

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

2. 植物代謝に関する試験

植物代謝試験は、テプラロキシジムの をそれぞれ標識化した化合物
 (C-ラベル、P-ラベル)を用いて、3種類の植物で試験を実施した。試験は各植物において取込試験(in-life phase)を通常施用量(低用量)、定性分析用高濃度処理(高用量)の2試験で実施し、更にそれらの試験で得られた試料を用いて残留物の分析(analytical phase)を実施した。

本抄録で記載する試験群の概要を以下に示す。

	供試植物	被験物質	処理法	処理量	試験項目
1)-(1)	ダイズ	テプラロキシジム (C-ラベル)	播種 51 日後 散布	100g ai/ha	低濃度 取込試験
1)-(2)		テプラロキシジム (C-ラベル)	播種 51 日後 散布	300g ai/ha	高濃度 取込試験
1)-(3)		テプラロキシジム (C-ラベル)	—	100g ai/ha 300g ai/ha	低・高濃度 代謝物分析試験
1)-(4)	ナタネ	テプラロキシジム (C-ラベル)	播種 45 日後 散布	100g ai/ha	低濃度 取込試験
1)-(5)		テプラロキシジム (C-ラベル)	播種 45 日後 散布	300g ai/ha	高濃度 取込試験
1)-(6)		テプラロキシジム (C-ラベル)	—	100g ai/ha 300g ai/ha	低・高濃度 代謝物分析試験
1)-(7)	テンサイ	テプラロキシジム (C-ラベル)	播種 52 日後 散布	50g ai/ha	低濃度 取込試験
1)-(8)		テプラロキシジム (C-ラベル)	播種 52 日後 散布	200g ai/ha	高濃度 取込試験
1)-(9)		テプラロキシジム (C-ラベル)	—	50g ai/ha 200g ai/ha	低・高濃度 代謝物分析試験
2)-(1)	ダイズ	テプラロキシジム (P-ラベル)	播種 60 日後 散布	100g ai/ha	低濃度 取込試験
2)-(2)		テプラロキシジム (P-ラベル)	播種 60 日後 散布	300g ai/ha	高濃度 取込試験
2)-(3)		テプラロキシジム (P-ラベル)	—	100g ai/ha 300g ai/ha	低・高濃度 代謝物分析試験

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

1) 標識テプラロキシジム(C-ラベル)を用いた植物代謝

(1) ¹⁴C-テプラロキシジム(C-ラベル)を用いたダイズにおける低濃度取り込み試験

(資料No. 運命-7)

試験実施機関： BASF 研究所(ドイツ)

報告書作成年： 1993 年 [GLP 対応]

供試標識化合物：

[¹⁴C] テプラロキシジム
(C-ラベル)

比放射能：

放射化学的純度：

* 標識位置

標識位置の設定理由：

供試植物：

ダイズ 品種 L2333(USA) 播種 51 日後

試験方法：

吸収・移行・分布

標識テプラロキシジム(C-ラベル)の 20%乳剤 1600 倍希釈液相当(125 ppm) を、800 L/ha の割合(100 g ai/ha に相当) で播種 51 日後に散布した。処理後 0(4 時間)、7、15、30 日に青刈りを採取し、60 日に植物全てを採取し、葉、茎、さや、豆および根にわけた。各部位をドライアイスと共に粉碎し、燃焼法により放射能を測定した。なお、植物は人工気象装置内で生育させた。

試験結果：

吸収・移行・分布

各試料における総放射性残留量を下表に示す。

表 1 C-ラベル・低濃度散布処理(100 g ai/ha)におけるダイズの残留量

採取時期	処理後日数	試料	TRR (mg/kg)*
散布直後	0 日	青刈り	2.292
中間期	7 日		2.259
	15 日		1.743
	30 日		1.337
収穫期	60 日	葉	7.819
	60 日	茎	0.138
	60 日	さや	0.536
	60 日	豆	0.480
	60 日	根	0.019

*：テプラロキシジム換算値

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

(2) ^{14}C -テプラロキシジム(C-ラベル)を用いたダイズにおける高濃度取り込み試験

(資料No. 運命-8)

試験実施機関： BASF 研究所(ドイツ)

報告書作成年： 1993 年 [GLP 対応]

供試標識化合物：

[^{14}C] テプラロキシジム
(C-ラベル)

比放射能：

放射化学的純度：

* 標識位置

標識位置の設定理由：

供試植物：

ダイズ 品種 L2333(USA) 播種 51 日後

試験方法：

吸収・移行・分布

標識テプラロキシジム(C-ラベル)の 20%乳剤 533 倍希釈液相当(375 ppm) を、800 L/ha の割合(300 g ai/ha に相当) で播種 51 日後に散布した。処理後 0(4 時間)、7、15、30 日に青刈りを採取し、60 日に植物全てを採取し、葉、茎、さや、豆および根にわけた。各部位をドライアイスと共に粉碎し、燃焼法により放射能を測定した。

なお、植物は人工気象装置内で生育させた。

試験結果：

吸収・移行・分布

各試料における総放射性残留量を下表に示す。

表 1 C-ラベル・高濃度散布処理(300 g ai/ha)におけるダイズの残留量

採取時期	処理後日数	試料	TRR(mg/kg)*
散布直後	0 日	青刈り	6.288
中間期	7 日		8.261
	15 日		6.430
	30 日		5.883
収穫期	60 日	葉	40.554
	60 日	茎	0.578
	60 日	さや	1.723
	60 日	豆	1.418
	60 日	根	0.040

* : テプラロキシジム換算値

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

(3) ^{14}C -テプラロキシジム(C-ラベル)を用いたダイズにおける代謝試験

(資料 No. 運命-9)

試験実施機関：(株)日曹分析センター

報告書作成年：1997年 [GLP 対応]

供試標識化合物：

[^{14}C] テプラロキシジム
(C-ラベル)

比放射能：

放射化学的純度：

標識位置の設定理由：

供試植物：

ダイズ 品種 L2333(USA) 播種 51 日後

試験方法：

吸収・移行・分布ならびに代謝物の同定および定量；

資料 No. 運命-7、8 で報告された、標識テプラロキシジム(C-ラベル)を低濃度 (100 g ai/ha) と高濃度(300 g ai/ha) で処理したダイズ試料(青刈り、成熟期の葉、茎、豆、さや、根)を用いて代謝物の同定および定量を行った。

すなわち、各部位をそれぞれ、
で抽出し、ろ液を
区、
区、水可
溶性区に分画した。水可溶性区はさらに吸着樹脂カラムに通し、
で溶出後、
を行って
抽出した。有機溶媒抽出区を固相抽出、HPLC、
二次元 TLC 等で単離し、コクロマトグラフィーおよびMS で同定した。抽出残渣については、さらに
酵素処理し、特徴付けを行った。

各部位の抽出液と抽出残渣の放射能を測定し、総放射性残留量(TRR)を求めた。資料 No. 7、8 では燃
焼法により、総放射性残留量(TRR)を求めていたが、燃焼法による測定は値のバラツキが大きいため
抽出法による総放射性残留量(TRR)を採用した。なお、高濃度処理試料を調製した目的は、代謝物の単
離や構造推定のために高残留の試料を得ることであった。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

試験結果：

吸収・移行・分布ならびに代謝物の同定および定量

① 吸収・移行・分布

抽出法による総放射性残留量(TRR)と処理量に対する回収率を下表に示す。また、各試料の抽出液と残渣の放射能の分布を低濃度および高濃度に分けて示す。

表1 C-ラベル・散布処理におけるダイズの残留量および処理量に対する回収率

採取時期	処理後 日数	試料	低濃度処理区		高濃度処理区	
			TRR (mg/kg)	回収率(%)*	TRR (mg/kg)	回収率(%)*
中間期	7日	青刈り	2.17	5.13	4.48	4.02
	15日	青刈り	1.55	4.39	6.34	5.16
	30日	青刈り	1.05	3.23	3.54	3.58
収穫期	60日	葉	6.20	29.60	35.19	45.39
	60日	茎	0.124	1.61	0.475	1.81
	60日	さや	0.535	1.43	1.57	1.37
	60日	豆	0.441	2.07	1.62	2.36
	60日	根	0.0372	0.09	0.0691	0.04

*：処理量に対する回収率% (申請者算出)

表2 C-ラベル・低濃度散布処理ダイズ試料の

抽出液と残渣の放射能の分布

部位	青刈り(7日)		青刈り(15日)		青刈り(30日)		葉(60日)	
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
総放射能	100.0	2.17	100.0	1.55	100.0	1.05	100.0	6.20
抽出区	95.7	2.08	93.6	1.45	91.6	0.96	90.4	5.61
区	4.2	0.09	3.4	0.05	1.4	0.01	2.4	0.15
区	44.2	0.96	35.7	0.56	23.7	0.25	15.4	0.96
水層区	38.6	0.83	44.9	0.74	60.2	0.63	61.7	3.81
抽出残渣	4.3	0.09	6.4	0.10	8.4	0.09	9.6	0.60
可溶化	4.0	0.21	6.0	0.092	7.9	0.082	9.5	0.594
最終抽出残渣	0.2	0.005	0.5	0.007	0.5	0.99	0.4	0.03

部位	豆(60日)		茎(60日)		さや(60日)		根(60日)	
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
総放射能	100.0	0.44	100.0	0.12	100.0	0.54	100.0	0.04
抽出区	92.5	0.41	83.8	0.10	86.2	0.46	72.7	0.03
区	0.9	0.00	1.6	0.00	0.5	0.00	0.2	0.00
区	39.2	0.18	15.4	0.01	11.3	0.06	18.0	0.01
水層区	48.2	0.21	60.9	0.09	59.7	0.30	59.5	0.02
抽出残渣	7.5	0.03	16.2	0.02	13.8	0.07	27.3	0.01
可溶化	8.1	0.035	15.7	0.03	13.9	0.074	—	—
最終抽出残渣	0.0	0.00	1.0	0.001	0.3	0.002	—	—

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

表3 C-ラベル・高濃度散布処理ダイズ試料の

抽出液と残渣の放射能の分布

部位	青刈り(7日)		青刈り(15日)		青刈り(30日)		葉(60日)	
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
総放射能	100.0	4.48	100.0	6.34	100.0	3.54	100.0	35.19
抽出区	95.1	4.26	93.0	5.89	91.2	3.22	88.9	31.28
区	3.2	0.14	1.7	0.11	0.8	0.03	0.5	0.19
区	46.5	2.08	31.5	1.99	25.3	0.89	20.0	7.03
水層区	44.6	1.99	54.0	3.42	56.1	1.98	61.0	21.52
抽出残渣	4.9	0.22	7.0	0.45	8.8	0.31	11.1	3.90
可溶化	—	—	—	—	—	—	4.8	1.68
最終抽出残渣							6.1	2.14

部位	豆(60日)		茎(60日)		さや(60日)		根(60日)	
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
総放射能	100.0	1.62	100.0	0.48	100.0	1.57	100.0	0.07
水タンク抽出区	95.2	1.54	87.6	0.42	87.3	1.37	77.1	0.05
区	0.2	0.00	—	—	0.3	0.00	0.0	0.00
区	45.3	0.73	16.5	0.08	18.0	0.28	21.4	0.01
水層区	41.9	0.68	57.0	0.28	58.5	0.91	45.6	0.02
抽出残渣	4.8	0.08	12.4	0.06	12.7	0.20	22.9	0.02

全体に での抽出性はよかった。処理後7日から60日の青刈り、葉試料では、88.9-95.7%が抽出され、60日の豆試料では、92.5-95.2%が抽出された。液々分配の結果、60日の豆試料では、と の量は同等であった。

② 代謝物の同定および定量

(a) 代謝物の同定

ダイズで同定された

であった。

は、テプラロキシジム、

であっ

た。

は

後に認められた。従って、

主要代謝物

は

であることがわかった。

テプラロキシジムの他に LCMS/MS によって同定された代謝物は、

であった。この他、HPLC 等で単離された未知代謝物が多

数存在した。

(b) 代謝物の定量

各部位での定量結果を次頁以降に示す。

が存在した。定量には

を考慮に入れ、各定量値を合計した。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

表 4 C-ラベル・低濃度散布処理におけるダイズ青刈り試料中の残留物

化合物	部位	青刈り(7日)		青刈り(15日)		青刈り(30日)	
		%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
テプラロキシジム		39.75	0.868	32.27	0.504	19.63	0.208
その他未知代謝物の合計 *4							
その他 *5							
抽出残渣							
合計							

*4: 個々の代謝物の最大値は、

*5: 分析をしなかった少量区の合計

低濃度処理での各青刈り試料および処理後 60 日の葉では、時間の経過とともにかなりの親化合物の分解が認められた。残留の主体は親化合物のテプラロキシジムと であつた。なお、
 として同定された。他に のような代謝物と
 などの代謝物が同定された。

処理後 60 日の茎、さやでの代謝物は葉とほぼ同じであつた。親化合物の存在量が 1-3% になり、残留の主体は となつた。

処理後 60 日の豆での残留の主体は、 であつた。その他の代謝物として
 が同定された。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

表 5 C-ラベル・低濃度散布処理における収穫期のダイズ葉、豆、茎、さや試料中の残留物

部位 化合物	葉(60日)		豆(60日)		茎(60日)		さや(60日)	
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
テブ ラキシム	15.02	0.929	n.d.	n.d.	3.38	0.004	1.31	0.007
その他未知代謝物の合計*4								
その他 *5								
抽出残渣								
合計								

*4: 個々の代謝物の最大値は、

*5: 分析をしなかった少量区の合計

n.d.: 検出されず

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

表 6 C-ラベル・高濃度散布処理におけるダイズ青刈り試料中の残留物

部位 化合物	青刈り(7日)		青刈り(15日)		青刈り(30日)	
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
テブラキシム	41.99	1.874	29.73	1.884	25.83	0.915
その他未知代謝物の合計 *4						
その他 *5						
抽出残渣						
合計						

*4: 個々の代謝物の最大値は、

*5: 分析をしなかった少量区の合計

高濃度処理での各青刈り試料、処理後 60 日の葉、茎、さやおよび豆での代謝は、低濃度処理の試料と同じであった。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

表 7C-ラベル・高濃度散布処理における収穫期のダイズ葉、豆、茎、さや試料中の残留物

部位	葉(60日)		豆(60日)		茎(60日)		さや(60日)	
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
テプラロキシジム	14.05	4.946	7.85	0.125	9.23	0.044	3.49	0.054
その他未知代謝物の合計*4								
その他 *5								
抽出残渣								
合計								

*4: 個々の代謝物の最大値は、

*5: 分析をしなかった少量区の合計

¹⁴C-テプラロキシジムはダイズにおいて、急速に代謝された。親化合物は低濃度処理区の豆を除く各部位で検出された。テプラロキシジム、が 10% TRR を超える主要代謝物であると同定された。10% TRR を超える未知の代謝物はなかった。LC/MS 分析で同定あるいは特徴づけされた代謝物から判断して、は起こらなかった。

ダイズにおけるテプラロキシジムの推定代謝経路を次頁に示す。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

(4) ^{14}C -テプラロキシジム(C-ラベル)を用いたナタネにおける低濃度取り込み試験

(資料No. 運命-10)

試験実施機関： BASF 研究所(ドイツ)

報告書作成年： 1994 年 [GLP 対応]

供試標識化合物：

[^{14}C] テプラロキシジム
(C-ラベル)

比放射能：

放射化学的純度：

標識位置の設定理由：

供試植物：

ナタネ 品種 Westar 播種 45 日後(6-8 葉期)

試験方法：

吸収・移行・分布

標識テプラロキシジム(C-ラベル)の 20%乳剤 1200 倍希釈液相当(167 ppm) を、600 L/ha の割合(100 g ai/ha に相当) で播種 45 日後(6-8 葉期)のナタネに散布した。処理直後に地上部を採取し、61 日後に植物全てを採取し、茎(葉を含む)、さや、種子および根にわけた。各部位をドライアイスと共に粉碎し、燃焼法により放射能を測定した。

なお、植物はガラス屋根の植物室内で自然条件下において生育させた。

試験結果：

吸収・移行・分布

各試料における総放射性残留量を下表に示す。

表 1 C-ラベル・低濃度散布処理(100 g ai/ha)におけるナタネの残留量

採取時期	処理後日数	試料	TRR (mg/kg)*
処理直後	0 日	地上部	4.010
収穫期	61 日	茎(葉を含む)	0.246
	61 日	さや	0.396
	61 日	種子	0.289
	61 日	根	0.107

*：テプラロキシジム換算値

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

(5) ^{14}C -テプラロキシジム(C-ラベル)を用いたナタネにおける高濃度取り込み試験

(資料 No. 運命-11)

試験実施機関： BASF 研究所(ドイツ)

報告書作成年： 1994 年 [GLP 対応]

供試標識化合物：

[^{14}C] テプラロキシジム
(C-ラベル)

比放射能：

放射化学的純度：

標識位置の設定理由：

供試植物：

ナタネ 品種 Westar 播種 45 日後(6-8 葉期)

試験方法：

吸収・移行・分布

標識テプラロキシジム(C-ラベル)の 20%乳剤 400 倍希釈液相当(500 ppm) を、600 L/ha の割合(300 g ai/ha に相当) で播種 45 日後に散布した。処理直後に地上部を採取し、67 日後に植物全てを採取し、茎(葉を含む)、さや、種子および根にわけた。各部位をドライアイスと共に粉碎し、燃焼法により放射能を測定した。

なお、植物はガラス屋根の植物室内で自然条件下において生育させた。

試験結果：

吸収・移行・分布

各試料における総放射性残留量を下表に示す。

表 1 C-ラベル・低濃度散布処理(300 g ai/ha)におけるナタネの残留量

採取時期	処理後日数	試料	TRR (mg/kg)*
処理直後	0 日	地上部	12.423
収穫期	67 日	茎(葉を含む)	1.410
	67 日	さや	2.151
	67 日	種子	1.020
	67 日	根	0.243

*：テプラロキシジム換算値

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

(6) ^{14}C -テプラロキシジム(C-ラベル)を用いたナタネにおける代謝試験

(資料 No. 運命-12)

試験実施機関： BASF 研究所(ドイツ)

報告書作成年： 1997 年 [GLP 対応]

供試標識化合物：

[^{14}C] テプラロキシジム
(C-ラベル)

比放射能：

放射化学的純度：

標識位置の設定理由：

供試植物：

ナタネ 品種 Westar 播種 45 日後(6-8 葉期)

試験方法：

吸収・移行・分布ならびに代謝物の同定および定量；

資料 No. 運命-10、11 で報告された、標識テプラロキシジム(C-ラベル)を低濃度 (100 g ai/ha) と高濃度(300 g ai/ha) で処理したナタネ試料(地上部、成熟期の茎(葉を含む)、さや、種子、根)を用いて代謝物の同定および定量を行った。各部位を 1 から 3 連でそれぞれ、

で抽出した。一部の試料について、更にろ液を液々分配し、
区、
水溶性区に分画した。水溶性区はさらに酵素
処理し、特徴付けを行った。
種子、茎の抽出残渣は、
をした後、酵素処理を行って特徴付けを行った。一部の抽出液
は HPLC を用いて代謝物の定量分析に供した。また、有機溶媒抽出区を HPLC で単離し、クロマト
グラフィーおよび MS で同定した。

資料 No. 運命-10、11 では燃焼法により総放射性残留量(TRR)を求めていたが、燃焼法による値はバラツキが大きいため、各部位の抽出液と抽出残渣の放射能から計算し、総放射性残留量(TRR)を求めた。なお、高濃度処理試料を調製した目的は、代謝物の単離や構造推定のために高残留の試料を得ることであった。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

試験結果：

吸収・移行・分布ならびに代謝物の同定および定量

① 吸収・移行・分布

抽出法による総放射性残留量(TRR)と処理量に対する回収率を下表に示す。また、各試料の抽出液と残渣の放射能の分布を低濃度および高濃度に分けて示す。なお、以下に示す表は、試料を抽出後、HPLCで分析し、残留物の定量および特徴付けを行いデータの取りまとめまで一連の操作が行われた試料のデータを抜粋して記載した。なお、さや試料は、茎と類似した分配を示したので高濃度処理の試料で残留物の定量および特徴付け等の分析は行わなかった。

表1 C-ラベル・散布処理におけるナタネの残留量および処理量に対する回収率

採取時期	処理後日数 低/高濃度	試料	低濃度処理区		高濃度処理区	
			TRR (mg/kg)	回収率(%)* ¹	TRR (mg/kg)	回収率(%)* ¹
散布直後	0日	地上部	4.998	2.21	7.460	1.82
収穫期	61/67日	茎(葉を含む)	0.236	3.54	1.625	2.64
	61/67日	さや	0.366	3.61	7.861 ^{*2}	12.37
	61/67日	種子	0.287	1.33	1.106	0.54

*1 処理量に対する回収率%(申請者算出)

*2 高濃度処理のさやの数値は燃焼法による再分析結果

表2 C-ラベル・低濃度散布処理ナタネ試料の抽出液と残渣の放射能の分布

部位	地上部(0日)		茎(61日)		さや(61日)		種子(61日)	
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
総放射能	100.0	4.998	100.0	0.236	100.0	0.366	100.0	0.287
区	—	—	—	—	—	—	8.4	0.024
区	98.2	4.910	69.9	0.165	79.1	0.290	74.6	0.214
水区	—	—	16.6	0.039	12.5	0.046	7.0	0.020
抽出残渣	1.8	0.088	13.6	0.032	8.3	0.031	15.6	0.045

表3 C-ラベル・高濃度散布処理ナタネ試料の抽出液と残渣の放射能の分布

部位	地上部(0日)		茎(67日)		さや(67日)		種子(67日)	
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
総放射能	100.0	7.460	100.0	1.625	100.0	7.861	100.0	1.106
区	—	—	—	—	—	—	11.9	0.131
区	99.0	7.387	53.3	0.868	46.2	3.639	57.8	0.640
水区	—	—	27.6	0.449	40.2	3.164	16.9	0.187
抽出残渣	1.0	0.073	15.3	0.248	12.4	0.978	13.4	0.149

全体に での抽出性はよかった。処理後 61 日の低濃度処理試料では、86.5-91.6%が抽出され、67 日の高濃度処理試料では、80.9-86.6%が抽出された。液々分配の結果、有機溶媒抽出性代謝物の量が主であった。

② 代謝物の同定および定量

(a) 代謝物の同定

ナタネで LC/MS/MS によって同定された化合物は、テプラロキシジムの他に

であった。

この他、HPLC 等で単離された未知代謝物が多数存在した。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

(b) 代謝物の定量

低濃度散布処理では、代謝物の同定ならびに特徴づけが行われた茎および種子に付いて示す。茎は区および水区の HPLC 分析の結果を、種子はメタノール区の HPLC 分析の結果を示す。

を考慮に入れ、各定量値を合計した。

表 4 C-ラベル・低濃度散布処理における収穫期ナタネ試料中の残留物

化合物	部位	茎(61日)		種子(61日)	
		%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
テトラキジム		2.1	0.035	n.d.	n.d.
その他未知代謝物の合計*2					
区					
水区					
抽出残渣					
合計					

n.d.: 検出されず

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

高濃度散布処理では、代謝物の同定ならびに特徴づけが行われた茎、種子および保存安定性用に分析された処理直後の地上部に付いて示す。地上部は 区を、茎は 区および水区を、種子は 区、 区および水区の HPLC 分析の結果を示す。

表 5 C-ラベル・高濃度散布処理におけるナタネ試料中の残留物

化合物	部位	地上部(0日)		茎(67日)		種子(67日)	
		%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
テプラロキシジム		82.9	6.187	2.1	0.035	n.d.	n.d.
その他未知代謝物の合計*2							
抽出残渣							
合計							

n.d.: 検出されず

代謝物組成は部位によって若干異なっている。

処理直後の地上部には、親化合物のテプラロキシジム がほとんどであった。

茎からは 区のような代謝物と 区のような代謝物および

など

のような3系統の代謝物が同定された。10%を超す主要代謝物は 区であった。

種子では、 区であった。水層区の 区が遊離した。

が残留の主体で 処理により少量の多数の有機溶媒可溶性代謝物が遊離した。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

表 6 C-ラベル・高濃度散布処理におけるナタネ茎、種子の抽出残渣中の残留物

化合物	部位	茎(67日)		種子(67日)	
		%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
抽出残渣					
最終抽出残渣					

* 種子(67日)の一部を代謝物同定のため、同様に抽出処理したため、残留量が若干異なる。

これらの抽出操作で極わずかの
は観察されなかった。

した。テプラロキシジムと

¹⁴C-テプラロキシジムはナタネにおいて、
代謝された。10%TRR を超える未知の代謝物はなかった。

により急速に

ナタネにおけるテプラロキシジムの推定代謝経路を下に示す。

テプラロキシジムのナタネにおける推定代謝経路図

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

(7) ^{14}C -テプラロキシジム(C-ラベル)を用いたテンサイにおける低濃度取り込み試験

(資料No. 運命-13)

試験実施機関： BASF 研究所(ドイツ)

報告書作成年： 1992年 [GLP 対応]

供試標識化合物：

[^{14}C] テプラロキシジム
(C-ラベル)

比放射能：

放射化学的純度：

標識位置の設定理由：

供試植物：

テンサイ 品種 Kawetina 播種 52 日後(4 葉期)

試験方法：

吸収・移行・分布

標識テプラロキシジム(C-ラベル)の 20%乳剤 2000 倍希釈液相当(100 ppm) を、500 L/ha の割合(50 g ai/ha に相当) で播種 52 日後(4 葉期)に散布した。処理後 0 日(6 時間)に地上部を採取し、45 日、124 日に植物全てを採取し、葉および根部にわけた。各部位をドライアイスと共に粉碎し、燃焼法により放射能を測定した。なお、植物は人工気象装置内で生育させた。

試験結果：

吸収・移行・分布

各試料における総放射性残留量を下表に示す。

表 1 C-ラベル・低濃度散布処理(50 g ai/ha)におけるテンサイの残留量

採取時期	処理後日数	試料	TRR (mg/kg)*
処理直後	0 日	地上部	4.731
中間期	45 日	葉	0.344
	45 日	根	0.118
収穫期	124 日	葉	0.050
	124 日	根	0.047

* : テプラロキシジム換算値

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

(8) ^{14}C -テプラロキシジム(C-ラベル)を用いたテンサイにおける高濃度取り込み試験

(資料No. 運命-14)

試験実施機関： BASF 研究所(ドイツ)

報告書作成年： 1992 年 [GLP 対応]

供試標識化合物：

[^{14}C] テプラロキシジム
(C-ラベル)

比放射能：

放射化学的純度：

標識位置の設定理由：

供試植物：

テンサイ 品種 Kawetina 播種 52 日後(4 葉期)

試験方法：

吸収・移行・分布

標識テプラロキシジム(C-ラベル)の 20%乳剤 500 倍希釈液相当(400 ppm) を、500 L/ha の割合(200 g ai/ha に相当) で播種 52 日後(4 葉期)に散布した。処理後 0 日(6 時間)に地上部を採取し、45 日、123 日に植物全てを採取し、葉および根部にわけた。各部位をドライアイスと共に粉碎し、燃焼法により放射能を測定した。なお、植物は人工気象装置内で生育させた。

試験結果：

吸収・移行・分布

各試料における総放射性残留量を下表に示す。

表 1 C-ラベル・低濃度散布処理(200 g ai/ha)におけるテンサイの残留量

採取時期	処理後日数	試料	TRR (mg/kg)*
処理直後	0 日	地上部	19.745
中間期	45 日	葉	0.171
	45 日	根	0.141
収穫期	123 日	葉	0.111
	123 日	根	0.055

*：テプラロキシジム換算値

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

(9) ^{14}C -テプラロキシジム(C-ラベル)を用いたテンサイにおける代謝試験

(資料 No. 運命-15)

試験実施機関： BASF 研究所(ドイツ)

報告書作成年： 1997 年 [GLP 対応]

供試標識化合物：

[^{14}C] テプラロキシジム
(C-ラベル)

比放射能：

放射化学的純度：

標識位置の設定理由：

供試植物：

テンサイ 品種 Kawetina 播種 52 日後(4 葉期)

試験方法：

吸収・移行・分布ならびに代謝物の同定および定量；

資料 No. 運命-13、14 で報告された、標識テプラロキシジム(C-ラベル)を低濃度 (50 g ai/ha) と高濃度 (200 g ai/ha) で処理したテンサイ試料のうち、高濃度(200 g ai/ha) 処理したテンサイ試料(生育途中の葉と根部、成熟期の葉と根部)を用いて代謝物の同定および定量を行った。

すなわち、各部位をそれぞれ、 で抽出し、ろ液を液々分配し、 区、

区、 区、水溶性区に分画し、それぞれを HPLC 分析した。さらに、水溶性区を、酵素処理後、酵素処理して特徴付けを行った。葉、根部の抽出残渣は、塩酸抽出をした後、酵素処理を行って特徴付けを行った。有機溶媒抽出区を HPLC で単離精製し、クロマトグラフィーおよび MS で代謝物を同定した。

各部位の抽出液と抽出残渣の放射能を測定し、総放射性残留量(TRR)を求めた。資料 No. 運命-13、14 では燃焼法により、総放射性残留量(TRR)を求めていたが、燃焼法による測定は値のバラツキが大きいため抽出法による総放射性残留量(TRR)を採用した。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

試験結果：

吸収・移行・分布ならびに代謝物の同定および定量

① 吸収・移行・分布

抽出法による総放射性残留量(TRR)と処理量に対する回収率を下表に示す。また、各試料の抽出液と残渣の放射能の分布を低濃度および高濃度に分けて示す。

表1 C-ラベル・高濃度散布処理におけるテンサイの残留量および処理量に対する回収率

採取時期	処理後日数	試料	高濃度処理区	
			TRR (mg/kg)	回収率%*
中間期	45日	葉	0.269-0.359	0.95-1.27
	45日	根部	0.231	0.25
収穫期	123日	葉	0.054-0.079	1.11-1.62
	123日	根部	0.044-0.068	0.92-1.43

*：処理量に対する回収率% (申請者算出)

表2 C-ラベル・高濃度散布処理テンサイ試料の抽出液と残渣の放射能の分布

部位	葉(45日)		根部(45日)		葉(123日)		根部(123日)	
	%TRR	mg/kg* ¹	%TRR	mg/kg* ¹	%TRR	mg/kg* ¹	%TRR	mg/kg* ¹
総放射能	100.0	0.314	100.0	0.231	100.0	0.065	100.0	0.054
抽出区	83.1	0.260	74.7	0.172	65.8	0.043	64.5	0.035
区* ²	36.5		24.3		17.4		5.6	
区* ²	40.9		47.2		42.5		47.7	
抽出残渣	17.0	0.054	25.3	0.058	34.2	0.022	35.5	0.019

*¹ 表中の mg/kg は数回の平均値である。

*² 操作中の損失があるため合計値は抽出区と一致しないことがある。

全体に での抽出性はよかった。処理後45日の試料では、74.7 - 83.1%が抽出され、123日の試料では、65%が抽出された。液々分配の結果、 の量が主であった。根部(123日)の場合、 は だけであった。

② 代謝物の同定および定量

(a) 代謝物の同定

テンサイの代謝物として が LC/MS により同定された。この他、HPLC 等で分離された未知代謝物が多数(25 ピーク以上)存在した。酵素および誘導化反応により、水層区の代謝物を特徴づけしたところ、テブラロキシジムの一部は、 に代謝され、おそらく光合成の過程により、テンサイの炭水化物プール(蔗糖、果糖およびブドウ糖)に取り込まれることが示された。テブラロキシジムおよびその代謝物のこれらは は観察されなかった。

(b) 代謝物の定量

各部位での定量結果を次頁に示す。

葉(123日)、根部(123日)の一部を代謝物同定のため、同様に抽出処理したもののデータであり、前述の分布率を測定したものと残留量が若干異なる。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

表 3 C-ラベル・高濃度散布処理におけるテンサイ試料中の残留物

化合物	部位	根部(45日)		葉(123日)		根部(123日)	
		%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
テプラロキシジム		n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.
その他未知代謝物の合計*1							
水層区							
水層区 内訳	処理後の 有機層						
	酵母処理						
	トラップ液 蒸留 酵母 上清						
抽出残渣							
合計							

n.d. : 検出せず

葉(45日)の抽出区を直接HPLC分析したときには、18ピークが検出され、その最大値はであった。

表 4 C-ラベル・高濃度散布処理におけるテンサイ根部(45日)、葉(123日)、根部(123日)の抽出残渣中の残留物

化合物	部位	根部(45日)		葉(123日)		根部(123日)	
		%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
抽出残渣							
最終抽出残渣							

テンサイにおけるテプラロキシジムの推定代謝経路を次頁に示す。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

テンサイにおけるテブラロキシジムの推定代謝経路

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

2) 標識テプラロキシジム(P-ラベル)を用いた植物代謝

(1) ^{14}C -テプラロキシジム(P-ラベル)を用いたダイズにおける低濃度取り込み試験

(資料 No. 運命-16)

試験実施機関： BASF 研究所(ドイツ)

報告書作成年： 1994 年 [GLP 対応]

供試標識化合物： [^{14}C] テプラロキシジム
(P-ラベル)

比放射能：

放射化学的純度：

標識位置の設定理由：

供試植物：

ダイズ 品種 L2333(USA) 播種 60 日後

試験方法： 吸収・移行・分布

標識テプラロキシジム(P-ラベル)の 20%乳剤 1200 倍希釈液相当(167 ppm) を、600 L/ha の割合(100 g ai/ha に相当) で播種 60 日後に散布した。処理後 0、30 日に青刈りを採取し、64 日に植物全てを採取し、茎(葉を含む)、さや、豆および根にわけた。各部位をドライアイスと共に粉碎し、燃焼法により放射能を測定した。なお、植物は当初人工気象装置内で生育させ、途中からガラス温室内で生育させた。

試験結果： 吸収・移行・分布

各試料における総放射性残留量を下表に示す。

表 1 P-ラベル・低濃度散布処理(100 g ai/ha)におけるダイズの残留量

採取時期	処理後日数	試料	TRR (mg/kg)*
散布直後	0 日	青刈り	2.532
中間期	30 日		0.760
収穫期	64 日	茎(葉を含む)	5.275
	64 日	さや	0.738
	64 日	豆	0.291
	64 日	根	0.029

*：テプラロキシジム換算値

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

(2) ^{14}C -テプラロキシジム(P-ラベル)を用いたダイズにおける高濃度取り込み試験

(資料 No. 運命-17)

試験実施機関： BASF 研究所(ドイツ)

報告書作成年： 1994 年 [GLP 対応]

供試標識化合物： [^{14}C] テプラロキシジム
(P-ラベル)

比放射能：

放射化学的純度：

標識位置の設定理由：

供試植物：

ダイズ 品種 L2333(USA) 播種 60 日後

試験方法： 吸収・移行・分布

標識テプラロキシジム(P-ラベル)の 20%乳剤 400 倍希釈液相当(500 ppm) を、600 L/ha の割合(300 g ai/ha に相当)で播種 60 日後に散布した。処理後 0、30 日に青刈りを採取し、60 日に植物全てを採取し、茎(葉を含む)、さや、豆および根にわけた。各部位をドライアイスと共に粉碎し、燃焼法により放射能を測定した。なお、植物は、当初人工気象装置内で生育させ、途中からガラス温室内で生育させた。

試験結果： 吸収・移行・分布

各試料における総放射性残留量を下表に示す。

表 1 P-ラベル・低濃度散布処理(300 g ai/ha)におけるダイズの残留量

採取時期	処理後日数	試料	TRR (mg/kg)*
散布直後	0 日	青刈り	4.603
中間期	30 日		2.164
収穫期	60 日	茎(葉を含む)	20.826
	60 日	さや	3.027
	60 日	豆	1.321
	60 日	根	0.031

*：テプラロキシジム換算値

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

(3) ^{14}C -テプラロキシジム(P-ラベル)を用いたダイズにおける代謝試験

(資料 No. 運命-18)

試験実施機関：(株)日曹分析センター

報告書作成年：1997年 [GLP 対応]

供試標識化合物： [^{14}C] テプラロキシジム
(P-ラベル)

比放射能：

放射化学的純度：

標識位置の設定理由：

供試植物：

ダイズ 品種 L2333(USA) 播種 60 日後

試験方法：

吸収・移行・分布ならびに代謝物の同定および定量；

資料 No. 運命-16、17 で報告された、標識テプラロキシジム(P-ラベル)を低濃度 (100 g ai/ha) と高濃度(300 g ai/ha) で処理したダイズ試料(青刈り、成熟期の葉を含む茎、豆、さや、根)を用いて代謝物の同定および定量を行った。

すなわち、各部位をそれぞれ、 で抽出し、ろ液を 区、 区、水可溶性区に分画した。水可溶性区はさらに吸着樹脂カラムに通し、 で溶出後、酵素処理を行って 抽出した。 抽出区を固相抽出、HPLC、二次元 TLC 等で単離精製し、-コクロマトグラフィーおよび MS で代謝物を同定した。抽出残渣を酵素処理し、特徴付けを行った。

各部位の抽出液と抽出残渣の放射能を測定し、総放射性残留量(TRR)を求めた。資料 No. 運命-16、17 では燃焼法により、総放射性残留量(TRR)を求めていたが、燃焼法による測定は振れが大きいので抽出法による総放射性残留量(TRR)を採用した。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

試験結果：

吸収・移行・分布ならびに代謝物の同定および定量

① 吸収・移行・分布

抽出法による総放射性残留量(TRR)と処理量に対する回収率を下表に示す。また、各試料の抽出液と残渣の放射能の分布を低濃度および高濃度に分けて示す。

表1 P-ラベル・散布処理におけるダイズの残留量および処理量に対する回収率

採取時期	処理後日数 低/高濃度	試料	低濃度処理区		高濃度処理区	
			TRR (mg/kg)	回収率(%)* ¹	TRR (mg/kg)	回収率(%)* ¹
中間期	30日	青刈り	0.55	2.50	2.75	5.56
収穫期	64/60日	茎(葉を含む)	3.54	34.11	15.61	48.86
	64/60日	さや	0.75	1.30	2.29	1.13
	64/60日	豆	0.45	2.07	1.46	1.83
	64/60日	根	0.019	0.01	0.045	0.01

* 処理量に対する回収率% (申請者算出)

表2 P-ラベル・低濃度散布処理ダイズ試料の水メタノール抽出液と残渣の放射能の分布

部位	青刈り(30日)		豆(64日)		さや(64日)		茎(64日)		根(64日)	
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
総放射能	100.0	0.55	100.0	0.45	100.0	0.75	100.0	3.54	100.0	0.019
抽出区	93.6	0.52	98.0	0.44	90.2	0.68	89.7	3.18	66.1	0.012
区	5.0	0.03	2.0	0.01	0.7	0.005	—	—	0.8	0.000
区	17.8	0.10	41.7	0.19	12.3	0.09	12.0	0.43	10.6	0.002
水層区	58.3	0.34	47.4	0.22	62.6	0.480	66.3	2.35	41.9	0.007
抽出残渣	6.4	0.04	2.0	0.01	9.8	0.07	10.3	0.36	33.9	0.006

表3 P-ラベル・高濃度散布処理ダイズ試料の水メタノール抽出液と残渣の放射能の分布

部位	青刈り(30日)		豆(60日)		さや(60日)		茎(60日)		根(60日)	
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
総放射能	100.0	2.75	100.0	1.46	100.0	2.29	100.0	15.61	100.0	0.045
抽出区	93.3	2.56	97.7	1.43	89.4	2.05	89.1	13.9	75.7	0.034
区	3.5	0.09	1.0	0.01	0.8	0.02	—	—	0.2	0.000
区	13.9	0.38	47.2	0.69	14.2	0.32	11.3	1.77	17.8	0.008
水層区	62.7	1.72	43.3	0.64	64.7	1.47	64.9	10.13	45.8	0.020
抽出残渣	6.7	0.18	2.3	0.03	10.6	0.24	10.9	1.69	24.3	0.011

全体に での抽出性はよかった。処理後30日の青刈り、処理後64/60日の茎試料では、89.1-93.6%が抽出され、64/60日の豆試料では、97.7-98.0%が抽出された。液々分配の結果、64/60日の豆試料では、 と の量は同等であった。

② 代謝物の同定および定量

(a) 代謝物の同定

ダイズで同定された

であった。

であった。

水層区の 後に認められた。従って、水層区の主要代謝物は であることがわかった。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

テプラロキシジムの他に LCMS/MS によって同定された代謝物は、
であった。

この他、HPLC 等で単離された未知代謝物が多数存在した。

(b) 代謝物の定量

各部位での定量結果を下表に示す。

を考慮に入れ、各定量値を合計した。

表 4 P-ラベル・低濃度散布処理におけるダイズ中間期青刈りおよび収穫期・豆、茎、さや試料中の残留物

化合物	部位		青刈り(30日)		豆(64日)		茎(64日)		さや(64日)	
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
テプラロキシジム	11.4	0.064	4.5	0.021	7.0	0.252	1.7	0.013		
その他未知代謝物の合計*4										
その他 *5										
抽出残渣										
合計										

*4: 個々の代謝物の最大値は

*5: 分析をしなかった少量区の合計

低濃度処理での処理後 30 日の青刈り試料では、かなりの親化合物の分解が認められた。残留の主体は親化合物のテプラロキシジム(11%)と であった。なお、 はその として同定された。他に のような代謝物と などの代謝物が同定された。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

処理後 64 日の茎、さやでの代謝物は青刈りとほぼ同じであった。親化合物の存在量が 1-7% になり、残留の主体は となった。処理後 64 日の豆での残留の主体は、
であった。その他の代謝物として が同定された。

表 5 P-ラベル・高濃度散布処理におけるダイズ中間期青刈りおよび収穫期・豆、茎、さや試料中の残留物

化合物	部位		青刈り(30日)		豆(60日)		茎(60日)		さや(60日)	
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
テプラロキシジム	16.4	0.449	7.5	0.109	9.4	1.479	2.0	0.046		
その他未知代謝物の合計*4										
その他 *5										
抽出残渣										
合計										

*4: 個々の代謝物の最大値は

*5: 分析をしなかった少量区の合計

n.d.: 検出されず

¹⁴C-テプラロキシジムはダイズにおいて、急速に代謝された。親化合物は豆を除く各部位で検出された。テプラロキシジム、 が 10%TRR を超える主要代謝物であると同定された。10%TRR を超える未知の代謝物はなかった。LC/MS 分析で同定あるいは特徴づけされた代謝物から判断して、 は起こらなかった。

ダイズにおけるテプラロキシジムの推定代謝経路を次頁に示す。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

テプラロキシジムのダイズにおける推定代謝経路図

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

3. 土壌中動態に関する試験

1) 好氣的湛水土壌中動態試験

当該農薬は、12 農産第 8147 号農薬の登録申請に係る試験成績の提出の除外の別表 2 に示されている「水田において使用されない場合」に該当するため、本農薬の好氣的湛水土壌中動態試験成績の提出を行わない。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

2) 好氣的土壤中動態試験

(I) ^{14}C -テプラロキシジム(C-ラベル)を用いたドイツ土壤における動態試験

(資料No.運命-19)

試験実施機関： BASF 研究所(ドイツ)

報告書作成年： 1994年 [GLP 対応]

供試標識化合物：

[^{14}C] テプラロキシジム
(C-ラベル)

比放射能：

放射化学的純度：

標識位置の設定理由：

供試土壤：

Limburgerhof sandy loam (ドイツ、Bruch West 州)

土性 USDA 法	砂 (%)	シルト (%)	粘土 (%)	有機炭素 含有率(%)	pH CaCl ₂	陽イオン交換 容量
SL	55	31	14	1.7	7.3	17.2

試験方法：

① 代謝試験

好氣的条件下で試験を行った。最大容水量の 40% に水分調整した土壤の一部分に標識テプラロキシジム 0.984298 mg/ml の溶液を加えよく混和し、さらに残りの土壤に加え全体を再びよく混和した。最終濃度は、0.5 mg/kg 乾土とした。乾土換算 100 g づつに分けてガラス皿に入れ、代謝試験装置に入れ、20±1°C で培養した。試料採取間隔を、処理後、0、1、7、14、30、61、104 日とした。揮散性物質は、7～14 日ごとに測定し、試験後期にはもっと長い間隔で測定した。各採取日に土壤試料の一部を試料酸化装置で燃焼し、生じた $^{14}\text{CO}_2$ の放射能を測定した。土壤試料の一部を
で順次抽出し、各抽出液の放射能を測定した。抽出後に残った土壤残渣の放射能 (非抽出放射能 (RRR)) を燃焼法で測定した。7、14、3、61、104 日の RRR を
で分画し、各画分の放射能を測定した。

② 分解物の同定および定量

代謝試験で得た 画分、 画分、 画分を濃縮し TLC および HPLC で分析した。別途、標識テプラロキシジムを 10 mg/kg 乾土で処理し、培養した試料を用いて同様に
で抽出し、HPLC 分画、MS 分析を行った。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

試験結果：

① 代謝試験

放射能の回収率を下表に示す。

日数	¹⁴ C-テプラロキシジム処理量に対する回収率 %						
				抽出液計	残渣	¹⁴ CO ₂	合計
0	93.3	3.5	—	98.0	2.0	—	100.0
1	79.2	3.3	2.6	85.1	11.4	—	96.5
7	34.0	3.9	4.1	42.0	27.7	23.0	92.7
14	17.5	7.3	2.4	27.1	29.9	39.5	96.5
30	4.5	2.0	4.9	11.4	35.6	56.4	103.3
61	1.4	1.2	3.1	5.7	29.3	63.7	98.6
104	1.2	1.6	2.9	5.7	24.8	66.6	97.1
—：測定せず							

による抽出率は着実に減少したが、への抽出率は最大 7.3%で、これが少量しか生じていないことを示している。抽出液の合計は、最初の 98%から 61 および 104 日の 5.7%まで減少した。CO₂への無機化は非常に高く、2 ヶ月後には 60%が無機化された。残渣は、1 ヶ月後で 35%の最大値に達し、その後、終了時の約 25%まで減少した。¹⁴CO₂以外の揮散性物質の生成はみられなかった。

残渣のアルカリ分画の結果を下表に示す。

日数	¹⁴ C-テプラロキシジム処理量に対する%			
	残渣			
7	27.7	4.9	4.9	19.6
14	29.9	3.1	5.3	24.8
30	35.6	3.5	4.9	25.5
61	29.3	2.9	4.1	22.0
104	24.8	2.4	4.1	23.0

残渣中放射能の大部分がに取込まれた。

② 代謝物の同定および定量

TLC クロマトグラムが複雑なため HPLC で代謝物の定性定量を行い、コクロマトグラフィーおよび MS で確認した。各画分の定量結果を次頁に示す。

を考慮に入れ、各定量値を合計した。

テプラロキシジムのDT₅₀およびDT₉₀は、一次式により、それぞれ 5.2 日、17.3 日と計算された。その分解はへの変換のみでなく、本質的に速いCO₂への生物学的無機化である。CO₂量は 14 日で処理量の 40%となり、104 日で 67%に達した。処理量の 10%以上の代謝物はCO₂であり、少量の代謝物としてが検出された。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

	¹⁴ C-テプラロキシジム処理後の抽出区中の残留量 (処理量%)										
	0日		1日			7日			14日		
化合物											
テプラロキシジム	90.4	2.8	73.1	2.2	0.4	29.6	1.4	n.d.	13.7	0.8	0.2
未知代謝物の合計											

n.d.: 検出されず

	¹⁴ C-テプラロキシジム処理後の抽出区中の残留量 (処理量%)								
	30日			61日			104日		
化合物									
テプラロキシジム	2.0	0.2	n.d.	0.2	n.d.	n.d.	0.1	0.2	n.d.
未知代謝物の合計									

n.d.: 検出されず

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

定量結果のまとめを下表に示す。

化合物	¹⁴ C-テプラロキシジム処理後の回収率 (処理量%)						
	0日	1日	7日	14日	30日	61日	104日
テプラロキシジム	93.2	75.7	31.0	14.7	2.2	0.2	0.3
未知代謝物の合計*1							
¹⁴ CO ₂							
抽出残渣							
合計							

土壌におけるテプラロキシジムの推定主代謝経路を下に示す。

土壌におけるテプラロキシジムの推定主代謝経路

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

(2) ^{14}C -テプラロキシジム(C-ラベル)を用いたアメリカ土壌における動態試験

(資料No. 運命-20)

試験実施機関： BASF 研究所(ドイツ)

報告書作成年： 1995 年 [GLP 対応]

供試標識化合物：

[^{14}C] テプラロキシジム
(C-ラベル)

比放射能：

放射化学的純度：

標識位置の設定理由：

供試土壌：

Holly Springs sandy loam (米国、ノースカロライナ州)

土性 USDA 法	砂 (%)	シルト (%)	粘土 (%)	有機炭素 含有率(%)	pH CaCl ₂	陽イオン 交換容量
SL	78	10	12	1.1	6.4	4.3

試験方法：

① 代謝試験

好気的条件下で試験を行った。1/3 barの75%に水分調整した乾土換算 2300 gの土壌に、標識テプラロキシジム 0.942 mg/mlの 溶液 1.22 mlを添加し(結果的に 0.5 mg/kg乾土)、乾土換算 100 gずつに分けてガラス皿に入れ、代謝試験装置に入れた。暗所に置き 20±1°Cで培養した。試料採取間隔を、処理後、0、1、2、4、7、14、30、62、92、182、273、361 日とした。代謝試験装置に湿らせた空気を通し、生ずる揮散性物質を、 で捕集した。各採取日に捕集液を採取し、放射能を測定し、新たな液と交換した。各採取日に土壌試料の一部を試料酸化装置で燃焼し、生じた $^{14}\text{CO}_2$ の放射能を測定して総放射性残留量(TRR)を求めた。土壌試料の一部を で順次抽出し、各抽出液の放射能を測定した。抽出後に残った土壌残渣の放射能(非抽出放射能(RRR))を燃焼法で測定した。0 日以外の採取日のRRRを で分画し、各画分の放射能を測定した。

② 分解物の同定および定量

代謝試験で得た 画分、 画分、 画分を濃縮し TLC および HPLC で分析した。処理後 1、2、4、7 日の土壌試料の残りの部分を合わせ で抽出し、HPLC で分析した。HPLC からのそれぞれの画分を集め MS 分析にかけた。別途、乾土換算 150 g の土壌に有効成分 2 mg/kg 乾土で処理し、9 日間培養した試料を用いて同様に 抽出、HPLC 分画、MS 分析を行った。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

試験結果：

① 代謝試験

放射能の回収率を下表に示す。

日数	¹⁴ C-テブラロキシジム処理量に対する回収率 %						
				抽出液計	残渣	¹⁴ CO ₂	合計
0	99.6	1.2	0.6	101.4	0.6	—	102.0
1	82.7	3.1	3.3	89.0	5.9	2.0	96.9
2	63.1	4.9	4.3	72.3	11.8	4.3	88.4
4	51.8	3.5	4.3	59.7	15.1	12.0	86.8
7	30.1	4.3	4.7	39.1	19.3	30.3	88.8
14	16.9	7.5	3.3	27.7	20.0	45.0	92.7
30	9.6	4.7	2.4	16.7	21.6	53.4	91.6
62	5.5	4.1	3.1	12.6	21.4	57.2	91.2
92	3.5	4.1	2.0	9.6	21.4	59.7	90.6
182	2.2	3.5	1.6	7.3	18.5	63.3	89.2
273	1.6	2.2	1.4	5.3	17.9	64.0	87.2
361	1.4	1.8	1.2	4.5	17.3	65.0	86.8

—：分析せず

土壌からの抽出率は経時的に低下したが、最初の1ヶ月間は大半の放射能が抽出された。

への抽出率は最大7.5%で、これからが少量しか生じていないことが判る。残渣は、7日の19.3%まで増加し、その後だいたい一定で最後にやや減少した(361日で17.3%)。¹⁴CO₂以外の揮散性物質の生成はみられなかった。¹⁴CO₂への無機化は速く(7日で30.3%)、361日まで連続的に増加し最終的に65.0%に達した。

残渣のアルカリ分画の結果を下表に示す。

日数	¹⁴ C-テブラロキシジム抽出残渣のアルカリ分画 (対処理量 %)					
	残渣	抽出物	水抽出物			
1	5.9	3.7	0.6	0.4	2.6	1.8
2	11.8	6.5	0.8	1.2	4.9	4.1
4	15.1	7.5	1.0	1.6	5.5	5.7
7	19.3	7.9	1.0	2.0	5.7	8.1
14	20.0	9.4	1.2	2.2	6.3	10.0
30	21.6	9.2	1.4	2.2	6.1	9.6
62	21.4	9.0	1.4	2.4	5.7	9.2
92	21.4	8.6	1.4	2.0	5.7	10.6
182	18.5	7.5	1.0	1.8	4.9	9.6
273	17.9	7.5	1.4	2.0	5.1	9.4
361	17.3	6.9	1.0	1.6	4.3	7.3

残渣中放射能の約50%が抽出された。さらに抽出放射能の2/3が抽出液に回収され、残渣に取込まれた。

② 代謝物の同定および定量

TLCクロマトグラムが複雑なためHPLCで代謝物の定性定量を行い、コクロマトグラフィーおよびMSで確認した。各画分の定量結果を次頁に示す。

を考慮に入れ、各定量値を合計した。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

¹⁴ C-テブラロキシジム処理後の抽出区中の残留量 (処理量%)									
日数	0 日			1 日			2 日		
化合物	DCM	MeOH	MeOH/水	DCM	MeOH	MeOH/水	DCM	MeOH	MeOH/水
テブラロキシジム	93.5	1.2	n.d.	72.1	2.4	0.4	50.3	2.8	0.6
未知代謝物の合計									

n.d. : 検出されず

¹⁴ C-テブラロキシジム処理後の抽出区中の残留量 (処理量%)									
日数	4 日			7 日			14 日		
化合物	DCM	MeOH	MeOH/水	DCM	MeOH	MeOH/水	DCM	MeOH	MeOH/水
テブラロキシジム	38.9	0.8	0.2	19.5	0.8	0.6	7.1	0.8	n.d.
未知代謝物の合計									

n.d. : 検出されず

¹⁴ C-テブラロキシジム処理後の抽出区中の残留量 (処理量%)									
日数	30 日			62 日			92 日		
化合物	DCM	MeOH	MeOH/水	DCM	MeOH	MeOH/水	DCM	MeOH	MeOH/水
テブラロキシジム	2.0	0.4	0.2	0.2	0.2	n.d.	0.2	n.d.	n.d.
未知代謝物の合計									

n.d. : 検出されず

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

日数	¹⁴ C-テプラロキシジム処理後の抽出区中の残留量 (処理量%)								
	182 日			273 日			361 日		
化合物	DCM	MeOH	MeOH/水	DCM	MeOH	MeOH/水	DCM	MeOH	MeOH/水
テプラロキシジム	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.
未知代謝物の合計									

n.d. : 検出されず

定量結果のまとめを下表に示す。

化合物	¹⁴ C-テプラロキシジム処理後の回収率 (処理量%)											
	0	1	2	4	7	14	30	62	92	182	273	361
テプラロキシジム	94.7	74.9	53.7	39.9	20.9	7.9	2.6	0.4	0.2	n.d.	n.d.	n.d.
未知代謝物の合計*1												
¹⁴ CO ₂												
抽出残渣												
合計												

n.d. : 検出されず *1 :

テプラロキシジムのDT₅₀およびDT₉₀は、一次式により、それぞれ5.3日、17.7日と計算された。そのCO₂への無機化は速く、CO₂量は7日で処理量の30%となり、1年後に65%に達した。処理量の10%以上の代謝物はCO₂であり、少量の代謝物として 検出された。

土壌におけるテプラロキシジムの推定主代謝経路を次頁に示す

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

土壌におけるテプラロキシジムの推定主代謝経路

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

(3) ^{14}C -テブラロキシジム(P-ラベル)を用いたアメリカ土壌における動態試験

(資料No. 運命-21)

試験実施機関： BASF 研究所(ドイツ)

報告書作成年： 1996 年 [GLP 対応]

供試標識化合物：

[^{14}C] テブラロキシジム
(P-ラベル)

比放射能：

放射化学的純度：

標識位置の設定理由：

供試土壌：

Holly Springs sandy loam (米国、ノースカロライナ州)

土性 USDA 法	砂 (%)	シルト (%)	粘土 (%)	有機炭素 含有率(%)	pH CaCl ₂	陽イオン 交換容量
SL	77	9	14	0.6	6.4	3.1

試験方法：

① 代謝試験

好気的条件下で試験を行った。1/3 barの75%に水分調整した乾土換算 2600 gに、標識テブラロキシジム + 非標識テブラロキシジム、計 1.034 mg/mlの 溶液 1.257 mlを添加し(結果的に 0.5 mg/kg乾土)、乾土換算 98.2~100.1 gづつに分けてガラス皿に入れ、代謝試験装置に入れた。暗所に置き 20±1°Cで培養した。試料採取間隔を、処理後、0、1、2、4、7、14、30、60、91、183、275、360 日とした。代謝試験装置に湿らせた空気を通し、生ずる揮散性物質を、 で捕集した。各採取日に捕集液を採取し、放射能を測定し、新たな液と交換した。各採取日に土壌試料の一部を試料酸化装置で燃焼し、生じた $^{14}\text{CO}_2$ の放射能を測定して総放射性残留量(TRR)を求めた。別の土壌試料の一部を で順次抽出し、各抽出液の放射能を測定した。抽出後に残った土壌残渣の放射能(非抽出放射能(RRR))を燃焼法で測定した。0日以外の採取日のRRRを で分画し、各画分の放射能を測定した。

② 分解物の同定および定量

代謝試験で得た 画分、 画分、 画分を濃縮し TLC および HPLC で分析した。別途、乾土換算 800 g の土壌に有効成分 10 mg/kg 乾土で処理し、30 日間培養した試料を用いて同様に、HPLC 分画、MS 分析を行った。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

試験結果：

① 代謝試験

放射能の回収率を下表に示す。

日数	¹⁴ C-テブラロキシジム処理量に対する回収率 %						
				抽出液計	残渣	¹⁴ CO ₂	合計
0	97.4	0.8	0.8	99.0	0.4	—	99.4
1	86.3	2.0	3.6	92.0	4.6	1.2	97.8
2	73.4	2.6	4.4	80.5	7.2	3.8	91.5
4	58.8	4.4	5.8	69.0	12.1	10.3	91.3
7	46.9	4.2	5.0	56.1	16.1	14.1	86.3
14	29.2	5.2	6.0	40.4	21.7	30.6	92.8
30	16.7	4.8	4.6	26.2	22.1	42.1	90.3
60	7.6	4.0	3.4	15.1	24.5	48.7	88.3
91	6.8	4.2	3.0	14.1	22.1	50.9	87.1
183	4.2	4.0	2.8	11.1	23.7	55.5	90.3
275	3.4	3.4	2.2	9.1	20.9	57.9	87.9
360	3.8	3.2	2.6	9.7	20.3	58.4	88.3

—：分析せず

土壌からの抽出率は最初の99.0%から360日の9.7%まで経時的に低下したが、最初の1ヶ月間は大半の放射能が抽出された。抽出率は最大6.0%で、これから抽出率が少量しか生じていないことが判る。残渣は、14日の21.7%まで増加し、その後、だいたい一定で最後にやや減少した(361日で20.3%)。¹⁴CO₂以外の揮散性物質の生成はみられなかった。¹⁴CO₂への無機化は速く(14日で30.6%)、360日まで連続的に増加し最終的に58.4%に達した。

残渣のアルカリ分画の結果を下表に示す。

日数	¹⁴ C-テブラロキシジム抽出残渣のアルカリ分画 (対処理量 %)				
	残渣	水抽出物	抽出物		
1	4.6	1.0	2.4	(0.2、 2.0)	1.0
2	7.2	1.4	3.6	(0.4、 2.8)	1.8
4	12.1	2.6	5.8	(1.0、 5.0)	3.4
7	16.1	3.2	7.2	(1.2、 6.2)	3.8
14	21.7	3.8	11.9	(2.2、 10.1)	5.8
30	22.1	2.4	10.5	(1.8、 8.0)	7.8
60	24.5	3.0	10.7	(2.2、 8.5)	11.3
91	22.1	2.0	10.3	(2.0、 7.6)	9.9
183	23.7	1.6	9.5	(2.0、 7.6)	8.5
275	20.9	2.4	8.0	(1.4、 6.4)	8.0
360	20.3	2.0	8.7	(2.0、 6.6)	7.8

残渣中放射能の約40%が抽出液に、さらに抽出放射能の約80%が抽出液に取込まれた。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

② 代謝物の同定および定量

TLC クロマトグラムが複雑なため HPLC で代謝物の定性定量を行い、コクロマトグラフィーおよび MS で確認した。各画分の定量結果を下表に示す。

日数	¹⁴ C-テブラロキシジム処理後の抽出区中の残留量 (処理量%)								
	0 日			1 日			2 日		
化合物									
テブラロキシジム	95.2	0.4	n.d.	79.7	0.8	0.4	66.8	1.2	0.6
未知代謝物の合計									

n.d. : 検出されず

日数	¹⁴ C-テブラロキシジム処理後の抽出区中の残留量 (処理量%)								
	4 日			7 日			14 日		
化合物									
テブラロキシジム	55.5	2.2	0.8	39.6	1.8	0.6	21.3	1.4	0.8
未知代謝物の合計									

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

¹⁴ C-テブラロキシジム処理後の抽出区中の残留量 (処理量%)									
日数	30 日			60 日			91 日		
化合物									
テブラロキシジム	6.8	0.6	0.4	0.8	n.d.	n.d.	0.6	n.d.	n.d.
未知代謝物の合計									

n.d. : 検出されず

¹⁴ C-テブラロキシジム処理後の抽出区中の残留量 (処理量%)									
日数	183 日			275 日			360 日		
化合物									
テブラロキシジム	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.
未知代謝物の合計									

n.d. : 検出されず

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

定量結果のまとめを下表に示す。

化合物	¹⁴ C-テプラロキシジム処理後の回収率 (処理量%)											
	0	1	2	4	7	14	30	60	91	183	275	360
テプラロキシジム	95.6	80.9	68.6	58.5	42.0	23.5	7.8	0.8	0.6	n.d.	n.d.	n.d.
未知代謝物の合計 ²												
¹⁴ CO ₂												
抽出残渣												
合計												

— : 測定せず n.d. : 検出されず

テプラロキシジムのDT₅₀およびDT₉₀は、一次式により、それぞれ8.5日、28.3日と計算された。そのCO₂への無機化は速く、CO₂量は14日で処理量の30%となり、1年後に58%に達した。処理量の10%以上の代謝物はCO₂であり、少量の代謝物として が検出された。

土壌におけるテプラロキシジムの推定主代謝経路を次頁に示す。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

土壌におけるテブラロキシジムの推定主代謝経路

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

3) 嫌氣的土壤中動態試験

12 農産第 8147 号農薬の登録申請に係る試験成績について、当該農薬は好氣的土壤中動態試験(資料 No. 運命-19、20、21)の結果、好氣的土壤中での半減期が 100 日未満であった。

試験成績の提出の除外の別表 2 に示されている「好氣的土壤中動態試験の結果から当該農薬の成分物質等の消失が速やかである場合」に該当するため、本農薬の嫌氣的土壤中動態試験成績の提出を行わない。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

4. 水中動態に関する試験

1) 加水分解動態試験

(1) ^{14}C -テプラロキシジム(C-ラベル)を用いた加水分解試験

(資料 No. 運命-22)

試験実施機関：(株) 日曹分析センター

報告書作成年：1997年 [GLP 対応]

供試標識化合物：

[^{14}C] テプラロキシジム
(C-ラベル)

比放射能：

放射化学的純度：

標識位置の設定理由：

供給水：

pH 4.0、5.0、7.0 および 8.8 の緩衝液

試験方法：

OECD No. 111、EPA §161-1 および EC method C7 のガイドラインに従って実施した。

標識テプラロキシジムの 溶液 および
非標識テプラロキシジム (19.0 mg) を 25 ml メスフラスコに入れ、 で定容した。その 溶液 6.0 ml を 500 ml 三角フラスコに入れ、 を留去した後、それぞれの緩衝液 480 ml をフラスコに加え、超音波で溶解し、約 10 $\mu\text{g}/\text{ml}$ の濃度にした。その 10 ml を 10 ml 試験管に分注し、22、35 および 45°C の暗所に静置し、0、1、2、4、8、16、33 日後に 2 連を採取した。これらの操作は無菌的に実施した。採取後は、抽出、 、TLC で定量分析し、分解生成物を機器分析により同定した。

定量結果より、加水分解定数および半減期を計算した。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

試験結果：以下に各温度、各 pH における加水分解の結果を示す。

2 連の平均値

pH	化合物名	22°C 加水分解の放射能の回収率 (%TAR)						
		0 DAT	1 DAT	2 DAT	4 DAT	8 DAT	16 DAT	33 DAT
4.0	Direct *							
	テブ ラキシム	90.9	76.1	69.3	56.9	38.4	16.1	0.1
	Others							
	Total;							
5.0	Direct *							
	テブ ラキシム	90.1	84.8	84.7	77.2	70.5	53.5	35.2
	Others							
	Total;							
7.0	Direct *							
	テブ ラキシム	90.2	91.0	91.8	87.0	92.1	83.5	87.3
	Others							
	Total;							
8.8	Direct *							
	テブ ラキシム	93.9	90.6	94.6	88.8	89.4	87.3	92.3
	Others							
	Total;							

* : 液々分配前に試験溶液を直接測定

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

2連の平均値

pH	化合物名	35°C 加水分解の放射能の回収率 (%TAR)						
		0 DAT	1 DAT	2 DAT	4 DAT	8 DAT	16 DAT	33 DAT
4.0	Direct *							
	テトラキシルム	86.4	47.6	32.8	15.8	1.8	0.5	0.2
	Others							
	Total;							
5.0	Direct *							
	テトラキシルム	90.3	73.5	65.9	55.9	29.6	7.8	0.6
	Others							
	Total;							
7.0	Direct *							
	テトラキシルム	89.7	88.7	91.8	85.7	84.4	75.7	69.2
	Others							
	Total;							
8.8	Direct *							
	テトラキシルム	92.3	88.4	92.1	85.5	84.7	77.6	70.5
	Others							
	Total;							

* : 液々分配前に試験溶液を直接測定

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

2連の平均値

pH	化合物名	45°C 放射能の回収率 (%TAR)						
		0 DAT	1 DAT	2 DAT	4 DAT	8 DAT	16 DAT	33 DAT
4.0	Direct *							
	テブ ラキシゾム	83.9	6.6	3.2	0.9	0.3	0.5	2.5
	Others							
	Total;							
5.0	Direct *							
	テブ ラキシゾム	90.7	45.9	29.1	7.3	0.8	1.3	0.1
	Others							
	Total;							
7.0	Direct *							
	テブ ラキシゾム	90.2	83.4	83.9	NA**	68.3	57.1	42.3
	Others							
	Total;							
8.8	Direct *							
	テブ ラキシゾム	89.3	85.6	81.5	72.5	59.9	45.9	33.0
	Others							
	Total;							

* : 液々分配前に試験溶液を直接測定

** : 分析せず

処理した¹⁴Cの回収率は、94.6 - 104.8%であった。反応液中のほとんど全てが で抽出され、水相の未抽出物は5%未満であった。 抽出物中の分解物 は、TLCクロマトグラフィーで確認した。

被験物質は、 に分解されると推定される。

水溶性分解物は、 してGCMSで を同定した。
以上の結果、分解生成物として、 が同定された。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

pH	各温度における推定半減期 (日)			
	22°C	25°C*	35°C	45°C
4.0	6.6	4.8	1.7	0.4
5.0	24.4	16.3	4.6	1.1
7.0	435.6	292.6	82.2	30.8
8.8	1784	843.1	86.7	22.7

* 25°C の値は、Arrhenius の式による計算値

テプラロキシジムの推定分解経路を以下に示す。

テプラロキシジムの推定加水分解経路

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

2) 水中光分解動態試験

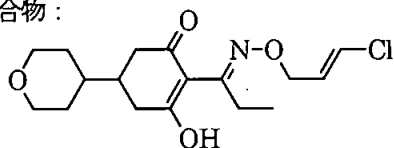
(1) 非標識テプラロキシジムを用いた水中光分解動態試験

(資料 No. 運命-23)

試験実施機関：(株) 日曹分析センター

報告書作成年：1997年 [Non-GLP]

供試化合物：



非標識テプラロキシジム

純度：

供試水：

蒸留水

河川水 (神奈川県足柄上郡開成町酒匂川の水、pH 7.9)

試験方法：

2個のフラスコにテプラロキシジムの溶液 18 ml を採り、濃縮乾固した。これに 200 ml の滅菌蒸留水および河川水をそれぞれ加え、超音波処理で溶解し、10 ppm 溶液を調製した。この試験液 10 ml を石英ガラス製試験管にとり、光照射装置 Suntest の光源 (キセノンランプ) 下 23 cm の位置に置き、 $25 \pm 1^\circ\text{C}$ 、照度約 15 万ルクス (約 800 W/m^2 , 300~800 nm) で連続照射した。照射区試料は、0、0.25、0.5、1、2、4 日後に、対照区 (暗所、 $25 \pm 1^\circ\text{C}$) 試料は、0、1、2、4 日後に採取して、固体抽出法 (C18 カートリッジ使用) および HPLC でテプラロキシジムを定量し、その分解定数、半減期を計算した。

試験結果：

	分解定数 (1/日)	半減期 (日)
蒸留水 照射区	1.140	0.6
蒸留水 対照区	0.0636	10.9
河川水 照射区	0.3841	1.8
河川水 対照区	0	分解せず

テプラロキシジムの光分解で、蒸留水での分解が河川水中よりも早かったのは、試験液の初期 pH (蒸留水：4.7、河川水：7.8) が影響していると推測される。光分解物としてが推定された。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

(2) ^{14}C -テプラロキシジム(C-ラベル)を用いた水中光分解動態試験

(資料 No. 運命-24)

試験実施機関：日本曹達(株) 小田原研究所 代謝研究部
報告書作成年：2006年 [GLP 対応]

供試標識化合物：

[^{14}C]テプラロキシジム
(C-ラベル)

比放射能：

放射化学的純度：

標識位置の設定理由：

供試水：

pH 9 の緩衝液および自然水を用いた。

テプラロキシジムは酸性条件の水溶液中で比較的不安定であり、塩基性条件でより安定であることから、蒸留水に代えて pH 9 の緩衝液を用いた。緩衝液を調製し、pH は 8.98 であった。調整後、細孔径 0.2 μm の除菌フィルターで除菌して、試験に供するまで約 4°C で冷蔵保存した。

自然水は、2006 年 2 月 7 日に神奈川県足柄上郡開成町の酒匂川より採取し、No. 5A の濾紙で濾過後、除菌ろ過後冷蔵保存し、pH は 7.34 であった。

光源：キセノンランプ (サンテスト CPS+加速暴露装置、光学フィルターで 290 nm 以下を除去)

光強度：平均 702 W/m^2 (波長範囲 290~800 nm)

試験方法：

標識テプラロキシジムの保存溶液をナスフラスコに 2 連で加え、減圧濃縮乾固し、それぞれに供試水を加え、共に 10.3 mg/L の試験溶液を調製した。クリーンベンチ内で除菌フィルターを用いて試験溶液の溶存酸素を減圧ろ過で除去した後、光照射区 (石英試験管を使用) と暗所対照区 (予備試料も含め) 各 10 mL (計 10 本) を無菌的に分注し、ガラス製の共栓で密栓した。

光照射区の容器を光源から約 23 cm の位置に設置し、周囲に冷却水を循環させて 24.5~24.9°C に維持した。試験溶液の光行路長は約 17 mm であった。暗所対照区の容器を 25.0°C の恒温水槽 (暗所) に設置した。

試験溶液調製直後を 0 時点とし、光照射 2、7、24、48、103 および 120 時間後に試験容器を 1 本ずつ採取し、液量と放射能を測定して物質収支を求めた。pH の測定は、調製直後および最終採取時点に実施した。各試験溶液を HPLC で定量分析を行い、テプラロキシジム及び分解物について、初期処理放射能に対する割合 (%IAR) を求め、人工光下での半減期 ($\text{DT}_{50 \text{ lab}}$) および太陽光換算での半減期 ($\text{DT}_{50 \text{ sun}}$) を算出した。分解物の同定は、標品を用いて LC/MS 分析で行った。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

試験結果：

光照射区および暗所対照区におけるテプラロキシジムのおよび分解物の定量値を表1および2に示す。全採取時点を通し、全ての試験溶液で98.8~100.6%IARの範囲であり、定量的に回収された。揮散性化合物及び二酸化炭素の発生は殆ど無いと判断した。

光照射区において、テプラロキシジムは処理24時間後ではほぼ消失し、処理48時間後では検出されなかった。

生成分解物は両試験溶液で共通であり、各分解物の消長も同様であった。表1に示すように、主分解物は

だった。未知代謝物は8つ検出されたが、10%IARを超えて生成するものは無かった。

暗所対照区では 以外の分解物は生じず、被験物質は安定（98.4%IAR以上）であった。

LC/MSを用いた定性分析により、両試験溶液中の各残留物とテプラロキシジムのおよび分解物の標品とのプロトン化分子および付加イオンを含めたフラグメントパターンが一致した。

以上より、テプラロキシジムの水中光分解動態は、供試水の違いで大きな差異は無く、光の暴露によって比較的容易に分解し、主に まで分解され、

有機揮散性化合物または二酸化炭素は殆ど生じないと推定された。

テプラロキシジムの水中における推定光分解経路を図1に示す。

表1 光照射区におけるテプラロキシジムのおよび分解物の定量値

供試水	時間 (h)	放射能の分布 (%IAR)	合計 (%IAR)
緩衝液	0		
	2		
	7		
	24		
	48		
	103		
	120		
自然水	0		
	2		
	7		
	24		
	48		
	103		
	120		

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

表2 暗所対照区におけるテブラロキシジムおよび分解物の定量値

供試水	時間 (h)	放射能の分布 (%IAR)	合計
		(%IAR)	
緩衝液	0		
	2		
	7		
	24		
	48		
	103		
	120		
自然水	0		
	2		
	7		
	24		
	48		
	103		
	120		

推定半減期：

緩衝液および自然水におけるテブラロキシジムの半減期 (DT₅₀ lab) は人工光下で4.2 および4.5 時間、北緯 35 度の春の太陽光換算値 (DT₅₀ sun) で1.2 および1.3 日であった (表3)。暗所対照区のDT₅₀ lab は共に 5000 時間以上であり、テブラロキシジムは水中における光分解を受けやすい化合物であった。

光照射区で減衰が見られた主な分解物について、半減期を求めた。

表3 人工光および太陽光換算によるテブラロキシジムの半減期

供試水	光照射区		暗所対照区
	人工光 DT ₅₀ lab (時間)	太陽光換算* DT ₅₀ sun (時間)	DT ₅₀ lab (時間)
緩衝液	4.2	29.7 (1.2 日)	5237.6 (218 日)**
自然水	4.5	31.7 (1.3 日)	5939.7 (247 日)**

*： 北緯 35°春の太陽光換算値

**： 申請者計算

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

表4 人工光および北緯35°春の太陽光換算による各分解物の半減期

分解物	供試水	光照射区	
		人工光 DT ₅₀ lab (時間)	太陽光換算* DT ₅₀ sun (時間)
	緩衝液		
	自然水		
	緩衝液		
	自然水		
	緩衝液		
	自然水		

* : 北緯35°春の太陽光換算値

** : 申請者計算

光強度 702 W/m²で120時間照射した人工光の積算照度を北緯35度(東京)、春(4月~6月)の太陽光換算すると、以下のとおり35.5日間の照射に相当した。

$$DT_{50 \text{ sun}} = \frac{I_{290 \sim 800} \times DT_{50 \text{ lab}} \times 24 \text{ (h)} \times 3600 \text{ (sec)} \times 10^{-6}}{I_0 \times (290 \sim 800 \text{ nm の放射照度}) / (\text{全波長の放射照度})}$$

DT_{50 sun} : 太陽光換算による推定半減期
 I_{290_800} : キセノンランプの光強度、702 W/m²
 DT_{50 lab} : 人工光下における半減期
 I₀ : 全天日射量の1日積算値、14.6 MJ/m²/day
 290~800 nmの放射照度 : 585.12 W/m²
 全波長の放射照度 : 1000.00 W/m²

$$\text{太陽光換算日数 (日)} = \frac{702 \times 120 \text{ (h)} \times 3600 \text{ (sec)} \times 10^{-6}}{14.6 \times (585.12/1000)} = 35.5 \text{ (日)}$$

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

図1 テブラロキシジムの水中における推定光分解経路

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

5. 土壌吸着試験

(1) ^{14}C -テプラロキシジム(C-ラベル)を用いた日本土壌における土壌吸着試験

(資料No. 運命-25)

試験実施機関：(株) 日曹分析センター

報告書作成年：1997年 [Non-GLP]

供試標識化合物：

[^{14}C] テプラロキシジム
(C-ラベル)

比放射能：

放射化学的純度：

標識位置の設定理由：

供試土壌：

Clay loam (十勝)、Light Clay (石川)、Silty Clay loam (茨城)、Sandy Clay loam (愛知) の4土壌。

土壌採取場所	十勝農試	石川農試	日植防 (茨城)	愛知農試
土性*	CL	LC	SiCL	SCL
砂 (%)	57.1	53.1	26.2	68.0
シルト (%)	21.5	19.6	50.9	14.5
粘土 (%)	21.4	27.3	22.9	17.5
有機炭素含有率 (%)	2.21	1.02	3.30	1.11
pH H_2O	5.7	7.1	6.4	6.6
KCl	5.8	5.8	6.9	6.0
陽イオン交換容量	11.7	20.3	21.4	7.9
リン酸吸収係数	1330	720	2000	290
粘土鉱物の種類	アロフェン パーミキュライト	モンモリロナイト カオリン鉱物	アロフェン パーミキュライト	カオリン鉱物 イライト

*：国際土壌学会法による分類

試験方法：

標識テプラロキシジムおよび非標識テプラロキシジムを 溶液に溶解し、0.096、0.394、1.54 および6.62 ppmの溶液を調製した。風乾土5gに純水5mlを加え24時間放置後、各処理液20mlを加え $25 \pm 1^\circ\text{C}$ で6時間振とうした。遠心分離後、上澄み液の放射能を測定し、Freundlich吸着係数を求めた。

試験結果：

土壌採取場所	土性	1/n	K_F^{ads}	r	OC%	$K_F^{\text{ads oc}}$	回収率*
十勝農試	Clay loam	0.88	1.07	0.997	2.21	48	93%
石川農試	Light Clay	0.73	3.65	0.999	1.02	358	88%
日植防 (茨城)	Silty Clay loam	0.76	1.08	0.994	3.30	33	92%
愛知農試	Sandy Clay loam	0.76	0.73	0.994	1.11	66	92%

* 溶液濃度 1.54 ppmの場合

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

(2) ^{14}C -テプラロキシジム(C-ラベル)を用いたアメリカ土壤における土壤吸着試験

(資料 No. 運命-26)

試験実施機関：(株) 日曹分析センター

報告書作成年：1997年 [GLP 対応]

供試標識化合物：

[^{14}C] テプラロキシジム
(C-ラベル)

比放射能：

放射化学的純度：

標識位置の設定理由：

供試土壤：

Sand (Holly Springs)、Sandy loam (Dinuba)、Loamy sand (Fuquay-Varina)、Loam (Savoy)、Clay (Red River Valley) の5米国土壤。

土壤採取場所	Holly Springs	Dinuba	Fuquay-Varina	Savoy	Red River Valley
土性*	S	SL	LS	L	C
砂 (%)	96	63	83	29	28
シルト (%)	2	24	12	48	23
粘土 (%)	2	13	5	23	49
有機炭素含有率 (%)	0.3	0.5	1.1	2.6	1.9
pH H ₂ O	6.9	7.5	5.9	6.3	6.8
陽イオン交換容量	1.9	12.5	4.6	22.4	41.5

*：USDA 法による分類

試験方法：

標識テプラロキシジムおよび非標識テプラロキシジムを 溶液に溶解し、0.103、0.175、0.767 および3.046 ppmの溶液を調製した。風乾土(乾土換算 10 g)に、各処理液 20 mlを加え 25±2°Cで6時間振とうした。遠心分離後、上澄み液の放射能を測定し、Freundlich吸着係数を求めた。

さらに、吸着試験で得た土壤に、デカントした試料の量に相当する量の 溶液を加え、25±2°Cで24時間振とうし、遠心分離を2回繰り返して、上澄み液の放射能を測定して脱着係数を求めた。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

試験結果：

<吸着係数>

土壌採取場所	土性	1/n	K_F^{ads}	r	OC%	$K_F^{ads}_{OC}$	回収率*
Holly Springs	Sand	0.961	0.011	0.7353	0.3	3.7	100%
Dinuba	Sandy loam	0.630	0.042	0.9020	0.5	8.4	100%
Fuquay-Varina	Loamy sand	0.896	0.424	0.9989	1.1	38.5	98%
Savoy	Loam	0.865	0.525	0.9995	2.6	20.2	96%
Red River Valley	Clay	0.810	1.467	0.9991	1.9	77.2	89%

*：溶液濃度 0.767 ppm の場合

<脱着係数>

土壌採取場所	土性	1/n _{des}	K_F^{des}	r
Holly Springs	Sand	—	—	—
Dinuba	Sandy loam	—	—	—
Fuquay-Varina	Loamy sand	0.944	3.19	0.9163
Savoy	Loam	0.949	1.51	0.9885
Red River Valley	Clay	0.999	1.00	0.9993

—：計算できず

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

(3) ^{14}C -テプラロキシジム(P-ラベル)を用いたドイツ土壤における土壤吸着試験

(資料 No. 運命-27)

試験実施機関： BASF 研究所(ドイツ)

報告書作成年： 1996 年 [GLP 対応]

供試標識化合物：

[^{14}C] テプラロキシジム
(P-ラベル)

比放射能

放射化学的純度：

標識位置の設定理由：

供試土壤：

Sandy loam / loamy sand (LUFA Speyer 2.1)、Sandy loam (LUFA Speyer 2.2)、Sandy loam (LUFA Speyer 2.3)、
Clay loam (Limburgerhof) の4ドイツ土壤。

土壤採取場所	LUFA Speyer 2.1	LUFA Speyer 2.2	LUFA Speyer 2.3	Limburgerhof
土性*	SL/LS	SL	SL	CL
砂 (%)	85	79	68	40
シルト (%)	2	7	17	23
粘土 (%)	13	14	15	37
有機炭素含有率 (%)	0.7	2.6	1.5	3.27
pH CaCl_2	5.7	6.0	6.5	7.8
陽イオン交換容量	4.3	11.5	11.4	11.2

*：USDA 法による分類

試験方法：

標識テプラロキシジムおよび非標識テプラロキシジムを 溶液に溶解し、0.0407、0.242、1.046
および5.068 ppmの溶液を調製した。土壤 10 gに各処理液 20 mlを加え $22\pm 1^\circ\text{C}$ で2時間振とうした。遠心
分離後、上澄み液の放射能を測定し、Freundlich吸着係数を求めた。

さらに、吸着試験の土壤に、デカントした試料の量に相当する量の 溶液を加え、 $25\pm 2^\circ\text{C}$ で16時間
振とうし、遠心分離操作を2回繰り返して、上澄み液の放射能を測定して脱着係数を求めた。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

試験結果：

<吸着係数>

土壌採取場所	土性	l/n	K_F^{ads}	r	OC%	$K_F^{ads}_{OC}$	回収率*
LUFA Speyer 2.1	Sandy loam/ loamy sand	1.004	0.187	0.9996	0.7	26.7	96%
LUFA Speyer 2.2	Sandy loam	0.962	0.469	0.9999	2.6	18.0	94%
LUFA Speyer 2.3	Sandy loam	0.989	0.106	0.9991	1.5	7.0	97%
Limburgerhof	Clay loam	1.239	0.010	0.9966	3.27	0.3	99%

*：溶液濃度 5.068 ppm の場合

<脱着係数>

土壌採取場所	土性	l/n _{des}	K_F^{des}	r
LUFA Speyer 2.1	Sandy loam/ loamy sand	1.023	0.076	0.9994
LUFA Speyer 2.2	Sandy loam	0.967	0.161	0.9998
LUFA Speyer 2.3	Sandy loam	0.959	0.070	0.9989
Limburgerhof	Clay loam	—	—	—

—：計算できず

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

6. カラムリーチング試験

(1) ^{14}C -テプラロキシジム(C-ラベル)を用いたカラムリーチング試験

(資料No. 運命-28)

試験実施機関： BASF 研究所(ドイツ)

報告書作成年： 1992年 [GLP 対応]

供試標識化合物： [^{14}C]テプラロキシジム
(C-ラベル)
比放射能：
放射化学的純度：

標識位置の設定理由：

供試土壌：

ドイツ標準土壌 2.1 (LUFA Speyer)： 土性の記載なし

<0.002 mm	0.002 - 0.063 mm	0.063 - 2.0 mm	有機炭素含 有率(%)	pH	陽イオン 交換容量	微生物活性(バイオマス) (mg C/100 g soil)
3	12	85	0.60	5.7	4.5	21.5

試験方法：

0.5 mg/kg で好氣的 30 日培養しカラム充填 200 ml の兩相当量で溶出

① リーチング用土壌調製と土壌の分析

好氣的条件下でリーチング用土壌を調整し、試験を行った。最大容水量の 40% に水分調整した 770 g の土壌に標識テプラロキシジムを加えよく混和した。最終濃度は、0.5 mg/kg 乾土とした。処理土壌は 110 g ずつ (乾土換算 100 g 相当) 5 個のガラス皿分けて、インキュベーション装置に入れ、 $20 \pm 2^\circ\text{C}$ で 30 日間培養した。揮散性物質は、15、30 日目に測定した。

② リーチング実験

内径 50 mm で各長さ 60 mm の 5 部分に分割でき、下部に円錐部(石英砂で満した)を持つガラスカラムを組み立てた。無処理土壌をカラムに約 25 cm の高さに充填し、カラム下部より土壌が水で飽和されるまでしみ込ませた。標識体で処理した土壌 110 g および非処理対照土壌 110 g をカラム最上部に添加した。土壌最上部にガラス目皿を置き、カラムに 393 mL の脱イオン水(200 mm 雨量相当)をポンプで流した。溶出水約 100 mL の 4 画分を 2 日間、採取した。このカラムおよび集水容器は光の影響を避けるためアルミホイルで包んだ。リーチング終了後カラムを分解し各土壌層とリーチング液の分析を行った。標識体で処理した土壌の非エージング試料および 30 日間の好氣的エージング後の試料の両方でリーチングを実施した。

③ 分解物の同定および定量

土壌試料は一部を試料酸化装置で燃焼し、生じた $^{14}\text{CO}_2$ の放射能を測定した。最大容水量の 40% に水分調整した 22 g の土壌試料は で 3 回、その後 (1:1) で 1 回抽出し、各抽出液の放射能を測定した。 および 画分は混合、濃縮し で溶解させ、TLC で分析した。抽出後に残った土壌残渣の放射能 (非抽出放射能 (RRR)) を燃焼法で測定した。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

リーチングした各土壌層は、風乾して一部を試料酸化装置で燃焼し、放射能を測定した。リーチング液は、エージング土壌では で、非エージング土壌では で抽出し、濃縮後エージング土壌では 、非エージング土壌では に溶解して、TLC・HPLC・HPLC/MS で分析した。

試験結果：

① 土壌

抽出分画の放射能分析を下表に示す。

試料	¹⁴ C-テプラロキシジム%TRR (mg/kg)				
	ERR 分画		ERR 合計	RRR	TRR
処理直後の土壌	79.7 (0.405)	10.4 (0.053)	90.2 (0.8)	6.3 (0.032)	100.0 (0.508)
30 日間エージング後の土壌	18.7 (0.095)	5.9 (0.030)	24.6 (0.125)	20.5 (0.104)	47.4 (0.241)
非エージングの土壌	76.4 (0.383)	15.6 (0.078)	92.0 (0.461)	9.4 (0.047)	100.0 (0.501)

処理直後、30 日間エージング後、および非エージングの土壌の TRR はそれぞれ 0.508、0.241、および 0.501 ppm であった。処理直後および非エージングの土壌では 90%以上が抽出され、ERR 両分画の TLC 分析により未変化体のみが検出された。エージングの土壌では 24.6%が抽出され、TLC 分析により主に未変化体と少量の 2 代謝物が検出された。

30 日間エージング中の土壌からの揮散性物質の割合を下表に示す。

試料のエージング 期間(日)	¹⁴ CのTRR % (mg/kg)		
	Trap A	Trap B	Trap C
0-15	27.4 (0.139)	<0.02 (<0.0001)	<0.02 (<0.0001)
15-30	14.7 (0.075)	<0.02 (<0.0001)	<0.02 (<0.0001)
0-30	42.1 (0.214)	<0.02 (<0.0001)	<0.02 (<0.0001)

30 日エージング後の土壌では、トラップに 42.1%が検出され、30 日で 40%以上が無機化した。この土壌では、24.6%が抽出され、20.5%が残渣に残存した。

非エージング土壌からの¹⁴Cのカラム土壌および浸出液の分布を下表に示す。

試料名	カラム 1 無処理土壌		カラム 2 処理土壌		カラム 3 処理土壌	
	μg	%	μg	%	μg	%
土層 1	<0.2		3.97	7.7	4.92	9.6
2	<0.2		1.18	2.3	0.88	1.7
3	<0.2		1.17	2.3	1.21	2.4
4	<0.2		1.83	3.6	1.02	2.0
5	<0.2		1.15	2.2	1.15	2.2
6	<0.2		1.69	3.3	1.70	3.3
土層合計			11.0	21.4	10.9	21.2
浸出液 1	<0.01		<0.01	<0.02	<0.01	<0.02
2	<0.01		0.013	0.03	0.032	0.06
3	<0.01		27.8	54.2	26.8	52.2
4	<0.01		8.25	16.1	9.01	17.6
浸出液合計			36.1	70.3	35.8	69.8
総合計			47.1	91.8	46.7	91.0

乾土換算 100 g の土壌に 51.3 μg(100%)をカラムに処理

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

土壌カラム(土層)に21.2-21.4%TRRが残存し、浸出液に69.8-70.3%TRRが溶出した。この浸出液を抽出してTLC分析を行い、主成分は未変化体であった。

30日間エージングした土壌からの¹⁴Cのカラム土壌および浸出液の分布を下表に示す。

試料名	カラム1 無処理土壌		カラム2 処理土壌		カラム3 処理土壌	
	μg		μg	%	μg	%
土層 1	<0.2		18.0	74.7	16.9	70.3
2	<0.2		1.99	8.3	2.12	8.8
3	<0.2		1.41	5.9	1.40	5.8
4	<0.2		0.70	2.9	0.50	2.1
5	<0.2		<0.2	<0.8	0.34	1.4
6	<0.2		0.20	0.8	<0.2	<0.8
土層合計			22.3	92.6	21.3	88.4
浸出液 1	<0.01		<0.01	<0.05	<0.01	<0.05
2	<0.01		<0.01	<0.05	<0.01	<0.05
3	<0.01		1.57	6.5	1.32	5.5
4	<0.01		0.62	2.6	1.01	4.2
浸出液合計			2.18	9.0	2.34	9.7
総合計			24.5	102	23.6	98.1

乾土換算 100 g の土壌に 24.1 μg(100%)をカラムに処理

土壌カラム(土層)に88.4-92.6%TRRが残存し、浸出液に9.0-9.7%TRRが溶出した。浸出液には、処理した有効成分の4.3~4.7%が溶出した。

この浸出液を抽出してTLC分析を行い、主成分は未変化体で7個の未知成分があった。HPLC/MS分析で十分なスペクトルが得られなかった。

土壌抽出および浸出液の分配の¹⁴C分布を下表に示す。

カラム土壌およびカラム浸出液の抽出区中の残留量μg(処理量%)		
土壌試料	抽出または分画	
非エージング土壌：カラム2 土層1(*1)	2.28 (4.4%)	0.71 (1.4%)
エージング土壌：カラム2 土層1(*2)	6.75 (28.0)	1.53 (6.3)
浸出液試料		水
非エージング土壌：カラム2 浸出液4(*1)	23.7 (46.2)	0.44 (0.9)
エージング土壌：カラム2 浸出液3(*2)	1.31 (5.4)	0.25 (1.0)

*1：乾土換算 100 g の土壌に 51.3 μg(100%)をカラムに処理

*2：乾土換算 100 g の土壌に 24.1 μg(100%)をカラムに処理

非エージング土壌では被験物質が土壌中で移動しやすく、約70%が溶出した。しかし好氣的条件で30日間エージングした土壌では40%以上が無機化され、リーチングでは上部の土層に吸着され、浸出液には、処理した有効成分の4.3~4.7%しか溶出しなかった。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

7. 代謝・分解のまとめ

テプラロキシジムの哺乳動物、植物、土壌、水、光における挙動の要約は下記の通りであり、代謝経路および結果の概要は次頁以降に示す。

1) 動物

ラットにテプラロキシジムの単回経口投与した場合、その吸収は速く、C-ラベルの低用量群、高用量群共1時間以内に最高血中濃度に達し、その後直線的に速やかに血中より消失した。C-ラベルの低用量群での半減期は約4時間、高用量群での半減期も約10時間であった。これに伴い、体外への排泄も速く、低用量群、高用量群共、48時間で約66-79%が尿へ排泄され、尿中への排泄が主要な経路であった。両投与量群共、糞への排泄は48時間で約16-22%であった(資料No. 運命-1)。P-ラベルを単回経口投与した場合も、体外への排泄も速く、低用量群、高用量群共、48時間で約72-77%が尿へ排泄され、尿中への排泄が主要な経路であった。両投与量群共、糞への排泄は48時間で約17-23%であった(資料No. 運命-4)。C-ラベル、P-ラベル投与共挙動がよく一致した。

C-ラベルの胆汁排泄試験では投与量の約36-56%が胆汁として排泄された(資料No. 運命-1)。経口投与の糞からの排泄量と比較すると、胆汁排泄は2-3倍高かった。このことは腸肝循環があることを示している。また、経口投与の糞に認められた全ての放射能は胆汁排泄に由来したものであることから、生体利用率は100%であった。

C-ラベルの単回経口投与では、低用量群、高用量群共、放射性物質は、体内の全ての組織および器官に分布した(資料No. 運命-1、運命-2)。高濃度を示した臓器は、胃腸系内容物、血漿、腎臓、肝臓等であった。臓器内濃度は、Tmax時間でピークとなり、その後徐々に減少した。例外は、高用量群の卵巣、子宮、脂肪組織および皮膚であり、1/4 Tmax時間で第2ピークとなりその後減少した。また、高用量群の血漿濃度は、1/4 Tmax時間で、腸肝循環によるものと思われる第2ピークを示した。120時間後には、体内残存率は1.1-2.4%となり、蓄積性の予想される臓器はなかった。C-ラベルの連続経口投与試験では、単回投与試験の臓器内分布と体内残存量は、ほとんど同様であり、連続投与による蓄積性は認められなかった(資料No. 運命-1)。

以上のことから、テプラロキシジムの経口投与した場合、消化管から投与量の大部分が吸収され体内に残留することなく、殆どは腎臓を経て尿中に、また一部は胆汁を介して糞中に速やかに排泄されるものと考えられる。C-ラベル投与においては、性別、投与量に関わらず、親化合物のテプラロキシジムの代謝物の %ずつ存在し、残留の主体であった(資料No. 運命-3)。その他に少量の が存在した。非標識被験物質を14日間投与後に¹⁴C標識した被験物質を単回投与しても、代謝活性の誘導は認められなかった。

胆汁では、親化合物のテプラロキシジムの および が主体であった。両化合物の合計値は、雄では投与量の 、雌では投与量の であった。 の量は雌よりも雄のほうが多かった。その他4%以下の が同定された。血漿、肝臓および腎臓中では親化合物が主要物質であった。主要な植物代謝物である は、雄ラットの尿にわずかに 存在することがわかった。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

2). 植物

適用作物であるダイズ、ナタネ、テンサイを用い、標識テプラロキシジムを幼苗期に茎葉散布し、吸収移行を調べた。

ダイズ(資料No. 運命-7、8、16、17)では青刈り、成熟期の葉、茎、豆、さや、根から、ナタネ(資料No. 運命-10、11)では地上部、成熟期の茎葉、さや、種子、根から、テンサイ(資料No. 運命-13、14)では生育途中の葉と根部、成熟期の葉と根部からと放射能が検出され、植物の生育とともに各部位に分布していった。

植物に処理されたテプラロキシジムは代謝されやすく、

代謝されていった。ダイズ(資料No. 運命-9、18)、ナタネ(資料No. 運命-12)では

のような および など
の生成した。葉、茎などからは、親化合物と が残留の主体であり、大豆やナタネ種子での残留の主体は、

であった。ダイズ、ナタネではテプラロキシジム、
が 10 %TRR を超える主要代謝物であると同定された。テンサイでは代謝物がさらに進み、
した(資料No. 運命-15)。C-ラベル、P-ラベルを用いたダイズの試験結果からも、植物での主な代謝物は、

を起こしていないことが判明した。酵素および誘導化反応により、テンサイでの水層区の代謝物を特徴づけしたところ、テプラロキシジムの一部は、 に代謝され、おそらく光合成の過程により、テンサイの炭水化物プール(蔗糖、果糖およびブドウ糖)に取り込まれることが示された。

3). 土壌

標識テプラロキシジムを用いた好気条件下での土壌における分解試験(資料No. 運命-19、20、21)では、テプラロキシジムの分解は速く、半減期約5-9日で分解するとともに、土壌からの抽出率が経時的に低下し、炭酸ガスと溶媒に抽出されない残渣が増大していった。¹⁴CO₂の発生率はドイツ土壌では104日で66.6%、アメリカ土壌では361日で65.0%に達した。また、残渣をアルカリ分画法により分配したところ、放射能の大部分が不溶部 と 区に認められた。処理量の10%以上の主成分は¹⁴CO₂で、少量の代謝物として が検出された。

4). 加水分解および水中光分解

テプラロキシジムは、中性からアルカリ性条件下では加水分解に対して安定であり、pH 5、22°Cで半減期24.4日が得られた(資料No. 運命-22)。しかし、蒸留水および河川水を用いた水中光分解において、半減期は人工光において4.2時間~1.8日、太陽光換算(北緯35度春)で1.2~1.3日と短く、光や微生物による分解を受けやすいと判断された(資料No. 運命-23、24)。

5). 土壌吸着および溶脱性

テプラロキシジムの土壌吸着係数を日本の4土壌(十勝、石川、茨城および愛知)、アメリカの5土壌、ドイツの4土壌を用いて測定した(資料No. 運命-25、26、27)。その結果、K_{oc}値は日本土壌では33~358、アメリカ土壌では3.7~77.2、ドイツ土壌では0.3~26.7であり、土壌への吸着は少ないと考えられる。また、有機物含量とKの間には相関性は見られず、K_{oc}値は日本土壌では-58.4、アメリカ土壌では39.8、ドイツ土壌では-0.396であった。

カラムリーチング試験において非エージング土壌では被験物質が土壌中で移動しやすく、約70%が溶出した。しかし好气的条件で30日間エージングした土壌では40%以上が無機化され、リーチングでは上

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

部の土層に吸着され、浸出液には、処理した有効成分の<5%が溶出された(資料 No. 運命-28)。

以上の結果から、畑地等に処理されたテブラロキシジムは急速に分解され、さらに、水中でも光や微生物により、容易に分解される。親化合物の土壌への吸着は少ないが、土壌中半減期が極めて早く、大部分が炭酸ガスに分解され、溶媒に抽出されない残渣が増大することから、水系を汚染する心配は少ないものと考えられる。

植物中の残留主体であるテブラロキシジム、は動物においても代謝物として検出された。ま
た、環境中の主分解物はCO₂であり、も動物における代謝物として検出された。
以上の結果より、テブラロキシジムの植物および環境中における代謝、分解物は、動物における代謝物と共通であり、当該農薬成分およびその代謝分解物はヒトを含めた自然環境中に長期間残留することは極めて少ないものと判断される。

動・植物、環境中におけるテブラロキシジムの推定代謝経路を次頁に示す。

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

テプラロキシジムの動植物・環境等における推定代謝分解経路図

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

植物		ダイズ																			
		¹⁴ C-テブラロキシジム(C-ラベル)低濃度 (100 gai/ha) 処理での残留量 (テブラロキシジム換算)														¹⁴ C-テブラロキシジム(C-ラベル)高濃度 (300 gai/ha) 処理での残留量 (テブラロキシジム換算)					
		青刈り(7日)		青刈り(15日)		青刈り(30日)		葉(60日)		豆(60日)		茎(60日)		さや(60日)		青刈り(7日)		青刈り(15日)		青刈り(30日)	
化合物	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	
テブラロキシジム	39.75	0.868	32.27	0.504	19.63	0.208	15.02	0.929	n.d.	n.d.	3.38	0.004	1.31	0.007	41.99	1.874	29.73	1.884	25.83	0.915	
合計																					

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

植物	ダイズ																			
	14C-テブプロキシジム(C-ラベル)高濃度(300 gai/ha)処理での残留量 (テブプロキシジム換算)								14C-テブプロキシジム(P-ラベル)低濃度(100 gai/ha)処理での 残留量 (テブプロキシジム換算)								14C-テブプロキシジム(P-ラベル) 高濃度(300 gai/ha)処理での残留量 (テブプロキシジム換算)			
	葉(60日)		豆(60日)		莖(60日)		さや(60日)		青刈り(30日)		豆(64日)		莖(64日)		さや(64日)		青刈り(30日)		豆(60日)	
化合物	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg
テブプロキシジム	14.05	4.946	7.85	0.125	9.23	0.044	3.49	0.054	11.44	0.064	4.51	0.021	7.04	0.252	1.69	0.013	16.43	0.449	7.45	0.109
合計																				
各部位の処理量 に対する回収率 (投与量%)																				

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

植物	ダイズ				ナタネ								テンサイ								
	¹⁴ C-テブラロキシジム(P-ラベル) 高濃度(300 gai/ha)処理での残留量 (テブラロキシジム換算)				¹⁴ C-テブラロキシジム低濃度 (100 gai/ha)処理での残留量 (テブラロキシジム換算)				¹⁴ C-テブラロキシジム高濃度(300 gai/ha)処理での 残留量 (テブラロキシジム換算)				¹⁴ C-テブラロキシジム高濃度 (200 gai/ha) 処理 での残留量								
	部位		部位		部位		部位		部位		部位		部位		部位		部位				
化合物	茎(60日)		さや(60日)		茎(61日)		種子(61日)		地上部(0日)		茎(67日)		種子(67日)		根部(45日)		葉部(123日)		根部(123日)		
	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	%TRR	mg/kg	
テブラロキシジム *1	9.43	1.479	2.02	0.046	2.1	0.035	n.d.	n.d.	82.9	6.187	2.1	0.035	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	n.d.	
非抽出残渣																					
合計																					
各部位の処理量 に対する回収率 (投与量%)																					

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

化合物	ドイツ土壤								アメリカ土壤										
	¹⁴ C-テトラロキシジム(C ₇ H ₆)処理後の回収率(処理量%)								¹⁴ C-テトラロキシジム(C ₇ H ₆)処理後の回収率(処理量%)										
日数	0	1	7	14	30	61	104	0	1	2	4	7	14	30	62	92	182	273	361
テトラロキシジム	93.2	75.7	31.0	14.7	2.2	0.2	0.3	94.7	74.9	53.7	39.9	20.9	7.9	2.6	0.4	0.2	n.d.	n.d.	n.d.
¹⁴ CO ₂																			
非抽出残渣																			
合計																			

化合物	アメリカ土壤											
	¹⁴ C-テトラロキシジム(P ₇ H ₆)処理後の回収率(処理量%)											
日数	0	1	2	4	7	14	30	60	91	183	275	360
テトラロキシジム	95.6	80.9	68.6	58.5	42.0	23.5	7.8	0.8	0.6	n.d.	n.d.	n.d.
¹⁴ CO ₂												
非抽出残渣												
合計												

本資料に掲載された情報に係る権利及び内容の責任は日本曹達株式会社にある。

加水分解 pH	¹⁴ C-テブラロキシジム(Cラベ [®] M)処理 (22℃)							抽出区のTLC分析結果 (処理量%)						
	4.0							5.0						
日数	0	1	2	4	8	16	33	0	1	2	4	8	16	33
テブラロキシジム	90.9	76.1	69.3	56.9	38.4	16.1	0.1	90.1	84.8	84.7	77.2	70.5	53.5	35.2
未知代謝物の合計														
合計														

加水分解 pH	¹⁴ C-テブラロキシジム(Cラベ [®] M)処理 (22℃)							抽出区のTLC分析結果 (処理量%)						
	7.0							8.8						
日数	0	1	2	4	8	16	33	0	1	2	4	8	16	33
テブラロキシジム	90.2	91.0	91.8	87.0	92.1	83.5	87.3	93.9	90.6	94.6	88.8	89.4	87.3	92.3
未知代謝物の合計														
合計														

水中光分解 I	テブラロキシジム処理後の回収率 (処理量%)					
日数	0	0.25	0.5	1	2	4
蒸留水 照射区	100	76	63	39	10	<4
蒸留水 対照区	100			93	78	78
河川水 照射区	100	90	78	63	39	22
河川水 対照区	100			103	108	101

二：分析せず

水中光分解 II	¹⁴ C-テブラロキシジム(Cラベ [®] M)の照射区における定量値 (処理量%)													
供試水	緩衝液							自然水						
時間	0	2	7	24	48	103	120	0	2	7	24	48	103	120
合計														

n.d：検出されず

[附]

テプラロキシジムの開発年表