

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

#### 4. 土壌吸着性試験

(資料 No. M-6)

エトキサゾールを用いた土壌吸着性試験

試験機関：

報告書作成年：

提出省略理由書

省略理由

エトキサゾールの土壌吸着性試験について検討を行った結果、本剤はガイドラインにおける「水への溶解度が小さいもの」に該当し、技術的にガイドラインに規定されている土壌吸着性試験法の適用は困難であると判断し、試験は実施しなかった。

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

5. 水中運命に関する試験

(資料 No. M-7)

(1) [<sup>14</sup>C]標識エトキサゾールを用いた加水分解運命試験

試験機関：

[GLP対応]

報告書作成年：

供試標識化合物：次表の標識化合物を使用した。

化学名および名称	5- <i>tert</i> -butyl-2-[2-(2,6-difluorophenyl)-4,5-dihydro-1,3-oxazol-4-yl]phenetole
化学構造式および標識位置 (*で表示)	
比放射活性	
放射化学的純度	
略 称	フェニル標識体

標識位置設定理由：

供試水溶液：

HPLC級の高純度水から調製した0.01 Mの濃度の次の緩衝液を使用した。各緩衝液はオートクレーブで滅菌し、溶存酸素は0.2 μmポアサイズのフィルターを通して滅菌した窒素ガスを通気して除去した。

pH	緩衝液組成
1.2	塩酸+塩化カリウム
5.0	酢酸+水酸化ナトリウム
7.0	磷酸二水素カリウム+水酸化カリウム
9.0	硼酸+水酸化ナトリウム

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

### 試験方法および分析方法

#### 1) 試験方法

- (1) 溶解補助剤：最終濃度1%のアセトニトリル
- (2) 試験濃度：0.037 mg/L (20℃における水溶解度の約1/2)
- (3) 試験温度、期間および採取時点：

pH	温度 (°C)	試料採取時点
1.2	37	0, 15, 30, 45, 60, 75, 90分
5.0	20	0, 4, 7, 10, 14, 17, 21日
7.0	20	0, 7, 10, 14, 18, 22, 30日
	50	0, 3, 5, 7, 9, 12, 16日
	60	0, 36, 60, 84, 108, 144, 168時間
	70	0, 12, 18, 24, 30, 36, 48時間
9.0	20	0, 7, 10, 14, 18, 22, 30日
	50	0, 4, 6, 9, 12, 15, 18日
	60	0, 36, 60, 84, 120, 156, 192時間
	70	0, 12, 18, 24, 36, 48, 60時間

#### (4) 試料環境：

試験溶液 (80.8 mL) はテフロンで裏打ちした螺旋蓋付きの三角フラスコ (100 mL 容) に密封し、設定温度±0.5℃の恒温遮光環境下でインキュベートした。試験はすべて無菌的に行い、試験期間中試験系の滅菌状態は維持された (微生物数を検定して確認)。試験溶液のpHは試験期間中維持されていた。

#### 2) 分析方法

各採取時点で2連の試料を分析した。

##### (1) 抽出と分画

試験溶液は試験容器のエーテル洗浄液 (約100 mL) で振とう抽出し、抽出液と水相に分離した。一部の試料 (pH7とpH9の20℃試料およびpH1.2試料) では試験溶液を分液ロートに移し、約100 mLのエーテルで2回抽出すると共に、試験容器を別途20~25 mLのアセトニトリルで洗浄し、エーテル抽出液と水相およびアセトニトリル洗浄液を得た。また、pH1.2試料は試験溶液をpH9に調整したのち、エーテル抽出した。

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

## 図 1 分析フロー

### (2) 放射活性測定

抽出液、水相など液体試料はすべて直接、液体シンチレーション計測 (LSC) して放射活性を定量した。

### (3) 分解物の分析

#### ① 分解物の検出と定量

pH7とpH9の20℃試料と容器洗浄液の濃縮液はTLCで、その他の試料のエーテル抽出液はペアードイオン法による逆相系HPLCで分析し、HPLCの場合は未変化体と分解物を放射能フロー検出器で検出し、溶出液を分画してLSC法で定量した。TLCの場合はラジオルミノグラフィー法またはTLCリニアスキャナーで分解物等を検出し、後者で定量した。

#### ② 分解物の同定

#### ③ 半減期算定

エトキサゾールの分解を擬似一次反応とみなし、次式より各試験温度における半減期を算出した。

$$\ln(\text{時間}t\text{における未変化体の濃度}) = -kt + \ln(\text{未変化体の初期濃度})$$

$$\text{半減期} = 0.693/k$$

k : 速度定数, t : 時間

25℃における半減期は次のアーレニウス式に基づき、 $\ln k$ と $1/T$ の回帰式から算定した。

$$\ln k = \ln A - E/RT$$

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

R: ガス定数 ( $8.314 \text{ JK}^{-1}\text{mol}^{-1}$ ), T: 絶対温度, A: 頻度定数,  
k: 温度Tにおける速度定数, E: 活性化エネルギー

結果:

1) エトキサゾールの加水分解半減期

エトキサゾールの濃度は擬似一次反応に従って低下した。表 1に示すように、20℃でエトキサゾールは酸性では比較的加水分解され易いが中性および塩基性では安定であった。

表 1 エトキサゾールの加水分解半減期

温度 (°C)	pH1.2	pH5.0	pH7.0	pH9.0
37	0.73時間	—	—	—
20	—	9.6日	161日 (147日)	165日 (217日)
25	—	—	(88日)	(124日)
50	—	—	8.0日	9.5日
60	—	—	3.2日	3.9日
70	—	—	1.5日	1.6日

( ): 50, 60, 70℃の3温度での速度定数からアーレニウス式に基づいて得た計算値。

2) 主要加水分解生成物および主要加水分解経路 (表 2~表 5および図 2)

いずれかの試験のいずれかの時点で処理量の10%を超えて検出された主要な加水分解生成物はR4とR7のみであり、その他の生成物は最大でも処理量の6%未満であった。R4は中性および塩基性条件下での主生成物で、R7は酸性条件下での主生成物であった。

表 2 pH7.0および9.0の70℃における $[^{14}\text{C}]$ 標識エトキサゾールの加水分解経時変化

時間 (hr)	pH7.0 (70℃)					pH9.0 (70℃)				
	未変化体	R7	R4	他	回収率	未変化体	R7	R4	他	回収率
0	101.4					101.4				
12	67.4					68.7				
18	63.1					67.4				
24	53.9					59.3				
30	49.5					—				
36	45.8					45.6				
48	37.4					41.7				
60	—					30.2				

数値: 対処理量% (2点の平均値; 原報の分解物定量結果の表中数値に抽出率を乗じて申請者が算出)。nd: 不検出。—: 未実施。

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

表 3 pH5.0, 20°Cにおける<sup>14</sup>C標識エトキサゾールの加水分解経時変化

時間 (日)	未変化体	R7	R4	その他	回収率
0	90.9				
4	65.0				
7	55.4				
10	38.8				
14	45.6				
17	26.8				
21	17.2				

数値：対処理量%（2点の平均値；原報の分解物定量結果の表中数値に抽出率を乗じて申請者が算出）。肩付き数値：成分数。nd：不検出

なお、pH1.2試料では当初、pH9に調整したのちエーテル抽出し、R4が主分解生成物として検出されたが、これは塩基性下で不安定なR7がpH9に調整した際にR4に変換されたためと判明した（表5）。

表 4 pH1.2, 37°Cにおける<sup>14</sup>C標識エトキサゾールの加水分解経時変化（pH9に調整後抽出）

時間 (分)	未変化体	R7+R4	その他	回収率
0	92.6			
15	71.7			
30	65.6			
45	48.7			
60	41.8			
75	30.1			
90	21.9			

数値：対処理量%（2点の平均値；原報の分解物定量結果の表中数値に抽出率を乗じて申請者が算出）。

表 5 pH1.2試料の抽出前pH調整によるR7のR4へのアーティファク的な変換

時間	分解物	pH9に調整後抽出	pH1.2から直接抽出*
1	R4		
	R7		
	R4+R7		
2	R4		
	R7		
	R4+R7		

数値：対総回収量%。

\*：正しい定量値

nd：不検出。

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

図 2 エトキサゾールの加水分解経路

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

(資料 No. M-8参)

(2) -1 [<sup>14</sup>C] 標識エトキサゾールを用いた水中光分解運命試験

試験期間：

[GLP対応]

報告書作成年：

供試標識化合物：次表の2種類の標識化合物を使用した。

化学名および名称	5- <i>tert</i> -butyl-2-[2-(2,6-difluorophenyl)-4,5-dihydro-1,3-oxazol-4-yl]phenetole	
化学構造式および標識位置 (*で表示)		
比放射活性		
放射化学的純度		
略 称	フェニル標識体	オキサゾール標識体

標識位置設定理由：

供試水：特性を次表にまとめた。

供試水	緩衝液 (pH9)	河川水 (自然水)
供試水の調整方法	ホウ酸0.618 gを水900 mLに溶解し水酸化カリウム水溶液でpH約8.7に調整後水で1000 mLとした。	—
供試水の選定	加水分解試験 (資料 No. M-7) において最も安定であったため	殺ダニ剤としての使用を通して流入の恐れがあるため
供試水の滅菌方法	オートクレーブ滅菌 (121°C, 15~20分)	0.2 μmのフィルターでろ過滅菌
採取場所	—	Ouse川 (Huntingdon市, 英国)
pH	9.20 (予備試験), 9.33 (本試験)	8.37 (予備試験), 8.46 (本試験)
溶存酸素 (mgO <sub>2</sub> /L)	—	8.94 (ろ過前), 8.86 (ろ過後)



本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

(つづき)

供試水	緩衝液 (pH9)	河川水 (自然水)
COD : mgO <sub>2</sub> /mg (50%希釈液)	—	28.5 (ろ過前) 7.5 (ろ過後)
BOD : mgO <sub>2</sub> /L (50%希釈液)	—	0.065 (ろ過前) 0.075 (ろ過後)
無菌状態 (生菌数を検定)	試験期間を通じて保たれた	試験期間を通じて保たれた

—:記載なし

光源および光強度

- (1) キセノンアーク光 (290~800 nm)
- (2) 26100 μW/cm<sup>2</sup> (250~800 nm, 1995年8月2日, 北緯52°における日中平均値)

試験方法および分析方法

1) 試験方法

- (1) 試験容器 : ホウケイ酸塩ガラス製 (内径2.5 cm, 高さ8.0 cmの円筒状)  
試験容器および試験器具はオートクレーブで滅菌
- (2) 溶解補助剤 : アセトニトリル (予備試験 ; 4%および10%, 本試験 ; 10%)
- (3) 試験濃度 : 予備試験 ; 0.005 mg/Lおよび0.01 mg/L, 本試験 ; 0.005 mg/L
- (4) 試験溶液 : 18 mLのpH9緩衝液または河川水を試験容器に入れ, 1 mLのアセトニトリルおよび試験原液 (0.01 mg/mLアセトニトリル溶液) をそれぞれ添加
- (5) 試験温度 : pH9緩衝液区 ; 20.1±0.3°C  
河川水区 ; 19.8±0.5°C  
pH9緩衝液暗所対照区 ; 20.0±0.4°C
- (6) トラップ液 : ①エチルジゴール (ジエチレングリコールモノエチルエーテル)  
②および③ 1 M水酸化カリウム水溶液

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

(7) 試料採取：次表にまとめた。

標識体	試験水	試験区	試料採取時点
オキサゾール 標識体 (予備試験)	緩衝液 (pH9)	照射区	3, 5, 7日
		非照射区	7日
	河川水	照射区	3, 5, 7日
		非照射区	7日
オキサゾール 標識体 (本試験)	緩衝液 (pH9)	照射区	0, 71.56, 143.53, 216.24, 288.46, 361.61時間
		非照射区	0, 71.56, 143.53, 216.24, 288.46, 361.61時間
	河川水	照射区	0, 54.0, 108.03, 162.07, 216.04, 269.66時間
		非照射区	0, 54.0, 108.03, 162.07, 216.04, 269.66時間
フェニル 標識体	緩衝液 (pH9)	照射区	0, 71.56, 143.53, 216.24, 288.46, 361.61時間
		非照射区	0, 71.56, 143.53, 216.24, 288.46, 361.61時間
	河川水	照射区	0, 54.0, 108.03, 162.07, 216.04, 269.66時間
		非照射区	0, 54.0, 108.03, 162.07, 216.04, 269.66時間

## 2) 分析方法

### (1) 抽出および分析

採取時点で各試験容器を秤量した後、1 mLを採取した。滅菌度およびpHを測定し、放射能をLSC法で測定（2連）した。残余の採取溶液に2倍量のジエチルエーテルを加えて抽出を行った後、水相およびエーテル相の放射能をLSC法で測定した。エーテル溶液はエーテルを蒸発させて乾固させて1 mLのアセトニトリルで再溶解した後、その0.1 mLをLSC法で放射能を測定した。残余のアセトニトリル溶液を0.05~0.1 mLまで濃縮して、薄層クロマトグラフィー（TLC）分析を行った。クロマトグラフィーで分析しない場合は $-15 \pm 5^{\circ}\text{C}$ で保管した。

予備試験の5日および7日の試料では、試験容器を2 mLのアセトニトリルで洗浄し、洗浄液の放射能もLSC法で測定した。

### (2) 分解物同定

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

### (3) 放射能の測定

液体試料の放射エネルギーは、その一部を直接液体シンチレーション計測 (LSC) で測定した。 [ $^{14}\text{C}$ ] 標識化合物の放射化学純度および代謝分解物の分析は、放射能検出器付き (Reeve model 9701) のHPLCと順相TLC (Kieselgel 60F<sub>254</sub> プレート) で行った。放射能は、BAS2000オートラジオグラフィイメージシステム (富士フィルム) を使用した2次元TLCおよびHPLCからの溶出液をフラクションコレクター (Pharmacia FRAC-100) で分画し、LSC法で定量した。

### 3) 半減期の算出

経時的な [ $^{14}\text{C}$ ] 標識エトキサゾールの減衰を疑似一次反応と見なし、次式より算出した。

$$\ln C = -kt + \ln C_0$$

ただし、 $k$  = 速度定数、 $C$  =  $t$ 時間後の [ $^{14}\text{C}$ ] 標識エトキサゾールの濃度、 $C_0$  = [ $^{14}\text{C}$ ] 標識エトキサゾールの初期濃度、 $t$  = 時間

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

#### 4) 量子収率の測定

##### (1) p-ニトロアセトフェノン/ピリジン (PNAP/pyr) アクチノメーター溶液

1.0 mLのPNAPアセトニトリル溶液 (4.00 mg/mL) を0.05 Mのピリジン滅菌水溶液 (4.00 mg/mL) で100 mLに希釈してアクチノメーター溶液を調整した (PNAP濃度は40.03 mg/L)。

##### (2) 試験環境

試験容器, 光源, 光照射および温度は, 水中光分解運命試験と同じ設定にした。

##### (3) 試料採取と分析

光照射後71.56時間, 143.53時間, 288.46時間, 361.61時間, 431.94時間にアクチノメーター溶液の0.5 mLを無菌的に採取し, このうちの0.1 mLをHPLCで分析して溶液中のPNAPを定量した。

## 結 果

### 1. 予備試験

結果を表1および表2に示す。

#### 1) 回収率

表1に示すように, 光照射を行った試験溶液からの放射能の回収率は5日間照射の河川水試料 (94.6%) を除いて全体的に低かった (77.4~89.7%)。洗浄液からの放射能の回収率が最大で5.5%で, 容器壁への吸着が少ないことを示した。揮発性成分は試験期間中では検出されなかった。

表1 オキサゾール標識体を用いた [<sup>14</sup>C] 放射能の回収率 (%)

照射時間 (日)	pH9 緩衝液				河川水			
	試験液	洗浄液	トラップ液	合計	試験液	洗浄液	トラップ液	合計
3	86.1	-	nd	86.1	86.9	-	nd	86.9
5	81.8	5.5	nd	87.3	90.4	4.2	nd	94.6
7	73.7	3.7	nd	77.4	86.7	3.0	nd	89.7
7(非照射区)	135.1	-	nd	135.1	91.3	-	nd	91.3

-: 試料なし, nd: 未検出

#### 2) 検体および溶解補助剤の濃度検討

表2に示すように, アセトニトリルの添加量が4%の場合では回収率は約70%と低かったが, 10%ではいずれの濃度でも90%以上の回収率が得られた。

表 2 アセトニトリルにおける回収率 (%)

オキサゾール標識体	緩衝液		河川水	
4% アセトニトリル				
0.005 mg/L	72.6	71.0	-	-
10%アセトニトリル				
0.005 mg/L	95.1	-	91.7	-
0.010 mg/L	94.9	93.2	91.8	-
	91.1	-	-	-

-: なし

以上より、本試験は [<sup>14</sup>C] 標識エトキサゾールの濃度を5 µg/L、アセトニトリルの濃度を10%とした。なお、アセトニトリルを10%添加した時のpHの値は、pH9緩衝液では9.07から9.33に、河川水では8.32から8.46に変化した。

## 2. 本試験

結果を表 3～表6および図 1に示す。

### 1) 回収率

表 3に示すように、河川水およびpH9緩衝液を用いた [<sup>14</sup>C] 標識エトキサゾールの水中光分解運命試験における放射能の回収率はいずれの標識体でも95%以上であった。

表 3 河川水およびpH9緩衝液における [<sup>14</sup>C] 放射能の回収率 (%)

照射時間 (時間)	オキサゾール標識体		フェニル標識体	
	河川水	緩衝液	河川水	緩衝液
0 / 0	97.0	95.2	96.5	98.9
54.00 / 71.56	96.8	97.6	95.9	95.5
108.03 / 143.53	97.5	95.7	97.2	96.8
162.07 / 216.24	99.0	96.0	99.0	96.9
216.04 / 288.46	96.5	97.6	96.8	95.7
269.66 / 361.61	97.7	97.0	100.5	95.4

数値は0時点を除き2連の平均値 (申請者計算)

### 2) 河川水における水中光分解

照射区における河川水中の [<sup>14</sup>C] 標識エトキサゾールの光分解生成物を表 4に示した。最終分析時点では親化合物は45～61%が残存し、6種類以上の分解物が検出された。オキサゾール標識体区ではR11が主要な分解物で経時的に増加し、約1ヵ月後の最終分析時点では23.9%に達した。他に施用量の10%を超える分解物としてR3が最大で11.1%生成した。一方、フェニル標識体区ではR12およびR15が施用量の10%を超え、最大で10.7%および12.2%となった。

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

非照射区では表 5に示すように、269時間後で88～93%の親化合物が残存し、2標識体とも暗条件下では安定であることが明らかになった。

表 4 河川水における  $[^{14}\text{C}]$  標識エトキサゾールの残存率および分解物（照射区）

分解物等	照射日数（北緯35°における計算値）									
	オキサゾール標識体					フェニル標識体				
	5.39	12.51	19.71	25.58	29.64	6.09	11.25	17.13	22.59	31.56
エトキサゾール	86.5	74.3	75.7	51.5	45.3	85.1	79.1	80.1	68.6	60.9
DFB										
R12										
R11										
R4/R15 <sup>a</sup>										
R3										
その他 <sup>b</sup>										

数値は2連の平均値でHPLCによる定量値（施用量に対する割合（%））。nd:未検出。

<sup>a</sup>: オキサゾール標識体ではR4として検出。<sup>b</sup>: 報告書の記載を基に申請者が算出。その他成分で施用量の%を超えるものはなかった。

表 5 河川水における  $[^{14}\text{C}]$  標識エトキサゾールの残存率（非照射区）

分解物等	培養時間 <sup>a</sup>											
	オキサゾール標識体						フェニル標識体					
	0	54	108	162	216	269	0	54	108	162	216	269
エトキサゾール	96.8	90.2	93.9	96.7	90.5	87.8	87.4	93.7	92.5	97.7	94.7	92.8
その他												

数値は2連の平均値でHPLCによる定量値（施用量に対する割合（%））。<sup>a</sup>: 小数点以下を申請者が四捨五入して記載した。

### 3) 緩衝液における水中光分解

表 6に示すとおり、pH9緩衝液中の  $[^{14}\text{C}]$  標識エトキサゾールの水中光分解は河川水中と同様であったが、親化合物の分解割合および分解物の生成量は河川水中よりも多かった。照射区では親化合物は約1ヵ月後の最終分析時点で%が残存したのみであった。オキサゾール標識体区ではR11が最も多く生成し、最終分析時点では%となった。他に施用量の%を超える分解物はなかった。一方、フェニル標識体区では、最終分析時点でR12が%、R15が%およびR3が%生成した。

非照射区の結果を表 7に示した。いずれの標識体も269時間後に89%の親化合物が残存し、pH9緩衝液中の暗条件下では安定であった。

表 6 pH9緩衝液における [<sup>14</sup>C] 標識エトキサゾールの残存率および分解物（照射区）

分解物等	照射日数（北緯35°における計算値）									
	オキサゾール標識体					フェニル標識体				
	8.58	17.57	24.28	38.24	45.71	8.08	16.77	25.09	32.80	46.99
エトキサゾール	83.9	38.6	17.0	15.2	17.1	75.1	54.2	55.4	24.9	14.9
DFB										
R12										
R11										
R4/R15 <sup>a</sup>										
R3										
その他 <sup>b</sup>										

数値は2連の平均値でHPLCによる定量値（施用量に対する割合（%））。nd:未検出。

<sup>a</sup>: オキサゾール標識体ではR4として検出。<sup>b</sup>: 報告書の記載を基に申請者が算出。その他成分で施用量の %を超えるものはなかった。

表 7 pH9緩衝液における [<sup>14</sup>C] 標識エトキサゾールの残存率（非照射区）

分解物等	培養時間 <sup>a</sup>											
	オキサゾール標識体						フェニル標識体					
	0	72	144	216	288	362	0	72	144	216	288	362
エトキサゾール	94.0	92.0	90.4	89.9	94.7	88.5	94.6	95.3	91.0	90.8	86.5	89.3
その他 <sup>b</sup>												

数値は2連の平均値でHPLCによる定量値（施用量に対する割合（%））。<sup>a</sup>: 小数点以下を申請者が四捨五入して記載した。

#### 4) エトキサゾールの光分解経路

水中での主要な光分解物としてDFB, R3, R11, R12およびR15が同定され、これを基にしたエトキサゾールの水中光分解経路を図 1に示した。

#### 5) 半減期

河川水およびpH9緩衝液中での [<sup>14</sup>C] 標識エトキサゾールの半減期を表 8に示した。北緯35°の夏の太陽光下換算した半減期は、河川水では28.6～59.7日、pH9緩衝液中では15.9～17.4日であった。水中のエトキサゾールは光照射により、河川水中では6.5～14倍（申請者計算）、pH9緩衝液中では25～57倍（申請者計算）分解が促進された。

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

水中におけるエトキサゾールは主に直接的な光分解で分解されたと考えられた。

表 8  $[^{14}\text{C}]$  標識エトキサゾールの水中光分解による半減期

試験区	オキサゾール標識体				フェニル標識体			
	照射区		非照射区		照射区		非照射区	
試料	河川水	緩衝液	河川水	緩衝液	河川水	緩衝液	河川水	緩衝液
実測半減期 (時間)	247.5	121.6	3465	6930	533.1	138.6	3465	3465
太陽光換算半減期 (日) <sup>a</sup>	28.6	15.9	-	-	59.7	17.4	-	-

<sup>a</sup>: 北緯35°における換算値。-: なし

#### 6) エトキサゾールの量子収率

エトキサゾールの量子収率 ( $\phi^{\circ}$ ) は0.026であり、これより求めた北緯40°、東経140°および水深30 cmにおける半減期は5.56日であった。この値は紫外線吸収スペクトラムから推計される値よりも低く、一重項酸素と反応する間接的な光反応が示唆された。

#### まとめ

水中におけるエトキサゾールは直接的な光分解により速やかに分解され、北緯35°における太陽光換算の半減期が河川水では28.6~59.7日、pH9緩衝液中では15.9~17.4日であった。10%を超える主要な分解物としてDFB, R11, R12, R15が同定された。



本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

図 1 エトキサゾールの水中光分解経路

(資料 No. M-8)

(2) - 2 エトキサゾールを用いた水中光分解運命試験

試験機関：

報告書作成年：

実施理由：先に実施（報告書作成は1997年）した [<sup>14</sup>C] 標識エトキサゾールを用いた水中光分解運命試験（資料 No. M-8参）において、河川水中における供試標識化合物の太陽光換算半減期が2種標識体で2倍のバラツキ(28.6日と59.7日)があり、また、試験容器としてホウケイ酸塩ガラスを用いた試験であったことから、日本の河川水と石英ガラスを用いて試験を行った。

供試化合物：次表の化合物を使用した。

化学名	5- <i>tert</i> -butyl-2-[2-(2,6-difluorophenyl)-4,5-dihydro-1,3-oxazol-4-yl]phenetole
化学構造式	
化学的純度	

供試水

- (1) 高純度水から調製し、0.2 μmポアサイズのフィルターを通してろ過滅菌したpH7.0のリン酸緩衝液
- (2) 0.2 μmポアサイズのフィルターを通してろ過滅菌した信濃川の河川水 (pH7.1)

光源および光強度

290 nm以下と800 nm以上の光をカットした6.5 kWのキセノンショートアーク光  
入射光強度：19.1 W/m<sup>2</sup> (290~400 nm) , 145 W/m<sup>2</sup> (290~800 nm)

試験方法および分析方法

1) 試験方法

- (1) 溶解補助剤：最終濃度10%のアセトニトリル
- (2) 試験濃度：0.005 mg/L
- (3) 試験容器：照射区は石英ガラス製、暗所対照区は褐色パイレックスガラス製の螺旋蓋付き100 mL容の瓶
- (4) 試験温度：28±2°C（試験期間中の水中温度）

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

- (5) 光照射 : 連続照射
- (6) 試料採取時点 :  
照射区 : 被験物質添加直後, 照射開始7, 14, 21, 28, 41日後の6時点  
暗所対照区 : 7, 14, 21, 28, 41日後の5時点
- (7) 試料環境 : 試験はすべて無菌的に行い, 試験期間中試験系の滅菌状態は維持された(生菌数を検定して確認)。

## 2) 分析方法

### (1) 抽出および分析

試験溶液をヘキサンで抽出し, 試験溶液中のエトキサゾール濃度をNPD-GCで定量した。  
GCカラム : Rtx-1 (内径0.53 mm, 長さ15 m, 膜厚1.0 μm)

### (2) 半減期算定

#### ①キセノン光連続照射下での半減期

エトキサゾールの分解を擬似一次反応と見なし, 次式より半減期を算出した。

$$\ln(C_t/C_0) = -kt$$

k : 速度定数, t : 時間, C<sub>0</sub> : 未変化体の初濃度,

C<sub>t</sub> : t時間後の未変化体の濃度

$$\text{半減期} = 0.693/k$$

#### ②自然太陽光換算半減期

自然太陽光換算半減期 (HLs) は, 自然太陽光下での1日当たりの平均積算放射照度 (300~400 nm) (A), ならびに試験条件におけるキセノン光放射照度 (Ix) およびキセノン光下での半減期 (HLx) を基に次式より算出した。計算に当たりキセノン光の光強度は, 290~400 nmでの観測値を基にした。

$$HLs = HLx \times 1.91 \times 24/A$$

## 結 果

エトキサゾールは直接的光分解を受けるもののその速度は遅い。河川水中の光増感剤でエトキサゾールの光分解は促進された。

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

表 1 エトキサゾールの残存率 (%) と半減期

照射時間／半減期	緩衝液		河川水	
	照射区	暗所対照区	照射区	暗所対照区
0 日	100		100	
7 日後	87.3	101	87.4	98.2
14 日後	84.7	100	81.5	98.6
21 日後	80.4	98.0	77.2	98.4
28 日後	77.1	98.2	71.1	96.5
41 日後	72.2	99.2	64.0	97.6
実測半減期	94.5日	—	66.3日	—
太陽光換算半減期*	169 日	—	119 日	—

\* : 1994年5月の東京地方太陽光観測値に基づく計算値。

申請者注：先に実施した試験（資料 No. M-8参）における太陽光換算半減期は河川水中が28.6～59.7日，緩衝液中が15.9～17.4日であり，本試験での太陽光換算半減期は河川水中が119日，緩衝液中が169日で，それぞれ2.0～4.1倍および9.7～10.6倍の開きがあった。これは，両試験における光強度の差（261 W/m<sup>2</sup>（290～800 nm）と145 W/m<sup>2</sup>（290～800 nm））および試験容器の差（ホウケイ酸塩ガラスと石英ガラス）と考えられた。

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

6. ガラス表面における光分解運命に関する試験

(資料 No. M-9)

[<sup>14</sup>C]標識エトキサゾールを用いたガラス表面光分解性試験

試験期間：

[GLP対応]

報告書作成年：

供試標識化合物：次表の2種類の標識化合物を使用した。

化学名および名称	5- <i>tert</i> -butyl-2-[2-(2,6-difluorophenyl)-4,5-dihydro-1,3-oxazol-4-yl]phenetole	
化学構造式および 標識位置 (*で表示)		
比放射活性		
放射化学的純度		
略 称	フェニル標識体	オキサゾール標識体

標識位置設定理由：

試験方法および分析方法

1) 試験方法

(1) 光源および光強度

- ① 10月の自然太陽光：10.0 W/m<sup>2</sup> (290~400 nm)
- ② 人工光：3.4 W/m<sup>2</sup> (290~400 nm)

人工光は作物栽培室の光源であり、エトキサゾールのなすにおける代謝運命試験と同じものを使用。

(2) 試験系および処理量

ガラス皿 (33.2 cm<sup>2</sup>) に各供試化合物のメタノール溶液 (100 µg/mL) 1 mLを添加し窒素気流下で溶媒を留去して試験に供した。処理量は3.1~3.5 µg/cm<sup>2</sup>であった。

(3) 光照射および試料採取

試料を自然太陽光下に48時間置いたのち、以降は24時間当たり15時間が明期、9時間が暗期の作物栽培室内に移し替え、間欠的に人工光に暴露した。暗所対照区試料は遮光し、同一条件の環境に置いた。

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

次の各時点で各供試化合物あたり各2点の照射区試料と暗所対照区試料を採取した。

光源	採取時点	照射区		暗所対照区	
		フェニル標識体	オキサール標識体	フェニル標識体	オキサール標識体
自然 太陽 光	0 時間	2	2	-	-
	1 時間	2	2	-	-
	3 時間	2	2	-	-
	7 時間	2	2	2	2
	10 時間	2	2	2	2
	24 時間	2	2	2	2
	48 時間	2	2	2	2
	人 工 光	7 日	-	-	-
21 日		-	-	-	2
24 日		2	2	-	-
42 日		2	2	-	2

表中数値は分析点数。-：未分析または未採取。

#### (4) 試験温度

0～48時間まで : 外気温 0～10℃

48時間以降42日まで：明期（15時間/日）は23～25℃，暗期（9時間/日）は17～18℃。  
ただし，週末は明期，暗期とも20℃。

#### 2) 分析方法

##### (1) 抽出

分析試料はガラス皿をHPLC級のメタノール（10～50 mL）で洗浄および超音波処理して抽出した。一部の試料は更にメタノール：水（1:1，約50 mL）で洗浄して抽出した。

##### (2) 放射活性測定

抽出液など液体試料は液体シンチレーション計測(LSC)して放射活性を定量した。

##### (3) 分解物分析

###### ① 検出と定量

各抽出液の濃縮液をTLCと逆相系HPLCで分析し，主にHPLCで定量した。HPLCの場合は分解物等を放射能フロー検出器で検出し，溶出液を分画してLSC法で定量した。TLCの場合はラジオルミノグラフィ法またはTLCリニアスキャナーで分解物等を検出および定量した。

###### ② 同定

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

## 結 果

結果の概要を表 1-1～表 2-2 にまとめた。

2種標識体のいずれにおいても48時間までの自然太陽光照射期間中は処理放射活性の有意な消失は認められなかった。しかし、その後の人工光照射期間中には、42日後に95%が回収された暗所対照区とは対照的に有意な放射活性の消失が認められ、両標識体とも42日後までに処理量の約60%が消失した。

ガラス皿上のエトキサゾールは暗所対照区では48時間内はほとんど減少せず、42日後においても処理量の92%（オキサゾール標識体）が未変化体として回収されたのに対し、照射区では48時間後で75～78%、42日後で1.3～1.6%にまで低下した。

表 1-1 フェニル標識体照射区における分解物等の推移

分解物等	自然太陽光							人工光	
	0h	1h	3h	7h	10h	24h	48h	24d	42d
未変化体	89.9	91.8	90.1	83.7	85.7	85.3	77.5	3.0	1.6
R3 <sup>a</sup>									
R7 <sup>b</sup>									
R13									
その他									
回収率									

表中数値は処理量に対する割合(%)。nd:未検出。<sup>a</sup>

<sup>b</sup>:TLCによる定量値。その他:その他のHPLC画分(計10画分,最大で %:42日後)と分析ロスなどHPLC分析で未回収の放射活性。

表 1-2 フェニル標識体暗所対照区における分解物等の推移

分解物等	自然太陽光							人工光	
	0h	1h	3h	7h	10h	24h	48h	24d	42d
未変化体									
R3 <sup>a</sup>									
R7 <sup>b</sup>									
R13									
その他									
回収率									

表中数値は処理量に対する割合(%)。nd:未検出。-:未分析(未実施)

<sup>a</sup>:  
<sup>b</sup>:TLCによる定量値。その他:その他のHPLC画分(計10画分,最大で %:7時間後)と分析ロスなどHPLC分析で未回収の放射活性。

ガラス皿から回収された分解率で処理量の %以上を占めた主要な分解生成物は1種

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

類のみであり、R3と同定された。R3は24日後に処理量の %を占めて最大となったのち、低下した。

他に、微量物質としてオキサゾール標識体に固有な開裂体であるR11がほぼ全期間に渡って処理量の %の割合で検出された。この検出量は暗所対照区よりも有意に高かった。R13は照射区では0時点でのみ微量（処理量の %）が検出されたが、その他の時点では検出されなかった。一方、暗所対照区では、R13は処理量の %（最大：オキサゾール標識体48時間）検出された。R7は暗所対照区の48時間、21日後および42日後で検出され、照射区では全期間にわたって検出されなかった。

表 2-1 オキサゾール標識体照射区における分解物等の推移

分解物等	自然太陽光							人工光	
	0h	1h	3h	7h	10h	24h	48h	24d	42d
未変化体	92.7	92.3	91.3	83.7	81.9	81.4	74.9	3.8	1.3
R3 <sup>a</sup>									
R7 <sup>b</sup>									
R13									
R11 <sup>b</sup>									
その他									
回収率									

表中数値は処理量に対する割合(%)。nd:未検出。<sup>a</sup>:

<sup>b</sup>:TLCによる定量値。その他:その他のHPLC画分(計10画分、最大で %:42日後)と分析ロスなどHPLC分析で未回収の放射性。

表 2-2 オキサゾール標識体暗所対照区における分解物等の推移

分解物等	自然太陽光							人工光		
	0h	1h	3h	7h	10h	24h	48h	7d	21d	42d
未変化体	-	-	-	94.0	94.1	93.5	93.5	93.3	91.4	92.2
R3 <sup>a</sup>										
R7 <sup>b</sup>										
R13										
R11 <sup>c</sup>										
その他										
回収率										

表中数値は処理量に対する割合(%)。nd:未検出。<sup>a</sup>:

<sup>b</sup>:HPLCによる定量値。<sup>c</sup>:HPLCでR11が溶出される画分の放射性をすべてR11とした場合の値。その他:その他のHPLC画分(計10画分、最大で %:7日後)と分析ロスなどHPLC分析で未回収の放射性。-:未実施。

(-):その他成分が計算でマイナスの場合。



本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

#### まとめおよび分解経路

ガラス表面上の固体状態のエトキサゾールは、10月の自然太陽光下では2日間で処理量の22～25%が、その後の40日間の人工光間欠照射条件下では更に74～76%がそれぞれ分解された。光が関与した分解生成物の中には揮発性の未知物質（42日間で処理量の約60%）も含まれていた。照射区の非揮発性の主要な分解生成物はR3であり、他にR11が微量検出された。R13は暗所対照区と0時点での照射区でのみ検出された。

エトキサゾールは

図 1の経路で分解されると考えられた。

図 1 エトキサゾールのガラス表面における推定光分解経路

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

## 7. 生物濃縮性

(資料 No. M-10 (水-11))

### (1) エトキサゾール原体のニジマスにおける生物濃縮性試験

試験機関：

報告書作成年：

検 体：エトキサゾール原体（純度 %）

供試生物：ニジマス *Oncorhynchus mykiss*, 1 群 30 匹, 性別記載なし

体長：8.6 ± 0.81 cm (平均±標準偏差) (最小値および最大値記載なし)

体重：9.9 ± 3.0 g (平均±標準偏差) (最小値および最大値記載なし)

#### 試験方法：

暴露条件：流水式

試験期間：取込段階 21 日, 排泄段階 10 日間

試験濃度区：平均実測濃度 10 ppb

希釈水：活性炭カラムろ過により脱塩素した水道水

試験液調製：設定濃度が 94 ppm になるように DMF に溶かし原液とした。これを希釈水と混合して設定暴露濃度の 10 ppb とした。原液は自動注入器で 160 mL/日, 希釈水はポンプで 1500 L/日の流速で注いだ。この量は 15 回/日で換水するのに十分であった。

環境条件：16 時間明期・8 時間暗期, 試験水温 14.6~15.3°C

観察および測定：取込および排泄段階を通じて, 魚の行動と死亡数を毎日観察した。サンプリング日程・数を以下に示す。

	取込日数								排泄日数			
	0	1	3	7	10	14	17	21	1	3	7	10
魚	-	-	2	2	-	2	2	2	2	2	2	3
水	2	2	2	2	2	2	2	2	-	-	-	-

全魚体中の検体濃度：上記の要領でランダムに 2 尾あるいは 3 尾 (10 日目) の魚を取り出し, ジクロロメタンで抽出し GC 法で分析した。

魚体中の脂質含量：ジクロロメタンでの抽出物の重量を測定し魚体中の脂肪含量を測定した。

試験液中の検体濃度：取込段階では, 上記の要領で採取し, GC 法で分析した。

試験結果：以下に示す。

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

魚体中の検体濃度 (ppm)

試験区	取込日数								排泄日数			
	0	1	3	7	10	14	17	21	1	3	7	10
10 ppb	/	/	6.6	13	/	3.5	1.5	4.2	5.3	3.3	1.2	0.67
	/	/	3.1	9.0	/	6.7	8.1	23	7.1	8.6	ND	ND
	/	/	/	/	/	/	/	/	/	/	/	ND
平均	/	/	4.9	11	/	5.1	4.8	14	6.2	6.0	0.6	0.2

平均値は有効数値 2 桁で申請者が計算。

魚体中の検体濃度は、取込期間 21 日目で 14 ppm となった。排泄期間 10 日目には 0.2 ppm となった。

(1) 試験水中の検体濃度 (ppb)

試験区	取込日数								排泄日数			
	0	1	3	7	10	14	17	21	1	3	7	10
10 ppb	10	15	8.4	7.6	9.1	10	8.7	8.5	/	/	/	/
	9.4	16	8.8	8.5	9.9	9.9	9.3	11	/	/	/	/
平均	9.8	16	8.6	8.1	9.5	10	9.0	9.5	/	/	/	/

試験水中の検体濃度は、21 日目で 9.5 ppb、0~21 日の平均では 10 ppb であった。

(2) 濃縮係数

① BCF<sub>ss</sub>

試験区 (ppb)	魚体中濃度 (Cf)	水中濃度 (Cw)	濃縮係数 (BCF <sub>ss</sub> )
10	8.6 ppm*	10 ppb	860*

\* : 7~21 日の平均を申請者が算出した。

② BCF<sub>k</sub>

試験区 (ppb)	取込速度定数 (k1)	排泄速度定数 (k2)	濃縮係数 (BCF <sub>k</sub> )
10	240	0.26	920

生物学的半減期は 2.6 日であった。

(3) 観察

試験期間中、異常な行動は観察されなかった。3 尾の死亡例が観察された (暴露 4, 5, 7 日目)。

(4) 脂質含量

分析した魚の脂肪含量は体重の 0.5~4.8% であった。

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

(資料 No. M-11 (水-12))

(2) エトキサゾール原体のブルーギルにおける生物濃縮性試験

試験機関：

報告書作成年：

検 体：エトキサゾール原体（純度 %）

供試生物：ブルーギル *Lepomis macrochilus*, 1群 90匹, 性別記載なし

体長（平均±標準偏差）4.6 ± 0.35 cm（平均値記載なし）

体重（平均±標準偏差）2.9 ± 0.55 g（平均値記載なし）

試験方法：

暴露条件：流水式

試験期間：取込段階 11日, 排泄段階 10日間

試験濃度区：設定濃度 10 ppb（平均実測濃度 8.5 ppb）

希釈水：活性炭カラムろ過により脱塩素した水道水

試験液調製：設定濃度が 100 ppm になるように DMF に溶かし原液とした。これを希釈水と混合して設定暴露濃度の 10 ppb とした。暴露期間中は、毎日、保存液の一定量を注入器に充填した。

環境条件：16 時間明期・8 時間暗期, 試験水温 24.8~25.0°C

観察および測定：取込および排泄段階を通じて、魚の行動と死亡数を毎日観察した。サンプリング日程・数を以下に示す。

	取込日数						排泄日数			
	0	4	5	6	8	11	1	2	4	10
魚	-	6	-	6	6	6	6	6	6	6
水	2	2	2	2	2	2	-	-	-	-

全魚体中の検体濃度：上記の要領でランダムに 6 尾の魚を取り出し、ジクロロメタンで抽出し GC 法で分析した。

魚体中の脂質含量：ジクロロメタンでの抽出物の重量を測定し魚体中の脂肪含量を測定した。

試験液中の検体濃度：取込段階では、上記の要領で採取し、GC 法で分析した。

試験結果：以下に示す。

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

(1) 魚体中の検体濃度 (ppm)

試験区	取込日数						排泄日数			
	0	4	5	6	8	11	1	2	4	10
10 ppb	/	6.8	/	6.0	11	13	6.0	6.5	4.5	0.43
	/	7.9	/	6.0	7.3	11	5.6	5.0	4.4	0.74
平均	/	7.4	/	6.0	9.2	12	5.8	5.8	4.5	0.59

平均値は有効数値 2 桁で申請者が計算。

魚体中の検体濃度は、取込 11 日目に 12 ppm となった。排泄期間 10 日目には検体濃度は 0.59 ppm となった。

(2) 試験水中の検体濃度 (ppb)

試験区	取込日数						排泄日数			
	0	4	5	6	8	11	1	2	4	10
10 ppb	13	7.1	7.3	6.5	6.8	6.5	/	/	/	/
	21	7.0	6.6	6.4	7.8	6.7	/	/	/	/
平均	17	7.1	7.0	6.5	7.3	6.6	/	/	/	/

試験水中の検体濃度は、取込期間では 6.6~17 ppb であり、平均は 8.5 ppb となった。

(3) 濃縮係数

① BCF<sub>ss</sub>

試験区 (ppb)	魚体中濃度 (C <sub>f</sub> )	水中濃度 (C <sub>w</sub> )	濃縮係数 (BCF <sub>ss</sub> )
10	10.6 ppm*	8.7 ppb	1200*

\* : 8~11 日の平均を申請者が算出した。

② BCF<sub>k</sub>

試験区 (ppb)	取込速度定数 (k <sub>1</sub> )	排泄速度定数 (k <sub>2</sub> )	濃縮係数 (BCF <sub>k</sub> )
10	320	0.26	1200

生物学的半減期は 2.5 日であった。

(4) 観察

試験期間中、異常な行動および死亡例は観察されなかった (暴露 4, 5, 7 日目)。

(5) 脂質含量

分析した魚の脂肪含量は体重の 2.5~4.8% であった。

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

## 8. その他

(資料 No. M-12)

(1) [<sup>14</sup>C]標識エトキサゾールを用いたワタにおける代謝試験<sup>註1</sup>

試験機関：

[GLP 対応]

報告書作成年：

供試標識化合物：次表の2種類の標識化合物を使用した。

化学名および名称	5- <i>tert</i> -butyl-2-[2-(2,6-difluorophenyl)-4,5-dihydro-1,3-oxazol-4-yl]phenetole	
化学構造式および標識位置 (*で表示)		
比放射活性		
放射化学的純度		
略 称	フェニル標識体	ジフルオロフェニル標識体

\*：申請者註：報告書中では YI-5301 の代わりに S-1283 と記載されている。

標識位置設定理由：

### 供試作物

ワタ (品種：Maxxa) ( )

### 栽培環境

米国カリフォルニア州の試験地において、網で覆ったスクリーンハウス内に土壌を詰め木枠 (奥行き 4 feet × 幅 3 feet × 深さ 3 feet, プロットと称す) を設置してワタ苗を栽培した。標識化合物施用前にはプロットあたりの苗の数を 12~15 本とした。

試験時期：

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

#### 施用液および施用方法

各標識化合物の 36%フロアブル(申請者註: 報告書中では「SC」と記載)製剤をそれぞれ調製し, その希釈液を各プロットあたり 0.09 lb a. i./エーカー(申請者註: 100 g a. i./ha)の割合で手動式スプレーヤーを用いて, 次に示すようなワタの生育時期に 2 回茎葉散布を行った。この散布量は慣行施用量の約 2 倍に相当する。

1 回目散布 ( ) :

ワタ苗 1 本あたり 3~5 個のワタの実がちょうど弾け始める時(収穫前 42 日に相当)

2 回目散布(1997 年 10 月 7 日) :

ワタ苗 1 本あたり 1~4 個の弾けたワタの実が付いている時(収穫前 21 日に相当)

散布後, ワタ苗には各プロットにドリップ式灌漑システムを使用して灌水した。

尚, 各施用液の放射化学的純度は使用前後ともに, フェニル標識体では 97.8%以上, ジフルオロフェニル標識体では 96.3%以上であった。

#### 試料採取

2 回目散布後 21 日目(1997 年 10 月 28 日)に, 実綿とジントラッシュ(乾燥した苞, 葉, 茎などから成る綿繰り後のくず)を採取した。実綿はさらに電気式ミニ綿繰り器により, 短い地毛がついた状態の種子(種子)と長い綿毛(リント)に分けた。全てのサンプルは分析時まで冷凍保存した。種子およびジントラッシュは一部を燃焼法により液体シンチレーションカウンター(LSC)で放射エネルギーを分析した。

#### 分析方法

##### (1) 抽出と分画

種子(50 g)は, 図 1 に示すように, メタノールで表面洗浄したのち, 乳鉢と乳棒で粉碎し, ヘキサン/アセトニトリル(1:1, v/v)で 3 回, 水で 1 回, メタノールで 1 回抽出し(水溶性抽出液として混合, 水/メタノール(約 1:1, v/v)), 遠心分離により抽出液と残渣に分離した。

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

図1 種子の分析フロー



本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

ジントラッシュ (50 g) は、図 2 に示すように、水で 1 回、メタノールで 1 回抽出し (水溶性抽出液として混合、水/メタノール (約 1:1, v/v))。水/メタノール (水溶性) 抽出液は 0.25 M 塩酸で加水分解を行い (申請者註: 抱合代謝物のアグリコンを遊離させるために実施)、酢酸エチルで抽出後分析した。また、ジントラッシュの抽出残渣は、図 3 に示すように、セルラーゼ処理 (セルロースを可溶化)、1,4-ジオキサン/水 (9:1, v/v) による加熱処理 (リグニン可溶化)、酸加水分解 (タンパク質を可溶化)、塩基加水分解 (ヘミセルロースを可溶化) の連続処理を行うことにより、植物構成各成分に分画した。

図 2 ジントラッシュの分析フロー

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

図3 ジントラッシュ抽出残渣の分析フロー

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

(2) 放射活性測定

表面洗浄液、抽出液など液体試料は直接、液体シンチレーション計測 (LSC) した。抽出残渣はその一部を自動燃焼装置で酸化燃焼処理したのち LSC 法で放射活性を定量した。

(3) 代謝物分析

① 代謝物等の検出と定量

表面洗浄液や抽出液は濃縮後、逆相系 HPLC/LSC や順相系 TLC で分析した。HPLC の場合は代謝物等を放射能フロー検出器で検出し、溶出液を分画して LSC 法で定量した。TLC の場合は PhosphoImager (Molecular Dynamics 社製) で代謝物等を検出し定量した。

② 代謝物同定

結 果

結果の概要を表 1～表 4 と図 4 にまとめた。

(1) 全放射能の挙動と分布

ワタ種子に存在する放射活性の総残留量 (TRR) は 0.02 (フェニル標識体) および 0.03 mg eq./kg (ジフルオロフェニル標識体) であった。TRR の 77～78% はメタノール (表面洗浄) および有機溶媒などにより抽出され、抽出残渣に残存する放射能は TRR の 22～23% であった。抽出残渣中の放射能が 0.01 mg eq./kg 未満であったため、さらなる分析は行わなかった。

一方、ジントラッシュ中の放射活性の総残留量は 4.47 (フェニル標識体) および 5.93 mg eq./kg (ジフルオロフェニル標識体) であった。TRR の 85～89% は有機溶媒などにより抽出され、抽出残渣に残存する放射能は TRR の 12～15% (0.67～0.68 mg eq./kg) であった。

表 1 ワタ種子およびジントラッシュ中の放射能分布

部 位 等	フェニル標識体		ジフルオロフェニル標識体	
	%TRR	濃度 (mg eq./kg)	%TRR	濃度 (mg eq./kg)
種子	100	0.020	100	0.031
抽出液合計	78.2	0.016	76.6	0.024
メノール(表面洗浄)	33.3	0.007	17.5	0.005
ヘキサン	9.4	0.002	12.1	0.004
アセトニトリル	19.4	0.004	29.1	0.009
水溶性	16.1	0.003	17.8	0.006
抽出残渣 (%)	21.8	0.004	23.4	0.007
ジントラッシュ	100	4.470	100	5.932
抽出液合計	85.1	3.805	88.6	5.250
ヘキサン	9.3	0.415	8.2	0.486
アセトニトリル	64.4	2.881	68.2	4.044
水溶性	11.4	0.509	12.2	0.720
抽出残渣 (%)	14.9	0.665	11.5	0.683

注：数値は丸めているため、合計値とは必ずしも一致しないことがある。

(2) 代謝物

ワタ種子およびジントラッシュの抽出液から、未変化体のほか、R3, R4, R7, R13, R14 (以上すべて両標識体に共通), R8, R12, R15 (フェニル標識体固有), DFB, R11 (ジフルオロフェニル標識体固有) が同定された。

① 種子

種子において、両標識体で %TRR を占める主要残留物は、未変化体 (フェニル標識体) および DFB (ジフルオロフェニル標識体) であったが、残留濃度はともに

未満であった。他に代謝物として、R3, R11, R14 および R15 が 検出された。また、TLC 分析において、未同定スポット、原点部分にとどまる極性成分やスポットが明確でない成分も認められた。

表 2 ワタ種子中の代謝物分布

代謝物等	フェニル標識体		ジフルオロフェニル標識体	
	%TRR	濃度 (mg eq./kg)	%TRR	濃度 (mg eq./kg)
TRR*	100	0.020	100	0.031
エトキサゾール	19.9	0.004	4.9	0.002
DFB				
R3				
R11				
R14/R15				
TLCの未同定スポット #1				
TLCの原点部分 (極性成分)				
TLCでスポットが明確でない成分				

\*: 溶媒抽出物および抽出残渣の放射活性の合計値を示す。

a) R14 の分析値

② ジントラッシュ

ジントラッシュの有機溶媒可溶性画分において、10%TRR を超える主要残留物は、未変化体 (            %TRR,            ) および R3 (            ,

           ) であった。他にフリー代謝物として、DFB, R4, R7, R11, R12, R13, R14 および R15 が検出されたが、いずれの代謝物も 4%TRR を超えることはなかった。水溶性画分からは、DFB, R3, R7, R8, R11, R12, R13, R14 および R15 が検出されたが、いずれも 4%TRR 未満であった。また、多数の未同定成分や極性成分も検出された。

ジントラッシュの抽出残渣をさらに分析した結果、セルラーゼ処理により 1.6~1.7%TRR, リグニン可溶化処理により 4.4~6.0%TRR, 2 M 塩酸加水分解により 1.4~1.6%TRR, 2 M NaOH 加水分解により 1.4~1.9%TRR の放射能が分離され、最終残渣に残存する放射能は 1%TRR 未満となった。このことから、エトキサゾールは代謝を受けたのち、最終的にはセルロース、リグニン、タンパク質やヘミセルロースなどの植物構成成分にまで取り込まれていると考えられた。なお、リグニン可溶化処理の酢酸エチル層からは、それぞれ %TRR 未満の未変化体や代謝物が認められた。

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

表 3 ジントラッシュ抽出液中の代謝物分布

代謝物等	フェニル標識体		ジフルオロフェニル標識体	
	%TRR	濃度 (mg eq./kg)	%TRR	濃度 (mg eq./kg)
有機溶媒可溶性画分*				
イトキサゾール	42.9	1.920	35.9	2.130
DFB				
R3				
R4				
R7				
R11				
R12				
R13				
R14				
R15				
HPLCの未同定ピーク				
TLCの未同定スポット#1				
TLCの原点部分(極性成分)				
TLCでスポットの明確でない成分				
水溶性画分**				
DFB				
R3				
R7				
R8				
R11				
R12				
R13				
R14				
R15				
HPLCの未同定ピーク				

注：数値は丸めているため、合計値とは必ずしも一致しないことがある。

\*：ヘキサノール抽出液ヘキサノール層、ヘキサノール抽出液アセトニトリル層およびアセトニトリル抽出液中の代謝物の合計。

\*\*：水溶性抽出液(酸性)酢酸エチル層、(塩基性)酢酸エチル層および水層中の代謝物の合計。

a) 13成分からなる(最大成分： %TRR, ppm)。 b) 15成分からなる(最大

成分： %TRR, ppm)。 c) 14成分からなる(最大成分： %TRR, ppm)。

d) 12成分からなる(最大成分： %TRR, ppm)。

表 4 ジントラッシュ抽出残渣中の代謝物分布

処 理	フェニル標識体		ジフルオロフェニル標識体	
	%TRR	濃度 (mg eq./kg)	%TRR	濃度 (mg eq./kg)
供試試料	14.9	0.665	11.5	0.683
セルラーゼ処理 酢酸エチル層 水層 (セルロース画分) (計)				
リグニン可溶化 酢酸エチル層	4.7	0.209	3.4	0.205
イキザゾール	0.9	0.038	0.4	0.023
DFB				
R3				
R4				
R7				
R11				
R13				
R15				
未同定成分 水層 (リグニン画分) (計)				
2 M 塩酸加水分解 (タンパク質画分)				
2 M NaOH加水分解 (ヘミセルロース画分)				
最終残渣				
回収放射能 合計 <sup>c)</sup>	12.0	0.535	9.9	0.587

注：数値は丸めているため、合計値とは必ずしも一致しないことがある。

a) 12成分からなる (TLCの原点部分およびスポットの明確でない成分含む)。

b) 12成分からなる (TLCの原点部分およびスポットの明確でない成分含む)。

c) 加水分解操作後の回収率はそれぞれ、86% (ジフルオロフェニル標識体)、80.5% (フェニル標識体) であった。





本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

#### まとめおよび代謝経路

スクリーンハウス内で栽培したワタ苗に、 $[^{14}\text{C}]$  標識エトキサゾールのフロアブル製剤を 100 g a. i. /ha で 2 回散布した後、21 日目に収穫し、種子とジントラッシュに分けて分析した。残留放射能濃度は、種子では 0.02~0.03 mg eq. /kg であり、ジントラッシュでは 4.47~5.93 mg eq. /kg であった。種子において 10%TRR を超える主要残留物は、未変化体および DFB であった（いずれも ）。エトキサゾールは主に表面洗浄液中に検出され、有機溶媒で抽出されなかったことから、種子中に残留するエトキサゾールは表面散布によるものであり、植物体内の浸透移行によるものではないと考えられる<sup>註2</sup>。ジントラッシュにおいて 10%TRR を超える主要残留物は未変化体（ ）および R3（ ）であった。

同定された代謝物の構造から推定したワタにおける代謝経路を図 4 に示す。

申請者註 1：本試験は米国でのワタ用途登録申請のために実施された。日本国内ではワタ用途の登録はない。

申請者註 2：報告書中には「有機溶媒で抽出されなかった」と記載されているが、実際にはフェニル標識体では有機溶媒で抽出が認められている。しかし、その検出量が微量（ ppm）であること、ジフルオロフェニル標識体では抽出されていないこと、他の作物でも浸透移行性が低いことが示されていることから、ワタについても、種子中に残留するエトキサゾールは主として表面散布によるものであると考えられる。

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

図 4 エトキサゾールのワタにおける推定代謝経路

\*:申請者註：報告書中では S-1283 と記載されている。

### <代謝分解のまとめ>

エトキサゾールの動物、植物、土壌、水中における代謝、分解、残留の要約は下記のとおりであり、代謝分解経路を485頁に、結果の概要を486～492頁に示した。

代謝分解試験にはエトキサゾールの を標識した  
(フェニル標識体)、  
を標識した (オキサゾール標識体) および  
を標識した (ジフルオロフェニル標識体、ワタ代謝試験  
においてオキサゾール標識体の代わりに使用)の3種類の標識化合物を用いた。

#### 動物代謝：(資料 No. M-1, 抄録 378～401 頁)

雌雄ラットに5 および 500 mg/kg の 2 用量で単回強制経口投与された2種の [<sup>14</sup>C] 標識エトキサゾールは標識位置、性、用量にかかわらず主として糞中に168時間内にほぼ定量的に排泄された。吸収率(48時間)は低用量では50～64%、高用量では16～19%であり、吸収分は標識位置、性および用量にかかわらず消化管(＋内容物)を除けば肝臓に最も高濃度で分布した。エトキサゾールはラット体内で *tert*-ブチル側鎖の酸化(水酸化)、ジヒドロオキサゾール環の酸化による環開裂と引き続き加水分解による分子開裂によって徹底的に代謝され、尿中には各標識体に固有な開裂体が主に排泄された。この活発な代謝と胆汁排泄による初回通過効果により血漿中 <sup>14</sup>C-濃度最高時点でも血漿および肝臓中の主要成分は代謝物であった。吸収率とこれに依存する事項(組織中濃度など)を除けばエトキサゾールの代謝挙動の用量差は比較的小さかった。主たる性差は尿と胆汁中の主要代謝物の順位、血漿および組織中濃度(雄>雌)に認められた。低用量の標識体の反復経口投与による排泄も急速で、蓄積性の低いことが証明された。

#### 植物代謝：(資料 No. M-2, M-3, M-4, M-12, 抄録 402～430, 468～480 頁)

申請に係る主要適用作物のうち、なす、りんご、ならびにみかんの代用としてのオレンジの3作物にフロアブル製剤とした [<sup>14</sup>C] 標識エトキサゾール(2種)を慣行施用量またはそれに概ね対応する施用量で、それぞれ収穫前4週間、30日、90日前に全面散布し、室内(なす)または屋外(りんご、オレンジ)で栽培した。

3作物のいずれにおいても収穫期を含むすべての調査時点で果実における放射性総残留量(TRR)の濃度は葉に比べて顕著に低かった。3作物のいずれにおいても [<sup>14</sup>C] 標識エトキサゾール(2種)の果実および葉表面からの浸透移行性は低く、収穫期果実 TRR の38～70%、葉 TRR の56～88%が表面に残留し、果実内部に移行した放射活性も大部分が果皮部に分布していた。

3作物の果実と葉のいずれにおいても収穫期の主たる残留物種は未変化体(エトキサゾール)であり、果実 TRR の36～69%、葉 TRR の約22～74%を占めた。収穫期までのいずれかの時点で単独で果実 TRR の10%以上または0.01 mg eq./kg 以上を占めた主要な代謝残留物は R7(りんご30日後、TRR の %、 ; オレンジ30日後、TRR

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

の %、 ) のみであった。また、葉においては単独で葉 TRR の 10%以上を占める代謝物は 3 作物のいずれにおいても検出されなかった。

作物表面および作物体中でエトキサゾールは主に、

に代謝

された。

作物中の微量代謝物として R2, R3, R7, R11, R12, R13, R14, R15 が同定された。これらのうち R2 と R12 はなすからのみ、R14 はオレンジからのみ検出された。また、R15 はなすでは検出されなかった。以上の 4 代謝物のうち、R12 は遊離体としてはりんご、オレンジから検出されていないが、抽出残渣加水分解物には含まれており、3 作物に共通な代謝物といえる。

なすでは R15 から R12 への加水分解が活発で R12 として検出されたと考えられることから 3 作物に共通な経路上の代謝物と考えられる。R14 は オレンジ以外の作物および動物では検出されなかったが、その量は最大でもオレンジ果実 TRR の %、 (未変化体残留量の %以下) の微量にすぎず、エトキサゾールの代謝は 3 作物で基本的に同じと考えられる。

また、ワタ (米国おける適用作物、日本国内に登録なし) にフロアブル製剤とした [<sup>14</sup>C] 標識エトキサゾール (2 種) を慣行施用量の約 2 倍量で経葉散布を行った。種子において 10%TRR を超える主要残留物は未変化体および DFB であったが、残留濃度はともに 0.01 mg eq./kg 未満と低かった。他に、R3, R11, R14 および R15 が微量検出された。エトキサゾールは主にメタノール表面洗浄液中に検出され、有機溶媒からはフェニル標識体でのみ微量抽出された。上述のとおり、他の作物でも浸透移行性が低いことが示されていることから、種子中に残留するエトキサゾールは主として表面散布によるものであると考えられる。ジントラッシュにおいて 10%TRR を超える主要残留物は未変化体 (1.96~2.15 mg eq./kg) および R3 ( ) であった。他に、R4, R7, R8, R11, R12, R13, R14 および R15 が検出された (各く )。以上により、エトキサゾールはワタにおいても上記 3 作物と同様に代謝されることが考えられた。

#### 土壌代謝および土壌吸着：

[好氣的土壌]：(資料 No. M-5, 抄録 431~438 頁)

慣行施用量の約 1.7 倍の濃度で好氣的畑土壌 (長野県須坂市小河原) に処理された [<sup>14</sup>C] 標識エトキサゾール (2 種) の半減期は約 19 日で、主に土壌微生物により急速に代謝され 1 年でフェニル環は処理量の約 20% が、また、ジヒドロオキサゾール環炭素も 61% が無機化された。エトキサゾールの主要代謝経路は

であり、最終的に CO<sub>2</sub> にまで無機化された。

土壌中でいずれかの時点で処理量の 10%以上を占めた主要な代謝物は R7, R8, R13 の 3 種であった。いずれも 100 日後までに最高値となったのち、以降は低下し、蓄積傾向は認められなかった。

[土壌吸着] : (資料 No. M-6, 抄録 439 頁)

エトキサゾールの水溶解度が  $7.04 \times 10^{-5}$  g/L (25°C) と低く、ガイドラインに示されている試験を行うことが困難なため試験を実施しなかった。水溶解度がかなり小さいため、エトキサゾールの土壌吸着性は高いと予測される。

#### 水中運命 :

[加水分解] : (資料 No. M-7, 抄録 440~445 頁)

エトキサゾールは中性 (pH7) および塩基性 (pH9) の水中では加水分解に対して安定であった (半減期 3~4 カ月, 25°C) が, pH5 の酸性条件では半減期は約 10 日 (20°C) で R7 に比較的容易に加水分解された。

[水中光分解-1] : (資料 No. M-8 参, 抄録 446~455 頁)

2 種類の [<sup>14</sup>C] 標識エトキサゾールを用いてキセノン光 (26100 μW/cm<sup>2</sup> 250~800 nm) の連続照射による水中光分解運命試験 (濃度: 0.005 mg/L, 溶解補助剤: アセトニトリル 10%, 温度: 約 20°C) を行った。

水中におけるエトキサゾールは直接的な光分解により速やかに分解された。北緯 35° における太陽光換算半減期はフェニル標識体では河川水で 59.7 日, 緩衝液で 17.4 日であり, オキサゾール標識体では河川水で 28.6 日, 緩衝液で 15.9 日であった。また, 量子収率 (φ<sup>o</sup>) は 0.026 であり, これより求めた北緯 40°, 東経 140° および水深 30 cm における半減期は 5.56 日であった。

主要分解物として DFB, R3, R4, R11, R12, R15 の 6 種類が検出され, エトキサゾールは

に分解すると考えられた。

[水中光分解-2] : (資料 No. M-8, 抄録 456~458 頁)

エトキサゾールは水中 (pH 7, 緩衝液) での直接的な光分解に対して安定 (290~400 nm の放射照度 19 W/m<sup>2</sup> のキセノン光連続照射による半減期は約 95 日, 初夏の太陽光換算半減期は 169 日) であったが, 環境水中の光増感剤による光増感効果を受け, 河川水中では分解が促進された (キセノン光連続照射による半減期は約 66 日, 初夏の太陽光換算半減期は 119 日)。

#### ガラス表面における光分解性運命 : (資料 No. M-9, 抄録 459~463 頁)

作物体表面での光分解を模してガラス表面に 3.1~3.5 μg/cm<sup>2</sup> の割合で 2 種の [<sup>14</sup>C] 標識エトキサゾールを処理し, 10 月の自然太陽光に 2 日間, 次いで作物栽培室内で人工光に 40 日間間欠暴露した。エトキサゾールは暗所では安定であったが, 光照射下では比較的不安定であり, 自然太陽光下では 2 日間で処理量の 22~25% が, その後の 40 日間の人工光間欠照射条件下では更に 74~76% が分解された。照射区の非揮発性の主要な分解生成物は R3 であり, 他に R11 が微量検出された。R13 は暗所対照区と 0 時点の照射区でのみ検出され, エトキサゾールはガラス表面では

た。作物表面上で

に分解されたと考えられ  
と推定される。

生物濃縮性：（資料 No. M-10, 11, 抄録 464～467 頁）

ニジマスを用いた生物濃縮性試験におけ BCF<sub>ss</sub> 値は 860 であり、BCF<sub>k</sub> 値は 920、魚体  
中半減期は 2.6 日であった。

ブルーギルを用いた生物濃縮性試験におけ BCF<sub>ss</sub> 値は 1200 であり、BCF<sub>k</sub> 値は 1200、  
魚体中半減期は 2.5 日であった。

以上のように作物に散布されたエトキサゾールは表面からの浸透移行性が低く、主に  
作物表面に未変化体として残留する。作物中の主残留物である未変化体は、動物体消化  
管からその 5～6 割が吸収されるが、急速に代謝および排泄されるため、長期に摂取し  
ても未変化体と代謝物のいずれに関しても顕著に蓄積するおそれはない。作物中の主要  
代謝物である R7 は動物体でも主要代謝経路上の代謝物として検出されており、動物体  
内では速やかに代謝および排泄される。オレンジでは動物で認められない R14 が検出さ  
れたが、極めて微量であり、かつ動物中では加水分解によって動物・植物・環境中での  
共通代謝物 R7 に代謝されると推定されるため、動物体に何らかの悪影響を及ぼすこと  
はないと考えられる。

環境中ではエトキサゾールは主に土壤微生物によって急速に CO<sub>2</sub> にまで代謝分解され、  
未変化体およびその基本骨格を有した代謝物が土壤中に長期に残留し、土壤中の生物に  
影響を及ぼしたり後作物を汚染したりするおそれはない。ドリフト等で河川などに混入  
した場合でもエトキサゾールの水溶解度が低いことおよび土壤吸着性が高いことに加  
え、加水分解と水中光分解で分解されるため、エトキサゾールが水道水に混入する可  
能性は極めて低い。また、土壤中で容易に代謝分解されることに加えて土壤吸着性が高い  
ため、地下水に混入する可能性も極めて低い。

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

<動植物等における代謝分解経路図>

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

<代謝分解の概要-1>

代謝分解物		Y1-5301 (親)	R2	R3	R4	R5	R6	R7	R8	R9	R10	R11	R12	R13	R14	R15	R16	R24	DFB	Met1	Met4	1B	未測定その他	抽出残渣	CO <sub>2</sub>	回収率 (%)			
動物	ラット	フェニル	雄																										
			雌																										
			平均	24.5																									
	ラット	ニル	雄																										
			雌																										
			平均	2.2																									
	ラット	ラット	雄																										
			雌																										
			平均	29.1																									
	動物	オキ	サゾ	雄																									
				雌																									
				平均	3.4																								
オキ		サゾ	雄																										
			雌																										
			平均	17.8																									
オキ		サゾ	雄																										
			雌																										
			平均	5.6																									
オキ		サゾ	雄																										
			雌																										
			平均	19.0																									
オキ	サゾ	雄																											
		雌																											
		平均	4.5																										

数値は投与量に対する割合 (%) ただし、肝臓は肝臓中放射活性に対する割合 (%)。肩付き数値は代謝物数。空白部分：不検出、またはなし。

\*: 12 時間後では検出。



本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

＜代謝分解の概要-2＞

代謝分解物	YI-5301 (親)	R2	R3	R4	R5	R6	R7	R8	R9	R10	R11	R12	R13	R14	R15	R16	R24	DFB	Met1	Met4	1B	未測定 その他	抽出 残渣	CO <sub>2</sub>	回収率 (%)		
		糞 0-48時間	75.9																								
尿 0-24時間																											
胆汁 0-48時間																											
肝臓 6時間後	6.7																										
糞 0-48時間	79.5																										
尿 0-24時間																											
胆汁 0-48時間																											
肝臓 6時間後	7.3																										
糞 0-48時間	74.7																										
尿 0-24時間																											
胆汁 0-48時間																											
肝臓 6時間後	7.4																										
糞 0-48時間	80.2																										
尿 0-24時間																											
胆汁 0-48時間																											
肝臓 6時間後	9.0																										

数値は投与量に対する割合(%)ただし、肝臓は肝臓中放射活性に対する割合(%)。肩付き数値は代謝物数。空白部分：不検出、またはなし。nr:定量できず。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

<代謝分解の概要-3>

代謝分解物					YI-5301 (親)	R2	R3	R4	R5	R6	R7	R8	R9	R10	R11	R12	R13	R14	R15	R16	R24	DFB	Met1	Met4	1B*	未同定その他	抽出残渣	CO <sub>2</sub>	回収率 (%) (ppm)				
植	す	0.2 kg	フェニル 標識体	果実	27日	68.5																											
				葉	後収穫	0.07																											
		a.i. /ha	オキサゾール 標識体	果実	28日	74.0																											
				葉	後収穫	0.14																											
	りんご	0.15 kg	フェニル 標識体	果実	30日	41.1																											
				葉		0.05																											
		a.i. /ha	オキサゾール 標識体	果実		37.9																											
				葉		0.96																											
					42.3																												
					0.04																												
					22.7																												
					0.16																												

上段数値は植物体の残留放射能 (TRR) に対する割合 (%), 下段数値は濃度 (ppm:mg eq./kg)。肩付き数値は代謝物数。空白部分: 不検出, またはなし。

\*\* : 14 日後或いは 15 日後に検出。 \* : HPLC における極性画分 (成分 1+成分 2), オキサゾール標識体ではこれより R11 を引いた値。

<代謝分解の概要-4>

代謝分解物				YI-5301 (親)	R2	R3	R4	R5	R6	R7	R8	R9	R10	R11	R12	R13	R14	R15	R16	R24	DFB	Met1	Met4	1B*	未同定その他	抽出残渣	CO <sub>2</sub>	回収率 (%) (ppm)				
植 物 体	オ レ ン ジ	0.4 kg a.i. /ha	フェニル 標識体	果実	59.0																											
				葉	0.06																											
				熱水	60.4																											
		オキサゾール 標識体	果実	0.49																												
			葉	21.0																												
			熱水	0.17																												
		90 日 後 収 穫	果実	36.4																												
			葉	0.02																												
			熱水	43.0																												
				6.7																												
				0.29																												

上段数値は植物体の残留放射能 (TRR) に対する割合 (%), 下段数値は濃度 (ppm:mg eq/kg)。肩付き数値は代謝物数。空白部分: 不検出, またはなし。  
 \*\*: 21 日後および 30 日後に検出。\*: HPLC における極性画分 (成分 1+成分 2), オキサゾール標識体ではこれより R11 を引いた値。

<代謝分解の概要-5>

代謝分解物					YI-5301 (親)	R2	R3	R4	R5	R6	R7	R8	R9	R10	R11	R12	R13	R14	R15	R16	R24	DFB	Met1	Met4	18	未同定その他	抽出残渣	CO <sub>2</sub>	回収率 (%) (ppm)						
植 物	ワ タ	0.1 kg a.i. /ha (2回)	フェニル 標識体	種子	21 日 後 収 穫	19.9																													
				ジント ラッシュ		0.004																													
			ジフルオロ フェニル 標識体	種子		4.9																													
				ジント ラッシュ		0.002																													
						ジント ラッシュ		36.3																											
						ラッシュ		2.153																											

上段数値は植物体の残留放射能 (TRR) に対する割合 (%), 下段数値は濃度 (ppm:mg eq/kg)。肩付き数値は代謝物数。空白部分: 不検出, またはなし。その他には, TLC の原点部分 (< %TRR), TLC でスポットが明確でない成分, ジントラッシュ抽出残渣に植物構成成分の可溶化処理を行った後の各画分に分布する放射活性 (< %TRR) を含む。HPLC および TLC 未同定成分は < %TRR。

\*: ジントラッシュ抽出残渣に植物構成成分の可溶化処理を行った後の最終残渣。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

<代謝分解の概要-6>

代謝分解物				YI-5301 (親)	R2	R3	R4	R5	R6	R7	R8	R9	R10	R11	R12	R13	R14	R15	R16	R24	DFB	Met 1	Met 4	1B	未同定その他	抽出残渣	CO <sub>2</sub>	回収率 (%)			
土	非滅菌 堆肥土	1 mg a.i. /kg	フェニル 標識体	16日後	45.4																										
				64日後	9.5																										
				25°C 暗所	100日後	5.9																									
				359日後	1.8																										
			サリチル 標識体	16日後	42.3																										
				64日後	9.8																										
				25°C 暗所	100日後	5.7																									
				359日後	1.6																										
水	加水分解	37 ppb	pH5 pH7 pH9	20°C	21日後	17.2																									
				70°C	48時間後	37.4																									
					41.7																										
	水中光-1	フェニル 標識体 5 ppb	緩衝液	47日後	14.9																										
			河川水	32日後	60.9																										
		サリチル 標識体 5 ppb	緩衝液	46日後	17.1																										
			河川水	30日後	45.3																										

数値は処理量に対する割合 (%)。肩付き数値は代謝物数。空白部分：不検出、またはなし。

<代謝分解の概要-7>

代謝分解物				YI-5301 (親)	R2	R3	R4	R5	R6	R7	R8	R9	R10	R11	R12	R13	R14	R15	R16	R24	DFB	Met 1	Met 4	1B	未同定その他	抽出残渣	CO <sub>2</sub>	回収率 (%)							
水	水中光-2	5 ppb	緩衝液	41日後	72.2																														
			河川水	41日後	64.0																														
ガラス表面	太陽光 (48時間) + 人工光 (40日)	3.1-3.5 μg/cm <sup>2</sup>	フェニル標識体	48時間後	77.5																														
				+24日後	3.0																														
				+42日後	1.6																														
				ナゾール標識体	48時間後	74.9																													
					+24日後	3.8																													
					+42日後	1.3																													

数値は処理量に対する割合 (%)。R3 は HPLC による R3+R7 の定量値を TLC による R7 の定量値で補正して算出。R11 は TLC による定量値。その他は HPLC の画分 (計 10 画分, 最大で %, 42 日後) と分析ロスなど HPLC 分析で未回収の放射活性。空白部分: 不検出, またはなし。

本資料に記載された情報に係わる権利及び内容の責任は協友アグリ株式会社にある。

[附] エトキサゾールの開発年表

特許						
物理的・化学的 性状						
有用動植物等 に及ぼす影響						
農薬残留						
適用農作物及 び適用害虫						
毒性						
急性						
亜急性						
慢性毒性及び 発がん性						
催奇形性						
繁殖性						
変異原性						
薬理						
製剤						
代謝						
製造						