

2. 植物体内運命に関する試験

(4) イミダクロプリドのなすにおける代謝

(代謝資料No.10)

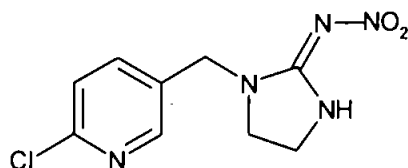
試験機関：

報告書作成年月日：1991年2月13日

供試標識化合物

化学名：1-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-N-ニトロイミダゾリジン-2-イリデンアミン

化学構造：



*：標識部位

標識：[^{-14}C] イミダクロプリド [I]

比放射能：5.74 MBq/mg (155 $\mu\text{Ci}/\text{mg}$)

放射化学的純度： %

標識位置の設定理由：

【方法】

1. 供試植物及び栽培土壌

8葉期まで育成したなす(品種：千両2号)を栽培容器(土壌：軽埴土)に定植し、パイレックスガラス製温室内で栽培した。給水及び病害虫防除は適時実施した。

2. 供試薬剤

^{14}C 標識 [I] 又は非標識 [I] を、それぞれ 1%含有する粒剤 (^{14}C 標識粒剤又は非標識粒剤) を調製した。

3. 試験群、薬剤処理

本試験では、次に示す 4 試験群を設けた。

試験群 1：圃場施用量 (2g/株) を処理した「なす」の総残留量及び代謝物を調べるため、 ^{14}C 標識粒剤及び非標識粒剤を計 2 g/株の処理量で定植時に植穴処理した。

試験群 2 (茎注入試験)：非標識粒剤を 2 g/株の処理量で「なす」に定植時植穴処理し、植穴処理 14 日、21 日、28 日及び 35 日後に ^{14}C 標識 [I] DMSO 溶液を計 0.135 mg有効成分/株の薬量でなすの茎に注入した。

試験群 3 (過剰量試験)：代謝物同定に役立てるため、 ^{14}C 標識粒剤及び非標識粒剤を計 10 g/株の過剰処理量で定植時に植穴処理した。

試験群 4 (過剰量試験) : 過剰量を処理して代謝物同定に役立てるため、非標識粒剤を 10 g /株の処理量で試験群 3 と同様に処理した。

4. 植物試料の採取

試験群 1

前収穫期である植穴処理 14 日後及び 35 日後に、それぞれなす 1 本及び 2 本の地上部を採取した。収穫期では、なす 1 本から植穴処理 49 日後及び 67 日後にそれぞれ果実を採取し、また別の 1 本から植穴処理 53 日後に果実を採取した。果実を採取したこれらなす 2 本の地上部を、植穴処理 69 日後に採取した。栽培容器の土壌を、地上部の採取と同時 (植穴処理 14 日後、35 日後及び 69 日後) に採取した。

試験群 2~4

植穴処理 69 日後に「なす」の地上部及び栽培容器の土壌を採取した。地上部は、「茎 (含む葉柄)」、「葉」及び「その他 (花、未成熟果実等)」に三分割し、果実は「へた」及び「可食部」に二分割した。

5. 抽出及び分画

植物試料

各部位に分割した試料を、メタノール/水 (80/20) 混液及びアセトニトリル/水 (80/20) 混液で摩砕抽出した。得られた各抽出液を混合し、n-ヘキサン、ジクロロメタンの順で液・液分配を行い、n-ヘキサン画分、ジクロロメタン画分及び水溶性画分を得た。水溶性画分は XAD-2 カラムで精製した。

土壌試料

試料を均質化し、アセトニトリル/水 (80/20) 混液で超音波抽出を行い、抽出液と固体残渣を得た。

6. 放射エネルギーの測定、放射性成分の定量及び同定

植物試料及び土壌試料からの各抽出画分は、液体シンチレーションカウンター (LSC) により放射エネルギーを測定した。また、抽出後の固体残渣は燃焼後、生じた $^{14}\text{CO}_2$ を液体シンチレーションカウンターで放射エネルギーを測定した。

植物試料及び土壌試料からの各抽出画分を、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) に供した。各抽出画分中の成分は、対照標準物質とのコクロマトグラフィーにより同定した。TLC 板上の放射性成分は、シリカゲル板から掻き取った後抽出し、LSC を用いて定量した。

また過剰量 (10 g /株) を植穴処理した植物試料の抽出物を用いて代謝物を単離・精製し、質量分析に供試した。

【結果】

1. 植物への放射能移行率 (表 1)

試験群 1 の 2 g /株の処理量で定植時植穴処理したなすでは、処理 14 日後、35 日後及び 69 日後にそれぞれ処理放射能の 2.72%、2.66% (平均) 及び 1.64% (平均) が植物体地上部に認められ、地上部の放射能は経時的に減少する傾向が認められた。また土壌中の放射能は、処理 14 日後、35 日後及び 69 日後にそれぞれ処理放射能の 78.25% (1.666 mg /kg)、73.50% (平均) (1.554 mg/kg) 及び 77.46% (1.516 mg /kg) 認められた。

表 1: 施用放射能の植物体及び土壌への分布率 (表中の数値は、処理量に対する%)

	試料採取日 (植穴処理後経過日数)						
	14 日	35 日			69 日		
	試料 1	試料 1	試料 2	平均	試料 1	試料 2	平均
植物体地上部 (計)	2.72	2.81	2.51	2.66	1.79	1.48	1.64
土 壌	78.25 [1.666]	71.29 [1.514]	75.70 [1.594]	73.50 [1.554]	82.26 [1.601]	72.65 [1.431]	77.46 [1.516]
合 計	80.97	74.10	78.21	76.16	84.05	74.13	79.09

[]内の数値は有効成分換算濃度 (mg/kg) を示す。

2. 総放射能残留量 (TRR) 及び植物部位への分布 (表 2)

試験群 1 の 2 g /株の処理量で定植時植穴処理したなすでは、植物体に吸収された放射能は求頂的に植物体内を移行する傾向が認められた。処理 14 日後には地上部 TRR の 98.8%が、処理 69 日後には地上部 TRR の 89.89%が葉から認められた。なお処理 35 日後に採取した試料において、茎から地上部 TRR の 67.7%が検出されたが、何らかの植物生理に依存した異例の現象と考えられた。

果実に移行した放射能は、処理 49 日後、53 日後及び 67 日後でそれぞれ地上部 TRR の 1.74% (処理量の 0.03%)、1.39% (同 0.02%) 及び 1.47% (同 0.03%) であり、その濃度は 0.039 mg/kg ~ 0.060 mg/kg であった。

果実を可食部とへたに分割すると、果実中放射能は主として可食部に分布していた。

表 2：総放射能残留量

			試料採取日 (植穴処理後経過日数)							
			14 日	35 日			69 日			
			試料 1	試料 1	試料 2	平均	試料 1	試料 2	平均	
茎	%TRR		1.17	67.68	2.55	35.12	<u>5.75</u>	<u>4.55</u>	<u>5.15</u>	
	mg/kg		0.190	5.474	0.194	2.834	0.173	0.131	0.152	
葉	%TRR		98.83	31.31	96.75	64.03	<u>87.99</u>	<u>91.79</u>	<u>89.89</u>	
	mg/kg		9.117	2.183	6.548	4.366	2.688	3.167	2.928	
果実	処理 49 日後に採取。	可食部	%TRR	—	—	—	—	1.22	—	0.61
			mg/kg	—	—	—	—	0.049	—	0.025
		へた	%TRR	—	—	—	—	0.52	—	0.26
			mg/kg	—	—	—	—	0.129	—	0.065
		果実全体	%TRR	—	—	—	—	<u>1.74</u>	<u>—</u>	<u>0.87</u>
			mg/kg	—	—	—	—	0.060	—	0.030
果実	処理 53 日後に採取。	可食部	%TRR	—	—	—	—	—	1.02	0.51
			mg/kg	—	—	—	—	—	0.032	0.016
		へた	%TRR	—	—	—	—	—	0.37	0.18
			mg/kg	—	—	—	—	—	0.104	0.052
		合計	%TRR	—	—	—	—	<u>—</u>	<u>1.39</u>	<u>0.69</u>
			mg/kg	—	—	—	—	—	0.039	0.020
果実	処理 67 日後に採取。	可食部	%TRR	—	—	—	—	0.74	—	0.37
			mg/kg	—	—	—	—	0.053	—	0.027
		へた	%TRR	—	—	—	—	0.73	—	0.36
			mg/kg	—	—	—	—	0.483	—	0.242
		合計	%TRR	—	—	—	—	<u>1.47</u>	<u>—</u>	<u>0.73</u>
			mg/kg	—	—	—	—	0.096	—	0.048
その他 (花及び未成熟果実)			%TRR	—	1.01	0.70	0.86	<u>3.05</u>	<u>2.27</u>	<u>2.66</u>
			mg/kg	—	1.139	0.322	0.731	0.721	0.762	0.742
合計 (地上部 TRR)			%	100	100	100	100	100	100	100

3. 代謝物の分布 (表 3)

表 3 に、試験群 1 (通常施用量処理) の茎葉 [茎、葉及びその他地上部 (花及び未成熟果実)] 及び果実 (可食部、へたを除く) における各代謝物分布を示す。

茎 葉 : 未変化の親化合物 [I] は処理後 14 日に 32.622% 茎葉 TRR (1.9208 mg/kg) であり、処理 35 日後には 8.757% 茎葉 TRR (0.3041 mg/kg) 、処理 69 日後には 10.226% 茎葉 TRR (0.1456 mg/kg) と減少した。

果実 (可食部) : 果実 TRR の 10% を上回る主要代謝物として、未変化の親化合物 [I]

が認められた。

茎葉における代謝物プロファイルと比較すると、

であった。

表 3 : 茎葉 (茎、葉、花及び未成熟果実) 及び果実 (可食部、へたを除く)

	茎葉 (茎、葉、花及び未成熟果実)						果実 (可食部)	
	処理後 14 日		処理後 35 日		処理後 69 日		処理後 49 日~67 日	
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
親化合物 [I]	32.622	1.9208	8.757	0.3041	10.226	0.1456	18.875	0.0081

4. 試験群 2 (茎注入試験)、試験群 3 及び 4 (過剰量処理試験) における代謝物

試験群 2 では、未変化の親化合物 [I] の他

が認められた。

また過剰量を処理した場合 (試験群 3 及び 4) では、

が認められ

た。

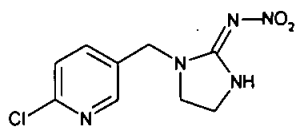
植穴処理された親化合物 [I] それ自身が根から地上部に吸収移行され、植物体内で代謝・分解されたと考えられた。

5. 推定代謝経路

なすに植穴処理された親化合物 [I] は、以下の経路により代謝されることが考えられた。

本試験の結果に基づき、図 1 になすにおける推定代謝経路を示す。

図 1 : なすにおける推定代謝経路



親化合物 [1]

2. 植物体内運命に関する試験

(5) イミダクロプリドのトマトにおける代謝—散布処理

(代謝資料No.11)

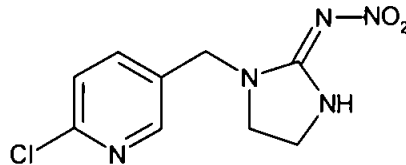
試験機関：

報告書作成年月日：1989年10月12日

供試標識化合物

化学名：1-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-N-ニトロイミダゾリジン-2-イリデンアミン

化学構造：



*：標識部位

標識：[^{-14}C] イミダクロプリド [I]

比放射能：4.04 MBq/mg (109.5 $\mu\text{Ci}/\text{mg}$)

放射化学的純度： %

標識位置の設定理由：

【方法】

1. 作物及び栽培方法

シルト質壤土を入れた 35 L 容栽培容器をドイツ モンハイムのバイエル社代謝研究所に設置し、植物を栽培した。収穫盛期の 14 日前の 1988 年 7 月 21 日にそれぞれ花房を 4 つ付けた 2 本のトマト植物に散布溶液を処理した。

2. 薬剤処理及び試料採取

25%水和剤 14.6 mg あるいは 17.5 mg をそれぞれ水 8 mL に懸濁後（有効成分約 0.05%）、エッペンドルフピペットの先端に取り付けた刷毛を用いて全ての果実が均一に湿るように散布溶液を処理した。総量として 805.8 μCi (29.81 MBq) を処理した。処理 4、7、14 及び 21 日後に 2 植物から成熟した果実を採取した。

3. 試料の抽出及び分画

各採取日のトマト 4 個をメタノール 400 mL で表面洗浄した後、メタノール/水混液 (3/1)、メタノール及びジクロロメタンを用いて磨砕抽出した。

抽出液を混合後、水のみになるまで濃縮した。次いでジクロロメタンで液々分配し、ジクロロメタン相と水相に分割した。

4. 放射エネルギーの測定、放射性成分の定量及び同定

表面洗浄液、ジクロロメタン相及び水相の液体試料中の放射エネルギーは液体シンチレーションカウンター (LSC) で、また、固体試料中の放射エネルギーはオキシダイザーで燃焼後、生じた $^{14}\text{CO}_2$ を LSC で測定した。

表面洗浄液、ジクロロメタン相及び水相を一次元及び二次元の薄層クロマトグラフィー (TLC) 分析に供した。溶液中の成分は対照標準物質とのクロマトグラフィーにより同定した。TLC プレート上の放射性成分は、シリカゲル板から掻き取った後、LSC で定量した。

5. 酵素/酸加水分解試験

処理 14 日後に採取したトマト抽出物の水相に、酵素 (セルラーゼ、グルコシダーゼ及びエステラーゼ) 加水分解処理及び酸 (pH=1) 加水分解処理を行った。処理終了後の溶液をジクロロメタンで分液し、ジクロロメタン相及び水相の放射エネルギーを LSC で測定した。

6. 茎注入試験

放射性標識 [I]、 ^{13}C 標識 [I] 又は非放射性標識 [I] を含む処理溶液 (10mg 有効成分/mL アセトニトリル) を、別個のトマトの茎及び葉柄に注入した。処理 10 日後に植物体を採取して粉碎し、抽出及び精製を行った。同定手段として TLC、核磁気共鳴スペクトロメトリー ($^1\text{H-NMR}$) 及び質量スペクトロメトリー (MS) を適用して代謝物を同定した。

7. 移行性試験

空調の施された温室内において、果実 1 房のみを残したトマト植物の全ての葉に 25WP 製剤の 0.12 または 0.15% 散布溶液 (有効成分 0.03 または 0.04%) を均一に処理した。それぞれ総量にして 230 または 336 μCi を処理した。

汚染を避けるため、収穫時を除き未成熟のトマトをプラスチックカバーで覆った。14 日後、成熟したトマトを収穫し、試料を燃焼後、放射エネルギーを LSC で求めた。

【結果】

1. 放射能の分布 (表 1)

トマト果実の表面洗浄液、抽出液及び固形残留物の放射エネルギーを合算し、総放射能残留量 (TRR) を求めた。処理 4、7 及び 14 日後の試料に認められた TRR は類似していた (0.84~1.01 mg/kg)。処理 21 日後の残留量 (0.64 mg/kg) は処理 4、7 及び 14 日後の試料に比べ低かったが、これは処理時期に果実が小さかったことに起因すると考えられた。

TRR の大部分が、メタノール表面洗浄液から回収された (TRR の 60.4~88.2%)。表面洗浄液中の放射エネルギーは経時的に減少し、処理 4 日後の TRR の 88.2% に対し処理 21 日後には TRR の 60.4% となった。一方、表面洗浄により除去されなかった放射エネルギーは経時的に増加し、処理 21 日後には 40% に達した。

表面洗浄で除去されず、溶媒で抽出された放射エネルギーの大部分はジクロロメタンに分配された。ジクロロメタン相中の放射エネルギーは経時的に増加し、処理 4 日後の 10.6% TRR に対して 21 日後には 30.8% TRR となった。水相中の放射エネルギーも経時的に増加し、処理 4 日後の 1.0% TRR に対して処理 21 日後には 8.1% TRR となった。未抽出放射エネルギーは少なかった (0.2~0.8% TRR)。

表 1. トマト中放射能の分布

画分	処理 4 日後		処理 7 日後		処理 14 日後		処理 21 日後	
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
表面洗浄液	88.2	0.89	77.3	0.64	76.4	0.65	60.4	0.39
ジクロロメタン相	10.6	0.11	20.2	0.17	20.2	0.17	30.8	0.19
水相	1.0	0.01	2.0	0.017	3.0	0.026	8.1	0.052
未抽出残留物	0.2	0.002	0.5	0.004	0.4	0.003	0.8	0.005
合計 (TRR)	100.0	1.01	100.0	0.84	100.0	0.85	100.1	0.64

2. 茎注入試験における代謝物の同定

茎注入試験から、

が同定された。また、

も同定

された。

3. 代謝物の分布 (表 2~3)

トマト果実の各画分における分布 (表 2)

表面洗浄液及びジクロロメタン相中の主要成分は、未変化の親化合物 [I] であった。

表面洗浄液中の主要成分である親化合物 [I] は、試験期間を通じて表面洗浄液に回収された放射エネルギーの 86.6~95.7% (52.2~84.4% TRR) を占めた。親化合物 [I] 以外に

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はバイエルクロップサイエンス株式会社にある。

表面洗浄液から回収された親化合物 [I] は経時的に減少した。
ジクロロメタン相でも、親化合物 [I] は試験期間を通じてジクロロメタン相から回収された放射能の 88%以上を占めた。親化合物 [I] 以外に

水相から親化合物 [I] は検出されなかった。

表 2. トマト各画分における親化合物及び代謝物の分布

成分	4 日後	7 日後	14 日後	21 日後
	%TRR	%TRR	%TRR	%TRR

果実全体における分布 (表 3)

果実全体において、親化合物 [I] は処理 4 日後の 94.4%TRR (0.95 mg/kg) から処理 21 日後の 79.4%TRR (0.51 mg/kg) へと経時的に減少し、

親化合物 [I]
に次ぐ量が認められた代謝物は、

表 3. トマト果実における親化合物及び代謝物の分布

成分	4 日後		7 日後		14 日後		21 日後	
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg

4. 加水分解試験

処理 14 日後の水相に酵素又は酸加水分解処理を行った結果、水相及びジクロロメタン相に分配された放射エネルギーに加水分解条件による顕著な差は認められなかった。何れの加水分解条件でも、水相に 60～80%の放射能が留まった。

表 3. トマト（処理 14 日後）抽出物の水相—加水分解結果

加水分解条件		処理 14 日後の水相中放射能 (%)		
		加水分解前	水相	ジクロロメタン相
酸加水分解	pH=1、12 時間、22°C	100	68	32
	pH=1、2 時間、80°C	100	67	23
酵素加水分解	セルラーゼ	100	60	40
	グルコシド	100	66	34
	エステラーゼ	100	80	20

5. 移行性試験

トマトの葉に散布溶液を処理後、放射能は果実に殆ど移行しなかった。処理 14 日後の放射エネルギーは親化合物換算で 0.003～0.006 mg/kg であり、表面散布処理後の残留量である 0.85 mg/kg と比較し、顕著に低いものであった。

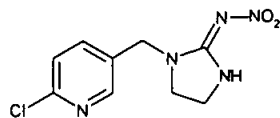
6. 代謝経路

親化合物 [I] をトマトに散布処理した所、残留量の大部分が果皮に存在した。主要残留成分は未変化の親化合物 [I] であり、

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はバイエルクロップサイエンス株式会社にある。

親化合物イミダクロプリド [I] のトマトにおける代謝分解は以下の経路で進行し、その代謝経路は他の植物と類似していた。本試験結果に基づくイミダクロプリド [I] のトマトにおける推定代謝経路を以下に示す。

推定代謝経路



親化合物 [I]

2. 植物体内運命に関する試験

(6) イミダクロプリドのりんごにおける代謝—散布処理

(代謝資料No.12)

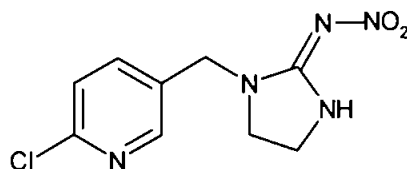
試験機関：

報告書作成年月日：1992年2月27日

供試標識化合物

化学名：1-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-N-ニトロイミダゾリジン-2-イリデンアミン

化学構造：



*：標識部位

標識：[^{14}C] イミダクロプリド [I]

比放射能：3.42 MBq/mg (92.3 $\mu\text{Ci/mg}$)

放射化学的純度： %

標識位置の設定理由：

【方法】

1. 作物及び栽培方法

バイエル社のモンハイム代謝研究所の栽培エリアにおいて、栽培容器 (0.5 m²) にシルト質壤土を入れ、りんご (品種：ゴールドデンデリシャス) を栽培した。栽培期間中は、植物の生長が最適に保たれるように土壤に給水し、施肥及び防除は適宜実施した。

2. 薬剤処理及び試料採取

りんご果実 80 個に対して合計 3 回、薬剤を塗布処理した。1 回目は 1989 年 6 月 27 日、2 回目は 1989 年 7 月 25 日、3 回目は 1989 年 8 月 22 日に処理した。いずれの処理においても水和剤 (25% WP) に製剤化した放射能標識 [I] に水を加え、約 500 倍に希釈した (有効成分約 0.05%)。この溶液 (2×100 μL) を 80 個のりんごに先端に刷毛を取り付けたエッペンドルフシリンジを用いて均一に処理した。

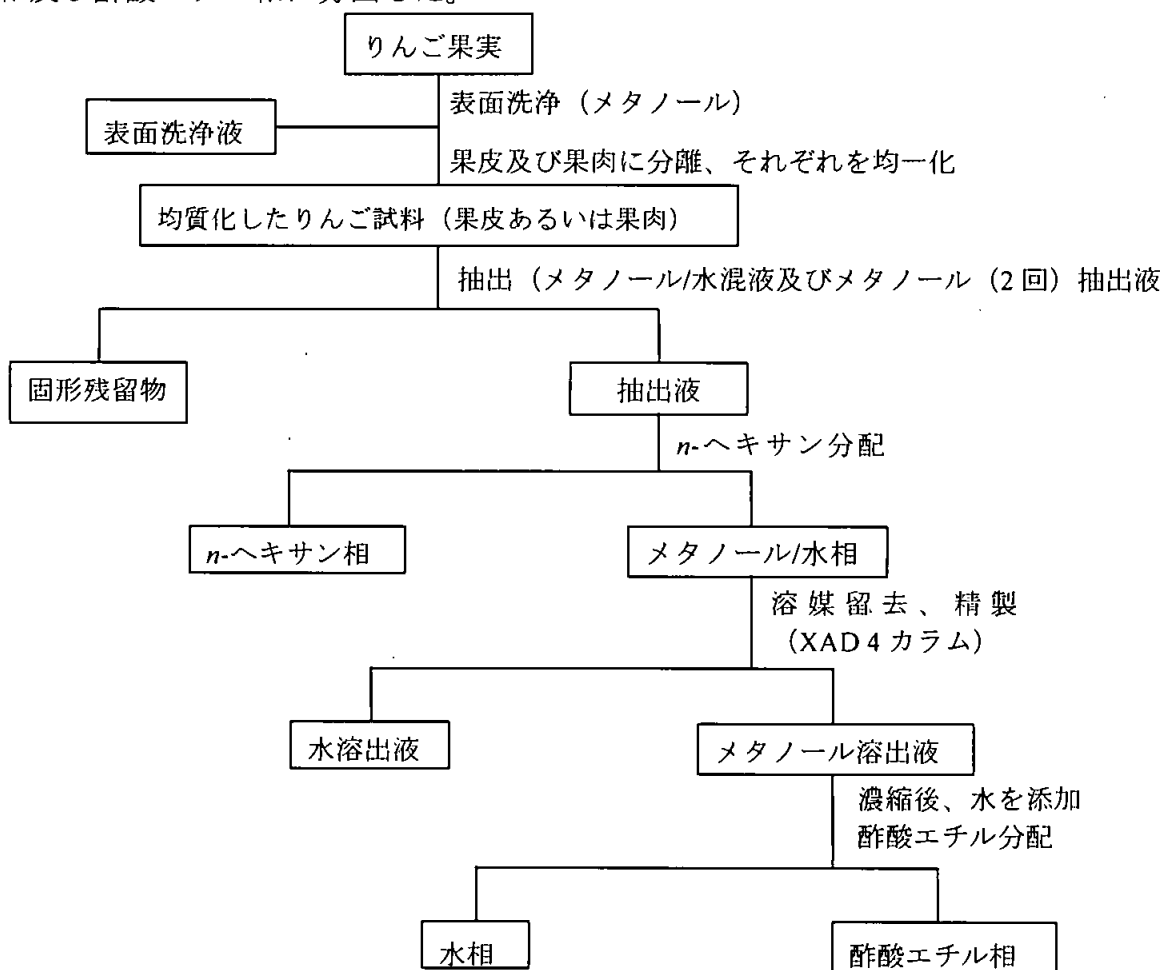
最終処理 0 及び 14 日後に試料を採取した。最終処理 0 日後は合計 10 個の果実 (1362.55 g) を採取し、14 日後には合計 70 個の果実 (10654.28 g) を収穫した。

3. 試料の抽出及び分画 (図 1)

りんご果実 (0 日試料は 10 個 [1362.55 g]、14 日試料は 20 個 [3279.16 g]) をメタノールに浸漬し、表面洗浄した。次いで、りんごを果皮及び果肉に分け、そ

れぞれを液体窒素中で均一化した。

液体窒素中で均一化した果皮及び果肉試料を同様の方法で抽出した。それぞれの試料をメタノール/水 (1/1、1回) 及びメタノール (2回) を用いて磨砕抽出後、抽出液を混合し、*n*-ヘキサンで分配した。*n*-ヘキサン相には放射能が含まれなかったため、これを捨てた。メタノール/水相からメタノールを留去した後、残りの水相を XAD 4 樹脂カラムに負荷し、水次いでメタノールで溶出させた。水溶出液には放射能が含まれなかったため、これを捨てた。メタノール溶出液を濃縮し、水を加え、残存するメタノールを留去後、残りの水相を酢酸エチルで分配し、水相及び酢酸エチル相に分画した。



4. 放射エネルギーの測定、放射性成分の定量及び同定

液体試料中の放射エネルギーは液体シンチレーションカウンター (LSC) で、また、抽出後の固体試料中の放射エネルギーはオキシダイザーで燃焼後、生じた $^{14}\text{CO}_2$ を液体シンチレーションカウンターで測定した。

表面洗浄液、XAD4 カラム溶出後の酢酸エチル相及び水相を、一次元及び二次元の薄層クロマトグラフィー (TLC) 分析ならびに高速液体クロマトグラフィー (HPLC) に供した。溶液中の成分は対照標準物質とのコクロマトグラフィーにより同定した。TLC 板上の放射性成分は、シリカゲル板から掻き取った後抽出し、

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はバイエルクロップサイエンス株式会社にある。

LSC を用いて定量した。

5. 移行性試験

果実近傍の 5 葉に、1 葉当たり放射性標識 [I] 計 0.181mg を 3 回処理した。

汚染を避けるため、収穫時を除き果実のプラスチックカバーで覆った。最終処理 14 日後に果実及び葉を収穫した。葉は燃焼後、放射エネルギーを LSC で測定した。果実は、果皮と果肉に分割し、メタノール抽出後に LSC で放射エネルギーを測定した。

【結果】

1. 放射能の分布 (表 1)

表面洗浄液、果皮及び果肉の抽出液、果皮及び果肉の固形残留物の放射エネルギーを合算し、総放射能残留量 (TRR) とした。TRR は最終処理 0 日後で 1.76 mg/kg、14 日後で 1.45 mg/kg と算出された。

採取時点を問わず、TRR の大部分は表面洗浄液から回収された (最終処理 0 日後 : 74.2%TRR、14 日後 : TRR の 64.9%TRR)。果皮から回収された放射エネルギーは、果肉から回収された放射エネルギーより多かった。

果皮及び果肉における放射エネルギーは、その大部分 (果皮及び果肉の各部位における放射エネルギーの約 87%及び約 98%) が抽出され、未抽出残留はわずかであった。果皮及び果肉から抽出された放射エネルギーのほとんど全てが XAD 4 カラムのメタノール溶出液画分に回収された。最終処理 0 日後から 14 日後にかけて表面洗浄液中の放射エネルギーが減少し、果皮及び果肉の XAD 4 カラムからのメタノール溶出液中の放射エネルギーが増加した。XAD 4 カラムのメタノール溶出液の内、極性のより高い画分である水相中放射エネルギーの割合が果皮で果肉に比べ高く、最終処理 14 日後において 0 日後より高かった。

表 1. りんご中放射能の分布

画分	最終処理 0 日後		最終処理 14 日後		
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	
表面洗浄液	74.2	1.31	64.9	0.94	
果皮	15.9	0.28	21.1	0.31	
n-ヘキサン相	<0.01	<0.001	0.1	0.002	
XAD 4 水溶出液	0.2	0.003	0.2	0.002	
XAD 4 メタノール 溶出液	計	13.7	18.1	0.262	
	(酢酸エチル相)	(10.4)	(0.183)	(10.8)	(0.157)
	(水相)	(3.3)	(0.059)	(7.3)	(0.105)
未抽出残留物	2.0	0.035	2.7	0.040	
果肉	9.9	0.17	14.0	0.20	
n-ヘキサン相	0.1	0.002	<0.1	<0.001	
XAD 4 水溶出液	0.1	0.001	0.1	0.001	
XAD 4 メタノール 溶出液	計	9.6	13.6	0.197	
	(酢酸エチル相)	(8.6)	(0.151)	(11.7)	(0.170)
	(水相)	(1.0)	(0.018)	(1.9)	(0.027)
未抽出残留物	0.1	0.002	0.3	0.004	
合計	100	1.76	100	1.45	

2. 代謝物の分布 (表 2~4)

表面洗浄液 (表 2)

表面洗浄液中の主要成分は未変化の親化合物 [I] であった (最終処理 0 日後 : 66.1%TRR 及び 1.163 mg/kg、14 日後 : 55.8%TRR 及び 0.805 mg/kg)。表面洗浄液中には、[I] 以外に

認められた。その他に、
で存在した。

表 2. りんご果実の表面洗浄液における代謝物の分布

画分	最終処理 0 日後		最終処理 14 日後	
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg

果皮 (表 3)

XAD 4 カラムからのメタノール溶出画分を酢酸エチル・水で分配し、得られた酢酸エチル相及び水相中の成分のみを分析した。

酢酸エチル相中の主要成分は、親化合物 [I] (最終処理 0 日後 : 6.0%TRR 及び 0.106 mg/kg、最終処理 14 日後 : 6.9%TRR 及び 0.100 mg/kg) であった。

水相には

表 3. りんご果皮における代謝物の分布

画分	最終処理 0 日後		最終処理 14 日後	
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg

果肉（表 4）

果皮と同様、XAD 4 カラムからのメタノール溶出画分を酢酸エチル・水で分配し、得られた酢酸エチル相及び水相中の成分のみを分析した。

主要成分は親化合物 [I]（最終処理 0 日後：4.9%TRR 及び 0.087 mg/kg、最終処理 14 日後：6.3%TRR 及び 0.091 mg/kg）であった。オ

果肉の水相中の放射エネルギーは少なく、0 日及び 14 日の総残留量はそれぞれ TRR の 1.0% (0.018 mg/kg) 及び 1.9% (0.027 mg/kg) であり、

表 4. りんご果肉の各画分における代謝物の分布

画分	最終処理 0 日後		最終処理 14 日後	
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg

果実全体（表 5）

表面洗浄液、果皮及び果肉で同定された代謝物を合算し、りんご果実における代謝物の分布を調べた。りんご果実における主要成分は未変化の [I] であり、0 日及び 14 日でそれぞれ総放射能残留量 (TRR) の 77.0% 及び 69.0% に相当した。TRR の 10% を超える代謝物は認められなかった。代謝物では

表 5. りんごにおける親化合物及び代謝物の分布

成分	最終処理 0 日後		最終処理 14 日後	
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
イミダクロプリド [I]	77.0	1.356	69.0	0.996

4. 移行性試験 (表 6)

移行性試験では、葉に処理した放射能の約半分が揮散により消失した。果実 (果皮及び果肉) に移行した放射能は無視しうる量であった。

表 6. 移行試験における分布

成分	残存放射能 (処理放射能の%)		
	実験 1	実験 2	平均
葉	55.88	52.16	54.02
果 肉	0.05	0.04	0.045
メタノール抽出画分	0.04	0.03	0.035
残渣	0.01	0.01	0.010
果 皮	0.01	0.03	0.020
メタノール抽出画分	0.01	0.02	0.015
残渣	<0.005	0.01	0.005
合計	55.94	52.23	55.585

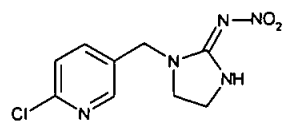
5. 代謝経路

イミダクロプリドをりんごに塗布処理した所、残留量の大部分が表面洗浄液及び果皮に存在した。主要残留成分は未変化の親化合物であり、

親化合物イミダクロプリド [I] のりんごにおける代謝分解は以下の経路で進行し、

[I] の推定代謝経路を以下に示す。

りんごにおける代謝経路



親化合物 [1]

2. 植物体内運命に関する試験

(7) イミダクロプリドのばれいしょにおける代謝一粒剤土壌混和处理

(代謝資料No.13)

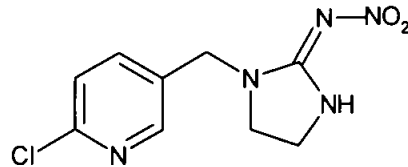
試験機関：

報告書作成年月日：1991年7月19日

供試標識化合物

化学名：1-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-N-ニトロイミダゾリジン-2-イリデンアミン

化学構造：



*：標識部位

標識：[^{14}C] イミダクロプリド [I]

比放射能：0.944 MBq/mg (25.5 $\mu\text{Ci}/\text{mg}$)

放射化学的純度： %

標識位置の設定理由：

【方法】

1. 作物、薬剤処理及び栽培方法

ばれいしょは雨除けをした施設において 0.96 m² の栽培容器 (砂利 10 cm の上に砂壤土 50cm を充填) にて栽培した。栽培期間中は、最適な水分条件を保つために適宜灌水した。

放射能標識 [I] を用いて 5% 粒剤を調製し、80cm の長さに畝立てした土壌 1 畝当たり粒剤 0.8 g (37.8 MBq) を土壌混和处理した。粒剤を混和处理後、6 個の種いも (品種 Clivia) を 1 畝当たり 2 個ずつ、3 畝に植付けた (1989 年 4 月 17 日)。ばれいしょは 1989 年 5 月 7 日に萌芽した。

本試験の処理量は、実際の推奨処理条件 (0.05g a.i./m 畝、つまり 1g 粒剤/m 畝) に基づいて設定した。

2. 試料採取

慣行条件に従い、茎葉部が完全に枯れ乾燥した処理後第 129 日にばれいしょを収穫した。付着している土壌等を除去するために塊茎 (3.833 kg) を冷水で注意深く洗浄し、塊茎全量 (ただし、500 g を除く) を細切した。また、ばれいしょ茎葉 (462g) は手で細切後、小分けした。試料は分析まで冷凍 (-20°C) 保存した。

3. 試料の抽出及び分画化

メタノール/水混液 (2/1 (塊茎)、1/1 (茎葉))、メタノール及びジクロロメタンを抽出溶媒に用いて磨砕抽出機により順次抽出した。抽出液を濃縮後、残った水相を *n*-ヘキサン次いで酢酸エチルで分配後、得られた画分 (*n*-ヘキサン相、酢酸エチル相及び水相) をそれぞれ濃縮した。

固体残留物は液体窒素中で磨砕し均一化した。

4. 放射能量の測定、放射性成分の定量及び同定

液体試料中の放射能量は液体シンチレーションカウンター (LSC) で、また、固体試料中の放射能量はオキシダイザーで燃焼後、生じた $^{14}\text{CO}_2$ を LSC で測定した。

酢酸エチル相は濃縮後精製せずに直接、茎葉の水相は XAD 4 カラムで精製後、また、塊茎の水相は XAD 4 及び C18 カートリッジで精製後、一次元及び二次元の薄層クロマトグラフィー (TLC) 分析に供した。溶液中の成分は対照標準物質とのコクロマトグラフィーにより同定した。

茎葉の酢酸エチル相を低圧液体クロマトグラフィーにより精製後、高速液体クロマトグラフィーを用いて代謝物を単離した。単離後の各成分を $^1\text{H-NMR}$ 分析により同定した。塊茎の水相中に存在するクロロニコチン酸 [M06] の同定には、同位体逆希釈分析も実施した。

【結果】

1. 放射能の吸収

処理 129 日後の収穫時において、処理放射能の 98.4% が土壌から回収され、ばれいしょの塊茎及び茎葉から回収された処理放射能はそれぞれ 2.2% 及び 0.3% であった。

2. 放射能の分布 (表 1)

処理 129 日後のばれいしょの塊茎及び茎葉中の総放射能残留量 (TRR) はそれぞれ 0.091 mg/kg 及び 5.76 mg/kg であった (表 1)。

塊茎では、TRR の 93.6% が抽出され、6.4% が未抽出であった。*n*-ヘキサン相には TRR の 0.4% (<0.0004 mg/kg) が分配され、酢酸エチル相及び水相にはそれぞれ TRR の 61.3% (0.056 mg/kg) 及び 31.9% (0.029 mg/kg) が分配された。

茎葉では、TRR の 73.6% が抽出され、26.4% が未抽出であった。*n*-ヘキサン相には TRR の 2.1% (0.12 mg/kg) が分配され、酢酸エチル相及び水相にはそれぞれ TRR の 38.2% (2.20 mg/kg) 及び 33.3% (1.92 mg/kg) が分配された。

表 1. ばれいしょ各画分における放射能分布

画分	各部位中の回収放射能に対する割合			
	塊茎		茎葉	
	%	mg/kg	%	mg/kg
n-ヘキサン相	0.4	<0.0004	2.1	0.12
酢酸エチル相	61.3	0.056	38.2	2.20
水相	31.9	0.029	33.3	1.92
未抽出残留物	6.4	0.006	26.4	1.52
合計	100.0	0.091	100.0	5.76

2. 塊茎及び茎葉における代謝物の分布 (表 2)

(1) 塊 茎

酢酸エチル相及び水相中の成分をそれぞれ個別に定量した。

酢酸エチル相中の主要成分は未変化の親化合物 [I] であり、45.3%TRR (0.041 mg/kg) であった。その他に

認められた。

水相における主要成分は

であった。その他に親化合物 [I] (3.0%TRR、0.003 mg/kg)、
が同定された。また、

の範囲であった。

塊茎中の主要成分は未変化の [I] であ
った (TRR の 48.3%、0.044 mg/kg)。

(2) 茎 葉

塊茎と同様に、酢酸エチル相及び水相中の成分をそれぞれ個別に定量した。

酢酸エチル相中の主要成分は未変化の親化合物 [I] であり、25.4%TRR (1.46 mg/kg) であった。

に相当した。

の範囲であった。

水相からは

認められた。その他に、親化合物 [I] (1.3%TRR、0.07 mg

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はバイエルクロップサイエンス株式会社にある。

/kg) 、

の範囲であった。

茎葉中の主要成分は未変化の

[I] であった (TRR の 26.7%、1.53 mg/kg) 。

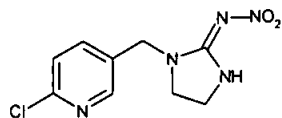
表 2. ばれいしょの塊茎及び茎葉における親化合物及び代謝物の分布

	塊茎		茎葉	
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg

3. 代謝経路

親化合物イミダクロプリド [I] のばれいしょにおける代謝分解は以下の経路で進行し、
。イミダクロプリド [I] のばれいしょにおける推定代謝経路を以下に示す。

推定代謝経路



親化合物 [1]

2. 植物体内運命に関する試験

(8) イミダクロプリドのばれいしょにおける代謝—散布処理

(代謝資料No.14)

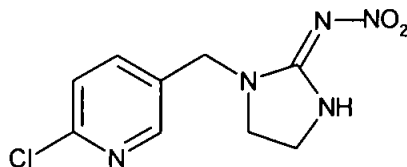
試験機関：

報告書作成年月日：1992年5月8日

供試標識化合物

化学名：1-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-N-ニトロイミダゾリジン-2-イリデンアミン

化学構造：



*：標識部位

標識：[^{14}C] イミダクロプリド [I]

比放射能：6.64 MBq/mg (179.5 $\mu\text{Ci}/\text{mg}$)

放射化学的純度： %

標識位置の設定理由：

【方法】

1. 作物及び栽培方法

表面積 0.36 m² の栽培容器 2 箱にばれいしょ (品種：Hansa) を 1987 年 4 月 29 日に植え付けた。ばれいしょは 1987 年 5 月 12 日に萌芽した。

2. 薬剤処理及び試料採取

放射性標識 [I] を用いて水和剤 25WP (有効成分含有量 22.75%) を調製した。30 mg の 25WP を水 50 μL に懸濁後、水 15 mL を加えて攪拌し、散布溶液を調製した (500 倍、散布溶液中の有効成分濃度 0.455%、134g 有効成分/ha)。散布処理はプロット散布器を用いて行った。

処理 7 日後及び 28 日後に一方の栽培容器からそれぞれ 1 株のばれいしょを採取した。茎葉を手で切断し、塊茎を洗浄した。慣行の収穫期である処理 64 日後に、もう一方の栽培容器からばれいしょ塊茎を収穫した。処理 64 日後の収穫では、慣行で実施されるように、茎葉が枯れほとんど乾燥していた。

3. 試料の抽出及び分画

塊茎及び茎葉について、それぞれ① メタノール/水混液 (1:1)、② メタノール及び③ ジクロロメタンを抽出溶媒に用いて磨砕抽出器により順次抽出した。

茎葉部試料の抽出液を濃縮して水性残渣とし、*n*-ヘキサン及びジクロロメタン（代替溶媒として酢酸エチルも使用）と液液分配し、有機相と水相を得た。塊茎の抽出液は濃縮後、*n*-ヘキサン分配をせずにジクロロメタンで分配した。

4. 放射エネルギーの測定及び放射性成分の同定

液体試料中の放射エネルギーは液体シンチレーションカウンター（LSC）で、また、固体試料中の放射エネルギーはオキシダイザーで燃焼後、生じた¹⁴C₂O₂をLSCで測定した。

各試料溶液を一次元及び二次元の薄層クロマトグラフィー（TLC）あるいは高速液体クロマトグラフィー（HPLC）を用いて対照物質とのクロマトグラフィーに供した。TLC板上の放射性成分は、リニアアナライザーで定量するか又はシリカゲル板から液体シンチレーションカクテル中に掻き取った後、LSCで定量した。更に、HPLCを用いて代謝物を単離/精製し、GC-MS及び¹H-NMR分析により同定した。また極性代謝物について、酵素加水分解、酸加水分解処理を行った。

5. 茎葉の未抽出放射能の特徴付け

抽出後のばれいしょ茎葉の固形残留物を70%硫酸65 mLに懸濁し、10°Cで16時間静置後、4時間加熱還流し、冷却後、不溶成分を遠心分離により取り除いた。遠心分離後の上清を混合し、濃縮後、加水分解した固体及び硫酸溶液中の¹⁴C-放射エネルギーをシンチレーションカウンターで測定した。硫酸溶液を弱塩基イオン交換カラムに供した後、水1 Lで溶出させ、溶出液を混合後250 mLに濃縮した。

【結果】

1. 放射エネルギーの分布（表1～2）

ばれいしょ塊茎（表1）

ばれいしょ塊茎中の総放射エネルギー残留量（TRR）は少なく、処理7日後の0.014 mg/kgから収穫期である処理64日後には0.009 mg/kgまで減少した。塊茎中の放射エネルギーは抽出されにくく、処理7及び28日後にはTRRのそれぞれ94.2%及び73.1%が未抽出であった。未抽出放射エネルギーは、処理64日後にTRRの11.8%まで減少した。また、抽出された放射エネルギーはその大部分が水相に分配され、有機相（ジクロロメタン相）に分配された放射エネルギーは少なかった。

表1. ばれいしょ塊茎中放射エネルギーの分布

画分	7日後		28日後		64日後	
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
ジクロロメタン相	0.6	<0.001	1.5	<0.001	4.5	<0.001
水相	5.2	<0.001	25.5	0.002	83.7	0.007
未抽出放射エネルギー	94.2	0.013	73.1	0.005	11.8	0.001
合計	100.0	0.014	100.0	0.007	100.0	0.009

ばれいしょ茎葉 (表 2)

ばれいしょ茎葉の TRR は、処理 7 日後の 2.51 mg/kg から処理 64 日後の 1.35 mg/kg まで減少した。各試料採取時における茎葉中の放射能は、大部分が抽出された。未抽出放射能は、処理 7 日、28 日及び 64 日後でそれぞれ TRR の 2.9%、9.5% 及び 14.1% であった。また抽出放射能は、*n*-ヘキサン相にはほとんど分配されず、大部分は酢酸エチル相及び水相に分配された。酢酸エチル相の放射能は経時的に減少し (処理 7 日後 : 84.5% TRR、64 日後 : 54.4% TRR)、一方水相の放射能が経時的に増加した (処理 7 日後 : 11.0% TRR、64 日後 : 29.4% TRR)。

表 2. ばれいしょ茎葉中放射能の分布

画分	7 日後		28 日後		64 日後	
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
<i>n</i> -ヘキサン相	1.60	0.04	2.58	0.05	2.05	0.03
酢酸エチル相	84.5	2.12	63.9	1.26	54.4	0.73
水相	11.0	0.28	24.0	0.47	29.4	0.39
未抽出放射能	2.9	0.07	9.5	0.19	14.1	0.19
合計	100.0	2.51	100.0	1.97	100.0	1.35

2. 代謝物の分布

塊 茎

収穫期である処理 64 日後の塊茎中の TRR は 0.009 mg/kg であり、
 が抽出された。液々分配後の有機相及び水相を薄層クロマトグラフィーで分析
 した所、約 0.001 mg/kg が親化合物 [I]、
 と同定された。処理 7 日後及び 28 日後の塊茎は、TRR が少なかったため分析
 できなかった。

茎葉 (表 3)

有機相及び水相中の成分をそれぞれ個別に定量した。

有機相の主要成分は未変化の親化合物 [I] であった。しかしながら親化合物
 [I] の残留量は経時的に減少し、処理 7 日後、28 日後及び 64 日後にはそれ
 ぞれ TRR の 71.8% (1.80 mg/kg)、48.2% (0.95 mg/kg) 及び 37.9% (0.51 mg/kg)
 であった。その他に

することが確認された。

水相からは が同定された。水相中の

が同定された。

茎葉では、ジクロロメタン相及び水相を合わせ TRR の

が同定された。茎葉中の主要成分は未変化の [I]
であった (37.9%TRR~71.8%TRR、0.51~1.80 mg/kg)。

表 3. ばれいしょ茎葉における親化合物及び代謝物の分布

画分	7 日後		28 日後		64 日後	
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg

3. ばれいしょ茎葉の未抽出残留物の特徴付け

茎葉 TRR の 14.1%に相当する 0.19 mg/kg が未抽出の ¹⁴C-放射能であった。

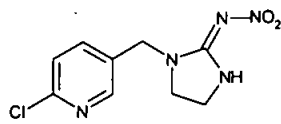
リグニン画分に未抽出 ¹⁴C-放射能の 29.7%が含まれた。また、¹⁴C-放射能の一部がグルコース画分に含まれた。

これらの加水分解結果より、ばれいしょ茎葉のデンプン及びセルロースに取り込まれたと考えられる。

4. 代謝経路

塊茎及び茎葉のいずれにおいても主要残留成分は未変化の親化合物 [I] であった。脱ニトロ体 [M01] のみが茎葉中の放射エネルギーの 10%を超える量で認められた。親化合物イミダクロプリド [I] のばれいしょにおける代謝分解は以下の経路で進行し、その代謝経路は他の植物と類似していた。イミダクロプリド [I] のばれいしょにおける推定代謝経路を以下に示す。

推定代謝経路



親化合物 [I]

2. 植物体内運命に関する試験

(9) イミダクロプリドのとうもろこしにおける代謝—種子粉衣処理

(代謝資料No.15)

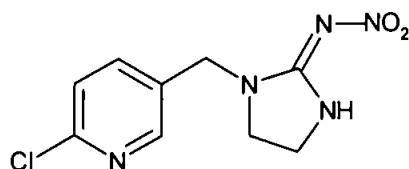
試験機関：

報告書作成年月日：1992年1月14日

供試標識化合物

化学名：1-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-N-ニトロイミダゾリジン-2-イリデンアミン

化学構造：



*：標識部位

標識： [^{14}C] イミダクロプリド [I]

比放射能：1.45MBq/mg (39.3 μCi /mg)

放射化学的純度： %

標識位置の設定理由：

【方法】

1. 作物及び栽培方法

栽培容器に壤質シルト土壌を入れ、とうもろこし（品種：Mutin D）を栽培した。葉期中の土壌に適時給水し、植物の生長が適切に保たれるようにした。

2. 薬剤処理及び試料の採取

放射性標識 [I] を用いて 70%粉末製剤 (70WS) を調製し、とうもろこしの種子 16 個に種子粉衣した。処理量は、通常圃場施用量 (700 g 有効成分/100kg 種子) を担保する 721g 有効成分/100kg 種子であった。種子粉衣後、とうもろこし種子を栽培容器に植付け、次の日程で試料を採取した。

採取時期	植付け(種子粉衣処理)後経過日数	植物のステージ及び採取本数	採取部位
第一回採取	33 日	高さ約 35cm、6~7 葉期、4 本	未成熟(青刈り)とうもろこし
第二回採取	61 日	高さ約 100cm、約 9 葉期、4 本	未成熟(青刈り)とうもろこし
最終採取	134 日	成熟期、8 本	成熟
			とうもろこし
			乾燥子実
			外皮
			穂軸
			かいば用植物体 (fodder)

3. 試料の抽出及び放射能測定

試料の抽出として、通常抽出（全採取部位に適用）と徹底抽出（乾燥子実及びか
いば用植物体のみに適用）を行った。

通常抽出：均一化した一定量について、① メタノール/水(1:1)混液、② メタノール
の順に摩砕抽出を行い、固形残留物（非抽出性残留 1）を得た。得られた
濾液を混合し、XAD4 樹脂カラムで精製し、メタノール抽出画分を得た。

苛酷抽出：通常抽出で得られたかいば用植物体及び乾燥子実の固形残留物を、①
メタノール、② 塩酸/メタノール(1:1)混液、③ 3.2N 水酸化ナトリウム/メタ
ノール(2:3)混液の順で還流抽出した。還流抽出で得られた抽出物はジクロロ
メタンで分配処理を行い、水相と有機相に分割した。

4. 放射能の測定及び放射性成分の同定／特徴付け

液体試料中の放射エネルギーは液体シンチレーションカウンター(LSC)で、また、固体試
料中の放射エネルギーはオキシダイザーで燃焼後、生じた $^{14}\text{CO}_2$ を LSC で測定した。

各試料溶液を一次元及び二次元の薄層クロマトグラフィー(TLC)を用いた対照物
質とのコクロマトグラフィーに供した。TLC 板上の放射性成分は、リニアアナライ
ザーで定量するか又はシリカゲル板から液体シンチレーションカクテル中に掻
き取った後、LSC で定量した。更に、高速液体クロマトグラフィー(HPLC)を用い
て代謝物を単離し、MS 及び $^1\text{H-NMR}$ 分析により同定した。また、代謝物の同定／
特徴付けには、酵加水分解、酵素加水分解も適用した。

5. 乾燥子実のグルコースによる放射能の取り込み

子実構成成分グルコースによる放射能の取り込みを調べるため、通常抽出後の乾
燥子実固形残留物（非抽出性残留 1）を酸加水分解処理してグルコースを取り出し、
取り込まれた放射能を測定した。

【結果】

1. 総放射能残留量 (TRR) (表 1)及び処理放射能の植物体への吸収率

総放射能残留量 (TRR) は、未成熟 (青刈り) とうもろこしで 5.84 mg/kg (植付け後第 33 日) 及び 1.52 mg/kg (同第 61 日) であった。成熟とうもろこしの TRR は、かいは用植物体 : 3.08 mg/kg、外皮 : 0.21 mg/kg、穂軸 : 0.12 mg/kg、乾燥子実 : 0.04 mg/kg であり、乾燥子実中の TRR は極めて少なかった。

未成熟 (青刈り) とうもろこしでは、通常抽出により TRR の 80% 以上が抽出された。成熟とうもろこしでは、人畜の可食部であるかいは用植物体及び乾燥子実において通常抽出により TRR の 67.9% (かいは用植物体) ~73.8% (乾燥子実) が抽出され、未成熟 (青刈り) とうもろこしと比して抽出効率が低下した。

種子粉衣処理した放射能のとうもろこし植物体への吸収率は、未成熟 (青刈り) とうもろこしで約 4.2% (植付け後第 33 日) 及び約 10.2% (同第 61 日)、成熟とうもろこしで約 20% (同 134 日) であった。

表 1: 通常抽出における放射能分布

植物部位		植付け後 経過日数	通常抽出画分		非抽出性残留		総放射能残留量 (TRR)	
			%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
未成熟 (青刈り)		33	92.4	5.40	7.6	0.44	100.0	5.84
とうもろこし		61	83.0	1.29	17.0	0.23	100.0	1.52
成熟 とう もろ こし	かいは用植物 体	134	67.9	2.09	32.1	0.99	100.0	3.08
	外 皮	134	68.3	0.14	31.7	0.07	100.0	0.21
	穂 軸	134	71.7	0.09	28.3	0.03	100.0	0.12
	乾燥子実	134	73.8	0.03	26.2	0.01	100.0	0.04

2. 代謝物の分布

未成熟 (青刈り) とうもろこし (表 2)

粉衣処理 33 日後及び 61 日後に採取した未成熟 (青刈り) とうもろこしでは、TRR の 92.4% (処理 33 日後) 及び 83.0% (処理 61 日後) が抽出された。最も多く認められた成分は未変化の親化合物 [I] であり、処理 33 日及び 61 日後でそれぞれ 65.2%TRR (3.81 mg/kg) 及び 47.2%TRR (0.72 mg/kg) であった。

TRR の 10%を越える代謝物として

が認められた。

表 2：未成熟（青刈り）とうもろこしにおける代謝物の分布

	未成熟とうもろこし (粉衣処理 33 日後)		未成熟とうもろこし (粉衣処理 61 日後)	
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
通常抽出画分 (計)	92.4	5.40	83.0	1.26
親化合物 [I]	65.2	3.81	47.2	0.72

成熟とうもろこし (表 3～表 5)

かいば用植物体 (表 3)

通常抽出ではかいば用植物体 TRR の 67.9%のみが抽出されたため、苛酷抽出も行った。かいば用植物体における最も多く認められた主要成分は、未変化の親化合物 [I] であった。親化合物 [I] は、未成熟とうもろこしで 65.2% TRR (3.81 mg/kg、処理 33 日後) であったのに対し、かいば用植物体では通常抽出及び苛酷抽出を合わせて 26.9% TRR (0.825 mg/kg) であった。

その他の主要成分として、

が確認された。

表 3 : 成熟とうもろこし (かいば用植物体) の代謝物分布

かいば用植物体	通常抽出画分		苛酷抽出画分						計	
			CH ₃ OH 還流		6N HCl/CH ₃ OH 還流		2N NaOH/CH ₃ OH 還流			
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
親化合物 [I]	22.2	0.68	2.1	0.065	2.3	0.071	0.3	0.009	26.9	0.825

外皮及び穂軸 (表 4)

外皮及び穂軸における主要成分は未変化の親化合物 [I] であり、外皮及び穂軸でそれぞれ TRR の 43.3% (0.091 mg/kg) 及び 46.6% (0.056 mg/kg) を占めた。

が認められた。

表 4 : 成熟とうもろこし (外皮及び穂軸) の代謝物分布

	成熟とうもろこし (粉衣処理 134 日後)			
	外皮		穂軸	
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
通常抽出画分 (計)	68.3	0.143	71.7	0.086
親化合物 [I]	43.3	0.091	46.6	0.056

乾燥子実 (表 5)

乾燥子実中の主要成分は未変化の親化合物 [I] であった。親化合物 [I] は通常抽出で TRR の 25.2% (0.010 mg/kg) を占め、また苛酷抽出でもとの含量で TRR の 1.2% (0.0005 mg/kg) を占めた。主要代謝物として、

を占めた。

その他に

が認めら

れた。

3. 乾燥子実のグルコースによる放射能の取り込み

乾燥子実のグルコースに取り込まれた放射能は、少なくとも TRR の 6% であった。このグルコースに取り込まれた放射能は、土壌から生成した放射性二酸化炭素が再同化されたものと考えられた。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はバイエルクロップサイエンス株式会社にある。

表 4 : 成熟とうもろこし (乾燥子実) の代謝物分布

乾燥子実	通常抽出画分		苛酷抽出画分						計	
			CH ₃ OH 還流		6N HCl/CH ₃ OH 還流		2N NaOH/CH ₃ OH 還流			
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
親化合物 [1]	25.2	0.010	1.2	0.0005	—	—	—	—	26.4	0.0105

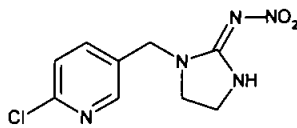
4. 代謝経路

[I] をとうもろこしに種子粉衣処理した場合、[I] は顕著に代謝された。分析した各部位（未成熟とうもろこし、成熟とうもろこし—かいば用植物体、外皮、穂軸及び乾燥子実）では、何れも未変化の親化合物 [I] が最も多く認められた。また各部位において、

種子粉衣処理後のとうもろこしにおける [I] の代謝経路は、他の植物代謝経路と類似し、以下の が確認された。

次頁に、[I] の推定代謝経路を示す。

とうもろこしにおける推定代謝経路



親化合物 [1]

2. 植物体内運命に関する試験

(10) イミダクロプリドの棉における代謝—種子粉衣処理

(代謝資料No.16)

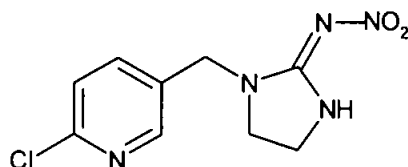
試験機関：

報告書作成年月日：1992年8月4日

供試標識化合物

化学名：1-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-N-ニトロイミダゾリジン-2-イリデンアミン

化学構造：



*：標識部位

標識：[^{-14}C] イミダクロプリド [I]

比放射能：5.51～5.56 MBq/mg (149～150.2 $\mu\text{Ci/mg}$)

放射化学的純度： %

標識位置の設定理由：

【方法】

バイエル社のモンハイム代謝研究所の栽培エリアにおいて、慣行条件に基づく種子粉衣処理実験を行った。また代謝物同定を容易にするため、過剰量の薬量を土壌灌注処理した試験も併せて行った。

1. 作物及び栽培方法

栽培容器に壤質シルト土壌を入れ、棉（品種：Coker 310）を栽培した。容器内の土壌に適時給水し、植物の生長が適切に保たれるようにした。

2. 薬剤処理及び試料の採取

種子粉衣処理：放射性標識 [I] を用いて 70%粉末製剤 (70WS) を調剤し、棉の種子 18 個に通常施用量 (460g 有効成分/100kg 種子) で種子粉衣した。種子粉衣後直ちに種子を栽培容器に植付けた (発芽した種子は 18 個中 9 個)。試験期間中、植物体から落下した葉及び花は全て採取した。成熟期 (植付け 211 日後) に植物体を収穫し、棉実 (種子及び棉毛) 及び植物残部に分割した。棉実は、更に種子及び棉毛に分割した。

土壌灌注処理：種子の植付け後、発芽した 2 個の栽培容器を用いて過剰量の土壌灌注処理を行った。処理は、植付け後 11～145 日の間に計 5 回 (累計施用量：約 30mg 有効成分) 行った。試験期間中、植物体から落下した葉及び花は全て

採取した。植付け 230 日後に、種子粉衣処理と同様に試料を採取した。

3. 抽出及び分画

各部位（種子、葉、棉毛及び植物残部）について、① ソクスレー抽出（n-ヘキサン）、② 摩砕抽出（メタノール/水（1/1）混液及びメタノール）、③ 還流抽出（メタノール、メタノール/6N 塩酸（1/1）混液、メタノール/2N 水酸化ナトリウム（3/2）混液）の一部又は全てを行った。

摩砕抽出で得られた抽出物を混合し、メタノールを留去して得られた濃縮液を XAD4 吸着樹脂カラムにより精製した。溶出は水及びメタノールを用いて行い、水には放射能が含まれていなかったため廃棄した。

過剰量を土壤灌注処理した棉試料の抽出は、種子粉衣処理の試料と同様に種子のみについて行った。

4. 放射エネルギーの測定、成分の定量及び同定/特徴付け

ソクスレー抽出、摩砕抽出及び還流抽出の各抽出画分、そして XAD4 樹脂カラムで得られたメタノール相中の放射能を、液体シンチレーションカウンター（LSC）により測定した。また抽出後の固体試料中の放射エネルギーはオキシダイザーで燃焼させ、生じた $^{14}\text{CO}_2$ を液体シンチレーションカウンターで測定した。

種子及び葉の各抽出画分（但し、還流抽出のメタノール/2N 水酸化ナトリウム抽出画分を除く）及び XAD4 樹脂カラムによる精製物を、一次元及び二次元の薄層クロマトグラフィー（TLC）に供し、リニアアナライザー又は X 線フィルムにより定量した。

代謝物の同定/特徴付けには、酵素加水分解、マススペクトロスコピーも適用した。

5. 土壤灌注処理した棉一種子を用いた代謝物の同定/定量及び代謝物の保存安定性

土壤灌注処理した棉一種子は分析まで冷凍保存し、保存開始後 21 日に抽出及び分画を行い代謝物を定量した。また別途冷凍保存した種子を保存開始後 279 日に抽出及び分画し、代謝物の安定性を検討した。

【結果】

1. 総放射能残留量及び放射能の吸収率(表 1～表 2)

[I] を種子粉衣処理又は過剰量を土壌灌注処理した綿—各部位（種子、棉毛、植物残部及び葉）における総放射能残留量（TRR）を表 1 に示す。

種子粉衣処理した綿では各部位の TRR は少なかった。葉では TRR として 0.11mg/kg が認められたが、種子、植物残部及び棉毛の TRR は何れも 0.01mg/kg を下回った（種子：0.0049mg/kg、植物残部：0.0049mg/kg、棉毛：0.0019mg/kg）。過剰量を土壌灌注処理した綿—各部位では、種子粉衣処理と比較して TRR が多く、種子、植物残部及び棉毛の TRR はそれぞれ 9.35mg/kg、3.50mg/kg 及び 0.72mg/kg であった。

表 1：種子粉衣処理又は土壌灌注処理した綿—各部位の TRR

綿—部位	TRR	
	種子粉衣処理 (mg/kg)	土壌灌注処理 (mg/kg)
種 子	0.0049	9.35
植物残部	0.0050	3.50
棉 毛	0.0019	0.72
葉	0.11	

種子粉衣処理した放射能の綿への移行率は、植物体全体では 4.88%と限られていた。綿に移行した放射能の大部分は葉に存在した。

表 2：種子粉衣処理時の綿への移行率

	種子	植物残部	棉毛	葉	全体
放射能吸収率	0.067%	0.068%	0.020%	4.72%	4.88%

2. 各部位における放射能の分布（表 3）

表 3 に、種子粉衣処理した綿—各部位（種子、植物残部、棉毛及び葉）における放射能の抽出画分への分布を示す。

種子粉衣処理：

種子では、種子中の植物油脂が抽出される n-ヘキサン画分に放射能は認められず、またメタノール/2N 水酸化ナトリウム画分にも放射能は認められなかった。種子中の放射能は、メタノール/水画分、メタノール画分、メタノール/6N 塩酸画分にそれぞれ TRR の 33.4%、23.3%及び 28.9%が分配された。未抽出残留は TRR の 14.4%（0.0007mg/kg）であった。

植物残部及び葉では、メタノール/水画分に何れも TRR の 70%以上が抽出された。なお植物残部では、摩砕抽出後の還流抽出（メタノール画分、メタノール/6N 塩酸画分）による放射能の遊離は認められなかった。棉毛の放射能

は、用いた抽出方法では抽出されなかった。

土壌灌注処理：

過剰量を土壌灌注処理した棉一種子では、大部分の TRR がメタノール/水面分 (19.9%TRR)、メタノール画分 (44.5%TRR) 及びメタノール/6N 塩酸画分 (32.4%TRR) に分配された。

表 3：棉—各部位の抽出放射能

		ソクスー抽出	摩砕抽出	還流抽出			未抽出 残留	合計
		n-ヘキサン 画分	MeOH/水 画分	MeOH 画分	MeOH/HCl 画分	MeOH/NaOH 画分		
種子粉衣処理								
種子	%TRR	0.0	33.4	23.3	28.9	0.0	14.4	100.0
	mg/kg	0.0000	0.0016	0.0012	0.0014	0.0000	0.0007	0.0049
植物 残部	%TRR	—	76.4	0.0	0.0	—	23.6	100.0
	mg/kg	—	0.0038	0.0000	0.0000	—	0.0012	0.0050
棉毛	%TRR	—	—	0.0	0.0	—	100.0	100.0
	mg/kg	—	—	0.0000	0.0000	—	0.0019	0.0019
葉	%TRR	—	73.2	—	—	—	26.8	100.0
	mg/kg	—	0.0800	—	—	—	0.0300	0.1100
土壌灌注処理								
種子	%TRR	0.6	19.9	44.5	32.4	2.1	0.5	100.0
	mg/kg	0.05	1.86	4.16	3.03	0.20	0.05	9.35

MeOH：メタノール、HCl：塩酸、NaOH：水酸化ナトリウム、—：抽出を行わず。

3. 種子粉衣処理した綿における代謝物の分布 (表 4)

種子粉衣処理した棉一種子の TRR は 0.0049mg/kg と少なかった。従って、類似の処理方法である土壌灌注で過剰量を処理した棉一種子の結果を外挿した。

過剰量を土壌灌注処理した棉一種子では、摩砕抽出のメタノール/水面分で認められた親化合物 [I] が画分放射能の 1%のみであり、また還流抽出のメタノール画分において を占めていた。 この結果から、種子粉衣処理した棉一種子に未変化の親化合物 [I] は認められず、還流抽出のメタノール画分は で構成されていると 考えられた。また、メタノール/水面分から、痕跡量の が認められた。

葉において、 が認められた。量的に多く生成した代謝物として、

が認められた。また微量代謝物として、未変化の親化合物 [I]、

が認められた。

表 4：種子粉衣処理した棉（種子、葉）における代謝物

	種子		葉	
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
親化合物 [I]	N.D.	N.D.	2.9	0.003

植物残部は、TRR が 0.0050mg/kg (<0.01mg/kg) であったため代謝物の同定及び定量を行わなかった。なお棉毛の TRR (0.0019%) は非抽出性であったため、棉毛の天然成分に取り込まれていると想定された。

4. 土壌灌注処理した代謝物の同定/生成量及び代謝物の保存安定性 (表 5)

表 5 に、土壌灌注処理した棉一種子における代謝物生成量及び代謝物の保存安定性結果を示す。

摩砕抽出で得られたメタノール/水面分では、第一回目 (保存開始後 21 日) の分析で未変化の親化合物 [I] (0.8%TRR、0.08mg/kg) 及び

が認められ、

も認められた。第二回目 (保存開始後 279 日)

の分析では、親化合物 [I]、

に量的な変化は認められ

なかった。しかしながら、

と考えられた。

還流抽出のメタノール画分では、第一回目及び第二回目の分析で

が主たる成分であった。また

が認められた

が、 [

生成した人工生成物であると考えられた。

還流抽出のメタノール/6N 塩酸画分からは、

が認められた。メタノール/水画分及びメタノール画分をメタノール/6N 塩酸 (1 : 1) 混液で6時間還流処理すると、これら2画分に含まれる代謝物が
に
変換された。従って、

は還流条件下での人工生成物であると考えられた。

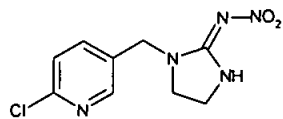
表5：土壌灌注処理した棉一種子における代謝物生成量及び代謝物の保存安定性

	第1回目		第2回目	
	保存開始後 21 日		保存開始後 279 日	
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
ソクスレー抽出 (n-ヘキサン画分)	0.6	0.05	0.7	0.06
摩砕抽出 (メタノール/水画分)	19.9	1.86	19.2	1.80
親化合物 [I]	0.8	0.08	1.0	0.09
還流抽出 (メタノール画分)	44.5	4.16	40.1	3.75
還流抽出 (メタノール/6N 塩酸画分)	32.4	3.03	37.2	3.48
還流抽出 (メタノール/2N 水酸化ナトリウム画分)	2.1	0.20	—	—
合 計	100.0	9.35	100.0	9.35

5. 種子粉衣処理後の棉における代謝経路(図2)

次頁に種子粉衣処理後の棉における [I] の想定代謝経路を示す。

棉における推定代謝経路



親化合物 [I]

2. 植物体内運命に関する試験

(11) イミダクロプリドのタバコにおける代謝

(代謝資料No.17)

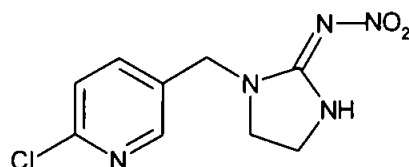
試験機関：

報告書作成年月日：1992年10月12日

供試標識化合物

化学名：1-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-N-ニトロイミダゾリジン-2-イリデンアミン

化学構造：



*：標識部位

標識：[^{14}C]イミダクロプリド[I]

比放射能：1.15MBq/mg (31.08 $\mu\text{Ci}/\text{mg}$)

放射化学的純度： %

標識位置の設定理由：

【方法】

1. 作物及び栽培方法

栽培容器にシルト質壤土 (USDA) を入れ、タバコ種子 (品種：Virginia) を植付け、温室にて栽培した。適時給水、植物防疫及び施肥を行い、植物の成長が適切に保たれるようにした。

2. 薬剤処理及び試料の採取

放射能標識[I]を用いて水和剤 WP25 を調製した。薬剤の処理として、タバコ周囲の土壌への灌注処理 1 回 (処理溶液中の有効成分 0.05%)、その後はタバコ植物体中部の 8 葉に散布処理 3 回 (処理溶液中の有効成分 14.6%) を行った。処理量は、1 回の土壌灌注処理で 20 mg 有効成分/植物、3 回の散布処理で 8.4 mg 有効成分/植物であり、計 28.4 mg 有効成分/植物であった。

最終散布処理の 2 週間後に、散布処理を行ったタバコ葉を採取した。

3. 試料の抽出及び精製

採取したタバコ葉を細切り後に均一化 (液体窒素下) し、メタノール/水混液 (1:1、1 回)、メタノール (1 回) 及びジクロロメタン (2 回) で順次抽出し、各抽出物を混合した (混合抽出物)。

4. 混合抽出物の精製

代謝物同定に使用するため、混合抽出物の一部を濃縮して水性残渣とし、XAD4樹脂カラムによる精製を行った。精製に使用した溶出液は酸性水及びメタノールであった。

4. 放射エネルギーの測定、放射性成分の定量及び同定

混合抽出物及び XAD 4 樹脂カラムで精製後に得られた水溶出液及びメタノール溶出液中の放射エネルギーは、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測定した。また、抽出後の固体試料中の放射エネルギーは、オキシダイザーで燃焼後、生じた $^{14}\text{CO}_2$ を液体シンチレーションカウンターで測定した。

混合抽出物、XAD 4 樹脂カラムで精製後に得られた水溶出液及びメタノール溶出液を、一次元及び二次元の薄層クロマトグラフィー (TLC) 分析ならびに高速液体クロマトグラフィー (HPLC) に供した。成分の定量は、リニアアナライザー (TLC) 及び放射能又は UV 検出器 (HPLC) により行った。溶液中の成分は対照標準物質とのコクロマトグラフィー、MS 及び $^1\text{H-NMR}$ により同定した。

【結果】

1. 総放射能残留 (TRR) 及び分布 (表 1)

たばこ葉における総残留量は 10.20 mg/kgあり、供試した抽出方法でその 97.7% (9.97 mg/kg) が抽出された。未抽出性残留は僅か2.3% (0.23 mg/kg) であった。

表 1: たばこ葉における総残留量及び分布

	TRR	
	%TRR	mg/kg
混合抽出物	97.7	9.97
未抽出残留	2.3	0.23
合計	100	10.20

2. 代謝物の定量及び同定 (表 2)

TLC 及び HPLC によるコクロマトグラフィー、MS 及び $^1\text{H-NMR}$ により、表 2 に示す代謝物が同定された。

たばこにおける主要成分は未変化の親化合物 [I] であり、TRR の 77.7% (7.93 mg/kg) を占めた。

親化合物 [I] 以外に認められた代謝物は、

であった。

表 2：たばこ葉における代謝物の生成量

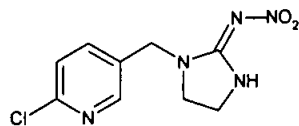
	%TRR	mg/kg
混合抽出物	(97.7)	(9.97)
親化合物 [I]	77.7	7.93

3. 代謝経路

たばこ葉における主要成分は未変化の親化合物 [I] (77.7%TRR、7.93 mg/kg) であった。

たばこにおける代謝経路を次頁に示す。

たばこにおける代謝経路



親化合物 [1]

2. 植物体内運命に関する試験

(12) イミダクロプリドの果実における代謝

(代謝資料No.参考資料1)

試験機関：

報告書作成年月日：1991年12月2日

供試化合物：イミダクロプリド [I] %水和剤

方法及び目的：

作物残留性試験においてイミダクロプリド [I] の %水和剤を2回散布した4種果実（ぶどう、なし、もも、りんご）及びなすを用いて、果実中に存在するを有する代謝物の残留量を検討した。

結 果：

(1)

表1：果実中の残留量

試料	試料調製場所 (品種)	残留量 (ppm)			
		親化合物 [I] (a)			
ぶどう	山梨(デラウェア)	0.456			
	長野(巨峰)	0.111			
なし	千葉(幸水)	0.162			
	鳥取(幸水)	0.060			
りんご	秋田(つがる)	0.104			
	福島(スターキングデリシヤス)	0.029			
もも	福島(白鳳)	0.084			
	山梨(白鳳)	0.125			
なす	茨城(千両2号)	0.084			

(2)

表2：

試料	試料調製場所 (品種)				
ぶどう	山梨(デラウェア)				
	長野(巨峰)				
なし	千葉(幸水)				
	鳥取(幸水)				
りんご	秋田(つがる)				
	福島(スターキングデリシヤス)				
もも	福島(白鳳)				
	山梨(白鳳)				
なす	茨城(千両2号)				

(3) 果実中の代謝物の特徴付け (表3)

ぶどう(デラウェア)及びりんご(つがる)について行った

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バイエルクロップサイエンス株式会社にある。

ぶどうでは、全残留量に占める有機可溶性代謝物の割合は78%であった。その主成分は親化合物 [I] であり、その比率は全残留量の45%であった。

表3：水酸化体 [III] 及びオレフィン体 [IV] の分析結果

作物 (品種)	全残留量	残留量 (ppm)						
		有機可溶性代謝物					水溶性代謝物	
		親化合物 [I]						
ぶどう (テラウエア)	1.02 ^{*)} (100)	0.456						
		(45)						
りんご (つがる)	0.12 ^{*)} (100)	0.104						
		(83)						

括弧 () 内の数値は、全残留量を100%とした時の割合 (%)

(4) 果実における代謝経路

親化合物 [I] の水和剤を散布した果実中の代謝経路は、次のとおり考えられた。

3. 土壌における運命

(1) イミダクロプリドの好氣的湛水土壌中運命試験

(代謝資料 No.18)

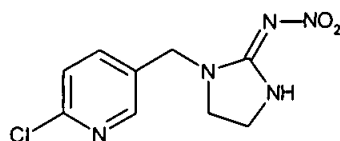
試験機関：

報告年月日：1990年12月13日

供試標識化合物

化学名：1-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-N-ニトロイミダゾリジン-2-イリデンアミン

化学構造：



*：標識部位

標識：[^{-14}C] 標識イミダクロプリド [I]

(比放射能：140 $\mu\text{Ci/mg}$ 、放射化学的純度： %)

標識位置の設定理由：

【方法】

1. 供試土壌

以下の2種類の水田土壌を用いた。

供試土壌の概要

	土壌採取地		
	高知	牛久	
成因・土性	沖積・軽埴土	火山灰・軽埴土	
pH (H ₂ O)	6.7	5.9	
総炭素含有量 (%)	2.1	6.7	
有機炭素含有量 (%)	3.12	11.31	
カチオン交換容量 (me/100 g)	13.8	29.5	
リン酸吸収係数	580	1460	
微生物活性 ($\mu\text{g}\cdot\text{glucose}/\text{土壌 g}$)	処理 2 週間前	2.025	2.325
	処理時	1.493	1.980
	処理 27 週間後	1.430	1.647

2. 処理方法及び試料採取

2 mmの篩にかけた供試土壌各 50 g (乾土重) をガラス容器に入れ、水を加えながら懸濁し、水深 2 cm に調製した。蒸留水に溶解した ^{14}C 標識 [I] を乾土重当たり 0.5 mg/kg の施用量で処理 (添加) し、よく混和させた。暗黒条件下、設定温度約 28°C (測定値: 29±3°C) にて 27 週間にわたって培養した。

培養システムには、二酸化炭素を除去した空気を供給し、生成する揮発性物質及び二酸化炭素をそれぞれ対応するクメン捕集液及びメチルセロソルブ/モノエタノールアミン (3:1) 捕集液により 2 週間間隔で捕集した。また、田面水及び土壌試料は、薬剤添加直後 (0 週)、1、3、7、15 及び 27 週間後に採取し、分析に供した。(以上、試験 I とする。)

また、抽出効率の検討及び代謝物の分離・同定のため、以下の 3 実験も行った。

・抽出効率の検討:

牛久 (火山灰) 土壌に ^{14}C 標識 [I] のアセトン溶液を添加 (施用量: 乾土重当たり 0.38 mg/kg) し、試験 I と同様に 6 週間培養した。培養終了後に田面水を分離し、土壌について各種溶媒によるソックスレー抽出 (1 回)、超音波抽出 (計 4 回) 及び振とう抽出 (計 4 回) を行い、抽出効率を検討した。

・過剰量の ^{14}C 標識 [I] を用いた代謝物の分離・同定:

高知 (沖積) 土壌 50 g に ^{14}C 標識 [I] のアセトン溶液を添加 (施用量: 乾土重当たり 0.38 mg/kg) し、試験 I と同様に 24 週間にわたって培養した。2 週間毎に揮発性物質を捕集し、培養終了後に田面水と土壌を採取して代謝物を分離・同定した。

・過剰量の非標識 [I] を用いた代謝物の分離・同定:

高知 (沖積) 土壌 5 kg に非標識 [I] のアセトン溶液を添加 (施用量: 乾土重当たり 20 mg/kg) し、湛水状態を保ちながら 24 週間にわたって培養した。培養終了後に土壌 (田面水を含む) を採取し、代謝物を分離した。

3. 抽出

1) 揮発性物質及び $^{14}\text{CO}_2$

採取した各捕集液を用いて液体シンチレーションカウンター (LSC) により放射能を測定した。

2) 田面水

採取した田面水についてジクロロメタン分配を計 3 回行った。有機相と水相から一定量を採取し、LSC により放射能を測定した。

3) 土 壌 (通常抽出)

土壌の (通常) 抽出処理として、上述の抽出効率の検討結果に基づいたアセトニトリルによる超音波抽出を行い、遠心分離により上澄と沈殿に分割した。沈殿について 80% アセトニトリルによる超音波抽出 (2 回) 及び洗浄 (1 回) を行った。各抽出液及び洗浄液を合わせて溶媒留去により濃縮した。濃縮物

をジクロロメタン分配（3回）及び洗浄（1回）し、有機相及び水相に分割後、各相の一定量を採取してLSCで放射能を測定した。

4) 結合性残留の苛酷抽出及び特徴付け

第3週から第27週時の土壌試料から得た抽出後の残渣（未抽出残留）について、次の2種類（① 還流抽出 + ② 酸/アセトニトリル抽出）の苛酷抽出を行い、放射性成分の定量を行った。

① 還流抽出：

アセトニトリルによる加熱還流抽出後、抽出液を濃縮して水を加え、ジクロロメタン分配して有機相と水相に分割した。

② 酸/アセトニトリル抽出：

0.1N塩酸/アセトニトリル混液による超音波抽出後、抽出液を濃縮してジクロロメタンで3回分配し、有機相と水相に分割した。

また第15週及び第27週の土壌試料については、上記（①及び②）の苛酷抽出後の土壌残渣（結合残留）を用いて特徴付け（ヒューミン、フルボ酸及びフミン酸への分画）を行った。

5) 放射性化合物の定性、定量及び同定

田面水（有機相）及び土壌抽出物（有機相及び水相）中の放射性化合物の定性は、薄層クロマトグラフィー（TLC）により行った。定量にはTLCリアナライザーを使用した。田面水の水相は、存在する放射能が少なかったため、放射性化合物の定性/定量を行わなかった。

また、化合物の同定は主としてTLCにて行ったが、確認のためHPLCも行った。

【結果】

1. 物質収支（表1）

薬剤添加直後（第0週）における田面水への放射能分布は、高知（沖積）土壌で処理放射能の53%、牛久（火山灰）土壌で同16%であった。田面水中の放射能は、第1週に処理放射能の17.3%（高知-沖積土壌）～7.6%（牛久-火山灰土壌）まで低下した。その後、田面水中の放射能は徐々に低下し、第27週には両土壌とも0.2%となった。また第1週以降、田面水と土壌間の放射能分布比は圧倒的に土壌に偏っており、処理放射能の80%以上が常に土壌に分布していた。

田面水に分布した放射能は主として有機相として回収されたが、回収量は経時的に減少した。水相として回収された田面水の放射能は、試験期間を通じて極微量であった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はバイエルクロップサイエンス株式会社にある。

一方、土壌に分布した放射能も主として有機相として回収された。有機相として回収された土壌中放射能は経時的に減少し、一方、水相として回収された土壌中放射能は経時的に増加した。また土壌の未抽出残留は経時的に増加し、第27週には土壌中放射能の約80%以上を占めた。

二酸化炭素の生成は極微量であり、第27週の高知土壌及び牛久土壌でそれぞれ1.5%及び0.6%認められた。その他の揮発性物質は、認められなかった。

表1: 物質収支 (表中の数値は、処理放射能に対する%)

土 壤		高知 (沖積) 土壌						牛久 (火山灰) 土壌					
		0	1	3	7	15	27	0	1	3	7	15	27
培養期間(週)													
田 面 水	有機相	52.3	16.7	6.8	2.0	0.6	0.1	15.6	7.4	3.6	1.3	0.6	0.1
	水 相	1.0	0.6	0.4	0.3	0.2	0.1	0.4	0.2	0.1	0.1	<0.1	0.1
	計	53.3	17.3	7.3	2.3	0.8	0.2	16.0	7.6	3.7	1.4	0.6	0.2
土 壌	有機相	51.5	72.0	72.6	55.0	32.6	9.1	84.0	79.7	79.6	74.0	49.9	13.7
	水 相	0.7	2.0	4.2	11.2	15.5	12.0	1.4	1.5	2.5	2.4	4.0	5.2
	未抽出残留	1.0	7.3	20.8	31.9	50.9	75.9	3.5	9.7	17.7	25.4	44.0	80.0
	計	53.2	81.3	97.6	98.1	99.0	97.0	88.9	90.9	99.8	101.8	97.9	98.9
揮発性物質		<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1
¹⁴ C ₂		<0.1	0.1	0.3	0.7	1.0	1.5	<0.1	0.1	0.2	0.4	0.5	0.6
回収率		106.5	98.7	105.1	101.1	100.8	98.7	104.9	98.6	103.7	103.6	99.0	99.7

2. 代謝物の同定

構造解析の結果、主要放射性成分として未変化の親化合物 [I] 及び

が同定された。

3. 放射性成分の生成量 (表2)

田面水及び土壌における放射性成分の生成量を表2に示す。

高知 (沖積) 土壌の試験系 (田面水及び土壌の合計) において、未変化の親化合物 [I] が第3週に処理放射能の78.9%を占め、第27週時には8.5%まで減少した。これに伴い、

を示した。

となった。

高知 (沖積) 土壌における未抽出残留は経時的に増加し、第3週に処理放射能の20%を上回り、第27週時には同75.9%となった。

また牛久 (火山灰) 土壌の試験系 (田面水及び土壌の合計) では、親化合物 [I] の減衰は高知 (沖積) 土壌と比して遅く、第27週には処理放射能の13.7%を占めた。

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バイエルクロップサイエンス株式会社にある。

牛久（火山灰）土壌における結合性残留は、高知（沖積）土壌と同様に経時的に増加した。その量は、第3週時に処理放射能の20%近く（17.7%）に到達し、第27週時には80.0%となった。

表2の結果に基づく親化合物〔I〕のDT50は、高知（沖積）土壌で53日、牛久（火山灰）土壌で69日であった。

表2：田面水及び土壌における放射性成分の生成量（表中の数値は、処理放射能に対する%）

土 壌	高知（沖積）土壌						牛久（火山灰）土壌					
	0	1	3	7	15	27	0	1	3	7	15	27
培養期間(週)												
田面水（計）	53.3	16.7	7.2	2.3	0.8	0.2	16.0	7.6	3.7	1.4	0.6	0.2
親化合物〔I〕	52.0	16.4	6.7	1.9	0.6	0.1	15.5	7.1	3.5	1.3	0.5	0.1
土 壌（計）	53.2	81.3	97.6	98.1	99.0	97.0	85.4	90.9	99.8	101.8	97.9	98.9
親化合物〔I〕	51.8	72.5	72.2	52.5	27.8	8.4	85.0	80.2	80.7	71.8	45.7	13.6
親化合物〔I〕 の合計	103.8	88.9	78.9	54.4	28.4	8.5	100.5	87.3	84.2	73.1	46.2	13.7

4. 未抽出残留の苛酷抽出及び特徴付け（表3及び表4）

表3に、第3週から第27週の土壌試料（未抽出残留）について行った苛酷抽出の結果を示す。また表4に、第15週及び第27週の土壌試料について苛酷抽出後の結合残留の特徴付け（ヒューミン、フルボ酸及びフミン酸への分画）を示す。

苛酷抽出により、供試土壌の未抽出残留から親化合物〔I〕が回収された。

高知（沖積）土壌の未抽出残留から、親化合物〔I〕として第3週に処理放射能の10.8%が回収され、その後は処理放射能の4.5%～5.4%の範囲で回収された。また

と増加した。

牛久（火山灰）土壌でも、親化合物〔I〕として第3週から第27週を通して処理放射能の9.4%～12.1%の範囲で回収された。

高知（沖積）土壌及び牛久（火山灰）土壌を通じ、未抽出残留から回収される、また親化合物の量に時間による変化は認められなかった。

従って、親化合物は土壌中で変換され、その大部分が土壌に吸着されると考えられた。

また苛酷抽出後に得られる結合残留の特徴付けの結果、ヒューミン分画に比較的多くの放射能が取り込まれていたことが示された。

表3：未抽出残留の苛酷抽出（表中の数値は、処理放射能に対する%）

土 壌		高知（沖積）土壌				牛久（火山灰）土壌			
培養期間（週）		3	7	15	27	3	7	15	27
未抽出残留（計）		20.8	31.9	50.9	75.9	17.7	25.4	44.0	80.0
還流 抽出	有機相(計)	10.8	5.8	7.0	7.7	12.2	11.0	11.0	19.3
	親化合物 [I]	10.5	5.0	5.4	4.5	11.9	10.1	9.4	12.1
	水相(計)	4.9	12.6	22.4	40.1	1.8	6.4	9.3	21.1
	親化合物 [I]	0.3	<0.1	<0.1	<0.1	0.2	<0.1	<0.1	<0.1
酸/ CH ₃ CN 抽出	有機相(計)	<0.1	<0.1	0.1	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1
	水相(計)	3.2	8.1	11.0	12.2	2.2	5.2	13.4	20.4
結合残留		1.9	5.4	10.4	15.9	1.5	2.8	10.3	19.2
親化合物 [I] の合計		10.8	5.0	5.4	4.5	12.1	10.1	9.4	12.1

CH₃CN：アセトニトリル

表4：土壌残渣の特徴付け（表中の数値は、処理放射能に対する%）

土 壌	高知（沖積）土壌		牛久（火山灰）土壌	
培養期間（週）	15	27	15	27
ヒューミン分画	4.9	8.4	5.0	9.8
フルボ酸分画	2.5	3.6	1.6	3.2
フミン酸分画	2.1	3.1	3.0	5.5
合 計	9.5	15.1	9.6	18.5

5. 試験系（田面水、土壌及び）全体における分布（表5）

試験系（田面水及び土壌）全体における代謝物生成量を表5に示す。

表 5 : 試験系 (田面水及び土壌) 全体における代謝物生成量

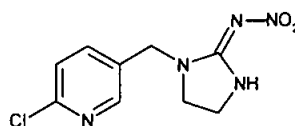
(表中の数値は、処理放射能に対する%)

土 壤		高知 (沖積) 土壌						牛久 (火山灰) 土壌					
		0	1	3	7	15	27	0	1	3	7	15	27
田 面 水	親化合物 [I]	52.3	16.7	6.8	2.0	0.6	0.1	15.6	7.4	3.6	1.3	0.6	0.1
	その他放射能	0.3	0.3	0.1	0.1	<0.1	<0.1	0.1	0.3	0.1	<0.1	0.1	<0.1
	水相	1.0	0.6	0.4	0.3	0.2	0.1	0.4	0.2	0.1	0.1	<0.1	0.1
土 壌	親化合物 [I]	51.8	72.5	83.0	57.5	33.2	12.9	85.0	80.2	92.8	81.9	55.1	25.7
回収率		106.5	98.7	105.1	101.1	100.8	98.7	104.9	98.6	103.7	103.6	99.0	99.7

6. 推定代謝経路

以下に、好氣的湛水土壌中における [I] の推定代謝経路を示す。

好氣的湛水土壌中における [I] の推定代謝経路図



親化合物 [I]

3. 土壌における運命

(2) イミダクロプリドの土壌中の好氣的分解・代謝

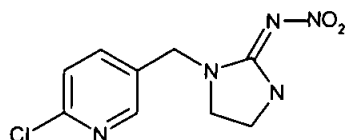
(代謝資料 No. 19)

試験機関：

報告年月日：1990年3月13日

化学名：1-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-N-ニトロイミダゾリジン-2-イリデンアミン

化学構造：



*：標識部位

標識：[$-^{14}\text{C}$] 標識イミダクロプリド [I]
(比放射能：5.57MBq/mg、放射化学的純度： %)

標識位置の設定理由：

【方法】

1. 供試土壌

以下の土壌1種類を用いた。

土 壌	採 取 地	土 性 (USDA 法)	p H		有機炭素 含量(%)	カチオン 交換容量 (meq/100g)	保水量 (%)
			H ₂ O	CaCl ₂			
BBA 2.2	Hanhofen (ドイツ)	壤質砂土	6.3	5.5	2.15	10	27.0

2. 処理及び処理量

土壌は2mmの篩にかけ、土壌水分は最大保水量の40%に保持した。

^{14}C - [I] のアセトニトリル溶液を石英砂に加え (約 651 μL /30 g)、かき混ぜながら溶媒を留去した後、残りの供試土壌 (1859.8 g) に加えて均一に混合した。処理量は 0.27 mg 有効成分/kg 土壌であり、この量は圃場における使用量 200g 有効成分/ha に相当する。

3. インキュベーション及び試料採取

500ml の各三角フラスコにそれぞれ土壌 100g (乾土重) を入れ、 $^{14}\text{CO}_2$ 及び揮発性有機化合物の捕集装置 (石英棉栓[パラフィン油処理]及びソーダ石灰で構成) を取り付けて $20 \pm 2^\circ\text{C}$ の暗所下で好氣的に培養した。

土壌試料は、処理後 0、1、3、7、14、35、62 及び 100 日に採取し、分析した。

4. 抽出、測定

1) 揮発性物質及び $^{14}\text{CO}_2$

石英棉栓を酢酸エチルで抽出し、液体シンチレーションカウンター (LSC) で測定した。またソーダ石灰は、1N塩酸を添加して発生した $^{14}\text{CO}_2$ をエタノール/メタノール (3:7) の捕集溶液と液体シンチレーションカクテルを含む捕集溶液に集め、LSC で測定した。

2) 土壌

土壌について、アセトニトリル、ジクロロメタン及び水の順に攪拌抽出し、各抽出物の放射能を測定した (以下、通常抽出とする)。

抽出物を有機相及び水相に分割し、それぞれ TLC 及びオートラジオグラフィーにて放射性成分の定量を行った。また HPLC による分析も行った。

また、通常抽出後の土壌 (結合残留) について、風乾後にアセトニトリルによる還流抽出を行い、TLC 及びオートラジオグラフィーにて放射性成分の定量を行った。

3) 結合性残留物

上記 2) の通常抽出後、風乾させた土壌 (結合残留) についてアセトニトリルによる還流抽出を行った。抽出物の放射能を測定し、TLC による放射性成分の定量も行った。

5. 代謝物の単離

代謝物の単離のため、二種類の土壌 (BBA 2.2 及び Monheim 1) に本薬剤の最高処理量の約 20、40、100 倍 (6、12、30mg/kg) を処理した。上記「3. インキュベーション及び試料採取」と同一条件下でインキュベーションした。土壌試料を採取後、アセトニトリルによる振とう抽出 (2回) 又はアセトニトリル (1回)、ジクロロメタン (2回) の順の振とう抽出を行った。

6. 代謝物の同定

TLC、HPLC、MS 及び $^1\text{H-NMR}$ により、代謝物の構造同定を行った。

【結果】

1. 物質収支及び放射能分布 (表 1)

試験期間を通じ、物質収支は 100%前後に保たれていた。土壌から抽出可能な放射能は経時的に減少し、処理 100 日後に処理放射能に対して 63.6%となった。

一方、結合残留は経時的に増加し、処理 100 日後には処理放射能に対して 21.6%となった。還流抽出により結合残留の一部放射能が抽出され、処理 100 日後では処理放射能に対して 7.7%が還流抽出により回収された。

また、経時的に二酸化炭素の生成が徐々に増加し、処理 100 日後には処理放射能に対して 10.0%生成した。二酸化炭素以外の揮発性物質は、痕跡 (処理放射能に対して<0.1%) 程度認められたのみであった。

表 1 : 物質収支及び放射能分布

処理後 経過 日数 (日)	処理放射能に対する%、n=2の平均値							
	抽出放射能 (通常抽出)				結合残留 ()内は還流処理で 抽出された量を示す。	揮発性 物質	¹⁴ CO ₂	合計
	CH ₃ CN	CH ₂ Cl ₂	水	計				
0	85.9	13.0	0.5	99.4	0.6 (n.a.)	n.a.	n.a.	99.9
1	93.3	5.0	1.3	99.5	4.2 (n.a.)	<0.1	0.1	103.8
3	84.6	7.4	1.9	93.8	5.2 (1.8)	<0.1	0.4	99.4
7	89.9	3.1	1.6	94.5	6.7 (2.3)	<0.1	1.0	102.2
14	86.5	3.0	2.0	91.5	8.3 (3.2)	<0.1	2.2	101.9
35	77.1	3.9	3.0	84.0	12.1 (3.7)	<0.1	4.6	100.7
62	67.9	3.1	2.7	73.6	19.9 (7.0)	<0.1	7.8	101.3
100	63.6	2.8	2.4	68.7	21.6 (7.7)	<0.1	10.0	100.2

CH₃CN : アセトニトリル、CH₂Cl₂ : ジクロロメタン、n.a. : 測定せず。

2. 代謝物の同定

同定した代謝物の大部分は、通常施用量の 100 倍量 (30 mg 有効成分/kg 土壌) を処理した土壌 BBA 2.2 より単離された。

単離された代謝物の構造解析の結果、親化合物 [I] の他、

検出された。その他に、
が考えられた。

3. 代謝物の生成量 (表 2)

主要放射性成分は未変化の親化合物 [I] であり、処理 0 日後の 97.65%から処理 100 日後の 70.65% (処理放射能に対する%、通常及び還流抽出の合計) へと減少した。処理 100 日後の親化合物 [I] は、処理放射能に対して通常抽出で 63.25%、苛酷抽出で 7.40%回収された。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はバイエルクロップサイエンス株式会社にある。

処理放射能に対して 10%以上生成した代謝物は、 $^{14}\text{CO}_2$ を除いて認められなかった。各代謝物 ($^{14}\text{CO}_2$ を除く) は、何れの採取時期においても 2.2%を上回ることはなかった。

なお認められた

と考えられた。

表 2 : 放射性成分の推移

放射性成分	処理放射能に対する% (n=2の平均値)										
	イミダクロプリド										$^{14}\text{CO}_2$
抽出法	通常	還流	計								
処理後経過日数 (日)	0	97.65	—	97.65							—
	1	97.65	—	97.65							0.10
	3	91.20	1.70	92.90							0.40
	7	91.20	2.20	93.40							1.00
	14	87.85	3.10	90.95							2.15
	35	80.00	3.50	83.50							4.60
	62	69.60	6.55	76.15							7.80
	100	63.25	7.40	70.65							9.95

N.D. : 検出されず。 — : 分析せず。*) : n=1 の値。

3. 推定半減期

本試験条件下における親化合物 [I] の推定半減期は、 188 ± 25 日と算出された。

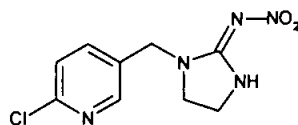
4. 好氣的土壤における推定代謝経路

好氣的土壤における代謝経路として、 の経路が考えられた。

これらは を経て最終代謝物である二酸化炭素まで代謝さされると考えられる。

次頁に、好氣的土壤中における [I] の推定代謝経路を示す。

好氣的土壤中における推定代謝経路



親化合物 [1]

3. 土壌における運命

(3) イミダクロプリドの土壌中の嫌氣的分解・代謝

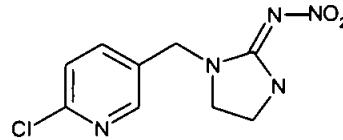
(代謝資料 No. 20)

試験機関：

報告年月日：1991年5月

化学名：1-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-N-ニトロイミダゾリジン-2-イリデンアミン

化学構造：



*：標識部位

標識：[$-^{14}\text{C}$] 標識イミダクロプリド [I]
(比放射能：5.18MBq/mg、放射化学的純度： %)

標識位置の設定理由：

【方法】

1. 供試土壌

以下の米国 カンサス市の農業用池から採取した底質（土壌）及び水を使用した。供試土壌の特性は下表のとおりである。

供試土壌の特性

採取地：米国カンサス市スタンレー		
土性		シルト質壤土
粒径分布 (%)	砂 (2000~63 μm)	13.6
	シルト (63~2 μm)	58.4
	粘土 (<2 μm)	28.0
有機炭素含有量 (%)		3.15
総窒素量 (%)		0.24
総リン量 (mg/kg)		700
炭酸カルシウム (g/kg)		14.7
pH (KCl)		6.89

2. 試験系の調製

供試土壌は 2 mm の篩にかけ、混合して乾燥重量（乾燥重量 49.48%）を求めた。各インキュベーション容器当たり供試湿土壌 101 g（乾土 約 50g）を配置した。その後インキュベーション容器に水深 10 cm となるように水を加えて密栓し、30 日間の前培養（プレインキュベーション）を行った。処理時に水層の溶存酸素を確認し、嫌氣的条件が保たれていることを確認した。

3. 処理量及び処理

米国における最大推奨圃場使用量は 200g 有効成分/ha であるが、本試験では十分量の代謝物を得るため 600g 有効成分/ha (5.6mg 有効成分/kg 乾土壌) の処理量とした。¹⁴C 標識 [I] 13.34 mgを純水 78mL に溶解して処理溶液とした。この処理溶液をピペットで採取し、インキュベーション容器の水層に添加 (0.28mg 有効成分/容器) し、水層を攪拌した。処理後、インキュベーション容器を窒素で充填し、密栓した。

4. インキュベーション、試料採取及び試験条件の確認

インキュベーション容器は、処理後暗所 22±1°Cにて最長で処理 358 日後まで培養した。

処理直後、3 日、7 日、14 日、30 日、60 日、120 日、249 日及び 358 日後に、試料として気相、水層及び土壌を採取した。水層及び土壌の分離は傾斜法により行った。気相の採取は、インキュベーション容器に窒素を通気し、容器内の気相を吸収・燃焼装置に捕集し、気相中の放射能を液体シンチレーション (LSC) カクテルに吸収した。また各試料採取日に、水層の溶存酸素、pH 及び酸化還元電位を測定した。

5. 抽出

水層：水層中に溶存している揮発性放射能及び非揮発性放射能を分析した。

溶存している揮発性放射能の抽出は、水層の一部をフラスコに採取して密栓し、酸性 (5N 塩酸 6mL) 条件下で攪拌してフラスコ内に放出させた。その後、圧縮空気を通気し、フラスコ内の揮発性放射能を捕集装置に導き、液体シンチレーション (LSC) カクテルに吸収した。

非揮発性放射能の抽出 (通常抽出) は、① 水層を濃縮せずに酸性化処理のみ (処理 0、3、7 及び 14 日後試料)、② 濃縮 (処理 30 日後試料) のみ又は濃縮後に SEP-PAK C18 カートリッジによる精製 (処理 120 日後試料)、③ クロロホルム (4 回) による抽出後、水相及び有機相を濃縮する 3 種類の手法で行った。

土壌：土壌中の放射能は、メタノール (3 回)、酢酸エチル (1 回)、ジクロロメタン (1 回) を用いた攪拌抽出を順次行った。混合した抽出物を濃縮し、水と混合後にジクロロメタンで 3 回分配した。水相及び有機相を濃縮した。

6. 未抽出放射能の特徴付け

通常抽出後の土壌 (処理 0 日後を除く) について、アセトン及び 1N 塩酸による 6 時間還流抽出 (苛酷抽出) を行った。

7. 放射能の測定

放射能の測定は、液体シンチレーション計測 (LSC) にて行った。

水層及び土壌から得た液体抽出物はシンチレーションカクテルと混合し、LSC に供した。また、気相中及び揮発性放射能は液体シンチレーション (LSC) カクテ

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はバイエルクロップサイエンス株式会社にある。

ルに吸収させ、LSC に供した。

固体試料（土壌）は風乾及び粉碎後にオキシダイザーで燃焼させ、生成する放射能を測定した。

8. 放射性成分の定量/同定

放射性成分の定量は、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）により行った。同定は、参照物質との HPLC 又は TLC コクロマトグラフィー、GC/MS、MS 及び $^1\text{H-NMR}$ により行った。

9. 代謝物生成用の過剰量試験

更に十分量の代謝物を得るため、通常施用量の 10 倍量（2000g 有効成分/ha、18.7mg 有効成分/kg 乾土壌）を処理した試験を行った。処理及びインキュベーション条件は本試験と同一にし、代謝物分離用の試料採取を処理 189 日、267 日及び 413 日に行った。

【結果】

1. 水層の溶存酸素、pH 及び酸化還元電位（表 1）

水層の溶存酸素は全インキュベーション期間で最大飽和濃度のほぼ 0% であり、嫌氣的条件が達成されていた。酸化還元電位は経時的に低下し、処理 0~7 日後では約 35~75mV、処理 14 日後以降はマイナス（-203~-80mV）となった。水層の pH は試験期間後半に僅かに上昇した。

表 1：水層の溶存酸素、pH 及び酸化還元電位（表中の数値は n=2 の平均値）

インキュベーション期間 (日)	pH		酸化還元電位 (mV)		溶存酸素 (O ₂) (*)	
	無処理	処理	無処理	処理	無処理	処理
0	5.90	6.05	75.5	61.5	0.75	0.00
3	5.95	6.05	48.0	43.5	0.40	0.95
7	6.20	6.20	34.5	41.0	0.55	1.55
14	6.45	6.25	-113.5	-80.5	0.00	1.30
30	7.05	6.95	-190.5	-199.5	0.25	0.00
60	6.90	6.80	-162.5	-174.0	0.00	0.35
120	7.60	7.35	-118.0	-137.0	0.00	0.00
249	7.10	6.85	-204.5	-174.0	0.00	1.40
358	7.30	6.90	-211.5	-172.5	0.45	0.00

処理： ^{14}C - [I] を処理した試験系、無処理： ^{14}C - [I] を無処理の試験系

(*)：最大飽和濃度 (=8.73mg O₂/L) に対する%

2. 物質収支及び放射能分布（表 2）

試験系における物質収支（放射能回収率）は 94.0~99.7% と得られた。

気相中に認められた放射能（処理放射能に対する%）は、処理 120 日後までは何

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はバイエルクロップサイエンス株式会社にある。

れも 0.1%以下(<0.1%)であり、処理 249 日及び 358 日にそれぞれ 0.2%及び 0.1%認められた。水層（溶存する $^{14}\text{CO}_2$ を含む）中の放射能（処理放射能に対する%）は、処理 0 日後の 93.4%から処理 358 日後の 18.0%と経時的に減少する一方、土壌中の放射能は処理 0 日の 2.7%から処理 358 日後の 75.9%へと増加した。

表 2：物質収支及び放射能分布（表中の数値は処理放射能に対する%、n=2 の平均値）

インキュベーション期間 (日)	気相	水層	土壌	物質収支 (放射能回収率)
0	<0.1	93.4	2.7	96.1
3	<0.1	83.3	14.0	97.3
7	<0.1	80.1	17.9	98.0
14	<0.1	73.4	24.7	98.1
30	<0.1	62.5	37.2	99.7
60	<0.1	36.7	60.7	97.4
120	<0.1	25.8	71.3	97.1
249	0.2	20.5	76.0	96.7
358	0.1	18.0	75.9	94.0

3. 土壌の抽出効率（表 3）

メタノール、酢酸エチル及びジクロロメタンを順次用いた通常抽出により、土壌から回収される放射能は処理 14 日後に最高値（処理放射能の 17.5%）となり、それ以降は経時的に減少した。一方、アセトン及び 1N 塩酸による 6 時間還流による苛酷抽出により、土壌から回収される放射能は経時的に増加した。

表 3：土壌の抽出効率（表中の数値は処理放射能に対する%、n=2 の平均値）

インキュベーション期間 (日)	通常抽出	苛酷抽出	未抽出放射能	土壌分布放射能 (計)
0	2.5	—	0.2	2.7
3	11.8	1.8	0.4	14.0
7	14.3	2.9	0.7	17.9
14	17.5	5.7	1.5	24.7
30	12.1	19.1	6.0	37.2
60	7.5	39.6	13.6	60.7
120	4.9	50.4	16.0	71.3
249	3.6	53.3	19.1	76.0
358	3.2	50.1	22.6	75.9

4. 代謝物の経時的推移（表 4）

水層及び土壌とも、未変化の親化合物 [I] が認められた。

水層：親化合物 [I] は処理 0 日後に（処理放射能に対して）93.4%認められた。

親化合物 [I] は水層において経時的に減少し、処理 358 日後には処理放射能の 0.1%以下となった。

土壌：親化合物 [I] は、その大部分が通常抽出により土壌から回収された。通常抽出により回収された親化合物 [I] は、処理 14 日後に最高値（処理放射能に対して 2.5%）を示し、それ以降は経時的に減少した。苛酷抽出でも、処理 14 日後に最高値（処理放射能に対して 2.5%）が認められ、それ以降は経時的に減少した。

表 4：試験系における各代謝物の分布（表中の数値は処理放射能に対する%、n=2 の平均値）

抽出方法	放射性成分	インキュベーション期間（日）									
		0	3	7	14	30	60	120	249	358	
水層	溶存 ¹⁴ CO ₂	—	—	—	—	—	—	—	0.5	0.2	
	親化合物 [I]	93.4	83.3	80.1	70.0	54.3	11.8	3.0	0.1	<0.1	
土壌	通常抽出	親化合物 [I]	2.5	11.7	14.1	16.8	11.0	3.7	1.4	0.1	<0.1
	苛酷抽出	親化合物 [I]	n.a.	1.0	1.2	1.9	1.7	0.6	0.3	<0.1	<0.1
	通常 + 苛酷抽出	親化合物 [I]	2.5	12.7	15.3	18.7	12.7	4.3	1.7	0.1	<0.1

n.a. : 抽出を行わず。

5. 試験系における親化合物 [I] の推定半減期（表 5）

試験系（水層及び土壌）全体における親化合物 [I] の推定半減期は、27 日と算出された。

表 5：試験系（水層及び土壌）全体における親化合物 [I] の経時的推移

（表中の数値は処理放射能に対する%、n=2 の平均値）

放射性成分	インキュベーション期間（日）									推定半減期	
	0	3	7	14	30	60	120	249	358		
試験系	親化合物 [I]	95.9	96.0	95.4	88.7	67.0	16.1	4.7	0.2	<0.1	27 日

4. 加水分解試験

(1) イミダクロプリドの緩衝液中における加水分解

(代謝資料 No.21)

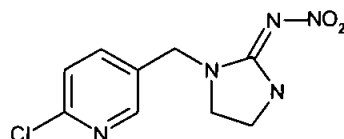
試験機関：

報告年月日：1989年9月6日

供試標識化合物：

化学名：1-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-N-ニトロイミダゾリジン-2-イリデンアミン

化学構造：



*：標識部位

標識：[^{-14}C] 標識イミダクロプリド [I]
(比放射能：5.58MBq/mg、放射化学的純度： %)

供試水溶液：a) 0.01M 酢酸緩衝液 (pH 5)
b) 0.02M トリス緩衝液 (pH 7)
c) 0.01M ほう酸緩衝液 (pH 9)

【方法】

実験はEPAガイドライン「加水分解試験」に基づいて実施した。

^{14}C 標識 [I] を 5 mg 有効成分/L の濃度で含む pH 5、7 及び 9 の上記緩衝液 (試験溶液) (1%以下のアセトニトリルを含む) を、最大 30 日間、25°C の暗所で培養した。

培養開始直後 (0 日) 及び開始後 5、10、14、18、22、26、30 日に試験溶液を採取した。試験溶液中の放射能は、液体シンチレーションカウンター (LSC) により測定した。

試料中の [I] 及び加水分解物の定量は、放射能検出器による高速液体クロマトグラフィー (HPLC、試料を直接 HPLC に注入)、薄層クロマトグラフィー (TLC) 及びオートラジオグラフィーにて行った。加水分解物の同定/特徴付けは、参照物質との HPLC 及び TLC コクロマトグラフィーの他、質量分光測定 (MS) 及び $^1\text{H-NMR}$ を用いて行った。

供試溶液の滅菌性確認を上記の試料採取日毎に、pH の確認を 0 日及び 30 日後に行った。

また分解物の同定及び特徴付けを行うため、非標識 [I] 45mg を pH9 ほう酸緩衝液 250mL 中で 40°C、7 日間加水分解を行った。

【結果】

1. 試験溶液の滅菌性及び pH

試験期間を通じて滅菌条件は維持されていた。また、pH も設定値に保持されていた。

2. 物質収支 (表 1)

試験系からの放射能の総回収率は、30 日間のインキュベーションを通じて処理量の 99.8~101.3% (pH 5)、99.8~101.5% (pH 7)、101.2~104.32% (pH 9) であり、良好であった。

表 1: 物質収支 (表中の数値は処理放射能(0 日の放射能)に対する%)

	インキュベーション期間 (日)							
	0	5	10	14	18	22	26	30
pH 5	100	100.2	100.4	99.8	101.0	100.6	101.3	101.1
pH 7	100	99.8	101.0	100.4	101.5	101.3	101.0	99.9
pH 9	100	102.4	102.3	102.9	104.3	102.4	102.7	101.2

3. 加水分解物の生成量 (表 2)

pH 5 及び 7 において、親化合物 [I] の分解及び加水分解物の生成は認められなかった。一方 pH 9 では、親化合物 [I] は微量分解し、

が生成した。30 日間のインキュベーション後に、親化合物 [I] は 30 日後には処理放射能に対して 93.0% となる一方、

となった。

非標識 [I] 45mg を pH9 ほう酸緩衝液 250mL 中で 40°C、7 日間加水分解を行った結果、

の構造は次のとおり考えられた。

表 2 : pH 9 における加水分解物生成量

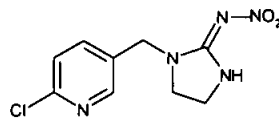
(表中の値は処理放射能に対する%)

インキュベーション 期間 (日)	親化合物 [I]		
0	99.70		
5	98.60		
10	98.00		
14	97.55		
18	96.65		
22	97.05		
26	95.25		
30	93.00		

4. pH 9 における推定半減期及び加水分解経路

[I] の加水分解は pH 9 のみで認められ、その一次速度式に従う半減期は 355 日 (速度定数 $K=1.95 \times 10^{-3}/\text{day}$) と算出された。pH 5 及び 7 における半減期は 1 年以上と考えられた。

pH 9 における推定分解経路を以下に示す。



親化合物 [I]

5. 水中光分解試験

(1) イミダクロプリドの水中光分解運命（緩衝液）

(代謝資料 No.22)

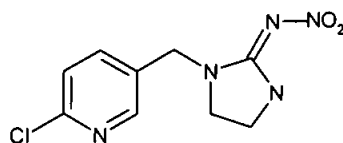
試験機関：

報告年月日：1988年7月18日 [GLP対応]

供試標識化合物

化学名：1-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-N-ニトロイミダゾリジン-2-イリデンアミン

化学構造：



*：標識部位

標識：[^{-14}C] 標識イミダクロプリド [I]

(比放射能：5.58MBq/mg、放射化学的純度： %)

標識位置の設定理由：

【方法】

1. 光源及び試験装置：

光源：キセノンランプ（UVガラスフィルター付、290nm以下の波長を除去）

分光分布：290～830nm

光強度：8.8～9.8 mW/cm²

(測定波長範囲、310～400nm)

試験装置：Suntest 照射装置（試験容器は石英製）

2. 供試水

滅菌 0.01M リン酸緩衝液 (pH 7)

3. 操作

^{14}C 標識 [I] を滅菌したリン酸緩衝液に添加し、試験濃度 5.4mg/L の試験水を調製した。この試験水 10mL を各滅菌済み試験容器に分注し、密栓した。これら試験容器を Suntest 照射装置内に設置し、23～24.5℃にて人工光を照射した。

試料（試験容器内の試験水）を、照射開始時 (T0)、照射開始 15、30、50、70、95 及び 120 分後に採取した。

暗所対照として、アルミホイルで覆った試験容器を同条件下で試験装置内に設置し、照射開始 120 分後に試料を採取した。

4. 試料中の放射能測定

液体シンチレーションカウンター (LCS) により、採取試料中の放射能を測定した。また採取試料は薄層クロマトグラフィー (TLC、ライナーアナライザーを使用) 又は高速液体クロマトグラフィー (HPLC、放射能検出器又は UV 検出器を使用) に直接供し、親化合物 [I] 及び代謝物の量を測定した。また質量スペクトロスコーピー (MS) によりクロマトグラフィーで単離した成分の構造を同定した。

5. 未知分解物の同定

本試験で未知光分解物が認められたため、追加試験として高濃度の試験水を用いた実験を行った。濃度 10mg 有効成分/L(0.01M リン酸緩衝液)の試験水を調製し、Suntest 装置内で 3.5 時間照射した(光強度 11.8~12.4mW/cm², 300~400nm)。照射後に試験水を採取し、HPLC、TLC、¹H-NMR 及び MS により光分解物の同定を行った。

【結果】

1. 回収率

各採取時点における試験開始時の放射能に対する放射能回収率は、99.7%~100.4%の範囲にあった。

表 1: 放射能回収率 (表中の数値は n=2 の平均値)

採取時点 (min.)	光照射							暗所対照
	0	15	30	50	70	95	120	120
回収率 (%)	-	100.4	100.1	100.0	100.2	99.7	100.0	101.4

2. 分解物生成量

試験水中の成分として、未変化の親化合物 [I] の他、
が同定された。

試験水中の親化合物 [I] は速やかに分解し、照射開始 120 分後には処理放射能に対して 28.70%となった。

一方、
の生成量は
とな
った。

また
が認めら
れた。

表 2：分解物生成量（表中の数値は n=2 の平均値）

	試料 採取時点 (min.)	処理放射能に対する%					
		親化合物 [I]					
光照射	0	99.40					
	15	87.05					
	30	70.90					
	50	55.30					
	70	42.40					
	95	32.30					
	120	28.70					
暗所 対 照	120	99.45					

*)：報告書で使用されている名称

3. の同定

また、表 2 に示す

の生成量には、

の存在も確認された。

4. 北緯 35 度（4 月～6 月）における半減期

親化合物 [I] の試験水中濃度に基づく推定半減期 (DT50) は、57.9 分（一次速度定数：0.012 min⁻¹）と算出された。

また、申請者が計算した北緯 35 度（4 月～6 月）における半減期は次の表のとおりである。

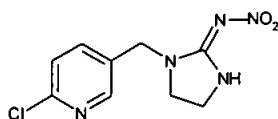
本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はバイエルクロップサイエンス株式会社にある。

北緯 35 度 (4 月～6 月) における半減期

試験での光強度	北緯 35 度 (4 月～6 月) における半減期
8.8 mW/cm ²	0.45 日 (10.9 時間)
9.8 mW/cm ²	0.51 日 (12.1 時間)

5. 水中 (緩衝液中) 光分解経路

以下に緩衝液中における光分解経路を示す。



親化合物 [I]

5. 水中光分解試験

(2) イミダクロプリドの水中光分解運命 (自然水)

(代謝資料 No.23)

試験機関:

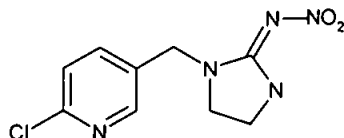
[GLP対応]

報告年月日: 2004年11月15日

供試標識化合物

化学名: 1-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-N-ニトロイミダゾリジン-2-イリデンアミン

化学構造:



*: 標識部位

標識: [$-^{14}\text{C}$] 標識イミダクロプリド [I]

比放射能: 4.11 MBq/mg (111 μCi /mg)

放射化学的純度: %

化学的純度: %

標識位置の設定理由:

【方法】

1. 試験系

供試水: ドイツレバークゼンにある池“Anglerweiher”の岸から5mの地点より表層約30cmの水を2003年8月7日に採取した。試験に使用する前に冷蔵庫で4日間保存した後、オートクレーブで滅菌した(pH 7.8)。

試験濃度: 設定濃度 1.0 mg/L (実測濃度: 0.931 mg/L)、溶解助剤アセトニトリルを0.15%含有。

試験温度: $25 \pm 1^\circ\text{C}$

光照射装置: Suntest 装置

光源: キセノンランプ(フィルターにより $\leq 290\text{ nm}$ の波長の光を除去)

試験容器: 23 mL 容石英製容器

光強度: 643 W/m^2 (測定範囲: 300~800 nm)

2. 試料採取及び分析

下表に示す日程で照射試験及び暗対照試験の試験容器を採取した。

各試料の試料採取時点

試料	採取日 (処理後経過時間)
照射	0、0.17、0.5、1、2、4、6 及び 24.17 時間後
暗対照	0、2 及び 24.17 時間後

採取試験容器の開封前に、試験容器を 10 分間吸引し溶液上部空間に存在する可能性のある揮発性物質を捕集したが、揮発性物質の分析は行わなかった。その後、試験容器を開放し、ガラス電極を用いて溶液の pH を測定した。

揮発性物質捕集後の試験溶液 100 μ L をそれぞれ採取し、液体シンチレーションカウンターで溶液中放射エネルギーを測定した。

試験溶液中の親化合物 [I] 及び分解物の濃度は、ラジオ高速液体クロマトグラフィー (HPLC) で分析した。また、HPLC では十分に分離できなかった HPLC の高極性領域に溶出する成分は、分離能がより良好な順相系ラジオ薄層クロマトグラフィー (TLC) を用いて定量した。

照射開始 0、6 及び 24 時間後の試料については試験溶液の滅菌性を確認した。

【結果】

1. 試験温度、試験溶液の滅菌性及び試験溶液の pH

試験温度は照射試料で平均 25.4°C(最高 26.4°C、最低 24.7°C)、暗対照試料で平均 25.2°Cであった。

試験期間を通じて滅菌が維持され、試験溶液の pH は試験期間中、8.3~8.9 のアルカリ領域に維持されていた。

2. 物質収支

照射試料及び暗対照試料とも、試験期間を通じて物質収支は良好であった。照射開始後の物質収支は、照射試料で処理放射能の 99.1%~104.8%、暗対照試料で処理放射能の 99.6%~101.5%であった。

表 2 : 物質収支 (表中の数値は処理放射能に対する%)

	照射時間 (経過時間) (hr)							
	0.00	0.17	0.50	1.00	2.00	4.00	6.00	24.17
照射試料	99.59	102.12	100.04	104.80	101.96	100.11	102.55	99.11
暗対照試料	99.59	—	—	—	101.27	—	—	101.45

2. 親化合物 [I] の分解及び分解物の生成量 (表 3)

親化合物 [I] の分解は、暗対照試料で認められなかった。一方、照射試料では、親化合物 [I] は試験期間を通じて継続的に分解し、照射終了後に未変化の親化合物 [I] として回収された量は処理放射能の 14.09%であった。

照射試料では、

また照射試料では、生成量が処理放射能の 10%以下である微量分解物として認められた。

れた。

認めら

自然水中におけるイミダクロプリドの光分解が完全に進行した推定された。

表 3 : イミダクロプリドの自然水における水中光分解 (表中の数値は処理放射能に対する%)

分解物	試験区	照射時間 (経過時間) [時]							
		0.00	0.17	0.50	1.00	2.00	4.00	6.00	24.17
親化合物 [I]	暗対照	99.59	—	—	—	101.27	—	—	101.45
	照射	99.59	101.85	99.36	101.92	93.36	77.11	66.37	14.09

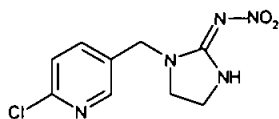
3. 半減期及び分解速度

親化合物 [I] は自然水中の光照射条件下で速やかに分解し、光分解の実験的半減期は 9.12 時間 (速度定数 0.076 時間^{-1}) と算出された。暗対照試料において、親化合物 [I] の分解は認められなかった。

実験条件の半減期 9.12 時間に基づき、イミダクロプリドの環境条件における半減期は約 2.4 日 (東京、北緯 35 度、4~6 月) と算出された。

4. 水中光分解経路

以下に自然水中における光分解経路を示す。



親化合物 [I]

6. 土壌吸着試験

(1) イミダクロプリドの土壌吸着試験

(代謝資料 No.24)

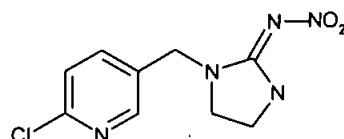
試験機関：

報告年月日：1991年1月31日

供試標識化合物：

化学名：1-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-N-ニトロイミダゾリジン-2-イリデンアミン

化学構造：



*：標識部位

標識：[$-^{14}\text{C}$] 標識イミダクロプリド [I]

(比放射能：5.74MBq/mg、放射化学的純度： %)

非標識：イミダクロプリド [I] (純度 %)

【方法】

1. 供試土壌

表1に示す4種の土壌を使用した。

土壌 No.	採取場所	土壌群名	土性 ¹⁾	OC% ²⁾	pH (H ₂ O)	pH (HCl)	CEC ³⁾	PAC ⁴⁾	水含有量 (%)
1	石川農試 (水田)	細粒灰色低地土	LiC	1.22	6.8	5.7	24.9	800	8.54
2	植調研究所 (水田)	—	LiC	2.60	6.7	6.0	21.5	820	8.65
3	福島農試 (畑地)	細粒黄色土	CL	1.08	7.6	6.7	13.5	540	2.82
4	日植防 牛久 (畑地)	褐色火山灰土壌	SiLS	3.61	7.7	6.9	21.4	2000	13.6

1) 土性：CL (埴質壤土)、LiC (軽埴土)、SiCL (微砂質埴壤土)、LS (埴質砂土)

2) 土壌中の有機炭素含有率 (%)、3) 陽イオン交換容量 (me/100g 乾土)

4) リン酸吸収係数 (mg/100g 乾土)

2. 試験方法

^{14}C 標識 [I] を、設定濃度 0.04、0.2、1.0 及び 5.0mg/L の4種濃度、温度 25°C、平衡化時間 40 時間の条件で、OECD ガイドラインに従って吸着試験を実施した。

なお、平衡化到達時間は、非標識 [I] を 1.25mg/L 含む 0.01M 塩化カルシウム溶

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はバイエルクロップサイエンス株式会社にある。

液 20mL と各供試土壌（5g、風乾重）を最長 48 時間振とうして測定した。経時的（振とう開始 8、16、24、32、40 及び 48 時間後）に水中の [I] の濃度を測定し、濃度の変化率（前回測定濃度との比較）が 10%以下となった時点を目録到達最小時間とした。

また設定濃度 1.0mg/L 区の試料（溶液及び土壌）における [I] の量を測定し、物質収支を算出した。

【結果】

1. 平衡到達時間

土壌 No.3（福島）は、振とう開始 16 時間後に平衡に到達した。その他の供試土壌では、何れも振とう開始 40 時間後に平衡に到達した。この結果に基づき、吸着試験での平衡化時間を 40 時間とした。

2. K（吸着係数）

吸着係数 K は 1.89～8.33 と算出され、[I] は土壌に対して中程度の吸着を示すと考えられた。

土壌 No.	K ¹⁾	1/n ¹⁾	r ¹⁾	OC% ²⁾
1	4.59	0.848	1.000	1.22
2	4.76	0.807	0.998	2.60
3	1.89	0.852	0.989	1.08
4	8.33	0.801	0.998	3.61

1) Freundlich の吸着等温式による定数項と相関係数

2) 土壌中の有機炭素含有率

3. 物質収支

物質収支は 97.6～103.4%と良好であり、試験期間中の [I] の分解は無かった。

7. その他

(1) イミダクロプリドの土壌表面光分解

(代謝資料 No. 25)

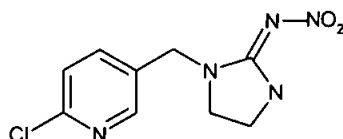
試験機関：

報告年月日：1990年2月7日

供試標識化合物：

化学名：1-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-N-ニトロイミダゾリジン-2-イリデンアミン

化学構造：



*：標識部位

標識：[$-^{14}\text{C}$] 標識イミダクロプリド [I]
(比放射能：5.58MBq/mg、放射化学的純度： %)

【方法】

本試験は米国 EPA ガイドラインに従って実施した。

1. 光源、試験装置及び試験温度：

光源：キセノンランプ (UVガラスフィルター付、290nm 以下の波長を除去)
光強度：光量測定法で測定した結果、光強度は $2.96 \times 10^{17} \sim 3.79 \times 10^{17}$ 光量子/秒であった。

試験装置：Suntest 照射装置

試験温度：25±2℃

2. 供試土壌及び処理量

砂壤土 (採取地：米国、土壌特性を下表に示す) 及び顕微鏡用スライドガラスを用いて土壌薄層板を作成し、 ^{14}C 標識 [I] 処理溶液を 48.5mg 有効成分/kg の処理量となるよう土壌薄層板の土壌表面に塗布した。処理後、照射試料の土壌表面を石英ガラスで覆い、暗所対照試料はアルミホイルで包んだ。

供試土壌

採取場所	土性	OC% ¹⁾	pH (CaCl ₂)	CEC ²⁾	粒子密度 (g/cm ³)
米国 カンザス市	砂壤土	1.40	6.8	22.0	2.6

1) 土壌中の有機炭素含有率 (%), 2) 陽イオン交換容量 (mval/100g 乾土)

3. 光照射及び試料の採取

土壌薄層板（照射試料及び暗対照試料）を Suntest 照射装置内に入れ、最長 15 日間に渡って人工光を照射した。土壌薄層板の採取は、次の表に示す間隔で行った。

	試料採取
試験Ⅰ	照射開始直後（0 時間）、6 時間、1 日、2 日、3 日及び 5 日後。 暗対照試料は照射終了時に採取した。
試験Ⅱ	照射開始直後（0 時間）、7 日、12 日及び 15 日後。 暗対照試料は照射終了時に採取した。

4. 土壌中の放射能抽出及び測定

土壌薄層板から土壌を遠沈管に掻き取り、アセトニトリル/水（80/20 v/v）混合液による 1 時間振とう抽出及び遠心分離を計 3 回行った。抽出後の土壌は乾燥させた。

放射能の測定は液体シンチレーション計測（LSC）により行った。液体試料は、シンチレーションカクテルと混合し、LSC に供試した。固体試料（抽出後の乾燥土壌）は燃焼させて LSC に供試した。

5. 分解物の定量及び同定

分解物の定量は、薄層クロマトグラフィー（TLC、リニアアナライザー検出）、オートラジオクロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー（HPLC、放射能及び/又は UV 検出器）により行った。分解物の同定は参照物質とのコクロマトグラフィーにより行った。

【結果】

1. 物質収支及び放射能分布（表 1）

土壌から回収された放射能は、処理放射能に対して照射試料で 90.9～107.4%、暗対照試料で 95.5～105.0%であった。

土壌からの未抽出放射能は照射時間に応じて増加し、15 日間の照射終了時には処理放射能に対して約 10%となった。

表 1：物質収支及び放射能分布

照射時間 (日)		処理放射能に対する% (n=2の平均値)		
		抽出放射能	未抽出放射能	回収率 (物質収支)
試験 I	0	102.9	0.3	103.2
	0.25	104.2	3.2	107.4
	1	99.3	5.4	104.7
	2	92.4	8.4	100.8
	3	92.1	9.3	101.3
	5	89.4	8.5	97.9
	暗対照	94.8	0.7	95.5
試験 II	0	100.0	0.4	100.4
	7	88.1	10.1	98.2
	12	80.8	10.1	90.9
	15	80.7	11.0	91.6
	暗対照	103.7	1.3	105.0

2. 分解生成物 (表 2)

親化合物 [I] は照射時間に応じて減少し、15 日間の照射終了後に処理放射能に対して 61.5% となった。分解物として、

も認められた。これら分解物のうち、
 となった。
 はなかった。

表 2：分解物の生成量

照射時間 (日)		処理放射能に対する% (n=2の平均、)					
		親化合物 [I]					
試験 I	0	100.3					
	0.25	97.3					
	1	86.1					
	2	75.0					
	3	72.2					
	5	73.0					
	暗対照	94.1					
試験 II	0	98.4					
	7	68.9					
	12	62.3					
	15	61.5					
	暗対照	101.7					

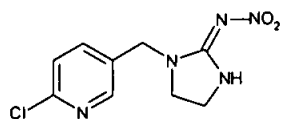
3. 半減期

親化合物 [I] の土壌表面における光分解は 2 相性を示すと考えられ、分解が速やかであった第 1 相 (1 次速度式) に基づく半減期を算出した。また RF2 次式に基づき半減期も算出した。

速度式	半減期	速度定数
1 次速度式	112.8 時間	$6.14 \times 10^{-3} \text{ hr}^{-1}$
RF 2 次式	38.9 日	$1.78 \times 10^{-2} \text{ day}^{-1}$

4. 推定分解経路

以下に土壌表面における推定光分解経路を示す。



親化合物 [I]

7. その他

(2) イミダクロプリドの水田における動態試験

(代謝資料 No.参考資料 2)

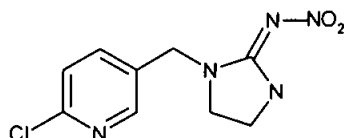
試験機関：

報告年月日：1991年1月7日

供試化合物：イミダクロプリド [I] 粒剤 (含有量 %)

化学名：1-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-N-ニトロイミダゾリジン-2-イリデンアミン

化学構造：



【方法】

稲を移植した火山灰土壌及び沖積土壌の人工水田 (1.8m×1.8m) に、イミダクロプリド %粒剤を 3kg/10a の処理量で処理した。田面水の深さは約 5cm に調整した。

処理後は土壌採取日まで、溶脱水を人工水田の下方側面部にある採水用蛇口から毎日採取した。土壌は稲収穫後 (処理 114 日後) に、土壌層 0~5cm、5~10cm、10~20cm 及び 20~30cm の 4 層に分けて採取した。

溶脱水中については親化合物 [I] 及び還元体 [M04]、土壌については親化合物 [I] の濃度を各々測定した。

【結果】

土壌中の親化合物及び代謝物の濃度

親化合物 [I] は 0~5cm 層にのみ検出され、その濃度は火山灰土壌で 0.057ppm (処理量の 5.5%)、沖積土壌で 0.031ppm (処理量の 3.6%) 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バイエルクロップサイエンス株式会社にある。

溶脱水中の親化合物及び代謝物の濃度

薬剤処理後から土壌採取時までの溶脱水の総量は、火山灰土壌水田で約1780L、
沖積水田土壌で約1320Lであった。溶脱水中に、親化合物 [I]
は検出されなかった。

表：親化合物及び代謝物の土壌及び溶脱水中濃度

土壌層・溶脱水			濃度 (ppm)		
			親化合物 [I]		
火山 灰土 壌	土 壌 層	0～5 cm	0.057		
		5～10 cm	<0.005		
		10～20 cm	<0.005		
		20～30 cm	<0.005		
	溶脱水		<0.0002		
沖積 水田 土壌	土 壌 層	0～5 cm	0.031		
		5～10 cm	<0.005		
		10～20 cm	<0.005		
		20～30 cm	<0.005		
	溶脱水		<0.0002		

7. その他

(3) イミダクロプリドの土壌カラムリーチング試験 (畑地条件)

(代謝資料 No.参考資料 3)

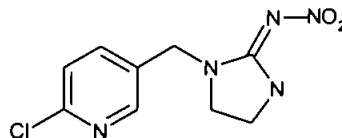
試験機関:

報告年月日: 1991年1月7日

供試化合物: イミダクロプリド [I] 標準品 (純度:)

化学名: 1-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-N-ニトロイミダゾリジン-2-イリデンアミン

化学構造:



【方法】

1. 土壌カラムの調製

ガラス製カラム (内径 5 cm、長さ 40cm) の下から順にガラスウール、石英砂を詰め、火山灰土壌 (560mg、土性: 軽埴土) を充填した (土壌層約 30cm)。

イミダクロプリド標準品を純水に溶解させ、濃度 119ppm の処理溶液を調製した。この溶液 1mL を土壌 20g に添加し、よく混和した (0.6 kg 有効成分/ha 相当)。この土壌を恒温器内 (28±1°C) で 2 日間 (実験 A) 又は 30 日間 (実験 B) インキュベーションし、軽く振動させながらカラムに詰め、その上に石英砂を約 3cm 敷いた。

2. 溶脱操作、試料の採取及び分析

多量の雨が極短期間に降った事態を想定し、全溶脱水量を 1200mL (降雨量換算 600mm) とした。土壌カラムへの給水 (溶脱) は自動給水装置を用いた。溶脱は、実験 A では 50mL/日 (降雨量換算 50mm/日) で 24 日間、実験 B では 100mL/日 (降雨量換算 25mm/日) で 12 日間行った。

溶脱水は 200mL 単位で採取し、また土壌は次のとおり採取した。

採取土壌

上層	[I] 標準品の処理層 (+上部石英砂層) と 10cm までの土壌層を合わせた層
中層	10~20cm の土壌層
下層	20~30cm (+下部石英砂層)

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はバイエルクロップサイエンス株式会社にある。

各試料（溶脱水及び土壌）中の親化合物 [I] の濃度を測定した。

【結果】

実験 A 及び実験 B とも、溶脱速度が異なるにも係わらず、土壌層での分布パターンに差は認められなかった。

親化合物 [I] は土壌のみから回収され、その値は上層から 65.3 (実験 B) % ~ 75.9% (実験 A)、中層から 24.1% (実験 A) ~ 34.7% (実験 B) であった。土壌カラムの下層に、親化合物 [I] は認められなかった。

また溶脱水中にも、親化合物 [I] は認められなかった。

表：土壌カラムにおける親化合物 [I] のリーチング

(単位：回収量に対する%)

	実験 A	実験 B
	(50mL/日×24 日間)	(100mL/日×12 日間)
土 壌		
上層 (0~10cm 層)	75.9	65.3
中層 (10~20cm 層)	24.1	34.7
下層 (20~30cm 層)	0.0	0.0
溶脱水	0.0	0.0

8. イミダクロプリド [I] の代謝分解の要約

[I] の動物、植物、土壌における代謝分解、加水分解及び光分解に関する試験結果を以下に要約する。結果の概要を表 1 に、全体の推定代謝経路を図 1 に示す。

(1) 動物体内運命

^{14}C [I] 投与

^{14}C [I] をラットに 1mg/kg 体重及び 20mg/kg 体重で経口投与すると、雌雄ともに投与放射能のほぼ全てが吸収された。単回経口投与では、雌雄とも吸収率は 94% 以上と考えられ、また単回十二指腸内投与した雄の吸収率は 93.2% と考えられた。(代謝資料 No.2)

経口投与後、血漿中の放射能は速やかに最高値を示し、T-max は雄で 0.63~0.72 時間、雌で 1.46~2.43 時間であった。血漿中の放射能消失は二相性を示した。第一相の半減期は雄で 2.59~3.26 時間、雌で 3.23~3.59 時間、第二相の半減期は雄で 25.84~118.09 時間、雌で 28.58~72.57 時間と示された。薬物動態パラメータ (V_c 及び V_{ss}) から、投与放射能は血漿から末梢コンパートメントへ速やかに分布し、更に高い組織移行性が示唆された。しかしながら、中心コンパートメントにおける MRT は比較的短く、腎排泄に先だって血漿への再分布も速やかであると考えられた。(代謝資料 No.2)

臓器/組織内への分布では、動物体 (胃腸管を除く) 中の放射能は何れも低かった。動物体 (胃腸管を除く) と他の臓器/組織を相対濃度 P に基づき比較すると、肝臓、腎臓、肺、皮膚及び血漿は動物体と同等又は高かった。また雄ラット 20mg/kg 体重を単回経口投与し、経時的な臓器/組織内分布を検討した。その結果、大部分の臓器/組織内において最初の測定時点で最高値が認められ、臓器/組織中の放射能は何れの臓器においても同様の速度で消失した。(代謝資料 No.2)

^{14}C [I] の代謝物として、未変化の親化合物の他に広範囲の代謝物が認められた。

尿に認められた主要代謝物は で
あった。また尿から、

が認められた。糞からは、

が認められたが、それ生成量は は糞 であった。なお は糞
のみに認められた。(代謝資料 No.2)

また、腎臓及び肝臓における代謝物の経時的分布を検討した。その結果、肝臓

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はバイエルクロップサイエンス株式会社にある。

中に代謝物 が認められ、これら代謝物は腎臓又は胆汁へ排泄される前に生分解を受けると考えられた。腎臓抽出物とラット尿をTLCで比較した場合、定性的に類似していることが確認された。

(代謝資料No.3)

これらの結果から、[I]の代謝経路として2種類の主要経路が考えられた。第一の経路として、

を受けた。

第二の経路として、

[I]の

であり、

を受けた。

高用量の[I]を経口投与した場合、雄は雌よりも[I]の尿中への排泄率が低く、また の排泄量が高かった。(代謝資料No.2及び3)

経口投与された放射能は速やかに尿及び糞中に排泄され、投与後48時間において、尿に投与量の約70~80%、糞に約15~25%が認められた(排泄比は尿:糞=約4:1)。また、(胆管カニューレを施した)雄に十二指腸内投与した結果、糞に認められた放射能は投与量の約4.7%のみに留まり、胆汁及び尿中にそれぞれ投与量の約36%及び56%が認められた。この腎尿排泄放射能の低下は、放射能の腸管循環に起因すると考えられた(代謝資料No.2)。

^{14}C [I] 投与

^{14}C [I] をラットに1mg/kg体重及び150mg/kg体重で経口投与した。同用量(1mg/kg体重)について、AUC及びAUC由来のパラメータ(CL、 C_{LR} 、MRT、 V_{ss})は標識位置による大きな差異は認められず、また排泄速度も同様であった。しかしながら ^{14}C [I] 投与と比較して、尿中への排泄量は ^{14}C [I] 投与で約90%(投与後48時間)と高く、また臓器/組織内分布における相対濃度Pも高かった。

代謝物の生成量では、[I]の

代謝物に

は認められなかった。

(代

謝資料No.6)

の動物体内における生成

(代謝資料No.5)

(2) 植物体内運命

我が国で [I] の適用が登録されている作物は、穀類（稲、とうもろこし）、いも類、野菜類（葉菜、根菜、果菜等）、果樹類等多岐にわたり、またその登録されている使用方法も「育苗箱施用」、「散布」、「土壌混和」、「種子粉衣」等様々である。従って、これら適用内容を網羅する「稲」、「なす」、「トマト」、「りんご」、「ばれいしょ」、「とうもろこし」、「棉」及び「たばこ」を用いた植物代謝試験が今日まで実施されている。

「なす」及び「稲」を用いて [I] の移行性を予備調査した。[I] を葉身及び葉柄に塗布（なす）又は葉鞘に塗布（稲）した場合、放射能の移行はわずかであったが、求頂的移行が認められた。（代謝資料No.7）

「稲」に箱施用を模して¹⁴C [I] を処理した結果、稲体には処理量の約4～7%のみが移行した。収穫期における稲体地上部放射能の大部分（約98%）は稲藁に存在し、玄米中の放射能は極少量であった。玄米では未変化の [I] のみが主要成分であり、稲藁では 〃 が主要成分と認められた。（代謝資料No.8）

また¹⁴C [I] を水面施用処理した結果、収穫時の放射能の大部分は土壌から回収され、玄米及び稲藁に移行した放射能はそれぞれ処理放射能の0.05%及び約4%と限られていた。玄米では未変化の [I] のみが主要成分であり、稲藁では 〃 が主要成分と認められた。（代謝資料No.9）

「なす」に¹⁴C [I] を植穴処理した結果、処理放射能のなす地上部への移行は限定されていた。処理放射能の約1.6～2.7%が地上部に認められ、地上部TRRの約90%が葉に分布していた。果実における主要成分は、未変化の [I] 次いで 〃 と認められ、[I] の量は約19%果実TRR（0.0081ppm）であった。茎葉では、未変化の [I] 及び 〃 が主要代謝物であった。（代謝資料No.10）

「トマト」及び「りんご」を用いて、¹⁴C [I] を果実に散布（塗布）処理を行った。その結果、果実中の主要成分は未変化の [I] のみであり、 〃 は認められなかった。また、葉に塗布した¹⁴C [I] の果実への移行性を調べた結果、移行量は無視しうる程度であった。（代謝資料No.11 及び 代謝資料No.12）

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はバイエルクロップサイエンス株式会社にある。

「ばれいしょ」を用いて、 ^{14}C [I] の土壌混和処理又は散布処理を行った。土壌混和処理では、塊茎中の主要成分として未変化の [I]

が認められ、茎葉中では未変化の [I] のみが主要成分であった。(代謝資料No.13)

散布処理を行った場合、塊茎の放射能残留量 (TRR) は極少量 (0.009ppm) であり、そのうち [I] が11.1%TRR (約0.001mg/kg) 、

存在すると認められた。茎葉では、未変化の [I] 及び [II] が主要成分と考えられた。茎葉における [I] の量的推移は経時的に減少し、一方、 [II] は経時的に増加した。(代謝資料No.14)

「とうもろこし」を用いて、 ^{14}C [I] の種子粉衣処理を行った。その結果、人畜可食部である「乾燥子実」及び「かいば用植物体」では未変化の [I] が最も多かった。乾燥子実では、 [I] に次いで [II] が主要成分であり、また [III] が認められた。かいば用植物体では、 [I] に次いで [II] が主要成分であった。(代謝資料No.15)

また「棉」に ^{14}C [I] の種子粉衣処理を行った結果、種子中の放射能残留量は極少量 (<0.005mg/kg) であった。種子中には [I] が認められた。葉においては、 [II] が主要成分であった。(代謝資料No.16)

「たばこ」に ^{14}C [I] の土壌灌注処理及び散布処理を行った結果、葉における主要成分は未変化の [I] のみと認められ、 [II] は認められなかった。(代謝資料No.17)

以上の植物代謝試験において認められた代謝物パターンから、 [I] の植物代謝経路は次のとおり要約される。また供試植物間に、代謝物の質的パターンの差は認められなかった。

植物代謝経路

(3) 土壌における運命試験

好氣的湛水土壌運命試験の結果、 [I] の半減期は53日 (沖積土壌) 及び69日

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はバイエルクロップサイエンス株式会社にある。

(火山灰土壌)と算出された。沖積土壌及び火山灰土壌とも、主要代謝物は
であった。経時的な土壌の未抽出残留の増加が認められた。この
未抽出残留の過酷抽出により、[I]及び の遊離が認められ
た。また結合残留の特徴付けの結果、フミン分画に比較的多くの放射能が取り込
まれていると考えられた。(代謝資料No.18)

好氣的土壌中運命試験の結果、処理100日後の土壌(壤質砂土)中放射能は処理
放射能に対して68.6%となった。好氣的土壌中運命試験では有意な二酸化炭素の生
成が認められ、処理100日後には処理放射能に対して10%生成した。土壌から抽出
される放射能の大部分は未変化の[I]であり、処理100日後には処理放射能に対
して約63%抽出された。また抽出後の結合残留について行った還流抽出により、
処理放射能に対して約7%の[I]の遊離が認められた。[I]の半減期は「188
±25日」と算出された。

認められた代謝物は、

であったが、その生成量は何れも であった。(代謝資料No.
19)

嫌氣的土壌中運命試験の結果、試験系全体(水層及び土壌)において[I]は
経時的に分解され、処理358日後には処理放射能に対して0.1%以下となった。主要
代謝物として が認められた。(代謝資料No.20)

(4) 水中における運命試験

[I]の加水分解運命試験の結果、pH 5及び7において[I]の分解は認められ
なかった。[I]はpH 9において分解が認められ、半減期は355日と算出された。
pH 9において、 が認
められたが、その生成量は であった。(代謝資料No.21)

緩衝液を用いた[I]の水中光分解運命試験の結果、[I]は速やかに光分解
され、試験水中濃度に基づく半減期は57.9分と算出された。また、北緯35度(4~6
月)における半減期は、0.45~0.51日と算出された。光分解生成物として
であった。分解物として、

が認められた。(代謝資料No.22)

自然水(池水)を用いた[I]の水中光分解試験の結果、[I]は広範囲に分

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はバイエルクロップサイエンス株式会社にある。

解された。試験水中濃度に基づく半減期は9.12時間であり、北緯35度（4～6月）における半減期は、約2.4日であった。光分解生成物として

であり、生成し

た。また、も
生成した であつた。（代謝資料No.23）

(4) 土壌吸着、土壌表面光分解及び土壌中での鉛直移動性

土壌吸着試験の結果、[I] のKは1.89～8.33と算出された。（代謝資料No.24）

また¹⁴C [I] を土壌スラリーに処理し、光を照射した試験の結果、分解物として

が認められた。これら分解生成物の生成量は、
であつた。（代謝資料No.25）

また人工水田及び土壌カラムにより [I] の鉛直移動性を検討した結果、[I] の鉛直移動性は認められなかった。（代謝資料No. 参考資料2及び参考資料3）

(5) 大動物（泌乳山羊及び産卵鶏）での代謝

¹⁴C [I] を10 mg/kg体重の投与量で泌乳山羊に3日間反復強制経口投与し、泌乳山羊での代謝が調査された。

最終投与後2時間（投与開始後50時間）での屠殺時まで、総投与放射能の49.57%（追加資料No.1）～58.0%（追加資料No.2）が排泄された。尿、糞及び乳汁に排泄された総投与放射能は、追加資料No.1でそれぞれ39.7%、9.6%及び0.23%、追加資料No.2で46.03%、11.57%及び0.413%であり、いずれも尿が主排泄経路であった。屠殺時に可食臓器・組織に残存した放射能は、総投与放射能の5.52%（追加資料No.1）及び5.27%（追加資料No.2）と推定された。（追加資料No.1及びNo.2：本農薬抄録の前半74～83及び84～95頁に記載）

乳汁及び可食臓器・組織（筋肉及び脂肪）の主要代謝物として、未変化の親化合物 [I] （乳汁、筋肉及び脂肪）、

が認められ、これら主要代謝物はいずれも
を有していた。（追加資料No.1：本農薬抄録の前半74～83頁に記載）

また可食臓器（肝臓及び腎臓）の主要代謝物として、

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はバイエルクロップサイエンス株式会社にある。

が認められ、

残留成分は、肝臓及び腎臓の総残留放射能 (TRR) に対して

を占めていた。 (追加資料No.2 : 本農薬抄録の前半84~95頁に記載)

^{14}C [I] を10 mg/kg体重の投与量で産卵鶏に3日間反復強制経口投与し、産卵鶏での代謝が調査された。 (追加資料No.3及びNo.4 : 本農薬抄録の前半96~101及び102~115頁に記載)

最終投与後2時間 (投与開始後50時間) での屠殺時において、臓器・組織内残留 (計算値) は総投与放射能に対して3.39% (追加資料No.3) 及び7.81% (追加資料No.4) と低く、また鶏卵の残留放射能も総投与放射能に対して0.2%未満と低かった。 (追加資料No.3及びNo.4 : 本農薬抄録の前半96~101及び102~115頁に記載)

鶏卵、肝臓、筋肉及び脂肪の総残留放射能 (TRR) に対して10%以上生成した主要代謝物として、未変化の親化合物 [I] (脂肪)、

が認められ、こ

れら主要代謝物は

を有していた。 (追加資料No.4 :

本農薬抄録の前半102~115頁に記載)

表 1. 代謝分解物の概要 (植物)

植物	試験の概要		放射性成分																				計	
			1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14	15	16	17	18	19	20		
稲	箱施用 0.32 kg a.i./ha	芽刈 65 日	%	9.1																			100.1	
			ppm	0.034																				0.378
		稲藁 124 日	%	8.7																				100.1
			ppm	0.114																				1.314
	玄米 124 日	%	13.6																				100.0	
		ppm	0.002																				0.014	
	箱施用 1.26 kg a.i./ha	玄米 124 日	%	11.9																			100.0	
			ppm	0.008																			0.064	
	水面施用 0.5 kg a.i./ha	稲藁 79 日	%	11.5																			100.0	
			ppm	0.168																			1.470	
玄米 79 日		%	6.3																			100.0		
		ppm	0.002																				0.036	
なす	積穴処理 0.02g a.i./株	果実 49~ 67 日	%	18.875																		100.0		
			ppm	0.0081																			0.0428	
		葉葉 14 日	%	32.622																			100.0	
			ppm	1.9208																				5.8882
		葉葉 35 日	%	8.757																			100.0	
			ppm	0.3041																				3.4727
		葉葉 69 日	%	10.226																			100.0	
			ppm	0.1456																				1.4241
		トマト	散布処理 a.i. 0.05% 散布溶液	果実 4 日	%	94.4																		100.0
					ppm	0.95																		
果実 7 日	%			90.6																			100.0	
	ppm			0.76																				0.84
果実 14 日	%			88.0																			100.0	
	ppm			0.75																				0.85
果実 21 日	%			79.4																			100.0	
	ppm			0.51																				0.64
果実 0 日	%			77.0																			100.0	
	ppm			1.356																				1.759
果実 14 日	%	69.0																			100.0			
	ppm	0.996																				1.445		
ばいしょ	土壌混和 処理 0.05g a.i./m ²	塊茎 129 日	%	48.3																		100.0		
			ppm	0.044																			0.091	
		葉葉 129 日	%	26.7																			100.0	
			ppm	1.53																				5.76
	散布処理 a.i. 0.46% 散布溶液	塊茎 64 日	%	11.1																			100.0	
			ppm	約 0.001																				0.009
		葉葉 7 日	%	71.8																			100.0	
			ppm	1.80																				2.51
		葉葉 28 日	%	48.2																			100.0	
			ppm	0.95																				1.97
葉葉 64 日	%	37.9																			100.0			
ppm	0.51																					1.35		

% : TRR (総放射能残留) に対する百分率, ppm : mg/kg.

表 1. 代謝分解物の概要 (大型動物)

動物	試験の概要	放射性成分 (表中の数値は総残留放射能 (TRR) に対する%、但し括弧 内の数値は µg eq/g)																		計	
		1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14	15	16	17	18		
泌乳山羊	¹⁴ C 試験 [1] 3日間反復強 制経口投与 10mg/kg 体重 (投与開始 後 50 hr)	乳汁	53.3																		81.0
		肝臓	0.79																		[3.33]
		腎臓	5.9																		14.38
		脾内脂肪	64.0																		[2.31]
		脳視床	64.5																		37.7
		ロイン	68.9																		[4.36]
		脂肪皮膚膜 (腎周囲)	67.6																		78.25
		大腿筋	63.4																		[3.10]
		皮下脂肪	73.5																		80.15
泌乳山羊	¹⁴ C 試験 [1] 3日間反復強 制経口投与 10mg/kg 体重 (投与開始 後 50 hr)	腎臓	6.19																	86.85	
			[0.838]																		[3.29]
産卵鶏	¹⁴ C 試験 [1] 3日間反復強 制経口投与 10mg/kg 体重 (投与開始 後 50 hr)	卵卵																		85.8	
		腎臓																			[1.89]
		心臓	[0.88]																		90.9
		砂嚢	[3.43]																		[1.91]
		皮膚	[0.09]																		33.87
		胸筋	[1.07]																		[5.800]
		大腿筋	[0.08]																		71.62
産卵鶏	¹⁴ C 試験 [1] 3日間反復強 制経口投与 10mg/kg 体重 (投与開始 後 50 hr)	脂肪	[0.49]																	[9.697]	
		脂肪	[0.49]																		[0.22]
		脂肪	[0.88]																		(1.10)
		脂肪	[3.43]																		(1.52)
		脂肪	[0.09]																		[3.43]
産卵鶏	¹⁴ C 試験 [1] 3日間反復強 制経口投与 10mg/kg 体重 (投与開始 後 50 hr)	脂肪	[1.07]																	[0.44]	
		脂肪	[0.08]																		[1.07]
		脂肪	[0.49]																		[0.51]
		脂肪	[0.49]																		[0.49]
産卵鶏	¹⁴ C 試験 [1] 3日間反復強 制経口投与 10mg/kg 体重 (投与開始 後 50 hr)	脂肪	1.81																	79.06	
		脂肪	[0.009]																		[0.380]
		脂肪	6.26																		63.09
		脂肪	[0.138]																		[7.893]
産卵鶏	¹⁴ C 試験 [1] 3日間反復強 制経口投与 10mg/kg 体重 (投与開始 後 50 hr)	脂肪	12.35																	67.73	
		脂肪	[0.191]																		[1.493]
																				60.98	
																				[0.944]	

動植物等における代謝経路図

