cm)	0.011	n.a.						

*: 親化合物換算値

n.a.: 分析せず

表 2 塊茎の抽出残渣における加水分解後の放射能分布

採取時期	試料	抽出残渣 ¹⁾	%TRR				抽出残渣 ²⁾
			沈殿(蛋白画分)		上澄み液		
					沈殿(グルコサゾン)	上澄み液	
成熟期	塊茎(皮)	48.2	11.3	2.4	11.9	3.1	19.7
	塊茎(皮を除く)	56.9	2.4	1.8	26.5	12.6	3.0

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

各採取時期の葉、茎葉、塊茎および土壌試料中の代謝物画分の推移を表 3-1 および表 3-2 に示す。

葉または茎葉における主要な画分は、親化合物[A]であり、48.0~103.0%TRR であった。代謝物として

が検出された。これらの中で は との
含量として %TRR 検出されたが、その他の代謝物は、いずれも %TRR 未満であった。

3 回目処理の 1 時間後に採取した未成熟の塊茎では、親化合物[A]の割合が 20.1%TRR であった。代謝物として

が検出された。代謝物 および未同定画分 の混合物が
%TRR (ppm) が検出された。その他の代謝物は、いずれも %TRR 未満であった。

成熟期の塊茎(皮)では、親化合物[A]は検出されなかった。代謝物 と
の混合物が %TRR(ppm) 検出された。その他に が検出さ
れたが、いずれも %TRR 未満であった。

成熟期の塊茎(皮を除く)においても親化合物[A]は検出されなかった。代謝物として
が検出されたが、いずれも %TRR 未満
であった。

土壌中(0~20cm 層)では、親化合物[A]の割合が 47.0~56.9%TRR であった。
代謝物として が %TRR 検出された。

推定代謝経路を図 1 に示す。

同定された代謝物から以下の代謝経路が推定された。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表 3-1 代謝物画分の推移 (1 および 3 回処理後)

試料採取時期	1 回目処理 1 時間後		3 回目処理 1 時間後					
	葉部		葉部		塊茎		土壌 (0~20cm)	
試料部位	葉部		葉部		塊茎		土壌 (0~20cm)	
TRR (ppm)	23.785		26.162		0.057		0.319	
代謝物画分	%TRR	ppm	%TRR	ppm	%TRR	ppm	%TRR	Ppm
親化合物 [A]	103.0	24.499	67.1	17.555	20.1	0.011	56.9	0.182
未分離画分	0.5	0.119	1.1	0.288	3.5	0.002	2.2	0.007
非抽出性残渣	n.a.	n.a.	4.1	1.073	46.3	0.026	37.0	0.118
合計	105.7	25.141	102.7	26.868	108.1	0.062	114.3	0.365

n.d. : 検出されず、n.a. : 分析せず

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表 3-2 代謝物画分の分布 (成熟期)

試料採取時期	成熟期 (3回目処理 14日後)							
試料部位	茎葉部		塊茎 (皮)		塊茎(皮を除く)		土壌 (0~20cm)	
TRR (ppm)	24.724		0.092		0.091		0.672	
代謝物画分	%TRR	ppm	%TRR	ppm	%TRR	ppm	%TRR	ppm
親化合物[A]	48.0	11.868	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	47.0	0.316
未分離画分	6.5	1.607	1.5	0.001	1.5	0.001	2.4	0.016
非抽出性残渣	9.7	2.398	48.2	0.044	56.9	0.052	52.0	0.349
合計	107.4	26.554	93.5	0.086	96.1	0.087	105.7	0.710

n.d. : 検出されず

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

図 1. シプロジニルの推定代謝経路

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

3. 土壌における代謝分解

(1) 好氣的、好氣的/嫌氣のおよび滅菌/好氣的条件下における土壌代謝 (資料 No.M-17)

試験機関：チバガイギー社 (スイス国)

報告書作成年：1992年 [GLP 対応]

供試標識化合物：

標識シプロジニル

供試土壌： Les Evouettes 微砂質壤土 (スイス国) を用いた。

その土性は以下の通りである。

砂	26.9%
シルト	59.7%
粘土	13.4%
USDA 分類	微砂質壤土
有機炭素	1.95%
pH	7.2
塩基置換容量(meq/100g)	13.7
最大容水量	67.04%
圃場容水量	55.54%
高比重(g/ml)	1.11

方 法：

処理、培養および試料採取； 標識シプロジニルをアセトンに溶解し、乾燥土壌あたり 1.5ppm になるように土壌に添加した後、均一に混合し、土壌水分を圃場容水量の 75%に調整し、3 種の条件、すなわち好氣的条件、好氣的/嫌氣的条件及び滅菌土壌を用いた好氣的条件とし、暗所、 $20\pm 2^{\circ}\text{C}$ で所定時間インキュベーションした。好氣的/嫌氣的条件下のインキュベーションは、好氣的条件下で 16 日間インキュベーションした後、湛水して嫌氣的条件とした。インキュベーション期間中、エチレングリコール、 H_2SO_4 および NaOH 捕集液を用い、揮発性物質

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

を捕集した。

好気的条件下に保った土壌は処理後 366 日まで採取し、好気的/嫌気的条件下に保った土壌は 16 日後（嫌気的 0 日目）から 120 日後まで採取した。滅菌/好気的条件下に保った土壌は処理後 90 日まで採取した。揮発性物質捕集液は、最初の 1 か月間は約 1 週間毎に、その後は 2 週間毎に採取した。

代謝物の分離および分析； 土壌中の代謝物の抽出、分離は以下のフローチャートに従って行った。

代謝物の分析； HPLC および TLC を用いて代謝物の同定/定量を行った。

放射能の測定； 直接または燃焼法により、LSC で測定した。

微生物活性の測定； 土壌を暗所、室温で圃場容水量の 35%にまで風乾し、試験開始前、105、182 および 366 日間インキュベーション後に微生物活性を測定した。その結果、366 日後でも 41%の活性が認められた。

結果： 物質収支を表 1 に示す。回収率は 94.2～103.8%であった。

好気的条件下では、シプロジニルの分解にともなって急速に非抽出性残留放射能が増加したが、62 日後以降は 55～58% TAR で、プラトーに達した。一方、二酸化炭素も経時的に増加し、62 日後で約 8% TAR、366 日後で約 24% TAR であった。

室温抽出相の代謝画分の経時変化を表 2 に示す。好気条件下では、シプロジニル[A]の土壌代謝は速やかに進み、一次減衰反応（2-コンパートメントモデル）を仮定して算出した半減期は約 21.4 日であった（表 3）。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

滅菌/好氣的条件下では分解速度および非抽出性残留放射能の生成が著しく低下し、好氣的条件から嫌氣的条件に変えるとその後の分解が急激に低下したことから、シプロジニルの土壌分解に微生物が関与しているものと考えられる。

室温抽出画分からは、親化合物[A]の他に 種類の代謝物画分が検出され、主要代謝物は であつた。その他、 が同定された。

好氣的条件下での推定代謝経路を図に示す。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表1 放射能の分布 (物質収支)

培養条件	培 養 期 間 (日)	処理放射能に対する割合 (%TAR)			
			非抽出性 画 分	二酸化 炭素	回 収 率
好氣的	0		0.18	0	100.42
	3		8.99	0.06	99.06
	6		14.87	0.23	98.10
	10		18.52	0.65	99.88
	14		24.31	1.13	97.75
	21		32.64	2.17	99.73
	30		40.76	3.32	99.18
	62		55.59	8.33	95.77
	90		55.72	10.84	95.95
	181		57.72	17.22	95.81
	366		56.21	24.40	94.18
好氣的/嫌氣的**	16 (0)		27.50	1.60	99.85
	62 (46)		30.10	1.46	98.27
	90 (74)		30.66	1.56	99.14
	120 (104)		33.13	1.55	99.34
滅菌好氣的	0		0.05	0	102.68
	30		1.42	0.02	101.66
	62		4.11	0.06	103.80
	90		3.41	0.02	98.28

* : 嫌氣条件用の湛水

** : () 内は、嫌氣的条件下での日数

— : 該当せず

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表2 代謝物画分の経時変化

培養条件	培養期間 (日)	処理放射能に対する割合 (%TAR)	
		親化合物 [A]	
好氣的	0	99.26	
	3	83.68	
	6	77.06	
	10	72.30	
	14	62.33	
	21	51.79	
	30	39.62	
	62	20.26	
	90	11.24	
	181	6.23	
	366	4.22	
好氣的/嫌氣的*	16 (0)	58.90	
	62 (46)	54.63	
	90 (74)	54.32	
	120 (104)	48.42	
滅菌好氣的	0	99.66	
	30	97.51	
	62	97.45	
	90	86.28	

— : 検出されず

* : () 内は嫌氣条件下での日数

表3 半減期

R ²	半減期 (t _{1/2})	DT ₉₀
0.998	21.4 日	121.0 日

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

図 好气的条件下におけるシプロジニルの推定土壌代謝経路

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

(2) 好氣的条件下における土壤代謝

(資料 No.M-18)

試験機関：チバガイギー社（スイス国）

報告書作成年：1994年 [GLP 対応]

供試標識化合物： 標識シプロジニル

供試土壤： Les Evouettes 微砂質壤土（スイス国）を用いた。その土性は以下の通りである。

砂	29.5%
シルト	56.9%
粘土	13.6%
USDA 分類	微砂質壤土
有機炭素	2.30%
pH	7.3
塩基置換容量(meq/100g)	14.00
最大含水量	52.6%
圃場含水量	40.8%
高比重 (g/mL)	1.35

方 法：

処理、培養および試料採取； 標識シプロジニルをアセトンに溶解し、乾燥土壤あたり 1.5ppm になるように土壤に添加した後、均一に混合し、土壤水分を圃場含水量の 75%に調整し、好氣的条件とし、暗所、平均 19.5°Cで所定時間インキュベーションした。インキュベーション期間中、エチレングリコール、H₂SO₄ および NaOH 捕集液を用い、揮発性物質を捕集した。

土壤は処理後 363 日まで頻繁に採取した。揮発性物質は、処理後 1 か月間は約 1 週間毎に、その後は 2 週間毎に採取した。

代謝物の分離および分析； 土壤中の代謝物の抽出、分離は以下のフローチャートに従って行った。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

土壌結合放射能の特性を検討するため、抽出残渣を用い、以下の通り、
を行っ
た。

代謝物の分析；

HPLC および TLC を用いて代謝物の同定/定量を行った。また、133 日後の抽出残渣の抽出液も TLC 分析した。

放射能の測定； 直接または燃焼法により、LSC で測定した。

微生物活性の測定； 土壌を暗所、室温で圃場容水量の 40%にまで風乾し、試験開始前、97、183 および 363 日間インキュベーション後に微生物活性を測定した。その結果、363 日後でも 45%の活性が認められた。

フェノールおよびアニリンの抽出性； フェノールおよびアニリンを土壌に 2ppm となる様

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

に添加後 2 時間インキュベーションし、本試験と同様の抽出を行い、抽出液を HPLC 分析した（土壌からの抽出性の検討）。

結果： 物質収支を表 1 に示す。回収率は 90.5～101.4%TAR であった。非抽出性画分は経時的に増加したが、91 日後以降は約 61～64%TAR でプラトーであった。二酸化炭素も経時的に増加し、62 日後に 9.5%TAR、363 日後に 24.7%TAR であった。抽出液中代謝物画分の経時変化を表 2 に示す。シプロジニル[A]は微砂質壤土中、好気的条件下で速やかに代謝され、一次減衰反応（2-コンパートメントモデル）を仮定して算出した半減期は 19 日であった（表 3）。

抽出性放射能画分を TLC で分析したところ数種類の代謝物画分が検出され、各 TLC 画分をさらに HPLC で分析したところ、

が確認された。親化合物[A]以外は 同定することはできなかつた。同じ Les Evouettes 土壌を用いた 標識体を用いた好気条件下土壌代謝試験（資料 No.M-17）で が代謝されていることから、 が生成すると考えられる。

133 日後の抽出残渣を 抽出した結果、非抽出性残渣の および %が抽出され、 抽出液の 2.11%、 抽出液の 2.47%は親化合物 [A]で、残りは と考えられた。一方、133 日後抽出残渣の有機質分画の結果は、以下の通りであった。

フミン画分	54.7%
フミン酸画分	20.0%
フルボ酸画分	20.8%

以上の結果から、シプロジニルは微砂質壤土中、好気条件下、速やかに分解され、半減期は 19 日であった。その代謝物は（一部の親化合物と共に）土壌吸着され、短時間のうちに土壌構成成分に取り込まれるものと考えられる。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表1 放射能の分布 (物質収支)

培養条件	培養期間 (日)	処理放射能に対する割合 (%TAR)		
			二酸化炭素	回収率
好氣的	0		-	101.4
	3		0.3	98.7
	6		1.3	95.4
	10		2.3	100.1
	14		3.2	95.8
	21		3.3	94.8
	30		3.1	92.5
	62		9.5	90.6
	91		14.2	93.7
	133		14.9	90.5
	182		18.9	92.7
	269		21.4	93.5
363		24.7	97.3	

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表2 代謝物画分の経時変化（上段：%TAR、 下段：ppm）

培養期間 (日)	CH ₂ Cl ₂ 相		水相
	親化合物 [A]	計	
0	99.3	100.2	0.4
	1.499	1.513	0.006
3	80.9	83.9	0.4
	1.222	1.267	0.006
6	72.0	75.4	0.6
	1.087	1.139	0.009
10	71.2	74.6	0.2
	1.075	1.126	0.003
14	57.1	60.5	1.7
	0.862	0.914	0.026
21	45.6	49.2	2.1
	0.689	0.743	0.032
30	43.0	47.5	2.4
	0.649	0.717	0.036
62	17.2	20.9	1.8
	0.260	0.316	0.027
91	12.5	16.7	1.6
	0.189	0.252	0.024
133	8.5	10.9	2.2
	0.128	0.165	0.033
182	6.0	8.3	1.6
	0.091	0.125	0.024
269	5.2	8.3	0.9
	0.079	0.125	0.014
363	4.8	7.5	0.9
	0.073	0.113	0.014

n.d : 検出されず:

表3 半減期

R ²	半減期 (t _{1/2})	DT ₉₀
0.995	19.0 日	131 日

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

(3) 好氣的条件下における土壤代謝

(資料 No.M-19)

試験機関：チバガイギー社（スイス国）

報告書作成年：1993年 [GLP 対応]

供試標識化合物：

標識シプロジニル

供試土壤： Collombey 壤質砂土（スイス国）を用いた。その土性は以下の通りである。

砂	82.4%
シルト	12.0%
粘土	5.6%
USDA 分類	壤質砂土
有機炭素	1.9%
pH	7.2
塩基置換容量(meq/100g)	13.9
最大容水量	46.5%
圃場容水量	30.3%
嵩比重(g/ml)	1.38

方 法：

処理、培養および試料採取； 標識シプロジニルをアセトンに溶解し、乾燥土壤あたり 3.0ppm になるように土壤に添加した後、均一に混合し、土壤水分を最大容水量の 40%（申請者注：圃場容水量の約 61%）に調整し、好氣的条件とし、暗所、20±2℃で所定時間インキュベーションした。インキュベーション期間中、エチレングリコール、H₂SO₄ および NaOH 捕集液を用い、揮発性物質を捕集した。

土壤は処理後 180 日まで採取した。揮発性物質は、処理後 1 か月間は約 1 週間毎に、その後は 2 週間毎に採取した。

代謝物の分離および分析； 土壤中の代謝物の抽出、分離は以下のフローチャートに従って行った。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

代謝物の分析；

HPLC および TLC で代謝物を同定/定量した。

放射能の測定； 直接または燃焼法により、LSC で測定した。

微生物活性の測定； 土壌を暗所、室温で圃場容水量の 35%にまで風乾し、試験開始前、94 および 180 日間インキュベーション後に微生物活性を測定した。その結果、180 日後でも 73%の活性が認められた。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

結果： 物質収支を表 1 に示す。回収率は 95.0～99.4% TAR であった。

土壌中の非抽出性放射能は、処理 90 日後以降 61～68% TAR でプラトーに達した。二酸化炭素は、45 日後に 4.5% TAR で、180 日後には 13% TAR であった。

処理 80 日後の土壌試料を

抽出し、その残渣（総残留放射能の約 68% を含む）を抽出すると、約 21% の放射能が遊離したが、ほとんどは吸着されたままであった。抽出相では、室温抽出等で認められたのと同じ画分が認められたが、極性物質が多く、親化合物は殆ど存在しなかった。

代謝物画分

の経時変化を表 2 に示す。シプロジニル[A]

は、壤質砂土で好氣的条件下、速やかに代謝され、一次減衰反応（2-コンパートメントモデル）を仮定して算出した半減期は約 24 日であった（表 3）。

親化合物[A]の他に 種類の代謝物画分が検出され、主要代謝物は

であった。その他、

が同

定された。

以上の結果、標識シプロジニルは、壤質砂土で好氣的条件下、急速に分解され、を經由して最終的に二酸化炭素を生成する。半減期は約 24 日であった。他の土壌と同様、シプロジニルの分解は、主として微生物による酵素的分解によるものと考えられる。土壌中における推定代謝経路を図に示す。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表1 放射能の分布 (物質収支)

培養条件	培養期間 (日)	処理放射能に対する割合 (%TAR)		
			二酸化炭素	回収率
好氣的	0		—	99.39
	3		0.17	98.05
	6		0.44	99.10
	10		0.51	98.41
	14		1.35	98.75
	20		1.94	98.25
	28		2.83	97.77
	45		4.49	97.41
	61		6.07	96.97
	90		8.55	95.00
	122		10.45	97.12
	180		13.44	95.59

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表 2 代謝物の経時変化

培養条件	培 養 期 間 (日)	処理放射能に対する割合 (%TAR)	
		親化合物 [A]	
好氣的	0	99.30	
	3	84.52	
	6	77.19	
	10	62.17	
	14	64.30	
	20	55.76	
	28	43.55	
	45	31.63	
	61	22.97	
	90	11.50	
	122	7.13	
	180	4.75	

表 3 半減期

R^2	半減期 ($t_{1/2}$)	DT ₉₀
0.999	23.73 日	101.4 日

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

図 好气的条件下でのシプロジニルの推定代謝経路

C

C

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

(4) 好氣的条件下における土壌代謝

(資料 No.M-20)

試験機関：チバガイギー社（スイス国）

報告書作成年：1994年 [GLP 対応]

供試標識化合物： 標識シプロジニル

供試土壌： Collombey 壤質砂土を用いた。その土性は以下の通りである。

砂	81.4%
シルト	13.5%
粘土	5.1%
USDA 分類	壤質砂土
有機炭素	2.2%
pH	7.2
塩基置換容量(meq/100g)	14.95
最大容水量	48.2%
圃場容水量	28.6%
嵩比重 (g/mL)	1.45

方 法：

処理、培養および試料採取； 標識シプロジニルをアセトンに溶解し、乾燥土壌あたり 3.1ppm になるように土壌に添加した後、均一に混合し、土壌水分を最大容水量の 40%（申請者注：圃場容水量の約 67%）に調整し、好氣的条件とし、暗所、平均 19.5℃で所定時間インキュベーションした。インキュベーション期間中、エチレングリコール、H₂SO₄および NaOH 捕集液を用い、揮発性物質を捕集した。

土壌は処理後 154 日まで頻繁に採取した。揮発性物質は、処理後 1 か月間は約 1 週間毎に、その後は 2 週間毎に採取した。

代謝物の分離および分析； 土壌中の代謝物の抽出、分離は以下のフローチャートに従って行った。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

代謝物の分析； HPLC および TLC

を用いて、代謝物の同定/定量を行った。

放射能の測定； 直接または燃焼法により、LSC で測定した。

微生物活性の測定； 土壌を暗所、室温で圃場容水量の 40%にまで風乾し、試験開始前、90 および 154 日間インキュベーション後に微生物活性を測定した。その結果、154 日後でも 47%の活性が認められた。

結 果： 物質収支を表 1 に示す。回収率は 88.9~102.9%であった。

経時的に非抽出性放射能および二酸化炭素が増加し、154 日後には非抽出性放射能が 61.5%TAR、二酸化炭素が 16.5%TAR であった。

代謝物画分の経時変化を表 2 に示す。154 日後には 90%TAR 以上が代謝されていた。一次減衰反応（単純一次反応モデル）を仮定して算出した半減期は 41.7 日であった（表 3）。

抽出性放射能画分を TLC で分析したところ、親化合物[A]の他に 代謝物画分が検出されたが、同定することはできなかった。同じ Collomby 土壌を用いた 標識シプロジニルを用いた好気条件下土壌代謝試験（資料 No.M-19）で、

ことから、

と考えられるが、吸着性が高く十分に抽出されないものと推定される（資料 No.M-18 参照）。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表1 放射能の分布 (物質収支)

培養条件	培養期間 (日)	処理放射能に対する割合 (%TAR)		
			二酸化炭素	回収率
好氣的	0		-	102.9
	3		0.3	101.2
	6		0.7	98.2
	9		1.2	100.5
	14		1.6	99.9
	21		2.9	99.2
	28		4.0	95.7
	59		7.5	92.7
	77		9.1	92.2
	91		11.5	93.1
	120		13.2	88.9
	154		16.5	91.6

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表 2 代謝物画分の経時変化（上段：%TAR、 下段：ppm）

培養期間 (日)	CH ₂ Cl ₂ 相			水相
	親化合物 [A]		計	
0	99.2		99.2	0.3
	3.10		3.10	0.01
3	91.0		91.7	0.5
	2.85		2.87	0.02
6	83.2		84.4	0.8
	2.60		2.64	0.03
9	85.0		86.0	1.2
	2.66		2.69	0.04
14	79.1		80.9	0.9
	2.48		2.53	0.03
21	68.7		71.0	1.3
	2.15		2.22	0.04
28	62.5		64.7	1.3
	1.96		2.02	0.04
59	38.0		41.2	1.7
	1.19		1.29	0.05
77	28.6		31.8	1.3
	0.90		1.00	0.04
91	22.2		26.0	0.9
	0.70		0.81	0.03
120	13.3		17.2	0.7
	0.42		0.54	0.02
154	8.5		12.3	0.8
	0.26		0.38	0.03

n.d : 検出されず:

表 3 半減期

R ²	半減期 (t _{1/2})	DT ₉₀
0.998	41.7 日	138.5 日

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

(5) 各種条件下における好氣的土壤代謝試験

(資料 No.M-21)

試験機関：RCC社（スイス国）

報告書作成年：1994年 [GLP 対応]

供試標識化合物：

標識シプロジニル

供試土壌： Les Evouettes（スイス国）より採取した微砂質壤土を用いた。
その土性は以下の通りである。

項 目	Les Evouettes 土壌
砂	59.1%
シルト	33.9%
粘土	7.0%
USDA 分類	微砂質壤土
有機炭素	1.39%
pH	7.7
塩基置換容量(meq/100g)	16.1
圃場容水量(1/3 バール)	39.8%
最大容水量	52.1%

方 法：

処理、培養および試料採取； アセトンに溶解した 標識シプロジニルをアセトン/水（1/1）で希釈し、実用処理量に相当する乾土あたり 1.0ppm またはその 1/10 量の 0.1ppm の設定濃度になるように土壌に添加し、以下の条件でインキュベーションした。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

実験番号	温度(°C)	土壌水分*	処理濃度(ppm)
1	20	60	1.0
2	20	30	1.0
3	10	60	1.0
4	20	60	0.1

*：圃場容水量に対する割合(%FC)

各実験に、フラスコ 13 本を用いた。土壌水分を調整し、所定の温度で通気しながらインキュベーションし、0、3、7、12（実験 3 の試料を除く）、21、41、71 および 110 日後に土壌試料を採取した。インキュベーション期間中、エチレングリコールおよび NaOH 捕集液を用い、揮発性物質を捕集した。揮発性物質捕集液は、1 週間に 1 回採取した。

代謝物の分離および分析； 所定時間インキュベーションした土壌は

抽出物を TLC および HPLC で分析した。

放射能の測定； 直接または燃焼法により、LSC で測定した。

微生物バイオマスの測定； インキュベーション開始前および終了後（112 日目）に、土壌中の微生物バイオマスを測定した。

結果：

(1) 微生物バイオマス； 各試験条件下での微生物バイオマスを表 1 に示す。

表 1 各試験条件下での微生物バイオマス

検査時期	温度(°C)	土壌水分 (%)	微生物バイオマス (C mg/100g 土壌)
実験開始時	—	—	62.0
実験終了時	20	60	60.5
	20	30	54.0
	10	60	57.2

- (2) 放射能の物質収支； 各試験の物質収支を表 2 に示す。回収率は、全試験通して、91.4～102.8% TAR であった。

処理直後の抽出性放射能はきわめて高く、約 95～96% TAR であったが、インキュベーション時間の経過にともなって徐々に減少し、インキュベーション終了時には約 15～44% TAR であった。それにともなって非抽出性放射能画分が増加した。処理量が低く (0.1ppm)、インキュベーション条件が分解に好適と考えられる実験 4 では 110 日目に、わずかではあるが非抽出性放射能の減少がみられるので、これらの非抽出性放射能はやがて減少し、 $^{14}\text{CO}_2$ に無機化されるものと考えられる。

- (3) 代謝物画分の経時変化と半減期； 抽出性放射能画分を TLC および HPLC で分析して得られた代謝物画分の経時変化を表 3 に示す。親化合物[A]以外に 種類の少量代謝物画分が認められたが、いずれも同定することはできなかった。

一次減衰反応 (実験 1～3 は単純一次反応モデル、実験 4 は 2-コンパートメントモデル) を仮定して求めた半減期は表 4 に示す通りであった。実験 1 (実用処理量 1ppm、湿度 60%FC、温度 20℃) での半減期は 24 日で、湿度が低い (30%FC) あるいは温度が低い (10℃) と、代謝は遅れ、半減期が長くなった (51、80 日)。また、処理量が実処理量より低い (0.1ppm) と半減期は短かった (13 日)。

以上の結果、 標識シプロジニルの好氣的条件下の土壤代謝は、培養温度および土壤湿度の影響を受け、また処理濃度によっても影響を受けた。培養温度は 10℃より 20℃の方が、土壤湿度は 30%FC より 60%FC の方が、また処理濃度は実使用量よりその 1/10 の方が代謝分解が速かった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表 2 物質収支

処 理 量 培 養 条 件	培 養 期 間 (日)	処理放射能に対する割合 (%TAR)		
			¹⁴ CO ₂	回 収 率
実験 1 処理量 : 1.0ppm 温度 : 20°C 土壌水分 : 60%FC	0		n.p. (n.p.)	97.3 (0.975)
	3		0.3 (<0.001)	97.4 (0.973)
	7		1.1 (0.011)	98.8 (0.991)
	12		1.5 (0.015)	95.8 (0.960)
	21		3.4 (0.034)	96.6 (0.968)
	41		5.3 (0.054)	97.8 (0.981)
	71		6.4 (0.064)	93.9 (0.942)
	110		8.3 (0.083)	92.1 (0.923)
実験 2 処理量 : 1.0ppm 温度 : 20°C 土壌水分 : 30%FC	0		n.p. (n.p.)	96.9 (0.971)
	3		0.2 (<0.001)	95.7 (0.957)
	7		0.5 (0.005)	96.4 (0.967)
	12		1.1 (0.011)	97.8 (0.980)
	21		1.1 (0.011)	96.3 (0.966)
	41		3.4 (0.034)	98.2 (0.985)
	71		1.9 (0.019)	93.4 (0.936)
	110		6.8 (0.069)	91.4 (0.917)

表中の()内の数値は ppm

n.p. : 測定せず

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表 2 物質収支-続き

処 理 量 培 養 条 件	培 養 期 間 (日)	処理放射能に対する割合 (%TAR)		
			¹⁴ CO ₂	回 収 率
実験 3 処理量 : 1.0ppm 温度 : 10°C 土壌水分 : 60%FC	0		n.p. (n.p.)	96.5 (0.967)
	3		0.1 (<0.001)	96.4 (0.965)
	7		0.3 (0.003)	98.9 (0.992)
	21		0.7 (0.007)	95.5 (0.958)
	41		0.4 (0.004)	97.1 (0.974)
	71		1.7 (0.017)	93.9 (0.941)
	110		2.6 (0.026)	92.3 (0.925)
実験 4 処理量 : 0.1ppm 温度 : 20°C 土壌水分 : 60%FC	0		n.p. (n.p.)	101.3 (0.100)
	3		0.6 (<0.001)	102.8 (0.101)
	7		1.7 (0.002)	101.9 (0.101)
	12		2.1 (0.002)	101.9 (0.101)
	21		3.2 (0.003)	100.1 (0.099)
	41		4.8 (0.005)	98.6 (0.098)
	71		5.4 (0.005)	97.9 (0.097)
	110		9.3 (0.009)	100.2 (0.099)

表中の()内の数値は ppm

n.p. : 測定せず

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表3 代謝物の経時変化 (処理放射能に対する割合、%TAR)

処理量・培養条件	培養期間 (日)	[A]	
実験1 処理量：1 ppm 温度：20℃ 土壌水分：60%FC	0	94.9 (0.951)	
	3	88.0 (0.882)	
	7	74.9 (0.750)	
	12	70.0 (0.702)	
	21	55.1 (0.553)	
	41	31.8 (0.319)	
	71	15.3 (0.153)	
	110	9.2 (0.092)	
実験2 処理量：1 ppm 温度：20℃ 土壌水分：30%FC	0	95.4 (0.956)	
	3	90.3 (0.905)	
	7	83.4 (0.836)	
	12	80.5 (0.807)	
	21	71.6 (0.717)	
	41	57.3 (0.574)	
	71	41.6 (0.417)	
	110	24.5 (0.245)	

表中の () 内の数値はppm

n.d. : 検出されず

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表 3 代謝物の経時変化-続き (処理放射能に対する割合、%TAR)

処理量・培養条件	培養 期間 (日)	[A]	
実験3 処理量：1 ppm 温度：10℃ 土壌水分：60%FC	0	94.5 (0.947)	
	3	93.4 (0.936)	
	7	92.8 (0.930)	
	21	81.5 (0.817)	
	41	72.2 (0.723)	
	71	51.3 (0.514)	
	110	40.0 (0.401)	
実験4 処理量：0.1 ppm 温度：20℃ 土壌水分：60%FC	0	95.8 (0.095)	
	3	84.9 (0.084)	
	7	65.0 (0.064)	
	12	55.5 (0.055)	
	21	26.2 (0.026)	
	41	18.2 (0.018)	
	71	12.4 (0.012)	
	110	10.0 (0.010)	

表中の () 内の数値はppm

n.d. : 検出されず

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表 4 各試験条件下での半減期

実験	試験条件			R ²	半減期 (t _{1/2})	DT ₉₀
	処理量	湿度*	温度			
1	1ppm	60%FC	20°C	0.9971	24.2	80.4
2	1ppm	30%FC	20°C	0.9967	50.7	168.3
3	1ppm	60%FC	10°C	0.9991	79.8	264.9
4	0.1ppm	60%FC	20°C	0.9953	13.0	87.5

* : 圃場容水量に対する割合

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

4. 水中運命に関する試験

(1) 加水分解試験

(資料 No.M-22)

試験機関 : PTRL East, Inc.(米国)

報告書作成年 : 1995 年 [GLP 対応]

供試標識化合物 :

標識シプロジニル

試験方法 : 「米国 EPA 農薬評価ガイドライン N 161-1 系」に従って試験を行った。シプロジニルのアセトニトリル溶液を各緩衝液 (pH5、7、9) に添加して約 1ppm の試験溶液を調製した (アセトニトリルの最終濃度は 1%)。これをガラス製試験管へ移し、25°C のインキュベーターに設置した。培養後 0、7、14、21 及び 32 日の試料を分析した。尚、各緩衝液の調製は以下の通り。

pH (緩衝液)	調製法
pH5 (酢酸緩衝液)	<ul style="list-style-type: none">・ 50mL の 0.1M NaOH 溶液に 73mL の 0.1M 酢酸を添加・ 最終容積が 500mL となるように純水を添加・ 0.1N 酢酸により pH5 に調整
pH7 (リン酸緩衝液)	<ul style="list-style-type: none">・ 12.9mL の 0.1M リン酸水素カリウムに 11.2mL の 0.1M リン酸二水素カリウムを添加・ 最終容積が 500mL になるように純水を添加
pH9 (ホウ酸緩衝液)	<ul style="list-style-type: none">・ 250mL の 0.01M ホウ酸ナトリウム水溶液に 23mL の 0.04M 塩酸を添加・ 最終容積が 500mL になるように純水を添加・ 濃塩酸と NaOH 飽和水溶液で pH9 に調整

分析法 : 放射活性は LSC で測定し、分解物等は TLC および HPLC で分析した。

結果 : 各 pH における加水分解性を表 1 に示した。いずれの pH においても親化合物[A] は分解されず、半減期は 1 年以上で安定であった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表1 各 pH における加水分解性 (25°C)

試料採取日	pH5	pH7	pH9
	親化合物 (%TAR*)		
0	100	100	100
7	97.7	98.0	97.8
14	96.5	97.6	99.2
21	97.0	98.9	99.9
32	93.9	97.6	98.0
—	推定半減期 (日)		
	401	1,376	2,070

* : 培養 0 日の試料中濃度を 100%とする

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

(2) 加水分解試験

(資料 No.M-23)

試験機関：RCC社（スイス国）

報告書作成年：1992年 [GLP 対応]

供試標識化合物：

標識シプロジニル

試験方法：「米国 EPA 農薬評価ガイドライン N 161-1 系」に従って試験を行った（ただし pH5 を pH4 に変更）。シプロジニルのアセトン溶液を緩衝液（pH4、7、9）に添加して約 2ppm の試験溶液を調整した（アセトンの最終濃度は 0.5%）。これをガラス製試験管へ移し、50°Cのインキュベーターに 5 日間設置した。尚、各緩衝液の調製は以下の通り。

pH（緩衝液）	調製法
pH4 (フタル酸緩衝液)	100mL の 0.1M フタル酸水素カリウム溶液に 2mL の 0.1M NaOH 溶液を添加、最終濃度 0.01M に希釈し塩酸で調整
pH7 (トリス緩衝液)	100mL の 0.1M トリスヒドロキシメチルアミノメタン (Tris) 溶液に 95mL の 0.1M 塩酸溶液を添加、最終濃度 0.01M に希釈し塩酸で調整
pH9 (ホウ酸緩衝液)	70mL の 0.1M ホウ酸溶液に 22.7mL の 0.1M NaOH 溶液を添加、最終濃度 0.01M に希釈し塩酸で調整

分析法：放射活性は LSC で測定し、分解物は TLC および HPLC で分析した。

結果：各 pH における加水分解性を表 1 に示す。50°C、pH4、7、9 では親化合物[A]は分解されなかった。従って、シプロジニルの 25°Cでの半減期は 1 年以上で加水分解には安定と判断される。

表 1 各 pH における加水分解性 (50°C)

試料採取日	親化合物 (%TAR*)		
	pH4	pH7	pH9
0	100	100	100
2	99.8	100.2	96.9
5	99.3	98.5	96.0

* : 0 日目の残留量を 100%とした

(3) 緩衝液中での光分解試験

(資料 No.M-24)

試験機関：チバガイギー社（スイス国）
報告書作成年：1994年 [GLP 対応]

供試標識化合物： 標識シプロジニル

供試水： pH7.27 の 2mM リン酸緩衝液を用いた。尚、滅菌メンブランフィルター（0.2 μm ）で滅菌した。

光源： キセノンアークランプ、UV フィルター（290nm 以下カット）使用

照射強度： 3.18 W/m²（300~400nm）

試験方法：

試験濃度； 被験物質のアセトニトリル溶液を供試水に加え、4.7 mg/L の試験溶液を調製した。共溶媒アセトニトリルの最終濃度は 0.67% 以下であった。

試験温度； 25 °C

照射期間； 22 日間

試料採取； 照射区は 0、2、5、7、9、12、16、19 及び 21 日後、暗所対照区は 0、19、22 日後に 1 連の試料を採取した。

滅菌性の確認； 試験開始時及び試験中に滅菌性を確認した。

試験容器； ホウ珪酸ガラス製シリンダー（サンプル量 15mL）、
ホウ珪酸ガラス製の蓋

分析方法； LSC で放射活性を測定し、TLC 及び HPLC で代謝物を分析した。

試験結果：照射区及び暗所対照区の代謝物の変化を表 1 に示す。回収率は照射区で 93.8~101.9%、対照区で 98.35~102.59% であった。

照射区では、シプロジニルは二段階の反応を示した。最初（0~12 日後）は光分解は緩慢であったが、その後（12~21 日後）は単純な一次反応となり、半減期は 5.5 日（東京春の自然光換算で 2.3 日）であった。全体（0~21 日）では、単純一次反応を仮定した半減期は 17.6 日（東京春の自然光換算で 7.2 日）であった。

暗所対照区では、試験期間中安定で加水分解は認められなかった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表1 照射区及び暗所対照区での代謝物の変化（施用量に対する割合、%TAR）

経過日数 (日)	照射区			暗所対照区
	親化合物 [A]		回収率	親化合物 [A]
0	101.94		101.9	101.94
2	97.89		99.8	n.a.
5	96.30		99.9	n.a.
7	98.18		99.9	n.a.
9	97.19		99.9	n.a.
12	90.67		98.2	n.a.
16	73.27		97.2	n.a.
19	26.43		94.3	98.35
21	29.23		93.8	n.a.
22	n.a.		n.a.	102.59

n.a. : 分析せず

- : 検出されず

(4) 蒸留水あるいは緩衝液中での光分解試験

(資料 No.M-25)

試験機関：チバガイギー社（スイス国）
報告書作成年：1994年 [GLP 対応]

供試標識化合物： 標識シプロジニル

供試水： 再蒸留水あるいは pH7.31 の 2mM リン酸緩衝液を用いた。尚、緩衝液は滅菌メンブランフィルター（0.2 μ m）で滅菌した。

光源： キセノンアークランプ、UV フィルター（290nm 以下カット）使用

照射強度： 3.01 ~8.13 W/m²（300~400nm）

試験方法：

試験濃度；1.03~5.44 mg/L の試験溶液を調製した。共溶媒アセトニトリル（あるいはメタノール）の最終濃度は 0.67%以下とした。

試験温度；25 °C

照射期間；23.5 時間~806.6 時間

試料採取；照射区は 6~10 試料（No.11-2 では 1 試料）、対照区は 0~2 試料を用いた。

試験容器；ホウ珪酸ガラス製シリンダー（サンプル量 15mL）、
ホウ珪酸ガラス製の蓋

分析方法；LSC で放射活性を測定し、TLC 及び HPLC で代謝物を分析した。

滅菌性；実験器具はオートクレーブ滅菌し、操作は無菌的に行った。一部試料で微生物活性を測定して汚染のない事を確認した。

試験結果：No.1~11-2 まで、各種条件下での蒸留水あるいは緩衝液中での光分解の半減期を表 1 に示す。蒸留水中での半減期は東京春自然光換算で 14.5~46.0 日、pH7.31 の緩衝液中では 3.36~31.0 日と幅が見られた。

アセトンや光分解物の様な光増感物質の添加で半減期は顕著に短くなった（No.3、5、11-2）。

溶媒を用いない場合、東京春季自然太陽光換算半減期は蒸留水で 14.5 日、緩衝液（pH7.31）では 13.8 日であった。

又、暗所対照区では、試験期間中安定で加水分解は認められなかった。

試験 No.8（共溶媒無、緩衝液無）の分解物の変化を表 2 に示す。

表 1 各試験の条件と半減期（東京春自然光換算、日）

No.	試験濃度 (mg/L)	共溶媒等	緩衝液の有無	CO ₂ 累積 (%)	回収率 (最初/最後)	半減期 (時間)	照射強度 (W/m ²)	東京春半減期* (日)
1	5.44	1)	有	—	99.0/80.9	208.3	3.01	3.36
2	1.05	1)	有	—	101.7/95.8	365.7	3.01	5.90
3	1.03	3)	有	—	109.4/70.7	9.77	3.01	0.16
4	1.07	1)	有	5.4	99.2/98.8	1921.3	3.01	31.0
5	1.11	3)	有	4.2	101.8/93.5	10.09	3.01	0.16
6	3.13	無	有	4.4	102.8/101.7	355.9	7.22	13.8
7	3.13	2)	有	6.5	100.8/90.1	236.0	7.22	9.13
8	4.02	無	無	16.0	100.0/85.0	333.9	8.11	14.5
9	4.23	5)	無	10.4	100.0/98.0	463.9	8.13	20.2
10	4.23	6)	無	10.1	100.0/91.5	426.1	8.13	18.6
11-1	3.83	無	無	5.8	100.0/141.2	1180.4	7.28	46.0
11-2		4)	無	—		168.9	7.28	6.59

*：東京春換算は申請者が算出

—：測定せず

- 1) 0.67%アセトニトリル（共溶媒）
- 2) 0.67%メタノール（共溶媒）
- 3) 1.0%アセトン（光増感物質）
- 4) 3.5mg/L 光分解物（光増感物質）の添加
- 5) 酸素添加
- 6) 窒素添加

表 2 No.8 試験での代謝物の変化（施用量に対する割合、%TAR）

試験区						対照区
照射時間	親化合物 [A]		その他	CO ₂	回収率	親化合物 [A]
0.0	99.0		-	-	100.0	99.0
10.1	95.5		-	-	99.6	NA
22.8	93.8		-	-	98.4	NA
63.1	93.4		-	-	99.4	NA
85.9	90.1		-	0.3	98.2	NA
122.3	66.6		7.5	1.8	94.1	NA
169.9	85.5		2.1	5.4	99.9	NA
223.2	28.4		16.8	10.0	84.4	96.0
265.3	23.3		5.8	14.0	87.7	NA
291.2	18.1		8.4	16.0	85.0	95.0

NA：測定せず

(5) 自然水中での光分解試験

(資料 No.M-26)

試験機関：スプリングボーン社（米国）
報告書作成年：1995年 [GLP 対応]

供試標識化合物 ①： 標識シプロジニル

供試標識化合物 ②： 標識シプロジニル

供試水： 供試水の性質を以下に示す。

採取源	テキサス州、Denton、 北テキサス大学、生物科学部 Water Resource Field Station
色	無色
pH	8.94
アルカリ度	332mg/L CaCO ₃
硬度	32mg/L CaCO ₃
溶存酸素	8.3mg/L
比伝導度	780 μ MHO/cm
微生物叢*	細菌類 糸状菌類
	4.23 × 10 ⁵ CFU/mL 3.73 × 10 ⁶ CFU/mL

*：（申請者注）滅菌は実施していないが、暗所対照区で殆ど分解が認められないことから、結果への影響はないと判断される

光源：キセノンアークランプ（UV フィルター付）

照射強度：4.15 W/m²（300～400nm）、12 時間/日の照射 [別添参照]

試験方法：

試験濃度；被験物質①、②を1：1に混和し、アセトニトリル溶液とした。これを供試水に加え、0.926 μ g/mL の試験溶液を調製した。共溶媒アセトニトリルの最終濃度は1%であった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

試験温度 ; 25.0°C (最低 23.7±1.32°C、最高 25.7±0.252°C)

照射期間 ; 30 日間 (12 時間照射/12 時間暗黒)

試料採取 ; 0、2、6、9、15、22 および 30 日後に照射区および暗所対照区から 2 連の試料を採取した。尚、試験期間中空気を通気し、揮発物質は 10%KOH 溶液等に捕捉し、試料採取時に捕捉溶液を取り替えた。

試験容器 ; ホウ珪酸ガラス製バイアル (約 19×65mm)、ネジ式栓 (テフロン製内張り、プラスチック製開放孔) 付き。

分析方法 ; LSC で放射活性を測定し、HPLC で代謝物を分析し、TLC、GC-MS で確認した。

試験結果 :

照射区および暗所対照区のシプロジニルの変化、回収率を表 1 に示す。

又、照射 30 日後の代謝物の割合 (TLC) を表 2 に示す。又、半減期のまとめを表 3、推定代謝経路を図に示す。回収率は、照射区で 93.8~103%、対照区で 97.2~102%であった。照射区でのシプロジニルの分解は 0~9 日は反応が遅く、9~30 日は速かった。一次反応を仮定すると、半減期は、暗所対照区での僅かな加水分解分を差し引いて、12.1 日 (東京春自然太陽光換算で 3.2 日) であった (表 3)。照射区では、TLC により親化合物[A]の他に、(表 2)、その他 GC-MS で が確認された。試験終了時には約 15% TAR の $^{14}\text{CO}_2$ の発生も認められ (表 1)、シプロジニルが水中光分解により無機化される事が示された。シプロジニルの主要分解経路*は、以下のように想定された (*申請者による想定)。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表1 シプロジニルの変化および回収率(施用量に対する割合、%TAR)

経過 日数	照射区				暗所対照区			
	親化合物[A]	その他	揮発物 捕捉 トラップ	回収率	親化合物 [A]	その他	揮発物 捕捉 トラップ	回収率
0	99.6	0	0	99.6	99.5	0	0	99.5
2	103	0	0	103	102	0	0	102
6	102	0	0.1	102.1	99.7	0	0	99.7
9	92.9	5.4	0.27	98.6	100	0	0	100
15	77.9	19.8	0.64	98.3	99.9	0	0	99.9
22	50.9	42.5	2.01	95.5	97.2	0	0	97.2
30	14.8	74.2*	4.83*	93.8	98.2	0	0	98.2

*: 試験自然水のpHが8.94とアルカリ性の為、 $^{14}\text{CO}_2$ は自然水中に炭酸塩(重炭酸塩)として残り、30日後に自然水中に約14.6%TARの $^{14}\text{CO}_2$ が確認された。一方、10%KOHトラップ溶液中の約18%(0.87%TAR)が $^{14}\text{CO}_2$ で残りは酸性揮発性分解物と推定された($^{14}\text{CO}_2$ として計約15%TAR)。

表2 30日後の2D-TLCによる代謝物画分

化合物	%TAR
親化合物[A]	9.98 (14.8)
合計	80.86

()内は、HPLCの結果

表3 半減期(単位:日)、一次反応(直線回帰)仮定

		光照射区	暗所対照区	光分解 半減期*	東京春 換算値**
全体(0~30日)		11.90	686.5	12.11	3.2
2相に分離 した場合	第1相 (0~9日)	91.70	1166.6	99.63	26.6
	第2相 (9~30日)	7.99	623.2	8.09	2.2

*: 暗所対照区での僅かな加水分解を差し引いた光分解のみの半減期(東京春太陽光換算はこの値に基づいた)

** : 申請者が算出

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

図 シプロジニルの自然水中光分解推定代謝経路（申請者作成）

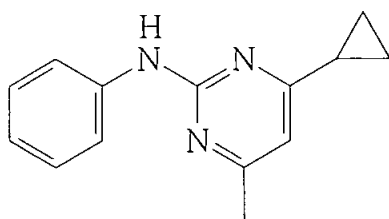
本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

(6) 水中光分解試験 (滅菌蒸留水、自然水)

(資料No.M-27)

試験機関 : (財)日本食品分析センター
報告書作成年 : 1995年

供試化合物 : 非標識シプロジニル



純度 ; %

供試水 : 滅菌蒸留水および自然水 (非滅菌、神奈川県秦野市大倉 水無川上流より採取、1994年12月7日)を用いた。

試験条件 : 農林水産省から提示された「農薬の成分物質等の水中での光分解性試験」の暫定実験指針に準じた。

試験装置 ; ウォータージャケット付きビーカーに試験溶液を入れ、石英ガラス製の蓋をして加速暴露装置内の試料室に置いた。

光源 ; キセノンランプ(UVフィルター付)

平均照度 ; 51 W/m^2 (300~400nm)

試験温度 ; 25°C

試験濃度 ; 1 mg/L (シプロジニルをエタノールに溶解後、河川水または滅菌蒸留水に加えた。尚、エタノールの最終濃度は0.1%)

分析法 : 試験溶液をアセトニトリルで希釈し、親化合物[A]および代謝物をHPLCで分析した。

結果 : 親化合物[A]および代謝物 の変化を表1に示す。 は河川水照射区においてのみ検出された。推定半減期を表2に示す。滅菌蒸留水中での半減期は24.2日 (東京春換算158.7日)、河川水での半減期は0.9日 (東京春換算5.9日)であった。暗所対照区では安定であった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表1 滅菌蒸留水および河川水中での[A] の変化

供試水	経過時間 (hr)	%TAR		
		照射区		暗所対照区
		[A]		[A]
滅菌蒸留水	0	100		n.a.
	24	98.4		n.a.
	48	95.2		n.a.
	72	94.2		n.a.
	120	91.0		n.a.
	168	83.0		97.8
	240	76.9		n.a.
	336	66.1		93.4
河川水	0	100		n.a.
	24	73.5		n.a.
	48	18.1		99.6
	72	2.2		n.a.
	120	0.7		98.7

n.a. : 分析せず - : 検出されず

表2 照射区における半減期

供試水	半減期	東京春換算値*
滅菌蒸留水	24.2日	158.7日
河川水	0.9日	5.9日

* : 申請者が算出

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

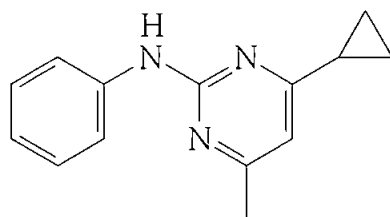
5. 土壌吸着性試験

(資料 No.M-28)

試験機関：(財)日本食品分析センター

報告書作成年：1995年

供試化合物：非標識シプロジニル



純度； %

供試土壌： 供試した土壌の特性を下表に示す。土壌は、いずれも畑地土壌である。

採取場所	福島農試	植防牛久 ¹⁾	愛知農総試	和歌山農試	岡山農試	植防宮崎
砂質(%)	53.4	26.2	68.0	41.7	60.5	87.1
シル質(%)	22.8	50.9	14.5	29.4	17.5	5.7
粘土(%)	23.8	22.9	17.5	28.9	22.0	7.2
土性 (USDA) *	砂質 埴壤土	微砂質 壤土	砂壤土	埴壤土	砂質 埴壤土	壤質 砂土
有機炭素含有率 (%)	0.96	4.19	1.11	1.33	0.69	1.56
pH (H ₂ O)	6.8	6.8	6.8	5.2	6.7	5.8
pH(KCl)	6.7	6.9	6.0	3.7	5.5	6.3
CEC (meq/100g)	13.5	21.4	7.9	11.0	8.7	7.0
硝酸吸収係数	540	2000	290	410	350	660
OECD 分類*	3	3	5	2	4	7

1): 火山灰土 * : 申請者による分類

試験方法：「OECD ガイドライン-106-吸着/脱着」に準じた。

吸着平衡試験：

供試化合物の 0.01M 塩化カルシウム溶液 20mL を、純水 5mL で平衡化した各供試土壌 5g (乾土) に加え振とうした (土/水比 0.2)。2、4 および 6 時間後に遠心分離し水相を分析した (2 回繰り返す)。得られた結果をもとに、土壌中濃度 (吸着量)、吸着平衡時間を得た。

吸着等温試験：

供試化合物の 0.01M 塩化カルシウム溶液 (4 段階の濃度) 20mL を、純水 5mL で平衡化した各供試土壌 5g (乾土) に加え (土/水比 0.2)、25±1℃で 6 時間振とうし吸着平衡させた後、遠心分離し水相を分析した (2 回繰り返す)。得られた結果をもとに土壌中濃度 (吸着量) を得た。

物質収支 (回収率)：

吸着等温試験の 2 番目に高濃度な溶液について、吸着平衡後の土壌中供試化合物量を測定し、水相および土壌の供試化合物合計量を初期添加量で除して求めた。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

分 析 法：（水相）酢酸エチル溶出後、濃縮乾固し、HPLC 移動相に溶解し、HPLC で分析した。

（固相）メタノール/水で加熱還流後、濃縮し水で定容後、0.01M 塩酸を加え、メタノール/水で溶出し HPLC で分析した。

結 果：下表に示す。

採取場所	福島農試	植防牛久 ¹⁾	愛知農総試	和歌山農試	岡山農試	植防宮崎
土性 (USDA)	砂質埴壤土	微砂質壤土	砂壤土	埴壤土	砂質埴壤土	壤質砂土
有機炭素含有率(%)	0.96	4.19	1.11	1.33	0.69	1.56
1/n	0.829	0.839	0.826	0.824	0.795	0.824
R ²	0.99892	0.99808	0.99858	0.99965	0.99716	0.99901
吸着平衡定数 K _F ^{ads}	24.34	44.04	21.42	24.05	42.95	9.22
有機炭素吸着定数 K _F ^{ads} _{OC}	2535	1051	1930	1808	6225	591
平均回収率(%)	87.8	92.6	86.4	76.4	87.4	94.0

1)：火山灰土

物質収率は 76.4～94.0%であった。吸着平衡定数 K_F^{ads} は 9.22～44.04、有機炭素吸着定数 K_F^{ads}_{OC} は 591～6225 で、シプロジニルの土壌中での移動性は低いと考えられた。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

6. 魚介類における濃縮性

(資料 No.M-29)

試験機関 : RCC 社 (スイス国)

報告書作成年 : 1994 年 [GLP 対応]

供試標識化合物 : 標識シプロジニル

供試動物 : ブルーギルサンフィッシュ (*Lepomis cyanellus*)、 体長 3.8~5.1cm
1 群 84 匹 (対照群は 25 匹)、平均体重 0.86~1.14g

方 法 :

暴露方法 ; 流水式 (300L/日) で連続暴露

試験期間 ; 取込期間 28 日間、排泄期間 14 日間

試験濃度 ; 0 (対照区) および 0.1mg/L (設定濃度、2 連)

試験液の調製 ; 標識シプロジニルを非標識のシプロジニル (純度 %) で希釈して (比放射能 1.99 μ Ci/mg)、アセトンに溶解し、ストック溶液を調製した。所定量のストック溶液と Tween 80 を混合後、水道水で希釈し、試験溶液を調製した。試験溶液中のアセトン濃度および Tween80 濃度は約 0.0014ppm および 0.003ppm であった (申請者が算出)。各試験容器 (100L) に、300L/日の割合で試験溶液を送った。対照区および排泄期間中は水道水のみを送った。

試験条件 ;

水温 ; 取込期間 19°C、排泄期間 17.4~20.2°C

pH ; 7.9~8.3

溶存酸素 ; 8.0~10.0mg/L

試料採取 ; 試験溶液および魚を取込期間前日 (試験溶液のみ)、取込期間の 0、3、7、14、21 および 28 日目に、排泄期間の 1、3、7、10 および 14 日目に採取した。また、暴露期間の 14 および 21 日目に代謝物分析用に別の魚を採取した。

分 析 ; 試験液中放射能は直接、また魚中放射能は可溶化後、LSC で測定した。

試験液はジクロロメタンおよびエチル酢酸で分配後、有機相中の親化合物[A]を TLC 分析した (7 日後の試料については、水相に関しても TLC 分析した)。

14 および 21 日後の代謝物分析用魚に関しては、ホモジナイズ後、

抽出した。代謝物を TLC および HPLC で分析した。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

結 果：

1) 試験溶液中における放射能

取込期間中の試験液中放射能濃度（親化合物換算値）を表 1 に示す。処理区 1 および 2 で 0.099～0.113mg/L（平均 0.107mg/L）あるいは 0.099～0.111mg/L（平均 0.104mg/L）で、ほぼ一定濃度に暴露されていた。尚、排泄期間中はいずれも定量限界以下であった。

表 1 取込期間中における試験液中放射能濃度（親化合物換算値）の経時変化

期 間 (日)	対照区	処理区 1	処理区 2
	mg/L		
0*	n.d.	0.111	0.111
0**	<BG	0.104	0.104
3	n.d.	0.099	0.099
7	n.d.	0.113	0.101
14	n.d.	0.099	0.100
21	<BG	0.113	0.106
28	<BG	0.112	0.106
平均		0.107	0.104
標準偏差		±0.006	±0.004

*：魚を水槽に入れる直前、 **：魚を水槽に入れて 1 時間後

n.d.：検出せず BG：バックグラウンド値

2) 試験溶液中の分解

試験溶液中の親化合物[A]および分解物の割合を表 2 に示す。親化合物は 83.0～99.2%であった（処理区 1 で平均 91.2%、処理区 2 で平均 92.5%）。7 日目試料の水相の分析で分解物が確認された。

表 2 試験液中の親化合物および分解物の割合 (%)

処理区		処理区 1					処理区 2				
取込期間 (日)		0	3	7	21	28	0	3	7	21	28
有 機 相	親化合物 [A]	99.2	92.9	83.0	92.7	88.3	99.1	92.4	84.6	91.8	94.4
	計	99.2	93.6	86.1	92.7	92.3	99.1	92.4	86.6	91.8	96.5
水 相											
	計	0.8	6.4	13.9	7.3	7.7	0.9	7.6	13.4	8.2	3.5
合計		100	100	100	100	100	100	100	100	100	100

n.d.：検出されず、 n.a.：分析せず、 <LOQ：定量限界以下

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

3) 魚における放射能

取込期間および排泄期間中の魚（食用部/非食用部/全体）における総残留放射能（親化合物換算値）の経時変化を表 3 に示す。魚における総放射能は、7～14 日で平衡に達した。排泄期間中の消失は速やかで、半減期は 0.3～0.8 日であった。

表 3 魚における総残留放射能の経時変化（ppm：親化合物換算値）

処理区		処理区 1			処理区 2		
部位		可食部	非可食部	全体	可食部	非可食部	全体
取込期間	0 日	2.445	9.247	4.958	2.436	7.107	4.541
	3 日	4.746	76.481	29.090	8.190	75.003	45.804
	7 日	4.177	67.007	45.494	3.830	63.450	37.115
	14 日	4.417	49.300	37.142	11.973	63.321	44.832
	21 日	6.124	59.989	44.320	8.654	65.332	38.045
	28 日	7.964	54.838	32.333	11.325	49.966	24.538
	平衡値	[5.909]	[61.523]	[39.622]	[8.794]	[63.413]	[38.066]
排泄期間	1 日	1.130	6.446	2.163	2.340	17.365	10.256
	3 日	0.221	0.746	0.789	0.364	0.977	0.503
	7 日	0.192	0.557	0.517	0.151	0.442	0.388
	10 日	0.217	0.433	0.360	0.149	0.378	0.379
	14 日	0.135	0.501	0.360	0.135	0.462	0.403
	半減期	[0.36 日]	[0.32 日]	[0.26 日]	[0.44 日]	[0.64 日]	[0.75 日]

4) 魚中における代謝

取込期間 14 および 21 日後の魚残留放射能中の親化合物および代謝物の割合を表 4 に示した。親化合物[A]の他に、代謝物 [B] が検出された。親化合物[A]は可食部で 19.5～29.3%TRR、非可食部で 17.1～17.3%TRR と代謝が進んでいた。代謝物 [B] は、可食部で 1.5～2.5%TRR、非可食部で 1.5～2.5%TRR で、 [B] と考えられた。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

表 4 魚残留放射能中の親化合物および代謝物の割合

放射能画分	取 込 期 間			
	14 日目		21 日目	
	可食部	非可食部	可食部	非可食部
	各部位における総残留放射能に対する割合 (%TRR)			
親化合物[A]	19.5	17.3	29.3	17.1
合 計	93.6	97.3	95.1	94.2
濃 度(ppm)				
親化合物[A]	3.327	9.941	3.538	9.124
合 計	15.971	55.911	11.484	50.261

<LOQ : 定量限界以下 - : 検出されず

5) 生物濃縮係数 (BCFss)

取込期間 0、3、7、21 および 28 日後の魚の各部位中総残留放射能 (親化合物換算値) を相当する試験液中親化合物濃度で割った値の平均値 (処理区 1、2) と、平衡時における BCFss を表 5 に示す。

表 5 取込期間中における魚の各部位における総残留放射能の BCFss 値

取込期間 (日)	BCFss**								
	可食部			非可食部			全体		
	処理 1	処理 2	平均	処理 1	処理 2	平均	処理 1	処理 2	平均
0 日*	23.07	23.65	23.36	87.24	69.00	78.12	46.77	44.09	45.43
3 日	47.94	85.31	66.63	772.54	781.28	776.91	293.84	477.13	385.48
7 日	46.93	43.52	45.23	752.89	721.02	736.96	511.17	421.76	466.47
21 日	61.86	91.10	76.48	605.95	687.71	646.83	447.68	400.47	424.08
28 日	84.72	115.56	100.14	583.38	509.86	546.62	343.97	250.39	297.18
平衡時***の BCFss	72 k=9.386 R ² =0.932			677 k=2.983 R ² =0.983			393 k=2.937 R ² =0.975		

* : 0.0417 日

** : [魚中総残留放射能 (親化合物換算値)] ÷ [試験水中親化合物濃度]

*** : 3~28 日の値から算出

注) 14 日については、水中の親化合物の割合を測定していないので BCF の算出から除外した。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

本試験の結果から、シプロジニルの取込は、7～14 日間で平衡に達し、生物濃縮係数（BCFss）は可食部、非可食部および全魚体でそれぞれ、72、677 および 393 であった。

魚からの排泄は速やかで、消失半減期は 0.3～0.8 日であった。可食部、非可食部ともに親化合物 [A]の他に主要代謝物として が検出された。

[申請者注]

表 4 の魚残留放射能中の親化合物の%TRR¹をもとに算出した親化合物の濃縮係数²を表 6 に示す。

表 6 魚の各部位における親化合物の BCFss 値（申請者が算出）

BCFss		
可食部	非可食部	魚全体 ³
18	116	81

親化合物としての生物濃縮係数（BCFss）は可食部、非可食部および魚全体でそれぞれ約 18、116、および 81 であった。

¹親化合物の%TRR は 14 日目と 21 日目の平均値

²親化合物の濃縮係数 = (平衡状態の BCFss) × (親化合物の%TRR)

³魚全体における親化合物の%TRR は可食部および非可食部の%TRR と可食部/非可食部の重量比より算出。

可食部/非可食部の重量比（46.7 : 53.3）は表 3 の取り込み期間における可食部/非可食部/魚全体の放射能分布比の平均値より算出

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

7. 代謝分解のまとめ

シプロジニル の動物、植物、土壌等における代謝、分解の要約は下記の通りである。

(1) 動物体内運命に関する試験

ラットを用いて吸収、分布、代謝および排泄に関する運命試験を実施し、動物体内におけるシプロジニルの運命を調べた。

標識シプロジニル 0.5 あるいは 100mg/kg、 標識シプロジニル 100mg/kg をラットに経口投与し、血中濃度、組織中分布、代謝および排泄を検討した。

(血中濃度) 血中パラメーターを以下に示す。低濃度雄を除きピークが二つ認められ、低濃度では最初のピーク、高濃度では二回目のピークが Cmax であった。ピークが二つ認められること、および二相性の減衰を示すことから、腸肝循環が示唆された。

パラメーター	0.5mg/kg		100mg/kg	
	雄	雌	雄	雌
Cmax (ppm)	0.082	0.467	8.955	3.485
Tcmax (時間)	0.5	1	12	8
Tcmax _{1/2} (時間)	1	2	19	36
AUC _{0-48hr} (μg·hr/g)	0.6	5.9	147.2	107.5

(胆汁排泄) 胆汁排泄試験で、0-48 時間の胆汁、尿中排泄は約 39、35%TAR、組織内残留が 8%TAR であることから、吸収率は約 82%と推定された。尚、糞中排泄は約 14%TAR であった。

(組織内分布) Tcmax 時に組織内残留濃度も最高値を示した。腎臓、肝臓および甲状腺で残留値が高かった。消失速度は 2 相性を示した (低濃度では、第 1 相半減期は 0.3~2 時間、第 2 相半減期は 5~17 時間)。

(代謝) 代謝物として

が検出された。このことから、動物における主要な代謝分解経路は以下の通りと推定された。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

(糞尿中排泄) 0~168 時間の排泄率は尿中が 48.30~67.64%TAR、糞中が 28.82~46.82%TAR で、96%TAR 以上が排泄された。

(2) 植物体内運命に関する試験

小麦、トマト、りんごおよびばれいしょを用いて植物体内におけるシプロジニルの運命を調べた。

(小麦) 標識シプロジニルあるいは 標識シプロジニルを小麦に 2 回 (1 回目 : 750g a.i./ha、2 回目 : 500g a.i./ha) 茎葉散布した。収穫時の総残留放射能は、麦藁で約 14.9ppm、籾殻で 6.8~8.2ppm、種実で 0.11~0.22ppm であった。代謝物として、 確認された。 %TRR 以上は の %TRR (麦藁) のみであった。また、種実のでんぷんに %TRR が取り込まれていた。小麦の主要代謝経路は以下のように想定された。

(トマト) 標識シプロジニルあるいは 標識シプロジニルをトマトに 750g a.i./ha、2 回茎葉散布した。収穫時の総残留放射能は、葉で 72.7~112.4ppm、果実で 5.0~6.7ppm であった。代謝物として が確認された。 %TRR 以上は、 が葉で 、果実で %TRR、 が葉で %TRR であった。トマトの主要代謝経路は以下のように想定された。

(りんご) 標識シプロジニルをりんごに 75mg a.i./樹、3 回散布した。収穫時の総残留放射能は、葉、果皮および果肉で 49.3、3.5 および 0.2ppm であった。代謝物として、 が確認された。成熟期果皮の非抽出性残渣 (53.6%TRR) を分画した結果、 が取り込まれていた。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

りんごの主要代謝経路は以下のように想定された。

(ばれいしょ) 標識シプロジニルあるいは 標識シプロジニル
を、ばれいしょに 560g a.i./ha、3 回処理した。収穫時の総残留放射能は、茎葉、塊茎(皮)および
塊茎(皮以外)で 24.7~25.9ppm、0.09ppm および 0.07~0.09ppm であった。
代謝物として、 が確認さ
れた。 は塊茎(皮除く)中で %TRR (ppm) であった。成熟期の塊茎の非抽出残渣
を加水分解処理し分画したところ、蛋白画分に 0.8~5.4%TRR、澱粉画分に 5.3~14.6%TRR が
取り込まれていた。ばれいしょの主要代謝経路は以下のように想定された。

以上より、植物における主要な代謝分解経路は以下の通りである。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

(3) 土壌中運命に関する試験

微砂質壤土および壤質砂土を用いて、好氣的条件（一部、嫌氣的条件および滅菌条件含む）での代謝を検討した。

微砂質壤土に 標識シプロジニルあるいは 標識シプロジニル
を約 1.5ppm 処理し、20℃でインキュベーションした。嫌氣条件下あるいは滅菌条件下では代謝は殆ど認められなかった。好氣条件下、半減期は 19.0～21.4 日であった。代謝物として
が確認されたが、 %TRR 以下であった。その他、二酸化炭素が 24～25%TRR 検出された。壤質砂土に 標識シプロジニルあるいは 標識シプロジニル
を約 3.0ppm 処理し、20℃でインキュベーションした。好氣条件下、半減期は 23.7～41.7 日であった。代謝物として 標識シプロジニル
が確認されたが、 %TRR 以下であった。その他、二酸化炭素が 13～17%TRR 検出された。

微砂質壤土に 標識シプロジニルを種々の条件（処理量；0.1 あるいは 1.0ppm、
温度；10 あるいは 20℃、土壌湿度；圃場容水量の 30 あるいは 60%）で試験し、代謝への影響を
検討した。処理量 0.1ppm、温度 20℃、土壌湿度 60%FC の方が代謝分解が速かった。

以上より、土壌における主要な代謝分解経路は以下の通りである。

(4) 環境中運命に関する試験

標識シプロジニル (pH5、7、9；25℃) あるいは 標識シプロジニル (pH4、7、9；50℃) を用いて各 pH での加水分解性を検討した。25℃における各 pH での半減期は 1 年以上で安定であった。

標識シプロジニルの緩衝液 (pH7.3) 中での光分解 (25℃) を検討した。半減期は、17.6 日（東京春換算 7.2 日）であった。

標識シプロジニルの緩衝液/滅菌蒸留水中の各種条件下での光分解(25℃)を検討した。溶媒を用いない蒸留水中での半減期は東京春自然光換算で 14.5 日であった。

標識シプロジニルおよび

標識シプロジニルの自然水中での

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

光分解 (25°C) を検討した。半減期は 12.1 日 (東京春換算 3.2 日) であった。分解物として
および二酸化炭素が確認された。

非標識シプロジニルの自然水/滅菌蒸留水中での光分解(25°C)を検討した。滅菌蒸留水中での半
減期は 24.2 日 (東京春換算 158.7 日)、自然水での半減期は 0.9 日 (東京春換算 5.9 日) であっ
た。自然水のみにおいて分解物として が確認された。

6 種の日本土壌を用いて、非標識シプロジニルの土壌吸着性を検討した。 K_F^{ads} は 9.22~44.04、
 $K_F^{ads}_{OC}$ は 591~6225 であった。シプロジニルの土壌移動性は低いと考えられた。

標識シプロジニルを用いて、ブルーギルサンフィッシュにおける濃縮倍率
(BCF_{ss}) を求めた。BCF_{ss} は魚全体で 393、可食部 72、非可食部 677 であった。

として、 が %TRR 検出された。排泄期間中の消失半減期は 0.3~0.8 日であった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はシンジェンタジャパン株式会社にある。

付. シプロジニルの開発年表

C

C