

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はTAC普及会にある。

## 2. 原体混在物及び代謝物の毒性

原体混在物

マウスにおける急性経口毒性試験

(資料No.39)

試験機関：

[GLP対応]

報告書作成年：2000年

検体の純度：

供試動物：ICR系[Crl:CD-1(ICR)]マウス、5週齢、体重：雄28.1~31.8g、雌22.0~24.9g、  
1群雌雄各5匹

観察期間：14日間

試験方法：59農蚕第4200号別添の急性経口毒性試験による。

投与方法：検体をポリエチレングリコール(日局マクロゴール400)に懸濁して経口投与した。  
投与前3時間及び投与後3時間絶食させた。

観察・検査項目：中毒症状及び生死を14日間観察した。投与直前、投与後2、3、5、8及び  
15日に体重を測定した。死亡動物及び試験終了時の全生存動物について組織の  
肉眼的病理検査を実施した。

結果：

投与方法	経口
投与量 (mg/kg)	雄及び雌 0、50、300、5000
LD <sub>50</sub> (mg/kg)	雄及び雌 300~5000
死亡開始時間及び終了時間	雄及び雌 投与後3時間から開始 雄及び雌 投与後2日に終了
症状発現時期及び消失時期	雄及び雌 投与後15分から発現 雄及び雌 投与後2日の死亡時まで継続
毒性徴候の認められなかった 最高投与量 (mg/kg)	300
死亡例の認められなかった 最高投与量 (mg/kg)	300

5000mg/kgを投与した動物は、雌雄いずれも投与後6時間以内に5例中4例が死

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はTAC普及会にある。

亡し、残りの各1例は2日目に死亡した。300mg/kg群及び50mg/kg群では全例が観察期間終了時まで生存した。5000mg/kg群の雌雄動物各2～5例には死亡の前に、自発運動の低下、腹臥位、立毛及び緩徐呼吸が観察された。300mg/kg及び50mg/kg群動物の一般状態及び体重には変化がみられなかった。

剖検の結果、5000mg/kg群雄動物に腹水及び胸水が観察されたが、同群の雌動物、300mg/kg群及び50mg/kg群の雌雄動物には異常がみられなかった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はTAC普及会にある。

原体混在物

細菌を用いる復帰変異試験

(資料No.40)

試験機関：

[GLP対応]

報告書作成年：2000年

検体純度：

試験方法：ヒスチジン要求性のサルモネラ菌 *Salmonella typhimurium* TA98、TA100、TA1535、TA1537株及びトリプトファン要求性の大腸菌 *Escherichia coli* WP2uvrA株を用い、ラット肝臓から調製した薬物代謝酵素系(S-9Mix)の存在下及び非存在下で、Amesらの方法を用いて変異原性を検定した。

検体はDMSOに溶解し、312.5～5000 $\mu$ g/プレート<sup>o</sup>の範囲の5濃度で実施した。本試験は2連制とした。陽性対照物質AF-2 [2-(2-furyl)-3-(5-nitro-2-furyl)acrylamide]、9-AA [9-aminoacridine]及び2-AA [2-aminoanthracene]はDMSOに、SA [Sodium azide]は蒸留水に溶解して使用した。

用量設定根拠：

試験結果：結果を次頁に示す。

検体は、用量設定試験及び本試験で、代謝活性化系の有無にかかわらず最高用量(5000 $\mu$ g/プレート<sup>o</sup>)においても、全ての供試菌株について、復帰変異コロニー数を増加(溶媒対照群の2倍以上)させなかった。

一方、陽性対照として用いたAF-2、9-AA、2-AA及びSAでは全ての検定菌株で明らかな復帰変異コロニー数の増加を示した。

以上の結果より、検体は代謝活性化を含む本試験条件下で復帰変異誘発性は有しないものと判断される。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はTAC普及会にある。

用量設定試験 (μg/プレート)

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はTAC普及会にある。

本試験

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はTAC普及会にある。

### 3. 製剤

#### (1) 急性毒性

ラットにおける急性経口毒性試験

(資料No.4)

試験機関：

[GLP対応]

報告書作成年： 1991年

検体の純度： 41%液剤

組成： グリホサート・イソプロピルアミン塩  
界面活性剤  
水

試験動物： SD系ラット、5~6週齢、体重：雄151.0~161.7g、雌123.1~132.0g、  
1群雌雄各10匹

観察期間： 14日間

投与方法： 検体を蒸留水に溶解して強制経口投与した。投与前に17~18時間絶食した。

観察・検査項目： 中毒症状及び生死を14日間毎日観察した。投与前及び投与後1、3、7及び14日に体重を測定した。死亡動物及び試験終了時の全生存動物について組織の肉眼的病理検査を行った。

結果：

投与方法	経口
投与量(mg/kg)	5000
LD <sub>50</sub> (mg/kg) (95%信頼限界)	雄 >5000 雌 >5000
死亡開始時間 及び終了時間	雄2日から開始、雌 死亡なし。 雄3日に終了。
症状発現時期 及び消失時期	雄及び雌 投与後15分から発現 雄及び雌 投与後48時間に消失
死亡例の認められなかった 最高投与量(mg/kg)	雄 該当なし 雌 5000

中毒症状としては、雌雄に関係なく自発運動量の低下及び腹臥位が観察された。投与後24時間で軽度な体重の減少が雄5例及び雌2例で認められたが、以後は順調に推移した。

肉眼的病理検査で、途中死亡動物の小腸に充血が認められた以外、異常はみられなかった。生存動物では、いずれの臓器にも異常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TAC普及会にある。

マウスにおける製剤の急性経口毒性試験

(資料No.5)

試験機関：

[GLP対応]

報告書作成年： 1991年

検体の純度： 41%液剤

組成： グリホサート・イソプロピルアミン塩  
界面活性剤  
水

供試動物： ddY系マウス、5~6週齢、体重：雄 23.47~26.06g、雌 20.54~22.20g、  
1群雌雄各10匹

観察期間： 14日間

投与方法： 検体を蒸留水に20%w/vの濃度で溶解して強制経口投与した。投与前に約4  
時間絶食した。

観察・検査項目： 中毒症状及び生死を14日間毎日観察した。体重は投与開始前、投与後1、3、  
7及び14日に測定した。死亡動物及び試験終了時の全生存動物について組織  
の肉眼的病理検査を行った。

結果：

投与方法	経口
投与量(mg/kg)	5000
LD <sub>50</sub> (mg/kg) (95%信頼限界)	雄 >5000 雌 >5000
死亡開始時間 及び終了時間	死亡例なし
症状発現時期 及び消失時期	雄及び雌 投与後30分~1時間から開始 雄及び雌 投与後24時間に消失
死亡例の認められなかった 最高投与量(mg/kg)	雄 5000 雌 5000

中毒症状としては、雌雄に関係なく自発運動量の低下が観察された。雌雄とも投与後24時間に軽度な体重の減少がみられたが、以後、順調に推移した。

肉眼的病理検査ではいずれの動物にも異常はみられなかった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はTAC普及会にある。

ラットにおける製剤の急性経皮毒性試験

(資料No.6)

試験機関：

[GLP対応]

報告書作成年： 1991年

検体の純度： 41%液剤

組成： グリホサート・イソプロピルアミン塩  
界面活性剤  
水

供試動物： SD系ラット、7~8週齢、体重：雄 245.1~267.1g、雌 184.2~194.3g、  
1群雌雄各10匹

観察期間： 14日間

投与方法： 未希釈の検体を刈毛した皮膚部位に塗布して24時間閉塞した。処理24時間後に処理部位の皮膚に残存した検体を蒸留水で洗い流した。

観察・検査項目： 中毒症状及び生死を14日間毎日観察した。投与直前、投与後1、3、7及び14日に体重を測定した。死亡動物及び試験終了時の全生存動物について適用部位を含む組織の肉眼的病理検査を実施した。

結果：

投与方法	経皮
投与量(mg/kg)	2000
LD <sub>50</sub> (mg/kg) (95%信頼限界)	雄 >2000 雌 >2000
死亡開始時間及び終了時間	死亡例なし
症状発現時期及び消失時期	雄及び雌 症状発現なし。
無毒性量(mg/kg)	雄及び雌 2000

雌雄動物に中毒症状は観察されなかった。投与24時間後の体重は、雌雄とも軽度に低下したが、以後、順調な増加がみられた。観察期間終了時に全供試動物の肉眼的病理検査を実施したところ、いずれの動物においても異常所見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TAC普及会にある。

ラットにおける製剤の急性吸入毒性試験

(資料No.8)

試験機関：

[GLP対応]

報告書作成年： 1992年

検体の純度： 41.0%液剤

組成： グリホサート・イソプロピルアミン塩  
界面活性剤  
水

供試動物： Crj:CD(SD)系ラット、7週齢、  
体重：雄 267.7~291.8g、雌 171.2~200.4g、1群雌雄各10匹

観察期間： 14日間

暴露方法： 検体を希釈せずに、給気量15L/分、排気量12L/分の条件下でミストを発生させ、4時間鼻部暴露させた。3.67mL/m<sup>3</sup>及び暴露可能な最大量である33.3mL/m<sup>3</sup>の投与量で実施した予備試験の結果に基づいて、本試験の用量を0.37、1.16、3.67、11.56及び33.3mL/m<sup>3</sup>とした。雌動物の試験ではこれらの用量段階ではLC<sub>50</sub>値が算出できなかったため14.67及び21.1mL/m<sup>3</sup>の用量を追加した。  
暴露開始1時間後及び3時間後に、捕集液[蒸留水/メタノール混合液(6:4)]を用いて捕集し、重量測定法により実際濃度を求めた。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はTAC普及会にある。

暴露条件；

設定濃度(mL/m <sup>3</sup> )	0.37	1.16	3.67	11.56	14.67	21.1	33.3
実際濃度(mL/m <sup>3</sup> )	0.06	0.12	1.02	2.17	2.03	2.75	4.18
粒子径分布(%)*							
<0.43 (μm)	0.2	0.3	0.2	0.2	0.1	0.0	0.0
0.43~0.65	1.1	0.6	0.6	1.5	0.8	0.9	1.3
0.65~1.1	5.6	4.5	5.4	8.0	4.5	5.5	6.5
1.1 ~2.1	19.5	14.8	17.8	18.1	14.6	16.1	19.0
2.1 ~3.3	30.0	28.3	28.7	27.8	27.1	29.6	30.5
3.3 ~4.7	19.9	24.9	21.7	20.1	21.9	20.9	19.3
4.7 ~7.0	7.7	10.3	8.5	8.2	8.9	9.3	7.9
7.0 ~11	2.2	2.6	2.3	2.5	2.3	2.6	2.2
>11	13.7	13.7	14.9	13.5	19.7	15.0	13.2
空気力学的質量中位径(μm)	3.0	3.3	3.2	3.0	3.4	3.2	3.0
呼吸可能な粒子(<4.7μm)の割合(%)	76.3	73.4	74.4	75.7	69.0	73.0	76.6
チャンバー容積(L)	37.4						
チャンパー内通気量(L/分)	15L						
暴露条件	ミスト 4時間 鼻部暴露						

\*：アンダーセンサンプラーに28.3L/分の流量で、暴露量に応じて5~420分間通気し、採取した検体の量から粒子径分布を測定した。

観察・検査項目：暴露中及び暴露後14日間、中毒症状及び生死を観察した。暴露前、暴露後1、2、3、5、7及び14日に体重を測定した。死亡動物及び観察期間終了時の全生存動物について肉眼的病理検査を実施した。

結果：

投与方法	吸入
暴露濃度(mL/m <sup>3</sup> )	雄：0.06、0.12、1.02、2.17、4.18 雌：0.06、0.12、1.02、2.17、2.03、2.75、4.18
LC <sub>50</sub> (mL/m <sup>3</sup> ) (95%信頼限界)	暴露量からの計算値      測定濃度からの計算値 雄：15.89(11.33~22.36)      2.64 雌：29.91(25.48~39.65)      3.80
死亡開始時間及び終了時間	雄及び雌：暴露後1日から開始 雄及び雌：暴露後2日に終了
症状発現時間及び消失時間	雄：暴露直後から発現、暴露後14日まで消失せず。 雌：暴露直後から発現、暴露後11日に消失
毒性兆候の認められなかった 最高濃度(mL/m <sup>3</sup> )	雄：なし(全群の動物に毒性兆候が認められた) 雌：0.37
死亡例の認められなかった 最高濃度(mL/m <sup>3</sup> )	雄：3.67 雌：14.67

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はTAC普及会にある。

中毒症状として、雌雄に関係なく、体毛の汚染、鼻周囲に血様物質の付着、異常呼吸音、呼吸困難、自発運動量低下、眼瞼下垂、眼瞼周囲に血様物質の付着、鼻汁、前肢に血様物質の付着、流涎が認められ、雄ではさらに腹部膨満、流涎痕及び肛門周囲の汚染が認められ、雌では腹臥位及び軟便が認められた。0.06ml/m<sup>3</sup>暴露群の雌を除く全群の雌雄動物において暴露後1~2日まで体重の減少が認められたが、その後回復した。なお、2.17ml/m<sup>3</sup>群の雄2例では暴露後7~14日より再び体重が減少した。

死亡動物の肉眼的病理検査では、全群の雌雄ほぼ全例で胸腺に点状出血ないし散在性出血、肺に散在性の赤褐色陥没部位が認められ、生存例の肉眼検査では、胸腺に出血斑、肺に褐色部位、胸腺、肝及び脾の萎縮及び胃腸管にガス貯留が認められた。雌では肺に陥没部位が認められた。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はTAC普及会にある。

(2) 皮膚及び眼に対する刺激性

ウサギを用いた皮膚刺激性試験

(資料No.12)

試験機関：

[GLP対応]

報告書作成年： 1991年

検体の純度： 41%液剤

[組成] グリホサート・イソプロピルアミン塩  
界面活性剤  
水

供試動物： 日本白色種ウサギ、体重：2.55 ~2.75kg, 1群雄6匹

観察期間： 5日間

投与方法： 検体をリント布に塗布し、刈毛した動物の背部非擦過皮膚(2×3cm)に4時間閉塞貼付した。暴露時間は4時間とし、皮膚に残った検体は水で湿らせたガーゼで拭き取った。同一動物の別の皮膚部位を擦過して同様に処理し、さらに、対照とした皮膚部位にはリント布のみを添布した。

観察項目： 暴露終了後30分、24、48、72時間及び5日に、適用部位の刺激性変化(紅斑、痂皮、浮腫)の有無等を観察し、Draize法に従って採点した。

刺激性の判定は、一次刺激性指数(P.I.I.)を算出して以下の基準に従った。

一次刺激性指数＝

{全動物の24時間及び72時間における非擦過皮膚及び擦過皮膚の[紅斑・痂皮]  
及び[浮腫]の採点合計} / 2(時点数) / 2(皮膚部位数) / 6(動物数)

判定基準

一次刺激性指数	判定
0 ~ 2	弱い刺激性
3 ~ 5	中等度の刺激性
6 ~ 8	強い刺激性

結果： 観察した刺激性変化の採点は次頁表1のとおりである。

表1. 刺激性採点結果



非擦過皮膚においては、暴露48時間後まで軽度な紅斑が認められたが、72時間後には全て消失した。擦過皮膚では、軽度な紅斑及び浮腫が暴露72時間後まで認められたが、5日後には完全に消失した。

検体の一次刺激性指数は0.96、対照皮膚部位の一次刺激性指数は0.33であった。

以上の結果から、グリホサート剤41%液剤はウサギの皮膚に対して弱い刺激性を有すると判断される。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はTAC普及会にある。

ウサギを用いた眼刺激性試験

(資料No.9)

試験機関：

[GLP対応]

報告書作成年： 1991年

検体の純度： 41%液剤

[組成] グリホサート・イソプロピルアミン塩  
界面活性剤  
水

供試動物： 日本白色種ウサギ、体重：2.05~2.20kg、非洗眼群雄6匹、洗眼群雄3匹

試験期間： 21日間

投与方法： 検体0.1mLを右眼に点眼し、洗眼群の3匹は2分後に微温水で洗眼した。非洗眼群の6匹については洗眼しなかった。左眼を無処理対照とした。

観察項目： 適用後1、24、48、72時間及び以後は2日毎に21日間にわたって角膜、虹彩及び結膜の刺激性変化を観察し、Draize法に従って採点した。中毒症状の有無を21日間毎日観察し、適用前、適用後72時間、7、14及び21日に体重を測定した。

各動物の採点結果から、個体別の評点を計算し、非洗眼群及び洗眼群毎に採点。

時間別の平均評点を算出して以下の区分により刺激性を判定した。

個体別評点(最大110)

=角膜混濁[程度×面積×5]+虹彩[程度×5]+結膜[(浮腫+分泌物+発赤)×2]

評価区分	個体別評点の採点時間別平均最大値	個体別評点の採点時間別平均	各採点時における個体別の評点
刺激性なし	0~5	48時間後 0	
軽度の刺激性	5~15	48時間後 5以下	
刺激性あり	15~30	4日後 5以下	
中等度の刺激性	30~60	7日後 20以下	7日後、6/6例が30以下 4/6例が10以下
中等度~重度の刺激性	60~80	7日後 40以下	7日後、6/6例が60以下 4/6例が30以下
重度の刺激性	80~110		

結果： 観察した非洗眼群動物の個体別刺激性変化の採点及び評点を表1に、洗眼群動物の個体別刺激性変化の採点及び評点を表2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TAC普及会にある。

1. 非洗眼群個別動物刺激性変化の採点及び評点

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はTAC普及会にある。

表2. 洗眼群動物個体別の刺激性変化の採点及び評点



非洗眼群では、適用24-48時間後に中等度の角膜の混濁及び虹彩の充血が認められたが、虹彩の充血は7日後以降消失し、角膜の混濁も21日後までにほとんど消失した。結膜においては適用1時間後に重度の浮腫、重度の分泌物及び軽度の発赤が認められたが、浮腫は時間の経過とともに軽度となり、適用15日後には6例中2例に軽度な腫脹が残ったが、その他の動物では消失した。発赤は適用 48-72時間後に強く発現し、以後は回復がみられた。適用15日後には6例中2例に軽度な血管の充血がみられたが、その他の動物では消失した。

最大評点は53.8、適用7日後に36.8であり、刺激性評価基準に照らすと、中等度~重度の刺激性に区分される。

洗眼群では、適用1-3日後の観察では非洗眼群と比較して刺激性は軽度であったが、観察期間後期には非洗眼群とほぼ同程度の刺激性反応が残った。

以上の結果から、グリホサート41%液剤はウサギの眼粘膜に対して中等度~重度の刺激性があるものと判断される。



本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はTAC普及会にある。

ウサギを用いた製剤100倍希釈液の眼刺激性試験

(資料No.10)

試験機関：

[GLP対応]

報告書作成年： 1993年

検体の純度： 41%液剤

[組成] グリホサート・イソプロピルアミン塩  
界面活性剤  
水

供試動物： 日本白色種ウサギ、体重：2.18~2.37kg、非洗眼群雄6匹、洗眼群雄3匹

観察期間： 72時間

投与方法： 検体を蒸留水で100倍に希釈して0.1mLを右眼に適用し、3匹は2分後に微温水で洗眼した。6匹については洗眼しなかった。左眼を無処置対照とした。

観察項目： 適用の1、24、48及び72時間後に角膜、虹彩及び結膜の刺激性変化を観察し、Draize法に従って採点した。各動物の採点結果から、個別別の評点を計算して非洗眼群及び洗眼群毎に採点時間別の平均値を算出し、以下の区分により刺激性を判定した。

個別別評点(最大110)

=角膜混濁[程度×面積×5]+虹彩[程度×5]+結膜[(浮腫+分泌物+発赤)×2]

評価区分	個別別評点の採点時間別平均の最大値	個別別評点の採点時間別平均	各採点時における個別別の評点
刺激性なし	0~5	48時間後 0	
軽度の刺激性	5~15	48時間後 5以下	
刺激性あり	15~30	4日後 5以下	
中等度の刺激性	30~60	7日後 20以下	7日後、6/6例が30以下 4/6例が10以下
中等度~重度の刺激性	60~80	7日後 40以下	7日後、6/6例が60以下 4/6例が30以下
重度の刺激性	80~110		

結果： 観察した個別別動物刺激性変化の採点及び評点を表1に示す。

非洗眼群及び洗眼群動物の角膜及び虹彩に刺激性変化は認められなかった。適用1時間後において非洗眼群動物の結膜に軽度の浮腫及び発赤が認められ、1例には軽度な分泌物が認められたが、浮腫及び分泌物は24時間後に消失し、発赤も48時間後には消失した。評点の最大値は5.0であった。洗眼群動物においても非洗眼群とほぼ同程度の刺激性が結膜に認められ評点の最大値は6.0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TAC普及会にある。

表1. 動物個体別の刺激性変化の採点及び評点



以上の結果から、グリホサート41%液剤の100倍希釈液はウサギの眼粘膜に対して軽度の刺激性があるものと判断される。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はTAC普及会にある。

ウサギを用いた製剤20倍希釈液の眼刺激性試験

(資料No.11)

試験機関：

[GLP対応]

報告書作成年：

1998年

検体の純度： 41%液剤

[組成] グリホサート・イソプロピルアミン塩  
界面活性剤及び水

供試動物： 日本白色種Kbs： JW系ウサギ、9-10週齢、体重：1.82~2.19kg、  
非洗眼群雄6匹、洗眼群雄3匹

観察期間： 72時間

投与方法： 検体を蒸留水で20倍に希釈して0.1mLを右眼に適用し、3匹は適用3分後に生理食塩水で洗眼した。6匹は洗眼しなかった。左眼は無処置対照とした。

試験項目： 適用の1、24、48及び72時間後に角膜、虹彩及び結膜の刺激性変化を観察し、Draize法に従って採点した。個体別動物の評点を計算し、Kay and Calandraによる眼刺激性程度分類法(0から7)で評価した。

個体別評点(最大110)

=角膜混濁[程度×面積×5]+虹彩[程度×5]+結膜[(浮腫+分泌物+発赤)×2]

結果： 観察した個体別動物の刺激性変化の採点及び評点を表1に示す。

非洗眼群動物の角膜及び虹彩には刺激性変化は認められなかった。非洗眼群において適用1時間後の観察で結膜に軽度の分泌物が6例中2例にみられたが、適用24時間後にはいずれの動物においても消失した。

評点の最大値は1時間後の0.67であった。

洗眼群でも、適用1時間後に、軽度の分泌物が1例の結膜に観察されたが、24時間後以降の観察では刺激性変化は認められなかった。

以上の結果から、グリホサート41%液剤の20倍希釈液はウサギの眼粘膜に対して刺激性を有さないと判断される。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はTAC普及会にある。

表1. 動物個体別の刺激性変化の採点及び評点

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はTAC普及会にある。

(3) 皮膚感作性

モルモットを用いた皮膚感作性試験

(資料No.13)

試験機関：

[GLP対応]

報告書作成年： 1991年

検体の純度： 41%液剤

[組成] グリホサート・イソプロピルアミン塩  
界面活性剤  
水

供試動物： Hartley 系白色種モルモット、体重：312.0~366.6g、1群雌10匹

観察期間： 惹起処置後2日間観察

試験操作： [Maximization法]

投与量設定根拠；

感作； 肩甲骨部位を刈毛し、皮膚適用部位6ヵ所(3対)を設けて1対ずつにフロイントの完全アジュバント、検体原液及びフロイントの完全アジュバントに懸濁した検体0.05mLを皮内注射した。この7日後に検体原液0.3mLを皮内注射部位に48時間閉塞貼付した。

一方、陽性対照群動物には皮膚適用部位6ヵ所(3対)に、2,4-ジニトロクロロベンゼン(DNCB)の0.1%(w/v)オリーブ油溶液0.05mLを、検体と同様の方法で皮内注射し、7日後にDNCB 0.1%溶液0.3mLを48時間閉塞貼付した。

惹起； 初回感作の21日後に刈毛した腹側部に検体原液0.3mLを、陽性対照群動物にはDNCB 0.3mLを24時間閉塞貼付した。

観察項目： 惹起24時間後及び48時間後に適用部位の紅斑及び浮腫の有無等を以下の基準で評点した。

判定基準

肉眼的に変化なし	0
軽度又はまばらな紅斑	1
中等度の紅斑	2
強度の紅斑及び浮腫	3

個別別評点から平均反応率(各動物評点合計/動物数)を算出し、非感作群及

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はTAC普及会にある。

び陽性対照群と比較して皮膚感作性を評価した。

結果： 各観察時間における感作変化が認められた動物数を下表に示す。



平均反応率は以下のとおりであった。



検体感作処置群動物に軽度な紅斑がみられたが、無処置群でも同程度の紅斑が認められたことから、この刺激性反応は皮膚一次刺激性によるものであり、皮膚感作性の反応ではないと考えられた。

一方、陽性対照物質を感作処置した動物には、惹起処置後、多数例に紅斑、浮腫あるいは痂皮形成が観察され、対応する感作無処置群と比較して皮膚反応に明らかな差が認められた。

以上の結果から、グリホサート41%液剤の皮膚感作性は陰性であると判断される。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はTAC普及会にある。

(4) 変異原性

細菌を用いる復帰突然変異試験

(資料No.26)

試験機関：

[GLP対応]

報告書作成年： 1991年

検体純度： 41%(液剤)

[組成] グリホサート・イソプロピルアミン塩  
界面活性剤  
水

試験方法： ヒスチジン要求性のサルモネラ菌 *Salmonella typhimurium*(TA98、TA100、TA1535、TA1537株及びトリプトファン要求性の大腸菌 *Escherichia coli* WP2uvrA株を用い、ラットの肝臓から調製した薬物代謝酵素系(S-9Mix)の存在下及び非存在下でAmesらの方法を用いて変異原性を検定した。

検体を蒸留水に溶解し、本試験では78~500 (TA100及びWP2uvrA)、15.6~1000あるいは2000µg/プレート [TA98、TA1535(+S9)及びTA1537(+S9)及び1.56~200µg/プレート [TA1535(-S9)及びTA1537(-S9)の範囲の各7濃度で実施した。試験は2連とし、用量設定試験及び本試験を実施した。陽性対照物質の溶媒にはジメチルスルホキシド(DMSO)を用いた。

用量設定根拠；

試験結果： 結果を次頁に示した。

検体は、代謝活性化を含め、生育阻害が認められない最高濃度において、いずれの菌株についても復帰変異コロニー数を増加させなかった。

一方、陽性対照として用いたN-エチル-N'-ニトロ-N-ニトロソグアニジン(ENNG)、2-ニトロフルオレイン(2-NF)、9-アミノアクリジン塩酸塩(ACR)、2-アミノアントラセン(2-AA)はいずれも各対照の菌株に対して明らかな復帰変異コロニー数の増加を示した。

以上の結果より、検体は代謝活性化を含む本試験条件下で復帰変異誘発性は有さないものと判断される。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はTAC普及会にある。

用量設定試験



本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はTAC普及会にある。

本試験 WP2uvrA及びTA100 2連の数値、( )は平均値

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はTAC普及会にある。

本試験 TA1535、TA98及びTA1537 2連の数値、( )は平均値

IX. 動植物及び土壌等における代謝分解

<代謝分解試験一覧表>

資料 No.	試験の種類	供試動植物等	試験項目・試験方法等	試験結果の概要	試験機関 (報告年)	記載頁
30	動物体内における代謝	ラット 雄、雌	吸収・排泄 分布、代謝 単回、経口 100、1000 mg/kg	血中最高濃度到達時間は雌雄とも低用量で2時間、高用量で4時間。半減期(第1相)は高低用量とも約2時間。 投与放射能の97%が48時間後までに尿及び糞中へ排泄され、168時間後までの尿中排泄は、低用量雄55.5%、雌36.2%、高用量雌雄とも約23%。7日後の体内残留放射能は、低用量で0.6-0.8%、高用量では雌雄とも0.4%。 血漿及び尿中放射能の大部分は親化合物で、	(1992)	IX 4
31	植物における代謝	水稻	代謝物の同定及び 分布検体を 土壌処理、 4週間後に移植	玄米中の放射能濃度は0.15ppmで、内90%は抽出残渣に存在した。	(1996) (1997)	IX 10
32		かんきつ	土壌処理後植物 による 吸収・移行	処理後の葉、外皮及び果肉から検出された放射能は処理量の0.1%以下で、土壌処理したグリホサートはかんきつにほとんど吸収されなかった。	(1996)	IX 13
32-2		キャベツ	土壌処理後植物 による 吸収・移行 植物代謝	収穫期の葉における残留放射能濃度0.0637ppm。	(2006)	IX 15
33	土壌中動態	好氣的土壌 火山灰植壤 土及び鉍質 軽植土	土壌中動態 3ppm 土壌混和、 25℃、 28日間培養	処理放射能の大部分がフルボ酸画分に検出され、ほとんどはグリホサートで、  二酸化炭素の発生は少量であった。	(1992)	IX 19
33-2		好氣的湛水 土壌(日本)	土壌中動態 2kg/ha 相当量 25±2℃、 178日間培養	グリホサートは処理後急速に減少し、30日後に処理放射能の18.4%、178日後には5.2%となり、これに対して二酸化炭素が増加し、178日後に60.0%に達した。	(2005)	IX 23
34		好氣的湛水 土壌(日本)	分解物の同定 3ppm、約21℃、 60日間培養	未同定分解物は と同定された。	(1997)	IX 28

資料 No.	試験の種類	供試動植物等	試験項目・試験方法等	試験結果の概要	試験機関 (報告年)	記載頁																								
36	加水分解	緩衝液	pH4、7、9 50±1℃、 5日間	グリホサート遊離態はいずれのpHにおいても5日後の残留率が96%以上で、ほとんど加水分解されなかった。	(1991)	IX 31																								
35	水中光分解動態	蒸留水、 自然水 (河川水)	光分解物の同定、 半減期 10mg/L 25℃ 7日間	蒸留水：グリホサート87.6%、 が 検出された。 自然水：グリホサート36.1%、 検出された。 半減期(太陽光換算)は蒸留水207日、自然水31.9日	(2006)	IX 32																								
37	土壌吸着	茨城 (火山灰土) 和歌山 (洪積堆積土) 岡山 (黄色土) 熊本 (黒ボク土)	試験原液濃度 1000µg/mL 25℃ 16時間振とう	すべての土壌の上澄液中にグリホサートは検出されず、土壌吸着が強いと考えられた。	(1992)	IX 37																								
38		茨城 (火山灰土) 宮崎 (砂丘未熟土)	試験原液濃度 5880 (茨城)、 6310 (宮崎) mg/L 25℃ 24時間振とう	<table border="1"> <thead> <tr> <th>土壌</th> <th>[土壌/水比]</th> <th>吸着率 (%)</th> <th>分配率 kd</th> <th>Koc</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>茨城</td> <td>1 : 50</td> <td>82.9</td> <td>265</td> <td>5020</td> </tr> <tr> <td>茨城</td> <td>1 : 100</td> <td>58.2</td> <td>153</td> <td>2890</td> </tr> <tr> <td>宮崎</td> <td>1 : 5</td> <td>87.4</td> <td>35.2</td> <td>5580</td> </tr> <tr> <td>宮崎</td> <td>1 : 25</td> <td>26.3</td> <td>9.02</td> <td>1430</td> </tr> </tbody> </table>	土壌	[土壌/水比]	吸着率 (%)	分配率 kd	Koc	茨城	1 : 50	82.9	265	5020	茨城	1 : 100	58.2	153	2890	宮崎	1 : 5	87.4	35.2	5580	宮崎	1 : 25	26.3	9.02	1430	(2004)
土壌	[土壌/水比]	吸着率 (%)	分配率 kd	Koc																										
茨城	1 : 50	82.9	265	5020																										
茨城	1 : 100	58.2	153	2890																										
宮崎	1 : 5	87.4	35.2	5580																										
宮崎	1 : 25	26.3	9.02	1430																										

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は TAC 普及会にある。

<代謝分解物一覧表>

記号	由来	名称(略称)	化学名	構造式
A	親化合物	グリホサート	N-(ホスホノメチル)グリシン	$  \begin{array}{c}  \text{O} \qquad \qquad \text{O} \\  \parallel \qquad \qquad \parallel \\  \text{HO}-\text{C}-\text{CH}_2-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{P}-\text{OH} \\  \qquad \qquad \qquad \qquad \qquad \qquad \qquad \qquad   \\  \qquad \qquad \qquad \qquad \qquad \qquad \qquad \qquad \text{OH}  \end{array}  $

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はTAC普及会にある。

1. 動植物及び土壌における代謝分解

<sup>14</sup>C-標識グリホサートを用いたラット体内における代謝試験

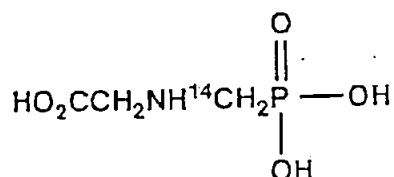
(資料No.30)

試験機関：

報告書作成年： 1992年

供試標識化合物：<sup>14</sup>C-標識グリホサート

構造式；



化学名；N-(ホスホノメチル)グリシン

比放射能；

放射化学的純度；

標識位置の設定理由；

供試動物：SD系ラット、7~8週齢、体重：雄 233~279g、雌 162~207g、  
1群雌雄各3匹

試験方法：

投与； <sup>14</sup>C-標識グリホサートに非標識グリホサートを加えて蒸留水に加熱溶解させた後、  
室温で静置して再結晶させ、アラビアゴム5%水溶液に懸濁させて投与液を調製した。  
低用量は100mg/kg、高用量は1000mg/kgとし、強制経口投与した。

用量設定根拠；

試験構成；下表のとおり設計した。試料採取時間は予備試験の結果に基づいて設定した。

用量	投与回数・経路	動物数	検討項目	試料採取時間
低用量 高用量	単回・経口	雌雄 各3匹	吸収・排泄 血中濃度推移	血液： 15, 30分, 1, 2, 4, 6, 8, 24時間、 以後24時間毎に120時間後まで
低用量 高用量	単回・経口	雌雄 各3匹	吸収・排泄 排泄、体内残留	尿： 4, 8, 24時間、 以後24時間毎に168時間後まで 糞： 24時間毎に168時間後まで
低用量 高用量	単回・経口	雌雄 各3匹	分布	組織： [高用量] 4時間後 [低用量] 2, 24, 168時間後
低用量	単回・経口	雌雄 各3匹	代謝	血漿： 2, 6時間後 尿： 0~24時間

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はTAC普及会にある。

血液試料は各動物の尾静脈から100 $\mu$ Lを採取した。

雄1匹に<sup>14</sup>C-標識検体を100mg/kgの用量で経口投与し、尿、糞及び呼気中の放射能を測定した結果、投与後120時間までに投与量の62.3%及び32.3%が尿及び糞中に排泄され、呼気中への排泄は検出されなかった。したがって、本試験では尿及び糞のみを採取した。

放射能測定；血液及び組織試料は組織溶解剤で溶解した後、脱色剤で脱色した。尿試料は水を加えて定容とした。糞試料は水を加えて攪拌し、均質にした。これらの試料にシンチレーターを加えて液体シンチレーションカウOUNTERで放射能を測定し、計数効率率はチャンネル比法で補正した。放射能の検出限界はバックグラウンド値の2倍とし、実測値からバックグラウンド値を差し引いて以後の計算に供試した。

代謝物の分析；血漿及び尿について、酵素加水分解、固相抽出、メタノール抽出、薄層クロマトグラフィー(TLC)及び高速液体クロマトグラフィー(HPLC)を用いて代謝物を分離、同定及び定量した。

結果：

吸収・排泄；

血中濃度推移：表1に血中濃度の推移を示す。検体100mg/kg投与で2時間後、1000 mg/kg 投与で4時間後に最高濃度に到達した。濃度の推移は、100mg/kg投与では雌雄間に明らかな差はみられなかったが、1000mg/kg投与では雄と比較して雌の最高濃度(Cmax)は82%、曲線下面積(AUC)は90%とわずかに低下した。

排泄：表2に尿及び糞中の経時的排泄量を示す。検体100mg/kg投与動物では、雌雄とも投与放射能の97%が48時間後までに尿及び糞中へ排泄された。投与168時間後までの尿中排泄は、雄動物で55.5%、雌動物では36.2%であった。1000mg/kg投与雌雄動物においても、投与放射能の97%以上が48時間後までに尿及び糞中へ排泄された。尿中排泄は雌雄とも約23%で、低用量を投与した動物と比較して低い割合であった。168時間後の体内残留放射能は、低用量で0.6~0.8%、高用量では雌雄とも0.4%で、ほとんど残留しなかった。

組織中分布；血中濃度の推移の結果から、低用量群では投与2時間後、高用量では4時間後に最高濃度に達したので、この時点の組織中分布を測定し、さらに、低用量投与動物については24時間後及び168時間後についても測定した。表3に組織中の放射能濃度、表4に投与放射能に対する割合を示す。

検体100mg/kg投与動物では、雌雄とも投与2時間後に腎臓に最も高い濃度の放射能が検出され、次いで小腸及び血漿にも比較的高い濃度の放射能が認められた。1000 mg/kg投与動物においては、腎臓、胃腸管及び血漿に高濃度の放射能が検出された。100mg/kg投与動物における投与24時間後及び168時間後の組織中濃度の測定結果から、組織中の残留放射能は急速に消失することが示された。

代謝物の検討；雄ラットを用いた予備試験で、24時間尿を $\beta$ -グルクロニダーゼ/アシルスルファターゼで酵素加水分解し、凍結乾燥又は減圧濃縮した後、液体シンチレーショ

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はTAC普及会にある。

ンカウンターで放射能を測定したところ、この前処理操作の前及び操作後の比較で放射能に変化はみられなかった。又、酵素処理前後の尿試料ともSep-Pak C18カートリッジによる固相抽出で、固相中への保持は認められず、メタノール抽出でも良好な抽出率が得られなかった。

血漿及び尿試料とも各種溶媒を用いたTLCにおいて、放射能は原点付近に留まり、良好なプロフィールは得られなかった。したがって、本試験では血漿及び尿試料を直接、高速液体クロマトグラフィーで分析した。

表5に分析結果を示す。血漿及び尿中で検出された放射能のほとんど大部分は未変化の親化合物であった。血漿及び尿から                      が検出されたが、血漿中の濃度はグリホサート当量で1ppm以下であり、尿中では投与量の2%以下であった。この

は確認することができなかったが、  
と推定された。図1に想定代謝経路を示す。

以上の結果、<sup>14</sup>C-グリホサートをラットに単回経口投与すると、大部分が未変化の親化合物として尿及び糞中に急速に排泄され、呼気中には排泄されなかった。投与放射能の血中濃度は、投与後2~4時間で最高となり、第1相の血中濃度半減期は1.9~2.3時間であった。血中濃度最高到達時点における組織中の残留放射能は、腎臓に高濃度で検出されたが、いずれの組織においても急速に減衰し、168時間後には1ppm(グリホサート当量)未満となった。

図1. 想定代謝経路



本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はTAC普及会にある。

表1. 血中濃度の推移(ppmグリホサート当量)



表2. 尿・糞中累積排泄量及び合計排泄量 投与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TAC普及会にある。

表3. 組織中分布濃度(ppmグリホサート当量)


本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はTAC普及会にある。

表4. 組織中分布 投与放射能に対する割合(%)



表5. 代謝物の割合

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は TAC 普及会にある。

水稻における代謝試験

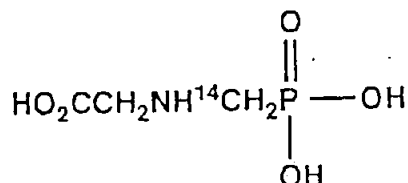
(資料 No.31)

試験機関：

報告書作成年： 1996 年、1997 年

供試標識化合物：<sup>14</sup>C-標識グリホサート

構造式；



化学名；N-(ホスホノメチル)グリシン

比放射能；

放射化学的純度；

非標識グリホサートの純度；

供試植物：稲(品種：キヌヒカリ)

栽培； 種子を育苗用培土に播種し、2~3 葉期まで育苗箱で栽培した。1/5000a ワグネルポットに沖積土を充填し、土壌表面をわずかに水が覆う程度に湛水し、3 日後に検体を処理した。処理 2 週間後に土壌を耕起し、水深を 3cm とした。1 週間後に代かきし、1 週間放置後、水稻苗をポットあたり 2 本ずつ移植し、温室内で栽培した。

方法：

試験溶液の調製；検体 38.882mg に蒸留水 12.96mL を加えて溶解し、濃度 3mg/mL の処理液を調製した。

処理部位及び方法；農薬使用量 300g/10a に相当する薬量で、1/5000a ワグネルポットに処理液 2mL を土壌処理した。

採取時期；下表のとおり、移植時(土壌処理 4 週間後)、移植の 4 週間後(検体処理 8 週間後)、出穂期(処理 99 日後)及び成熟期(処理 133 日後)に土壌、田面水及び植物試料を採取した。

根は土壌と分離せず、土壌として分析した。

移植時	土壌
移植 4 週間後	茎葉、土壌、田面水
出穂期	穂、茎葉、土壌、田面水
成熟期	玄米、モミ殻、わら、土壌

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は TAC 普及会にある。

#### 分析方法；

放射能測定：液体試料は直接、固形試料は燃焼後、液体シンチレーションカウンターで放射能を測定した。成熟期のわら及び玄米は、蒸留水を加えて氷冷下で磨砕し、懸濁液を吸引濾過した抽出液の放射能を測定した。玄米の抽出残渣は乾燥させ、燃焼法で測定した後、 $\alpha$ -アミラーゼ、 $\beta$ -グルコシダーゼ、セルラーゼ及びカルボキシペプチダーゼ A による酵素処理、酸処理及びアルカリ処理し、各抽出液及び抽出残渣の放射能を測定した。もみ殻は燃焼法で測定した。

土壌試料はアセトンで抽出した。抽出残渣は水酸化ナトリウムで抽出してフミン画分を分離し、抽出液には塩酸を添加して遠心分離してフミン酸及びフルボ酸に分画し、各画分の放射能を燃焼法で測定した。田面水は蒸留水で希釈して測定した。

代謝物の同定及び定量：土壌のフルボ酸画分及び成熟期のわら及び玄米の抽出液は、高速液体クロマトグラフィー(HPLC)で代謝物を分離した。各代謝物について、薄層クロマトグラフィー(TLC)上でオートラジオグラムを作成し、代謝物の領域とそれ以外の領域及びバックグラウンド(TLC 展開していない部分)に分画して各領域の放射線量(AU)を測定し、代謝物の割合を算出した。

結果： 表 1 から表 3 に各時点における試料中の放射能分布、表 4 には玄米の水抽出残渣を酵素、酸及びアルカリ処理で分画後の放射能分布を示す。

吸収及び移行；供試植物移植時の土壌には処理放射能の 81.1%が検出され、この内、フルボ酸画分が処理放射能の 71.7%、フミン酸画分が 0.9%、抽出残渣画分(フミン画分)は 8.3%であった。

移植から 4 週間後に、土壌処理した放射能は植物茎葉に 0.2%、土壌に 85.4%、田面水には 0.1%が検出され、植物による吸収及び田面水への放射能の移行はわずかであった。

出穂期(処理 99 日後)には、処理放射能の 1.5%が茎葉に検出されたが、穂では 0.1%未満で、植物による吸収はわずかであった。田面水への移行放射能は処理放射能の 0.1%未満で、75.7%は土壌から検出された。

成熟期には、玄米に 0.1%(残留濃度 0.152ppm)、わらに 0.3%、もみ殻に 0.1%未満で、土壌中に 77.9%が検出された。

代謝物の分析及び同定；HPLC による方法では同定することができず、TLC を用いて分析した結果、グリホサート以外に

と同定された。

玄米のアルカリ処理により

処理放射能の 0.1%未満が抽出されたが、微量であり、同定できなかった。玄米抽出残渣中放射能は大部分が糖類あるいは糖類抱合体として存在した。わらにグリホサートが同定され、濃度は 0.019ppm 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 TAC 普及会にある。

表 1. 各時点における放射能分布 (1) 処理放射能に対する割合(%)


表 2. 各時点における放射能分布 (2) 試料中の総放射能に対する割合(%)


表 3. 各時点における放射能分布 (3) 試料中の放射能濃度(ppm、グリホサート当量)


表 4. 玄米水抽出残渣試料を酵素、酸及びアルカリ処理で分画後の放射能分布


本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は TAC 普及会にある。

かんきつにおける代謝

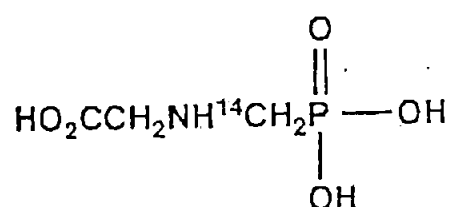
(資料 No.32)

試験機関：

報告書作成年： 1996 年

供試標識化合物： $^{14}\text{C}$ -標識グリホサート

構造式；



化学名；N-(ホスホノメチル)グリシン

比放射能；

放射化学的純度；

非標識グリホサートの純度；

供試植物；5年生柑橘(品種：温州)

栽培； 25L 容プラスチック製鉢を 5.1 m<sup>2</sup>の屋外温室に置いて栽培した。

方法；

試験溶液の調製；検体 49.56mg に蒸留水 16.52mL を加えて溶解し、濃度 3mg/mL の処理液を調製した。

処理部位及び方法；ビーカーに入れた赤玉土 200ml に、農薬使用量 300g/10a に相当する処理液 7mL を吸着させ、供試植物のポット土壌表面に重層した。試験は2連とした。

採取時期；処理2週間後、4週間後及び成熟期(処理8週間後)に、各ポットについて葉5枚及び果実2個を採取し、果実は外皮と果肉に分けた。処理直後の赤玉土からも土壌試料を採取し、直ちに抽出して添加回収率を測定した。

分析； 土壌試料は 0.5M 水酸化ナトリウムで2回振とう抽出した。植物試料(葉、外皮及び果肉)は水を加えてホモジナイズし、遠心分離して抽出液と残渣に分けた。

放射能測定；液体試料中の放射能は直接、液体シンチレーションカウンターで測定し、固体試料については燃焼後測定した。

結果； 概要を表1に示す。

処理直後の土壌を 0.5M 水酸化ナトリウムで抽出したところ、処理量の約 63%が抽出され、処理量の約 32%は既に残渣に存在し、グリホサートは土壌処理後、速やか

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は TAC 普及会にある。

に土壤に吸着されると考えられた。土壤からの放射能総回収率は 94.9%であった。

処理後の植物試料(葉、外皮及び果肉)から検出された放射能は処理量の 0.1%以下で、  
処理後の時間が経過しても残留放射能は増加せず、土壤に処理したグリホサートは、  
かんきつの地上部にはほとんど吸収されないと考えられた。

表 1. 水酸化ナトリウム抽出後の放射能分布



本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は TAC 普及会にある。

キャベツにおける代謝試験

(資料 No.32-2)

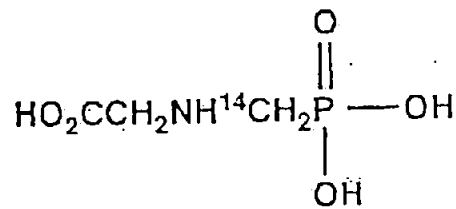
試験機関：

[GLP 対応]

報告書作成年： 2006 年

供試標識化合物：<sup>14</sup>C-標識グリホサート

化学構造；



標識位置；ホスホノメチル部

標識位置の設定理由；

化学名；N-(ホスホノメチル)グリシン

比放射能；

放射化学的純度；

非標識化合物の純度；

供試植物；キャベツ(品種 Stonehead F1：英国 BBCH 基準の成長段階 13~15)

栽培条件；プラスチック製容器(75×55cm、深さ 30cm)に砂壤土を入れ、検体を土壌処理してから 7 日後に苗を移植した。

方法；

試験溶液の調製；標識検体 20.8mg を 4ml の水に溶解し、この溶液を非標識グリホサート 409.19mg と共に製剤補助成分混合物 0.8386g に加えて超音波処理後、水で希釈して試験溶液 275mL を調製した。

処理方法；容器内の土壌に、有効成分 2kg/ha に相当する量の試験溶液を散布処理した。

採取時期；以下の時期に供試植物各 2 個について葉及び根試料を採取した。

- |          |              |
|----------|--------------|
| ① 生育期 I  | BBCH 成長段階 45 |
| ② 生育期 II | BBCH 成長段階 47 |
| ③ 収穫期    | BBCH 成長段階 49 |

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は TAC 普及会にある。

分析方法；

放射能測定：試料をホモジナイズして一部を燃焼し、シンチレーターを加えて自動クエンチ補正付き液体シンチレーションカウンターで放射能を測定した。各抽出液は減圧下で濃縮後、シンチレーターを加えて測定し、抽出残渣は燃焼後、測定した。

抽出：ホモジナイズした葉及び根試料にアセトニトリルを加えて超音波処理後、遠心分離して抽出、次いで、[アセトニトリル：水(1:1)]混合液及び水酸化アンモニウム(0.25M)及びリン酸二水素カリウム(0.1M)を含有する水性緩衝液で抽出した。さらに、生育期Ⅱ及び収穫期の試料については、残渣を 0.2M 酢酸緩衝液(pH5)に懸濁して 37°C、18 時間、β-グルコシダーゼ処理した。処理後、遠心分離して上澄を分析用試料とし、残渣は 0.1M 塩酸、0.1M 水酸化ナトリウム、6M 塩酸、2M 水酸化ナトリウムで順次処理し、溶媒を除去後、酢酸エチルで分配して水相及び有機相に分画した。

代謝物同定：各採取時期における試料部位別の抽出液をプールして、254nm に設定した吸光度検出器及び放射能検出器付きの高速液体クロマトグラフィー(HPLC)で同定し、展開溶媒系[エタノール：水：15N 水酸化アンモニウム：トリクロロ酢酸：酢酸(65：35：2.5：3.5：2)]を用いる薄層クロマトグラフィー(TLC)で確認した。

結果： 各採取時期の残留放射能濃度及び抽出後の放射能分布を表 1 に示す。

生育期Ⅰ、生育期Ⅱ及び収穫期の葉における残留放射能濃度はそれぞれ 0.0841ppm、0.0874ppm、0.0637ppm(グリホサート当量)であった。各時期に採取した葉の放射能は 40%以上がアセトニトリル及び水性緩衝液で抽出された。さらに抽出処理を続けた生育期Ⅱ及び収穫期の葉及び根の残留放射能は、合計 90%以上が溶媒で抽出され、非抽出性放射能は葉で 5.4%以下、根で 8.5%以下であった。

表 2 に代謝物分布を示す。

図 1 に想定代謝経路を示す。

土壌処理後、キャベツに吸収されたグリホサートは、  
あるいは直接、極性化合物に代謝された。

經由

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は TAC 普及会にある。

表 1. 溶媒により抽出された放射能



表 2. 代謝物の分布

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は TAC 普及会にある。

図 1. キャベツ植物における AK-01 の想定分解経路

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は TAC 普及会にある。

好氣的土壤中動態試験

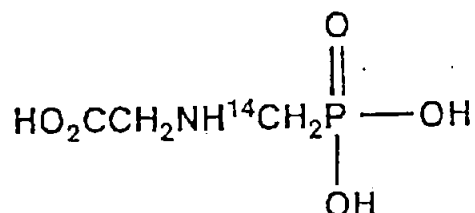
(資料 No.33)

試験機関：

報告書作成年： 1992 年

供試標識化合物： $^{14}\text{C}$ -標識グリホサート

化学構造；



標識位置；ホスホノメチル部

標識位置の設定理由；

化学名；N-(ホスホノメチル)グリシン

比放射能；

放射化学的純度；

供試土壌：茨城県農業試験場の火山灰埴壌土(水戸土壌)及び日本植物調節剤研究協会研究所の鉾物質軽埴土(藤代土壌)を用いた。これら土壌の特性を以下に示す。

特性	火山灰埴壌土	鉾物質軽埴土
粗砂 0.2 - 2.0mm (%)	30.5	3.4
細砂 0.02 - 0.2mm (%)	22.9	13.5
シルト 0.002 - 0.02mm (%)	24.9	39.0
粘土 0.002mm 以下 (%)	21.7	44.1
有機炭素 (%)	6.14	2.38
陽イオン交換容量 (me/100g)	28.3	24.2
pH	6.1	6.2
リン酸吸収係数	1970	1110

供試土壌 30g(乾土換算)を内径 4cm のフラスコに入れ、最大容水量の 50%となるように蒸留水を加えて容器をアルミ箔で覆い、暗所 25°C で 2 週間予備培養した。同様に調製した 2 土壌試料をオートクレーブで 110°C、1 日 30 分間、連続 3 日間滅菌し、滅菌土壌とした。

方法：

試験溶液の調製；標識検体を蒸留水に溶解し、100 $\mu\text{g}/\text{mL}$  の試験溶液を調製した。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は TAC 普及会にある。

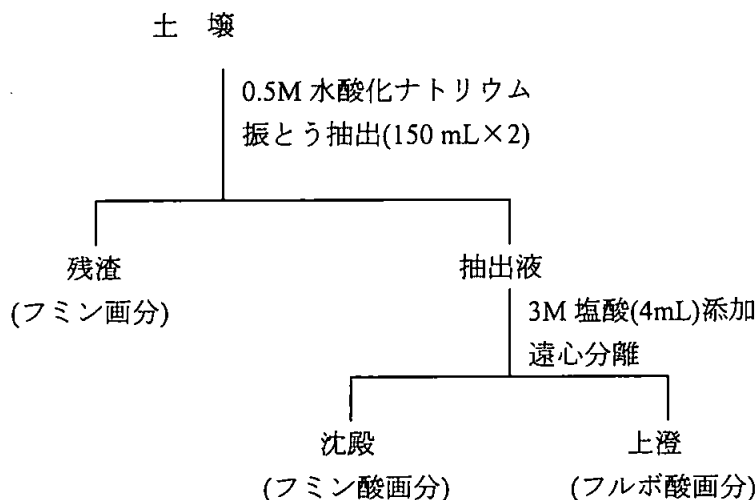
処理方法；農薬の畑地使用量 300g(有効成分)/10a に相当する 3ppm となるように、試験溶液 0.9mL を容器内土壌 30g に混和して暗所、25℃で 28 日間培養した。

培養期間中、ポリウレタンフォーム及び 20%モノエタノールアミン水溶液を充填したトラップ 2 本を設置して通気し、揮発性の  $^{14}\text{C}$ -標識化合物及び  $^{14}\text{C}$ -標識二酸化炭素を捕集した。

採取時期；土壌試料は処理直後、1、2、3、5、7、14 及び 28 日後に採取した。

分析方法；

放射性成分の抽出及び分画；以下の操作で抽出及び分画した。



放射能測定：フルボ酸画分は直接、フミン画分は燃焼後、フミン酸画分は蒸留水を加えた液を用いて液体シンチレーションカウンター(LSC)で測定した。ポリウレタンフォームに捕集した揮発性成分はトルエンで抽出して LSC で測定し、モノエタノールアミン水溶液についても LSC で測定した。

代謝物の分析：各画分を高速液体クロマトグラフィー(HPLC)で分析した。

半減期；最小二乗法で直線回帰から消失速度定数(ke)を求め、 $t_{1/2}=0.693/ke$  を用いて算出した。

結果： 各供試土壌での半減期を表 1 に示す。非滅菌土壌ではグリホサートは経時的に減少し、滅菌土壌では非滅菌土壌と比較して、火山灰埴壌土及び鉍物質埴壌土のいずれにおいても分解速度は遅かった。

表 1. 半減期

土 壤	火山灰埴壌土	鉍物質埴壌土
非滅菌	202 日	81.2 日
滅菌	212 日	370 日

滅菌土壌中の各画分放射能分布を表 2 及び表 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 TAC 普及会にある。

火山灰埴壤土及び鉍物質軽埴土のいずれも、処理放射能の大部分がフルボ酸画分に検出された。鉍物質軽埴土では、フルボ酸画分の放射能が経時的に減少したが、火山灰埴壤土においては処理後 28 日まで変動がみられなかった。滅菌土壌においても、処理放射能の大部分がフルボ酸画分に検出されたが、28 日間にほとんど変動がみられなかった。

いずれの土壌でも  $^{14}\text{C}$ -標識二酸化炭素の発生はわずかであったが、火山灰埴壤土と比較して鉍物質軽埴土では発生量がやや多かった。滅菌土壌では二酸化炭素の発生は全く検出されなかった。 $^{14}\text{C}$ -標識揮発性有機物は検出されなかった。

火山灰埴壤土及び鉍物質軽埴土のいずれにおいても、フルボ酸画分中の放射能のほとんどは未変化のグリホサートであった。火山灰埴壤土では

が検出されたが、鉍物質軽埴土には検出されなかった。

の生成は鉍物質軽埴土の非滅菌土壌でやや高く、経時的な増加がみられ、微生物による分解物と考えられた。又、HPLC における保持時間から、

と考えられ、ラットに検出されたと同一化合物であろうと

推定された。一方、は火山灰埴壤土にのみ検出され、試験期間中ほぼ一定の割合であった。有機リン化合物はフルボ酸-金属と複合体を形成することが知られていることから、は分解物ではなく、未変化の親化合物と土壌成分との複合体であろうと推定された。

以上、非滅菌畑土壌中におけるグリホサートの分解は緩慢で、主に土壌中のフルボ酸画分に吸着されて残留するものと考えられる。

表 2. 非滅菌土壌における放射能分布：処理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 TAC 普及会にある。

表 3. 滅菌土壌における放射能分布：処理放射能に対する割合(%)



表 4. 放射能濃度：ppm(グリホサート当量)



本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は TAC 普及会にある。

好氣的湛水土壌中動態試験

(資料 No.33-2)

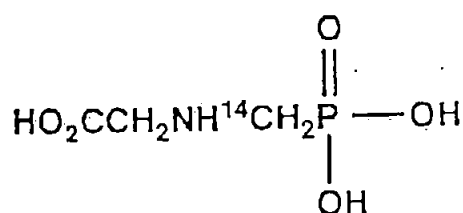
試験機関：

[GLP 対応]

報告書作成年：2005 年

供試標識化合物： $^{14}\text{C}$ -標識グリホサート

化学構造；



標識位置；ホスホノメチル部

標識位置の設定理由；

化学名；N-(ホスホノメチル)グリシン

比放射能；

放射化学的純度；

非標識化合物の純度；

供試土壌；千葉県の水田土壌、砂質埴壤土、pH 6.2(1:5 水中)

有機炭素含有量 2.2%、砂 54.24%、シルト 22.24%、粘土 23.52%

供試標識化合物処理前に 6 週間予備培養した。

方法；

容器及び土壌充填；供試土壌 137.5g(乾土重 100g)を 500mL ガラス製容器内に深さ 5cm と  
なるよう充填し、蒸留水 210ml を加えて約 5cm の水層を形成した。滅菌土壌試料は、  
土壌を 115°C、0.75 時間/日で 3 日間連続オートクレーブ処理した後、1 回オートク  
レーブ処理した蒸留水を加えて調製した。

揮発性物質の捕集；揮発性の有機化合物を捕集するため、ポリウレタンフォームの栓を土壌  
容器上部に設置し、これを通過した気流を、土壌容器に接続した空容器、ジエチレ  
ングリコールモノメチルエーテル入りトラップ、二酸化炭素ガスを捕集する 1M 水  
酸化カリウム溶液(フェノールフタレイン添加)入りトラップ 2 個を順次通過させた。

試験溶液の調製及び処理；供試標識化合物の水溶液を調製し、農薬の使用量 2kg(有効成分)  
/ha に相当する量を試験容器水層の表面に均一に処理した。

培養； 処理後、供試土壌を暗所、25±2°C で最長 178 日間培養した。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は TAC 普及会にある。

採取時期；非滅菌土壌は処理直後、3、7、14、30、59、119 及び 178 日後に、滅菌土壌は処理直後、7、14 及び 30 日後に試料を採取した。

揮発性成分捕集用のポリウレタンフォーム栓は処理後 3、7 及び 14 日に採取して新品と交換し、各トラップの捕集剤は、処理後 45 日までは週 1 回、以降は 2 週間に 1 回採取した。

分析方法；

抽出：土壌は 0.25M 水酸化アンモニウム及び 0.1M リン酸二水素カリウム水溶液で 6 回抽出した。さらに、50°C で 60 分間超音波処理後、室温下で同じ抽出溶媒により 15 分間振とうし、次に 50°C で 5 時間超音波処理後、室温下で同じ抽出溶媒により 2 時間振とうして抽出した。ポリウレタンフォーム栓も土壌及び溶媒で抽出した。

放射能測定；自動クエンチ補正付き液体シンチレーションカウンター(LSC)で測定した。抽出残渣は、燃焼し、燃焼生成物を CO<sub>2</sub> 吸着剤及びシンチレーターに吸着させた。バックグラウンド値の 2 倍を検出限界とした。

分析：各抽出液試料及び土壌表面水試料について、放射能検出器及び吸光度検出器を用いる高速液体クロマトグラフィー(HPLC)で測定し、標準品とのクロマトグラフィーで同定した。又、薄層クロマトグラフィー(TLC)によりグリホサートを確認した。

抽出残渣については、処理後 30 日、119 日及び 178 日に採取した試料の残渣をフミン、フミン酸及びフルボ酸に分画した。

半減期；以下の計算式を用いて半減期(DT<sub>50</sub> 値)及び 90% 減衰期(DT<sub>90</sub> 値)を算出した。

$$DT_{50} = \frac{\ln 2}{k} \quad DT_{90} = \frac{\ln 10}{k}$$

k：速度定数

結果：表 1 に各抽出画分の放射能分布、表 2 に土壌及び表面水中の代謝物分布、表 3 に半減期及び 90% 減衰期を示す。

非滅菌土壌に処理した放射能の回収率は 178 日間の各時点でいずれも 96.3% 以上であった。水酸化アンモニウム及びリン酸二水素カリウム水溶液により抽出された放射能は処理 7 日後が最大(処理放射能に対して合計 68.6%)で、以後、減少して 178 日後には合計 23.8% となった。表面水の放射能は処理直後の 104.9% から急速に減少した。一方、<sup>14</sup>C-二酸化炭素は時間の経過につれて増加し、178 日後に処理放射能の 60.0% に達した。抽出残渣を分画した結果、処理放射能に対してフルボ酸画分に最大 15.8%、フミン画分には最大 6.9% が検出された。

滅菌土壌の放射能回収率は 93.8% 以上で、処理 7 日後に処理放射能の最大 80.3% が溶媒で抽出された。非滅菌土壌と比較して揮発性物質の割合は極めて低く、<sup>14</sup>C-二酸化炭素が最大 2.5% で、揮発性有機物は検出されなかった。

土壌抽出液及び表面水を HPLC で分析した結果、非滅菌土壌試料におけるグリホサ

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は TAC 普及会にある。

ートは処理後急速に減少し、土壌及び表面水中の合計が 30 日後に処理放射能の 18.4%、処理 178 日後には 5.2%となった。滅菌土壌ではグリホサートの減少は緩やかで、土壌及び表面水中の合計量として、処理 30 日後においても 60.6%が残存した。

非滅菌土壌中の主な代謝物は で、処理 30 日後に土壌及び表面水中の合計で となった。滅菌土壌においても が主な代謝物で、処理 14 日後に最大となり、処理放射能の に達した。

これ以外に HPLC 保持時間が が検出され、さらに、少量の が検出されたが、いずれも処理放射能の であった。

推定半減期は非滅菌土壌で 12 日、滅菌土壌では 34 日であった。

主な推定代謝経路を図 1 に示す。

非滅菌土壌に処理したグリホサートの代謝経路は、 に代謝され、さらに二酸化炭素となる経路及びグリホサートから直接、二酸化炭素に分解される経路が考えられた。

表 1. 抽出画分の放射能分布：処理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 TAC 普及会にある。

表 2. 代謝物の分布：処理放射能に対する割合(%)



表 3. 半減期及び 90%減衰期

項目	非滅菌土壌			滅菌土壌	
	表面水	土壌	全体	表面水	全体
一次回帰定数 (k/日)	0.4189	0.0763	0.0557	0.2508	0.0204
半減期 (DT <sub>50</sub> , 日)	1.7	9.1	12	2.8	34
90%減衰期 (DT <sub>90</sub> , 日)	5.5	30	41	9.2	113
相関係数 r <sup>2</sup>	0.995	0.971	0.982	0.899	0.918

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は TAC 普及会にある。

図 1. 想定代謝経路

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は TAC 普及会にある。

好氣的湛水土壤中代謝物の同定

(資料 No.34)

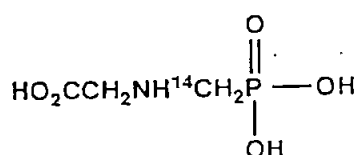
試験機関：

[GLP 対応]

報告書作成年： 1997 年

供試標識化合物：<sup>14</sup>C-標識グリホサート

化学構造；



標識位置；ホスホノメチル部

化学名；N-(ホスホノメチル)グリシン

比放射能；

放射化学的純度；

非標識化合物の純度；

供試土壌：日本で採取した砂壤土。土壌の特性を以下に示す。

砂	(%)	28.0
シルト	(%)	35.4
粘土	(%)	36.6
有機炭素含有率	(%)	2.60
陽イオン交換容量(meq/100g)		21.5
pH[水]		6.7
pH[KCl]		6.0
リン酸吸収係数		820

供試土壌 323.66g(乾土換算 240.0g)を 1L 容のフラスコ容器に入れ、最大容水量の 50% となるように蒸留水を加えて暗所の 20℃で 4 日間予備培養した。

方法：

試験溶液の調製；供試標識化合物 1371μCi を蒸留水 5mL に溶解した。

処理方法；乾土換算で 3mg/kg となるように、試験溶液 398μL を各容器の土壌表面に処理した。

揮発性成分を捕集するため、捕集剤 1M 水酸化カリウム及びシリカゲルをそれぞれ充填したトラップを容器に接続した。捕集液は、週 1 回交換した。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は TAC 普及会にある。

培養； 処理後、暗所、約 21℃で 20 日間培養後、純水を加えて水深を 3cm に維持し、供試標識化合物処理後 60 日間培養した。

採取時期； 処理 24 日後に 1 容器、処理 60 日後に 5 容器から土壌を採取した。

抽出； 土壌表面の水を除去後、土壌に[0.25M 水酸化アンモニウム+0.1M 2 水素リン酸カリ]水溶液を加えて 4 回振とう抽出した。

放射能測定； 土壌表面水、抽出液、高速液体クロマトグラフィー(HPLC)で分画した溶出液及び揮発性成分捕集剤の放射能を自動クウェンチ補正付きの液体シンチレーションカウンターで測定した。

分析； 抽出液中の代謝物を HPLC 及び薄層クロマトグラフィー(TLC)で分析した。

結果； 土壌抽出液の放射能は、処理放射能に対して、処理 24 日後に 53.1%、処理 60 日後には 37.3%であった。土壌表面水中の放射能は処理 24 日後及び 60 日後にそれぞれ 0.04%及び 0.03%であった。捕集された揮発性成分は二酸化炭素であると推定され、処理 24 日後及び 60 日後にそれぞれ 12.0 及び 14.2%であった。

表 1 に抽出液から分画された各放射性成分の分布を示す。

土壌抽出液を分析した結果、未変化のグリホサートは処理 24 日後に処理放射能の 41.7%、60 日後には 27.5%で、いずれの時期にも抽出された放射能の 70%以上を占めた。

未同定代謝物 は、ニンヒドリンを用いた検出方法による順相 TLC において標準品とのコクロマトグラフィーを実施した結果、と同定された。この代謝物は、処理 24 日後及び 60 日後にそれぞれ処理放射能の 8.0%及び 7.8%、抽出された放射能の 15.0%及び 20.9%で、土壌中の主な代謝物であった。

これ以外に 代謝物が検出されたが、いずれも処理放射能の 4.1%以下、抽出された総放射能の 2.2%以下であった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は TAC 普及会にある。

表 1. 放射性成分の分布



本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は TAC 普及会にある。

## 2. 加水分解、水中光分解及び土壌吸着

緩衝液中における加水分解性試験

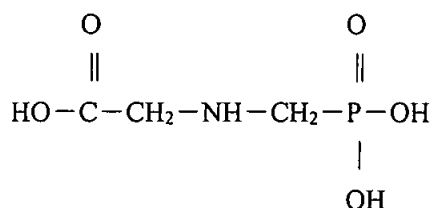
(資料 No.36)

試験機関：

報告書作成年： 1991 年

供試化合物：グリホサート(非標識化合物)

化学構造；



化学名；N-(ホスホノメチル)グリシン

純度；

供試水溶液：

緩衝液の調製及び pH

pH4 緩衝液：[0.2M/L 酢酸ナトリウム 36mL + 0.2M/L 酢酸 164mL] 200mL 定容

pH7 緩衝液：[0.1M/L 水酸化ナトリウム 148mL + 0.1M/L リン酸一カリウム 250mL]  
500mL 定容

pH9 緩衝液：[0.1M/L 水酸化ナトリウム 107mL + 0.2M/L 塩化カリウム 125mL  
+0.2M/L ホウ酸 125mL] 500mL 定容

試験方法：

試験濃度；供試化合物 5000mg/L 水溶液 1mL を各緩衝液に添加し、100mL に定容して、これを 50mL ずつ分取して 2 連の試料とした。

試験温度；50±1°C

試験期間；5 日間振とう

分析方法；イオンクロマトグラフィー

結果：

pH	グリホサート遊離酸残留量(%)		
	I	II	平均
4	102	98.7	100.4
7	101	106	103.5
9	98.9	96.6	97.8

以上の結果より、グリホサート遊離酸はいずれの pH においても 5 日後の残留率は 90% 以上であり、試験に用いた緩衝液中で安定と判断される。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は TAC 普及会にある。

水中光分解動態試験

(資料 No.35)

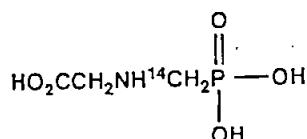
試験機関：

[GLP 対応]

報告書作成年： 2006 年

供試標識化合物：<sup>14</sup>C-標識グリホサート

化学構造；



標識位置；ホスホノメチル部

化学名；N-(ホスホノメチル)グリシン

比放射能；

放射化学的純度；

非標識化合物の純度；

供試水：蒸留水及び自然水(河川水)

蒸留水

滅菌；121°Cで15分間オートクレーブ処理

pH；7.49

自然水

採取場所；英国 Cambridgeshire, Huntingdon 所在の River Great Ouse  
212µm フィルターで固形物を除去

採取年月日；2004年8月26日

滅菌；滅菌メンブランフィルターによりろ過

pH；7.92(フィルター通過前)

光源：キセノンアーク光源を装着した Suntest 加速暴露装置を使用。鏡及び光学フィルターにより波長 290nm 未満の光線を除去した。

光強度：自然水 51.65W/m<sup>2</sup>、蒸留水 44.81 W/m<sup>2</sup> (波長範囲 300~400nm)

試験方法：蒸留水を用いて濃度 10mg/L、3日間光照射した予備試験では、放射能回収率は 99.1% 以上、1日後及び3日後の<sup>14</sup>C-標識グリホサートはそれぞれ処理放射能の 88.2% 及び 81.7% に減少し、3日後には揮発性放射能が 0.1% 検出された。

これらの結果に基づき本試験では以下のとおり設定した。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は TAC 普及会にある。

溶解補助剤；供試標識化合物の保存用水溶液(濃度 308.0 $\mu\text{g}/\text{mL}$ )と非標識グリホサートの水溶液(濃度 2.246 $\text{mg}/\text{mL}$ )を同容量混合して放射能を希釈し、これに水を加えて定容とした。溶解補助剤は使用しなかった。

試験濃度；自然水及び蒸留水いずれも水溶解度 11.6 $\text{g}/\text{L}$  の半分以下の 10 $\text{mg}/\text{L}$  とした。

試験温度；25 $\pm$ 2 $^{\circ}\text{C}$

試験期間；7 日間

試料採取時期；供試化合物処理直後(暗対照試料のみ)、1、2、3、4、5 及び 7 日後あるいは 1、2、3、5、6 及び 7 日後

試験容器の材質・形状；

内径 2.5 $\text{cm}$ 、高さ 8.5 $\text{cm}$ 、容積約 50 $\text{mL}$  のホウケイ酸ガラス製円筒容器

揮発性放射能捕集装置；5 日及び 7 日後に試料を採取する試験容器には、揮発性有機物を捕集するジエチレングリコールモノメチルエーテル入りトラップ 1 基及び二酸化炭素を捕集する 1 $\text{M}$  水酸化カリウム溶液入りトラップ 2 基を、空のトラップに続けて繋いだ。

分析方法；

放射能測定；液体シンチレーションカウンタ(LSC)で測定した。バックグラウンドの 2 倍を正確な測定の限界とした。

同定；高性能液体クロマトグラフィー(HPLC)を用いてカラム溶出液画分を集めて放射性成分を分析した。又、薄層クロマトグラフィー(TLC)で既存の標準品と比較して同定の結果を確認した。

半減期の算定；供試化合物濃度の推移は一次カイネティックに適合するとみなして減衰線を作成し、以下の式から分解速度を計算した。

$$C=C_0e^{-kt} \rightarrow \ln C=\ln C_0-kt$$

C：時間 t におけるグリホサートの処理放射能に対する%

C<sub>0</sub>：0 時のグリホサートの処理放射能に対する%

k：速度定数

t：経過時間

時間 t に対する lnC をプロットして直線の勾配 -k を求め、DT<sub>50</sub> 値及び DT<sub>90</sub> 値を次式から計算した。

$$DT_{50} = \ln 2 / k$$

$$DT_{90} = \ln 10 / k$$

結果：放射能回収率を表 1 に、放射性分解物の割合を表 2-1 及び表 2-2 に、推定半減期を表 3 に示す。

放射能回収率；光照射した蒸留水及び自然水試料の放射能回収率は、揮発性成分を含めてそ

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は TAC 普及会にある。

それぞれ 98.1~101.0%、97.3~99.5%、暗対照試料ではそれぞれ 98.3~101.1%、98.5~100.1 の範囲内であった。

揮発性成分；処理 5 日後及び 7 日後の光照射試料から微量の揮発性有機物及び二酸化炭素が検出された。暗対照試料から二酸化炭素が処理放射能の 0.1% 検出されたが揮発性有機物は検出されなかった。

放射性成分の分布；7 日間光照射後の蒸留水には、グリホサートが処理放射能の 87.6%、  
検出され  
た。5 日間光照射した時点では 認められたが、7 日後には  
検出限界以下となった。

自然水では、7 日間の光照射後にグリホサートは処理放射能の 36.1% に減少し、

検出された。これらの他、処理 3~5 日後に 検出  
された。

暗対照の蒸留水及び自然水におけるグリホサートはほとんど減少しなかった。

自然水の光照射によって生じた について化学的特徴付けを  
試みたが、いずれも同定には至らなかった。

分解経路；図 1 に推定分解経路を示す。グリホサートは水中で光照射を受けると  
を経て極性化合物及び二酸化炭素に分解されると推定された。

半減期；蒸留水及び自然水中の光分解半減期は、人工光源ではそれぞれ 862 時間、115 時間  
で、北緯 35 度の春季東京における太陽光に換算すると、207 日及び 31.9 日であった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は TAC 普及会にある。

表 1. 放射能回収率：処理放射能に対する割合(%)

照射条件	試料採取時期(日)	蒸留水				自然水			
		水	揮発性物質		合計	水	揮発性物質		合計
			有機物	CO <sub>2</sub>			有機物	CO <sub>2</sub>	
光照射	1	99.0	-	-	99.0	99.2	-	-	99.2
	2	101.0	-	-	101.0	99.5	-	-	99.5
	3	98.1	-	-	98.1	97.3	-	-	97.3
	4	100.7	-	-	100.7	98.0	-	-	98.0
	5	98.6	nd**	0.1	98.7	97.0	0.9	0.3	98.2
	7	99.6	0.1	0.3	100.0	96.5	1.7	0.7	98.9
暗対照	0	101.1	-	-	101.1	100.1	-	-	100.1
	1	98.3	-	-	98.3	99.3	-	-	99.3
	2	99.3	-	-	99.3	98.5	-	-	98.5
	3	100.3	-	-	100.3	100.0	-	-	100.0
	4	100.3	-	-	100.3	98.6	-	-	98.6
	5	98.9	nd	0.1	99.0	100.0	nd	0.1	100.1
	7	100.1	nd	0.1	100.2	99.6	nd	0.2	99.8

- : 分析せず。試験容器に揮発性物質捕集トラップを接続しなかった。 \*\*nd : 検出せず。

表 2-1. 蒸留水中放射性分解物の割合：処理放射能に対する割合(%)

供試水	照射条件	採取時期(日)	グリホサート						
蒸留水	光照射	1	97.0						
		2	95.4						
		3	91.3						
		5	88.5						
		6	86.8						
		7	87.6						
	暗対照	0	97.7						
		1	97.0						
		2	98.2						
		3	97.9						
		5	98.3						
		6	95.7						
		7	99.4						

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は TAC 普及会にある。

表 2-2. 自然水中放射性分解物の割合：処理放射能に対する割合(%)

供試水	照射条件	採取時期 (日)	グリホサート						
自然水	光照射	1	86.4						
		2	69.8						
		3	58.3						
		4	49.0						
		5	48.0						
		7	36.1						
	暗対照	0	97.1						
		1	97.5						
		2	97.7						
		3	98.7						
		4	95.9						
		5	98.0						
		7	98.0						

表 3. 推定半減期

供試水	速度定数 k/h	半減期 DT <sub>50</sub>		90%減衰期 DT <sub>90</sub>		相関係数 r <sup>2</sup>
		人工光源	太陽光換算	人工光源	太陽光換算	
蒸留水	0.0008	862 時間	207 日	2865 時間	688 日	0.857
自然水	0.0060	115 時間	31.9 日	383 時間	106 日	0.973

図 1. 推定分解経路

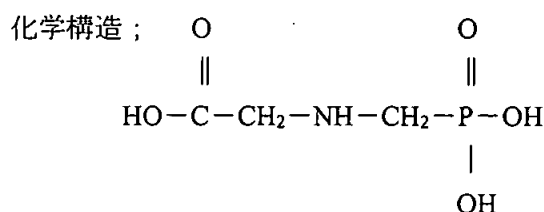
本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は TAC 普及会にある。

土壌吸着試験 (資料 No.37)

試験機関:

報告書作成年: 1992 年

供試化合物: グリホサート遊離酸(非標識化合物)



化学名; N-(ホスホノメチル)グリシン

純度;

供試土壌: 特性を下表に示す。

採取場所		茨城(牛久)	和歌山	岡山	熊本
土壌群名		褐色火山灰 土壌	洪積埴壤土	中粗粒黄色土 大代統	表層多腐植質 黒ボク土
土 性	砂 (%)	26.2	41.7	60.5	30.6
	シルト (%)	50.9	29.4	17.5	49.7
	粘土 (%)	22.9	28.9	22.0	19.7
有機炭素含有率(%)		3.61	1.75	0.69	12.9
pH	水	7.7	6.0	6.7	7.4
	KCl	6.9	5.2	5.5	6.7
陽イオン交換容量 (me/100g)		21.4	11.0	8.7	49.9
リン酸吸収係数		2000	410	350	1850
粘土鉱物の種類		アロフェン パーミキュライト	カオリン鉱物 パーミキュライト	ハロサイト	アロフェン パーミキュライト

試験方法: 予備試験として、所定量の乾燥土壌を 50mL 容の遠心管に計りとり、水 5mL を加えて一夜放置した。グリホサート遊離酸の標準品水溶液(1000 $\mu$ m/mL)と 0.01M 塩化カルシウム水溶液の混合液を調製して試験溶液とし、供試土壌に試験溶液 20mL を添加した。対照とした容器には土壌を入れず、0.01M 塩化カルシウム水溶液 20mL 及び試験溶液を入れた。試験容器を 25°C、16 時間振とう後、3000rpm で 30 分間遠心分離した。所定量の上澄を酢酸セルロースフィルターでろ過し、イオンクロマトグラフィでグリホサートを定量した。

予備試験の結果により、本試験の方法を決定することにした。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はTAC普及会にある。

結果： 予備試験の結果を下表に示す。

土壌	グリホサート濃度( $\mu\text{g}/\text{ml}$ )
対照(土壌なし)	6.41
茨城(牛久)土壌	nd*
和歌山土壌	nd
岡山土壌	nd
熊本土壌	nd

\*nd：検出限界( $0.1\mu\text{g}/\text{mL}$ )未満

いずれの土壌においても、16時間振とう後の上澄液中にグリホサートは検出されなかった。これはグリホサートの土壌吸着性が極めて高いことによるものと考えられ、これ以上の試験実施は不可能で、土壌吸着平衡定数は求められなかった。



本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は TAC 普及会にある。

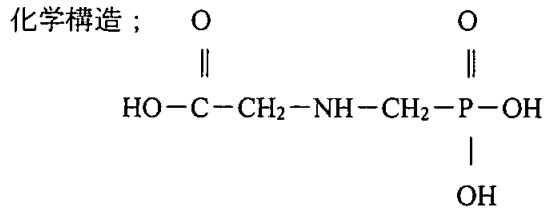
土壌吸着試験

(資料 No.38)

試験機関：

報告書作成年： 2004 年

供試化合物：グリホサート遊離酸(非標識化合物)



化学名；N-(ホスホノメチル)グリシン

純度；

供試土壌：

採取場所		宮城県宮崎郡佐土原町	茨城県牛久市結束町
土壌群		砂丘未熟土	黒ボク土(火山灰)
土性	砂 (%)	91.1	33.5
	シルト (%)	5.4	47.0
	粘土 (%)	3.5	19.5
有機炭素含有率 (%)		0.63	5.28
pH	水	5.9	6.3
	0.01M CaCl <sub>2</sub>	5.5	5.8
陽イオン交換容量 (me100g)		5.2	31.5
リン酸吸収係数		370	2040
粘土鉱物の種類		アロフェン	緑泥石(クロライド)
OECD 土壌 No.		5	2
土壌含水率 (%)		0.837	8.74

試験方法：供試土壌の調整、試験溶液の作製、土壌/水比及び試験条件を以下に示す。

供試土壌		宮崎土壌		茨城土壌	
[土壌：水(溶液)]比 (w/v)		1：5	1：25	1：50	1：100
容器内	土壌 (g)	2	2	0.5	1
	0.01M 塩化カルシウム溶液 (mL)	9	45	45	45
	試験原液 (mL)	1	5	5	5
試験原液の濃度 (mg/L 0.01M 塩化カルシウム溶液)		6310		5880	
温度 (°C)		25 ± 1			

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は TAC 普及会にある。

供試化合物を塩化カルシウム溶液(0.01M)に添加して試験原液を作製した。

土壌への吸着率が 20%以上と予測された濃度を含めた 2 通りの土壌/溶液比を設定した。供試土壌に塩化カルシウム溶液を加えて約 16 時間振とうして供試土壌を調整した後、試験原液を添加して試験液を調製し、24 時間振とうした。

塩化カルシウム溶液に試験原液を添加した土壌抜き液を対照とし、供試化合物を含まない塩化カルシウム溶液と土壌の混合物をブランク試料とした。

試験液を 1000g、20 分間遠心分離し、高速液体クロマトグラフィー(HPLC)で分析した。

物質収支の割合は、24 時間振とう後の試験液中供試化合物の量と土壌に吸着された供試化合物量の合計を試験原液添加量で除して算出した。

結果：

#### 吸着試験の結果

供試土壌	[土壌：水]比	吸着率(%)	分配係数 Kd	Koc	物質収支(%)
宮崎土壌	1：5	87.4	35.2	5580	94.7
	1：25	26.3	9.02	1430	98.6
茨城土壌	1：50	82.9	265	5020	93.4
	1：100	58.2	153	2890	91.2

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はTAC普及会にある。

代謝分解の概要

代謝分解物			A (親化合物)										
動物	ラット低用量	尿	24時間 雄	94.7									
			雌	94.7									
		血漿	2時間後 雄	87.2									
			雌	83.3									
		臓器	肝臓	2時間後 雄									
				雌									
		腎臓	2時間後 雄										
			雌										
		皮膚	2時間後 雄										
			雌										
血液	2時間後 雄												
	雌												
骨格筋	2時間後 雄												
	雌												
植物	イネ	茎葉	処理 99日後										
			処理133日後	6.8									
		玄米	処理133日後	9.3									
	かんきつ	葉	処理2週後										
			処理8週後										
		外皮	処理2週後										
			処理8週後										
		果肉	処理2週後										
			処理4週後										
	処理8週後												
	キャベツ	葉	生育期 I	3.9									
			生育期 II	3.2									
			収穫期	3.5									
		根	処理2週後	3.2									
			処理4週後	1.9									
処理8週後			3.7										
土壌	水田土壌	砂質埴壌土 178日後	5.2										
		砂壌土 60日後	27.5										
	畑地土壌	火山灰埴壌土 28日後	67.4										
		鉾物質軽埴土 28日後	66.4										
水中	加水分解	pH 4 5日後	100.4										
		pH 7 5日後	103.5										
		pH 9 5日後	97.8										
	水中光分解	蒸留水 7日後	87.6										
		自然水 7日後	36.1										

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は TAC 普及会にある。

## 代謝分解のまとめ

グリホサートの動物、植物、土壌、加水分解及び水中光分解における代謝、分解、残留の要約は以下のとおりであり、結果の概要を IX - 41 頁に、代謝分解経路を IX - 43 頁に示した。

### (1) 動物における代謝

$^{14}\text{C}$ -標識グリホサートは、経口投与後 48 時間以内に 97~98% が尿及び糞中に排泄され、速やかに体外へ排出された。雌雄の排泄経路を比較すると、低用量(100mg/kg)では雄の尿中排泄率が、雌よりやや高かった。高用量(1000mg/kg)では雌雄いずれも尿中排泄が約 23%、糞への排泄が約 76% であった。呼気への排泄は検出されなかった。

血中濃度の推移は、低用量の経口投与で雌雄間に差はみられなかったが、高用量では雄に比較して雌の最高血中濃度が低かった。いずれの用量でも最高血中濃度到達時間及び第一相の半減期は雌雄間で大きな差はなく、2~4 時間で到達し、半減期は約 2 時間であった。

臓器分布については、最高血中濃度到達時点において、腎臓中の濃度が最も高く、血漿及び肝臓中の濃度も比較的高かった。低用量投与動物の組織中濃度を経時的に測定したところ、いずれの組織においても時間の経過に伴って急速な減少が認められた。

代謝物について、血漿及び尿中の放射性成分は、80%以上が未変化の親化合物で、血漿及び尿からは                      の明確なピークが検出され、                      と推定された。この代謝物の割合は全体の                      であった。

### (2) 植物における代謝

湛水条件下で  $^{14}\text{C}$ -標識グリホサートを土壌処理してから 2 週間後に水稻を移植した試験では、処理放射能は水稻にほとんど吸収されず、成熟玄米中の放射能濃度は 0.152ppm で、この内、約 10% が抽出された。残りの非抽出性放射能はセルロース、でんぷん等の糖に取り込まれ、あるいはそれらの抱合体として存在した。わらには 0.277 の残留放射能が検出され、これを分画したところ、グリホサート以外の明確な放射性成分は検出されなかった。

かんきつを植えたポットの土壌に  $^{14}\text{C}$ -標識グリホサートを処理した試験において、処理後の葉、外皮及び果肉から検出された放射能は処理量の 0.1% 以下で、処理後の時間が経過しても残留放射能の増加は認められなかったことから、土壌処理したグリホサートはかんきつの地上部分にはほとんど吸収されないと考えられた。

キャベツを植えたポットの土壌に  $^{14}\text{C}$ -標識グリホサートを処理した試験では、収穫期の葉における残留放射能濃度が 0.0637ppm で、この内 94% が抽出された。主な放射性成分は                      と                      と推定された。グリホサートは 3.5% であった。

### (3) 土壌における代謝

畑状態の火山灰埴壌土及び鉍質軽埴土に  $^{14}\text{C}$ -グリホサートを 3ppm 添加した好氣的土壌運命試験における半減期は、非滅菌火山灰土壌で 202 日、非滅菌鉍質土壌では約 80 日で、滅菌土壌ではそれぞれ 212 日、370 日であった。非滅菌土壌から                      放射性化合物が検出され、                      と暫定的に同定され、処理放射能の 10% 以下の割合であった。その他は約 12% 以下で、この化合物はグリホサートの分解物ではなく、未変化の親化合物と土壌成分との複合体であろうと推定された。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は TAC 普及会にある。

水田状態の土壌に  $^{14}\text{C}$ -標識グリホサートを処理した試験では、放射能の大部分が土壌から検出され、田面水中の放射能は微量で、処理後の時間経過に伴い処理放射能の 0.1%以下に減少した。水田土壌から、グリホサート以外に 化合物が検出され、主な代謝物は と推定された。

pH4, 7 及び 9 の緩衝液を用いた加水分解試験において、5 日後のグリホサート残留率は 97.8%以上で、グリホサートはほとんど加水分解を受けないと考えられた。

蒸留水及び自然水を用いた水中光分解運命試験の結果、7 日間照射後の蒸留水にグリホサートが処理放射能の 87.6%、 検出された。自然水では、グリホサートは処理放射能の 36.1%に減少し、

検出された。グリホサートは水中で光照射を受けると を経て極性化合物及び二酸化炭素に分解されると推定された。

蒸留水及び自然水中の光分解半減期は、人工光源ではそれぞれ 35.9 日、4.8 日で、春季東京における太陽光に換算すると 207 日及び 31.9 日であった。

非火山灰土及び火山灰土を用いた土壌吸着試験の結果、Koc は非火山灰土において 1430~5580、火山灰土では 2890~5020 であった。

グリホサートの動物、土壌等における代謝分解経路図