

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

IX. 動植物、土壤および光等における代謝・分解

[代謝・分解試験成績一覧表]

資料 No (頁)	試験の種類	供試動 植物等	投与方法・処理量	結果の概要	試験機関 (報告書作成年)
M-1. 1 (245)	動物における血液中動態	ラット	標識ビ'フェントリンを 4. または 35mg/kg 1 回経口投与	4~6 時間で最高値。 放射能の減少は徐々で、24 および 48 時間でも検出可能。	FMC 生物化学研究所 (1986)
M-1. 2 (247)	動物における排泄、組織内分布	ラット	標識ビ'フェントリン 5mg/kg を 1 回経口投与。	組織内残留は微量。 48 時間後の排泄率： 糞中 76~79%；尿中 6~7% 7 日後の排泄率：91~92%	FMC 生物化学研究所 (1983)
M-1. 3 (251)	動物における吸収、排泄、分布	ラット	標識ビ'フェントリン 4 または 35mg/kg, 1 回経口投与。 非標識ビ'フェントリン 4mg/kg を 14 日間連続投与後、15 日目に 標識ビ'フェントリンを 1 回投与。	4mg/kg 1 回投与後の排泄率： 糞中 73~83%、尿中 13~20% 35mg/kg 1 回投与後の排泄率： 糞中 69~71%、尿中 22% 4mg/kg 連続投与後 48 時間までの排泄率： 糞中 66~73%、尿中 18~25% 7 日後脂肪中に微量な残留	FMC 生物化学研究所 (1986)
M-1. 4 (255)	動物における吸収、排泄、分布	ラット	標識ビ'フェントリン 4 または 35mg/kg, 1 回経口投与した。 非標識ビ'フェントリン 4mg/kg を 14 日間連続投与後、15 日目に 標識ビ'フェントリンを 1 回投与した。	4mg/kg 1 回投与の排泄率： 糞中 74~83%、尿中 9~12% 35mg/kg 1 回投与の排泄率： 糞中 76%、尿中 12% 4mg/kg 連続投与後 48 時間までの排泄率： 糞中 74~84%、尿中 12~14% 7 日後脂肪中に微量な残留がみられた。	動物試験： Hazleton 研究所 放射能分析： Xenobiotic 研究所 (1988)
M-1. 5 (260)	動物における体内分布	ラット	オートラジオラバーを実施。 標識ビ'フェントリン 0.5mg/kg を 1 回経口投与。	標的器官はなし。 24 時間までに大部分排泄。	Huntingdon Research Centre (1986)
M-1. 6 (262)	動物における蓄積性	ラット	標識ビ'フェントリン 0.5mg/kg を 70 日間連続経口投与。155 日間観察。	臓器中の半減期：19~51 日	Huntingdon Research Centre (1986)
M-1. 7 (265)	胆管挿管動物における吸収、排泄	ラット	標識ビ'フェントリンを 雄雄各々 2.5 および 5.0mg/kg を 1 回経口投与した。	総吸収率： 雄：49.8% 雌：35.6%	FMC 生物化学研究所 (1992)
M-1. 8 (269)	動物における排泄物中の代謝物の同定	ラット	標識ビ'フェントリン 4 または 35mg/kg, 1 回経口投与。 非標識ビ'フェントリン 4mg/kg を 14 日間連続投与後、15 日目に 標識ビ'フェントリンを 1 回投与。	72 時間までに尿糞中に大部分が排泄された。	FMC 生物化学研究所 (1986)

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

資料 No (頁)	試験の種類	供試動 植物等	投与方法・処理量	結果の概要	試験機関 (報告書作成年)
M-1. 9 (276)	動物の排泄 物中の代謝 物の同定	ラット	試験 M-1. 4 における排泄物 を 分画し TLC および HPLC で代謝物を同定した。		FMC生物化 学研究所 (1988)
M-1. 10 (282A)	動物におけ る排泄	ヤギ	泌乳中の母動物に 標識ビ'フェントリンを 2mg/kg (50ppm 相当) 每日 2 回、連続 7 日間経口投与。	排泄の主要経路は消化管およ び尿管。 乳中放射能は 4 日で平衡に達 した。	Analytical Bio-Chemistry Laboratories, Inc. (ABC) (1984)
M-1. 11 (282D)	乳中への排 泄	ヤギ	泌乳中の母動物に 標識ビ'フェントリンを 2mg/kg (50ppm 相当) 每日 2 回、連続 7 日間経口投与。	乳中放射能は 4~7 日で平衡 に達した。	FMC生物化 学研究所 (1984)
(282F)	動物代謝のまとめ				
M-2. 1 (283)	植物体内に おける代謝	リンゴ	標識ビ'フェントリン の 476ppm を 3 週間間隔で果実 に 3 回処理。 0, 7, 14, 21 日目に測定。	処理 21 日後で果皮表面に 2%、果皮に 91%、果肉に 7% 放 射能が分布し、皮に局在し果 肉に有意な移行がなかった。 残留物の大部分 (果皮 : 98%、果肉 : 89%) は親化合物 であった。	FMC生物化 学研究所 (1983)
M-2. 2 (286)	植物体内に おける代謝	ワタ	標識ビ'フェントリンを葉および土壤に 1 回 処理。 0, 14, 28 日目および成熟期 に採取。	成熟期処理葉中の 63~65% が 親化合物 土壤からの吸収移行なし。 植物体内の移行なし。	FMC生物化 学研究所 (1986)
M-2. 3 (292)	植物体内に おける代謝	トウモロコシ	標識ビ'フェントリンを葉または苞皮および 土壤にそれぞれ 2 回、1 回、 3 回処理。 0, 7, 14, 30 日目の他にサレ ージ期および成熟期に採取。	土壤、葉面及び苞皮から子実 への移行は認められない。葉 上のビ'フェントリンは徐々に分解。 処理 30 日後の葉中には、65 ~66% の親化合物	FMC生物化 学研究所 (1987)

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

資料 No (頁)	試験の種類	供試動植物等	投与方法・処理量	結果の概要	試験機関 (報告書作成年)
M-3.1 (298)	土壤中に おける代謝	土壤	標識ビ'フェントリン 1ppm を処理後、0, 1, 3, 7, 14, 21日目に採取。	21日後: 親化合物: 86.9% CO_2 : 3.8%	FMC生物化 学研究所 (1984)
M-3.2 (300)	土壤中に おける代謝	土壤	標識ビ'フェントリン 3ppm 処 理後、0, 29, 60, 180 日目 に採取。	半減期: 2~6 カ月	FMC生物化 学研究所 (1984)
M-3.3 (303)	土壤中に おける代謝	土壤	標識ビ'フェントリン 1.1ppm 処理後、0, 30, 61, 120 日目に採取。	半減期: 2~4.5 カ月 120 日後の回収率: 親化合物: 37.7~54.8% CO_2 : 15.6~28.8% (総回収率)	FMC生物化 学研究所 (1984)
M-3.4 (303)	土壤中代謝 物の同定	土壤	標識ビ'フェントリン 処 理後 120 日目に採取。	120 日後の代謝物: 親化合物: 40~59%	FMC生物化 学研究所 (1986)
M-3.5 (309)	嫌気性土壤 中における 代謝	土壤	標識ビ'フェントリン 3ppm を処理後、31, 61 日目に採取。	半減期: 169~204 日 61 日後の代謝物 親化合物: 75.3~79.2%	FMC生物化 学研究所 (1985)
M-3.6 (315)	土壤におけ る吸脱着	土壤	標識ビ'フェントリンを含 む水を 1:100 の割合で土壤 に加え、24 時間振とう。	土壤吸着係数は 4 種の土壤で $K_d = 992 \sim 5429$, $K_{oc} = 1310000 \sim 302000$ である。 ペルメトリンよりも強く吸着し た。 脱着係数は $K_d' = 3342 \sim 11610$ であった。	FMC生物化 学研究所 (1984)
M-3.7 (317)	土壤におけ る吸着	土壤	非標識ビ'フェントリンを含む水を 1:5 の割合で土壤に加え、16 時間振とう。	ビ'フェントリンの大部分が土壤から 検出され、高い吸着性が示さ れた。	株式会社 化学分析コ ンサルタント (2000)
M-3.8 (319)	土壤中にお ける移動	土壤	標識ビ'フェントリンを処理。120 および 180 日後に採取した試料からの 抽出放射能と抽出残分を用 いて土壤 TLC と土壤カラムクロマト を実施。		FMC生物化 学研究所 (1984)
M-4.1 (322)	加水分解	水	遮光条件下、pH 5, 7, 9 の 滅菌緩衝液中で 0~22 日、 および 49 日後の残留量測 定。	有意な加水分解はみられな かった。	FMC生物化 学研究所 (1983)

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

資料 No (頁)	試験の種類	供試動 植物等	投与方法・処理量	結果の概要	試験機関 (報告書作成年)
M-4. 2 (325)	水中光分解	水	標識ビ'フェントリンを 1ppm 含む純水 (30%アセトニトリル含む) に太陽光又は人工光を照射した。人工光では光増感剤添加水でも実施した。 試験溶液は 0~30 日後に HPLC および LSC 分析した。	太陽光、人工光(純水)および人工光(増感剤添加水)での半減期はそれぞれ、254.7 日、11.9 日および 0.31 日。 北緯 35 度太陽光換算値はそれぞれ 230 日、23 日および 0.6 日。	FMC 生物化 学研究所 (1985)
M-4. 3 (332)	水中光分解	水	自然水、滅菌精製水を用い、分析法および試験溶液の調整法を検討。 非標識ビ'フェントリン 0.1 μg/mL 含む試験溶液 (5%アセトニトリル含む) に 25±2°C でキセノン光を照射し、0~7 日後に分析。	推定半減期は自然水で約 12 日、滅菌精製水で約 10 日。 暗所区ではいずれも安定。 ビ'フェントリンの水溶解度が極めて低いため、ガイドラインに従った試験の実施は不可能。	株化学分析コ ンサルタント (2000)
M-4. 4 (336)	光分解	土 壤	標識ビ'フェントリンを殺菌土壌に処理後 30 日間自然光に暴露。 処理後 0, 3, 7, 14, 21, 30 日目に採取。	土壤表面での光分解は徐々に進行し半減期は 104 日であった。	FMC 生物化 学研究所 (1986)

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

(註) ピフェントリンおよびその代謝・分解物の名称および有効成分表示について

ピフェントリンの化学名(IUPAC名、CAS名)は、II. 物理的化学的性状の項に示さ
れるとおりであるが、本項においては試験の性質上、便宜的に試験成績に記載された
ままの名称を用いる。これに従い、有効成分表示も成績書に記載されているピフェン
トリンおよびその異性体を含めた合計含有率をそのまま用いる。

なお、一般名ピフェントリンは有効成分である二種の異性体(略称)に対する命名であるが、本項の試験の性質上、試験検体が有効成分および有効成分以外の幾何異性体を含む場合、もしくは有効成分以外の幾何異性体の場合であってもこれらを便宜上ピフェントリンと呼称する。この場合はピフェントリンに幾何異性体名を接辞し、例えば などと呼称する。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

代謝物・分解物—覽表 (推定化合物を含む)

記号	略 称	化 学 名	構 造 式
A	ビフェントリン	[2-メチル-(1,1'-ビフェニル)-3-イル]-メチル=シス-トランス-3-(2-クロロ-3,3,3-トリフルオロ-1-プロピル)-2,2-ブチルクロロプロパンカルボキシラート	

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

<分解代謝試験の手引き>

1. ¹⁴C標識位置の設定理由

2.

本代謝分解試験では2種類の¹⁴C標識化合物を使用した。

本剤はビフェニルカルビノール(ベンジルアルコール)とビニルシクロプロパンカルボン酸とがエステル結合により結ばれた化合物であり、これら各構成部分の各種代謝における挙動を明確にするためには、それぞれの部位の中心的な部分を標識することが望ましい。

以下にその構造式、化学名、標識位置及び略称を示す。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

2. 動物代謝試験での用量設定根拠

3. 植物代謝試験における散布量について

4. 土壌代謝試験における処理量について

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

9.1 動物代謝

9.1.1 ラット血液中の動態

(資料 No. M-1.1)

試験機関: FMC生物化学研究所

報告書作成年: 1986年

供試標識化合物:

供試動物: SD系ラット、成熟雄、計32匹（体重 117.8~218.2g）

方 法 :

投与前18時間絶食させ、コーン油中に溶解した標識ビフェントリンを胃管法で投与した。

投与量および採血方法は次の通りである。

(低用量 1回投与)

A群: 5匹に4mg/kgを1回投与し、投与後1、2、3、4、6、8、10、12、24、48および72時間後に尾静脈より採血し、採血後4時間で各ケージに戻し、飼料および水を自由摂取させた。

B群: 20匹に4mg/kgを1回投与し、投与後2、4、10および24時間に心臓穿刺で5匹ずつ屠殺し採血した。

(高用量 1回投与)

C群: 5匹に35mg/kgを1回投与し、投与後1、2、3、4、6、8、10、12、24、48および72時間後に尾静脈より採血した。

D群: 20匹に35mg/kgを1回投与し、投与後3、6、10および24時間後心臓穿刺で5匹ずつ屠殺

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

し採血した。

A群およびC群のラットの血液試料はヘパリン処理後燃焼分析した。B群およびD群はヘパリン処理後遠心分離し、分離した血漿を液体シンチレーションカウンターで計数した。

結果：

血液および血漿中の放射性化合物の平均濃度はピフェントリン当量として以下の通りであった。

用 量 群	群	投与量 (mg/kg)	実平均 投与量 (mg/kg)	放射能 (μ Ci)	分 析 位
低用量1回	A	4	5.4	12.6	血 液
	C	35	37.0	17.2	
高用量1回	B	4	4.2	7.2	血 漿
	D	35	36.6	11.0	

(下段へ続く)

放射性化合物平均濃度(ピフェントリン当量) (μ g/ml)										
1時間	2時間	3時間	4時間	6時間	8時間	10時間	12時間	24時間	48時間	72時間
0.148	0.324	0.434	0.664	0.611	0.448	0.363	0.299	0.111	0.082	0.055
0.579	0.920	1.590	2.493	3.289	2.511	2.492	1.928	1.273	0.821	0.524
	0.262		1.885			0.499		0.160		
		3.709		8.783		5.421		1.994		

本試験の結果は以下のように要約される。

- ① 標識ピフェントリンを4mg/kgおよび35mg/kgの投与量で1回経口投与した場合、化合物はゆるやかに吸収された。
- ② 血中および血漿中濃度は投与後約6時間でピークに達した。
- ③ 血液中の放射能の半減期は6.0時間(低投与量)および8.7時間(高投与量)であった。

以上から、ピフェントリンをラットに経口投与した場合、すみやかに排泄されることが示された。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

9.1.2 ラットを用いた代謝試験

(資料 No. M-1.2)

試験機関: FMC生物化学研究所

報告書作成年: 1983年

供試標識化合物:

供試動物: SD系ラット、雌雄各3匹、投与時体重範囲 188~252g

方 法 :

吸收、排泄、体内分布: 投与前18時間絶食させたラットに、コーン油中に溶解した被験物質5mg/kgを胃管法で1回投与した。実際の(平均)投与量は以下であった。

性 別	投与量(mg/kg)	実際の(平均)投与量(mg/kg)
雄	5	5.12
雌	5	5.38

投与後、糞、尿試料は0~8、8~12時間、以降24時間ごとに、168時間後まで分別採取した。

投与7日後に、ラットを屠殺し、血液を採取した後、肝臓、脳、心臓、腎臓、脾臓、皮膚、骨、筋肉、肺、脂肪組織および生殖腺を摘出した。

尿の放射能分析は直接液体シンチレーション・カウンターで実施し、糞、組織および血液試料は燃焼法により実施した。

代謝物の同定: 糞試料は、メチルアセト、ヘキサン、アセトニトリルを用いて抽出し、高速液体クロマトグラフィーを用いて定量分析した。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

結果：

吸收、排泄、体内分布：

糞中への放射能の排泄率 (%)

性	採取時間									合計
	8	12	24	48	72	96	120	144	168	
雄	0.37	36.30	29.41	13.37	1.91	0.81	0.46	0.31	0.24	83.17
雌	<0.01	9.42	42.75	24.01	3.33	1.62	1.06	0.77	0.58	83.56

(雌雄とも各3匹の平均値)

尿中への放射能の排泄率 (%)

性	採取時間									合計
	8	12	24	48	72	96	120	144	168	
雄	1.08	0.72	1.82	1.98	0.56	0.24	0.15	0.10	0.84	7.47
雌	0.65	1.09	2.69	2.45	0.57	0.31	0.21	0.07	0.29	8.31

(雌雄とも各3匹の平均値)

糞および尿への7日間累計排泄率 (%)

性	糞	尿	合計
雄	83.18	7.47	90.65±1.46
雌	83.54	8.33	91.87±6.13

表に示されたとおり、投与された放射能の大部分は、糞尿中に排泄される。これらの排泄の主要経路は糞であり、また投与後48時間以内にその大部分が排泄される。またこの排泄に関して、性差は認められなかった。

血液および主要臓器中の放射能の残留量 (投与後7日)

性	放射能残留量 (ppm)					
	脳	骨	脂肪	生殖腺	心臓	腎臓
雄	0.013	0.033	0.776	0.008	0.025	0.027
雌	0.011	0.093	1.650	0.499	0.027	0.051

性	放射能残留量 (ppm)					
	肝臓	肺*	筋肉	皮膚	脾臓	血液
雄	0.066	0.030	0.021	0.173	0.019	0.030
雌	0.117	0.019	0.041	0.398	0.039	0.036

(雌雄とも各3匹の平均値)

* : 異常値を示した雄雌各1匹は計算から除外

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

放射能の回収率：

糞、尿および組織中の残留量の全残留量に対する比率と、投与量に対する回収率は以下の通りであった。

試 料	残留量に対する割合(%)	
	雄	雌
糞	89.9	87.2
尿	8.1	8.7
組織/カ-カス	2.0	4.1
合 計	100.0	100.0
投与量に対する回収率	92.5	95.8

(各3匹の平均値)

代謝物の同定：

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本試験の結果は、以下のように要約される。

①投与されたビフェントリンは、投与後速やかにラット体内から排泄され、大部分は48時間以内に排泄された。

②排泄の主要経路は糞中への排泄であった。

③糞中では、親化合物の排泄が多く認められ、

④尿中の代謝物は、

⑤組織中への残留は極めて微量であった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

9.1.3 ラットを用いた吸収、排泄および分布試験

(資料 No. M-1.3)

試験機関：FMC生物化学研究所

報告書作成年：1986年

供試標識化合物：

供試動物：SD系ラット、雌雄各17匹、体重範囲 雄 163.9~272.8g 雌 152.7~203.9g

方 法：

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

ビフェントリンの

部分を標識した2種の化合物を用いた排泄率を調査し

た結果、いずれの化合物も排泄は速やかで、7日間で90～96%の排泄率であった。排泄経路は主として糞であり66～83%を占めた。高用量1回、低用量1回および連続投与群の排泄の様態は同様であった。呼気中の二酸化炭素に有意な量の放射能を認めなかった。

投与後7日の組織・臓器およびその他の部分の放射能分布を調査した結果、脂肪中の濃度は微量ではあるが他の臓器に比べて高かった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

9.1.4 ラットを用いた吸収、排泄および分布試験

(資料 No. M-1.4)

試験機関：Hazleton研究所（動物試験）

Xenobiotic研究所（放射能分析）

報告書作成年：1988年

供試標識化合物：

供試動物：SD系ラット、雄24匹、雌31匹、体重範囲 雄 309~361g、雌 213~258g

A. 予備試験

投与前18時間絶食させた2匹の雄に 標識ビフェントリンを、2匹の雌に 標識ビフェントリンを各々4mg/kgの用量で単回経口投与した。尿、糞および呼気中の放射能を投与48時間後まで調査した。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

B. 本 試 験

各群の投与計画の概要は以下の表のとおりである。

群	性	頭数	用量 (mg/kg) × 回数	¹⁴ C-標識位置	備 考
A (対 照)	雄	5	0 (対照)	-	コーン油のみ投与
	雌	5	0 (対照)	-	
B (低用量 1回)	雄	5	4 × 1		
	雌	5	4 × 1		
C (低用量連続)	雄	5	4 × 14 4 × 1		非標識化合物を毎日 1回14日間投与後、 試験15日後に標識化 合物を1回投与。
	雌	5	4 × 14 4 × 1		
D (高用量 1回)	雄	7	35 × 1		
	雌	7	35 × 1		
D' (〃)	雌	7	35 × 1		D群雌の再試験

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本試験は以下のように要約される。

1. 標識したビフェントリンを低用量単回投与($4\text{mg}/\text{kg} \times 1$ 回)、低用量反復投与($4\text{mg}/\text{kg} \times 14$ 回：非標識、 $4\text{mg}/\text{kg} \times 1$ 回：標識)および高用量単回投与($35\text{mg}/\text{kg} \times 1$ 回)した場合、投与7日間で糞中に投与量の71.2~83.5%および、尿中に9.37~14.5%が排泄された。
2. 呼気中に優位な放射能はなかった。
3. 投与7日後のカーカスには投与量の2.38~5.33%の残留がみられた。
4. 投与7日後の組織および臓器中濃度は低用量群で0.001~1.44ppm、高用量群で0.031~15.6ppmであった。最も濃度の高いのは脂肪であった。
5. 各投与群において吸収の排泄様式に性差は認められなかった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

9.1.5 ラットを用いたオートラジオグラフィー試験

(資料 No. M-1.5)

試験機関: Huntingdon Research Centre

報告書作成年: 1986年

供試標識化合物:

供試動物: SD系ラット、約6週令、雄8匹、体重範囲 131~141g

方 法 :

0.5mg/kg (約6 μ Ci/投与量) の標識ビフェントリンをコーン油に溶解し1回経口投与し、
0.5、1、2、6、24、48、96 および 192時間後に屠殺した。8時点の全身オートラジオグラフ
ィーによって組織内の放射能濃度を評価した。その検出限界は4~10dpm/mg(湿式)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エフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

結 果 :

8回の検査時点に於ける全身オートラジオグラフィーから放射能の濃度分布概要は次の表の通りであった。

臓器/ 組織	投与後時間(時間)							
	0.5	1	2	6	24	48	96	192
胃	++	++	++	+++	++++	+++	++	++
小大腎	-	-	-	-	-	-	-	-
肝	-	-	-	-	-	-	-	-
心	-	-	-	-	-	-	-	-
副腎	-	-	-	-	-	-	-	-
肺	-	-	-	-	-	-	-	-
脂肪	-	-	-	-	-	-	-	-
褐色	-	-	-	-	-	-	-	-
脂	-	-	-	-	-	-	-	-
褐色	-	-	-	-	-	-	-	-
血	-	-	-	-	-	-	-	-
齒	-	-	-	-	-	-	-	-
筋	-	-	-	-	-	-	-	-
骨	-	-	-	-	-	-	-	-
下	-	-	-	-	-	-	-	-
垂	-	-	-	-	-	-	-	-
眼	-	-	-	-	-	-	-	-
液	-	-	-	-	-	-	-	-
鼻	-	-	-	-	-	-	-	-
脾	-	-	-	-	-	-	-	-
腫	-	-	-	-	-	-	-	-
腺	-	-	-	-	-	-	-	-
胰	-	-	-	-	-	-	-	-
腺	-	-	-	-	-	-	-	-
腎	-	-	-	-	-	-	-	-
臍	-	-	-	-	-	-	-	-

(本表は申請者が報告書中の結果の記載に基づき作表した)

土；痕跡(検出限界程度)、+；低濃度、++；中濃度、+++；高濃度、

本試験の結果は以下のように要約される。

- ①雌ラットの消化管からの吸収は遅く6時間後に組織内放射能濃度は最高となった。
- ②消化管および肝臓(胆管も含む)の濃度が高かった。血液、骨髄、内分泌系臓器および脂肪中にも分布がみられた。なお、脂肪中では192時間後でも分布がみられた。
- ③下垂体以外の中権神経系の放射能が検出されないことから、放射能が血液／脳関門を大量に通過しないことを示した。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

9.1.6 ラット体内における代謝試験

(資料 No. M-1.6)

試験機関: Huntingdon Research Centre

報告書作成年: 1986年

供試標識化合物:

供試動物: SD系ラット、雌80匹(体重 179~207g)

方 法 :

生体内蓄積試験:

コーン油中に溶解した被験物質0.5 mg/kg/日を最長の場合、70日間毎日60匹に経口投与した。

20匹には何も投与せず、対照群とした。投与終了後、最長85日間の回復期間を設けた。

投与開始後1、3、7、14、21、28、35、42、49、56、63、70、73、78、85、92、99、113、127 および 155日目に屠殺し、肝臓、腎臓、卵巢、脂肪、皮膚および血液を採取した。血液の一部を遠沈し、血漿も採取した。

投与開始後 56、63、70、73、99、113、127 および 155日目に、坐骨神経を採取した。放射能分析は、サンプルオキシダイザーで酸化した後、液体シンチレーション・カウンターで測定した。

半減期(T)は次式より求めた。

$$T = \frac{\log e^2}{b} \quad (b \text{は傾き})$$

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

放射能濃度は、脂肪中で最も高く、肝臓、腎臓、皮膚および卵巢のそれは何れの時期でも血漿中濃度より高かった。また、全血中と血漿中の放射能濃度が類似していたことから、血球中の放射能取り込みがほとんどなく、血球の特定部位への蓄積がないことが示された。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本試験の結果は、以下のように要約される。

- ①放射能濃度は、脂肪中で最も高く、肝臓、腎臓、皮膚および卵巣のそれは何れの時期でも血漿中濃度より高かった。
- ②全血中と血漿中の放射能濃度が類似していたことから、血球中への蓄積がないことが示された。
- ③投与中止後の回復期間中の各分析部位についての分析値から算出した半減期は、脂肪51日、皮膚50日、肝臓19日、腎臓28日、卵巣40日、および坐骨神経42日であった。
- ④脂肪中の代謝物は、親化合物が65~85%を示し、

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

9.1.7 胆管に挿管したラットを用いた代謝試験

(資料 No. M-1.7)

試験機関: FMC生物化学研究所

報告書作成年: 1992年

供試標識化合物:

供試動物 : 胆管挿管したSD系ラット、雌雄各6匹

体重範囲 雄 233~335g、雌 215~383g

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

方 法 :

用 量 :

投与前12~18時間絶食させたラットにコーン油に溶解した被験物質を胃管法で1回投与した。

投与群および実際の投与量は以下であった。

<u>投与群(mg/kg)</u>	<u>性 動物数</u>	<u>実際の投与量(mg/kg)</u>	<u>備 考</u>
0	雄 2	0	コーン油のみ投与。
0	雌 2	0	"
5.0	雄 4	5.2	中毒症状あり。2匹死亡。
2.5	雌 4	2.7	雄で死亡始めたため、投与量を減らす。

試料採取 :

投与後、個別に代謝ケージに入れ、胆汁、糞および尿を別々に採取した。採取した胆汁を補うため、タウロコール酸ナトリウム／生理食塩水を試験期間中十二指腸に連続注入した。

胆汁は12時間、糞および尿は24時間ごとに3~6日間採取した。組織、臓器および消化管内容物を屠殺または死亡後に採取した。

した。

分 析 :

液体試料はシンチレーターを添加してLSCで、固体試料は燃焼分析によって放射能を測定した。糞および尿はアセトン／メタノール混合溶液で抽出し、抽出物をクロマトグラフィーで精製した。

胆汁は酵素で加水分解してアグリコンを求めTLCおよびHPLCで定量した。さらにGC/MSで代謝物の確認を行った。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本試験の結果は以下のように要約される。

- 1.胆管挿管したラットに放射能標識したピフェントリンを経口投与したときの排泄割合は、糞（雄24.9%、雌48.7%）、胆汁（雄18.6%、雌30.0%）、尿（雄10.7%、雌15.0%）の順であった。
- 2.消化管による吸収率は雄が35.6%、雌が49.8%であった。
- 3.糞中代謝物は親化合物が多く（雄92.3%、雌89.5%）、胆汁中には大部分が抱合体（雌雄平均96.0%）で、親化合物は雌雄平均0.3%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エフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

9.1.8 ラット排泄物中の代謝物の同定

(資料 No. M-1.8)

試験機関: FMC生物化学研究所

報告書作成年: 1986年

供試標識化合物:

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

供試動物 :

SD系ラット。成熟したラット雌雄各15匹を投与方法を変えた3群に分け計6群にした。

方 法 :

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

(糞中には親化合物およびその
誘導体が、また、尿中には親化合物の加水分解物が
多くみられた。

本試験の結果は以下のように要約される。

①SD系ラット雌雄各15匹を3つの試験群に分け、ビフェントリンの
投与した。用量群は低用量1回投与、低用量連続投与および高用量
1回投与の3群とした。最終投与後7日間の吸収、排泄および残留を測定し、また排泄物中の
代謝物の同定・定量を行った。

②放射能は48~72時間以内には糞および尿中に大部分が速やかに排泄され、7日後には組織に残
留する割合は少なかった。

③糞中には親化合物が多く、その他には親化合物の
みられた。尿中には加水分解物がみられた。

化合物が

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

9.1.9 ラットの排泄物中の代謝物の同定・定量

(資料 No. M-I. 9)

試験機関：FMC生物化学研究所

報告書作成年：1988年

供試標識化合物：

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本試験の結果は以下のように要約される。

- 1.先に実施した試験を補うために 標識ビフェントリンを雄ラットに、
標識ビフェントリン雄ラットに投与した。投与方法は4mg/kg単回投与、4mg/kg反復（15日）投与および
35mg/kg 単回投与の3群で、糞および尿を7日間採取し、屠殺ご組織・臓器中の残留量を測定した（反復投与は試験15日に屠殺）。
- 2.吸入排出の収支を調べた結果、放射能の大部分は48～72時間に糞および尿に排泄され、尿中代謝物は抱合されたものとされないものの両方の形で排泄されたが、糞中代謝物は主に抱合されない形で排泄された。
- 3.代謝物の確認および定量はTLC、HPLCおよびLSCで行った。同定された代謝物の概要是投与方法の異なる3群間で同様であった。
- 4.糞中代謝物は
- 5.尿中代謝物は親化合物の構造をもった代謝物はほとんど認ず、加水分解または酸化物の確認したものは次の通りであった。
- 6.ビフェントリンのラット体中の代謝は他のピレスロイドと同じで、加水分解、酸化および抱合であった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

動物における推定代謝経路図

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

9.1.10 泌乳中のヤギにおける代謝試験 (資料 No. M-1.10)

試験機関: Analytical Bio-Chemistry Laboratories, Inc.

報告書作成年: 1984年

供試標識化合物:

供試動物 : ヤギ、チーズ生産用乳を搾乳する雌、体重37~57kg、6頭（途中1頭を除外）

方 法 :

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本試験の結果は以下のように要約される。

- ① 標識のビフェントリンを泌乳中のヤギに7日間投与した場合、排泄および体内残留様式は同様であった。
- ② 乳中への移行は投与開始から4日後に平衡状態となり、放射能の残留量はビフェントリン当量として0.7~1.5ppmであった。
- ③ 心臓、腎臓、肝臓、筋肉および脂肪中の残留量はビフェントリン当量として各々約0.4~0.6、0.3~1.0、1.6~3.9、0.2~0.5および0.7~2.8ppmであった。
- ④ 排泄は消化管および尿管が主要な排泄経路であった。
- ⑤ 内眼的病理検査、乳量、乳中の脂肪含量、ヤギの健康について異常は認めなかった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

9.1.11 ヤギにおける代謝試験 (資料 No. M-1.11)

試験機関: FMC生物化学研究所

報告書作成年: 1984年

供試標識化合物:

供試動物 : ヤギ、チーズ生産用乳を搾乳する雌、体重37~57kg、6頭(途中1頭を除外)。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本試験の結果は以下のように要約される。

- ①乳中の残留量は、投与後4～7日でプラトーとなり、最高残留量もこの時期に認められた。
- ②乳中残留量は、炭素原子の標識位置の相違に関係なかった。
- ③乳中放射能残留の大部分は未変化の親化合物であり、4～5種の未知物質の存在が確認されたが、その量は僅かであった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

動物代謝試験まとめ

標識位置の異なる化合物を用いた動物代謝試験成績(抄録中資料番号 M-1.3, M-1.4, M-1.8, M-1.9)を一覧表にするとともに、結果について1つにまとめなおした。

供試標識化合物 :

供試動物 : SD系成熟ラット1群雌雄各5匹

試験方法 :

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本試験の結果は以下のように要約される。

1. 投与した放射能の大部分は72時間以内に糞及び尿中に排泄され、糞中へは抱合されない形で排泄されたが、尿中へは抱合体と抱合されないものの両方の形で排泄された。高用量群の放射能排泄速度は低用量群より僅かに遅れる傾向が認められた。
2. 粪中には親化合物の他、以下のような代謝物が多く認められた。

また、尿中には親化合物の構造をもった代謝物がほとんど認められず、以下の加水分解または酸化物が確認された。

3. ピフェントリンのラットにおける代謝は他の合成ピレスロイドと同様、加水分解、酸化物加水および抱合であった。反復投与群の糞中には単回投与群に比べて
が多く認められたことから、程度な誘導効果が推定された。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

9.2 植物代謝

9.2.1 リンゴにおける代謝試験

(資料 No. M-2.1)

試験機関: FMC生物化学研究所

報告書作成年: 1983年

供試標識化合物:

供試作物: リンゴ(デリシャス)、Rutgers大学(ニュージャージー州)

方 法 :

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本試験の結果は次のように要約される。

- ①476ppmのビフェントリンをリンゴ果実に3回施用し、0、7、14および21日後に採取し分析した。
- ②果肉および果皮中の残留物の大部分は親化合物でシス体からトランス体への有意な異性化は認められなかった。
- ③残留物の大部分は果皮に存在しており、有意な移行はなかった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

9.2.2 ワタにおける代謝試験

(資料 No. M-2.2)

試験機関: FMC生物化学研究所

報告書作成年: 1986年

供試標識化合物:

供試作物:

ポットにワタの種を4粒播種し、発芽後間引きをして1本仕立てにした。8葉になった時点
で(約3週間)供試した。

方 法 :

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本試験の結果は次のように要約される。

①ピフェントリンをワタの葉または土壌に施用された場合分解があった。

葉では極性の強い代謝物がみられた。

②

③ピフェントリンをワタに施用した場合、植物体内の移行はなかった。土壌中からの吸収移行も認められなかった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

ワタにおける想定代謝経路

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

9.2.3 トウモロコシにおける代謝試験

(資料 No. M-2.3)

試験機関: FMC生物化学研究所

報告書作成年: 1987年

供試標識化合物:

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本試験の結果は以下のように要約される。

- ①トウモロコシではピフェントリンの土壌、葉面および苞皮から子実への有意な移行はみられなかった。
- ②
- ③葉上のピフェントリンのシス体からトランス体への異性化は認められなかった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

トウモロコシにおける想定代謝経路

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

9.3 土壌代謝

9.3.1 好気性条件下の土壤中における代謝・分解

(資料 No. M-3.1)

試験研究機関：FMC生物化学研究所

報告書作成年：1984年

供試標識化合物：

供試土壤：

土壤名	土壤構成成分(%)			土性区分	有機質含有量(%)	陽イオン交換容量(meq/100g)	pH	仮比重
	砂	シルト	粘土					
Cosad*	54.4	35.2	10.4	砂壤土	3.0	16.1	7.0	1.18

*：ニューヨーク州ナイアガラ郡で採取

方 法：

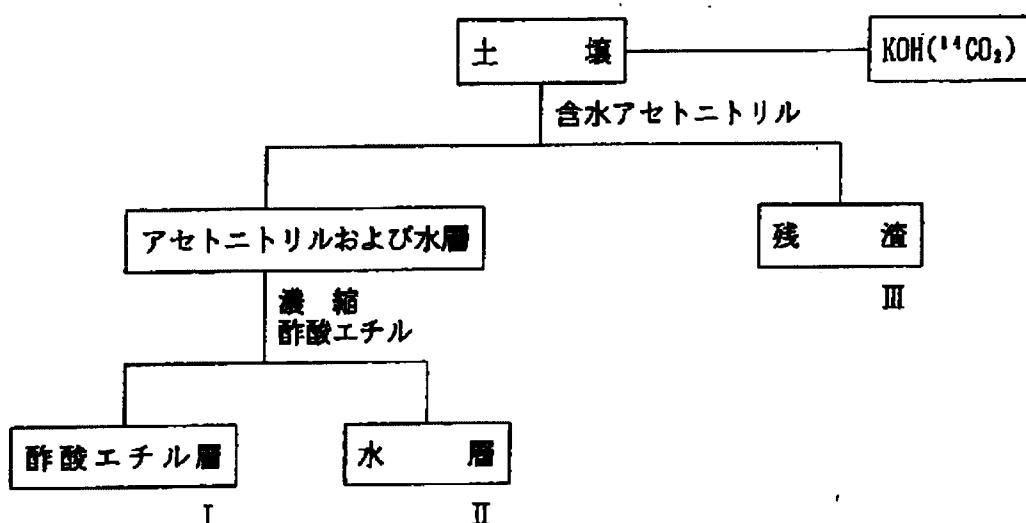
ふるいわけし風乾後、乾土50g をBellco Biometer フラスコに入れ、1.0ppmになるよう標識化合物を投与し、圃場容水量の65%になるよう水分を添加した。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

暗黒中 $25 \pm 3^{\circ}\text{C}$ で培養し、投与から0、1、3、7、14および21日目に採取した。

二酸化炭素の捕集フラスコに 0.1N KOH 溶液を入れ、一定の時間ごとに採取し定量した。

土壌抽出の概要を下図に示した。



分析は燃焼分析、高速液体クロマトグラフィー、薄層クロマトグラフィー、液体シンチレーション計数計を行った。

結 果 :

記号	分 画	放射能分布の経時的変化 (%)					
		0日	1日	3日	7日	14日	21日
A	ビフェントリン (I)	94.5	93.1	95.1	92.3	91.3	86.9
-	有機溶剤層未確認物 (I)	2.2	2.1	2.2	2.4	3.2	4.7
-	水 層 (II)	0.5	2.2	0.8	2.6	0.6	1.0
-	CO ₂	-	-	0.3	0.9	1.9	3.8
-	抽出残渣 (III)	2.8	2.6	1.6	1.8	3.0	3.6

未確認の代謝物が4～6個認められたが、1.3%を超えるものはなかった。

本試験の結果は次のように要約される。

①好気性条件下の土壌(砂壌土)にビフェントリン 1.0ppm 处理し、 $25^{\circ}\text{C} \pm 3^{\circ}\text{C}$ で培養した場合、

親化合物は徐々に分解した。

②分解は4～6個の非極性代謝物および土壌結合型代謝物を形成しながら二酸化炭素へ進行した。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

9.3.2 好気性条件下の土壤中における代謝・分解

(資料 No. M-3.2)

試験機関: FMC生物化学研究所

報告書作成年: 1984年

供試標準化合物:

供試土壤: 以下の3種の土壤を供試した。

土壤名	土壤構成成分(%)			土性区分	有機質含有量(%)	陽イオン交換容量(meq/100g)	pH	仮比重
	砂	シルト	粘土					
Hagerstown	20.8	54.8	24.4	シルト質壤土	2.3	13.8	7.5	1.16
Cosad	54.4	35.2	10.4	砂壤土	3.0	16.1	7.0	1.18
Dunkirk	30.4	55.2	14.4	シルト壤土	3.1	14.2	7.1	1.13

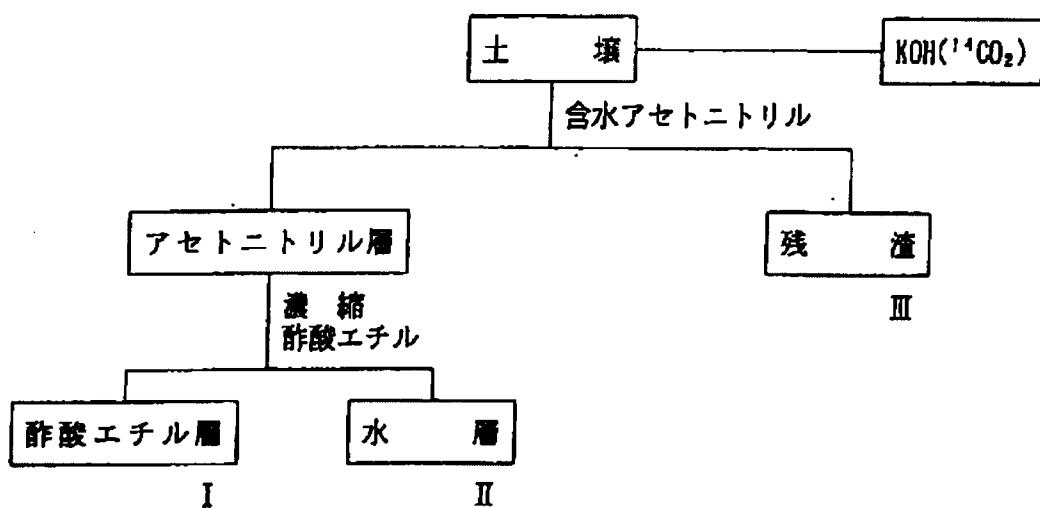
方 法 :

土壤処理: ふるいわけ、風乾後、乾土として50g をBellco Biometer フラスコに入れエタノール溶液のビフェントリンを3.0ppm処理した。エタノール蒸散後、面積容水量の65%になるよう調節した。暗黒中25°C±3°Cで培養。処理後0、29、60および180日に採取した。

二酸化炭素の捕集: フラスコの側室に0.1N水酸化カリウム溶液10mlを入れ隨時採取して定量した。

土壤抽出: 概要は以下に図で示した。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。



分析：燃焼分析、高速液体クロマトグラフィー、薄層クロマトグラフィー、液体シンチレーション計数を用いた。

結果：

経時的代謝物分布(%)：

Hagerstown	経時的放射能分布 (%)			
	0日	29日	60日	180日
ビフェントリン (I)	89.5	80.1	69.0	34.7
有機層未確認物 (I)	7.1	7.9	10.6	6.3
水層 (II)	0.1	0.9	0.4	0.5
CO ₂	-	2.5	8.8	36.9
抽出残渣 (III)	3.3	8.6	11.2	21.6

Cosad	経時的放射能分布 (%)			
	0日	29日	60日	180日
ビフェントリン (I)	90.8	70.8	40.3	33.0
有機層未確認物 (I)	7.2	7.1	8.9	7.7
水層 (II)	0.1	4.5	7.7	0.4
CO ₂	-	4.6	25.4	35.0
抽出残渣 (III)	1.9	13.0	17.7	23.9

Dunkirk	経時的放射能分布 (%)			
	0日	29日	60日	180日
ビフェントリン (I)	90.1	83.5	77.6	54.8
有機層未確認物 (I)	7.1	7.3	8.4	7.6
水層 (II)	-	0.4	0.9	0.3
CO ₂	-	0.5	2.1	13.4
抽出残渣 (III)	2.8	8.3	11.0	23.9

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

半減期；3種の土壌の半減期は下表の通りであった。

土壌名	半減期(日)
Hagerstown (シルト質堆塙土)	125
Cosad (砂壤土)	50
Dunkirk (シルト壤土)	205

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

9.3.3 好気性条件下の土壤中における代謝・分解

(資料 No. M-3.3)

試験機関: FMC生物化学研究所

報告書作成年: 1984年

供試標識化合物:

供試土壤: 次の3種の土壤を用いた。

土壤名	土壤構成成分(%)			土性区分	有機質含有量(%)	陽イオン交換容量(meq/100g)	pH	仮比重
	砂	シルト	粘土					
Hagerstown	20.8	54.8	24.4	シルト質土壤土	2.3	13.8	7.5	1.16
Cosad	54.4	35.2	10.4	砂壤土	3.0	16.1	7.0	1.18
Dunkirk	30.4	55.2	14.4	シルト壤土	3.1	14.2	7.1	1.13

方法:

土壤処理: 篩別け、風乾後、乾土として50g をBellco Biometer フラスコに入れ、エタノール

溶液の ピフェントリンを1.1ppm処理した。エタノール蒸散後、圃場容水量の

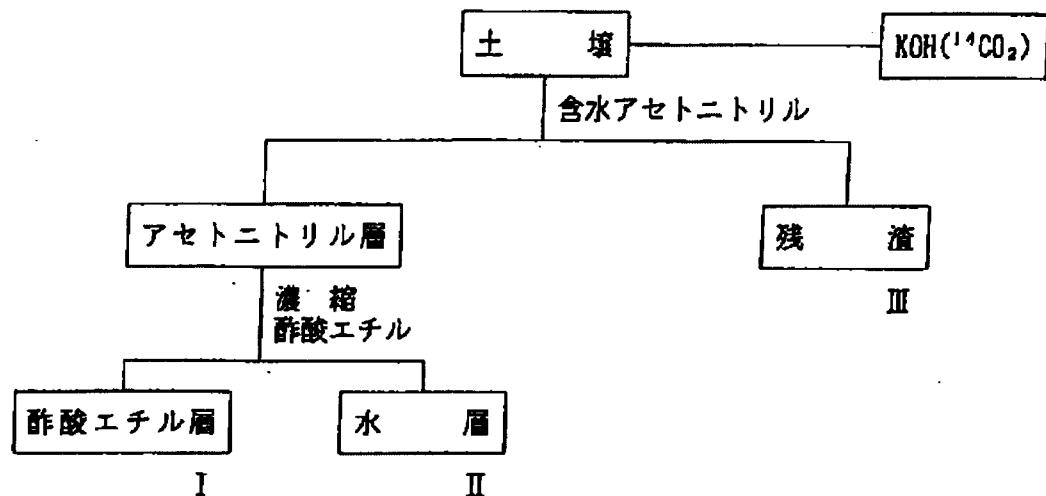
65% になるよう調整した。暗黒中25°C±3°Cで培養し、処理後 0、30、61および120日に採

取した。

二酸化炭素の捕集: フラスコの側室に0.1N水酸化カリウム溶液を入れ隨時採取して定量した。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

土壤抽出 ; 概要は次の図に示した。



分析 ; 分析は燃焼分析、高速液体クロマトグラフィー、薄層クロマトグラフィー、液体シンチレーション計数計を用いた。

結果 : 各分画における放射能分布(%)の概略を以下の表に示した。

(%)

分 画	0 日			30 日			61 日			120 日		
	(a)	(b)	(c)	(a)	(b)	(c)	(a)	(b)	(c)	(a)	(b)	(c)
ビフェントリン (I)	90.0	90.8	95.1	67.6	71.4	77.5	52.2	55.6	68.7	37.7	43.9	54.8
酢酸エチル層 中未確認物 (I)	-	-	-	5.7	9.1	7.0	7.2	13.6	10.1	8.0	15.9	15.5
水層 (II)	6.3	5.7	0.8	5.1	1.5	1.7	0.5	0.3	0.5	0.6	1.1	0.2
CO ₂	-	-	-	7.0	5.9	5.2	17.9	13.8	8.7	28.8	22.1	15.6
抽出残渣 (III)	3.7	3.5	4.1	14.6	12.1	8.6	22.2	16.7	12.0	24.9	17.0	13.9

土壤名 : (a) ; Hagerstown 土壤、(b) ; Cosad 土壤、(c) ; Dunkirk 土壤

半減期 ; 3種の土壤におけるビフェントリンの半減期は下表の通りであった。

土壤名	半減期(日)
Hagerstown (シルト質壊土)	69
Cosad (砂壊土)	87
Dunkirk (シルト壊土)	135

本試験の結果は以下のように要約される。

①Hagerstown 土壤、Cosad 土壤およびDunkirk 土壤の半減期は2~4.5ヶ月であった。

②処理後 120 日で親化合物は37.7~54.8%回収された。CO₂の総発生は15.6~28.8%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エフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

9. 3. 4 好気性条件下の土壤中における代謝・分解

(資料 No. M-3.4)

試験機関: FMC生物化学研究所

報告書作成年: 1986年

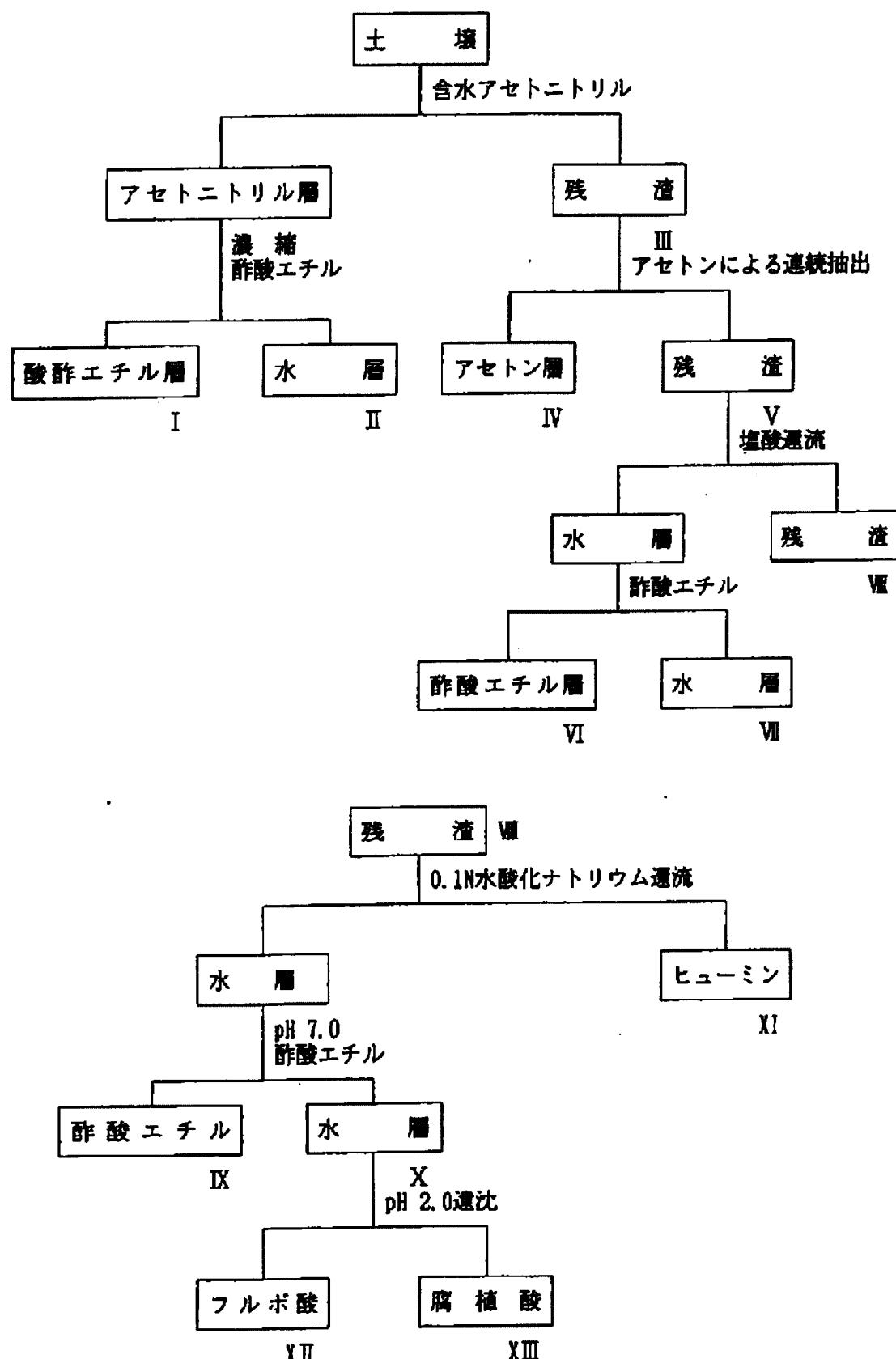
供試標識化合物:

供試土壤: (前記資料 M-3.3 と同一の土壤試料を用いた)

土壤名	土壤構成成分(%)			土性区分	有機質含有量(%)	陽イオン交換容量(meq/100g)	pH	仮比重
	砂	シルト	粘土					
Hagerstown	20.8	54.8	24.4	シルト質壤土	2.3	13.8	7.5	1.16
Cosad	54.4	35.2	10.4	砂壤土	3.0	16.1	7.0	1.18
Dunkirk	30.4	55.2	14.4	シルト壤土	3.1	14.2	7.1	1.13

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

方 法：土壤の抽出の概要は下図の通りである。



分析：燃焼分析、液体クロマトグラフィー、薄層クロマトグラフィー、液体シンチレーション計数計を、単独又は組合せて用いた。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本試験の結果は以下のように要約された。

- ①ビフェントリンの土壤中の分解は加水分解と酸化による。
- ②処理後 120日の土壤の有機溶剤抽出分画の主要化合物は親化合物で、残留放射物の40~59%であった。
- ③土壤と結合した放射性化合物はフルボ酸、腐植酸およびヒューミンに均一に分布していた。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

9.3.5 酸性条件下の土壤中における代謝・分解

(資料 No. M-3.5)

試験機関 : FMC Corporation

報告書作成年 : 1985年

供試土壤 :

米国土壤を供試した。供試土壤の由来及び土壤特性を下表に示した。

名称	コサド	
採取地	ニューヨーク州ウイルソン	
土性分類	砂壤土	
粒径分布	砂(%)	54.4
	シルト(%)	35.2
	粘土(%)	10.4
有機物含量(%)	3.0	
陽イオン交換容量 (meq/100g)	16.1	
pH	7.0	
密度(g/cm ³)	1.18	

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

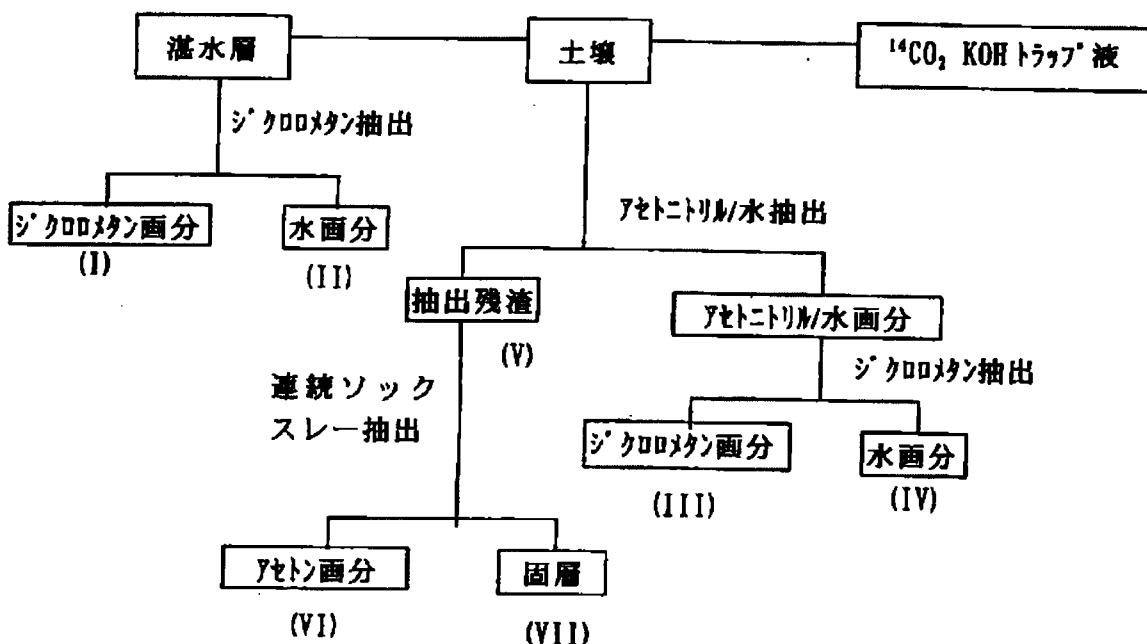
方法：

土壤の調製、処理及びインキュベート

土壤を 2.0 mm の篩いに通した後、水分含量を圃場容水量の 20% に風乾した。乾土換算 50g の土壤を 250mL 容のバイオメーターフラスコに入れ、「¹⁴C-ビフェントリンのエタノール溶液 177.6 μL または 320 μL をビフェントリン濃度が乾土換算で 3.0 ppm となるように土壤に処理した。エタノール留去後、水分含量を圃場容水量の 75% になるように調整した。フラスコ側室には 0.1N KOH 10mLを入れ、1週間毎に液を交換して ¹⁴CO₂ の測定を行った。処理した土壤を 29 日間静置して好気的にインキュベートし、その後脱気した HPLC 級蒸留水 60 mL で湛水した。嫌気的な環境に到達するのを助けるために、湛水前に乾燥アルファルファ 0.5 g を各試料に混入した。土壤は暗所、25±3°C でインキュベートした。

土壤の採取及び抽出

嫌気的条件の開始から 31 及び 61 日目に採取し分析に供した。土壤と湛水を分離し、湛水はジクロロメタンで抽出した。土壤は、アセトニトリル/水 (7:3) にて抽出し、抽出液はさらにジクロロメタンで抽出し、有機溶媒可溶画分及び極性の水溶性画分を得た。抽出残渣 (V) はアセトンを用いて 24 時間還流するソックスレー抽出を行った。有機溶媒可溶画分 (I、III、VI) は HPLC 及び TLC にて分析した。抽出操作を以下に示した (原報告書 FIGURE 1)。



高速液体クロマトグラフィー (HPLC) 及び薄層クロマトグラフィー (TLC) 分析条件

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

HPLC 条件	カラム : Whatman Magnum 9 逆相 ODS-2 (内径 9.4 mm×25 cm)
	溶出 : グラジエント ; アセトニトリル/水(50/50)→アセトニトリル 5mL/min
	検出 : UV254nm,
	定量 : 代謝物標準品を共溶出し、当該溶出液中放射能を LSC 測定
TLC 条件	プレート [画分 I, III] : シリカゲル GHLF, 250μm プレート(アナルティック) [画分 VI] : シリカゲル GF 250μm プレート(Quanta/gram)
	展開 : ヘキサン/トルエン/1-テル/酢酸(11.5 : 8.5 : 2.0 : 0.3)
	検出 : コダック X-Omat XAR-5 74μm
	定量 : 放射能存在のシリカゲル分取、LSC 測定

¹⁴CO₂ 及び放射能の測定

¹⁴CO₂は 0.1N KOH トロッパ 溶液を直接 LSC 測定した。¹⁴CO₂の確認は、Ba(OH)₂を添加し Ba¹⁴CO₃沈殿後の上清及び沈殿中放射能測定により行った。

放射能測定は、液体シンチレーションカウンター(LSC)にて行った。抽出残渣土壌は、生物試料用オキシダイザーを用いて燃焼して測定した。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

土壤中におけるビフェントリンの想定代謝経路

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

9.3.6 土壌中における吸脱着

(資料 No. M-3.6)

試験機関: FMC生物化学研究所

報告書作成年: 1984年

供試標識化合物:

供試土壤:

土性区分	採取場所	土壤構成成分(%)			有機炭素含有量(%)	陽イオン交換容量(meq/100g)	pH	OECD 土壌No.
		砂	シルト	粘土				
砂土	Leon 米国フロリダ州	91.6	4.8	3.6	0.76	3.5	6.2	5
砂壤土	Cosed 米国ニューヨーク州	54.4	35.2	10.4	1.74	16.1	7.0	3
シルト壤土	Dunkirk 米国ニューヨーク州	30.4	65.2	14.4	1.80	14.2	7.1	3
壤土	Hagerstown 米国メリーランド州	20.8	54.8	24.4	1.34	13.8	7.5	2

方 法 :

ビフェントリンはアセトニトリルを用い、ペルメトリンはアセトンを用いて2%溶液とし、この原液の一定量をとり、0.01M 塩化カルシウム溶液で定容した。その濃度を次の表に示した。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

吸着 ; 100 °C恒量土壤0.5g相当の各土壤を250ml エルレンマイヤーフラスコに入れ、溶液50mlを添加し、22~23°Cで24時間振とうした。遠心分離した上澄を液体シンチレーション計測に供した。残りの土壤および溶液の重量を測定した。

脱着 ; 吸着試験の土壤と検体溶液を秤量後、50mlの塩化カルシウム溶液を添加、平衡化し、吸着試験と同様に測定した。

土壤中の放射能は燃焼法によって測定した。

結果 :

吸着時における K_a および K_{oc} は次のとおりであった。

土性区分	ビフェントリン		ペルメトリン	
	K_a	K_{oc}	K_a	K_{oc}
砂 土	992	130,526	367	48,289
砂 壤 土	4,160	239,080	1,404	80,690
シルト壤土	5,429	301,611	2,403	133,500
壤 土	3,688	275,224	1,087	81,119

脱着時における K_a および K_{oc} は次のとおりであった。

土性区分	ビフェントリン		ペルメトリン	
	K_a	K_{oc}	K_a	K_{oc}
砂 土	3,342	439,737	843	110,921
砂 壤 土	11,044	634,713	2,161	124,195
シルト壤土	11,610	645,000	2,520	140,000
壤 土	10,254	765,224	1,661	123,955

本試験は以下のとおり要約される。

- ①ビフェントリンはペルメトリンよりも土壤に強く吸着される。
- ②試験した4種の土壤の K_a は992~5429で、 K_{oc} は131000~302000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エフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

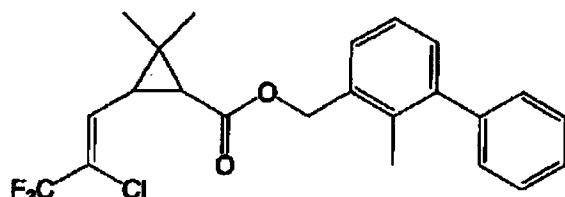
9.3.7 土壌中における吸脱着

(資料 No. M-3.7)

試験機関：株化学分析コンサルタント
報告書作成年：2000年

供試化合物：ビフェントリン

化学構造：



化学名：

[2-メチル-(1,1'-ビ'フェニル)-3-イソブチリネート]ジ[トランス-3-(2-クロロ-3,8,8-トリフルオロ-1-プロペニル)-2,2-ジメチルシクロプロピル]メチルケート

純度：

供試土壌：

土壤番号	No.6	No.8	No.14	No.20
土壤分類	水田土壌	水田土壌	畑土壤	畑土壤
採取場所	福岡県立農業技術研究所	沖縄県立農業技術研究所	緑色火山灰土壌	砂丘朱鷺土土壠
土性	粘壤土	粘壤土	シルト粘壤土	シルト粘壤土
砂(%)	28.0	42.2	26.2	86.0
シルト(%)	35.4	31.9	50.9	7.1
粘土(%)	36.6	25.9	22.9	6.9
有機質素含有率(%)	2.60	1.21	2.25	1.5
pH(CaCl ₂)	6.0*	6.5*	5.6	5.9
陽イオン交換容量 (me/100g)	21.5	11.3	21.4	9.7
リン酸吸収係数	620	390	2300	1030
粘土鉱物の種類	モンモリロナイト	クロライト、イライト	アロフェン、 バーミキュライト	アロフェン、 ハロイサイト
OECDのNo.	2	3	4	5

*: pH(KCl)

試験方法：

試験溶液の作成：

ビフェントリン 2μg/mL アセトニトリル溶液 25mL を 500mL 容メスフラスコに、0.01 M 塩化カルシウム溶液で定容し、0.1μg/mL の試験溶液（アセトニトリル 5% 含有）を作成した。測定の結果、実際の濃度は 0.070μg/mL であった。

吸着操作：

各土壌 5g を遠沈管に取り、水 5mL を加え平衡化後、試験溶液 20 mL を加え (1:5) 振とうした (25°C ± 1°C)。16 時間後、試料を採取し、遠心分離し、水相および土壌相のビフェントリン濃度を測定した。また、土壌を含まない遠沈管に試験溶液 20 mL を加え同様に振とうし (コントロール区)、管壁へのビフェントリン付着の有無を調べた。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

分析方法：

遠心分離後、水相はヘキサンで抽出し濃縮してアルミナカラム C.C.で精製後、ECD 検出器付きガスクロマトグラフを用いて測定した。土壤相はアセトンで抽出して溶媒を留去後、ヘキサンに転溶しアルミナカラム C.C.で精製後、ECD 検出器付きガスクロマトグラフを用いて測定した。

結果：

ピフェントリンの水溶解度は 13ppt であるが、本試験で用いた分析法における水相の検出限界は 50ppt (0.00005 μ g/mL) であり、試験溶液の濃度を水溶解度以下に設定することは不可能であった。そこで本試験では、参考までに 5%アセトニトリル溶液の試験溶液を調整し、ピフェントリン製剤を処理した場合の推定環境濃度である 0.1 μ g/mL での吸着挙動を予備的に調べた。

吸着操作の結果、多くの土壤で水相からピフェントリンが検出されず、ピフェントリンの大部分は土壤層に存在した。このことよりピフェントリンは極めてよく土壤に吸着されると考えられた。また、コントロール試験の結果、ガラス吸着も認められた。

土壤番号	初期添加量 (μ g)	水相		土壤相	
		存在量(μ g)	濃度(μ g/mL)	存在量(μ g)	濃度(μ g/mL)
No.6	1.40	0	<0.00005	1.531	0.306
		0	<0.00005	1.539	0.308
No.8	1.40	0	<0.00005	1.551	0.310
		0	<0.00005	1.589	0.318
No.14	1.40	0.00002	0.00006	1.549	0.310
		0	<0.00005	1.639	0.328
No.20	1.40	0.0062	0.00025	1.626	0.325
		0.0018	0.00007	1.655	0.331
コントロール	1.40	0.325	-	1.078*	-
		0.325	-	1.141*	-

* : ガラス付着量

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

9.3.8 土壌中における移動

(資料 No. M-3.8)

試験機関: FMC生物化学研究所

報告書作成年: 1984年

供試標識化合物:

供試土壌:

土性区分	土壌構成成分 (%)			有機質含有量 (%)	陽イオン交換容量 (meq/100g)	pH	仮比重
	砂	シルト	粘土				
砂土*	91.6	4.8	3.6	1.3	3.5	6.2	1.47
砂壤土	54.4	35.2	10.4	3.0	16.1	7.0	1.18
沙壤土	30.4	65.2	14.4	3.1	14.2	7.1	1.13
壤土	20.8	54.8	24.4	2.3	13.8	7.5	1.16

*: 砂土は結合性長期残留物のかためロットグラフ試験にも供試した

方 法 :

土壌処理および抽出:

標識ビフェントリンを砂壤土に処理し、120日および

180日間放置した土壌にアセトニトリル:水(7:3)を加え抽出し、酢酸

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

エチルで分配し濃縮した。

土壤プレート調製およびスポット；各土壤を風乾後ふるいにかけ、蒸留水を加えてクロマトグラフプレートに均一な土壤層を作った。72時間風乾後、標識化合物および土壤抽出物をスポットした。

抽出試料	¹⁴ C標識位置	抽出溶媒	用量 (μ l)	放射能濃度 (dpm)
120日後抽出		酢酸エチル	20	255, 220
120日後抽出		酢酸エチル	35	266, 196
180日後抽出		酢酸エチル	30	252, 234
180日後抽出		酢酸エチル	20	238, 680
ピフェントリン		塩化メチレン	10	310, 867

土壤プレートの展開、オートラジオグラフ；プレートをTLCチャンバーに入れて、蒸留水を1cmの深さに加え、10cm展開した。展開後風乾してフィルムに7日間露出させ現像した。

結合性残留物の移動性；砂土をカラムに30cmの高さに詰め、ガラスウールをのせ水で飽和した。土壤結合性残留物をガラスウールに積層した。陽性対照として砂壤土にピフェントリン1ppmを加えたものをガラスウールに積層した。

カラム上に処理した放射能濃度は次のとおりである。

処理対象物質	放射能濃度 (dpm)
120日後抽出残分	407, 406
120日後抽出残分	407, 406
180日後抽出残分	600, 750
180日後抽出残分	600, 750
ピフェントリン(対照)	678, 416

各カラムとも250ml(50.8cm)の蒸留水で溶出した。

結果：

抽出可能残留成分の移行性：

ピフェントリン処理後120および180日経過した土壤の有機溶媒抽出物、各種土壤のTLCのRF値(平均)は次のとおりであった。

土性区分	120日後 抽出物	180日後 抽出物	ピフェントリン (対照)
砂 土	0.26	0.26	0.24
砂 壤 土	0.04	0.03	0.05
糀 壤 土	0.04	0.04	0.04
埴 壤 土	0.03	0.04	0.02

土壤結合性の残留成分の移行性：

有機溶媒で抽出できない残留成分の砂土のカラムクロマトグラフィーによる移行性(%)は次のとおりであった。

カラム/分画	結合性残留物(%)*		ピフェントリン (対照)
	120日後	180日後	
~抽出残分~層	95.8	97.4	99.9
0~6 cm	0	0	0
7~12 cm	0	0	0
13~18 cm	0	0	0
19~24 cm	0	0	0
25~30 cm	0	0	0
溶出	4.2	2.6	0.1
回収率(%)	99.4	99.9	93.9

* : 2回の平均値

本試験の結果は以下のとおり要約される。

- ①土壤中の抽出可能な代謝・分解物を含むピフェントリンの土壤移行性は砂土の場合低移行性（クラスⅡ）であり、他の土壤では非移行性（クラスⅠ）であった。
- ②土壤結合性の残留物質中には水溶性成分がわずかに認められたが、大部分の化合物は移行性を示さなかった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

9.4 その他

9.4.1 加水分解性に関する試験

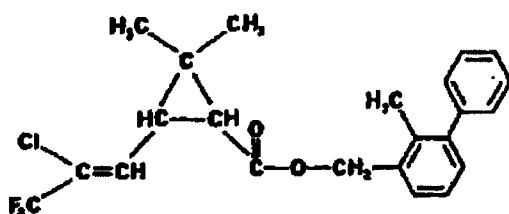
(資料 No. M-4. 1)

試験機関: FMC生物化学研究所

報告書作成年: 1983年

供試化合物: (分析用標準品)

化学構造:



化学名: [2-メチル-(1,1'-ビフェニル)-3-イル]メチルシス-3-[2-(4-クロロ-3,3,3-トリフルオロ-1-ブロモ)-2,2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレート

方 法 :

緩衝液およびビフェントリン溶液の組成の概略を以下に示した。

pH 5 緩衝液	: フタル酸水素カリウム-水酸化ナトリウム
pH 7 緩衝液	: リン酸二水素ナトリウム-水酸化ナトリウム
pH 9 緩衝液	: ホウ酸ナトリウム-塩酸
非緩衝液	: 脱イオン水(ミリオット法-通過)
ビフェントリン 溶液	: [高濃度群] 67.92 μg/ml (アセトトリル溶液) ; [低濃度群] 6.792 μg/ml (アセトトリル溶液)

褐色ガラスびんに100ml の脱イオン水と20mlの緩衝液(または120mlの脱イオン水)を入れ加圧滅菌し、一晩25°Cで放置後、高濃度または低濃度ビフェントリン溶液10mlを加え試験溶液として供試した。

試験は25°Cの暗条件下で実施し、試験開始0、1、5、6、7、8、12、13、19、20および22日後に試料1mlずつを採取し、HPLC(外部標準)でビフェントリン量(μg)を分析した。

試験開始49日目に残った全ての試験溶液をジクロロメタンで抽出し、濃縮後さらにアセトニトリルに溶解し、同様に分析した。

結 果 :

結果は次の表のとおりであった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

経過日数 (日)	回収量 (μg) [ピフェントリン 総量 $67.92 \mu\text{g}/130\text{ml}$]						
	非緩衝液	pH 5 緩衝液		pH 7 緩衝液		pH 9 緩衝液	
		反復1	反復2	反復1	反復2	反復1	反復2
0	(0.43)	(0.37)	(0.37)	(0.27)	(0.24)	(0.28)	(0.28)
1	0.43	0.37	0.37	0.27	0.24	0.28	0.28
5	0.43	0.23	0.31	0.37	0.35	0.38	0.36
6	0.42	0.26	0.37	0.39	0.36	0.39	0.36
7	0.38	0.23	0.28	0.31	0.29	0.34	0.35
8	0.41	0.19	0.26	0.30	0.32	0.34	0.34
12	0.27	0.40	0.29	0.30	0.19	0.26	0.27
13	0.34	0.38	0.30	0.09	0.39	0.33	0.32
19	0.17	0.16	0.065	0.03	0.095	0.30	0.295
20	0.11	0.12	0.11	0.025	0.11	0.25	0.25
22	0.028	0.048	0.036	0.012	0.049	0.23	0.16
小計 (μg)	3.42	2.76	2.76	2.48	2.64	3.38	3.27
49(最終)	56.86	58.40	57.84	54.15	55.40	54.99	57.48
合計 (μg)	60.28	61.16	60.6	56.63	58.04	58.37	60.65
回収率 (%)	88.8	90.5	89.2	83.4	85.5	85.9	89.3

経過日数 (日)	回収量 (μg) [ピフェントリン 総量 $679.2 \mu\text{g}/130\text{ml}$]						
	非緩衝液	pH 5 緩衝液		pH 7 緩衝液		pH 9 緩衝液	
		反復1	反復2	反復1	反復2	反復1	反復2
0	(4.8)	(4.0)	(4.1)	(4.1)	(4.5)	(4.4)	(4.5)
1	4.78	3.98	4.12	(4.12)	4.47	4.45	4.53
5	4.67	2.32	(2.3)	(3.7)	(3.9)	(4.2)	(4.2)
6	4.71	2.09	2.52	3.30	3.47	4.01	4.12
7	4.34	1.87	2.24	3.05	3.31	3.88	3.82
8	4.55	1.79	2.37	2.96	3.19	3.71	3.75
12	3.76	1.13	1.47	3.65	3.30	2.75	2.77
13	(3.7)	(0.75)	(1.2)	(2.2)	(2.2)	(2.2)	(2.2)
19	3.70	0.514	0.963	1.05	1.24	1.59	1.58
20	3.02	0.342	0.703	0.703	0.997	(1.0)	(1.0)
22	2.34	0.11	0.17	0.18	0.20	0.495	0.218
小計 (μg)	44.37	26.60	22.15	29.01	30.78	32.69	32.69
49(最終)	596.8	615.4	614.9	603.0	603.0	553.9	567.1
合計 (μg)	641.1	642.0	637.1	632.0	633.8	586.6	599.8
回収率 (%)	94.4	94.5	93.8	93.0	93.3	86.4	88.3

()内は推計値

ピフェントリン濃度は試験開始22日目までに急速に減少したが、この減少は加水分解ではなく、主にピフェントリン結晶の沈殿と溶液表面への浮遊によるものであった。これはHPLCによ

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

るピークがビフェントリンのもののみであり、分解物等のピークはみられないことによって裏付けられた。

また、回収率が低濃度および高濃度試験において各々83.4~90.5、および86.4~94.5であり見かけ上の減少がみとめられたが、この原因は試料採取時にピペットに付着したり、抽出操作時における消失であった。

以上の結果から、本試験条件下においてビフェントリンの有意な加水分解はないと考えられた。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

9.4.2 水中での光分解性試験

(資料 No. M-4. 2)

試験機関: FMC Corporation (米国)

報告書作成年: 1985年

供試標識化合物:

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

供試水： 高純度 HPLC 級水 (pH 7.4, Burdick & Jackson)

光源： 野外試験：自然太陽光 (ニュージャージー州, Princeton)

室内試験：擬似太陽光 (G. E. 製太陽灯)

光強度 = $1500 \mu\text{W}/\text{cm}^2$ (測定波長範囲 = 300~400nm)

試験方法：

試験溶液の調製：標識化合物

が 1ppm となるようにアセトニトリル溶
液中で希釈した。増感剤添加区では、アセトンをさらに添加した。

試験溶液への光照射：各試料はホウケイ酸ガラス製アンブルに密封し、水浴(約 25°C)中に
入れた光照射用の平たいガラス製トレー中に置かれた。

試験溶液の分析：(野外試験) 増感剤非添加区は光照射後、0, 3, 7, 14, 21, 30 日に採
取された。

(室内試験) 増感剤添加区は光照射後、0, 1, 2, 3, 4, 6, 8 時間に、
増感剤非添加区は光照射後、0, 1, 3, 5, 7, 10, 14 日に採取された。

双方の試験において採取された試料は 2 連ずつ LSC 測定により計数し
た。総放射能収支及び物質収支のために、アンブル及びガラス器具は全て
アセトニトリルで洗浄した。水性試料については直接 HPLC で分析して、
親化合物及び分解物の生成物分布 % を求めた。

半減期の計算：TI プログラマブル 580 計算機を用いて時間(日)に対する \log [ビフェント
リンの %] の単純な直線回帰分析から光分解速度定数 (k) を導いた。半減期
($T_{1/2}$) は、以下の一次速度式から求めた。半減期 ($t_{1/2}$) = $0.693 / k$

結 果：

標識の自然太陽光試験についてのビフェントリン
及びその関連分解物の分布 % を、それぞれ表 1 及び 2 に、 標識の人工
太陽光試験での結果を表 3、増感剤を添加/非添加した 標識
の人工太陽光試験での結果を表 4 および 5 に要約した。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

光増感剤を添加しないで自然太陽光に暴露した場合、FMC 54800 は 254.7 日の平均半減期 ($T_{1/2}$) で、その相当する

生成物に転換した。人工光の Sunlamp を照射した場合は、FMC 54800 は非増感の及び増感(2%アセトン)させた溶液中において、それぞれ 11.9 及び 0.31 日の半減期 ($T_{1/2}$) で、その

生成物に転換した。放射性炭素の回収率は 90%を上回っており、親化合物には有意な損失がなく、揮発性の光分解物の生成も無視できる程度であったことを示していた。ビフェントリンの想定光分解経路を図 1 に示した。

また、北緯 35 度の春の太陽光に換算した場合の推定半減期を表 6 に示した。

表 6 北緯 35 度、春の太陽光に換算した推定半減期

光源	測定値	北緯 35 度 太陽光換算値
太陽光 (NJ 州)	254.7 日	230 日
人工光 (純水)	11.9 日	23 日
人工光 (増感剤添加水)	0.31 日	0.6 日

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

図1 ピフェントリンの想定光分解経路

9.4.3 水中光分解性試験の予備検討試験

(資料 No. M-4.3)

試験機関：株式会社化学分析コンサルタント

報告書作成年：2000年

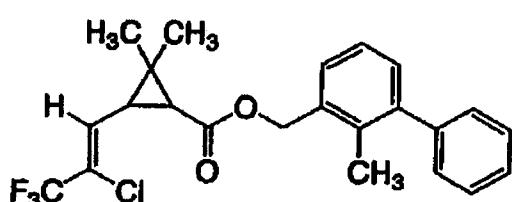
本試験は、ビフェントリンの水溶解度が 13ppt と極めて低いため、精度の高い分析法、および試験溶液の調整法を検討した後、参考までに水中光分解性の予備試験として実施した。

供試化合物：

名称：ビフェントリン

化学名：2-メチルビフェニル-3-イルメチル-(Z)-(1RS, 3RS)-3-(2-クロロ-3,3,3-トリフルオロ-プロパ-1-ニエル)-2,2-ジメチルシクロプロパンカルボキシラート

構造式：



供試水：
自然水：荒川中流（埼玉県志木市秋ヶ瀬取水口付近）で採取した河川水
精製水：滅菌精製水

分析法の検討：

10ppt 添加の回収試験：自然水と精製水各 500mL に 0.005 μg/mL アセトニトリル溶液 1mL を添加した 10ppt 試験溶液を調製して回収試験を行った。試料はヘキサンで抽出してアルミニカラムで精製後 ECD-GC で分析した。

試験溶液調製法の検討：

アセトニトリル添加量による回収試験：自然水と精製水にアセトニトリル添加量を 5%、10%、20% に変えて 0.1 μg/mL 溶液 500mL を調製し、25°C で 48 時間暗所に放置後、中間層から試料を採取して分析した。また、500mL 容ビーカーをアセトンで洗浄して付着残留したビフェントリン量を分析した。

水中光分解性予備試験：

光源：キセノン光照射装置（島津製作所製、サンテスター XF-180）

特殊 UV ガラスフィルター付（放射光の波長領域を 290nm 以上に制限）

光強度：36.2～36.4W/cm² (波長範囲 300～400nm)

401～404W/cm² (波長範囲 300～800nm)

試験溶液の調製：ビフェントリン 2 μg/mL を含むアセトニトリル溶液を供試水に加えてよく攪拌し、0.1 μg/mL 試験溶液（5%アセトニトリル含有）を調製した。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

試験溶液への光照射： 試験溶液は 10mL 容石英ガラス製共栓試験管に入れて、所定時間キセノン光を照射した。対照試験として光を遮蔽した暗所区も設定した。光照射区及び暗所区の温度は $25 \pm 2^{\circ}\text{C}$ で実施した。

試験溶液の分析： 光照射後、0、1、3、5、7 日後に試験溶液を採取した。試験溶液を採取後、試験管はアセトンで洗浄し、洗浄液は試験液にあわせて分析に供した。

結 果：

分析法の検討： ピフェントリンの検出限界は、試料量 10mL の場合 70ppt、500mL の場合は 2ppt となる。ピフェントリン 10ppt 溶液 500mL での回収率は、自然水で 94%、精製水で 90% であった。（表-1 参照）

試験溶液調整法の検討： 試験溶液の調製時にアセトニトリルの添加量が多いとビーカーへの付着量が増加する傾向が認められたが、試料採取後、ビーカーをアセトンで洗浄した合計の回収率はいずれも 82~88% であった。（表-2 参照）

水中光分解性予備試験： 光照射区では、ピフェントリンはいずれも時間と共に分解し、7 日後の残存率は自然水で 61%（推定半減期は約 12 日）、滅菌精製水で 54%（推定半減期は約 10 日）であった。しかし、対照の暗所区ではいずれも安定であった。（表-3 参照）

水中光分解性試験実施の可否： ピフェントリンの水溶解度は 13ppt と極めて低いため、水中光分解試験の試験溶液を水溶解度の 1/2 以下に調製し、通常用いられている 10mL 容石英試験管を用いての試験の実施は不可能である。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

表-1 10ppt ピフェントリン添加回収試験の結果（原報告書 表-1）

試料名	回収率(%)	平均値(%)
自然水-1 2 3 4 5	110	94
	94	
	94	
	88	
	86	
精製水-1 2 3 4 5	89	90
	101	
	79	
	85	
	96	

表-2 アセトニトリル添加量による回収試験の結果（原報告書 表-2）

	試験溶液 の濃度 ($\mu\text{g/mL}$)	平均値 ($\mu\text{g/mL}$)	溶液 500mL (μg)	ピーカー 付着量 (μg)	合計 (μg)	ピーカー 付着率 (%)	回収率 (%)
自然水-アセトニトリル 5%-1 2 3	0.079	0.080	40.0	2.0	42.0	4	84
	0.080						
	0.080						
自然水-アセトニトリル 10%-1 2 3	0.077	0.072	36.0	5.8	41.8	12	84
	0.071						
	0.069						
自然水-アセトニトリル 20%-1 2 3	0.064	0.058	29.0	13.5	42.5	27	85
	0.061						
	0.058						
精製水-アセトニトリル 5%-1 2 3	0.074	0.074	37.0	6.1	43.1	12	86
	0.073						
	0.074						
精製水-アセトニトリル 10%-1 2 3	0.058	0.059	29.5	11.5	41.0	23	82
	0.058						
	0.060						
精製水-アセトニトリル 20%-1 2 3	0.058	0.057	28.5	15.6	44.1	31	88
	0.059						
	0.054						

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

表-3 自然水及び滅菌精製水による水中光分解性の結果（原報告書 表-3）

経過日数		自然水の測定値 ($\mu\text{g/mL}$)			残存率	滅菌精製水の測定値 ($\mu\text{g/mL}$)			残存率
		測定値		平均値		測定値		平均値	
光 照 射 区	開始前	0.076	0.074	0.075	100	0.083	0.082	0.082	100
	1	0.064	0.062	0.063	84	0.065	0.067	0.066	80
	3	0.059	0.056	0.058	77	0.061	0.061	0.061	74
	5	0.047	0.046	0.046	61	0.046	0.049	0.048	59
	7	0.043	0.050	0.046	61	0.044	0.044	0.044	54
	開始前	0.076	0.074	0.075	100	0.083	0.082	0.082	100
	1	0.080	0.077	0.078	104	0.079	0.081	0.080	98
暗 所 区	3	0.079	0.081	0.080	106	0.084	0.085	0.084	102
	5	0.076	0.078	0.077	103	0.077	0.079	0.078	95
	7	0.085	0.081	0.083	110	0.087	0.089	0.088	107

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

9.4.4 土壌表面および土壌中の光分解

(資料 No. M-4.4)

試験機関：FMC生物化学研究所

報告書作成年：1986年

供試標識化合物：

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

供試土壤 :

土性区分	土壤構成成分 (%)			有機質含有量 (%)	イオン交換用量 (meq/100g)	pH	仮比重
	砂	シルト	粘土				
シルト壤土	24.8	60.0	15.2	2.1	10.9	4.8	1.2

方 法 :

処理 ; シルト壤土は乾燥後、ふるいわけしてから滅菌(121°C、2回)を行った。ペトリ皿に蒸留水10mlおよび土壤4.9gを入れ厚さ0.5mmになるように1晩乾燥させた。

ビフェントリンをプレート当たり の場合 $1.82\mu\text{Ci}$ 、 の場合 $0.65\mu\text{Ci}$

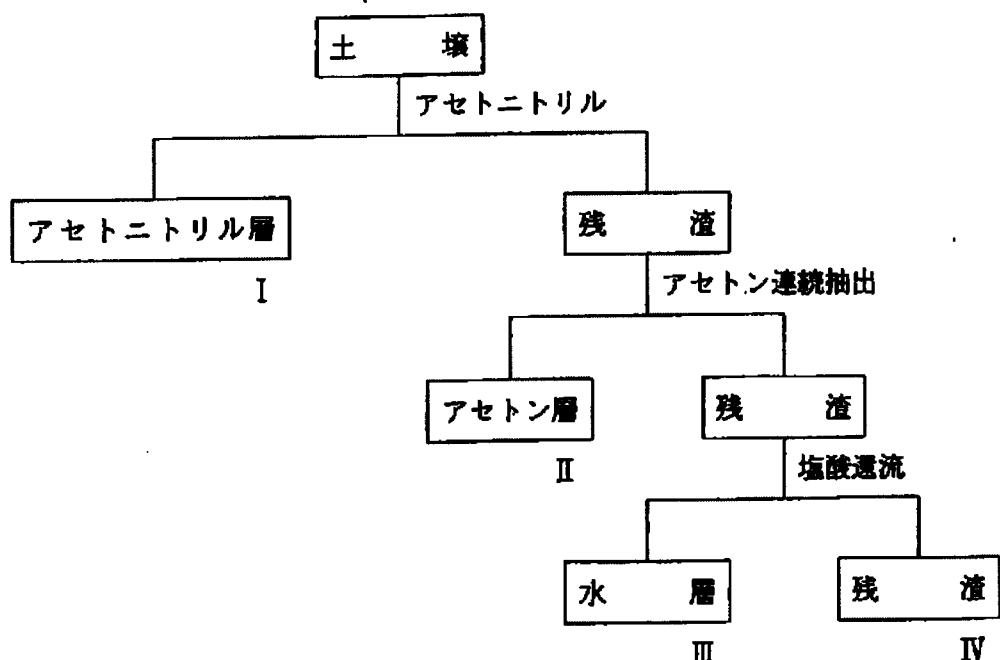
処理した。ガラス製のふたをプラスチックテープでシールした。

光化学実験 ; 自然光に30日間曝露した。日光照射の状況、温度、湿度、風について記録した。

土壤プレートは雨がかかるないようボロシリケート製のガラスで覆い、また日光の照射により温度が上昇しないように2重の水浴で冷却した。対照として半数の土壤プレートはアルミニウムで遮光した。温度は20~30°Cに保った。

試料採取 ; 2反復で光照射後 0、3、7、14、21および30日に採取した。対照群も同時点で採取した。

土壤抽出 ; 抽出の概要を下図に示した。



分析 ; 燃焼分析、液体シンチレーション計数および高速液体クロマトグラフィーを用いた。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本試験の結果は以下のように要約される。

- ①土壤表面上のピフェントリンは太陽光線によって徐々に光分解する。
 - ②シス配置からトランス配置への異性化、エステル結合の分解が認められた。
-
- ③この条件下の半減期は 104日であった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

代謝・分解のとりまとめ

1.動物体中の代謝

ビフェントリンを動物に経口投与した場合、血中濃度は徐々に上昇し投与後6時間でピークに達しその後減少に転じた。オートラジオグラフィによる組織内残留濃度も投与後6時間で最高濃度となり、特に消化管、肝臓および腎泌尿器系に濃度が高く、その他心臓および脂肪に放射能が認められた。各組織、臓器の放射能は時間とともに減少し、96時間で検出限界以下となったが、脂肪中放射能は192時間後も中程度の残留濃度であった。投与直後中枢神経系に放射能が検出されなかつことは血液／脳関門を通過する量は少ないものと判断される。投与した大部分が投与後48～72時間で排泄され、7日間に90～96%の排泄率を示し、組織内残留は3%前後であった。脂肪中の濃度が他の臓器に比して放射能が高かった。排泄の経路は糞が主要な経路でついで尿であったが、呼気中CO₂には無かつた。

代謝物および排泄の様式に関しては性別、投与量、投与回数に差がなかった。

70日間毎日ビフェントリン0.5mg/kgラットに投与し、その後85日間の回復期間を設け、この間の組織および臓器内の残留量を経時的に調査した結果、各臓器内の半減期は肝臓で19日、腎臓で28日、脂肪で51日、皮膚で50日、卵巣で40日、坐骨神経で40日で、特定部分への蓄積はなかつた。全血液中濃度と血漿中濃度が類似していたことから、血球中への放射能の取込みはほとんどないと考えられた。

代謝物は尿中では加水分解物および酸化的加水分解物が主で糞中には親化合物が多かつた。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

2.植物体中の代謝

体内移行試験では、リンゴにおいて、果実表面に処理したビフェントリンは表皮にとどまり果肉に滲透移行することはなかった。ワタの葉に処理した場合、無処理の茎葉、被包、ワタおよび種子に放射能を認めなかった。また、トウモロコシにおいて、土壤処理した場合の標識ビフェントリンはサイレージ期および成熟期の茎葉および雌穂への移行を認めず、茎葉および苞皮に処理した場合も子実への移行は認められなかった。これらのとおり、植物体内においてビフェントリンおよびその代謝物の吸収・移行は認められなかった。

3.土壤中の代謝

好気性土壤（シルト質土壤土、砂質土壤土、シルト土壤）にビフェントリンを処理した場合、加水分解と酸化により分解し半減期は 50～205 日であった。CO₂ 発生量は 180 日間で 13.4～36.6%、親化合物は 33.0～54.8% 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エフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

4. 土壌中の移行性

土壌中のピフェントリンおよび有機溶媒可溶代謝物の移行性は、砂土において極小、他の土壌においては非移行性と分類された。

5. 土壌における吸脱着

砂壤土、シルト土壌、埴壤土、細砂土の4種の土壌を用いた試験においては、土壌吸着係数はピフェントリンでは $K_d=992\sim5429$ であり、ペルメトリンのそれが $K_d=367\sim2403$ であった。従って、ピフェントリンはペルメトリンよりも強い吸着性を示す。脱着係数は各々 $K_d'=3342\sim11610$ 、および $K_d'=843\sim2520$ であった。従って、土壌中の移行による地下水汚染の危険性は少ないものと考えられる。

6. 水中光分解

純水(30%アセトニトリル含む)にピフェントリンを処理し、太陽光又は人工光を照射した場合、半減期はそれぞれ、254.7日および11.9日であり、北緯35度太陽光に換算した場合はそれぞれ230日および23日であった。また、人工光で溶液に光増感剤を添加した場合は分解が促進された。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

7. 加水分解性

pH 5.0、7.0 および 9.0 の暗黒条件下における加水分解は有意なものではなかった。

ビフェントリンの種々の代謝試験の結果は以下のとおり総括される。

ビフェントリンの動物体内、植物体内、土壤中および光における各主要代謝・分解経路は類似しており、動物体内と異なった特記すべき代謝・分解物は植物体内および土壤中に認められなかった。また、親化合物ビフェントリンを含め、多くの代謝物が動物体内および土壤中に蓄積する有力な証拠はなく、土壤中の移行による地下水汚染等、環境に与える影響は少ないものと考えられた。

8. 土壌表面の光分解

殺菌した土壤表面にビフェントリンを処理し、太陽光に暴露した場合、徐々に異性化および加水分解が認められた。半減期は、104 日であった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

動植物、土壤および光等における（推定）代謝・分解経路図

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はエフエムシー・ケミカルズ株式会社にある。

[付録] ピフェントリンの開発年表