

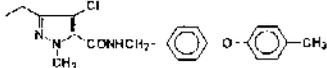
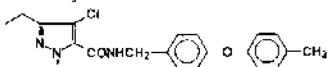
2. 植物体内運命

(1) ^{14}C 標識トルフェンピラドのなすにおける代謝

(資料 M-9)

試験機関：(株)三菱化学安全科学研究所

報告書作成年：1998年

供試標識化合物： 1) [^{14}C]トルフェンピラド  比放射能：
放射化学的純度：
2) [^{14}C]トルフェンピラド  比放射能：
放射化学的純度：

供試植物：なす(品種：千両2号【水耕試験】 および黒陽【ポット試験、[土壌] 黒ぼく土に園芸培上、パーマキュライト、化成48肥料、苦土石灰を加えた混合培土、[追肥] 尿素硫化磷安48号、50~100mg/ポット、3回、[給水] 毎日1回実施)

方 法：試験は RI ガラス温室(温度：昼 25℃、夜 17℃、湿度：40~80%、光照度：7500~98800Lux、自然光補光なし)内で行った。

1) 根部からの吸収・移行性試験

第2本葉未展開期(播種3週間後)のなすの根部の土壌を水洗して除いたのち、[^{14}C]トルフェンピラド 1.0 $\mu\text{g}/\text{mL}$ を含む春日井水耕液に1時点当たり3本の根部を浸して生育した。1、2、4日後に採取し、ラジオルミノグラフ(RLG)法と燃焼法で ^{14}C の吸収・移行性を調べた。

2) 葉における吸収・移行性試験

[^{14}C]トルフェンピラドの簡易乳剤の約40倍希釈液(7.5 mg/mL)を播種10週間後のなすの葉中央部の主葉脈に対して直交させて帯状(1cm巾)に塗布した。そののち、根部を春日井水耕液に浸し、RI ガラス温室内で生育させた。直後、7、28日後に処理葉を採取し、RLG法で ^{14}C の吸収・移行性を調べた。

3) 葉および果実における吸収・移行・代謝試験(ポット試験)

[^{14}C] および [^{14}C]トルフェンピラドの簡易乳剤の約400倍希釈液(750 $\mu\text{g}/\text{mL}$)を播種10週間後の果実および果実の着果部位直下の葉の表裏にそれぞれ60 μg (合計120 μg)を塗布した。この処理量は実用量の75 g a.i./10a で散布したとき約20%が葉の表裏に付着したと仮定したときの濃度(1.5 $\mu\text{g}/\text{cm}^2$)に相当する。処理直後、3、7、14、28日後に処理部位(処理葉2枚および処理果実2個)および非処理部位(処理部位近くの葉および果実)に分け、分析試料とした。分析試料のうち、処理部位の葉および果実はエーテルで表面を洗浄した[表面残留性(SR)画分]。そののち、メタノールによるホモジナイズ抽出を3回行い、抽出液と抽出残留物[非抽出性(BR)画分]に分けた。抽出液は濃縮後、水/酢酸エチル分配を行い、有機溶媒可溶性(OS)および水可溶性(WS)画分に分離し、放射能を測定した。非処理部位の葉および果実は乾燥し、燃焼法で処理後放射能を測定した。それらを基に吸収・移行性を調べた。

4) 代謝物の同定・定量

3) 項で得たSR、OSおよびWS画分中の ^{14}C 代謝物について、ラジオアイソトープ検出器およびUV検出器付HPLC(RI-UV-HPLC)[条件： C_{18} カラム、0.1% TFA含有アセトニトリル/水系]を用いた標品とのクロマトグラ

フィーで同定した。さらに、 ^{14}C 代謝物の放射性ピーク面積百分率を求め、試料中の各代謝物の添加放射能に対する割合を算出した。

結果：1) 根からの吸収・移行性

(1) RLG法：検出された放射能はほとんどが根部に分布し、茎および葉への移行は見られなかった。

(2) 燃焼法：

画分	^{14}C 処理量に対する割合、%			植物体中の分布率、%		
	1日	2日	4日	1日	2日	4日
葉	<0.1	0.2	0.4	0.1	0.5	0.7
茎	<0.1	0.1	0.2	0.1	0.3	0.4
根	29.4	38.2	53.9	99.8	99.2	98.9
植物体合計	29.4	38.5	54.5	100.0	100.0	100.0
水耕液	63.1	52.2	39.3			
合計	92.5	90.7	93.8			

植物体への放射能の移行量は経時的に増加し、1日後に54.5%となった。4日後の吸収された放射能は葉に0.4%（分布率で0.7%）、茎に0.2%（0.4%）、根に53.9%（98.9%）であった。

2) 葉における吸収・移行性

葉の中央に塗布された放射能は経時的に吸収されて葉脈沿いに移行し、処理28日後には塗布部より葉の先端方向の全面に分布したが、葉の基部方向への移行はほとんど見られなかった。

3) 葉および果実における吸収・移行・代謝試験（ポット試験）

(1) ^{14}C 分画結果

各部位中の放射能を溶媒分画した結果を次表に示す。

標識化合物	画分	^{14}C 処理量に対する割合、%					
		0日	3日	7日	14日	28日	
[^{14}C]	処理葉	SR	75.1	95.3	90.8	89.8	87.1
		OS	21.4	5.7	7.2	9.0	10.2
		WS	2.0	0.5	0.3	1.0	1.6
		BR	<0.1	0.4	0.1	0.2	0.3
		合計	98.5	101.9	98.4	100.0	99.2
	非処理葉		<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1
	非処理果実		<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1
	処理果実	SR	97.1	97.1	95.0	92.2	90.6
		OS	2.0	1.5	2.2	6.4	5.1
		WS	0.1	0.1	0.2	0.4	1.4
		BR	<0.1	0.1	0.1	0.2	0.5
合計		99.2	98.8	97.5	99.2	97.6	

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬㈱にある。

標識 化合物	画分		¹⁴ C 処理量に対する割合、%				
			0 日	3 日	7 日	14 日	28 日
[¹⁴ C]	処理葉	SR	73.0	78.3	89.7	90.8	87.9
		OS	24.4	17.6	6.6	4.8	6.3
		WS	0.1	0.7	0.3	1.2	2.0
		BR	<0.1	0.2	0.1	0.2	0.3
		合計	97.5	96.8	96.7	97.0	96.5
	非処理葉		<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1
	非処理果実		<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1
	処理果実	SR	94.7	98.7	95.0	92.9	91.8
		OS	3.7	1.1	2.4	7.7	6.1
		WS	0.1	0.1	0.3	0.7	0.4
		BR	<0.1	0.1	0.1	0.3	0.2
		合計	98.5	100.0	97.8	101.6	98.5

処理 28 日後の処理部位の SR (表面残留性 ¹⁴C) 画分に 87.1~91.8%が分布し、植物体中への吸収はわずかであった。非処理の葉および果実への分布は 0.1%以下であり、非処理部位への移行は見られなかった。

4) 代謝物の同定・定量

(1) 代謝物の同定

なすの処理葉および処理果実の SR、OS および WS 画分中の ¹⁴C 代謝物は合計 検出され、それらのうち

が標品との RI-UV-HPLC 法によるクロマトグラフィーで一致し同定された。また、

はトルフェンピラドに対する相対保持時間および標識体間の差を比較して推定した。なお、[¹⁴C] 標識体に特有な代謝物が 検出され、そのうちの であったが、[¹⁴C] 標識体に特有な代謝物は検出されなかった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬㈱にある。

(2) 代謝物の定量

処理葉の溶媒可溶性画分 (SR、OS、WS 画分) 中の ^{14}C 代謝物の ^{14}C 処理量に対する割合およびトルフェンピラド換算残留濃度の分析結果を次表に示す。

代謝物		^{14}C 処理量に対する割合、%									
		[^{14}C] 標識体					I ^{14}C] 標識体				
No.	同定	直後	3日	7日	14日	28日	直後	3日	7日	14日	28日
	溶媒可溶性画分	98.5	101.5	98.3	99.8	98.9	97.5	96.6	96.6	96.8	96.2
	トルフェンピラド	95.6	97.1	94.0	94.8	93.6	94.6	92.4	92.5	91.6	89.5
	その他	0.1	0.2	0.3	--	--	0.1	0.6	0.2	1.0	2.0
	BR 画分	--	0.4	0.1	0.2	0.3	--	0.2	0.1	0.2	0.3

-- : 検出せず、あるいは ^{14}C 処理量の 0.1%未満

代謝物		トルフェンピラド換算濃度、 $\mu\text{g/g}$ (ppm)									
		[^{14}C] 標識体					[^{14}C] 標識体				
No.	同定	直後	3日	7日	14日	28日	直後	3日	7日	14日	28日
	溶媒可溶性画分	151	170	175	179	218	180	138	119	152	142
	トルフェンピラド*	147	163	167	169	206	174	132	113	144	132
	その他	0.2	0.3	0.5	--	--	0.2	0.9	0.2	1.6	2.9
	BR 画分	--	0.7	0.2	0.4	0.7	--	0.3	0.1	0.3	0.4

-- : 検出せず、あるいは $0.2 \mu\text{g/g}$ (^{14}C) 標識体の 7、14、28 日は $0.1 \mu\text{g/g}$) 未満

処理葉において、トルフェンピラドは処理 28 日後で ^{14}C 処理量の 89.5~93.6% (換算残留濃度 $132\sim 206 \mu\text{g/g}$) が残存し、 ^{14}C 処理量の 0.1%以上生成した代謝物は 検出された。主要な代謝物は

生成した。その他の同定された代謝物は であった。
 [^{14}C] 標識体処理で特有の代謝物の は7日以後に検出されたが、28 日後で 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日本農薬㈱にある。

処理葉および処理果実の抽出性画分の未同定代謝物については量的にも少なく構造の解析は困難であるが、使用した標識体等を考慮し構造を推定した。

結論： なすにおいて、塗布処理されたトルフェンピラドは根、葉、果実からの吸収・移行がわずかであった。また、処理量のほぼ 90%が未変化体で、

明らかとなった。

以上の結果から、なすにおける推定代謝経路は以下の通りとなった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬㈱にある。

トルフェンピラドのなすにおける推定代謝経路図

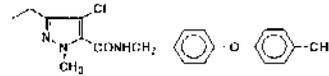
(2) [^{14}C]トルフェンピラドのキャベツにおける代謝

(資料 M-10)

試験機関：(株)三菱化学安全科学研究所

報告書作成年：1998年

供試標識： [^{14}C]トルフェンピラド
化合物



比放射能：
放射化学的純度：

供試植物：キャベツ（品種：秋徳）、結球肥大期（播種 94 日後）、1 本/ポット（[土壤] 化成 48 肥料を加えた黒ぼく土、[移植] 播種 77 日後に 8 号鉢へ移植、[追肥] IB 化成 S1 号 0.7g/ポット、3 回、[給水] 毎日 1 回実施）

方 法：試験はグロースキャビネット（昼 22℃、夜 17℃、湿度 70%、50,000 Lux [13 hr/day] 照射）内で行った。

1) 試料の調製

15%トルフェンピラド乳剤に [^{14}C]トルフェンピラドを添加し、水で希釈して 0.5mg/mL の処理溶液を調製した。結球肥大期に達したキャベツ 1 ポット当たり処理溶液 4 mg/8 mL を散布チャンバー (0.16 m²) 内で噴霧器を用いて地上部全面に散布処理し、試験を行った。本条件で散布量の約 60%が植物に付着した場合は、トルフェンピラドの実用量 (75 g a.i./10a) を処理する圃場では散布量の約 20%が植物に付着する量に相当する。

処理直後、7、14、28 日後に各 1 ポットをグロースキャビネットから取り出し、結球部分と外葉部に分け、分析用試料とした。

2) 試料の抽出・溶媒分画

分析試料はメタノールによるホモジナイズ抽出を 3 回行い、抽出液と抽出残留物 [非抽出性 (BR) 画分] に分けた。抽出液は濃縮後、凝固処理を行い葉緑素を除去したのち、水/酢酸エチル分配を行い、有機溶媒可溶性 (OS) および水可溶性 (WS) 画分に分画した。WS 画分は更に濃縮後、10 倍量のアセトニトリルを加えて分配し、アセトニトリル画分 (WS/OS 画分) と水相画分 (WS/WS 画分) に分画し、放射能を測定した。

3) 代謝物の同定・定量

2) 項で得た OS、WS/OS および WS/WS 画分中の ^{14}C 代謝物について、UV 検出器およびラジオアイソトープ検出器付 HPLC (UV- RI-HPLC) [条件：C₁₈ カラム、0.1% TFA 含有アセトニトリル/水系] を用いた標品とのコクロマトグラフィーで同定した。主代謝物については GC-MS 法で測定後マスペクトルを解析し、確認した。さらに、 ^{14}C 代謝物の放射性ピーク面積百分率を求め、試料中の各代謝物の添加放射能に対する割合を算出した。

結 果：1) 吸収・移行・分布

各部位中の放射能を溶媒分画し、各画分への分布率を測定した結果を次表に示す。

画分		分布率、%			
		0日	7日	14日	28日
外葉	OS	87.6	89.5	91.4	78.7
	WS	2.9	8.4	6.0	15.9
	WS/OS	2.8	2.1	4.4	10.7
	WS/WS	0.1	6.3	1.6	5.2
	BR	0.1	0.6	1.4	5.1
	合計	90.6	98.5	98.8	99.7
結球	OS	9.1	1.2	0.8	0.1
	WS	0.3	0.3	0.4	0.2
	WS/OS	0.2	0.2	0.1	<0.1
	WS/WS	0.1	0.1	0.3	0.2
	BR	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1
	合計	9.4	1.5	1.2	0.3
¹⁴ C処理量に対する割合、%		80.0	78.0	62.2	58.9

¹⁴C処理量に対する直後の付着率は80.0%であり、28日後には58.9%に減少した。植物体中の分布は、直後では外葉に90.6%、結球に9.4%であったが、28日後では外葉に99.7%、結球に0.3%となった。溶媒分画した結果、経時的に極性化が進み、処理後28日の外葉でOS画分に78.7%、WS画分に15.9%、結球でOS画分に0.1%、WS画分に0.2%分布した。このことから可食部である結球にわずかに残留した放射能は散布されたものが直接小結球に付着し、そのものが検出された可能性が高く、葉において吸収された未変化体および生成する代謝物の移行性は低いものと推測された。

2) 代謝物の同定

外葉および結球のOS、WS/OS および WS/WS 画分中の¹⁴C代謝物は合計検出され、それらのうち、主代謝物はGC-MS法による保持時間およびマススペクトルが と一致し、 はRI-UV-HPLC法による標品とのクロマトグラフィーで と一致し、同定された。また、 は直接、メチル化後およびメチル化/アセチル化後RI-UV-HPLC法により測定し、これらの化学的挙動とトルフェンピラドに対する相対保持時間が

と一致し、同定された。また、OS画分中の極性代謝物、WS/OS および WS/WS 画分はHPLC測定で溶出が速く、分離が不十分なブロードなピークとして検出されたが、β-グルコシダーゼおよび酸で分解され、特に、酸分解により46~89%がエーテルで抽出され、分離が良好な遊離形代謝物として同定・定量ができた。それゆえ、これらのほとんどが抱合体であることが判明した。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬㈱にある。

3) 代謝物の定量

(1) 外葉

抽出性画分（OS および WS 画分）中代謝物の ¹⁴C 残留量に対する割合およびトルフェンピラド換算残留濃度の分析結果を次表に示す。

代謝物		¹⁴ C 残留量に対する割合、%											
		直後			7 日			14 日			28 日		
No.	同定	OS	WS	合計	OS	WS	合計	OS	WS	合計	OS	WS	合計
	抽出性画分	87.6	2.9	90.5	89.5	8.4	97.9	91.4	6.0	97.4	78.7	15.9	94.6
	トルフェンピラド*	86.4	2.8	89.2	74.7	0.1	74.8	77.4	0.9	78.3	52.4	2.6	55.0
	その他	0.6	0.1	0.7	1.5	3.9	5.4	1.7	1.4	3.1	0.1	3.4	3.5
	BR 画分	--	--	0.1	--	--	0.6	--	--	1.4	--	--	5.1

-- : 検出せず、あるいは ¹⁴C 残留量の 0.1%未満
 *) 未同定代謝物（C-1 等）は、資料 M-11 の 標識体にて確認した No.を示す。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬㈱にある。

外薬において、トルフェンピラドは処理 28 日後で¹⁴C 処理量の 55.0% (残留濃度 4.63 μg/g) が残存し、¹⁴C 処理量の 0.1%以上生成した代謝物は検出された。

代謝物		¹⁴ C 残留量に対する割合、%		
		7 日	14 日	28 日

(2) 結球

抽出性画分 (OS および WS 画分) 中代謝物の¹⁴C 処理量に対する割合およびトルフェンピラド換算残留濃度の分析結果を次表に示す。

代謝物		¹⁴ C 残留量に対する割合、%											
		直後			7 日			14 日			28 日		
No.	同定	OS	WS	合計	OS	WS	合計	OS	WS	合計	OS	WS	合計
	抽出性画分	9.1	0.3	9.4	1.2	0.3	1.5	0.8	0.4	1.2	0.1	0.2	0.3
	トルフェンピラド*	9.0	0.2	9.2	1.0	0.1	1.1	0.7	0.1	0.8	--	--	--
	その他	--	0.1	0.1	--	0.2	0.2	--	0.3	0.3	0.1	0.2	0.3
	BR 画分	--	--	<0.1	--	--	<0.1	--	--	<0.1	--	--	<0.1

--: 検出せず、あるいは¹⁴C 残留量の 0.1%未満

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬㈱にある。

代謝物		トルフェンピラド換算残留濃度、 $\mu\text{g/g}$			
No.	同定	直後	7日	14日	28日
	抽出性画分	2.61	0.51	0.25	0.03
	トルフェンピラド*	2.56	0.38	0.17	--
	その他	0.03	0.07	0.06	0.03
	BR画分	<0.03	<0.03	<0.02	<0.01

--: 検出せず、あるいはトルフェンピラド換算残留濃度 $0.03\sim 0.01\mu\text{g/g}$ 未満

結球において、トルフェンピラドは処理 28 日後で ^{14}C 処理量の 0.1% (残留濃度 $0.03\mu\text{g/g}$) 未満となった。 ^{14}C 処理量の 0.1%以上生成した代謝物は検出されたが、以下であった。

外葉の抽出性画分の未同定代謝物については量的にも少なく構造の解析は困難であるが、使用した標識体等を考慮し構造を推定した。

結論: キャベツにおいて、散布処理された [^{14}C]トルフェンピラドは葉から比較的容易に吸収され、代謝を受けたが、可食部である結球への移行性は低いことが明らかとなった。

以上の結果から、キャベツにおける推定代謝経路は以下の通りとなった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬㈱にある。

[^{14}C]トルフェンピラドのキャベツにおける推定代謝経路図

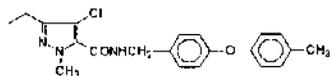
(3) [^{14}C]トルフェンピラドのキャベツにおける代謝

(資料 M-11)

試験機関：㈱三菱化学安全科学研究所

報告書作成年：1999年

供試標識： [^{14}C]トルフェンピラド
化合物



比放射能：
放射化学的純度：

供試植物：キャベツ（品種：秋徳）、結球肥大期（播種 94 日後）、1 本/ポット（[土壤] 化成 48 肥料を加えた黒ぼく土、[移植] 播種 77 日後に 8 号鉢へ移植、[追肥] IB 化成 S1 号 0.7g/ポット、3 回、[給水] 毎日 1 回実施）

方 法：試験はグロースキャビネット（昼 23°C、夜 17°C、湿度 70%、50,000 Lux [13 hr/日] 照射）内で行った。

1) 試料の調製

15%トルフェンピラド乳剤に [^{14}C]トルフェンピラドを添加し、水で希釈して 0.5mg/mL の処理溶液を調製した。結球肥大期に達したキャベツ 1 ポット当たり処理溶液 4 mg/8 mL を散布チャンパー (0.16 m²) 内で噴霧器を用いて地上部全面に散布処理し、試験を行った。本条件で散布量の約 60%が植物に付着した場合は、トルフェンピラドの実用量 (75 g a.i./10a) を処理する圃場では散布量の約 20%が植物に付着する量に相当する。

処理 28 日後に 1 ポットをグロースキャビネットから取り出し、結球部分と外葉部に分け、分析用試料とした。

2) 試料の抽出・溶媒分画

分析試料はメタノールによるホモジナイズ抽出を 3 回行い、抽出液と抽出残留物 [非抽出性 (RR) 画分] に分けた。抽出液は濃縮後、凝固処理を行い葉緑素を除去したのち、水/酢酸エチル分配を行い、有機溶媒可溶性 (OS) および水可溶性 (WS) 画分に分画した。WS 画分は更に濃縮後、10 倍量のアセトニトリルを加えて分配し、アセトニトリル画分 (WS/OS 画分) と水相画分 (WS/WS 画分) に分画し、放射能を測定した。

3) 代謝物の同定・定量

2) 項で得た OS、WS/OS および WS/WS 画分中の ^{14}C 代謝物について、UV 検出器およびラジオアイソトープ検出器付 HPLC (UV- RI-HPLC) [条件：C₁₈カラム、0.1% TFA 含有アセトニトリル/水系] を用いた標品とのコクロマトグラフィーで同定した。 ^{14}C 代謝物の放射性ピーク面積百分率を求め、試料中の各代謝物の添加放射能に対する割合を算出した。

結 果：1) 吸収・移行・分布

各部位中の放射能を溶媒分画し、各画分への分布率測定結果およびそれらのトルフェンピラド換算残留濃度を次表に示す。

画分	分布率、%	
	外葉	結球
OS	70.29	0.56
WS	11.44	0.73
WS/OS	7.84	0.25
WS/WS	3.60	0.48
BR	15.47	1.51
合計	97.20	2.80
¹⁴ C 処理量に対する割合、%	89.4	

¹⁴C 処理量に対する 28 日後の残留率は 89.4%であった。植物体中の分布は外葉に 97.20%、結球に 2.80%となった。溶媒分画した結果、外葉で OS 画分に 70.29%、WS 画分に 11.44%、BR 画分に 15.47%、結球で OS 画分に 0.56%、WS 画分に 0.73%、BR 画分に 1.51%分布した。

2) 代謝物の同定

外葉および結球の OS、WS/OS および WS/WS 画分中の ¹⁴C 代謝物は合計 検出され、それらのうち、 は直接、メチル化後およびメチル化/アセチル化後 RI-UV-HPLC 測定による化学的挙動とトルフェンピラドに対する相対保持時間が

と一致し、同定さ

れた。

また、WS/OS および WS/WS 画分は HPLC 測定で溶出が速く、分離が不十分な多数のブロードなピークとして検出された。酸分解により WS/OS 画分では 71~77%がエーテルで抽出されたが、WS/WS 画分ではエーテル抽出率が 11~45%と低く、そののちのアセトニトリル分配を行うことにより合計で 82~91%が溶媒に抽出され、アセトニトリル分配された分解物は高極性の代謝物であった。それゆえ、これらのほとんどが抱合体であることが判明した。

3) 代謝物の定量

外葉および結球の抽出性画分（OS および WS 画分）中代謝物の ¹⁴C 残留量に対する割合およびトルフェンピラド換算残留濃度の分析結果を次表に示す。

代謝物		¹⁴ C 残留量に対する割合、%						トルフェンピラド換算残留濃度、 $\mu\text{g/g}$	
		外葉			結球			外葉	結球
No.	同定	OS	WS	合計	OS	WS	合計	外葉	結球
	抽出性画分	70.29	11.44	81.73	0.56	0.73	1.29	7.75	0.11
C-25	トルフェンピラド	48.46	1.31	49.77	0.39	0.02	0.41	4.71	0.034
	その他	--	2.18	2.18	--	0.16	0.16	0.22	0.018
	BR 画分	--	--	15.47	--	--	1.51	1.47	0.12

--: 検出せず、あるいは ¹⁴C 残留量の 0.1%未満（トルフェンピラド換算残留濃度 $0.01\ \mu\text{g/g}$ [外葉]、 $0.002\ \mu\text{g/g}$ [結球] 未満）
 未同定代謝物（ ）等は、資料 M-10 の 標識体にて確認した No.を示す。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬㈱にある。

外葉において、トルフェンピラドは¹⁴C処理量の49.77%（残留濃度4.71 μg/g）が残存し、¹⁴C処理量の0.1%以上生成した代謝物は 検出された。主要な代謝物は、

となった。

結球において、トルフェンピラドは処理28日後で¹⁴C処理量の0.41%（残留濃度0.034 μg/g）となった。

外葉および結球の抽出性画分の未同定代謝物については量的にも少なく構造の解析困難であるが、使用した標識体等を考慮し構造を推定した。

結 論： キャベツにおいて、散布処理された [¹⁴C]トルフェンピラドは[¹⁴C]トルフェンピラド処理による試験（M-9）と同様に葉から比較的容易に吸収され、代謝を受けたが、可食部である結球への移行性は低いことが明らかとなった。

以上の結果から、キャベツにおける推定代謝経路は以下の通りとなった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬㈱にある。

[¹⁴C]トルフェンピラドのキャベツにおける推定代謝経路図

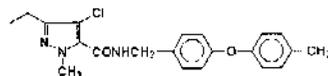
(4) [^{14}C]トルフェンピラドのももにおける代謝

(資料 M-12)

試験機関：㈱三菱化学安全科学研究所

報告書作成年：1998年

供試標識： [^{14}C]トルフェンピラド
化合物



比放射能：
放射化学的純度：

供試植物： もも（品種：紅清水）、果実が約4cmに成長した時期、1本/ポット

方 法： 試験は RI ガラス温室（温度：25~30℃、湿度：40~80%、光照射：自然光補光なし）内で行った。

1) 試料の調製

15%トルフェンピラド乳剤に [^{14}C]トルフェンピラドを添加し、水で希釈して 1.0mg/mL の処理溶液を調製した。約4cmに成長した果実が着果した1枝を散布チャンパー (0.16 m²) 内に入れ、処理溶液 4 mg/4 mL を噴霧器を用いて枝全面に散布処理し、試験を行った。本条件で散布量の約60%が植物に付着した場合は、トルフェンピラドの実用量 (75 g a.i./10a) を処理する圃場では散布量の約20%が植物に付着する量に相当する。

処理直後、14、28、56 日後に各1ポットを RI ガラス温室から取り出し、処理した枝の葉、茎および果実、および非処理の葉に分け、更に処理後56日の果実は果皮、果肉および種子に分けたのち、分析用試料とした。

2) 試料の抽出・溶媒分画

分析試料はメタノールによるホモジナイズ抽出を3回行い、抽出液と抽出残留物 [非抽出性 (BR) 画分] に分けた。抽出液は濃縮後 (葉は凝固処理を行い葉緑素を除去したのち)、水/酢酸エチル分配を行い、有機溶媒可溶性 (OS) および水可溶性 (WS) 画分に分画した。WS 画分は更に濃縮後、10 倍量のアセトニトリルを加えて分配し、アセトニトリル画分 (WS/OS 画分) と水相画分 (WS/WS 画分) に分画し、放射能を測定した。

3) 代謝物の同定・定量

2) 項で得た OS、WS/OS および WS/WS 画分中の ^{14}C 代謝物について、UV 検出器およびラジオアイソトープ検出器付 HPLC (UV- RI-HPLC) [条件：C₁₈ カラム、0.1% TFA 含有アセトニトリル/水系] を用いた標品とのコクロマトグラフィーで同定した。主代謝物は酸分解したのちメチル化し、GC-MS 法で測定後マススペクトルを解析し、確認した。さらに、 ^{14}C 代謝物の放射性ピーク面積百分率を求め、試料中の各代謝物の添加放射能に対する割合を算出した。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬㈱にある。

結 果： 1) 吸収・移行・分布

各部位中の放射能を溶媒分画し、分布率を測定した結果を次表に示す。

試料		画分	分布率、%				
			0日	14日	28日	56日	
処理部位	葉	OS	81.8	67.0	74.0	54.4	
		WS	1.7	4.1	13.7	12.7	
		(WS/OS)	1.7	2.8	7.3	3.3	
		(WS/WS)	--	1.3	6.4	9.4	
		BR	--	2.0	2.6	16.0	
		合計	83.5	73.1	90.3	83.1	
	茎	OS	11.8	12.5	6.1	6.9	
		WS	--	0.1	0.1	0.2	
		BR	--	0.1	0.2	0.4	
		合計	11.8	12.7	6.4	7.5	
	果実	OS	4.4	13.6	3.0	8.4	
		WS	0.3	0.5	0.2	0.5	
		(WS/OS)	0.3	--	0.1	0.2	
		(WS/WS)	--	0.5	0.1	0.3	
		BR	--	0.1	0.1	0.4	
		合計	4.7	14.2	3.3	9.3	
	非処理の葉		OS	--	--	--	--
			WS	--	--	--	--
BR			--	--	--	--	
合計			--	--	--	--	
¹⁴ C 処理量に対する割合、%			32.6	31.5	37.8	32.8	

試料	分画	分布率、%		
		果皮	果肉	種子
56日後の果実	OS	8.2	0.1	--
	WS	0.2	0.3	--
	BR	0.4	--	--
	合計	8.8	0.4	0.1
	果実中の分布率、%	94.6	4.3	1.1

--：分布率0.1%未満

¹⁴C 処理量に対する直後の付着率は32.6%であり、56日後までの残留率は31.5~37.8%と経時的な変化がなかった。処理した枝の各部位への分布割合も経時的な変化は見られず、処理後56日の処理葉に83.1%、処理茎に7.5%、処理果実に9.3%であった。果実に残留する¹⁴Cの約95%は果皮に存在した。また、非処理の葉への分布は0.1%未満であり、移行は見られなかった。

溶媒分画した結果、経時的に極性化が進み、処理後 56 日の処理葉で OS 画分に 54.4%、WS 画分に 12.7%、処理果実の果皮で OS 画分に 8.2%、WS 画分に 0.2%、果肉で OS 画分に 0.1%、WS 画分に 0.3%分布した。

2) 代謝物の同定

処理葉の OS、WS/OS および WS/WS 画分中の ^{14}C 代謝物は合計 24 種検出され、それらのうち、主代謝物の一種はメチル化後の GC-MS 法による保持時間およびマススペクトルが [] と一致し、 [] は直接、メチル化後およびメチル化/アセチル化後 RI-UV-HPLC 測定による化学的挙動、トルフェンピラドに対する相対保持時間および標品とのクロマトグラフィーで []

[] と一致し同定された。また、2 種は β -グルコシダーゼおよび酸分解により遊離したアグリコンが [] と一致し、同定された。WS 画分中の高極性代謝物は酸分解により大部分が [] に収束し、[] の抱合体であることが判った。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬㈱にある。

3) 代謝物の定量

(1) 処理葉

抽出性画分（OS および WS 画分）中代謝物の ^{14}C 残留量に対する割合およびトルフェンピラド換算残留濃度の分析結果を次表に示す。

代謝物		^{14}C 残留量に対する割合、%											
		直後			14 日			28 日			56 日		
No.	同定	OS	WS	合計	OS	WS	合計	OS	WS	合計	OS	WS	合計
	抽出性画分	81.8	1.7	83.5	67.0	4.1	71.1	74.0	13.7	87.7	54.4	12.7	67.1
	トルフェンピラド	81.8	1.7	83.5	46.0	0.3	46.3	37.2	0.2	37.4	20.0	--	20.0
	その他	--	--	--	5.6	0.4	6.0	1.1	2.8	3.9	1.6	3.9	5.5
	抽出性代謝物合計	--	--	--	21.0	3.8	24.8	36.8	13.5	50.3	34.4	12.7	47.1
	BR 画分	--	--	--	--	--	2.0	--	--	2.6	--	--	16.0

--: 検出せず、あるいは ^{14}C 残留量の 0.1% 未満、Gul: β -グルコース抱合体、conj: 抱合体類、*) WS 画分中の抱合体類（酸分解で生成したアグリコン）
 **) 未同定代謝物（ ）等は、資料 M-13 の 標識体にて確認した No. を示す。

代謝物		トルフェンピラド換算残留濃度 μ g/g (ppm)			
No.	同定	直後	14 日	28 日	56 日
	抽出性画分	100.1	55.4	56.4	41.6
	トルフェンピラド	100.1	36.0	24.1	12.4
	その他	--	4.7	2.5	3.4
	RR 画分	--	1.5	1.4	9.9

処理葉において、トルフェンピラドは処理 56 日後で ¹⁴C 残留量の 20.0% (残留濃度 12.4 μ g/g) が残存し、抽出性代謝物生成量は 28 日後に最高値 (50.3%) を示し、56 日後には 47.1% となった。¹⁴C 残留量の 0.1% 以上生成

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬㈱にある。

した代謝物は 検出された。処理 56 日後の主要な代謝物は、

代謝物	¹⁴ C 残留量に対する割合、%		
	14 日	28 日	56 日
抽出性代謝物合計			

(2) 処理茎

抽出性画分（OS および WS 画分）中代謝物の ¹⁴C 残留量に対する割合の分析結果を次表に示す。

代謝物		¹⁴ C 残留量に対する割合、%											
		直後			14 日			28 日			56 日		
No.	同定	OS	WS	合計	OS	WS	合計	OS	WS	合計	OS	WS	合計
	抽出性画分	11.8	<0.1	11.8	12.5	0.1	12.6	6.1	0.1	6.2	6.9	0.2	7.1
	トルフェンピラド	11.8	--	11.8	11.9	--	11.9	5.6	--	5.6	6.2	--	6.2
	その他	--	--	--	0.1	0.1	0.2	--	0.1	0.1	--	0.2	0.2
	抽出性代謝物合計	--	--	--	0.6	0.1	0.7	0.5	0.1	0.6	0.7	0.2	0.9
	BR 画分	--	--	--	--	--	0.1	--	--	0.2	--	--	0.4

-- : 検出せず、あるいは ¹⁴C 残留量の 0.1%未満

Gul : β-グルコース抱合体

^{*)} 未同定代謝物 () は、資料 M-13 の 標識体にて確認した No.を示す。

処理された茎において、¹⁴C 残留量のほとんどがトルフェンピラドであり、

主要な代謝物は

(3) 処理果実

抽出性画分（OS および WS 画分）中代謝物の ¹⁴C 残留量に対する割合およびトルフェンピラド換算残留濃度の分析結果を次表に示す。

代謝物		¹⁴ C 残留量に対する割合、%								
		直後			14 日			28 日		
No.	同定	OS	WS	合計	OS	WS	合計	OS	WS	合計
	抽出性画分	4.4	0.3	4.7	13.6	0.5	14.1	3.0	0.2	3.2
	トルフェンピラド	4.4	0.3	4.7	12.6	0.1	12.7	2.3	--	2.3
	その他	--	--	--	--	0.4	0.4	0.3	0.2	0.5
	抽出性代謝物合計	--	--	--	1.0	0.4	1.4	0.7	0.2	0.9
	BR 画分	--	--	--	--	--	0.1	--	--	0.1

代謝物		¹⁴ C 残留量に対する割合、%						
		56 日						
		果皮			果肉			合計
No.	同定	OS	WS	合計	OS	WS	合計	
	抽出性画分	8.2	0.2	8.4	0.1	0.3	0.4	8.8
	トルフェンピラド	7.2	--	7.2	--	--	--	7.2
	その他	0.6	0.1	0.7	0.1	0.1	0.2	0.9
	抽出性代謝物合計	1.0	0.2	1.2	0.1	0.3	0.4	1.6
	BR 画分	--	--	0.4	--	--	--	0.4

-- : 検出せず、あるいは ¹⁴C 残留量の 0.1% 未満
 () : 果肉中の ¹⁴C 残留量、Gul : β-グルコース抱合体、conj : 抱合体類
 *) 未同定代謝物 () は、資料 M-13 の 標識体にて確認した No. を示す。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬㈱にある。

代謝物		トルフェンピラド換算残留濃度、 $\mu\text{g/g}$ (ppm)				
No.	同定	直後	14日	28日	56日	
					果皮	果肉
	抽出性画分	2.97	4.40	0.51	40.7	0.04
	トルフェンピラド	2.97	3.95	0.37	34.8	--
	その他	--	0.15	0.08	3.9	0.02
	BR画分	--	0.03	0.02	1.9	--
	合計	2.97	4.43	0.53	42.6	0.04

* 未同定代謝物 () は、資料 M-13 の 標識体にて確認した No.を示す。

処理した果実の収穫期（処理 56 日後）において、トルフェンピラドは ^{14}C 残留量の 7.2%が残存したが、果肉には全く検出されなかった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬㈱にある。

結 論： ももにおいて、散布処理された [^{14}C]トルフェンピラドは葉から比較的容易に吸収され、代謝を受けたが、非処理葉への移行性は低いことが明らかとなった。

以上の結果から、ももにおける推定代謝経路は以下の通りとなった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬㈱にある。

[¹⁴C]トルフエンピラドのももにおける推定代謝経路図

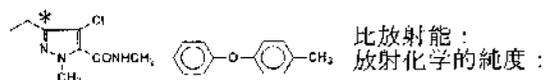
(5) [^{14}C]トルフェンピラドのももにおける代謝

(資料 M-13)

試験機関：㈱三菱化学安全科学研究所

報告書作成年：1999年

供試標識： [^{14}C]トルフェンピラド
化合物



供試植物： もも（品種：紅清水）、果実が約4cmに成長した時期、1本/ポット

方 法： 試験はRIガラス温室（温度：25~30℃、湿度：40~80%、光照射：自然光補光なし）内で行った。

1) 試料の調製

15%トルフェンピラド乳剤に [^{14}C]トルフェンピラドを添加し、水で希釈して1.0mg/mLの処理溶液を調製した。約4cmに成長した果実が着果した1枝を散布チャンパー (0.16 m³) 内に入れ、処理溶液4 mg/4 mLを噴霧器を用いて枝全面に散布処理し、試験を行った。本条件で散布量の約60%が植物に付着した場合は、トルフェンピラドの実用量 (75 g a.i./10a) を処理する圃場では散布量の約20%が植物に付着する量に相当する。

果実は処理53日後に落果し、直ちに採取し、果皮、果肉および種子に分け、その他は処理56日後にポットをRIガラス温室から取り出し、処理した枝の葉、莖に分け、分析用試料とした。

2) 試料の抽出・溶媒分画

分析試料はメタノールによるホモジナイズ抽出を3回行い、抽出液と抽出残留物 [非抽出性 (BR) 画分] に分けた。抽出液は濃縮後 (葉は凝固処理を行い葉緑素を除去したのち)、水/酢酸エチル分配を行い、有機溶媒可溶性 (OS) および水可溶性 (WS) 画分に分画した。WS画分は更に濃縮後、10倍量のアセトニトリルを加えて分配し、アセトニトリル画分 (WS/OS画分) と水相画分 (WS/WS画分) に分画し、放射能を測定した。

3) 代謝物の同定・定量

2) 項で得た OS、WS/OS および WS/WS 画分中の ^{14}C 代謝物について、UV 検出器およびラジオアイソトープ検出器付 HPLC (UV-RI-HPLC) [条件：C₁₈カラム、0.1% TFA 含有アセトニトリル/水系] を用いた標品とのクロマトグラフィーで同定した。さらに、 ^{14}C 代謝物の放射性ピーク面積百分率を求め、試料中の各代謝物の添加放射能に対する割合を算出した。

結 果： 1) 吸収・移行・分布

各部位中の放射能を溶媒分画し、分布率を測定した結果を次表に示す。

画分	分布率、%					
	処理後 56 日		処理後 53 日			
	葉	茎	果実			
			果皮	果肉	種子	合計
OS	50.74	6.51	4.94	0.26	<0.01	5.20
WS	32.19	0.51	0.40	0.54	0.02	0.96
(WS/OS)	26.44	--	0.30	0.24	--	0.54
(WS/WS)	5.75	--	0.10	0.30	--	0.40
BR	3.15	0.26	0.38	0.04	0.04	0.46
合計	86.08	7.28	5.72	0.84	0.06	6.62
果実中の分布率、%			86.4	12.7	0.9	100.0
¹⁴ C 処理量に対する割合、%	23.49					

--：測定せず

¹⁴C 処理量に対する処理部位の残留率は 23.49%であった。植物体中の分布は処理葉に 86.08%、処理茎に 7.28%、処理果実に 6.62%であった。果実に残留する ¹⁴C の 12.7%が果肉に分布した。溶媒分画した結果、処理葉で OS 画分に 50.74%、WS 画分に 32.19%、処理果実の果皮で OS 画分に 4.94%、WS 画分に 0.40%、果肉で OS 画分に 0.26%、WS 画分に 0.54%分布した。

2) 代謝物の同定

処理葉の OS、WS/OS および WS/WS 画分中の ¹⁴C 代謝物は合計 検出された。それらのうち、 は直接、メチル化後およびメチル化/アセチル化後 RI-UV-HPLC 法により測定し、これらの化学的挙動、トルフェンピラドに対する相対保持時間および標品とのクロマトグラフィーで

と一致し、同定された。また、果肉の高極性代謝物は直接およびβ-グルコシダーゼや酸分解により遊離したアグリコンが と一致し、同定された。また、葉の WS 画分中の主要な代謝物は HPLC 法で分取・単離後、β-グルコシダーゼ分解により遊離したアグリコンが と一致し、β-グルコース抱合体 であることが判った。

3) 代謝物の定量

(1) 処理葉および処理茎

抽出性画分（OS および WS 画分）中代謝物の ^{14}C 残留量に対する割合およびトルフェンピラド換算残留濃度の分析結果を次表に示す。

代謝物		^{14}C 残留量に対する割合、%						トルフェンピラド換算残留濃度 $\mu\text{g/g}$ (ppm)	
		処理葉			処理茎			処理葉	処理茎
No.	同定	OS	WS	合計	OS	WS	合計	処理葉	処理茎
	抽出性画分	50.74	32.19	82.93	6.51	0.51	7.02	62.17	9.58
	トルフェンピラド	27.95	0.14	28.09	5.16	--	5.16	21.06	7.04
	その他	1.98	17.90	19.88	--	0.51	0.51	14.93	0.69
	抽出性代謝物合計	22.79	32.05	54.84	1.35	0.51	1.86	41.11	2.54
	BR 画分	--	--	3.15	--	--	0.26	2.36	0.35
	合計	--	--	86.08	--	--	7.28	64.53	9.93

--: 検出せず、あるいは ^{14}C 残留量の 0.1%未満、gul: β -グルコース抱合体、conj: 抱合体類、*) WS 画分中の抱合体類（酸分解で生成したアグリコン）
**) 未同定代謝物（ ）等は、資料 M-12 の 標識体にて確認した No.を示す。

処理 56 日後の処理葉において、トルフェンピラドは ^{14}C 残留量の 28.09%（残留濃度 21.06 $\mu\text{g/g}$ ）が残存し、

(2) 処理果実

抽出性画分 (OS および WS 画分) 中代謝物の ^{14}C 残留量に対する割合およびトルフェンピラド換算残留濃度の分析結果を次表に示す。

代謝物		^{14}C 残留量に対する割合、%							トルフェンピラド換算残留濃度 $\mu\text{g/g}$ (ppm)	
		果皮			果肉			合計	果皮	果肉
No.	同定	OS	WS	合計	OS	WS	合計			
	抽出性画分	4.94	0.40	5.34	0.26	0.54	0.80	6.14	10.28	0.11
	トルフェンピラド	4.11	0.17	4.28	0.02	--	0.02	4.30	8.24	0.003
	その他	--	0.10	0.10	--	0.30	0.30	0.40	0.17	0.042
	抽出性代謝物合計	0.83	0.23	1.06	0.24	0.54	0.78	1.84	2.04	0.105
	BR 画分	--	--	0.38	--	--	0.04	0.42	0.73	0.01

-- : 検出せず、あるいは ^{14}C 残留量の 0.01% (果皮 $0.01 \mu\text{g/g}$ 、果肉 $0.001 \mu\text{g/g}$) 未満

*) 未同定代謝物 () は、資料 M-12 の 標識体にて確認した No. を示す。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農業㈱にある。

処理果実において、トルフェンピラドは処理 53 日後の果皮に ^{14}C 残留量の 4.28% (残留濃度 $8.24 \mu\text{g/g}$) 残存したが、果肉に 0.02% (残留濃度 $0.003 \mu\text{g/g}$) とわずかであった。

結 論： ももにおいて、散布処理された [^{14}C]トルフェンピラドは [^{14}C]トルフェンピラド処理による試験 (資料 M-11) と同様に葉から比較的容易に吸収されて代謝を受けた。また、果実に付着したトルフェンピラドの果肉への移行がわずかで、

以上の結果から、ももにおける推定代謝経路は以下の通りとなった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬㈱にある。

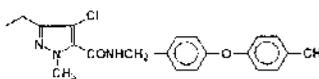
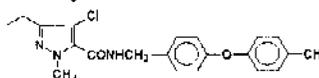
[¹⁴C]トルフェンピラドのももにおける推定代謝経路図

3. 土壤中運命

(1) ^{14}C 標識トルフェンピラドの好気・嫌氣的土壤中運命試験

(資料 M-14)

試験機関：(株)三菱化学安全科学研究所
報告書作成年：1999年

供試標識化合物： 1) [^{14}C]トルフェンピラド  比放射能：
放射化学的純度：
2) [^{14}C]トルフェンピラド  比放射能：
放射化学的純度：

供試土壌：茨城土壌（軽埴土、日本植物防疫協会研究所牛久岡場）

および高知土壌（軽埴土、日本植物防疫協会研究所高知試験場）

方法：1) 分解試験

乾土当たり 50 g の生土に最大容水量の約 60 % の水を加えたのち、好氣的条件下では空気を、嫌氣的条件下では窒素を通気して 10 日間プレインキュベーションした土壌に標識化合物を乾土換算 0.75 $\mu\text{g/g}$ 土壌（使用量 75 g a.i./10a に相当）処理した。最大容水量の約 60 % に調節したのち、30°C で、空気を通気して好氣的畑地条件下では 91 日間または 183 日間、オートクレーブ滅菌畑地条件下では 28 日間、嫌氣的畑地条件下では窒素を通気して 28 日間試験をした。

経時的に土壌（好氣的畑地条件：直後、3 日、1、2 週間、1、2、3 [茨城土壌最終時点]、6 ヶ月後 [高知土壌最終時点]、滅菌畑地および嫌氣的畑地条件：直後、1、2、4 週間後）および揮散性物質（1N NaOH およびポリウレタンフォームで捕集）を採取した。

土壌中の放射性物質はアセトン 1 回、メタノール 2 回抽出後、抽出物を酢酸エチル/水に分配して中性抽出有機溶媒可溶性画分（OS-1 画分）と中性抽出水可溶性画分（WS-1 画分）に分画した。抽出残土は更に 0.1N NaOH で 1 回抽出し、抽出液と抽出残土に分離した。抽出液は酸性下、酢酸エチル/水に分配して塩基性抽出有機溶媒可溶性画分（OS-2 画分）と塩基性抽出水可溶性画分（WS-2 画分）に分画した。WS-1 画分および WS-2 画分で ^{14}C 処理量の 2 % を超える時点については濃縮し、10 倍量のアセトニトリルを加えて、可溶性画分（WS-OS 画分）と不溶分に分画した。OS-1 画分と OS-2 画分および WS-1 画分と WS-2 画分をそれぞれ合わせ、有機溶媒可溶性画分（OS 画分）および水可溶性画分（WS 画分）とした。抽出残土は放射能を測定して BR 画分とし、 ^{14}C 処理量の 10 % を超える 3 時点について常法により腐植画分（フミン、フミン酸、フルボ酸画分）を行った。フルボ酸画分は酸性下、酢酸エチル抽出を行い、抽出物を FA-OS 画分とした。

また、捕集した揮散物の放射能を測定した。

2) 代謝物の同定・定量

OS-1 画分、OS-2 画分、WS-OS 画分および FA-OS 画分中の放射性代謝物は、ラジオアイソトープ検出器 (RI) および UV 検出器付 HPLC (RI-UV-HPLC)

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬㈱にある。

の条件Ⅰ (ODS-2カラム、0.1% TFA 含有アセトニトリル/水系) および HPLC 条件Ⅱ (Phenylカラム、0.1% TFA 含有アセトニトリル/水系) を用いたクロマトグラフィーで同定し、RI-HPLC 条件Ⅱで放射性ピーク面積百分率を求め、各試料中の各代謝物の添加放射能に対する割合を算出した。

なお、1N NaOH 補集液は塩化バリウムによる ^{14}C の確認を行った。

結果：1) 処理後の放射能の分布

(1) 好氣的畑地条件

茨城土壌の各時点における分布および BR 画分を更に腐植分画を行った結果を次表に示す。

標識化合物	画分		^{14}C 処理量に対する%							
			0日	3日	7日	14日	31日	63日	91日	
[^{14}C]	土壌	OS	OS-1	96.2	54.3	39.7	28.9	20.3	10.1	7.0
			OS-2	1.4	26.7	37.5	38.7	36.9	26.9	17.9
			合計	97.6	81.0	77.2	67.6	57.2	37.0	24.9
		WS	WS-1	0.5	0.4	0.4	0.6	1.3	0.6	0.4
			WS-2	0.1	1.1	1.2	2.2	3.1	6.3	6.5
			合計	0.6	1.5	1.6	2.8	4.4	6.9	6.9
	BR			2.9	17.2	22.9	29.1	34.2	43.1	50.9
	揮散性物質	1N NaOH	--	<0.1	0.1	0.5	2.2	7.5	12.9	
		ポリウレタンフォーム	--	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	
	合計			101.1	99.7	101.8	100.0	98.0	94.5	95.6
[^{14}C]	土壌	OS	OS-1	93.8	58.5	44.5	24.6	14.0	6.5	5.4
			OS-2	1.6	18.9	21.3	25.5	17.7	11.7	9.3
			合計	95.4	77.4	65.8	50.1	31.7	18.2	14.7
		WS	WS-1	0.2	0.2	0.2	0.1	0.3	0.2	0.1
			WS-2	0.2	1.8	1.6	2.1	2.2	2.3	1.7
			合計	0.4	2.0	1.8	2.2	2.5	2.5	1.8
	BR			3.2	18.5	22.7	29.5	31.8	30.7	30.7
	揮散性物質	1N NaOH	--	1.2	3.6	10.4	24.3	37.6	42.1	
		ポリウレタンフォーム	--	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	
	合計			99.0	99.1	93.9	92.2	90.3	89.0	89.3

画分		分布率、%					
		^{14}C 処理量に対する%					
		[^{14}C] 標識体			[^{14}C] 標識体		
		3日	31日	91日	3日	31日	91日
腐植画分	フルボ酸	6.4	15.4	14.3	4.3	4.2	4.6
	(FA-OS 画分)	(1.1)	(4.3)	(5.2)	(0.7)	(0.6)	(0.7)
	フミン酸	27.0	14.7	19.3	28.8	19.0	19.4
	フミン	66.6	70.0	66.5	67.0	76.9	76.1

OS 画分は速やかに減少し、91 日後に 15~25% となり、WS 画分は 7% 未満であった。BR 画分は [^{14}C] 標識体で 91 日後に 50.9% となったが、

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬㈱にある。

[^{14}C] 標識体では 31 日後に 31.8%と最高値を示したのち減少した。それらについて腐植分画を行った結果、大部分 (66~77%) がフミン画分に分布した。

1N NaOH 捕集物は 91 日後に [^{14}C] 標識体で 12.9%、[^{14}C] 標識体で 42.1%生成し、その 99%は塩化バリウムで沈殿となり $^{14}\text{CO}_2$ であることが確認された。揮散性有機物は検出されなかった。

高知土壌の各時点における分布および BR 画分を更に腐植分画を行った結果を次表に示す。

標識化合物	画分		^{14}C 処理量に対する代謝物含有率、%								
			0日	3日	7日	14日	30日	62日	91日	183日	
[^{14}C]	土壌	OS	OS-1	99.4	84.2	64.0	40.0	17.8	9.0	6.4	4.0
			OS-2	0.2	6.7	12.2	13.4	10.3	7.3	8.4	8.6
			合計	99.6	90.9	76.2	53.4	28.1	16.3	14.8	12.6
		WS	WS-1	0.2	1.8	3.9	6.5	1.2	0.3	0.2	0.2
			WS-2	0.1	0.5	2.0	5.3	10.3	11.0	9.1	8.1
			合計	0.3	2.3	5.9	11.8	11.5	11.3	9.3	8.3
	BR		0.8	5.4	16.0	24.7	42.4	39.8	38.0	32.6	
	揮散性物質	1N NaOH	--	0.2	1.7	5.7	14.9	24.0	29.2	39.8	
		ホリウレタンフォーム	--	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	
	合計		100.7	98.8	99.8	95.6	96.9	91.4	91.3	93.3	
[^{14}C]	土壌	OS	OS-1	101.5	76.7	56.2	27.3	13.3	8.3	5.7	3.8
			OS-2	0.1	3.6	3.2	2.2	1.1	0.8	0.6	0.6
			合計	101.6	80.3	59.4	29.5	14.4	9.1	6.3	4.4
		WS	WS-1	0.2	0.3	0.4	0.6	0.4	0.2	0.2	0.1
			WS-2	--	0.8	1.3	1.8	1.6	1.3	1.2	1.1
			合計	0.2	1.1	1.7	2.4	2.0	1.5	1.4	1.2
	BR		0.9	7.7	12.7	22.7	21.3	16.4	18.7	14.6	
	揮散性物質	1N NaOH	--	6.6	22.1	42.7	55.1	63.0	67.2	72.2	
		ホリウレタンフォーム	--	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	
	合計		102.7	95.7	95.9	97.3	92.8	90.0	93.6	92.4	

画分		分布率、%					
		(^{14}C 処理量に対する%)					
		[^{14}C] 標識体			[^{14}C] 標識体		
		7日	91日	183日	7日	91日	183日
腐植画分	フルボ酸	16.0	20.1	16.6	15.2	6.1	12.7
	(FA-OS 画分)	(1.8)	(3.3)	(2.0)	(0.3)	(0.1)	(0.1)
	フミン酸	22.2	25.0	24.8	24.4	18.9	17.3
	フミン	61.8	54.9	58.6	60.4	75.1	70.1

OS 画分は速やかに減少し、183 日後に 4~13%となり、WS 画分は 8%未満であった。BR 画分は 14~30 日後に最高値を示したのち両標識体とも減少

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬㈱にある。

した。それらについて腐植分画を行った結果、大部分（55~75%）がフミン画分に分布した。

$^{14}\text{CO}_2$ は183日後に [^{14}C] 標識体で約40%、 [^{14}C] 標識体で72%となった。揮散性有機物は検出されなかった。

(2) 嫌氣的畑地条件

標識化合物	画分		^{14}C 処理量に対する代謝物含有率、%								
			茨城土壤				高知土壤				
			0日	7日	14日	28日	0日	7日	14日	28日	
[^{14}C]	土壤	OS	OS-1	98.7	92.9	89.4	87.6	98.4	93.5	92.7	89.4
			OS-2	0.2	2.2	3.4	3.4	0.1	1.5	1.9	2.6
			合計	98.9	95.1	92.8	91.0	98.5	95.0	94.6	92.0
		WS	WS-1	0.3	0.8	0.4	0.8	1.0	1.3	1.1	1.0
			WS-2	<0.1	0.1	0.1	0.1	<0.1	<0.1	<0.1	0.1
			合計	0.3	0.9	0.5	0.9	1.0	1.3	1.1	1.1
	BR		1.8	6.2	7.0	9.2	1.0	4.0	5.5	8.3	
	揮散性物質	1N NaOH	--	<0.1	<0.1	<0.1	--	0.3	0.2	0.4	
		ホリウレタンフォーム	--	<0.1	<0.1	<0.1	--	<0.1	<0.1	<0.1	
	合計		101.0	102.2	100.3	101.1	100.5	100.6	101.4	101.8	

嫌氣的条件下では高知土壤で28日後に $^{14}\text{CO}_2$ の発生が28日後に0.4%みられたが、両土壤とも大部分がOS画分に分布し、BR画分の生成も28日後で8.3~9.2%と少なかった。

(3) 滅菌畑地条件

標識化合物	画分		^{14}C 処理量に対する代謝物含有率、%								
			茨城土壤				高知土壤				
			0日	7日	14日	28日	0日	7日	14日	28日	
[^{14}C]	土壤	OS	OS-1	96.8	95.6	96.1	95.5	99.8	98.2	97.0	96.2
			OS-2	0.3	0.4	0.3	0.3	0.1	0.2	0.2	0.3
			合計	97.1	96.0	96.4	95.8	99.9	98.4	97.2	96.5
		WS	WS-1	0.6	0.5	0.1	0.1	0.1	0.1	0.2	0.2
			WS-2	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1
			合計	0.6	0.5	0.1	0.1	0.1	0.1	0.2	0.2
	BR		3.6	3.8	3.7	5.0	0.9	2.0	2.7	3.4	
	合計		101.3	100.3	100.2	100.9	100.9	100.5	100.1	100.1	

滅菌条件では両土壤とも分解傾向がみられなかった。

2) 代謝物の同定

OS画分およびWS画分中の ^{14}C 代謝物は好氣的畑地条件下で、嫌氣的畑地条件下で検出され、滅菌条件下では代謝物が検出されなかった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬㈱にある。

3) 代謝物の定量

(1) 好氣的畑地条件

茨城土壤における抽出性画分（OS、WS 画分）中の代謝物の分析結果を次表に示す。

標識化合物	代謝物		画分	¹⁴ C 処理量に対する代謝物含有率、%							
	No.	同定		直後	3日	7日	14日	31日	63日	91日	
[¹⁴ C]	抽出性代謝物			98.2	82.5	78.8	70.4	61.6	43.9	31.8	
		P-10	トlfエンピラト*		94.7	45.5	29.3	18.8	10.1	5.5	3.6
		その他			2.3	5.1	3.2	4.5	4.8	6.9	7.6
[¹⁴ C]	抽出性代謝物			95.8	79.4	67.6	52.3	34.2	20.7	16.5	
		P-10	トlfエンピラト*	OS	92.5	53.8	39.6	20.8	8.1	4.5	3.9
	その他			1.7	4.9	4.4	2.0	2.4	2.9	2.3	

-- : 検出せず

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬㈱にある。

高知土壌における抽出性画分（OS、WS 画分）中の代謝物の分析結果を
下表に示す。

標識 化合物	代謝物		画分	¹⁴ C 処理量に対する代謝物含有率、%							
	No.	同定		直後	3日	7日	14日	30日	62日	91日	183日
[¹⁴ C]	抽出性代謝物			99.7	93.2	82.1	65.2	39.6	27.6	24.1	20.9
		P-10 トルフェンピラト	OS	98.1	64.3	37.4	23.6	10.2	6.0	4.8	3.3
		その他		1.6	4.7	2.1	1.9	7.6	7.1	7.1	4.4
	[¹⁴ C]	抽出性代謝物			101.8	81.4	61.1	31.9	16.4	10.6	7.7
		P-10 トルフェンピラト	OS	101.1	63.1	43.6	21.7	10.1	6.9	5.1	3.0
	その他		0.7	2.7	2.6	2.7	2.9	1.9	1.7	1.8	

-- : 検出せず

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬㈱にある。

茨城土壌における代謝物のトルフェンピラド換算濃度を次表に示す。

標識 化合物	代謝物		トルフェンピラド換算濃度、 $\mu\text{g/g}$						
	No.	同定	直後	3日	7日	14日	31日	63日	91日
[¹⁴ C]									
	P-10	トルフェンピラド	0.714	0.343	0.221	0.142	0.076	0.041	0.027
[¹⁴ C]									
	P-10	トルフェンピラド	0.691	0.402	0.296	0.155	0.061	0.034	0.029

高知土壌における代謝物のトルフェンピラド換算濃度を次表に示す。

標識 化合物	代謝物		トルフェンピラド換算濃度、 $\mu\text{g/g}$							
	No.	同定	直後	3日	7日	14日	30日	62日	91日	183日
[¹⁴ C]										
	P-10	トルフェンピラド	0.743	0.487	0.283	0.179	0.077	0.045	0.036	0.025
[¹⁴ C]										
	P-10	トルフェンピラド	0.749	0.468	0.323	0.161	0.075	0.061	0.038	0.022

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬㈱にある。

(2) 嫌氣的畑地条件

抽出性画分（OS、WS 画分）中の代謝物の分析結果を下表に示す。

標識 化合物	代謝物		¹⁴ C 処理量に対する代謝物含有率、%							
			茨城土壌				高知土壌			
			No.	同定	直後	7日	14日	28日	直後	7日
[¹⁴ C]	抽出性代謝物		99.2	96.0	93.3	91.9	99.5	96.3	95.7	93.1
	P-10	トルフェンピラド	97.9	92.8	89.2	87.7	97.5	87.6	87.2	82.7
	その他		1.3	1.8	1.7	1.9	2.0	2.9	2.6	2.9

--: 検出せず、あるいは処理量の 0.1%未満

(3) 滅菌畑地条件

抽出性画分（OS、WS 画分）中の代謝物の分析結果を下表に示す。

標識 化合物	代謝物		¹⁴ C 処理量に対する代謝物含有率、%							
			茨城土壌				高知土壌			
			No.	同定	直後	7日	14日	28日	直後	7日
[¹⁴ C]	抽出性代謝物		97.7	96.5	96.5	95.9	100.0	98.5	97.4	96.7
	その他		2.0	2.0	1.7	2.0	1.5	1.9	1.9	2.3

滅菌条件では代謝物が全く検出されず、分解しないことが明らかとなった。

以上の結果を基に算出した土壌中におけるトルフェンピラドの半減期を次表に示す。

土壌	標識 化合物	好氣的		嫌氣的
		半減期	90%減衰期	半減期
茨城土壌	[¹⁴ C]	3日	34日	/
	[¹⁴ C]	5日	29日	179日*)
高知土壌	[¹⁴ C]	5日	32日	/
	[¹⁴ C]	5日	30日	127日*)

*) 外挿値

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬㈱にある。

結論： 好氣的畑地条件下の土壤におけるトルフェンピラドは半減期 3~5 日、90%減衰期 29~34 日で分解し、

嫌氣的および滅菌畑地条件下ではトルフェンピラドの分解がほとんどないか全くなかったことから、土壤中の好氣的微生物等により速やかに分解されることが判明した。

土壤における代謝は、本試験に使用した [^{14}C] および [^{14}C] トルフェンピラドにより解明できたものと考えられる。

以上の結果から、土壤における推定代謝経路は以下の通りとなった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬㈱にある。

トルフェンビラドの土壌における推定代謝経路図

4. 水中運命

加水分解運命試験の省略理由：

下記に記載の通り、25℃における加水分解性の半減期は1年以上のため加水分解運命試験は不用である。

(1) 加水分解試験

(資料 EF-1)

試験機関：㈱三菱化学安全科学研究所

報告書作成年：1996年

供試化合物：非標識トルフェンピラド（純度 ）

供試水溶液：pH 4；Kolthoff and Vleeschouwer のクエン酸塩緩衝液

pH 7；Clark and Lubs のリン酸緩衝液

pH 9；Clark and Lubs のホウ酸緩衝液

緩衝液は、0.25 μ m のミポフィルターでろ過・滅菌した。

試験溶液の調製前に窒素で5分間パージして酸素を除去した。

試験方法：OECD テストガイドライン 111 「pH の関数としての加水分解」に準拠し、加水分解性を評価した。

試験濃度；水溶解度 (0.087 mg/L) の 1/2 以下の 0.04 mg/L に設定した。

試験溶液；トルフェンピラド 4 mg/L のエタノール溶液を調製し、この溶液を緩衝液で 100 倍希釈して 0.04 mg/L 緩衝液の試験溶液（エタノール 1% 含有）とした。

試験容器；100mL 容のフラスコ（パイレックスガラス製）

試験温度；50±0.1℃

試験期間；暗所、5日間

分析方法；試験溶液 8 mL をアセトニトリルで 10 mL 定容としたのち、UV 検出器付 HPLC の濃縮カラムに 2 mL 注入し、バルブ切り替えにより分析カラムに導入しトルフェンピラド濃度を測定した。各緩衝液の初期濃度における回収率は 101.5~102.6% であった。

結果：

pH	試験温度 (°C)	試験期間 (日)	トルフェンピラド 残存率 (%)	25℃における推定半減期
4.0	50	5	102.4	1年以上
7.0	50	5	101.1	1年以上
9.0	50	5	99.5	1年以上

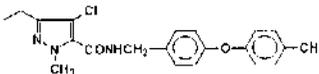
OECD テストガイドラインでは、50℃、5日における予備試験で被験物質残存率が90%以上のとき、25℃における被験物質の半減期は1年以上と評価されることから、トルフェンピラドは加水分解に対して安定であり、本試験を必要としないと判断した。

(2) 水中光分解運命試験

(資料 EF-2)

試験機関：㈱三菱化学安全科学研究所

報告書作成年：1999年

供試化合物：[^{14}C]トルフェンピラド  比放射能：
放射化学的純度：

供試水：[精製水] 茨城県 水道水を Milli-Q SP 型超純水製造装置により
精製、ろ過滅菌した。比抵抗 $18.3 \text{ M}\Omega \cdot \text{cm}$

[河川水] 利根川下流 より採取し、試験溶液調製前に浮遊物
をろ紙 No.7 [東洋濾紙] でろ過した。

採取日：1998年5月31日、pH：6.8 [23.3°C]

光源：キセノンアークランプ (1.5 kW) を光源とし、Special UV フィルター (屋
外条件用で 290 nm 波長立上がり) により 290 nm 以下の紫外光の成分を
除いた。

[光強度] $765 \text{ W/m}^2 \pm 10\%$ (波長範囲 300~800 nm)

試験方法：「農薬の物理的・化学的性状に関する試験方法」(1997) に準じた。

試験溶液濃度： $20 \mu\text{g/L}$ (水溶解度の 1/4)、0.5%アセトニトリル含有

繰り返し数：各試験区とも2連で実施

試験液量：50 mL

試験容器：50 mL 容石英ガラスセル (滅菌)

試験温度： $25 \pm 1^\circ\text{C}$

試験期間：58 時間

分析時点：0、24、34、48、58 時間

分析：各時点の試験溶液中の放射能を測定した。水相を pH 1 に調整後、
酢酸エチルで2回抽出し、抽出物中の ^{14}C -トルフェンピラドを高分離能シカゲル薄層コマ
トグラフにより分離し、イメージプレートに露光した。そのうち、バイオイメージングア
ナライザーでデータ処理し、定量した (TLC/BAS 法)。

TLC 条件 I：展開溶媒；酢酸エチル/ヘキサン=3:1 [同定・定量]

TLC 条件 II：展開溶媒；酢酸エチル/ヘキサン/酢酸=85/30/5 [同定]

分解速度：上記の TLC 条件 I で得られた結果より、速度定数及び半減期を算
出した。

分解物の同定：10%を超えた分解物について同定した。

TLC 条件 I で分解物の ^{14}C スポットと標品の Rf 値を比較して分解物
の ^{14}C スポットに近い標品を選択し、それらについて、TLC 条件 II で
展開し、 ^{14}C スポットと標品のコマトグラフにより同定した。

分解物の定量：TLC 条件 I による TLC/BAS コマトグラフの ^{14}C スポットの放射能総
百分率から算出した。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬㈱にある。

結 果：

分解速度 : トルフェンピラドの水中での光分解における経時的な残存率、速度定数、半減期を下表に示す。

試験水	トルフェンピラドの残存率 (%)				速度定数、k (hr ⁻¹)		半減期 (hr)		北緯 35° , 春、 太陽光換算
	24 hr	34 hr	48 hr	58 hr	測定値	平均値	測定値	平均値	
精製水	65.8	54.0	41.1	32.7	0.0192	0.0197	36.1	35.2	11.4 日
	60.4	48.7	39.1	30.5	0.0201		34.5		
河川水	66.3	55.3	42.3	34.6	0.0183	0.0198	37.9	35.0	11.3 日
	60.9	48.0	41.6	26.7	0.0213		32.5		

対照区(遮光)では 58 時間後の平均残存率が精製水で 90.2%、河川水で 89.6%とほとんど分解が認められなかった。

58 時間後の回収率は、光照射区の精製水で 90.6%、河川水で 94.4%であり、対照区(遮光)では精製水で 92.3%、河川水で 94.2%であった。

分解物の同定：

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬㈱にある。

TLC 条件 1 による初期放射能に対する割合を下表に示す。

	経過時間 (hr)	¹⁴ C 添加量に対する割合、% (光照射区)												
		水相中回収率	水相中抽出率										P-10	P-11
精製水	0	100.0	100.0										97.8	
	24	91.4	89.6										61.6	
	34	87.3	83.5										50.2	
	48	86.5	80.4										39.2	
	58	87.1	79.0										31.0	
河川水	0	100.0	100.0										97.7	
	24	97.3	91.7										62.2	
	34	94.5	86.0										50.4	
	48	93.8	82.2										40.9	
	58	93.6	79.5										30.0	

— : 検出せず

	経過時間 (hr)	¹⁴ C 添加量に対する割合、% (遮光区)												
		水相中回収率	水相中抽出率	P-1	P-2	P-3	P-4	P-5	P-6	P-7	P-8	P-9	P-10	P-11
精製水	0	100.0	99.9										97.2	
	58	92.3	92.5										89.1	
河川水	0	100.0	100.0										97.5	
	58	94.2	94.1										87.3	

— : 検出せず

光照射区 :

精製水 ; トルフェンピラト[®] が試験開始時に 97.8%、58 時間後は 31.0% となった。

河川水 ; トルフェンピラト[®] が試験開始時に 97.7%、58 時間後は 30.0% となった。

遮光区 :

精製水 ; トルフェンピラト[®] が試験開始時に 97.2%、58 時間後は 89.1% となった。

河川水 ; トルフェンピラト[®] が試験開始時に 97.5%、58 時間後は 87.3% となった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬㈱にある。

トルフェンピラドの主要な水中光分解経路は、

以上の結果を基に、水中のトルフェンピラドの光照射下における分解経路は以下の通りとなった。

トルフェンピラドの推定水中光分解経路図

5. 土壌吸着性

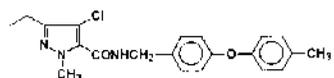
(1) 土壌吸着性試験

(資料 EF-3)

試験機関：㈱三菱化学安全科学研究所

報告書作成年：1998年

供試化合物：[^{14}C]トルフェンピラド



比放射能：
放射化学的純度：

供試土壌：石川土壌、高知土壌、北海道十勝土壌、茨城土壌。

土性を以下に示す。

試験土壌	石川土壌	高知土壌	北海道十勝土壌	茨城土壌*
採取場所	石川県農試内	日植防高知試験農場内	北海道立十勝農試内	日植防研究所内
土壌群名	グライ土	灰色低地土	黒ボク土	黒ボク土
土性	軽埴土	軽埴土	埴壤土	軽埴土
有機炭素含有率 (%)	1.02	1.33	2.21	4.77
pH H_2O 中	7.1	6.5	5.7	6.8
1N KCl 中	5.8	6.4	5.8	6.4
陽イオン交換容量 (meq/100g)	20.3	10.2	11.7	36.5
リン酸吸収係数	720	370	1330	2080
粒子分布 (%)				
砂	53.1	47.6	57.1	33.6
シルト	19.6	27.2	21.5	29.3
粘土	27.3	25.2	21.4	37.1

*：火山灰土壌

方法：「農薬の物理的・化学的性状に関する試験方法」(1997)に記載の「OECD テストガイドライン 106」(1981)に準じた。

1) 供試土壌の調製

2 mm 以下に篩い分けした土壌を使用直前に土壌量の約 2 倍の水で平衡化(室温下、24 時間以上 60 回/分で水平振とう混合)した。

2) 試験溶液および土壌量の設定

ガイドラインでは、試験の最高濃度は 0.01M CaCl_2 飽和溶解度の 1/2 あるいは 5 mg/L を超えない濃度に設定することとなっているが、トルフェンピラドの水溶解度が 87 $\mu\text{g/L}$ であることから、40 $\mu\text{g/L}$ で実施することにした。スクリーニング試験はその 1/5 で実施することとなっているが、吸着後の水相中濃度が非常に低くなり測定が困難になるものと推定されたことから 1/2 の濃度の 20 $\mu\text{g/L}$ で実施することにした。また、ガイドラインでは、通常、試験液/土壌比が 5/1 となっているが水溶解度が極端に低く、吸着後の水相中トルフェンピラドの測定が困難であることが予想されたことから試験液/土壌比を 50/1 に変更して実施した。

3) スクリーニング試験

試験溶液濃度 : 20 $\mu\text{g/L}$ 0.01M CaCl_2 溶液

試験液量/土壌量 : 50 mL/1 g

試験温度 : 25 \pm 1 $^\circ\text{C}$

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬㈱にある。

振とう速度 : 100 min⁻¹
 吸着段階 : 16 時間、1 回
 脱着段階 : 吸着段階後の土壌を 16 時間、2 回
 分析 (水相) : 吸着・脱着段階後に土壌粒子を遠心分離 (2500 min⁻¹) し、上澄液 (水相) 中の放射能を測定した。水相を酢酸エチル抽出し、抽出物中の ¹⁴C-トルフェンピラドを高分離能薄層クロマトグラフィーにより分離し、イメージングプレートに露光した。そののち、バイオイメージングアナライザーでデータ処理し、定量した。

結 果 :

試験土壌	吸着率 (%)	脱着率 (%)
石川土壌	96.8	4.9
高知土壌	93.7	8.3
北海道十勝土壌	93.6	8.6
茨城土壌	93.5	5.2

吸着率は 93.5~96.8%、脱着率は 4.9~8.6%であった。

なお、本スクリーニング試験はトルフェンピラドの水溶解度の約 1/4 (20 μg/L) で、試験液量/土壌量の比をガイドラインの 5/1 を 50/1 に変更して行って結果を得たが、次の段階の高次試験をガイドライン通りに実施した場合、最高濃度群は水中濃度が本スクリーニング試験の 1/5 まで低下することが予想され、使用した分析法による定量性の良好な範囲内となるが、2番目の濃度群 (最高濃度群の 1/5) では定量性が悪くなり、3番目の濃度群 (最高濃度群の 1/25) では測定が不可能となることが判った。それゆえ、高次試験は、試験濃度を水溶解度の 1/2、1/4、1/8、1/16 で、試験液量/土壌量の比を 50/1 に変更することにより、実施可能と推測されたが、OECD ガイドラインによれば溶解度の低い化合物についても濃度範囲は最低でも 1桁は必要であると記載されており、この規定に沿った試験を実施することは困難であると判断された。

以上のように、トルフェンピラドの高次試験が困難なことが判明したことから、本スクリーニング試験の吸着段階の吸着率を用いて、吸着係数 (K_F^{ads}) および各土壌中の有機炭素に対する吸着係数 ($K_F^{ads_{oc}}$) を算出した。

試験土壌	K_F^{ads}	$K_F^{ads_{oc}}$
石川土壌	1,522	149,220
高知土壌	747	56,130
北海道十勝土壌	726	32,830
茨城土壌	722	15,140

K_F^{ads} は 722~1,522 で、 $K_F^{ads_{oc}}$ は 15,140~149,220 (平均 63,330) であった。

代謝・分解まとめ

トルフェンピラドの哺乳動物、植物、土壌における代謝、分解、残留の要約は以下の通りであり、代謝経路を 445 頁に、結果の概要を 446～448 頁に表示した。

(1) 動物

^{14}C 標識トルフェンピラドをラットに単回経口投与（低用量区：1 mg/kg、高用量区：20 mg/kg）した結果、全血中 ^{14}C 濃度推移は最高血中濃度到達時間（ T_{\max} ）が低用量区で 2～6 時間後、高用量区で 4～12 時間後となり、その後、見かけの半減期として両用量区とも 11～28 時間で減少した。血中 ^{14}C 濃度対時間曲線下面積 [AUC(0-∞)] は高用量区が低用量区の 14～21 倍を示し、投与量にほぼ依存した。尿・糞排泄試験において、親化合物（トルフェンピラド）は尿、血漿、肝臓、白色脂肪中で検出されず、糞中で 4.1～15.1% 検出された。投与 168 時間後までの尿・糞排泄率は 90% 以上であり、排泄は速やかであった。呼気には検出されず、尿・糞中排泄は雌雄間、2 種の標識体間にほとんど差がみられなかった。胆汁排泄試験において、胆汁中に 48 時間で 51～70% が排泄され、トルフェンピラドがわずかに検出（0.7% 以下）され、吸収されたトルフェンピラドはほとんどが代謝をうけるものと考えられる。

胆汁排泄試験による胆汁および尿中排泄率と体内残存率の合計から体内吸収率を求めた結果、低用量区で 69～73%、高用量区で 58～78% となった。なお、胆汁排泄試験では胆汁を体外に導出していることから、実際の吸収率はこれ以上であると推定される。

以上の結果、吸収されたトルフェンピラドは速やかに代謝を受け、少量が尿中に、ほとんどが胆汁経由で糞中に排泄された。

組織内濃度推移は T_{\max} 以降多くの組織で血中濃度の減衰に比例したが、投与後 4～12 時間においては肝臓、腎臓、褐色脂肪などの濃度が高く、血漿中濃度の数倍から 40 倍を示し、また、褐色脂肪および甲状腺は雌が雄よりも 2～3 倍高い濃度を示した。しかし、これらの組織は 168 時間までに速やかに減衰し、残留性はみられなかった。

ラットに14日間反復投与(1 mg/kg/day)した結果、各投与24時間後の血中濃度推移は2~3回投与まで増加し、その後ほぼ一定の濃度で推移した。雌雄とも血中濃度が速やかに定常状態に達し、その濃度も低いことから、反復投与による蓄積傾向はみられなかった。

1、7、14回反復投与後の尿・糞代謝物のパターンにはほとんど変化がなく、性差および標識体間の差が少なく、投与回数が増えるに従い糞中代謝物量の増加が認められたが各代謝物の分布割合には変化がなかった。また、反復投与における尿・糞・血漿中代謝物のパターンおよび分布割合は単回投与の結果と類似し、反復投与による顕著な変化はみられなかった。

ラット繁殖試験(資料 T-24)の哺育期間中の乳児に影響がみられたことから、妊娠末期または哺育期のラットに投与し、胎盤または乳汁を介した移行性を調べた。その結果、顕著な胎盤透過性はみられなかったが、乳汁移行性がみられた。

(2) 植物

なす、キャベツ、ももを用い、2種の¹⁴C標識トルフェンピラドを処理後の吸収・移行・代謝性を調べた。

水耕法(根浸漬)によるなすの根部からの¹⁴C吸収量は、4日後に約55%で、根から上部への移行量は茎に0.2%(植物体中の分布率0.4%)、葉に0.4%(0.7%)であった。また、なすの葉において先端方向への移行が観察されたが、葉の基部方向へは移行せず、キャベツにおける外葉から結球への移行もみられなかった。一方、抽出性代謝物は吸収されてから代謝を受けて生成したものと推定されることから、それらの合計量がほぼ吸収量と推測されるが、その量はなすの28日後の処理葉および果実でそれぞれ¹⁴C処理量の5~7%および5%、キャベツの28日後の外葉で¹⁴C残留量の32~40%、ももの56日後の処理葉および果実でそれぞれ¹⁴C残留量の47~55%および1.6~1.8%であった。

なすの葉および果実に塗布処理した結果、親化合物は28日後に¹⁴C処理量の90%以上(葉で132~206ppm、果実で0.76~0.80ppm)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日本農薬㈱にある。

キャベツの小結球期に散布処理した結果、親化合物は 28 日後の外葉で ^{14}C 残留量の 50~55% (4.6~4.7ppm)、結球で <0.1~0.4% (<0.01~0.03ppm)であった。結球で検出された親化合物は移行したのではなく散布時に付着し、残留したものであった。植物体中の抽出可能な主代謝物は外葉で

であり、結球で
であった。

ももの葉および果実に散布処理した結果、親化合物は 56 日後の葉で ^{14}C 残留量の 20~28% (12.4~21.1ppm)、56 日および 53 日後の果実で 7.2%および 4.3% (99%以上が果皮に分布、果肉 <0.01ppm)であった。植物体中の抽出可能な主代謝物は

であり、果肉で
であった。

キャベツおよびももにおいて、

植物代謝試験における主残留物は、親化合物(トルフェンピラド)であった

の作物残留試験を実施した。

作物残留に係る保留基準(環境省告示第三十五号、(平成 14 年 4 月 24 日付官報))
による規制対象化合物は、親化合物(トルフェンピラド)となった。

(3) 土 壤

^{14}C 標識トルフェンピラドを用いた好氣的畑地条件下の畑地土壌（茨城軽埴土および高知軽埴土）における代謝試験で親化合物（トルフェンピラド）は半減期が3~5日、90%減衰期が29~34日と速やかに消失した。嫌氣的畑地条件下では半減期が127~179日（推定値）と遅く、滅菌畑地条件下ではほとんど分解がみられず、土壌中の好氣的微生物等による分解が示唆された。茨城土壌91日および高知土壌183日後の主代謝物は無機化した CO_2 で [^{14}C]標識体で42%、72%、[^{14}C]標識体で13%、40%生成し、次いで

生成し

た。

一方、土壌残留試験の容器内試験では親化合物（トルフェンピラド）の半減期が6~34日であり、親化合物と代謝物（ ）の合計値の半減期は9~47日であった。

圃場試験では、親化合物（トルフェンピラド）の半減期が3~5日であり、親化合物と代謝物（ ）の合計値の半減期は3~10日であった。

トルフェンピラドは土壌における半減期が比較的短く、水溶解度が0.087 mg/Lと低く、土壌吸着係数 ($K_{\text{F}}^{\text{ads}}$) が63,330と非常に大きい。

(4) 水 中

加水分解性 (EF-1) は、pH4.0、7.0、9.0で安定であった。

水中光分解性 (EF-2) は、半減期35日とすみやかに分解した。

動物および植物中のトルフェンピラドの主代謝経路は植物中の微量代謝物を除き、同様であると考えられる。したがって、代謝物の毒性も親化合物を用いた一連の毒性試験において確認されたものと考えられる。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬株式会社にある。

トルフェンピラドの動植物等における代謝分解経路図

代謝物一覧表 (1)

代謝物 (ラット)		経口単回 1 mg/kg		経口単回 20 mg/kg		経口単回 1 mg/kg		経口単回 1 mg/kg																																						
		排泄率 (%)	代謝物 (%)	排泄率 (%)	代謝物 (%)	排泄率 (%)	代謝物 (%)	排泄率 (%)	代謝物 (%)																																					
経口投与量	経口投与回数	胆汁排泄		胆汁排泄		胆汁排泄		胆汁排泄																																						
		胆汁排泄率 (%)	代謝物 (%)	胆汁排泄率 (%)	代謝物 (%)	胆汁排泄率 (%)	代謝物 (%)	胆汁排泄率 (%)	代謝物 (%)																																					
経口投与量	経口投与回数	胆汁排泄率 (%)	代謝物 (%)	胆汁排泄率 (%)	代謝物 (%)	胆汁排泄率 (%)	代謝物 (%)	胆汁排泄率 (%)	代謝物 (%)																																					
1.7	1.4	2.2	66.9	2.0	60.2	1.9	70.9	1.5	67.4	61.6	2.5	1.9	52.5	3.0	1.4	2.4	48.4	1.8	25.9	66.9	0.7	1.2	49.3	0.7	0.9	1.8	26.7	3.3	80.3	2.8	96.3	35.9	1.9	31.9	2.7	86.3	1.7	96.8	58.2	1.3	32.0	2.1	80.8	1.7	88.5	40.2
91.0	98.9	2.3	82.8	2.0	82.9	1.9	82.1	1.5	82.3	83.6	2.8	7.6	54.7	3.0	6.2	2.5	67.8	1.8	53.4	69.5	2.3	8.2	51.3	0.7	3.5	18.292	3.4	95.1	2.9	102.8	43.9	1.9	35.0	2.7	96.4	1.7	97.2	42.0	1.3	96.2	2.2	90.3	1.8	99.2	41.9	
91.0	98.9	85.1	85.9	85.0	83.8	72.7	64.0	70.3	55.2	80.1	55.5	41.0	95.5	37.9	99.1	98.9	42.0	37.5	92.5	101.0	44.9																									

空欄は検出せず、あるいは検出限界以下。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本興業㈱にある。

代謝物一覧表 (3)

代謝物	植物										土壌				水中光分解		加水分解														
	14C分布率,% (トルフエンピラド換算濃度, μg/g)										14C処理量に対する割合,%				14C処理量に対する割合 合,%		50℃の残存 率,%														
	キヤベツ										好気的埋蔵条件		好気的埋蔵条件		高知土壌		高知土壌														
	外葉	結球	外葉	結球	葉	根	葉	根	葉	根	91日	183日	28日	28日	茶畑	高知土壌	茶畑	高知土壌	照射区	遮光区	照射区	遮光区	照射区	遮光区	照射区	遮光区					
経過期間																															
14C標識化合物																															
酸化合物	49.27	0.41	0.0341	55.0	4.63	28.09	21.06	4.28	6.24	0.02	0.0003	20.0	12.4	7.2	34.7	3.6	3.9	3.3	3.0	87.7	82.7	93.9	94.4	30.1	38.0	89.9	87.9	102.4	101.1	99.5	
トルフエンピラド																															
非抽出物	15.47	0.47	1.51	0.12	5.1	0.43																									
抽出物	97.20	0.22	2.80	0.23	99.7	6.39	21.5	23.6	0.28	0.23	0.04	0.01	1.60	3.9	0.4	4.9	50.9	30.7	32.6	14.6	9.2	8.3	5.0	3.4							
合計 (回収率)																															
米固定	31.96	2.64	6.88	0.06	39.6	3.33	54.84	41.11	1.06	2.04	0.78	0.11	47.1	22.2	1.2	6.1	12.9	42.1	39.8	72.2	4.1	10.3	1.9	2.2							
14CO2																															
揮発抽出物																															
合計 (回収率)																															

空欄は検出せず、あるいは検出限界以下。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本農薬㈱にある。

＜トルフエンピラドの開発年表＞