

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。

IX. 動植物および土壌等における代謝分解

ジクワットジプロミドの代謝試験には以下の標識位置の化合物を用いた。

名称	構造式および標識位置
標識ジクワットジプロミド	
標識ジクワットジプロミド	

<代謝分解試験一覧表>

資料 No.	試験の種類	供試動物植物等	供試数	投与方法および処理量	試験機関報告年	頁	
M-01 GLP	動物代謝 代謝/分布 および排泄	ラット	雌雄 各 5	標識ジクロ ットジプロミドを 1mg ㊦/kg 単回経口投与	1991 年	m-15	
	1 日後までに 90%TAR 以上が糞尿中に排泄され、7 日後には尿中に 3~4%TAR、糞中に 93~95%TAR が排泄された。糞尿中からは、親化合物のみが確認された。7 日後、いずれの組織からも残留放射能は認められなかった。						
M-02 GLP	動物代謝 代謝/分布 および排泄	ラット	雌雄 各 5	標識ジクロ ットジプロミドを 100mg ㊦/ kg 単回経口投与	1991 年	m-18	
	4 日後までに 90%TAR 以上が糞尿中に排泄され、7 日後には尿中に 7~9%TAR、糞中に 84~87%TAR が排泄された。糞尿中からは、親化合物のみが確認された。7 日後の各組織中総残留放射能は、腎臓および肝臓で高かった。						
M-03 GLP	動物代謝 吸収および 分布	ラット	雌雄 各 3 or 18	標識ジクロ ットジプロミドを 1 あるいは 100mg ㊦/kg 単回経口投 与	1991 年	m-21	
	血中パラメーターは以下の通りであった。また、組織中総残留放射能は、肝臓、腎臓および肺で高い値を示した。						
	投与量		1mg/kg		100mg/kg		
	性別		雄	雌	雄		雌
	Cmax (μg/g)		0.013	0.014	1.862		0.993
	Tcmax (hr)		1	2	1		1
	AUC _{0-24hr} (μg · hr/g)		0.111	0.096	8.365		9.053
M-04 GLP	動物代謝 代謝物同定	ラット	雌雄各 5	資料 No.M-03 の尿 (48 時間後まで) および糞 (72 時間後まで) を使用	1991 年	m-26	
	尿から親化合物 が 76.2~79.8%TRR 検出された。糞抽出液からは親化合物 が 75.4~ 86.7%検出された。						

資料 No.	試験の種類	供試動物等	供試数	投与方法および処理量	試験機関 報告年	頁
M-05	動物代謝 代謝および 排泄	ラット	雄 5	標識ジクワット ジプロミドを 45mg ｲﾝ/kg 単回経口投与あるいは 10mg ｲﾝ/kg 単回皮下投 与	1976 年	m-29
	3 日以内に 90%TAR 以上が排泄され、経口では糞、皮下では尿が主要経路 であった。大部分は親化合物 として排泄されたが、代謝物として が確認された。経口投与後の吸収率は約 6.8%と推定された。					
M-06 GLP	動物代謝 吸収および 排泄	ラット	雄 12	標識ジク ワットジプロミドを非標識ジ クワットジプロミドで希釈し て、剃毛した背部に 0.05、0.5 および 5.0mg 適用	1988 年	m-32
参考 資料 MR-01 GLP	動物代謝 吸収/分布 および排泄				1986 年	m-35
参考 資料 MR-02	動物代謝 皮膚透過性 (<i>in vitro</i>)				1985 年 1991 年修正	m-40

資料 No.	試験の種類	供試動植物等	投与方法および処理量	試験機関 (報告年)	頁
参考資料 MR-03 GLP	動物代謝 皮膚透過性 (<i>in vitro</i>)			1990年	m-42
参考資料 MR-04 GLP	動物代謝 皮膚透過性 (<i>in vitro</i>)			1990年	m-44
M-07	植物代謝 分布/代謝	大麦 オート麦	標識ジクットジ ブロミドを大麦およびオート 麦の地上部に 0.3、0.6 お よび 1.1kg/ha、あるいは 標識ジクット ジブロミドを大麦中止部に 0.77kg/ha 散布 (枯凋処理)	1973年	m-46
	親化合物	は速やかに光分解し、 が %TRR 以上検出され、その他、 が認められた。			
M-08	植物代謝 代謝	小麦 大麦	標識ジクットジ ブロミドを小麦に通常量お よびその 100 倍量散布。 標識ジクット ジブロミドを大麦に 1.1kg/ha 散布	1978年	m-55
	親化合物	は を生成した。さらに、 代謝物が天然植物成分に取り込ま れると考えられた。			

資料 No.	試験の種類	供試動植物等	投与方法および処理量	試験機関 (報告年)	頁
M-09 GLP	植物代謝 分布/代謝	小麦	標識ジク ワットジプロミド [®] を小麦に 10.2kg/ha 散布	1989 年	m-60
	親化合物 は を生成した。さらに、籾殻の植物構成成分 (アミノ酸、タンパク質、サッカライド、リグニン、でんぷん、セルロース等) 画分から放射活性が認められ、代謝物が天然植物成分に取り込まれると考えられた。				
M-22 GLP	植物代謝 分布/代謝	なたね	標識ジク ワットジプロミド [®] をなたね の成熟期に 575g/ha で 枯凋処理	2012 年	m-67
	種子中の代謝物を分析したところ、主要代謝物はジクワット (48.0%TRR、0.465mg/kg) であった。その他に、 が検出されたが、いずれも %TRR 未満であった。ジクワットは に代謝されると考えられた。				
M-10	植物代謝 分布/代謝	なたね	標識ジクワット ジプロミド [®] を 0.3、0.6 お よび 1.1kg/ha 相当地上 散布	1971 年	m-72
	なたね油中の TRR は 7 日後で検出限界以下、14 日後で 0.02ppm 以下であった。油粕中 TRR は最大で 3.22ppm で、55~59%TRR は親化合物 であった。				
M-23 GLP	植物代謝 分布/代謝	ばれいしょ	標識ジク ワットジプロミド [®] をばれい しょの塊茎成熟期に 969g/ha で枯凋処理	2012 年	m-75
	塊茎 (皮を除く) および皮中の代謝物を分析したところ、主要代謝物はジクワット (71.7~78.7%TRR、0.023~0.031mg/kg) であり、その他に主要な代謝物は認められなかった。				

資料 No.	試験の種類	供試動植物等	投与方法および処理量	試験機関 (報告年)	頁
M-11	植物代謝 分布/代謝	ばれいしょ	標識ジクワット ジプロミドを 1.7kg/ha 相 当地上散布 (枯凋処理)	1967 年	m-80
	塊茎における残留量は 0.012~0.047ppm で、 以外の代謝物は検出されな かった。				
M-24 GLP	植物代謝 分布/代謝	トマト	標識ジク ワットジプロミドをトマト の発芽直前に土壤に 1032g/ha 散布	2012 年	m-83
	果肉および葉中の総残留放射能を分析したところ、いずれも 0.01 mg ジクワ ットイオン/kg 未満と低かった。トマトにおけるジクワットジプロミドの土 壌からの取り込みはわずかであると考えられた。				
M-12	植物代謝 代謝	トマト とうもろこし	標識ジクワットジ プロミドを各種条件で処 理	1966 年	m-85
	代謝的な分解ではなく、光による分解が想定された。分解は太陽光暴露 1 週間以内に起こり、分解量と光強度との間には相関性が認められた。 への分解が示唆された。				
M-13	植物代謝	水稻 (除外理由)			m-90

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。

資料 No.	試験の種類	供試動植物等	投与方法および処理量	試験機関 (報告年)	頁
参考 資料 MR-05	植物代謝 後作残留	にんじん レタス 小麦		1989年	m-97
参考 資料 MR-06	植物代謝 代謝メカニズム				m-100

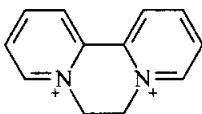
資料 No.	試験の種類	供試動植物等	投与方法および処理量	試験機関 (報告年)	頁
M-14 GLP	土壌代謝 好氣的 湛水条件	砂土	乾土約 10g に池水約 30mL を添加し、 標識ジクワットジプロミド [®] を乾土当たり 2.677 μ g 1 α /g 施用し、約 25 $^{\circ}$ C で 31 日間インキュベート	1988 年	m-103
M-15 GLP	土壌代謝 好氣的条件	砂壤土	乾土約 10g に 標識ジクワットジプロミド [®] を乾土当たり 2.677 μ g 1 α /g 施用し、約 25 $^{\circ}$ C で 9 か月間インキュベート	1988 年	M-105
M-16 GLP	土壌代謝 嫌氣的 湛水条件	砂土	乾土約 10g に池水約 30mL を添加し、 標識ジクワットジプロミド [®] を乾土当たり 2.677 μ g 1 α /g 施用し、窒素ガス下、約 25 $^{\circ}$ C で 9 か月間インキュベート	1988 年	m-107

資料 No.	試験の種類	供試動植 物等	投与方法および処理量	試験機関 (報告年)	頁
参考 資料 MR-07 GLP	土壌中微生物による分解	砂壤土 2種			m-109
参考 資料 MR-08 GLP	土壌中微生物による分解	壤質砂土 砂質埴壤土		2001年	m-113
参考 資料 MR-09	土壌中代謝	砂土 砂壤土 埴壤土2 泥炭土		1975年	m-117

資料 No.	試験の種類	供試動植物等	投与方法および処理量	試験機関 (報告年)	頁
M-17 GLP	加水分解	緩衝液 (pH5、7、9)	<p>標識ジクワットジプロクトを pH5、7 および 9 の緩衝液に 55mg イオン/L 施用し、25°C、暗所下、30 日間インキュベート</p>	1985 年	m-122
			<p>pH5 および 7 では、30 日間分解は認められなかった。pH9 では僅かに分解が認められ、推定半減期は約 222 日であった。</p>		
M-18 GLP	水中光分解	緩衝液 (pH7)	<p>標識ジクワットジプロクトを 20.1µg イオン/mL 施用し、25°C、54.45W/m² (300~400nm) 照射下、東京春換算で約 92 日間インキュベート</p>	1987 年	m-124
			<p>半減期は一次減衰反応仮定で算出して 32 日 (東京春換算 225~227 日) であった。分解物として が %TRR 検出された。</p>		
M-19 GLP	水中光分解	滅菌 自然水	<p>標識ジクワットジプロクトを 10µg イオン/mL 施用し、25°C、38.74W/m² (300~400nm) 照射下、3 日間インキュベート</p>	2005 年	m-130
			<p>半減期は 31 時間 (東京春換算 6.5 日) であった。代謝物として が検出された。</p>		
M-20 GLP	水中光分解	自然水	<p>非標識ジクワットジプロクトを 5µg イオン/mL 施用し、25°C、43.6W/m² (300~400nm) 照射下、60 時間インキュベート</p>	2000 年	m-133
			<p>半減期は 1.86 日 (東京春換算 10.4 日) であった。</p>		
参考 資料 MR-10	水中光分解			1978 年	m-135

資料 No.	試験の種類	供試動植物等	投与方法および処理量	試験機関 (報告年)	頁
M-21	土壌吸着	4種 日本土壌	ジクワットジプロミド [®] 5.62mg/L の 0.01M 塩化カルシウム水溶液を土壌 に加え (土/水比 0.2)、16 時間 振とう (予備試験)	1991 年	m-138
	水相中のジクワットジプロミド濃度は検出限界以下で、 K_F^{ads} あるいは $K_F^{ads}_{oc}$ は求められなかった。ジクワットは強度の土壌吸着性を有すると考 えられた。				
参考 資料 MR-11	土壌吸着			1994 年	m-140

<代謝分解物一覧表>

記号	一般名または略称	化学名	構造式	由来
[A]	ジクワット	1,1'-エチレン-2,2'- ビピリジリウム		(親)

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。

記号	一般名または略称	化学名	構造式	由来

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。

記号	一般名または略称	化学名	構造式	由来

1. 動物代謝に関する試験

(1) ラットにおける単回経口投与（低用量）後の排泄試験

(資料No.M-01)

試験機関：

報告書作成年：1991年

供試標識化合物： で標識した 1,1'-エチレン-2,2'-ビピリジリウム
ジブロミド（以下、 標識ジクワットジブロミド）

放射化学的純度； 、比放射能；

供試動物： Wistar系ラット 雌雄各5匹
雄 約50日齢、雌 約60日齢、 体重：雄226～240g、雌200～204g

試験方法：

投与； 標識ジクワットジブロミドを非標識ジクワットジブロミド
で希釈後（比放射能 ジクワット（イオン））、ジクワット（イオン）
として1mg/kgの用量で単回経口投与した。

試料の採取； 投与後、ラットを代謝ケージに収容し、尿を投与8、24、36、48、72、96、
120、144及び168時間後に、また糞を投与24、48、72、96、120、144及び168
時間後に採取した。ケージは、24時間毎に洗浄し、洗浄液を回収した。最終の
採取後に、動物をCO₂麻酔下で屠殺し、骨、脳、脂肪組織、心臓、腎臓、肝臓、
水晶体、肺、筋肉、脾臓、精巣/卵巣、胃、胃内容物、小腸、小腸内容物、大
腸、大腸内容物、血漿、全血及びカーカスを採取した。

放射能の測定； 尿、ケージ洗浄液、全血及び血漿はそのまま、糞、細断したカーカス
及び細切した組織/臓器はホモジナイズし、燃焼法によりLSCで放射能を測定
した。

尿及び糞試料の分析； 投与8時間後までの尿をプールし、溶媒系〔メタノール/ヨウ化カ
リウム（100%水溶液）/ブタン-1-オール=80/15/5〕、あるいは溶媒系〔メタノ
ール/水/酢酸=60/30/10〕を用いて、TLC分析した。

投与24時間後までの糞をプールし、10M塩酸（糞/塩酸=1/10）で2時間還流抽出した。抽出物を窒素ガス下で乾燥させ、メタノールに懸濁して遠心分離した。上清を溶媒系〔メタノール/ヨウ化カリウム（100%水溶液）/ブタン-1-オール=80/15/5〕を用いてTLC分析した。

試験結果：

排泄： 投与後の累積排泄率の変化を表1に示した。24時間後までに90%TAR以上が尿あるいは糞中に排泄された。168時間後までに尿中に3~4%TAR、糞中に93~95%TARが排泄された。

表1 投与後の累積排泄率の変化（投与量に対する割合、%TAR）

試料採取時間 (hr)	8	24	36	48	72	96	120	144	168	
♂	尿	1.87	2.16	2.65	2.68	2.70	2.71	2.71	2.72	2.72
	糞	—	91.67	—	94.65	94.74	94.75	94.84	94.84	94.85
	ケージ洗浄液	—	0.20	—	0.24	0.25	0.28	0.29	0.30	0.34
	合計	1.87	94.48	94.52	97.57	97.69	97.74	97.84	97.86	97.90
♀	尿	2.71	3.36	3.44	3.48	3.52	3.53	3.54	3.55	3.55
	糞	—	88.50	—	92.41	92.61	92.64	92.66	92.67	92.67
	ケージ洗浄液	—	0.23	—	0.26	0.29	0.31	0.32	0.33	0.38
	合計	2.71	92.09	92.17	96.15	96.42	96.49	96.52	96.54	96.60

—： 試料採取せず 数値は5匹の平均値

組織中残留量； 投与168時間後の各組織中残留量を表2に示した。

投与168時間後の各組織中の総残留放射能は定量限界未満であった。

尿及び糞試料の分析； プールした尿および糞試料のTLC分析の結果、親化合物[A]のみが確認された。

表2 投与168時間後の各組織中残留放射能

組織/臓器	♂		♀	
	ppm*	%TAR	ppm*	%TAR
骨	0.000	0.000	0.000	0.000
脳	0.000	0.000	0.000	0.000
脂肪組織	0.000	0.000	0.000	0.000
心臓	0.000	0.000	0.000	0.000
腎臓	0.000	0.000	0.001	0.000
肝臓	0.000	0.000	0.000	0.000
肺	0.000	0.000	0.000	0.000
水晶体	0.000	0.000	0.000	0.000
筋肉	0.000	0.000	0.000	0.000
脾臓	0.000	0.000	0.000	0.000
精巣/卵巣	0.000	0.000	0.000	0.000
血漿	0.000	0.000	0.000	0.000
全血	0.000	0.000	0.000	0.000
胃	0.000	0.000	0.000	0.000
小腸	0.000	0.000	0.000	0.000
大腸	0.000	0.000	0.000	0.000

数値は5匹の平均値

*：親化合物換算値

結論： ラットでは、低用量で単回経口投与されたジクワットはほとんど吸収されず、糞中へ排泄された（93～95%TAR）。尿中への排泄は、3～4%TARであった。

(2) ラットにおける単回経口投与（高用量）後の排泄試験

(資料No.M-02)

試験機関:

報告書作成年: 1991年

供試標識化合物: ジプロミド で標識した1,1'-エチレン-2,2'-ビピリジリウム
(以下、標識ジクワットジプロミド)

放射化学的純度; 、 比放射能;

供試動物: Wistar系ラット 雌雄各5匹

雄 約50日齢、雌 約60日齢、 体重: 雄 216~238g、雌 194~206g

試験方法:

投与; 標識ジクワットジプロミドを非標識ジクワットジプロミド
で希釈後（比放射能ジクワット（イオン）、ジクワット（イオン）
として100mg/kgの用量で単回経口投与した。

試料の採取; 投与後、ラットを代謝ケージに収容し、尿を投与8、24、36、48、72、
96、120、144及び168時間後に、また糞を投与24、48、72、96、120、144及び
168時間後に採取した。ケージは、24時間毎に洗浄し、洗浄液を回収した。最
終の採取後に、動物をCO₂麻酔下で屠殺し、骨、脳、脂肪組織、心臓、腎臓、
肝臓、水晶体、肺、筋肉、脾臓、精巣/卵巣、胃、胃内容物、小腸、小腸内容
物、大腸、大腸内容物、血漿、全血及びカーカスを採取した。

放射能の測定; 尿、ケージ洗浄液、全血及び血漿は、そのまま、糞、細断したカーカ
スおよび細切した組織/臓器はホモジナイズし、燃焼法により、LSCで放射能
を測定した。

尿及び糞試料の分析; 投与48時間後までの尿をプールし、溶媒系〔メタノール/ヨウ化
カリウム（100%水溶液）/ブタン-1-オール=80/15/5〕を用いて、TLC分析した。
投与72時間後までの糞をプールし、10M塩酸（糞/塩酸=1/10）で2時間還流抽
出した。抽出物を窒素ガス下で乾燥させ、メタノールに懸濁して遠心分離した。

上清を溶媒系〔メタノール/ヨウ化カリウム（100%水溶液）/ブタン-1-オール
=80/15/5〕を用いて、TLC分析した。

試験結果：

排泄； 投与後の累積排泄率の変化を表1に示した。96時間後までに90%TAR以上が尿あるいは糞中に排泄された。168時間後までに尿中に7~9%TAR（ケージ洗浄液含む）、糞中に84~87%TARが排泄された。

表1 投与後の累積排泄率の変化（投与量に対する割合、%TAR）

試料採取時間 (hr)	8	24	36	48	72	96	120	144	168	
♂	尿	1.09	2.94	3.89	5.31	5.67	5.69	5.70	5.70	5.70
	糞	—	43.44	—	77.02	82.90	83.80	84.08	84.11	84.17
	ケージ洗浄液	—	2.55	—	2.70	2.78	2.80	2.80	2.80	2.90
	合計	1.09	48.93	49.88	85.03	91.36	92.28	92.57	92.62	92.78
♀	尿	1.11	2.79	3.64	4.78	5.02	5.07	5.10	5.11	5.11
	糞	—	30.16	—	69.54	82.40	85.24	86.57	86.79	86.83
	ケージ洗浄液	—	1.39	—	1.52	1.58	1.61	1.62	1.62	1.71
	合計	1.11	34.34	35.19	75.84	89.00	91.92	93.29	93.52	93.65

—： 試料採取せず 数値は5匹の平均値

組織中残留量； 投与168時間後の各組織中残留量を表2に示した。

組織中残留濃度は、腎臓（雄で0.050、雌で0.102ppm）および肝臓（雄で0.032、雌で0.039ppm）であった。

尿及び糞試料の分析； プールした尿及び糞試料のTLC分析の結果、親化合物[A]のみが確認された。

表2 投与168時間後の各組織中残留放射能

組織/臓器	♂		♀	
	ppm*	%TAR	ppm*	%TAR
骨	0.012	0.00	0.010	0.00
脳	0.001	0.00	0.008	0.00
脂肪組織	0.002	0.00	0.017	0.00
精巣/卵巣	0.001	0.00	0.013	0.00
心臓	0.002	0.00	0.008	0.00
腎臓	0.050	0.00	0.102	0.00
肺	0.004	0.00	0.010	0.00
筋肉	0.002	0.00	0.020	0.00
脾臓	0.004	0.00	0.017	0.00
肝臓	0.032	0.00	0.039	0.00
水晶体	0.025	0.00	0.026	0.00
胃	0.011	0.00	0.012	0.00
小腸	0.014	0.00	0.010	0.00
大腸	0.025	0.00	0.017	0.00
血漿	0.014	0.00	0.001	0.00
全血	0.022	0.00	0.015	0.00

数値は5匹の平均値

*：親化合物換算値

結論： ラットでは、経口投与されたジクワットはほとんど吸収されず、大部分が糞中に排泄された（84～87%TAR）。尿中への排泄は、7～9%TARであった。排泄率に性差はみられなかった。

(3) ラットにおける単回経口投与（低用量/高用量）後の組織内分布 （資料No.M-03）

試験機関：

報告書作成年：1991年

供試標識化合物： ジブロミド [以下、 標識ジクワットジブロミド] で標識した1,1'-エチレン-2,2'-ビピリジリウム

放射化学的純度； 比放射能；

供試動物： Wistar系ラット
（雄 約50日齢、雌 約60日齢、体重：雄 174～242g、雌 176～206g）、

試験方法： 投与； 標識ジクワットジブロミド及び非標識ジクワットジブロミドの混合水溶液を以下の用量で単回経口投与した。

群	低/高用量	投与濃度*	供試動物数	比放射能**
A	低用量	1mg/kg	雌雄各3匹	1.567
B	高用量	100mg/kg	雌雄各3匹	0.044
C	低用量	1mg/kg	雄18匹	2.770
D	高用量	100mg/kg	雄18匹	0.027
E	低用量	1mg/kg	雌18匹	1.567
F	高用量	100mg/kg	雌18匹	0.025

*：ジクワット（イオン）として **：単位 MBq/mg

試料の採取； A及びB群の動物は、投与1、2、4、8、12及び24時間後に尾静脈より約250 μ Lを採血した。C、D、E及びF群の動物は、投与2、4、8、24、48及び96時間後に各3匹ずつをCO₂麻酔下で屠殺し、骨、脳、脂肪組織、心臓、腎臓、肝臓、水晶体、肺、筋肉、脾臓、精巣/卵巣、胃、胃内容物、小腸、小腸内容

物、大腸、大腸内容物、血漿、全血及びカーカスを採取した。

試料の調製； 血漿は必要に応じて蒸留水を加えて1mLとし、シンチレーションカクテルと混合した。全血、組織のホモジネート及びカーカスのホモジネートは乾燥し、サンプルオキシダイザーで燃焼処理した。燃焼処理中に発生する CO₂を吸収液に捕集し、シンチレーションカクテルと混合した。

放射能の測定； 全ての試料の放射能を液体シンチレーションカウンター (LSC) で計数した。

試験結果：

A群およびB群の全血中放射能濃度を表1、各種血液パラメーターを
表2に示した。投与1~2時間後に最高濃度 (Cmax) となり、最高濃度は、1mg/kg群で
0.013~0.014µg/g、100mg/kg群で0.993~1.862µg/gであった。半減期は1mg/kg群で3.6~
5.0時間、100mg/kg群で1.6~2.2時間で、高濃度群でむしろ半減期が短かったが、高濃度
では、4~24時間後にかけて濃度が減少しなかった。最高濃度 (Cmax) 及びAUC_{0~24hr}
は、投与量にほぼ比例していた。

表1 全血中放射能濃度 (µg/g：親化合物換算値)

投与量	1mg/kg (A群)			100mg/kg (B群)		
	♂	♀	平均	♂	♀	平均
1	0.013	0.010	0.011	1.862	0.993	1.428
2	0.011	0.014	0.012	1.206	0.878	1.042
4	0.007	0.009	0.008	0.272	0.258	0.265
8	0.006	0.004	0.005	0.144	0.337	0.240
12	0.003	0.002	0.003	0.256	0.345	0.300
24	0.002	0.001	0.002	0.209	0.310	0.259

表2 各種血中動態パラメーター

投与量	1mg/kg (A群)		100mg/kg (B群)	
	雄	雌	雄	雌
Cmax (µg/g)	0.013	0.014	1.862	0.993
Tcmax (hr)	1	2	1	1
半減期 [T _{1/2}] (hr)	5.0	3.6	1.6	2.2
AUC _{0~24hr} (µg・hr/g)	0.111	0.096	8.365	9.053

C、D、E及びF群の各組織中残留濃度を表3（雄）及び表4（雌）に示した。

1mg/kg投与群雄（C群）では、消化管を除くと、腎で最高の放射能濃度が投与2時間後に得られた（0.096 μ g/g）。

100mg/kg投与群雄（D群）では、消化管を除くと、腎、肺及び肝で最高の放射能濃度が投与2時間後に得られた（それぞれ5.751、2.429及び0.865 μ g/g）。腎の放射能濃度は、投与8時間以降も比較的高い値であった。また、消化管では投与96時間後においても有意な放射能濃度であった。

1mg/kg投与群雌（E群）では、消化管を除くと、腎で最高の放射能濃度が投与2時間後に得られた（0.064 μ g/g）。

100mg/kg投与群雌（F群）では、消化管を除くと、腎、肺及び肝で最高の放射能濃度が得られた（それぞれ2.590 [4時間後]、3.802 [2時間後] 及び1.060 [4時間後] μ g/g）。腎の放射能濃度は、投与48時間後には0.739 μ g/g、投与96時間後には0.251 μ g/gであった。

結 論： 1及び100mg/kg投与群共に、血中の放射能濃度に明らかな性差はみられなかった。投与1～2時間後に最高濃度Cmaxに達し、半減期は1.6～5.0時間であった。組織中の放射能濃度は、消化管を除くと肝臓、腎臓および肺で高かった。放射能の組織内分布に性差はみられなかった。

表3 組織中放射能濃度の経時変化（雄： $\mu\text{g/g}$ 、親化合物換算値）

群	1mg/kg (C群)						100mg/kg (D群)					
	2	4	8	24	48	96	2	4	8	24	48	96
骨	0.008	0.008	0.005	0.001	0.000	0.000	0.439	0.462	0.309	0.260	0.259	0.024
脳	0.003	0.003	0.002	0.000	0.000	0.000	0.121	0.132	0.092	0.104	0.064	0.021
脂肪組織	0.005	0.004	0.002	0.000	0.000	0.000	0.140	0.071	0.101	0.187	0.067	0.004
精 巢	0.006	0.005	0.002	0.000	0.000	0.000	0.203	0.182	0.149	0.117	0.117	0.014
心 臓	0.009	0.007	0.004	0.000	0.000	0.000	0.466	0.300	0.340	0.187	0.143	0.028
腎 臓	0.096	0.040	0.022	0.006	0.002	0.001	5.751	3.057	1.755	1.814	1.674	0.194
肺	0.012	0.009	0.003	0.000	0.001	0.000	2.429	2.413	0.945	0.452	0.186	0.025
筋 肉	0.007	0.006	0.003	0.000	0.002	0.000	0.340	0.328	0.226	0.187	0.113	0.017
脾 臓	0.007	0.012	0.004	0.001	0.000	0.000	0.337	0.411	0.362	0.275	0.227	0.038
肝 臓	0.014	0.011	0.006	0.001	0.001	0.000	0.865	0.865	0.461	0.460	0.315	0.065
水晶体	0.001	0.004	0.001	0.000	0.000	0.000	0.074	0.733	0.140	1.025	0.173	0.074
胃	0.695	0.744	0.160	0.030	0.012	0.009	88.562	91.779	130.48	184.30	24.923	0.236
小 腸	2.208	0.447	0.104	0.037	0.006	0.003	80.341	37.843	31.336	36.298	8.561	0.583
大 腸	0.162	2.583	2.819	0.257	0.023	0.009	8.599	58.742	64.062	90.947	17.699	1.942
カーカス	0.010	0.009	0.075	0.004	0.000	0.000	0.482	0.499	3.424	1.357	0.395	0.116
全 血	0.010	0.006	0.003	0.001	0.000	0.000	0.436	0.251	0.207	0.135	0.137	0.006
血 漿	0.016	0.007	0.002	0.000	0.000	0.000	0.614	0.301	0.239	0.161	0.086	0.005
胃内容物 ^a	25.846	4.333	0.819	22.424	0.527	0.221	9783.9	11360	10892	3988.7	3667.5	12.099
小腸内容物 ^a	117.167	20.168	4.590	1.978	0.315	0.261	3500.4	1276.2	1276.2	926.22	232.50	22.338
大腸内容物 ^a	3.395	78.298	99.378	8.004	0.713	0.415	358.06	3983.9	2812.7	2815.1	618.33	60.449

a : 総量(μg)で示した 数値は3匹の平均値

表4 組織中放射能濃度の経時変化 (雌: $\mu\text{g/g}$ 、親化合物換算値)

群	1mg/kg (E群)						100mg/kg (F群)					
	投与後時間(hr)	2	4	8	24	48	96	2	4	8	24	48
骨	0.009	0.005	0.002	0.000	0.001	0.001	0.285	0.441	0.157	0.154	0.140	0.085
脳	0.003	0.001	0.001	0.000	0.002	0.000	0.131	0.123	0.058	0.056	0.490	0.119
脂肪組織	0.006	0.003	0.001	0.000	0.001	0.000	0.216	0.127	0.115	0.209	0.322	0.094
卵巣	0.010	0.007	0.002	0.001	0.000	0.000	0.570	0.400	0.196	0.272	0.069	0.011
心臓	0.010	0.007	0.003	0.001	0.001	0.000	0.440	0.347	0.240	0.249	0.154	0.015
腎臓	0.064	0.039	0.026	0.006	0.002	0.002	2.272	2.590	1.398	2.054	0.739	0.251
肺	0.011	0.008	0.004	0.000	0.001	0.000	3.802	1.526	1.854	0.355	0.105	0.038
筋肉	0.008	0.005	0.002	0.000	0.000	0.000	0.247	0.231	0.151	0.111	0.156	0.032
脾臓	0.013	0.007	0.004	0.001	0.001	0.000	0.279	0.435	0.220	0.217	0.100	0.082
肝臓	0.016	0.011	0.005	0.001	0.001	0.001	0.833	1.060	0.339	0.476	0.164	0.059
水晶体	0.005	0.004	0.001	0.001	0.003	0.001	0.225	0.344	0.112	0.046	0.094	0.097
胃	0.752	0.436	0.009	0.055	0.001	0.000	134.04	198.21	137.94	154.42	7.823	0.227
小腸	5.073	0.788	0.201	0.051	0.003	0.001	78.972	32.170	26.889	84.240	12.033	0.833
大腸	0.485	3.086	3.890	0.112	0.009	0.001	49.669	112.46	89.399	84.365	38.855	2.544
カーカス	0.007	0.003	0.045	0.002	0.001	0.001	0.630	0.634	0.498	2.265	1.745	0.007
全血	0.012	0.006	0.001	0.002	0.001	0.001	0.235	0.232	0.108	0.244	0.000	0.000
血漿	0.016	0.005	0.004	0.002	0.001	0.000	0.420	0.352	0.163	0.386	0.055	0.017
胃内容物 ^a	22.985	9.664	0.267	1.682	0.054	0.005	9258.6	9976.9	9648.4	5755.5	274.49	9.578
小腸内容物 ^a	62.674	14.225	4.109	1.362	0.052	0.007	1947.4	672.80	656.25	1388.5	192.78	17.484
大腸内容物 ^a	9.333	64.573	75.043	2.295	0.183	0.013	1991.6	2849.2	2050.1	1721.1	1219.2	79.246

a: 総量(μg)で示した 数値は3匹の平均値

糞； 糞中から回収された放射能の投与量に対する割合は平均85.5%であった。
プールした糞抽出液のHPLC分析結果を表2に示す。ジクワット[A]が抽出液中放射能の86.7%（雄）および75.4%（雌）確認された。その他、
が確認された。

ラットにおける推定代謝経路を図に示す。

表1 尿中代謝物 (%TRR)

代謝物	雄	雌
ジクワット[A]	76.2	79.8

表2 糞中代謝物（抽出液中放射能に対する割合、%）

代謝物	雄	雌
ジクワット[A]	86.7	75.4

結論： 標識ジクワットジプロミドをジクワット（イオン）として
100mg/kgの用量でラットに単回経口投与後、尿中からジクワット[A]の他に
が確認された。

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。

図 ラットにおける推定代謝経路

(5) 経口投与あるいは皮下投与後のラットにおける代謝/排泄 (資料No.M-05)

試験機関：

報告書作成年：1976年

供試標識化合物： 以下、
で標識した1,1-エチレン-2,2'-ビピリジリウムジプロミド
標識ジクワットジプロミド)

*： 標識位置

放射化学的純度； 比放射能；

供試動物： Wistar系ラット（体重180～200g）、1群雄5匹

方 法：

投与方法等；

- 1) 経口及び皮下投与試験； 標識ジクワットジプロミドを非標識ジクワットジプロミド で希釈後、水に溶解し、各5匹のラットに単回経口投与（45mgイオン/kg）あるいは単回皮下投与（10mgイオン/kg）した。
- 2) *in vitro*試験； 酵母抽出液（0.5%）、ブドウ糖（0.5%）およびペプトン（0.5%）を含む0.1Mリン酸緩衝液（pH7.2）を用いて、ラット盲腸内容物の10%ホモジネートを調製した。これを37℃で2時間インキュベートした後、遠心分離（2500 rpm、10分）によって上清を得た。この上清に 標識ジクワットジプロミド水溶液（500μg）を添加し、37℃で24時間インキュベートした後、反応を停止させた。

試料採取； 尿及び糞を5匹ずつまとめて24時間ごとに、4日間採取した。

分析方法；

尿は水で4倍に希釈し、LSCで放射能を測定した。糞は、2N-硫酸（10%w/v）を加えて3時間還流した後、酸抽出液及び残渣に分けた。酸抽出液はそのまま、残渣は燃焼法により、それぞれLSCで放射能を測定した。

希釈尿及び糞の酸抽出液を弱陽イオン交換樹脂に吸着させ、洗浄後、カラムに保持されたジクワットを飽和塩化アンモニウム溶液で溶出した。溶出液中のジクワットを比色定量した。

尿（0～48時間）、糞（0～48時間）の酸抽出液及び*in vitro*試験の培養液について、

弱陽イオン交換クロマトグラフィー（試料を添加後水で洗浄し、5%ギ酸で溶出）でクリーンアップ/抽出し、ペーパークロマトグラフィーまたはTLCで代謝物を同定した。

結 果：

経口投与および皮下投与後の排泄率の変化を表1および表2に示した。いずれの投与方法でも、投与後3日以内に90%TAR以上が尿または糞中に排泄された。経口投与では糞中、皮下投与では尿中排泄が主要経路であった。尚、排泄放射能の大部分は親化合物[A]として排泄された。

表1 経口投与後の排泄率の変化（投与量に対する割合、%TAR）

試料		0～1日	1～2日	2～3日	3～4日	計
尿		3.8 (3.5)	1.5 (1.3)	0.9 (0.5)	0.1 (0.02)	6.3 (5.3)
糞	酸抽出液	32.8 (27.4)	25.9 (21.7)	11.7 (6.7)	3.2 (1.9)	73.6 (57.7)
	残渣	9.4	3.3	2.3	1.7	16.7
累計		46.0	76.7	91.6	96.6	—

() 内は、ジクワットの比色定量値 —：該当せず

表2 皮下投与後の排泄率の変化（投与量に対する割合、%TAR）

試料		0～1日	1～2日	2～3日	3～4日	計
尿		79.0 (74.5)	4.9 (3.5)	1.7 (0.8)	1.5 (0)	87.1 (78.8)
糞	酸抽出液	3.1 (0.6)	0.7 (0)	0.3 (0)	0.15 (0)	4.3 (0.6)
	残渣	0.2	0.1	0.2	0.05	0.6
累計		82.3	88.0	90.2	91.9	—

() 内は、ジクワットの比色定量値 —：該当せず

各試料中の代謝物の割合を表3に示した。代謝物として、
 が検出された。経口投与後の糞あるいは*in vitro*培養液中で
 が比較的多い傾向が認められた。その他、組織中では、さらに に代謝される
 ものと考えられた。しかし、大部分は親化合物のジクワット[A]のままであった。

表3 各試料中の代謝物の割合

投与経路等	試料	代謝物 (%TAR)			
		[A] ジクワット			
経口	尿	5.1			
	糞	57.1			
皮下	尿	74.5			
培養 (<i>in vitro</i>)	培養液	88.0			

結 論： ジクワットは腸内細菌叢および吸収後組織中である程度まで代謝される可能性が示唆されたが、大部分は未変化のまま尿及び糞中に排泄されることが示された。代謝物としては、
 が確認された。尚、経口投与後の吸収率は約6.8%と推定された。

(6) ラットにおける経皮吸収試験

(資料No.M-06)

試験機関:

報告書作成年: 1988年

供試標識化合物: ジプロミド で標識した1,1'-エチレン-2,2'-ビピリジリウム
(以下、 標識ジクワットジプロミド)

*: 標識位置

放射化学的純度; 比放射能;
尚、標識化合物は、純度 %の非標識ジクワットジプロミドで希釈して試験に用いた。

供試動物: Sprague-Dawley系ラット (約7~8週齢、体重 245~309g)
1群雄12匹

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。

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。

参考資料

- (7) パラコート及びジクワットの製剤（単剤及び混合剤）のラットにおける排泄及び組織内分布の比較試験 (資料No.MR-01)

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。

以上より、ジクワットとパラコートは、血中濃度変化、分布及び排泄において、同様の傾向を示した。また、両化合物を混合することの影響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。

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。

参考資料

(8) ジクワット製剤原液及び散布液ジクワットのヒト皮膚からの透過性 (*in vitro*)

(資料No.MR-02)

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 論：ヒトの皮膚からのジクワット吸収は、非常に緩慢であり、またその量も非常に少量であると結論される。

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。

参考資料

(9) ヒト及びラットの皮膚の透過性 (*in vitro*)

(資料No.MR-03)

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 論： ヒトの皮膚におけるジクワットの透過性は、ラットの皮膚に比較して低い
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。

参考資料

(10) ヒト、ウサギ、モルモット、マウス及びラットの皮膚の透過性 (*in vitro*)

(資料No.MR-04)

結 論： ヒトの皮膚におけるジクワットの透過（吸収）は、透過が始まるまでの時間が他の供試動物に比べて長いこと、並びに透過率が低いことから、他の実験動物の皮膚よりも優れたバリアーであると考えられる。

2. 植物代謝に関する試験

(1) 大麦およびオート麦における代謝試験

(資料 No. M-07)

試験機関：

報告書作成年： 1973年

供試標識化合物： で標識した 1,1'-エチレン-2,2'-ビピリジリウムジブロミド
(以下、 標識ジクワットジブロミド) ならびに で標識した1,1-
エチレン-2,2'-ビピリジリウムジブロミド (以下、 標識ジクワットジブロミド)

化合物	標識体	標識体
構造式 (* : 標識位置)		
比放射能		
放射化学的純度		

供試植物： 大麦およびオート麦

個別のポットで栽培した大麦およびオート麦 (標識体)、および木製の箱で栽培した大麦 (標識体) を成熟期まで生育させた。

方法：

処理液の調製： ジクワットジブロミドを 0.1%Lissapol NX
に溶解し、処理液を調製した。

処理方法： 大麦およびオート麦 (標識体処理区) あるいは木製の箱の中央部分 (標識体処理区) に処理液を散布し枯凋処理した。
散布後、植物の上に、ポリテン製紫外線透過性シートを被せて降雨を防止したが、太陽光線は通過するようにした。

処理量： 標識体処理区 (大麦およびオート麦) ;
0.3、0.6 および 1.1 kg ai/ha (0.25、0.5 および 1.0 lb ai/acre)
標識体処理区 (大麦) ; 0.77 kg ai/ha (0.7 lb ai/acre)

試料の採取：

標識体処理区 (大麦およびオート麦) ;
処理7日および14日後に植物を採取した。採取した植物は、茎と穀粒に分離し、それぞれ分析試料とした。

標識体処理区（大麦）；

処理直後、処理 1、3、7、14 および 49 日後に大麦の茎を 2 g 採取し、分析試料とした。

分析方法： 標識体処理区（大麦およびオート麦/茎および穀粒、2 連）、および
標識体処理区（オート麦/茎、1 連）の抽出・分析スキームをそれぞれ図 1 および図 2 に示す。

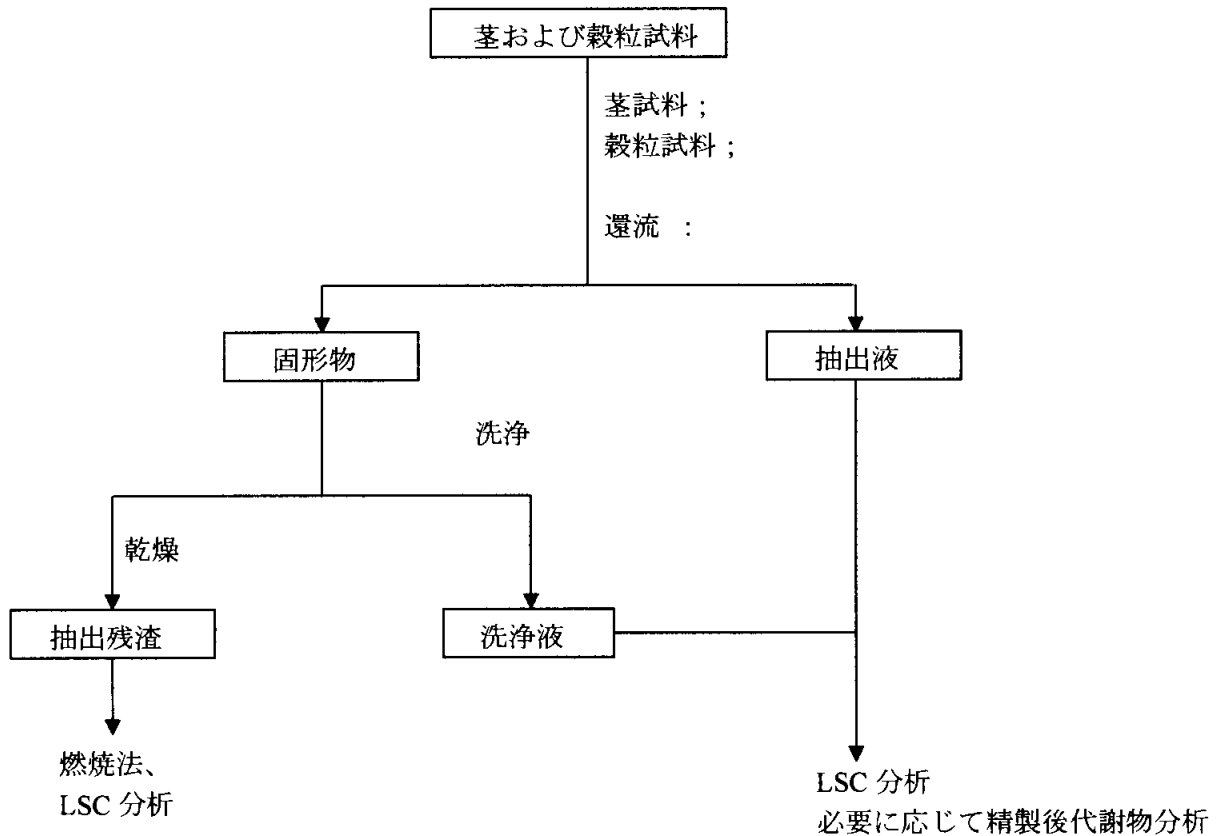


図 1 大麦およびオート麦（茎および穀粒）試料の抽出および分析スキーム
< 標識体処理区 >

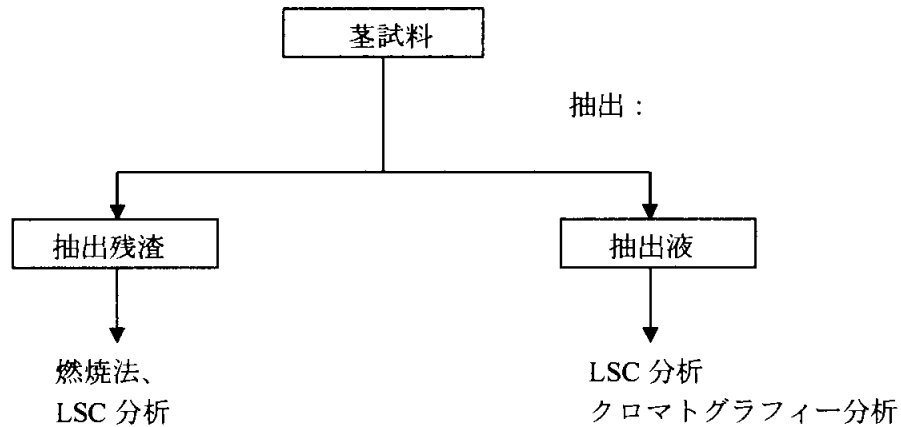


図2 大麦茎試料の抽出および分析スキーム
< 標識体処理区 >

ジクワットの定量： 抽出液の一部に非標識ジクワットジブロミドを溶解し
によりジクワットを沈殿させた。その後、
燃烧分析後の LSC 分析により放射能を測定し、比放射能から植物試料抽出
液中のジクワットの割合を算出した。

代謝物の定量： 一部の試料について実施した。
は、

燃烧法により LSC で放射能を測定し、比放射能から植物試
料抽出液中の各代謝物の割合を算出した。 についても同様の方法で代
謝物の割合を算出した。

結果：

総残留放射能： 標識体を処理した大麦、オート麦、および
標識体を処理した大麦における総残留放射能 (TRR) 濃度を表 1、2 および 4 に示す。
標識体処理区では、いずれの試料においても 1.1 kg/ha の処理区におい
て総残留放射能濃度が最も高く、大麦茎、穀粒およびオート麦茎、穀粒でそれぞれ、
90.7~98.3 ppm、14.6~14.8 ppm、および 27.2~42.2 ppm、6.9~8.1 ppm であった。
標識体処理区における大麦茎の総残留放射能濃度は、処理 1 日後に最
大 277 ppm であり、その後減少し、49 日後には 34 ppm となった。

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。

また、
標識体処理区における茎および穀粒は、それぞれ 78.9～92.3%
TRR および 85.2～92.8%TRR が
により抽出され、
標識体
処理区における大麦茎は、66.7～99.5%TRR が
により抽出された。

ジクワット量： 表 1、2 および 4 に示すように、大麦およびオート麦に処理されたジクワット [A] は経時的に速やかに分解した。
標識体を処理した大麦の茎では、ジクワット [A] は処理 1 日後で 34.6%TRR であったが、その後減少し、49 日後には 6.6%TRR となった。

代謝： 標識体を処理した大麦およびオート麦における代謝物分布を表 3 に示す。大麦における主要残留物として、ジクワット [A] および
が
、茎においてそれぞれ 8.7～18.5%TRR (%TRR：総残留放射能に対する割合) および
%TRR、穀粒においてそれぞれ 36.3%TRR および
%TRR 検出された。その他の代謝物として、茎において
が
%TRR 検出された。オート麦においても茎および穀粒の主要残留物はジクワット [A] であり、それぞれ 44.4%TRR および 23.1%TRR 検出され、主要代謝物として
が検出された (茎； %TRR、穀粒； %TRR)。

標識体を処理した大麦の茎における代謝物分布を表 4 に示す。主要残留物はジクワット [A] であったが、代謝物として
が検出され、処理 14 日後に %TRR に達したが、49 日後には %TRR に減少した。その他の代謝物として、

検出されたが、いずれも

%TRR 未満であった。

想定代謝経路： 大麦およびオート麦において、
が %TRR を超えて検出された。
他に
が検出された。

ジクワットの大麦およびオート麦における想定代謝経路を図 3 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 大麦における総残留放射能 (TRR) 濃度、抽出液の割合、およびジクワット量
 < 標識体処理区 >

処理量 処理後日数	0.3 kg/ha		0.6 kg/ha		1.1 kg/ha	
	7	14	7	14	7	14
茎						
TRR 濃度 (ppm ^a)	17.3	16.9	31.8	22.6	90.7	98.3
抽出液 (%TRR)	87.5	79.8	79.9	92.1	92.3	78.9
ジクワット (%TRR ^b)	16.5	15.5	17.8	18.0	14.3	9.5
(ppm ^c)	2.9	2.6	6.5	4.3	13.0	9.3
穀粒						
TRR 濃度 (ppm ^a)	4.6	2.6	5.9	6.5	14.8	14.6
抽出液 (%TRR)	85.2	88.3	92.1	90.0	90.2	92.8
ジクワット (%TRR ^b)	21.1	39.3	31.7	26.2	29.0	31.4
(ppm ^c)	1.0	0.9	1.8	1.7	4.3	4.6

値は2連の平均値 (申請者が計算)

a: ジクワット換算値

b: 抽出液中のジクワットの割合 (%) より申請者が計算。

c: ジクワット換算値 (申請者が計算)

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 オート麦における総残留放射能 (TRR) 濃度、抽出液の割合、およびジクワット量
< 標識体処理区 >

処理量 処理後日数	0.3 kg/ha		0.6 kg/ha		1.1 kg/ha	
	7	14	7	14	7	14
茎						
TRR 濃度 (ppm ^a)	10.0	7.3	16.0	18.8	27.2	42.2
抽出液 (%TRR)	83.7	83.8	85.5	85.1	80.9	86.1
ジクワット (%TRR ^b)	34.9	32.5	52.6	39.8	38.7	45.7
(ppm ^c)	3.4	2.4	8.4	7.5	10.9	19.3
穀粒						
TRR 濃度 (ppm ^a)	1.7	1.5	3.8	4.6	8.1	6.9
抽出液 (%TRR)	93.5	89.7	89.5	87.6	92.2	89.7
ジクワット (%TRR ^b)	51.8	33.3	45.2	25.2	54.4	25.7
(ppm ^c)	0.8	0.5	1.7	1.1	4.8	1.8

値は2連の平均値 (申請者が計算)

a: ジクワット換算値

b: 抽出液中のジクワットの割合 (%) より申請者が計算。

c: ジクワット換算値 (申請者が計算)

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 大麦およびオート麦における代謝物分布

試料および抽出画分		標識体処理区	
		抽出液 (%TRR)	代謝物 (%TRR、カッコ内は ppm ^a) ジクワット [A] ^b
大麦 茎			
0.6 kg/ha 処理区 (処理 14 日後)			
抽出液	84.6	15.6 (1.9)	
抽出液	95	NA	
1.1 kg/ha 処理区 (処理 7 日後)			
抽出液	91.8	18.5 (16.8)	
1.1 kg/ha 処理区 (処理 14 日後)			
抽出液	82.8	10.4 (10.0)	
抽出液	74.9	8.7 (8.7)	
抽出液	96	NA	
大麦 穀粒			
1.1 kg/ha 処理区 (処理 14 日後)			
抽出液	94.7	36.3 (5.0)	
オート麦 茎			
0.3 kg/ha 処理区 (処理 7 日後)			
抽出液	78.6	44.4 (4.0)	
オート麦 穀粒			
1.1 kg/ha 処理区 (14 日後)			
抽出液	87.8	23.1 (1.6)	

NA : 分析せず ND : 検出せず

a : ジクワット換算値 (申請者が計算)

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 大麦茎における総残留放射能 (TRR) 濃度、抽出液の割合、ジクワット量および代謝物量
 < 標識体処理区 >

処理量	0.77 kg/ha						
	処理後日数	0	1	3	7	14	49
大麦茎							
TRR 濃度 (ppm ^a)		253	277	207	124	183	34
抽出液 (%TRR)		99.5	93.5	88.5	87.5	66.7	76.8
ジクワット (%TRR)			34.6	29.9	15.8	14.0	6.6
[A] (ppm ^c)	NA		(95.8)	(61.9)	(19.5)	(25.6)	(2.2)
	(%TRR)						
	(ppm ^c)						
	(%TRR)						
	(ppm ^c)						
	(%TRR)						
	(ppm ^c)						
	(%TRR)						
	(ppm ^c)						

NA : 分析せず

a : ジクワット換算値

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3 ジクワットの大麦およびオート麦における想定代謝経路

(2) 大麦/小麦における代謝試験

(資料 No. M-08)

試験機関:

報告書作成年: 1978 年

供試標識化合物: で標識した 1,1'-エチレン-2,2'-ビピリジリウムジブロミド
(以下、 標識ジクワットジブロミド)ならびに で標識した 1,1'-
エチレン-2,2'-ビピリジリウムジブロミド (以下、 標識ジクワットジブロミド)

化合物	標識体	標識体
構造式 (* : 標識位置)		
比放射能		
放射化学的純度		

供試植物: 大麦および小麦

試験方法:

試験 1;

処理方法:

標識ジクワットジブロミド

を製剤化 (9 mL) し、成熟小麦に散布した (通常散布濃度、散布面積
60 × 60 cm)。また、 標識体ジクワットジブロミド
を同様に製剤化 (5 mL) し、小麦に散布した (通常散
布濃度の 100 倍量、散布面積 50 × 20 cm)。

試料の採取: いずれの小麦も処理 9 日後に収穫し、麦わらおよび穀粒に分画し、分析試料と
した。

分析方法: ジクワットの定量; 麦わらおよび穀粒試料 (各 4 g) にそれぞれ

各抽出液の一部に非標識ジクワットジブロミド二水
和物 300 mg を添加後、水溶性アルコールから再結晶化した。結晶を風乾後、30 mg を
正確に秤量し、LSC 測定を実施し、ジクワットの割合を算出した。

抽出; 麦わらおよび穀粒は

で抽出し、各抽出液に

ついて LSC で放射能測定および抽出残渣については燃焼法により LSC で放射能測定
を行った。さらに麦わらの抽出液について、陽イオン交換クロマトグラフィー

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。

およびゲルろ過クロマトグラフィー
により分画し、LSC 分析および TLC 分析を実施した。また、抽出
液中のシュウ酸含量を分析した。小麦の麦わらの抽出スキームを図 1 に示す

試験 2 ;

処理方法： 標識ジクワットジプロミド
を成熟大麦に 1.1 kg a.i./ha 相当量を散布処理した。

試料の採取： 処理 4 日後に収穫し、植物は 70°C で乾燥させ、粉碎し、粉末状にした。

分析方法： 抽出は還流をすべて 4 時間で行った以外は、小麦試料と同様（クロロホルム抽出
は実施せず）に行い、水抽出液について、陽イオン交換クロマトグラフィー（水およ
び塩酸で溶出）により分画し、LSC 分析および TLC 分析を実施した。

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

図1 小麦麦わらの抽出スキーム

m-57

試験結果：

試験 1： 標識ジクワットを小麦に処理後 9 日目の麦わらおよび穀粒におけるジクワットの割合を表 1 に示す。通常施用量の場合、麦わらおよび穀粒において、12%TRR (%TRR：総残留放射能 (TRR) に対する割合) および 25%TRR のジクワットが検出された。一方、通常施用の 100 倍量进行处理した場合にはそれぞれ 39%TRR および 42%TRR とやや高い値を示した。

表 1 小麦麦わらおよび穀粒におけるジクワットの割合

処理量	ジクワット量 (%TRR)	
	穀粒	麦わら
通常施用量	25	12
100 倍量	42	39

通常施用量で処理した場合の麦わら抽出液を分画した結果を表 2 および図 1 に示す。代謝物としては および がそれぞれ %TRR および %TRR 検出され、また も非常に少量検出された。

、 %TRR は分子量 の非陽イオンおよび陽イオン性の 成分より成ることが明らかになった。このことより、生成した放射性化合物が天然の植物成分中に取り込まれた可能性が高いと考えられた。抽出残渣は %TRR であった。

表 2 小麦の麦わらにおける代謝物分布

画分		総残留放射能に対する割合 (%TRR)
クロロホルム抽出画分		
水抽出画分		
酸抽出画分	ジクワット [A]	12
抽出残渣		

小麦穀粒の水抽出物にもある程度の量のジクワット [A] および が認められたが、放射能の大部分は TLC クロマトグラム上で分離できない成分として検出された。

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。

試験 2 : 標識ジクワットを大麦に処理した場合、4 日後に が検
出され、さらに が検
出された。これら のうち単独で大きな部分を占める成分は認められず、また同
定は困難であった。

代謝経路 : 小麦における想定代謝経路を図 2 に示す。小麦に処理されたジクワット [A] は
を生成する
が 、これら代謝/分解物はさらに天然の植物成分に
取り込まれると考えられた。

図 2 小麦における推定代謝経路

(3) 小麦における代謝試験

(資料 No. M-09)

試験機関：

報告書作成年：1989年

供試標識化合物： で標識した 1,1'-エチレン-2,2'-ビピリジリウムジブロミド
(以下、 標識ジクワットジブロミド)

構造式：

*：標識位置

比放射能：

放射化学的純度：

標識位置の設定理由：

供試植物： 冬小麦（品種：Brimstone）

英国バークシャー州 Bracknell にある研究所内の圃場（屋外）で1986年10月21日に播種した。

供試土壌：使用した土壌の土性は以下のとおりであった。

pH；	6.0
有機物含量；	6.45%
土壌分類；	埴壤土
砂；	35.6%
シルト；	34.5%
粘土；	29.9%
CEC；	21.6 meq/100 g 乾燥土壌
圃場容水量；	29.1% (1/3 bar)、16.6% (15 bar)

方法：

処理液の調製： ジクワットジブロミド

をブラ

ンク製剤 30 mL に溶解し、処理液を調製した。

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。

処理方法： 1987年7月24日（成熟期、収穫7日前）に植物体（0.05 m²）に噴霧処理を行った。

処理量： 10.2 kg/ha（推奨処理量の9.1倍量）

試料の採取： 処理7日後に枯凋した麦を地上レベルで切り取り、麦わらと穂を切り離した。穂はさらに、穀粒と籾殻に分画し、穀粒、籾殻および麦わらを分析試料とした。採取後籾殻および麦わらは、それぞれはさみで細断した。

分析方法：

抽出； 抽出には

を使用し、2つの異なる抽出方法を用いて、籾殻、麦わらおよび穀粒試料を抽出した。1つは

抽出液と抽出残渣に分離した。もう1つは順次抽出であり、各試料を以下のようにして抽出した。

[籾殻]

[麦わら]

[穀粒]

放射能の測定；放射能の測定は、抽出液はそのまま、抽出残渣は燃焼後のLSC分析により実施した。尚、穀粒試料は、全体をコーヒーグラインダーにより粉末化した試料を燃焼させ、LSC分析による放射能測定も行った。

代謝物の分析；抽出液のHPLCおよびTLCクロマトグラフィー分析により代謝物の同定・定量を実施した。代謝物量の計算には、両分析値の平均を使用した。得られた抽出液は必要に応じて
分解を実施

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。

し、 分解後の抽出液についても HPLC および TLC 分析した。また、未同定の放射能を多く含む画分は
分析に供した。

試験結果：

総残留放射能： 抽出および順次抽出の結果をそれぞれ表 1 および 2 に示す。
籾殻、麦わらおよび穀粒中の総残留放射能濃度は、両抽出法においてほぼ同様であり、
それぞれ 167~168 ppm、111~136 ppm および 2.79~3.79 ppm であった。これらの試
料から により、79.0~89.4%TRR が抽出された。

代謝： 籾殻および麦わらにおける主要残留物は未変化のジクワット [A] であり、それぞ
れ 22.5~34.4%TRR および 14.9~32.1%TRR 検出された。代謝物として、
が検出され、それぞれ %TRR および
%TRR であった。穀粒においても主要残留物は未変化のジクワット [A] であり、
42.4~51.0%TRR 検出され、次いで が %TRR、
が %TRR 検出された。

籾殻、麦わらおよび穀粒において、 抽出ではそれぞれ約 、 および %
TRR が同定され、順次抽出では約 、 および %TRR が同定された。
TLC クロマトグラム上に が観察されたが、未同定の抽出
放射能の大部分は、 あるいは に認められた (表 2)。こ
れらの放射能は、
を有していることが示された。

このことから、ジクワットの代謝物は、一部、植
物構成成分に取り込まれると考えられた。

代謝経路： 小麦における想定代謝経路を図 5 に示す。小麦に処理されたジクワット [A] は
分解を受け、 や が生成
し、代謝物の一部は天然植物成分に取り込まれると考えられた。

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 1 小麦各部位における総残留放射能および代謝物 (抽出)

部位	籾殻		麦わら		穀粒	
総残留放射能 (ppm ^a)	168		136		3.79 (3.65)	
単位	ppm	%TRR	ppm	%TRR	ppm	%TRR
ジクワット [A]	57.8	34.4	43.7	32.1	1.93	51.0

a : ppm、ジクワット換算値

表 2 小麦各部位における総残留放射能および代謝物 (順次抽出)

部位	籾殻		麦わら		穀粒	
総残留放射能 (ppm ^a)	167		111		2.79	
単位	ppm	%TRR	ppm	%TRR	ppm	%TRR
ジクワット [A]	37.6	22.5	16.5	14.9	1.18	42.4

- : 検出せず

a : ppm、ジクワット (イオン) 換算値

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 粃殻試料の植物構成成分への系統的分画の概要

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 2 稗殻試料の順次抽出の概要

図 3 麦わら試料の順次抽出の概要

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 4 穀粒試料の順次抽出の概要

図 5 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。

分析方法： 種子の抽出・分析スキームをそれぞれ図1に示す。

図1 種子の抽出および分析スキーム

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。

代謝物の同定および定量； 残留放射能については、抽出液はそのまま、フィルターおよび抽出残渣は燃焼後、液体シンチレーションカウンター（LSC）により分析した。
代謝物の同定は TLC を用いて標準品とのクロマトグラフィーによりおこない、更なる確認は HPLC を用いておこなった。

結果：

総残留放射能： 種子における総残留放射能は、燃焼法/LSC による直接分析では、0.766mg ジクワットイオン/kg、抽出過程で得られた残留放射能の和では、0.969mg ジクワットイオン/kg であった。

抽出率： 種子における抽出率を表 1 に示す。

種子における抽出率は高く、82.1%が抽出された。

表 1. 抽出率

抽出		非抽出 ^{b)}		TRR
% TRR	mg/kg ^{a)}	% TRR	mg/kg ^{a)}	mg/kg ^{a)}
82.1	0.796	17.9	0.173	0.969

a) ジクワットイオン換算値

b) 抽出残渣およびフィルター中の残渣の放射能濃度の和。

抽出残渣： 抽出残渣の分析結果を表 2 示す。

抽出残渣について、

を用いて更なる抽出をおこなったが、 %TRR (mg ジクワットイオン/kg) が非抽出のままであった。

表 2. 抽出残渣の分析結果

抽出残渣 (%TRR)	16.9	
抽出法	%TRR	mg/kg ^{a)}

a) ジクワットイオン換算値

代謝： 種子における代謝物の同定結果を表 3 に示す。

種子における主要代謝物としてジクワット[A]が検出され、48.0%TRR (0.465 mg ジクワットイオン/kg) であった。その他に、 および が検出されたが、いずれも であった。また、 が検出されたが、い

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。

ずれも %TRR 未満であった。

表 3. 代謝物同定結果

総残留放射能 1		0.969	
総残留放射能 2		0.766	
代謝物		%TRR	mg/kg
クロマト グラフィー	ジクワット[A]	48.0	0.465
合計		100.1	0.969

a) 抽出液中、フィルターおよび抽出残渣の残留放射能を個別に測定し足したもの

b) 種子をそのまま燃焼法/LSC で測定したもの

推定代謝経路： 本試験から得られた推定代謝経路を図 1 に示す。

ジクワット[A]は
られた。

に代謝されると考え

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) なたねにおける代謝試験

(資料 No. M-10)

試験機関：

報告書作成年：1971年

供試標識化合物： 標識ジクワットジプロミド

構造式：

*：標識位置

化学名： 1-1'-エチレン-2,2'-ビピリジリウムジプロミド

比放射能：

放射化学的純度：

標識位置の設定理由：

供試植物： なたね（品種：Zollerngold）

処理 12 株および対照植物を個別のポットで成熟期まで栽培した。

方法：

処理液の調製： ジクワットジプロミドを 0.1%Lissapol NX（分散剤：アルキルフェノールエチレンオキシド濃縮物）6 mL に溶解し、処理液を調製した。

処理方法： なたねを 1 株ずつ 1 フィート平方の散布装置内へ移し、各処理溶液 6 mL/株を、莢の大部分が褐色となる時期（9 月）に植物の地上部に散布処理した。散布後、降雨から守るポリテン製シートの屋根の下で日光に暴露した。

処理量： 0.3、0.6 および 1.1 kg/ha（各処理量 4 株ずつ処理）

試料の採取： 処理 1 週間および 2 週間後に各処理量ごとに 2 株から種子を採取し分析試料とした。

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： 種子試料からなたね油および油粕への分画・分析フロースキームを図1に示す。
種子試料は、対照試料についても同様に分析し、処理試料および対照試料のそれぞれの放射能の平均を計算して、それらの差を残留放射能とした。

図1 種子試料の分析フロースキーム

ジクワットの定量； 0.6 kg/ha 処理区の処理 14 日後の油粕試料については、

比放射能を測定しジクワットの割合を算出した。

試験結果： なたね油および油粕中の総残留放射能（TRR）を表1に示す。

なたね油中の残留放射能は、処理 7 日後では検出限界（0.003 ppm）未満であり、処理 14 日後では最大 0.02 ppm（1.1 kg/ha 処理区）検出された。

油粕における総残留放射能濃度は、最大で 1.1 kg/ha 処理区の処理 14 日後の 3.22 ppm であった。

油粕中の残留濃度が通常非標識ジクワットの残留試験の油粕中の残留値とよく一致していたことから、本試験における油粕中のジクワットの代謝分解物は僅かであると考えられた。油粕中の残留放射能のうち、67～89%TRR が で抽出されたが、0.6 kg/ha 処理 14 日後試料では、その一部（55.4～58.5%TRR）が未変化のジクワットであった。

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 なたね油および油粕中の残留放射能

処理量 (kg/ha)	処理後 経過日数	なたね油	油粕	
		残留濃度 (ppm ^a)	残留濃度 (ppm ^a)	抽出放射能の割合 (%TRR)
0.3	7	ND	0.37	83
		ND	0.18	80
0.6		ND	0.96	85
		ND	0.94	85
1.1		ND	0.48	67
		ND	0.66	75
0.3	14	0.003	0.52	86
		0.006	10.02	76
0.6		0.01	1.49	75
		0.003	1.51	71
1.1		0.004	3.22	85
		0.02	1.87	89

ND：検出限界（0.003 ppm）未満

a：ppm（ジクワット換算値）

(6) ばれいしょにおける代謝試験

(資料 No. M-23)

試験機関 :

報告書作成年: 2012 年

供試標識化合物 :

(以下、

で標識した 1,1'-エチレン-2,2'-ピピリジリウムジブロミド
標識ジクワットジブロミド)

* : 標識位置

比放射能 :

放射化学的純度 :

供試植物および土壌 : ばれいしょ (BELANA 種)

砂壤土 (ドイツ国、ニーダーザクセン州)

方法 :

処理液の調製 : 標識ジクワットジブロミドを、200g ジクワットイオン/L となるように水で希釈し、処理液を調製した。

処理方法 : ばれいしょは 1 x 1 x 1.2 m³ の容器で生育させた。処理液を 400 L/ha の容量で塊茎成熟期 (BBCH44-48) に散布し、枯凋処理した。処理量は、969g ジクワットイオン/ha (設定は 1000g ジクワットイオン/ha) であった。

試料の採取 : 処理 10 および 20 日後に、塊茎および茎葉を採取した。塊茎は、土を除去し洗浄した後、皮を剥き、皮、塊茎 (皮を除く)、洗浄液を分析試料とした。茎葉の分析はおこなわなかった。

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。

分析方法： 塊茎（皮を除く）および皮の抽出・分析スキームを図1に示す。

図1 塊茎（皮を除く）および皮の抽出および分析スキーム

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。

代謝物の同定および定量； 残留放射能については、抽出液はそのまま、フィルターおよび抽出残渣は燃焼後、液体シンチレーションカウンター（LSC）により分析した。

代謝物の同定は TLC を用いて標準品とのクロマトグラフィーによりおこない、更なる確認は HPLC を用いておこなった。

結 果：

総残留放射能および抽出率： 各試料における総残留放射能および抽出率を表 1 に示す。

各試料における総残留放射能はいずれも 0.05mg ジクワットイオン/kg 未満であった。全ての試料において抽出率は高く、95.3%TRR 以上が抽出された。抽出残渣における残留放射能はいずれも低かったことから、更なる分析はおこなわなかった。

また、洗浄液中の残留放射能は極めて低かった（約 0.0003mg ジクワットイオン/kg/ばれいしょ）ことから、更なる分析はおこなわなかった。

表 1. 総残留放射能および抽出率

試料採取日	試料	抽出		非抽出 ^{b)}		TRR1 ^{c)}	TRR2 ^{d)}
		% TRR	mg/kg ^{a)}	% TRR	mg/kg ^{a)}	mg/kg ^{a)}	mg/kg ^{a)}
処理 10 日後	塊茎 (皮を除く)	97.1	0.028	2.9	0.001	0.029	0.026
	皮	95.3	0.042	4.7	0.002	0.044	0.042
処理 20 日後	塊茎 (皮を除く)	97.1	0.031	2.9	0.001	0.032	0.028
	皮	96.3	0.037	3.7	0.001	0.039	0.038

a) ジクワットイオン換算値

b) 抽出残渣およびフィルター中の残渣の放射能濃度の和。

c) 抽出液中、フィルターおよび抽出残渣の残留放射能を個別に測定し足したもの

d) 試料をそのまま燃焼法/LSC で測定したもの

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。

代謝：

塊茎（皮を除く）； 塊茎（皮を除く）における代謝物の同定結果を表 2 に示す。

塊茎（皮を除く）における主要代謝物としてジクワット[A]が検出され、処理 10 日後の試料で 78.7%TRR (0.023mg ジクワットイオン/kg)、処理 20 日後の試料で 73.9%TRR (0.024mg ジクワットイオン/kg) であった。その他では、処理 10 日後の試料で微量認められた以外に、代謝物は認められなかった。

表 2. 塊茎（皮を除く）における代謝物同定結果

試料採取日		処理 10 日後		処理 20 日後	
総残留放射能 1 ^{a)}		0.029		0.032	
総残留放射能 2 ^{b)}		0.026		0.028	
代謝物		%TRR	mg/kg ^{c)}	%TRR	mg/kg ^{c)}
クロマト グラフィ ー	ジクワット[A]	78.7	0.023	73.9	0.024
合計		99.9	0.030	100.0	0.033

- a) 抽出液中、フィルターおよび抽出残渣の残留放射能を個別に測定し足したもの
 b) 塊茎（皮を除く）をそのまま燃焼法/LSC で測定したもの
 c) ジクワットイオン換算値

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。

皮； 皮における代謝物の同定結果を表3に示す。

皮における主要代謝物としてジクワット[A]が検出され、処理10日後の試料で71.7%TRR (0.031mg ジクワットイオン/kg)、処理20日後の試料で72.7%TRR (0.028mg ジクワットイオン/kg)であった。その他に代謝物は認められなかった。

表3. 皮における代謝物同定結果

試料採取日		処理10日後		処理20日後	
総残留放射能 1 ^{a)}		0.044		0.039	
総残留放射能 2 ^{b)}		0.042		0.038	
代謝物		%TRR	mg/kg ^{c)}	%TRR	mg/kg ^{c)}
クロマト グラフィ ー	ジクワット[A]	71.7	0.031	72.7	0.028
合計		100.0	0.043	100.1	0.039

ND：検出されず

a) 抽出液中、フィルターおよび抽出残渣の残留放射能を個別に測定し足したもの

b) 皮をそのまま燃焼法/LSCで測定したもの

c) ジクワットイオン換算値

以上より、ジクワットジプロミドをばれいしょの塊茎成熟期に枯凋処理し、塊茎（皮を除く）および皮中の代謝物を分析したところ、主要代謝物はジクワット[A]であり、その他に主要な代謝物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。

(7) ばれいしょにおける代謝試験

(資料 No. M-11)

試験機関：

報告書作成年：1967年（文献公表年）

Environmental Contamination & Toxicology

Vol. 2, No.3, p. 169-177

供試標識化合物： 標識ジクワットジプロミド

構造式：

*：標識位置

化学名： 1-1'-エチレン-2,2'-ビピリジリウムジプロミド

比放射能：

放射化学的純度：

標識位置の設定理由：

供試植物： ばれいしょ（品種：Majestic）

圃場に設置したポットで栽培した。

方法：

処理液の調製； ジクワットジプロミドを 0.1% Lissapol NX（
）に 0.3%（w/w）の濃度で溶解し、処理液を調製した。

処理方法； 1株当たり処理液 15 mL をばれいしょ 6株の地上部に散布処理した（枯凋処理）。

処理量； 1.7 kg ai/ha（1.5 lb ai /acre）

試料の採取； 処理2週間後にばれいしょ塊茎を採取し、洗浄、乾燥して1株 250 g ずつの試料とした。

分析方法； 塊茎試料の分析フロースキームを図1に示す。

図1 塊茎試料の分析フロースキーム

ジクワットの定量； 陽イオン交換樹脂に吸着されたジクワットを飽和塩化アンモニウム水溶液で溶出して化学的方法（比色法）で定量した。

試験結果：

圃場で処理したばれいしょ塊茎の放射エネルギーおよびジクワット量を表1に示す。抽出液に検出された放射能は0.012～0.047 ppm（平均0.021 ppm）であり、ジクワット量は0.010～0.046 ppm（平均0.023 ppm）であった。これらの分析値は、ばれいしょ地上部にacre当たり1 lbのジクワット(イオン)を散布した多くの圃場試験における残留値(0.02 ± 0.01 ppm)とよく一致した。また、残留放射エネルギーとジクワット量が良好に一致することから、ジクワットの代謝分解物が存在しないことが推定された。

ジクワットの光分解物である

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。

の存在は確認

されなかった。

表1 抽出液中の放射エネルギーおよび化学的分析法によるジクワット量

試料 番号	放射能測定値				ジクワット量 [A]	
	抽出液中の 放射能		陽イオン交換樹脂クロマトグラフィー			
			飽和塩化アンモニウ ム水溶液溶出画分	2.5%塩化アンモニ ウム水溶液洗浄画分	μg	ppm
	μg*	ppm	μg*	μg*		
1	11.85	0.047	4.09	0.13	11.72	0.046
2	4.10	0.016	1.59	0.02	4.30	0.018
3	3.38	0.014	1.17	0.07	4.30	0.018
4	2.97	0.012	0.54	0.01	4.88	0.020
5	4.29	0.017	1.23	0.02	6.10	0.025
6	4.29	0.017	0.54	0.00	2.44	0.010
平均		0.021				0.023

* μg : ジクワット換算値

(8) トマトにおける代謝試験

(資料 No. M-24)

試験機関：

報告書作成年：2012年

供試標識化合物： 以下、
で標識した 1,1'-エチレン-2,2'-ビピリジリウムジプロミド
標識ジクワットジプロミド

*：標識位置

比放射能：

放射化学的純度：

供試植物および土壌： トマト (VITELLA 種)
砂壤土 (ドイツ国、ニーダーザクセン州)

方法：

処理液の調製： 標識ジクワットジプロミドを、200g ジクワットイオン/L となるように水で希釈し、展着剤を加え、処理液を調製した。

処理方法： トマトは $1 \times 1 \times 0.6 \text{ m}^3$ の容器で温室で生育させた。トマトの種子を播種し、その4日後 (BBCH7：発芽直前) に処理液を 300 L/ha の容量で土壌に散布した。処理量は、1032g ジクワットイオン/ha (設定は 1000g ジクワットイオン/ha) であった。

試料の採取： 成熟期 (BBCH86-89；処理 112 日後) に、果実 (成熟および未成熟)、茎および葉を採取したが、果実 (成熟) および葉のみを分析試料とした。

分析方法： 果実 (成熟) および葉における総残留放射能を燃焼法/液体シンチレーションカウンター (LSC) により分析した。いずれの試料においても、総残留放射能が 0.01mg ジクワットイオン/kg 未満と低かったことから、更なる分析は行わなかった。

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。

結 果：

総残留放射能： 燃焼法/LSCにて直接測定した果実（成熟）および葉の総残留放射能は、それぞれ<0.001 mg ジクワットイオン/kg および 0.002 mg ジクワットイオン/kg であった。いずれの試料においても、総残留放射能が 0.01mg ジクワットイオン/kg 未満と低かったことから、更なる分析は行わなかった。

以上より、ジクワットジプロミドをトマトの発芽期に土壌処理し、果肉および葉中の総残留放射能を分析したところ、いずれも 0.01 mg ジクワットイオン/kg 未満と低かった。トマトにおけるジクワットジプロミドの土壌からの取り込みはわずかであると考えられた。

(9) トマトおよびとうもろこしにおける代謝試験

(資料 No. M-12)

試験機関：

報告書作成年：1966年

供試標識化合物： 標識ジクワットジブロミド
標識ジクワットジブロミド

化学名： 1-1'-エチレン-2,2'-ビピリジリウムジブロミド

化合物	標識体	標識体
構造式 (*：標識位置)		
比放射能		
放射化学的純度		

供試植物： トマトおよびとうもろこし
播種後 4~6 週間目の植物を使用。

方法：

処理液の調製： 非標識あるいは ジクワットジブロミドを
に溶解し、約 1 mg/mL の濃度の処理液を調製した。調製した処理液を用いて以下の[1]~[5]の実験を実施した。

[1] とうもろこし/トマトおよびろ紙上におけるジクワットの消長

処理： 非標識ジクワット処理液 50 μ L (ジクワット 50 μ g 相当量) をマイクロシリンジを用いて表 1 に示した環境条件下で供試植物 (とうもろこしおよびトマト) およびろ紙上に滴下した。また、別途シリコン添加の試験溶液を処理した。

試料の採取および分析方法： 処理直後から 8 日間にわたって、表 1 に示した時点で植物を採取し、1 N 硫酸で抽出する標準的な分析法を用いて植物中のジクワットを定量した。

[2] トマトにおける非抽出性残渣の消長

処理： トマトに 標識ジクワットジブロミド 50 μ g/植物を散布処理した。

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。

試料の採取および分析：処理直後から8日間にわたって、表2に示した時点でトマト植物を採取して1N硫酸で抽出し、非抽出性残渣中の放射能を燃焼法によりLSCで測定した。

[3] とうもろこしトマトにおける分解物の同定

処理： とうもろこしおよびトマトに 標識および 標識ジクワットジプロミド 200 µg をそれぞれ散布処理し、以下の条件で植物を栽培した。

- (a) -1 標識ジクワットジプロミド処理植物を、7月の3週間、屋外で栽培。
(降雨による物質の流亡を防ぐためにポリテン製シートで覆った。)
- (a) -2 標識ジクワットジプロミド処理植物を暗所で1週間栽培。
- (b) -1 標識ジクワットジプロミド処理植物を10~11月の3週間、屋外で栽培。
- (b) -2 標識ジクワットジプロミドを処理した植物を暗所で1週間栽培。
- (c) -1 標識ジクワットジプロミド処理植物を温室内で5日間栽培。
- (c) -2 標識ジクワットジプロミド処理植物を暗所で5日間栽培。

分析方法：(a)の試料は 浸漬し、 抽出後、ろ過した。抽出液を 陽イオン交換ろ紙クロマトグラフィーにより分析した。(b)および(c)の試料は(a)と同じ方法で抽出し、陽イオン交換ろ紙およびTLCクロマトグラフィーにより分析した。(b)および(c)の試料のクロマトグラフィー分析に際しては、光照射した 標識ジクワットジプロミド処理溶液 をマーカーとして用いた。

[4] 異なる抽出方法を用いたトマトおよびろ紙からの放射能の抽出

処理： トマトおよびろ紙それぞれに、 標識ジクワットジプロミド 120 µg を処理し、植物の地上部分を切断しポリエチレン製トレーに移して8~9月の太陽光に4週間暴露した。同量の 標識ジクワットジプロミドを処理したろ紙についても同様に太陽光に暴露した。また、トマトおよびろ紙を暗所条件下において同様の実験を行った。

試料の採取および分析方法：処理2週間および4週間後に、植物ならびにろ紙を採取し、以下の2種類の方法で分析した。

- (1) 1N硫酸を用いて抽出し、抽出液について標準的な分析法によりジクワットを定量し非抽出性残渣については燃焼法によりLSCで放射能を測定した。
- (2) メタノール/水(4/1)で抽出し、非抽出性残渣の半量を燃焼法によるLSC分析に供した。残りの残渣については、さらに1N硫酸で抽出してから非抽出性残渣中の放射能を測定した。1N硫酸抽出液については標準的な分析法によりジクワットを定量した。

[5] ろ紙における揮発性放射能の消長

処理： ろ紙ディスクに 標識および 標識ジクワットジブロミド 20 µg を処理し、8~9月に8週間太陽光に暴露した。

試料の採取および分析方法： 処理4週間および8週間後に、ろ紙上に残存する放射能を燃焼法によりLSCで測定した。

試験結果：

[1] トマト/とうもろこしおよびろ紙上におけるジクワットの消長

異なる植物および栽培条件下での非標識ジクワット処理後のジクワット量の経時的变化を表1に示す。ジクワットの減衰は、対照としたろ紙を除くと、6月に処理した屋外のとうもろこしで最も速く、次いで5月のシリコン添加の処理液を処理した温室とうもろこし、3月に処理した温室トマトの順であった。これらのジクワットの減少は、処理した植物表面上および植物体内部における分解および非抽出性残渣の増加によると考えられた。

表1 非標識ジクワットジブロミド処理後のジクワット量の経時的变化^a

植物および栽培条件 ^b	処理後経過日数 (日)								
	0	1	2	3	4	5	6	7	8
とうもろこし、温室 (1月)	100	99	93	-	98	-	87	-	86
とうもろこし、温室 (5月)	100	-	82	-	90	-	68	-	-
とうもろこし、温室 (5月) 処理液にシリコンを添加	100	-	68	-	59	-	47	-	-
とうもろこし、屋外 (6月)	100	-	42	-	14	-	14	-	-
トマト、温室 (1月)	100	105	93	-	83	-	88	-	78
トマト、温室 (3月)	100	-	76	-	-	66	-	-	52
トマト、暗所	100	-	100	-	103	-	91	-	-
ろ紙、温室 (1月)	100	-	-	11	-	-	-	6	-

a: 数値はジクワットジブロミド処理直後のジクワット (イオン) 量を100とし、各時点の割合 (%) を示す。

b: 温室には水銀蒸気ランプが設置されていた。

[2] トマトにおける非抽出性残渣の消長

標識ジクワットジブロミドを処理したトマトにおける非抽出性残渣の放射能の経時的变化を表2に示す。温室および屋外において非抽出性残渣の経時的な増加が認められたが、少量であった。よって、[1]の試験においてジクワット量が経時的に減少したのは、非抽出性残渣の増加によるだけでなく、他の分解物の生成の可能性が示唆された。

表2 トマトにおける非抽出性残渣の経時的变化^a

栽培条件	処理後経過日数 (日)				
	0	2	4	6	8
温室	1	2	3	4	-
屋外 (6月)	1	7	8	-	16

a: 数値は試料中の非抽出性残渣中放射能の割合 (%TRR) を示す。

[3] とうもろこし/トマトにおける分解物の同定

屋外で太陽光に3週間暴露した試料 [(a) -1 および (b) -1] に残存したジクワットの量は極めて少量で、ジクワット[A]以外にスポットが存在した。(a) -1 試料にはさらに別の化合物の痕跡もみられた。暗所で栽培した試料 [(a) -2 および (b) -2] には、ジクワット以外に放射性化合物は検出されなかった。温室内および暗所の試料 [(c) -1 および (c) -2] についてもジクワット以外に放射性化合物は検出されなかった。

[4] 異なる抽出方法を用いたトマトおよびろ紙からの放射能の抽出

標識ジクワットジプロミドを処理したトマトおよびろ紙において、標準的な分析方法である1N硫酸により抽出した放射能測定の結果を表3に示す。太陽光に4週間暴露したトマトでは、ジクワット量は処理直後と比較して15%に減少し、ろ紙に処理したジクワットは4週間後には検出されなかった。非抽出性残渣は、4週間太陽光暴露後に植物試料およびろ紙において、5および8%TARであった。一方、暗所における4週間後のジクワット量は、植物およびろ紙においてそれぞれ処理直後の79~88%であり、非抽出性残渣はいずれも0.4%TARと少量であった。

表3 1N硫酸抽出によるジクワット量および非抽出性放射能

試験条件		ジクワット量 (%) ^a	非抽出性残渣 (%TAR)
処理直後トマト		100	0.4
太陽光、 4週間	トマト	15	5
	ろ紙	0	8
暗所、 4週間	トマト	88	0.4
	ろ紙	79	0.4

a: 数値はジクワットジプロミド処理直後のジクワット (イオン) 量を100とし、それに対する割合 (%) を示す。

標識ジクワットジプロミドを処理したトマトおよびろ紙において、メタノール/水 (4/1) 抽出後およびそれに続く1N硫酸による抽出後の抽出残渣、ならびに1N硫酸抽出液中のジクワット量を表4に示す。太陽光に4週間暴露した場合、植物およびろ紙

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。

においてメタノール水抽出後の非抽出性残渣中の放射能は、それぞれ 24 および 29% TAR であったが、さらに硫酸抽出することにより、4 および 11% TAR となった。

表4 トマトおよびろ紙におけるメタノール水溶液および1N硫酸抽出後の非抽出性残渣

試験条件		メタノール/水抽出		(メタノール/水抽出後) 1N硫酸抽出		
		非抽出性残渣		非抽出性残渣		1N硫酸抽出液中のジクワット量 (μg) *
		μg (ジクワット換算値) *	%TAR**	μg (ジクワット換算値) *	%TAR**	
植物	処理直後	13.5、15.0	12	0.7、0.6	0.6	6.2、14.6
	太陽光、2週間	24.6、22.0	19	3.1、4.1	3	4.0、4.4
	太陽光、4週間	27.7、28.9	24	4.8、4.4	4	7.8、6.3
	暗所、4週間	7.1、7.4	6	1.2、0.8	0.8	9.5、0
ろ紙	処理直後	5.0、3.8	4	0.8、0.6	0.6	7.6、0
	太陽光、2週間	28.4、31.0	25	12.5、10.6	10	0、0
	太陽光、4週間	32.4、36.6	29	13.4、12.1	11	0、9.5
	暗所、4週間	11.2、11.3	9	1.4、2.6	2	0、0

* : 2連それぞれの測定値 ** : 2連の平均

[5] ろ紙における揮発性放射能の消長

標識および 標識ジクワットジブロミドを処理したろ紙上の放射能の経時的变化を表5に示す。ろ紙上の放射能は、太陽光の暴露により処理直後から8週間後には53~73%に減少した。これにより、ジクワットから揮発性の放射性物質が生成したことが示され、同様のことが植物においても起こると考えられた。

表5 標識ジクワットを処理したろ紙の放射能の経時的变化^a

処理標識体	処理後経過期間		
	処理直後	4週間	8週間
標識体	100	78	73
標識体	100	70	53

a: 数値はジクワットジブロミド処理直後のジクワット(イオン)量を100とし、各時点の割合(%)を示す。

以上の[1]~[5]の結果から、植物においてジクワットは代謝的に分解されないが、光による分解を受けると考えられた。分解は太陽光暴露後1週間以内に起こり、分解量と光強度との間には明瞭な相関性が認められた。分解物としては およびそれ以外の分解物の存在が確認された。ろ紙上放射能が経時的に減少することから、揮発性物質への分解が示唆された。

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。

- (10) ジクワット原体の水稻における代謝試験除外のための申請者考察 (資料 No. M-13)

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。

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。

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。

以上のことから、ジクワットの水稻代謝試験は、他の作物による既存の試験でみられたものと同様で、現状のデータ以上に追加される情報は無いと推察される。

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。

参考資料

(11) 後作物代謝試験

(資料 No. MR-05)

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。

試験結果：

このように試験期間を通じて土壌中においてジクワットは未変化のまま残留していた。

ジクワットを砂壤土に処理後、所定の期間にわたり休閑させ、その後栽培した作物（にんじん、レタスおよび小麦）に取り込まれ

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。

た放射能を測定した結果、大部分の植物試料中の残留放射能は検出限界（0.008 ppm）未満であった。理後 365 日経過した後に播種し栽培したにんじん葉部から 0.017 ppm、処理後 120 日および 365 日経過した後に播種し栽培した小麦のわら試料から、それぞれ 0.022 ppm および 0.024 ppm の放射能が検出された。これら植物試料について代謝物分析した結果、認められた唯一の放射性化合物はジクワット[A]のみであった。ジクワットは迅速に土壤に吸着され、植物に取り込まれる可能性は少ないと考えられる。従って、にんじん葉部および麦わら試料中の残留放射能は、不十分な水洗浄に起因する土壤による汚染と考えられた。

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。

参考資料

(12) ジクワットのグルコースとの相互反応 (光照射下)

(資料 No. MR-06)

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。

試験結果：

ジクワットおよびグルコースは光照射下、両分子が結合した生成物を形成する事が示された。

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。

3. 土壌中動態に関する試験

(1) 好氣的湛水土壌中動態試験

(資料 No.M-14)

試験機関：

報告書作成年：1988年

供試標識化合物：

標識した 1,1'-エチレン-2,2'-ビピリジリウム
ジブロミド (以下、 標識ジクワットジブロミド)

*： 標識位置

放射化学的純度：

比放射能：

供試土壌：土壌は使用前に 2mm の篩を通した。池底質土壌及び付随水の特徴は以下の通りである。

採取場所		米国フロリダ州
土相	分類 (USDA)	砂土
	粒径分布	
	砂質 (%)	92
	シルト質 (%)	4
	粘土 (%)	4
	pH	7.6
	密度	1.55
	圃場容水量 (1/3bar, %)	2.12
水相	陽イオン交換能 (meq/100g)	3.4
	有機物質 (%)	0.5
	pH	7.83

試験方法：

施用・培養条件； 各 25×125mm の培養管に湿度 15.1% の土壌 11.779g (乾燥土 10.0g 相当) を入れ、通気した 25°C、pH7.83 の池水各 30mL を添加した。これに、標識被験物質のストック溶液を添加・混和し、乾燥土当りジクワット (イオン) として 2.677µg/g とした。

湿空気を送り、暗所、24.9±0.2°C で 31 日間インキュベートした。

試料採取； インキュベート 0、1、2、7、14、21 及び 31 日後に土壌/水試料を採取した。揮発成分は 1N KOH 溶液、1N 硫酸溶液及びエチレングリコール溶液にトラップし、試料採取毎にトラップ溶液を取り替えた。

水相； 水相は等量の 12N 塩酸を加えて 6N 塩酸相当とし、6 時間還流後濾過により粒子物質を取り除き、濃縮後分析した。

土壌； 土壌は、アセトン及びメタノール/水で抽出後、6N 塩酸で 3 回還流抽出し、濃縮後分析した。

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。

分 析； 放射活性は LSC で測定した。土壤中残渣は燃焼法により LSC 測定した。
代謝物は HPLC で分析し、TLC で確認した。

結 果： 試験系中での物質収支を表 1、ジクワットの経時変化 (HPLC) を表 2 に示した。回収率は 84.7~112.8%TAR であった。試験開始時には水相に 10.2%TAR の放射活性が認められたが、段々と減少し終了時には 1.6%TAR であった。水相および土壌抽出液の HPLC、TLC 分析で、ジクワット以外は検出されなかった。ジクワットは、好氣的湛水条件下の土壤中で安定であった。

表 1 物質収支 (施用量に対する割合、%TAR)

系		培 養 日 数						
		0	1	2	7	14	21	31
水相		10.2	3.6	2.2	4.2	1.6	0.9	1.6
土相	抽出	73.7	101.4	82.1	107.1	85.3	100.3	92.5
	非抽出	1.1	0.7	0.9	1.5	1.0	1.2	1.3
	計	74.8	102.1	83.0	108.6	86.3	101.5	93.8
揮発物		-	*	*	*	*	*	*
回収率		84.7	105.8	85.1	112.8	87.9	102.5	95.5

-: 測定せず * : 検出限界 (0.05 ppm) 以下

表 2 ジクワットの経時変化 (施用量に対する割合、%TAR)

系		培 養 日 数						
		0	1	2	7	14	21	31
水相		9.7	3.4	2.0	3.8	1.4	0.7	1.5
土相		70.2	99.5	80.2	102.5	82.7	97.8	89.4
合計		79.9	102.9	82.2	106.3	84.1	98.5	90.9
抽出性放射能		83.9	105.0	84.2	101.3	88.2	101.2	94.2

(2) 好氣的土壤中動態試験

(資料 No.M-15)

試験機関：
報告書作成年：1988年

供試標識化合物： 標識した 1,1'-エチレン-2,2'-ビピリジリウム
ジブロミド (以下、 標識ジクワットジブロミド)

* : 標識位置

放射化学的純度：
比放射能：

供試土壌：土壌は使用前に 2mm の篩を通した。土壌特性は以下の通りである。

採取場所	米国 カリフォルニア州 Stockton
分類 (USDA)	砂壤土
粒径分布	
砂質 (%)	62
シルト質 (%)	22
粘土 (%)	16
pH	7.5
密度	1.41
圃場容水量 (1/3bar, %)	16.5
陽イオン交換能 (meq/100g)	12.4
有機物質 (%)	3.0

試験方法：

施用・培養条件； 各 25×125mm の培養管 (50ml) に土壌 10.0g (乾燥土換算) を入れた。 標識被験物質のストック溶液を添加・混和し、試験濃度を乾燥土当りジクワット (イオン) として 2.677 μ g/g とした。暗所、25.2 \pm 0.4 $^{\circ}$ C で 9ヶ月間培養した。

試料採取； インキュベート 0、1、3、7、14日及び 1、2、3、4、6、9ヶ月後に土壌試料を 2連で採取した。

揮発成分は 1N KOH 溶液、1N 硫酸溶液及びエチレングリコール溶液にトラップし、試料採取毎にトラップ溶液を取り替えた。

抽出； アセトン及びメタノールで抽出後、18N 硫酸で 10時間還流抽出し、クリーンアップ後分析した。

分析； 放射活性は LSC で測定した。土壌中残渣は燃焼法により LSC 測定した。代謝物は HPLC で分析し、TLC で確認した。

結果： 試験系中での物質収支及びジクワットの経時変化（HPLC）を表 1 に示した。回収率は 87.8～105.7% TAR であった。土壌の非抽出性残渣は約 1% TAR 以下で、殆どが抽出された。揮発物は試験期間中全く認められなかった。抽出液中放射能は殆どがジクワットで、抽出液の HPLC、TLC 分析でジクワット以外の代謝物は認められなかった。また、2 種の TLC 分析で各試料中のジクワット[A]の割合は、抽出液中放射能の 98～100% であった。ジクワットは好氣的条件の土壌中で 9 か月間安定で、半減期を求める事は出来なかった。

表 1 物質収支及びジクワットの経時変化 (%TAR)

培養期間	抽出		非抽出性残渣	揮発物質	回収率
	ジクワット [A]	計*			
0 日	102.7	103.9	1.16	-	103.9
1 日	86.5	87.5	1.01	**	87.8
3 日	105.3	105.7	0.33	**	105.7
7 日	96.8	97.2	0.26	**	97.2
14 日	101.9	102.6	0.26	**	102.4
1 ヶ月	98.1	98.4	0.28	**	98.3
2 ヶ月	97.8	98.6	0.78	**	97.8
3 ヶ月	104.3	104.9	0.62	**	104.6
4 ヶ月	101.2	101.4	0.17	**	101.6
6 ヶ月	94.3	94.7	0.40	**	94.6
9 ヶ月	92.1	92.5	0.36	**	92.5

- : 測定せず * : 計=ジクワット [A]+非抽出性残渣

** : 検出限界 (0.024 ppm) 以下

(3) 嫌氣的土壤中動態試験

(資料 No.M-16)

試験機関：

報告書作成年：1988年

供試標識化合物：

ジプロミド 標識した 1,1'-エチレン-2,2'-ピピリジリウム
(以下、 標識ジクワットジプロミド)

*： 標識位置

放射化学的純度：

比放射能：

供試土壌：土壌は使用前に 2mm の篩を通した。池底質土壌及び付随水の特性は以下の通りである。

採取場所		米国フロリダ州
土相	分類 (USDA)	砂土
	粒径分布	
	砂質 (%)	92
	シルト質 (%)	4
	粘土 (%)	4
	pH	7.6
	密度	1.55
	圃場容水量 (1/3bar, %)	2.12
水相	陽イオン交換能 (meq/100g)	3.4
	有機物質 (%)	0.5
	pH	7.83

試験方法：

施用・培養条件； 各 25×125mm の培養管 (50ml) に池底質土壌 10.0g (乾燥土換算) を入れ、通気した 25℃、pH7.83 の池水各 30ml を添加した。その後、窒素ガス下 35 日間プレインキュベートした。 標識被験物質のストック溶液を添加・混和し、乾燥土当りジクワット (イオン) として 2.677 μg/g とした。さらに、窒素ガス下、暗所、25.3±0.4℃で 9ヶ月間培養した。

試料採取； インキュベート 0、1、3、7、14 日及び 1、2、3、4、6、9ヶ月後に土壌/水試料を 2 連で採取した。

揮発成分は 1N KOH 溶液、1N 硫酸溶液及びエチレングリコール溶液にトラップし、試料採取毎にトラップ溶液を取り替えた。

土壌抽出等； 水相は等容量の硫酸と合わせ、10 時間還流し、クリーンアップ後分析した。土壌は、アセトン及びメタノールで抽出後、18N 硫酸で 10 時間還流抽出し、クリーンアップ後分析した。

分析； 放射活性は LSC で測定した。土壌中残渣は燃焼法により LSC 分析した。代謝物は HPLC で分析し、TLC で確認した。

結果： 試験系中での物質収支を表1、ジクワット及び代謝物の経時変化を表2に示した。回収率は86.5～111.6%TARであった。水相中放射活性は試験開始時に1.9%TARで、その後若干増えたが、試験終了時には1.4%TARで、殆どが土相中に存在した。揮発物は試験期間中全く認められなかった。抽出物は殆どがジクワットで、
 が認められたが10%TAR以下であった。ジクワットは試験期間中僅かに減少したが、半減期を求める事は出来なかった。ジクワットは、嫌気的条件下の土壤中
 で安定であると言える。

表1 物質収支 (%TAR)

培養期間	水相	土相	計	揮発物	回収率
0日	1.8	96.4	98.2	-	100.0
1日	1.8	98.1	99.9	*	100.3
3日	2.9	86.9	89.9	*	89.9
7日	2.9	98.1	101.0	*	98.5
14日	2.5	88.2	90.7	*	92.5
1ヶ月	3.1	81.0	84.1	*	92.5
2ヶ月	12.3	90.8	103.1	*	111.6
3ヶ月	2.7	74.8	77.5	*	86.5
4ヶ月	1.0	79.3	80.3	*	89.9
6ヶ月	1.7	76.9	78.6	*	87.2
9ヶ月	1.4	84.8	86.2	*	91.7

-: 測定せず

*: 検出限界 (0.024 ppm) 以下

表2 ジクワットとその代謝物の経時変化 (%TAR)

培養期間	ジクワット [A]	
0日	98.8	0.0
1日	97.0	0.0
3日	100.0	0.0
7日	100.0	0.0
14日	98.1	2.7
1ヶ月	91.4	8.2
2ヶ月	92.0	7.9
3ヶ月	89.6	9.5
4ヶ月	89.6	8.8
6ヶ月	90.4	7.5
9ヶ月	94.1	5.5

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。

参考資料

(4) 土壌中微生物による分解-1

(資料No.MR-07)

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：

Frensham 土壌由来微生物では 43 日以内に約 70～80%、Broadricks 土壌由来微生物では 42 日以内に約 50～60%、*Lipomyces* では 20 日以内に約 40%が無機化された。

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。

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 土壤中微生物による推定代謝経路

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。

参考資料

(5) 土壌中微生物による分解-2

(資料No.MR-08)

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：

微生物の存在しない対照区ではジクワットの代謝は認められなかった。*Lipomyces* あるは2種の土壌由来微生物存在下ではジクワッ

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。

トは代謝され、
が増加した。

遅延期間（代謝が始まる前の期間）

と半減期を求めた。
遅延期間は 1.94～2.53 日、半減期は 0.44～2.71 日で、ジクワットは *Lipomyces* あるいは土壌微生物の存在下で速やかに代謝されることが示された。

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。

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。

参考資料

(6) ジクワットならびに の土壤中動態について (資料No.MR-09)

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。

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。

結 論： 土壌中におけるジクワットおよびその分解には土壌中微生物が関与していると考えられた。

図 土壌中における推定代謝経路

4. 水中動態に関する試験

(1) pH5、7 および 9 での加水分解

(資料 No.M-17、PC-03)

試験機関：

報告書作製年： 1985 年

供試標識化合物：

ジクロリド (以下、
で標識した 1,1'-エチレン-2,2'-ビピリジリウム
標識ジクワットジクロリド)

放射化学的純度； *： 標識位置
比放射能；

緩衝液： 以下の滅菌緩衝液を用いた

pH 5.0 緩衝液	0.1M フタル酸水素カリウム：0.05M 水酸化ナトリウム緩衝液	1:1
pH 7.0 緩衝液	0.1M O-リン酸二水素カリウム：0.1M リン酸水素二ナトリウム緩衝液	1:1.9
pH 9.0 緩衝液	0.1M ホウ酸中 0.1M 塩化カリウム：0.05M 水酸化ナトリウム緩衝液	1:1

試験条件：

試験濃度； 滅菌保存用液 約 55mg/L(ジクワットイオン)、補助溶媒は用いなかった。

インキュベーション； 25°C、遮光下 30 日間

試料採取； 0、2、8、16 および 30 日後

分 析： 放射能は、LSC で計測した。また、親化合物および分解物の分析は、TLC で行った。

結 果：

試験開始時および終了時に測定した各試料の pH は表 1 の通りである。

表 1 各試料の pH

サンプリング間隔	pH 5	pH 7	pH 9
試験開始時	5.03	7.04	9.13
試験終了時 (30 日)	5.01	7.03	9.16

各試料のジクワット濃度 (%TRR) および物質収支 (%TAR) を表 2 に示す。回収率は 89.3 ~106.7%TAR であった。

pH5 および 7 においては、30 日後まで、分解は認められなかった。pH9 でも 30 日後の分解率は 10%未満で安定であった

表 2 各試料におけるジクワットイオン濃度および物質収支 (2 連平均)

経過日数	pH5		pH7		pH9	
	ジクワット[A] %TRR	回収率 %TAR	ジクワット[A] %TRR	回収率 %TAR	ジクワット[A] %TRR	回収率 %TAR
0	92.9	100**	91.1	100	89.8	100
2	—	103.8	—	93.6	91.5	97.9
8	—	91.9	—	89.3	88.9***	97.2***
16	—	103.2	—	96.0	85.6	96.6
30	91.5	106.7	89.2	90.4	83.0***	93.9

** : 1 試料において、LSC 測定前に試料損失があり 1 連。

*** : 1 試料のみの値

以上より、ジクワットは、25℃で pH5 および 7 で 30 日間加水分解は認められず、pH9 では僅かに分解が認められ、推定半減期は約 222 日であった。

(2) 緩衝液中光分解試験 (pH7)

(資料 No.M-18、PC-04)

試験機関：

報告書作製年： 1987 年

供試標識化合物：

標識 1,1'-エチレン-2,2'-ビピリジリウム ジプロミド

(以下、

標識ジクワットジプロミド)

*： 標識位置

比放射能：

放射化学的純度：

緩衝液： 緩衝液の組成は以下の通りで、オートクレーブにより滅菌を行った。

0.01M オルトリン酸緩衝液 (pH7)	0.2M <i>O</i> -リン酸二水素一ナトリウム (39ml) + 0.2M <i>O</i> -リン酸一水素二ナトリウム (61ml) + 超純水
--------------------------	--

試験濃度： ガラス容器中でジクワットイオンとして 20.1 µg/mL となるように調整

試験温度： 25±1°C

光源： 自然太陽光の分光分布と近似したキセノンアーク灯 (290nm 以下の紫外線はフィルターでカット) 付装置 (Heraeus) により連続照射。光強度は平均 54.45W/m² (300~400nm)。

試料採取： 東京春換算で約 0、24、44、69 および 92 日相当時間経過後に試料を採取した。

分析： 放射能活性は LSC で測定した。また、TLC により分解物を分離/定性し、オートラジオグラフィーにより定量した。揮発性成分は、塩酸、メトキシエタノール、エタノールアミンの捕集液に採取し、放射能の定量を行った。

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。

結果および考察：

各試料の物質収支を表 1 に示す。回収率は 98.2～105.9%TAR であった。

表 1 各試料の物質収支 (%TAR)

平均 照射期間*	試料 No.	照射期間*	水相	揮発性 物質	合計
0	0A	0	102.9	—	102.9
	0B	0	102.2	—	102.2
24	1A	24.4	105.8	0.1	105.9
	1B	24.4	103.6	0.1	103.7
44	2A	44.4	99.2	0.2	99.4
	2B	42.8	99.2	0.2	99.4
69	3A	68.1	97.8	0.4	98.2
	3B	69.5	98.5	0.4	98.9
92	4A	93.1	99.3	0.5	99.8
	4B	91.3	97.8	0.5	98.3
暗所対照	対照 A	—	100.7	—	100.7
	対照 B	—	102.2	—	102.2

*：東京春換算値（日）

—：該当せず（暗所対照については、東京春 92 日間照射試料と同一期間経過）

水相を TLC 分析して得られた画分の経時変化を表 2 に示す。東京春換算で約 92 日間照射後、ジクワット[A]は約 73%TRR、
は約 %TRR であった。ジクワットの半減期を一次減衰反応を仮定して算出した結果
を表 3 に示す。半減期は東京春換算で 225～227 日（実験日日数で 32 日）であった。

緩衝液中における推定分解経路を図に示す。

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 2 水相中代謝物画分の経時変化 (%TRR)

平均照射期間*	試料 No.	照射期間*	ジクワット [A]					合計
0	0A	0	97.7					100
	0B	0	98.0					100
24	1A	24.4	89.7					99.8
	1B	24.4	92.1					99.8
44	2A	44.4	88.4					99.9
	2B	42.8	84.1					99.9
69	3A	68.1	80.3					99.7
	3B	69.5	79.9					99.7
92	4A	93.1	73.9					99.5
	4B	91.3	72.7					99.5
暗所 対照	対照 A	—	97.9					100
	対照 B	—	97.6					100

* : 東京春換算値 (日)

— : 該当せず (暗所対照については、東京春 92 日間照射試料と同一期間経過)

ND : 不検出

表 3 ジクワットの緩衝液中における半減期

方法	対数	SFO	FOMC
相関係数	0.9879	0.9880	0.9880
東京春換算半減期 (日)	225.4	227.1	227.1
実験半減期 (日)	32.2	32.4	32.4

SFO : Simple First Order

FOMC : First Order Multi-Compartment

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 ジクワットの緩衝液中における推定分解経路

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。

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) 水中光分解試験 (滅菌自然水-1)

(資料 No.M-19、PC-06)

試験機関：

報告書作成年： 2005年

供試標識化合物：

標識した 1,1'-エチレン-2,2'-ビピリジリウム
ジプロミド (以下、 標識ジクワットジプロミド)

比放射能： *： 標識位置
放射化学的純度：

供試水： ガンマ線照射により滅菌した池の自然水。物理化学的性質を下表に示す。

名称	Middle Row Pond 水、英国
pH	7.02
電気伝導度 (μS/cm)	414
総炭素 (mg/L)	39.2
総無機炭素 (mg/L)	38.9
総浮遊固体 (mg/L)	2.8
硝酸態窒素 (mg/L)	0.5
アンモニウム態窒素 (mg/L)	0.2
HCO ₃ としてのアルカリ度 (mg/L)	197.4
総マグネシウム (mg/L)	20.8
総カルシウム (mg/L)	47.7
総鉄 (mg/L)	<0.1
総溶解性鉄 (mg/L)	<0.05
三価鉄 (mg/L)	<0.05
二価鉄 (mg/L)	<0.05

試験条件： 農水省ガイドライン 2-6-2「水中光分解運命試験」に従った。

照射装置； サンテスト加速暴露装置 (Heraeus Equipment Ltd. (英国) 製)
フィルターで 290nm 以下の UV をカット

光源； キセノンアークランプ

光強度； 38.74 W/m² (300~400nm)

Li-Cor 製 LI-1800 ポータブル分光放射計で測定

供試濃度； 10μg/mL (ジクワットイオンとして)

溶媒メタノールは<1%v/v

試験温度； 25 ± 2 °C

試験容器； 側枝付ホウ珪酸ガラス製 (蓋は石英製)。内径 4cm、側枝までの
深さ 2.5cm。尚、試験溶液量は 8mL。

照射期間； 3日間連続 (東京春季自然太陽光換算で約 15日間相当)

試料採取； 0、2、4、12、18、24、48 及び 72 時間後に 2 連で採取
 (対照区は 72 時間後のみ)。
 尚、 等揮発物は 2M NaOH 溶液にトラップした。

分析法： 放射能は LSC で測定した。親化合物および分解物は、HPLC で分析し、LC-MS-MS、LC-NMR で確認した。

結果： 代謝物の経時変化を表 1 に示した。回収率は対照区を含めて 92.3~100.4% TAR であった。

ジクワットは比較的速やかに分解し、半減期は 31 時間 (東京春季自然太陽光換算で 6.5 日) であった。又、暗所対照区では殆ど分解は認められなかった。照射区の主要代謝物は で試験終了時には %TAR であった。その他、 が確認されたが、試験終了時 %TAR であった。また、極性成分画分は LC-NMR 及び LC-MS 分析により、 と同定され、48 時間後には %TAR が観察された。その他の分解物として、の混合物が確認された。尚、試験終了時には %の揮発物が認められたが、それ以上の同定は行わなかった。ジクワットの推定分解経路を図に示す。

表 1 照射区及び暗所対照区での分解物の経時変化 (施用量に対する割合、%TAR)

経過時間 (hours)	ジクワット [A]					計	揮発物	回収率
0	90.9					94.6	0	94.6
2	88.1					95.7	0	95.7
4	81.4					92.3	0	92.3
12	60.2					92.9	0.2	93.1
18	58.1					92.1	0.3	92.4
24	61.7					99.9	0.5	100.4
48	32.0					91.3	2.1	93.4
72	15.8					90.5	3.8	94.3
72 (暗所・対照区)	94.2					0	0	94.2

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 自然水中での推定分解経路

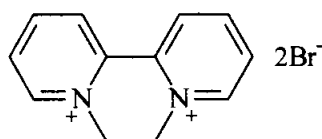
(4) 水中光分解試験 (自然水-2)

(資料 No.M-20、PC-05)

試験機関 :

報告書作製年 : 2000 年

供試化合物 : 非標識 1,1'-エチレン-2,2'-ビピリジリウムジブロミド
(以下、ジクワット)



純度 ;

供試自然水 : 英国ケンブリッジ州ハンティンドン近郊の Ouse 川から採取した河川水を用いた。特性を以下に示す。

pH	溶存酸素 濃度 (%)	温度 (°C)	伝導率 ($\mu\text{S}/\text{cm}$) *	固形浮遊物 (g/L) *	蒸散後総残渣 (g/L) *
7.9	80.5	15.5	306	0.002	0.41

* : 212 μm メッシュフィルター濾過後に測定。尚、使用前に、Whatman #5 でさらに濾過した以外には滅菌しなかった。

試験条件 :

照射装置 ; サンテスト加速暴露装置 (Heraeus Equipment Ltd. (英国) 製)
フィルターにより 290nm 以下の UV をカット

光源 ; キセノンアーク灯

光強度 ; 平均 43.6 W/m^2 (300~400nm)

1680B ダブルスペクトロメーター (Glen Spectra Ltd. (英国) 製) で測定

容器 ; ホウ珪酸ガラス製 (内径 2.5cm、高さ 8.0cm の円筒型)

尚、試験液は 20mL とした

試験濃度 ; 約 5 $\mu\text{g}/\text{mL}$ (ジクワットイオン)

試験温度 ; 25°C

試料採取 ; 0、6、12、24、36、48 および 60 時間後

分析 ; 走査分光光度計 (430~360nm) によりジクワット濃度を分析した。

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：

ジクワットイオン濃度の経時変化を表 1、遮光対照液中のジクワットイオン濃度の変化を表 2 に示す。

ジクワットの自然水中光分解半減期は、1.86 日（東京春換算で 10.4 日）であった。

表 1 ジクワットの経時変化 (2 連平均)

照射期間 (日)		ジクワットイオン 濃度%*	溶液中ジクワットイオン 濃度 (µg/mL)
実験日	東京春換算		
0	0	100.0	4.82
0.25	1.4	82.2	3.96
0.5	2.8	76.8	3.70
1	5.6	70.1	3.38
1.5	8.4	50.1	2.42**
2	11.2	46.7	2.25
2.5	14.1	36.1	1.74

*：試験開始時の濃度（ジクワットイオンとして 4.82µg/L）を 100 とする

**：1.98 と 2.85 の平均値だが、1.98 については異常値と判断され、半減期の算出には用いられていない。

表 2 遮光対照液中のジクワットの経時変化

遮光インキュベーション 期間 (日)	ジクワットイオン濃度%*	溶液中ジクワットイオン濃度 (µg/mL)
0.25	85.1	4.10
0.5	95.9	4.62
1	95.4	4.60
1.5	97.5	4.70
2	97.5	4.70
2.5	94.0	4.53

*：試験開始時の濃度（ジクワットイオンとして 4.82µg/L）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。

参考資料

(5) 水中における光分解試験

(資料No.MR-10)

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。

以上より、水中に溶解したジクワットは太陽光や紫外線によって速やかに、
等の低分子化合物にまで分解されるものと推定
される。
推定分解経路を図に示す。

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。

図 推定水中光分解経路

5. 土壌吸着性試験

(1) 4種の日本土壌における土壌吸着試験

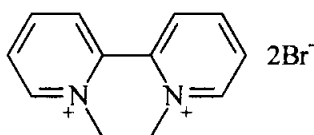
(資料 No.M-21,PC-02)

試験機関：

報告書作成年： 1991年

試験目的： 4種類の土壌の塩化カルシウム溶液中の吸着平衡後の吸着量と水相濃度をもとにフロイントリッヒ吸着等温式により吸着平衡定数 K_F^{ads} および有機炭素吸着平衡定数 $K_F^{ads}_{OC}$ を求める。

供試化合物： 非標識 1,1'-エチレン-2,2'-ビピリジリウム ジブロミド
(以下、ジクワットジブロミド)



純度：

供試土壌： 土壌の特性を下表に示す。

試料番号	2	8	14	19
供試土壌群名	細粒強グライ土	沖積鈹質土壌	褐色火山灰土壌	多腐植質黒ボク土
由来	日植調 古川試験地内	日植防研 高知試験場内	日植防研 牛久圃場内	日植調 熊本試験地内
pH (H ₂ O)	5.7	7.5	7.7	7.4
pH (CaCl ₂)	4.9	6.5	6.9	6.7
土性分類 (USDA)*	微砂質埴土	壤土	微砂質壤土	壤土
砂%	14.0	42.2	26.2	30.6
シルト%	44.1	31.9	50.9	49.7
粘土%	41.9	25.9	22.9	19.7
有機炭素%	3.37	1.21	3.61	12.91
陽イオン置換容量 (meq/100 g)	27.7	11.3	21.4	49.9
リン酸吸収係数	830	390	2000	1850
粘土鈹物の種類	カオリン鈹物 モンモリロナイト	クロライト イライト	アロフェン バーミキュライト	アロフェン バーミキュライト
水分 (%)	4.9	1.7	11.1	19.6
OECD分類	4	3	2	3

方法：

予備試験； 乾土 5g に純水 5mL を加えて一夜放置後、ジクワットジブロミド 5.62 μ g/mL の 0.01M 塩化カルシウム水溶液 20mL を加え (土/水比 0.2) 16 時間振盪し、3000rpm で 15 分間遠心した。上澄み液を陽イオン交換樹脂カラムクロマトグラフィーにより精製し、HPLC によりジクワット

ジブロミドの水相中濃度を求めた。

平衡化時間の測定； 0.01M 塩化カルシウム水溶液によりジクワットジブロミドの 5.18 μ g/mL 濃度のストック溶液を調製し、これを 0.01M 塩化カルシウム水溶液により希釈して 1.05 μ g/mL 溶液を調製し、試験溶液とした。乾土 5g に純水 5mL を加えて一夜放置後、前述のジクワットジブロミドの 0.01M 塩化カルシウム水溶液を加え（土/水比 0.2）、2 あるいは 4 時間振盪し、3000rpm で 15 分間遠心した。上澄み液を陽イオン交換樹脂カラムクロマトグラフィーにより精製し、HPLC により水相中濃度を求めた。同時に対照試料（土壌なし）についても実施した。

物質収支； 残土に硫酸を加え、加熱還流抽出後、陽イオン交換樹脂カラムクロマトグラフィーにより精製し、HPLC により抽出液中濃度を求め、固相（土壌）中濃度を計算した。水相中濃度と合わせて物質収支を求めた。

分 析； 水相中ジクワットジブロミドは、HPLC により、固相（土壌）は、加熱還流抽出物を HPLC 分析した。

結果及び考察：

予備試験； 予備試験の結果を表 1 に示す。平均回収率は 95.8~99.8%であった。水相中濃度は、いずれも検出限界未満であった。従って、本試験は実施しなかった。

平衡化試験； 各試験土壌において 2 あるいは 4 時間の振盪後測定した水相からは、いずれも全く検出されなかった。2 時間後には、既に平衡に達していたと考えられる。

表 1 予備試験の結果

試料 No.	初期添加量 (μ g)	プラトー到着時の吸着量 (μ g)	平衡溶液中の量 (μ g)	試験土壌ブランク (μ g)	不足量 (μ g)	回収率 (%)	
						実測値	平均値
2	112.4	105.0	<0.6	<0.6	7.4	93.4	99.2
	112.4	118.2	<0.6	<0.6	+5.8	105	
8	112.4	113.4	<0.6	0.9	+0.1	100	99.8
	112.4	113.0	<0.6	0.9	0.3	99.7	
14	112.4	103.6	<0.6	<0.6	8.8	92.2	95.8
	112.4	111.8	<0.6	<0.6	0.6	99.5	
19	112.4	108.0	<0.6	<0.6	4.4	96.1	96.2
	112.4	108.3	<0.6	<0.6	4.1	96.4	

予備試験の結果、水相中にジクワットジブロミドが認められなかったことから、本試験は実施せず、 $K_{F^{ads}}$ あるいは $K_{F^{ads}_{OC}}$ を求めることは出来なかった。ジクワットは強度の土壌吸着性を有すると考えられた。

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。

参考資料

(2) 32種のデンマーク土壌における土壌吸着試験

(資料 No.MR-11)

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。

以上の結果から、ジクワットは高濃度においても強度の土壌吸着性を有すると考えられた。

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. 代謝分解のまとめ

1) 動物代謝に関する試験

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、動物体内におけるジクワットの運命を調べた。

標識ジクワットジプロミドをジクワットイオンとして 1mg/kg 単回経口投与した。7日後までに 3~4%TAR が尿中、93~95%TAR が糞中排泄された。糞尿中からは親化合物[A]のみが確認された。組織中に残留放射能は認められなかった。

標識ジクワットジプロミドをジクワットイオンとして 100mg/kg 単回経口投与した。7日後までに 7~9%TAR が尿中、84~87%TAR が糞中排泄された。糞尿中からは親化合物[A]のみが確認された。組織中に残留放射能は、腎臓および肝臓で高かった。

標識ジクワットジプロミドをジクワットイオンとして 1 あるいは 100mg/kg 単回経口投与した。1~2 時間後に T_{max} に達し、半減期は 1.6~5.0 時間であった。C_{max}、AUC_{0-24hr} は、投与量にほぼ比例していた。組織中の放射能濃度は、肝臓、腎臓および肺で高かった。

標識ジクワットジプロミドをジクワットイオンとして 100mg/kg 単回経口投与した。48 時間後までの尿および 72 時間後までの糞を用いて代謝物を同定した。尿から、親化合物[A]が 76~80%TRR、 が各 %TRR (計約 %TAR 相当) 検出された。糞中からは[A]のみが確認された。

標識ジクワットジプロミドをジクワットイオンとして 45mg/kg 単回経口投与あるいは 10mg/kg 単回皮下投与した。4 日後までに、92~97%TAR が排泄された。経口投与では排泄放射能の 6.5%が尿中、93.5%が糞中、皮下投与では 95%が尿中、5%が糞中排泄された。経口投与後の吸収率は約 6.8%と推定された。親化合物[A]以外に が確認された。

以上のことから、ジクワットイオンは一部 (吸収率; 約 6.8%) が消化管から吸収され、主に尿中排泄された (3~9%TAR)。尿では、76~80%は親化合物[A]、各 %が であった。糞からは親化合物[A]のみが確認された。

2) 植物代謝に関する試験

大麦、小麦、オート麦、なたね、ばれいしょ、トマト、とうもろこしを用いて植物体内におけるジクワットの運命を調べた。

標識ジクワットジブロミドを大麦およびオート麦の地上部に 0.3、0.6 および 1.1kg/ha 散布、あるいは 標識ジクワットジブロミドを大麦中心部に 0.77kg/ha 散布した（枯凋処理）。ジクワットは速やかに光分解し、主要代謝物として が認められ、その他に、 が検出された。

標識ジクワットジブロミドを小麦に通常量およびその 100 倍量散布、 標識ジクワットジブロミドを大麦に 1.1kg/ha 散布した。代謝物として、 (%TRR)、 (%TRR) が検出され、その他、 の存在が確認された。さらに、各種高分子放射能活性画分が認められ、代謝物が天然植物成分に取り込まれると考えられた。

標識ジクワットジブロミドを小麦に 10.2kg/ha 相当散布した。代謝物として (%TRR) および (%TRR) が検出され、 の存在が確認された。その他、籾殻試料の植物構成成分（アミノ酸、タンパク質、サッカライド、リグニン、でんぷん、セルロース等）から放射能が検出され、代謝物が植物構成成分に取り込まれることが示唆された。

標識ジクワットジブロミドをなたねの成熟期に 575g/ha で枯凋処理した。種子中の主要代謝物としてジクワット[A] (48.0%TRR、0.465mg/kg) が検出され、その他に、 が検出されたが、いずれも %TRR 未満であった。ジクワットは に代謝されると考えられた。

標識ジクワットジブロミドをなたねに 0.3、0.6 および 1.1kg/ha 相当地上散布した。7 日後でなたね油中 TRR は検出限界以下、14 日後で 0.02ppm 以下であった。油粕中 TRR は最大で 3.22ppm で、55~59%TRR は親化合物[A]であった。

標識ジクワットジブロミドをばれいしょの塊茎成熟期に 969g/ha で枯凋処理した。塊茎（皮を除く）および皮中の主要代謝物としてジクワット[A] (71.7~78.7%TRR、0.023~0.031mg/kg) が検出され、その他に主要な代謝物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。

標識ジクワットジプロミドをばれいしょに 1.7kg/ha 相当地上散布（枯凋処理）した。塊茎における残留量は 0.012～0.047ppm で、親化合物[A]以外の代謝物は検出されなかった。

標識ジクワットジプロミドをトマトの発芽直前に土壌に 1032g/ha 散布した。果肉および葉中の総残留放射能はいずれも 0.01 mg ジクワットイオン/kg 未満と低かった。トマトにおけるジクワットジプロミドの土壌からの取り込みはわずかであると考えられた。

あるいは 標識ジクワットジプロミドを、トマト、とうもろこしおよびろ紙に処理し、光照射との関係を検討した。ジクワットの代謝には が想定された。分解は太陽光暴露 1 週間以内に起こり、分解量と光強度との間に相関性が認められた。ろ紙上放射能が経時的に減少することから、揮発性物質への分解が示唆された。

以上のことから、ジクワットは 等に代謝され、さらに一部は植物構成成分に取り込まれると考えられる。

3) 土壌中動態に関する試験

ジクワットの好氣的湛水条件、好氣的条件および嫌氣的湛水条件（嫌氣的条件に相当）での土壌代謝を検討した。

乾土約 10g に池水約 30mL を添加し 標識ジクワットジプロミドを乾土当たりジクワットイオンとして 2.677 μ g/g 施用し、約 25 $^{\circ}$ C で 31 日間インキュベートした。水相では試験開始時には 10.2% TAR であったが、31 日後には 1.6% TAR に減少し、対応して土相中残留放射能が増加した。31 日間ジクワットは安定で代謝は認められなかった。

乾土約 10g に 標識ジクワットジプロミドを乾土当たりジクワットイオンとして 2.677 μ g/g 施用し、約 25 $^{\circ}$ C で 9 か月間インキュベートした。非抽出性残渣は 1.1% TAR 以下で、殆どが抽出された。抽出液中から親化合物[A]以外の代謝物は検出されず、9 か月間ジクワットは安定であった。

乾土約 10g に池水約 30mL を添加し、 標識ジクワットジプロミドを乾

土当たりジクワットイオンとして 2.677 $\mu\text{g/g}$ 施用し窒素ガス下、約 25 $^{\circ}\text{C}$ で 9 か月間インキュベートした。放射活性の殆どは、土相中に存在し、非抽出性残渣は 1%TAR 以下であった。親化合物[A]以外に が一つ検出されたが %TAR 以下であった。ジクワットは試験期間中僅かに減少したが、半減期を求めることは出来なかった。

以上のことから、ジクワットは好氣的湛水条件、好氣的条件および嫌氣的条件下の土壤中で安定であった。

4) 環境中動態に関する試験

標識ジクワットジクロリドを pH5、7 および 9 の緩衝液にジクワットイオンとして 55 $\mu\text{g/mL}$ 施用し、25 $^{\circ}\text{C}$ 、暗所下、30 日間インキュベートした。pH5 および 7 では、30 日間分解は認められなかった。pH9 では僅かに分解が認められ、推定半減期は約 222 日であった。

標識ジクワットジプロミドを緩衝液 (pH7) にジクワットイオンとして 20.1 $\mu\text{g/mL}$ 施用し、25 $^{\circ}\text{C}$ 、54.45 W/m^2 (300~400nm) 照射下、東京春換算で約 92 日間インキュベートした。一次減衰反応を仮定して、半減期は 32 日 (東京春換算 225~227 日) であった。分解物として が %TRR 検出された。

標識ジクワットジプロミドを滅菌自然水にジクワットイオンとして 10 $\mu\text{g/mL}$ 施用し、25 $^{\circ}\text{C}$ 、38.74 W/m^2 (300~400nm) 照射下、3 日間インキュベートした。半減期は 31 時間 (東京春換算 6.5 日) であった。分解物として 、 検出された。

非標識ジクワットジプロミドを自然水にジクワットイオンとして 5 $\mu\text{g/mL}$ 施用し、25 $^{\circ}\text{C}$ 、43.6 W/m^2 (300~400nm) 照射下、60 時間インキュベートした。半減期は 1.86 日 (東京春換算 10.4 日) であった。

非標識ジクワットジプロミド 5.62 $\mu\text{g/mL}$ の 0.01M 塩化カルシウム水溶液を 4 種日本土壌に加え (土/水比 0.2)、16 時間振とうした (予備試験)。その結果、水相中にジクワットジプロミドが認められなかったことから、 K_F^{ads} あるいは $K_F^{\text{ads}}_{\text{OC}}$ を求める本試験は実施出来なかった。従って、ジクワットは強度の土壌吸着性を有すると考えられた。

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。

7. 動植物などにおける推定代謝分解経路

8. 代謝分解の概要

供試物	標識位置 処理化合物	処理量	条件	試料	代謝物 (投与量または処理量に対する%) ¹⁾													投与量または処理量に対する回収率 (%)					
					A																		
動物	ラット (M-01)	標識 ジクワット	1 mg/kg	単回経口投与	雄	尿 (0-168 時間)														2.7			
						糞 (0-168 時間)																94.9	
						腎 (168 時間後)																	0.00 (0.000 µg/g)
						肝 (168 時間後)																	0.00 (0.000 µg/g)
					雌	尿 (0-168 時間)																	3.6
						糞 (0-168 時間)																	92.7
						腎 (168 時間後)																	0.00 (0.001 µg/g)
						肝 (168 時間後)																	0.00 (0.000 µg/g)
	ラット (M-02)	標識 ジクワット	100 mg/kg	単回経口投与	雄	尿 (0-168 時間)														5.7			
						糞 (0-168 時間)																84.2	
						腎 (168 時間後)																	0.00 (0.023 µg/g)
					雌	肝 (168 時間後)																	0.00 (0.020 µg/g)
						水晶体 (168 時間後)																	0.00 (0.038 µg/g)
						尿 (0-168 時間)																	5.1
糞 (0-168 時間)																	86.8						
腎 (168 時間後)																		0.00 (0.102 µg/g)					

1) : 動物代謝試験では投与量に対する割合、植物の場合は試料中に検出された放射能に対する割合

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。

供試物	標識位置 処理化合物	処理量	条件	試料	代謝物 (投与量または処理量に対する%) ¹⁾															投与量または処理量に対する回収率 (%)						
					A																					
動物	ラット (M-02)	標識 ジクワット	100 mg/kg	単回経口投与	肝 (168 時間後)	雌															0.00 (0.102 µg/g)					
					水晶体 (168 時間後)																			0.00 (0.102 µg/g)		
	ラット (M-03)	標識 ジクワット	1 mg/kg	単回経口投与	全血 (24 時間後)	雄																(0.001 µg/g)				
					腎 (96 時間後)																			(0.001 µg/g)		
					肝 (96 時間後)																				(0.000 µg/g)	
					水晶体 (96 時間後)																					(0.000 µg/g)
					全血 (24 時間後)																					(0.002 µg/g)
			100 mg/kg	単回経口投与	腎 (96 時間後)	雌																			(0.002 µg/g)	
					肝 (96 時間後)																				(0.001 µg/g)	
					水晶体 (96 時間後)																					(0.001 µg/g)
					全血 (24 時間後)																					(0.135 µg/g)
					腎 (96 時間後)																					(0.194 µg/g)
100 mg/kg	単回経口投与	肝 (96 時間後)	雄																			(0.065 µg/g)				
		水晶体 (96 時間後)																					(0.074 µg/g)			
		全血 (24 時間後)																					(0.244 µg/g)			
100 mg/kg	単回経口投与	腎 (96 時間後)	雌																			(0.251 µg/g)				

1) : 動物代謝試験では投与量に対する割合、植物の場合は試料中に検出された放射能に対する割合

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。

供試物	標識位置 処理化合物	処理量	条件	試料	代謝物 (投与量または処理量に対する%) ¹⁾														投与量または 処理量に 対する回収 率 (%)			
					A																	
動物	ラット (M-03)	標識 ジクワット	100 mg/kg	単回経口投 与	肝 (96 時間後)	雌															(0.059 µg/g)	
					水晶体 (96 時間後)																	
	ラット (M-04)	標識 ジクワット	100 mg/kg	単回経口投 与	ブール尿 (48 時間後)	雄	76.2															
					ブール糞 (48 時間後)		86.7															
					ブール尿 (48 時間後)	雌	79.8															
					ブール糞 (48 時間後)		75.4															
	ラット (M-05)	標識 ジクワット	45 mg/kg	単回経口投 与	尿 (0-4 日)	雄	5.1														6.3	
					糞 (酸抽出液) (0-4 日)		57.1															73.6
					糞 (残渣) (0-4 日)																	
			100 mg/kg	単回皮下投 与	尿 (0-4 日)	雌	74.5															87.1
糞 (酸抽出液) (0-4 日)																					4.3	
糞 (残渣) (0-4 日)																						0.6
植 物	大麦 +ト麦 (M-07)	標識 ジクワット	0.6 kg/ha	地上部散布	大麦 茎 (処理 14 日後) (ギ酸抽出液)	15.6																
			1.1 kg/ha	地上部散布	大麦 茎 (処理 7 日後) (臭化水素酸 抽出液)	18.5																

1) : 動物代謝試験では投与量に対する割合、植物の場合は試料中に検出された放射能に対する割合

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。

供試物	標識位置 処理化合物	処理量	条件	試料	代謝物 (投与量または処理量に対する%) ¹⁾														投与量または処理量に対する回収率 (%)			
					A																	
植 物	大麦 オート麦 (M-07)	1.1 kg/ha	地上部散布	大麦 茎 (処理 14 日後) (臭化水素酸 抽出液)	10.4																	
				大麦 茎 (処理 14 日後) (水およびギ酸 抽出液)	8.7																	
				大麦 穀粒 (処理 14 日後) (臭化水素酸 抽出液)	3.63																	
				オート麦 穀粒 (処理 14 日後) (臭化水素酸 抽出液)	23.1																	
		0.3 kg/ha	地上部散布	オート麦 茎 (処理 7 日後) (臭化水素酸 抽出液)	44.4																	
		7.7 kg/ha	枯凋処理	大麦 茎 (処理 14 日後) (ギ酸抽出液)	14.0																	
大麦 小麦 (M-08)	標識 ジクワット	30.1mg/ 60×60cm	枯凋処理	小麦	ワラ	12																
					穀粒	25																
		1.64g/ 50×20cm		ワラ	39																	
				穀粒	42																	
小麦 (M-09)	標識 ジクワット	10.2 kg/ha	枯凋処理	小麦 (0.5M 硫 酸抽出)	粗穀	34.4																
					ワラ	32.1																
					穀粒	51.0																

¹⁾：動物代謝試験では投与量に対する割合、植物の場合は試料中に検出された放射能に対する割合

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。

供試物	標識位置 処理化合物	処理量	条件	試料	代謝物 (投与量または処理量に対する%) ¹⁾														投与量または 処理量に 対する回収 率 (%)	
					A															
植 物	小麦 (M-09)	標識 ジクワット	10.2 kg/ha	枯凋処理	小麦 (順次 抽出)	初殻	22.5													
						ワラ	14.9													
						穀粒	42.4													
	なたね (M-22)	標識 ジクワット	575g/ha	枯凋処理	種子 (処理 5 日後)	48.0 (0.465)*													91.2	
	なたね (M-10)	標識 ジクワット	0.3kg/ha	枯凋処理	油粕 (処理 7 日後)														80~83	
			0.6kg/ha														85			
			1.1kg/ha														67~75			
			0.3kg/ha		油粕 (処理 14 日後)												76~86			
			0.6kg/ha													71~75				
			1.1kg/ha														85~89			
	ばれい しょ (M-23)	標識 ジクワット	969g/ha	枯凋処理	塊茎 (皮を 除く)	処理 10 日後	78.7 (0.023)*												97.0	
						処理 20 日後	73.9 (0.024)*										89.0			
					皮	処理 10 日後	71.7 (0.031)*											88.1		
						処理 20 日後	72.7 (0.028)*											85.7		
ばれい しょ (M-11)	標識 ジクワット	1.7kg/ha	枯凋処理	塊茎 (処理 14 日後)													(A: 0.023 ppm)			
トマト (M-24)	標識 ジクワット	1032g/ha	土壌散布	果実(成熟) (処理 112 日後)													(A: <0.001 mgジクワット イオン/kg)			
				葉 (処理 112 日後)												(A: 0.002 mgジクワット イオン/kg)				

¹⁾: 動物代謝試験では投与量に対する割合、植物の場合は試料中に検出された放射能に対する割合 * : mg/kg(ジクワットイオン換算値)

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。

供試物	標識位置 処理化合物	処理量	条件	試料	代謝物 (投与量または処理量に対する%) ¹⁾														投与量または処理量に対する回収率 (%)										
					1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14											
土 壤	好氣的 湛水土 壤 (M-14)	標識 ジクロット	2.677 µg イ n/g 乾土	好氣的 湛水土 壤	水相 (31 日)	1.5																							
					土相 (31 日)	89.4																							
	好氣的 土 壤 (M-15)	標識 ジクロット		好氣的土 壤	9 ヶ月間培養後土 壤	92.1																							
					嫌氣的 土 壤 (M-16)	標識 ジクロット	嫌氣的土 壤	9 ヶ月間培養後土 壤	94.1																				
水 中	加水分 解 (M-17)	標識 ジクロット	55 mg イn /L	加水分解 (30 日間)	pH	5	91.5																						
						7	89.2																						
						9	83.0																						
	水中光 分解 (M-18)	標識 ジクロット	20.1µg/L	水中光分解 (緩衝液)	東京春換算で約 92 日間 (pH7)	73																							
水中光 分解 (M-19)	標識 ジクロット	10µg/L	水中光分解 (滅菌自然 水)	光照射下 (72 時間後)	15.8																								
				暗所対照区 (72 時間後)	94.2																								

1)：動物代謝試験では投与量に対する割合、植物の場合は試料中に検出された放射能に対する割合

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。

ジクワット開発年表