

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

(4) キャベツにおける代謝試験

(資料 11-1-4)

試験機関 : 三井化学(株)

報告書作成年 : 2000 年

供試標識化合物:

略称: [F-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 放射化学的純度:

略称: [G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 放射化学的純度:

供試植物: キャベツ(シキドリ)

試験方法:

1) 葉面処理代謝試験

ガラス製ビーカーに土壌を入れ、キャベツ苗 1 本を移植した。4~5 葉期に、[F-<sup>14</sup>C]ジノテフランおよび[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン各 25 μg(実圃場で散布した場合の想定付着量)を混合し、アセトン溶液で第 3 葉の葉面に処理した。その後人工気象室内で栽培した。処理葉、その他地上部、根部および土壌を 19 日後まで経時的に採取した。

2) 土壌処理代謝試験

ガラス製ビーカーに土壌を入れ、キャベツ苗 1 本を移植した。2~3 葉期に、[F-<sup>14</sup>C]ジノテフランおよび[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン各 25 μg(実圃場で施用した場合の想定処理量)を混合し、アセトン溶液で土壌に処理した。その後人工気象室内で栽培した。地上部、根部および土壌を 43 日後まで経時的に採取した。

3) 分析方法

各部位は、抽出後に放射能量の測定と成分の解析、定量を行った。葉面処理代謝試験における処理葉については、溶媒によるリンスを行った後に抽出した。代謝物の解析は LC/MS により、定量は HPLC および TLC により行った。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

試験結果：放射能分布の経時変化を表1および2に、ジノテフランの経時変化を表3および4に、代謝物組成を表5および表6に示した。

申請者注：本文中の回収率、残留量等については、表中の数値を四捨五入して記載した。

### 1) 放射能分布

- ① 葉面処理代謝試験 19日後の放射能回収率は82%であった。処理葉で81%、その他地上部で1%、根部で0.1%が検出された。放射能回収率が低下したことから、二酸化炭素などの揮発性成分が生成していると考えられた。
- ② 土壌処理代謝試験 43日後の放射能回収率は79%であった。土壌に処理した放射能の40%が植物体に吸収され、地上部で38%、根部で1%、土壌で39%が検出された。

### 2) ジノテフランの経時変化

- ① 葉面処理代謝試験 処理葉のジノテフランは経時的に減衰し、19日後に残存放射能量の30%(16ppm)となった。処理葉における半減期は9.3日であった。
- ② 土壌処理代謝試験 地上部残存放射能中のジノテフランは経時的に減衰し、43日後に残存放射能量の24%(0.4ppm)となった。

### 3) 代謝物

各試験における主な代謝物を以下に示した。

#### ① 葉面処理代謝試験

処理葉(11日後)における残存放射能量の88%について、同定または化学的特徴付けが可能であった。

#### ② 土壌処理代謝試験

地上部(43日後)における残存放射能量の83%について、同定または化学的特徴付けが可能であった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

#### 4) 代謝経路

表1 葉面処理代謝試験における放射能分布の経時変化(処理量に対する割合(%))

供試化合物	分析対象	処理後時間(日)			
		0	5	11	19
$[F-^{14}C]$ ジノテフラン + $[G-^{14}C]$ ジノテフラン	処理葉	93.62	91.78	87.15	81.39
	リンス部	90.25	80.97	61.25	36.12
	抽出部	3.35	10.41	24.87	42.50
	ヘキサン部	0.02	0.20	0.48	0.57
	抽出残渣	<0.005	0.20	0.55	2.20
	その他地上部	NA	0.33	0.79	0.75
	根部	NA	0.02	0.08	0.14
	放射能回収率	93.62	92.13	88.02	82.28

NA: 分析せず

表2 土壌処理代謝試験における放射能分布の経時変化(処理量に対する割合(%))

供試化合物	分析対象	処理後時間(日)			
		0	11	28	43
$[F-^{14}C]$ ジノテフラン + $[G-^{14}C]$ ジノテフラン	地上部	NA	8.24	27.92	38.38
	根部	NA	0.43	0.85	1.41
	土壌	105.48	83.41	52.51	38.96
	放射能回収率	105.48	92.08	81.28	78.75

NA: 分析せず

表3 葉面処理代謝試験におけるジノテフランの経時変化

(残存放射能量に対する割合%)( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物	分析対象	処理後時間(日)			
		0	5	11	19
$[F-^{14}C]$ ジノテフラン+ $[G-^{14}C]$ ジノテフラン	処理葉	98.14 (135.1)	75.47 (69.27)	54.24 (39.39)	29.79 (16.38)

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

表 4 土壌処理代謝試験におけるジノテフランの経時変化  
(残存放射能量に対する割合(%)、( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物	分析対象	処理後時間(日)			
		0	11	28	43
[F- <sup>14</sup> C]ジノテフラン+ [G- <sup>14</sup> C]ジノテフラン	地上部	NA	61.22 (0.93)	37.70 (0.57)	23.95 (0.38)

NA: 分析せず

表 5 葉面処理代謝試験における代謝物組成  
(残存放射能量に対する割合(%)、( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物	[F- <sup>14</sup> C]ジノテフラン+[G- <sup>14</sup> C]ジノテフラン		
処理後時間	5日	11日	19日
分析対象	処理葉	処理葉	処理葉
代 謝 物 組 成	ジノテフラン 75.47(69.27)	54.24(39.39)	29.79(16.38)
合計			

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

表 6 土壌処理代謝試験における代謝物組成

(残存放射能量に対する割合(%)、( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物		[F- <sup>14</sup> C]ジ'ノテフラン + [G- <sup>14</sup> C]ジ'ノテフラン		
処理後時間		11日	35日	43日
分析対象		地上部	地上部	地上部
代 謝 物 組 成	ジ'ノテフラン	61.22(0.93)	24.21(0.39)	23.95(0.38)
	合計			

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

(5) キュウリにおける代謝試験

(資料 11-1-5)

試験機関：三井化学(株)

報告書作成年：2000年

供試標識化合物：

略称：[F-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 放射化学的純度：

略称：[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 放射化学的純度：

供試植物：キュウリ(サガミハンシロ)

試験方法：

1) 葉面処理代謝試験

ガラス製ビーカーに土壌を入れ、キュウリ苗1本を移植した。3~4葉期に、[F-<sup>14</sup>C]ジノテフランまたは[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン50μg(実圃場で散布した場合の想定付着量)をアセトン溶液で、第3葉の葉面に処理した。処理後は人工気象室内で栽培した。処理葉、その他地上部および根部を15日後まで経時的に採取した。

2) 土壌処理代謝試験

ガラス製ビーカーに土壌を入れ、キュウリ苗1本を移植した。1~2葉期に、[F-<sup>14</sup>C]ジノテフランまたは[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン50μg(実圃場で施用した場合の想定処理量)をアセトン溶液で、土壌に処理した。処理後は人工気象室内で栽培した。地上部、根部および土壌を20日後まで経時的に採取した。

3) 代謝試験

4) 分析方法

各部位は、抽出後に放射能量の測定と成分の解析、定量を行った。葉面処理代謝試験における処理葉については、溶媒によるリンスを行った後に抽出した。代謝物の解析はLC/MSにより、定量はHPLCおよびTLCにより行った。

試験結果：放射能分布の経時変化を表1~3に、ジノテフランの経時変化を表4~6に、代謝物組成を表7~9に示した。

申請者注：本文中の回収率、残留量等については、表中の数値を四捨五入して記載した。

## 1) 放射能分布

- ① 葉面処理代謝試験 9日後の放射能回収率は 88~94% ( $[F-^{14}C] \sim [G-^{14}C]$ ) であった。処理葉で 81~92% ( $[F-^{14}C] \sim [G-^{14}C]$ )、その他地上部で 2~6% ( $[G-^{14}C] \sim [F-^{14}C]$ )、根部で 0.3~0.5% ( $[G-^{14}C] \sim [F-^{14}C]$ ) が検出された。放射能回収率が低下したことから、二酸化炭素などの揮発性成分が生成していると考えられた。
- ② 土壌処理代謝試験 20日後の放射能回収率は 93~96% ( $[G-^{14}C] \sim [F-^{14}C]$ ) であった。土壌に処理した放射能の 28~37% ( $[F-^{14}C] \sim [G-^{14}C]$ ) が植物体に吸収され、地上部で 28~36% ( $[F-^{14}C] \sim [G-^{14}C]$ )、根部で 0.2~0.6% ( $[F-^{14}C] \sim [G-^{14}C]$ )、土壌で 57~68% ( $[G-^{14}C] \sim [F-^{14}C]$ ) が検出された。
- ③

## 2) ジノテフランの経時変化

- ① 葉面処理代謝試験 処理葉のジノテフランは経時的に減衰し、9日後に残存放射能量の 60~67% ( $[F-^{14}C] \sim [G-^{14}C]$ ) となった。処理葉における半減期は  $[F-^{14}C]$  で約 9 日、 $[G-^{14}C]$  で約 12 日であった。
- ② 土壌処理代謝試験 地上部残存放射能中のジノテフランは経時的に減衰し、20日後に残存放射能量の 37~56% ( $[G-^{14}C] \sim [F-^{14}C]$ ) となった。
- ③

## 3) 代謝物

各試験における主な代謝物を以下に示した。

- ① 葉面処理代謝試験  
処理葉( $[F-^{14}C]$  は 9 日後、 $[G-^{14}C]$  は 15 日後)  
処理葉( $[F-^{14}C]$  は 9 日後、 $[G-^{14}C]$  は 15 日後)における残存放射能量の 91~92% ( $[G-^{14}C] \sim [F-^{14}C]$ ) について、同定または化学的特徴付けが可能であった。
- ② 土壌処理代謝試験  
地上部(20 日後)

地上部(20 日後)における残存放射能量の 79~90% ( $[G-^{14}C] \sim [F-^{14}C]$ ) について、同定または化学的特徴付けが可能であった。

- ③

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

#### 4) 代謝経路

表1 葉面処理代謝試験における放射能分布の経時変化(処理量に対する割合(%))

供試化合物	分析対象	処理後時間(日)			
		0	3	9	15
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	処理葉	96.33	92.38	81.33	NA
	リンス部	71.53	41.89	14.71	NA
	抽出部	23.84	49.18	63.77	NA
	ヘキサン部	0.96	0.51	0.50	NA
	抽出残渣	<0.005	0.80	2.35	NA
	その他地上部	NA	2.31	5.98	NA
	根部	NA	0.27	0.53	NA
	放射能回収率	96.33	94.96	87.84	NA
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	処理葉	97.03	93.61	91.84	86.27
	リンス部	80.54	54.00	52.17	44.80
	抽出部	13.39	37.76	36.83	37.65
	ヘキサン部	3.10	0.85	0.69	0.37
	抽出残渣	<0.005	1.00	2.15	3.45
	その他地上部	NA	1.01	2.19	2.87
	根部	NA	0.13	0.33	0.53
	放射能回収率	97.03	94.75	94.36	89.67

NA: 分析せず

表2 土壌処理代謝試験における放射能分布の経時変化(処理量に対する割合(%))

供試化合物	分析対象	処理後時間(日)				
		0	6	10	14(15) *1	20
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	地上部	NA	9.06	13.34	18.91	27.92
	根部	NA	0.40	0.35	0.48	0.23
	土壌	96.48	90.06	81.98	76.91	67.81
	放射能回収率	96.48	99.52	95.67	96.30	95.96
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	地上部	NA	15.96	22.35	32.39	36.05
	根部	NA	1.61	1.70	1.74	0.62
	土壌	94.26	77.02	67.64	60.28	56.55
	放射能回収率	94.26	94.59	91.69	94.41	93.22

NA: 分析せず

\*1: F-<sup>14</sup>C は 14 日、G-<sup>14</sup>C は 15 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三井化学アグロ株式会社にある。

表 3 可食部代謝試験における放射能分布の経時変化(処理量に対する割合(%))

供試化合物	分析対象	処理後時間(日)	
		3	6(7) *1
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	果実部	95.31	93.40
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	果実部	97.32	94.73

\*1: F-<sup>14</sup>C は 6 日、G-<sup>14</sup>C は 7 日

表 4 葉面処理代謝試験におけるジノテフランの経時変化

(残存放射能量に対する割合%、( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物	分析対象	処理後時間(日)			
		0	3	9	15
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	処理葉	97.92 (NA)	83.17 (31.75)	59.85 (15.12)	NA (NA)
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	処理葉	95.60 (NA)	82.83 (47.28)	67.41 (30.05)	52.82 (20.16)

NA: 分析せず

表 5 土壌処理代謝試験におけるジノテフランの経時変化

(残存放射能量に対する割合%、( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物	分析対象	処理後時間(日)				
		0	6	10	14(15) *1	20
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	地上部	NA	67.32 (1.18)	65.82 (0.72)	61.48 (0.58)	55.64 (0.85)
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	地上部	NA	73.63 (1.10)	66.17 (0.95)	49.41 (0.69)	37.34 (0.61)

NA: 分析せず

\*1: F-<sup>14</sup>C は 14 日、G-<sup>14</sup>C は 15 日

表 6 におけるジノテフランの経時変化

(残存放射能量に対する割合%、( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物			
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン			
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン			

\*1: F-<sup>14</sup>C は 6 日、G-<sup>14</sup>C は 7 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三井化学アグロ株式会社にある。

表7 葉面処理代謝試験における代謝物組成

(残存放射能量に対する割合(%)、( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物		[F- <sup>14</sup> C]ジノテフラン			
処理後時間		3日	6日	9日	15日
分析対象		処理葉	処理葉	処理葉	処理葉
代 謝 物 組 成	ジノテフラン	83.17(31.75)	61.40(21.34)	59.85(15.12)	NA
	合計				

供試化合物		[G- <sup>14</sup> C]ジノテフラン			
処理後時間		3日	6日	9日	15日
分析対象		処理葉	処理葉	処理葉	処理葉
代 謝 物 組 成	ジノテフラン	82.83(47.28)	72.86(33.65)	67.41(30.05)	52.82(20.16)
	合計				

NA: 分析せず

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

表8 土壌処理代謝試験における代謝物組成  
(残存放射能量に対する割合(%)、( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物		[F- <sup>14</sup> C]ジノテフラン		
処理後時間		6日	14日	20日
分析対象		地上部	地上部	地上部
代 謝 物 組 成	ジノテフラン	67.32(1.18)	61.48(0.58)	55.64(0.85)
	合計			

供試化合物		[G- <sup>14</sup> C]ジノテフラン		
処理後時間		6日	15日	20日
分析対象		地上部	地上部	地上部
代 謝 物 組 成	ジノテフラン	73.63(1.10)	49.41(0.69)	37.34(0.61)
	合計			

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

表 9

代謝物組成

(残存放射能量に対する割合(%)、( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物			
処理後時間			
分析対象			
代謝物 組成	ジノテフラン		
合計			

供試化合物			
処理後時間			
分析対象			
代謝物 組成	ジノテフラン		
合計			

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

(6) インゲンにおける代謝試験

(資料 11-1-6)

試験機関：三井化学(株)

報告書作成年：2000年

供試標識化合物：

略称：[F-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 放射化学的純度：

略称：[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 放射化学的純度：

供試植物：インゲン(グリーントップ)

試験方法：

1) 葉面処理代謝試験

ガラス製ビーカーに土壤を入れ、インゲン苗1本を移植した。4葉期に、[F-<sup>14</sup>C]ジノテフランおよび[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン各25μg(実圃場で散布した場合の想定付着量)を混合し、アセトン溶液で第3葉の葉面に処理した。処理後は人工気象室内で栽培した。豆、さや、処理葉、処理葉の脇葉、その他地上部および根部を27日後まで、経時的に採取した。

2) 土壌処理代謝試験

ガラス製ビーカーに土壤を入れ、インゲン苗1本を移植した。2~3葉期に、[F-<sup>14</sup>C]ジノテフランまたは[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン50μg(実圃場で施用した場合の想定処理量)をアセトン溶液で、土壤に処理した。処理後は人工気象室内で栽培した。豆、さや、地上部、根部および土壤を55日後まで、経時的に採取した。

3) 撥発性成分の捕集試験

ガラス製ビーカーに土壤を入れ、インゲン苗1本を移植した。3葉期に、[F-<sup>14</sup>C]ジノテフランまたは[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン50μg(実圃場で散布した場合の想定付着量)をアセトン溶液で、第2葉の葉面に処理した。処理葉を透光性の樹脂製容器に入れ、トラップ(二酸化炭素捕集用：2N水酸化カリウム水溶液、他の揮発性成分捕集用：エチレングリコール)を接続して揮発性成分を捕集した。処理後は人工気象室内で栽培した。処理11日後に、処理葉、その他地上部、根部および土壤を採取した。

4)

5)

## 6) 分析方法

各部位は、抽出後に放射能量の測定と成分の解析、定量を行った。葉面処理代謝試験および揮発性成分の捕集試験における処理葉については溶媒によるリンスを行った後に抽出した。代謝物の解析は LC/MS により、定量は HPLC および TLC により行った。

試験結果： 放射能分布の経時変化を表 1～5 に、ジノテフランの経時変化を表 6～9 に、代謝物組成を表 10～13 に示した。

申請者注： 本文中の回収率、残留量等については、表中の数値を四捨五入して記載した。

### 1) 放射能分布

- ① 葉面処理代謝試験 27 日後の放射能回収率は 86% であった。豆で 0.2%、さやで 1%、処理葉で 83%、処理葉の脇葉で 0.3%、その他地上部で 0.8%、根部で 0.3%、土壤で 0.5% が検出された。
- ② 土壌処理代謝試験 55 日後の放射能回収率は 92～100% ( $[F-^{14}C] \sim [G-^{14}C]$ ) であった。土壌に処理した放射能は 15～25% ( $[F-^{14}C] \sim [G-^{14}C]$ ) が植物体に吸収され、豆で 0.3%、さやで 1%、地上部で 13～23% ( $[F-^{14}C] \sim [G-^{14}C]$ )、根部で 1%、土壤で 75～77% ( $[G-^{14}C] \sim [F-^{14}C]$ ) が検出された。
- ③ 挥発性成分の捕集試験 11 日後の放射能回収率は 90～95% ( $[F-^{14}C] \sim [G-^{14}C]$ ) であり、二酸化炭素が 0.1～0.2% ( $[G-^{14}C] \sim [F-^{14}C]$ )、その他の揮発性成分が 0.04～0.2% ( $[G-^{14}C] \sim [F-^{14}C]$ ) 検出された。
- ④

### 2) ジノテフランの経時変化

- ① 葉面処理代謝試験 処理葉のジノテフランは経時的に減衰し、27 日後に残存放射能量の 21% となった。処理葉における半減期は 10.1 日であった。
- ② 土壌処理代謝試験 地上部残存放射能中のジノテフランは経時的に減衰し、55

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

日後に残存放射能量の3~8% ( $[G-^{14}C] \sim [F-^{14}C]$ )となつた。

③

### 3) 代謝物

各試験における主な代謝物を以下に示した。

#### ① 葉面処理代謝試験

処理葉(10日後)

処理葉(10日後)における残存放射能量の94%について、同定または化学的特徴付けが可能であった。

#### ② 土壌処理代謝試験

地上部(55日後)

地上部(55日後)における残存放射能量の70~81% ( $[F-^{14}C] \sim [G-^{14}C]$ )について、同定または化学的特徴付けが可能であった。

③

#### 4) 代謝経路

表 1 葉面処理代謝試験における放射能分布の経時変化(処理量に対する割合(%))

供試化合物	分析対象	処理後時間(日)			
		0	10	20	27
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン + [G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	豆	NA	NA	NA	0.19
	さや	NA	NA	0.35	1.21
	処理葉	95.73	94.15	86.65	82.57
	リンス部	86.80	60.50	45.00	31.70
	抽出部	8.85	32.55	40.00	49.60
	抽出残渣	0.08	1.10	1.65	1.27
	脇葉	NA	0.22	0.61	0.27
	その他地上部	NA	0.68	0.68	0.83
	根部	NA	0.18	0.97	0.33
	土壌	0.29	0.46	0.51	0.47
放射能回収率		96.02	95.69	89.77	85.87

NA: 分析せず

表 2 土壌処理代謝試験における放射能分布の経時変化(処理量に対する割合(%))

供試化合物	分析対象	処理後時間(日)			
		0	22	40	55
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	豆	NA	NA	0.01	0.27
	さや	NA	NA	0.49	1.22
	地上部	NA	9.64	10.03	12.87
	根部	NA	1.43	0.80	1.09
	土壌	102.17	79.26	81.28	76.58
	放射能回収率	102.17	90.33	92.61	92.03
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	豆	NA	NA	0.06	0.33
	さや	NA	NA	0.83	1.36
	地上部	NA	5.79	14.57	22.90
	根部	NA	0.75	1.00	0.75
	土壌	101.75	90.26	82.32	74.64
	放射能回収率	101.75	96.80	98.78	99.98

NA: 分析せず

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

表 3 挥発性成分の捕集試験における放射能分布

(処理 11 日後、処理量に対する割合(%))

供試化合物	分析対象						
	処理葉	その他地上部	根部	土壌	二酸化炭素	その他の揮発性成分	放射能回収率
[F- <sup>14</sup> C]ジノテフラン	84.54	2.96	1.30	0.39	0.24	0.20	89.63
[G- <sup>14</sup> C]ジノテフラン	92.63	0.73	0.27	0.87	0.11	0.04	94.65

表 4 における放射能分布の経時変化(処理量に対する割合(%))

供試化合物		分析対象		
[F- <sup>14</sup> C]ジノテフラン				
[G- <sup>14</sup> C]ジノテフラン				

表 5 における放射能分布の経時変化(処理量に対する割合(%))

供試化合物		分析対象		
[F- <sup>14</sup> C]ジノテフラン				
[G- <sup>14</sup> C]ジノテフラン				

表 6 葉面処理代謝試験におけるジノテフランの経時変化

(残存放射能量に対する割合%)( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物	分析対象	処理後時間(日)			
		0	10	20	27
[F- <sup>14</sup> C]ジノテフラン + [G- <sup>14</sup> C]ジノテフラン	処理葉	96.97 (244.29)	52.75 (37.63)	33.23 (23.60)	21.17 (15.07)

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

表 7 土壌処理代謝試験におけるジノテフランの経時変化  
(残存放射能量に対する割合(%)、( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物	分析対象	処理後時間(日)			
		0	22	40	55
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	地上部	NA	34.50 (0.30)	20.13 (0.17)	8.27 (0.09)
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	地上部	NA	32.03 (0.12)	9.64 (0.10)	2.72 (0.04)

NA: 分析せず

表 8  
におけるジノテフランの経時変化  
(残存放射能量に対する割合(%)、( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物				
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン				
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン				

表 9  
におけるジノテフランの経時変化

供試化合物			
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン			
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン			

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

表 10 葉面処理代謝試験における代謝物組成  
(残存放射能量に対する割合(%)、( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物		[F- <sup>14</sup> C]ジノテフラン + [G- <sup>14</sup> C]ジノテフラン		
処理後時間		10 日	20 日	27 日
分析対象		処理葉	処理葉	処理葉
代 謝 物 組 成	ジノテフラン	52.75(37.63)	33.23(23.60)	21.17(15.07)
	合計			

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

表 11 土壌処理代謝試験における代謝物組成  
(残存放射能量に対する割合(%)、( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物		[F- <sup>14</sup> C]ジノテフラン		
処理後時間		22 日	40 日	55 日
分析対象		地上部	地上部	地上部
代 謝 物 組 成	ジノテフラン	34.50(0.30)	20.13(0.17)	8.27(0.09)
	合計			

供試化合物		[G- <sup>14</sup> C]ジノテフラン		
処理後時間		22 日	40 日	55 日
分析対象		地上部	地上部	地上部
代 謝 物 組 成	ジノテフラン	32.03(0.12)	9.64(0.10)	2.72(0.04)
	合計			

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

表 12  
(残存放射能量に対する割合(%)、( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物				
処理後時間				
分析対象				
代 謝 物 組 成	ジノテフラン			
	合計			

表 13  
(残存放射能量に対する割合(%)、( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物				
処理後時間				
分析対象				
代 謝 物 組 成	ジノテフラン			
	合計			

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

(7) イチゴにおける代謝試験

(資料 11-1-7)

試験機関：三井化学(株)

報告書作成年：2000年

供試標識化合物：

略称：[F-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 放射化学的純度：

略称：[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 放射化学的純度：

供試植物：イチゴ(トヨノカ)

試験方法：

1) 葉面処理代謝試験

ビニールポットに土壌を入れ、イチゴ苗1本を移植した。4週後、[F-<sup>14</sup>C]ジノテフランまたは[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 50 μg(実圃場で散布した場合の想定付着量)をアセトン溶液で、第1葉の葉面に処理した。その後は人工気象室内で栽培した。果実部、処理葉、その他地上部、根部および土壌を29日後まで経時的に採取した。

2)

3) 分析方法

各部位は、抽出後に放射能量の測定と成分の解析、定量を行った。葉面処理代謝試験における処理葉および可食部代謝試験における果実部については溶媒によるリンスを行った後に抽出した。代謝物の解析はLC/MSにより、定量はHPLCおよびTLCにより行った。

試験結果：放射能分布の経時変化を表1および2に、ジノテフランの経時変化を表3および4に、代謝物組成を表5および6に示した。

申請者注：本文中の回収率、残留量等については、表中の数値を四捨五入して記載した。

1) 放射能分布

① 葉面処理代謝試験 29日後の放射能回収率は86～88%([F-<sup>14</sup>C]～[G-<sup>14</sup>C])であった。果実部で0.7～1%([G-<sup>14</sup>C]～[F-<sup>14</sup>C])、処理葉で84～86%([F-<sup>14</sup>C]～[G-<sup>14</sup>C])、その他地上部で1%、根部で0.04～0.1%([F-<sup>14</sup>C]～[G-<sup>14</sup>C])、土壌で0.2

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

～0.3% ( $[G-^{14}C] \sim [F-^{14}C]$ )が検出された。放射能回収率が低下したことから、二酸化炭素などの揮発性成分が生成していると考えられた。

②

## 2) ジノテフランの経時変化

① 葉面処理代謝試験 処理葉のジノテフランは経時的に減衰し、29日後に残存放射能量の42～46% ( $[G-^{14}C] \sim [F-^{14}C]$ )となった。処理葉における半減期は  $[F-^{14}C]$  で 19.5 日、 $[G-^{14}C]$  で 18.2 日であった。29日後の果実部において、ジノテフランは残存放射能量の 21～40% ( $[F-^{14}C] \sim [G-^{14}C]$ ) であり、その濃度は 0.02～0.04ppm ( $[F-^{14}C] \sim [G-^{14}C]$ ) であった。

②

## 3) 代謝物

各試験における主な代謝物を以下に示した。

① 葉面処理代謝試験

処理葉(29日後)

果実部(29日後)

処理葉(29日後)における残存放射能量の 82～83% ( $[F-^{14}C] \sim [G-^{14}C]$ )、果実部(29日後)における残存放射能量の 77～82% ( $[G-^{14}C] \sim [F-^{14}C]$ )について、同定または化学的特徴付けが可能であった。

果実部(29日後)において検出された代謝物の濃度は、いずれも 0.05ppm 以下であった。

②

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

#### 4) 代謝経路

表1 葉面処理代謝試験における放射能分布の経時変化(処理量に対する割合(%))

供試 化合物	分析対象	処理後時間(日)			
		0	8	20	29
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	果実部	NA	NA	0.51	1.04
	抽出部	NA	NA	0.50	1.02
	抽出残渣	NA	NA	0.01	0.02
	処理葉	96.40	88.52	83.84	83.72
	リンス部	95.39	75.00	61.18	43.42
	抽出部	1.01	12.89	21.32	36.84
	抽出残渣	<0.005	0.63	1.34	3.46
	その他地上部	NA	0.45	1.06	1.34
	根部	NA	0.12	0.05	0.04
	土壤	NA	0.13	0.21	0.29
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	放射能回収率	96.40	89.22	85.67	86.43
	果実部	NA	NA	0.45	0.65
	抽出部	NA	NA	0.44	0.61
	抽出残渣	NA	NA	0.01	0.04
	処理葉	98.60	92.63	87.66	85.77
	リンス部	91.08	68.47	54.84	52.54
	抽出部	7.52	23.22	31.24	29.62
	抽出残渣	<0.005	0.94	1.58	3.61
	その他地上部	NA	0.73	0.85	0.95
	根部	NA	0.14	0.06	0.09
放射能回収率	土壤	NA	0.13	0.10	0.17
	放射能回収率	98.60	93.63	89.12	87.63

NA: 分析せず

表 2

放射能分布の経時変化(処理量に対する割合(%))

供試 化合物					
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン					
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン					

表 3 葉面処理代謝試験におけるジノテフランの経時変化  
(残存放射能量に対する割合%、( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物	分析対象	処理後時間(日)			
		0	8	20	29
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	処理葉	98.52 (80.06)	73.24 (38.14)	56.49 (38.66)	45.67 (24.20)
	果実部	NA	NA	30.37 (0.01)	21.33 (0.02)
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	処理葉	96.58 (67.97)	67.42 (38.08)	50.26 (29.03)	42.35 (20.18)
	果実部	NA	NA	46.64 (0.02)	39.95 (0.04)

NA: 分析せず

表 4 におけるジノテフランの経時変化  
(残存放射能量に対する割合%、( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物					
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン					
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン					

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

表 5 葉面処理代謝試験における代謝物組成

(残存放射能量に対する割合(%)、( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物		[F- <sup>14</sup> C]ジノテフラン				
処理後時間		8日	20日	29日	20日	29日
分析対象		処理葉	処理葉	処理葉	果実部	果実部
代 謝 物 組 成	ジノテフラン	73.24(38.14)	56.49(38.66)	45.67(24.20)	30.37(0.01)	21.33(0.02)
	合計					

供試化合物		[G- <sup>14</sup> C]ジノテフラン				
処理後時間		8日	20日	29日	20日	29日
分析対象		処理葉	処理葉	処理葉	果実部	果実部
代 謝 物 組 成	ジノテフラン	67.42(38.08)	50.26(29.03)	42.35(20.18)	46.64(0.02)	39.95(0.04)
	合計					

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

表 6 可食部代謝試験における代謝物組成

(残存放射能量に対する割合(%)、( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物		[F- <sup>14</sup> C]ジノテフラン		[G- <sup>14</sup> C]ジノテフラン	
処理後時間		8日	14日	8日	14日
分析対象		果実部	果実部	果実部	果実部
代 謝 物 組 成	ジノテフラン	87.02(2.20)	85.92(1.10)	87.53(4.40)	88.96(1.65)
合計					

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

(8) カブにおける代謝試験

(資料 11-1-8)

試験機関 : 三井化学(株)

報告書作成年 : 2000 年

供試標識化合物:

略称: [F-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 放射化学的純度:

略称: [G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 放射化学的純度:

供試植物: カブ(耐病ひかり)

試験方法:

1) 葉面処理代謝試験

ガラス製ビーカーに土壤を入れ、カブ苗 1 本を移植した。4~5 葉期に、[F-<sup>14</sup>C]ジノテフランまたは[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 50 μg(実圃場で散布した場合の想定付着量)をアセトン溶液で、第 3 葉の葉面に処理し、その後人工気象室で栽培した。主根部、処理葉、その他地上部、細根部および土壤を 20 日後まで経時的に採取した。

2) 土壤処理代謝試験

ガラス製ビーカーに土壤を入れ、カブ苗 1 本を移植した。2~3 葉期に、[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 50 μg(実圃場で施用した場合の想定処理量)をアセトン溶液で、土壤に処理した。主根部、地上部、細根部および土壤を 30 日後まで経時的に採取した。

3) 分析方法

各部位は、抽出後に放射能量の測定と成分の解析、定量を行った。葉面処理代謝試験における処理葉については溶媒によるリンスを行った後に抽出した。代謝物の解析は LC/MS により、定量は HPLC および TLC により行った。

試験結果: 放射能分布の経時変化を表 1 および 2 に、ジノテフランの経時変化を表 3 および 4 に、代謝物組成を表 5 および 6 に示した。

申請者注: 本文中の回収率、残留量等については、表中の数値を四捨五入して記載した。

1) 放射能分布

① 葉面処理代謝試験 20 日後の放射能回収率は 85~92% ([F-<sup>14</sup>C]～[G-<sup>14</sup>C]) であった。主根部で 2~3% ([F-<sup>14</sup>C]～[G-<sup>14</sup>C])、処理葉で 81~86% ([F-<sup>14</sup>C]～[G-<sup>14</sup>C])、その他地上部で 1~2% ([F-<sup>14</sup>C]～[G-<sup>14</sup>C])、細根部で 0.1%、土壤で 0.3~0.4% ([F-<sup>14</sup>C]～[G-<sup>14</sup>C]) が検出された。放射能回収率が低下したことから、二酸化炭素などの揮発性成分が生成していると考えられた。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

② 土壌処理代謝試験 30 日後の放射能回収率は 92%であった。土壌に処理した放射能は 51%が植物体に吸収され、主根部で 2%、地上部で 49%、細根部で 0.6%、土壌で 41%が検出された。

## 2) ジノテフランの経時変化

① 葉面処理代謝試験 処理葉のジノテフランは経時的に減衰し、20 日後に残存放射能量の 12%(1.6ppm)～13%(1.8ppm)([G-<sup>14</sup>C]～[F-<sup>14</sup>C])となった。処理葉における半減期は 5.7 日であった。主根部において、ジノテフランは 10 日後にのみ検出され、それ以降は検出されなかった。

② 土壌処理代謝試験 地上部残存放射能中のジノテフランは経時的に減衰し、30 日後に残存放射能量の 8%(0.5ppm)となった。主根部のジノテフランは、30 日後に残存放射能量の 36%であり、その濃度は 0.02ppm であった。

## 3) 代謝物

各試験における主な代謝物を以下に示した。

### ① 葉面処理代謝試験

主根部(20 日後)

処理葉([F-<sup>14</sup>C]ジノテフランの 20 日後、[G-<sup>14</sup>C]ジノテフランの 10 日後)

主根部(20 日後)における残存放射能量の 67～81%([G-<sup>14</sup>C]～[F-<sup>14</sup>C])、処理葉における残存放射能量の 70～85%([F-<sup>14</sup>C]～[G-<sup>14</sup>C])について、同定または化学的特徴付けが可能であった。

主根部(20 日後)において検出された代謝物の濃度は、いずれも 0.01ppm 以下であった。

### ② 土壌処理代謝試験

主根部(30 日後)

地上部(30 日後)

主根部(30 日後)における残存放射能量の 92%、地上部における残存放射能量の 87%について、同定または化学的特徴付けが可能であった。

主根部(30 日後)において検出された代謝物の濃度は、いずれも 0.02ppm 以下であ

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

った。

#### 4) 代謝経路

表 1 葉面処理代謝試験における放射能分布の経時変化(処理量に対する割合(%))

供試化合物	分析対象	処理後時間(日)			
		0	10	14	20
$[F-^{14}C]$ ジノテフラン	主根部	NA	NA	NA	2.38
	処理葉	95.26	NA	NA	81.37
	リンス部	67.24	NA	NA	10.51
	抽出部	28.00	NA	NA	67.50
	抽出残渣	0.02	NA	NA	3.36
	その他地上部	NA	NA	NA	1.15
	細根部	NA	NA	NA	0.05
	土壤	NA	NA	NA	0.34
	放射能回収率	95.26	NA	NA	85.29
$[G-^{14}C]$ ジノテフラン	主根部	NA	1.11	1.76	2.94
	処理葉	95.13	93.22	92.89	86.03
	リンス部	71.20	23.44	27.87	11.41
	抽出部	23.91	66.99	63.18	72.54
	抽出残渣	0.02	2.79	1.84	2.08
	その他地上部	NA	0.53	0.61	2.41
	細根部	NA	0.07	0.07	0.08
	土壤	NA	0.16	0.16	0.35
	放射能回収率	95.13	95.09	95.49	91.81

NA: 分析せず

表 2 土壤処理代謝試験における放射能分布の経時変化(処理量に対する割合(%))

供試化合物	分析対象	処理後時間(日)				
		0	6	10	15	30
$[G-^{14}C]$ ジノテフラン	主根部	NA	0.32	0.50	0.93	1.76
	地上部	NA	18.90	28.43	45.66	48.55
	細根部	NA	0.52	1.04	1.64	0.64
	土壤	97.39	72.75	67.10	47.38	41.45
	放射能回収率	97.39	92.49	97.07	95.61	92.40

NA: 分析せず

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

表 3 葉面処理代謝試験におけるジノテフランの経時変化  
(残存放射能量に対する割合(%)、( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物	分析対象	処理後時間(日)			
		0	10	14	20
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	処理葉	92.60 (17.03)	NA	NA	12.77 (1.78)
	主根部	NA	NA	NA	<0.005 (<0.005)
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	処理葉	95.92 (18.62)	26.99 (4.84)	29.39 (3.61)	12.23 (1.62)
	主根部	NA	14.51 (<0.005)	<0.005 (<0.005)	<0.005 (<0.005)

NA: 分析せず

表 4 土壤処理代謝試験におけるジノテフランの経時変化  
(残存放射能量に対する割合(%)、( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物	分析対象	処理後時間(日)				
		0	6	10	15	30
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	地上部	NA	45.85 (1.13)	35.41 (1.06)	21.49 (0.67)	8.15 (0.48)
	主根部	NA	63.92 (0.07)	56.23 (0.04)	44.61 (0.03)	35.77 (0.02)

NA: 分析せず

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

表 5 葉面処理代謝試験における代謝物組成  
(残存放射能量に対する割合(%)、( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物	[F- <sup>14</sup> C]ジノテフラン	
処理後時間	20日	20日
分析対象	主根部	処理葉
代 謝 物 組 成	ジノテフラン	<0.005(<0.005)
		12.77(1.78)
	合計	

供試化合物	[G- <sup>14</sup> C]ジノテフラン				
処理後時間	10日	20日	10日	20日	
分析対象	主根部	主根部	処理葉	処理葉	
代 謝 物 組 成	ジノテフラン	14.51(<0.005)	<0.005(<0.005)	26.99(4.84)	12.23(1.62)
	合計				

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

表 6 土壌処理代謝試験における代謝物組成

(残存放射能量に対する割合(%)、( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物		[G- <sup>14</sup> C]ジノテフラン		
処理後時間		6日	15日	30日
分析対象		主根部	主根部	主根部
代 謝 物 組 成	ジノテフラン	63.92(0.07)	44.61(0.03)	35.77(0.02)
	合計			

供試化合物		[G- <sup>14</sup> C]ジノテフラン		
処理後時間		6日	15日	30日
分析対象		地上部	地上部	地上部
代 謝 物 組 成	ジノテフラン	45.85(1.13)	21.49(0.67)	8.15(0.48)
	合計			

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

(9) ミカンにおける代謝試験

(資料 11-1-9)

試験機関 : 三井化学(株)

報告書作成年 : 2000 年

供試標識化合物:

略称: [F-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 放射化学的純度:

略称: [G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 放射化学的純度:

供試植物: ミカン(青島)

試験方法:

1) 葉面処理代謝試験

1/5000a ワグネルポットに土壤を入れ、約 1m のミカン苗 1 本を移植した。[F-<sup>14</sup>C]ジノテフランおよび[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン各 25 μg(実圃場で散布した場合の想定付着量)をアセトン溶液で、葉一枚の葉面に処理した。その後人工気象室内で栽培した。処理葉および周辺葉を 60 日後まで経時的に採取した。

2)

3) 分析方法

各部位は、抽出後に放射能量の測定と成分の解析、定量を行った。葉面処理代謝試験における処理葉および における果実部については溶媒によるリンスを行った後に抽出した。また、果実部は果皮と果肉に分けて抽出した。代謝物の解析は LC/MS および 2 次元 TLC により、定量は HPLC および TLC により行った。

試験結果: 放射能分布の経時変化を表 1 および 2 に、ジノテフランの経時変化を表 3 および 4 に、代謝物組成を表 5 および 6 に示した。

申請者注: 本文中の回収率、残留量等については、表中の数値を四捨五入して記載した。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

1) 放射能分布

- ① 葉面処理代謝試験 60日後の放射能回収率は84%であった。処理葉で84%、周辺葉で0.6%が検出された。放射能回収率が低下したことから、二酸化炭素などの揮発性成分が生成していると考えられた。

②

2) ジノテフランの経時変化

- ① 葉面処理代謝試験 処理葉のジノテフランは経時的に減衰し、60日後に残存放射能量の23%(11ppm)となった。

②

3) 代謝物

各試験における主な代謝物を以下に示した。

- ① 葉面処理代謝試験

処理葉(14日後)

処理葉(14日後)における残存放射能量の92%について、同定または化学的特徴付けが可能であった。

②

2) 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三井化学アグロ株式会社にある。

と考えられた。

表 1 葉面処理代謝試験における放射能分布の経時変化(処理量に対する割合(%))

供試化合物	分析対象	処理後時間(日)			
		0	14	37	60
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン + [G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	処理葉	102.76	90.99	84.57	83.57
	リンス部	101.21	65.21	56.71	50.49
	抽出部	1.54	24.63	25.34	28.87
	抽出残渣	0.01	1.15	2.52	4.21
	周辺葉	NA	0.29	0.27	0.59
	放射能回収率	102.76	91.28	84.84	84.16

NA: 分析せず

表 2 における放射能分布の経時変化(処理量に対する割合(%))

供試化合物						
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン						
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン						

表 3 葉面処理代謝試験におけるジノテフランの経時変化  
(残存放射能量に対する割合%)( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物	分析対象	処理後時間(日)			
		0	14	37	60
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン + [G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	処理葉	91.38 (74.49)	49.18 (24.58)	33.88 (19.36)	23.41 (10.63)

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

表 4 におけるジノテフランの経時変化  
(残存放射能量に対する割合(%)、( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物						
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン						
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン						

表 5 葉面処理代謝試験における代謝物組成  
(残存放射能量に対する割合(%)、( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物	[F- <sup>14</sup> C]ジノテフラン + [G- <sup>14</sup> C]ジノテフラン		
処理後時間	14 日	37 日	60 日
分析対象	処理葉	処理葉	処理葉
代 謝 物 組 成	ジノテフラン	49.18(24.58)	33.88(19.36)
			23.41(10.63)
	合計		

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

表 6 における代謝物組成  
(残存放射能量に対する割合(%)、( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物				
処理後時間				
分析対象				
代 謝 物 組 成				

供試化合物				
処理後時間				
分析対象				
代 謝 物 組 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三井化学アグロ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

(10) ナシにおける代謝試験

(資料 11-1-10)

試験機関：三井化学(株)

報告書作成年：2000年

供試標識化合物：

略称：[F-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 放射化学的純度：

略称：[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 放射化学的純度：

供試植物：ナシ(幸水)

試験方法：1/5000a ワグネルポットに土壌を入れ、約 1m のナシ苗 1 本を移植した。結実期に、[F-<sup>14</sup>C]ジノテフランまたは[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 20 μg(実圃場で散布した場合の想定付着量)をアセトン溶液で、未熟果実に処理した。その後、人工気象室内で栽培した。果実を 12 週後まで経時的に採取した。果実は溶媒でリンスした後、果皮と果肉に分け、それぞれを抽出し、分析した。代謝物の解析は LC/MS および 2 次元 TLC により、定量は HPLC により行った。

試験結果：放射能分布の経時変化を表 1 に、ジノテフランの経時変化を表 2 に、処理 12 週後の果実部における代謝物の組成を表 3 に示した。

申請者注：本文中の回収率、残留量等については、表中の数値を四捨五入して記載した。

1) 放射能分布

12 週後の放射能回収率は 81～83% ([F-<sup>14</sup>C]～[G-<sup>14</sup>C]) であった。処理された放射能は、果実表面より、果皮から果肉へと移行していると考えられた。12 週後において、リンス部で 9～15% ([F-<sup>14</sup>C]～[G-<sup>14</sup>C])、果皮で 34～36% ([G-<sup>14</sup>C]～[F-<sup>14</sup>C])、果肉で 34～36% ([G-<sup>14</sup>C]～[F-<sup>14</sup>C]) が検出された。放射能回収率が低下したことから、二酸化炭素などの揮発性成分が生成していると考えられた。

2) ジノテフランの経時変化

果実部のジノテフランは経時的に減衰し、12 週後に残存放射能量の 23～32% ([F-<sup>14</sup>C]～[G-<sup>14</sup>C]) となった。その濃度は 0.03ppm であった。果実部における半減期は [F-<sup>14</sup>C] で 3.46 週、[G-<sup>14</sup>C] で 5.27 週であった。

3) 代謝物

果実部における主な代謝物を以下に示した。

果実部(12週後)

果実部(12週後)における残存放射能量の67~76%([F-<sup>14</sup>C]~[G-<sup>14</sup>C])について、同定または化学的特徴付けが可能であった。

果実部(12週後)において検出された代謝物の濃度は、いずれも0.02ppm以下であった。

3) 代謝経路

表1 放射能分布の経時変化(処理量に対する割合(%))

供試化合物	分析対象	処理後時間(週)			
		0	4	9	12
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	果実部	92.78	87.19	71.27	80.83
	リンス部	85.03	30.41	12.45	9.49
	果皮	7.22	36.50	33.11	35.75
	果肉	0.53	20.28	25.71	35.59
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	果実部	90.45	93.27	85.22	83.20
	リンス部	83.27	21.52	24.27	15.06
	果皮	6.93	55.84	40.15	34.09
	果肉	0.25	15.91	20.80	34.05

表2 可食部代謝試験におけるジノテフランの経時変化  
(残存放射能量に対する割合%)( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物	分析対象	処理後時間(週)			
		0	4	9	12
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	果実部	94.89 (1.77)	56.01 (0.10)	21.16 (0.03)	23.05 (0.03)
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	果実部	93.54 (0.92)	56.52 (0.79)	39.54 (0.13)	32.30 (0.03)

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

表 3 可食部代謝試験における代謝物組成

(残存放射能量に対する割合(%)、( )内はジノテフラン換算濃度 ppm)

供試化合物		[F- <sup>14</sup> C]ジノテフラン		
処理後時間		4週	9週	12週
分析対象		果実部	果実部	果実部
代 謝 物 組 成	ジノテフラン	56.01(0.10)	21.16(0.03)	23.05(0.03)
	合計			

供試化合物		[G- <sup>14</sup> C]ジノテフラン		
処理後時間		4週	9週	12週
分析対象		果実部	果実部	果実部
代 謝 物 組 成	ジノテフラン	56.52(0.79)	39.54(0.13)	32.30(0.03)
	合計			

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

(11) リンゴにおける代謝試験

(資料 11-1-11)

試験機関：三井化学(株)

報告書作成年：2000年

供試標識化合物：

略称：[F-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 放射化学的純度：

略称：[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 放射化学的純度：

供試植物：リンゴ(王林)

試験方法：1/5000a ワグネルポットに土壌を入れ、約 1m のリンゴ苗 1 本を移植した。[F-<sup>14</sup>C]ジノテフランまたは[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 50 μg(実圃場で散布した場合の想定付着量)をアセトン溶液で、葉一枚の葉面に処理し、その後人工気象室で栽培した。処理葉および周辺葉を 55 日後まで経時的に採取した。処理葉は溶媒でリーンした後、抽出し、分析した。周辺葉は抽出後に分析した。代謝物の解析は LC/MS により、定量は HPLC および TLC により行った。

試験結果：放射能分布の経時変化を表 1 に、ジノテフランの経時変化を表 2 に、処理 20 日後の処理葉における代謝物組成を表 3 に示した。

申請者注：本文中の回収率、残留量等については、表中の数値を四捨五入して記載した。

1) 放射能分布

55 日後の放射能回収率は 84～86% ([G-<sup>14</sup>C]～[F-<sup>14</sup>C]) であった。処理葉で 83～84% ([G-<sup>14</sup>C]～[F-<sup>14</sup>C])、周辺葉で 1%が検出された。放射能回収率が低下していることから、二酸化炭素などの揮発性成分が生成していると考えられた。

2) ジノテフランの経時変化

処理葉のジノテフランは経時的に減衰し、55 日後に残存放射能量の 28～31% ([G-<sup>14</sup>C]～[F-<sup>14</sup>C]) となった。処理葉における半減期は[F-<sup>14</sup>C]で 20.2 日、[G-<sup>14</sup>C]で 17.2 日であった。

3) 代謝物

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

処理葉における主な代謝物を以下に示した。

処理葉(20日後)

処理葉(20日後)における残存放射能量の83~89%([F-<sup>14</sup>C]~[G-<sup>14</sup>C])について、同定または化学的特徴付けが可能であった。

4) 代謝経路

表1 放射能分布の経時変化(処理量に対する割合(%))

供試化合物	分析対象	処理後時間(日)			
		0	20	30	55
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	処理葉	96.68	88.85	89.44	84.33
	リンス部	91.78	59.40	75.21	55.24
	抽出部	4.88	28.13	12.01	25.60
	抽出残渣	0.02	1.32	2.22	3.49
	周辺葉	NA	0.41	0.51	1.21
	放射能回収率	96.68	89.26	89.95	85.54
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	処理葉	98.41	91.46	91.65	82.51
	リンス部	89.06	69.50	64.02	41.35
	抽出部	8.49	19.63	23.72	38.59
	抽出残渣	0.86	2.33	3.91	2.57
	周辺葉	NA	0.34	0.33	1.13
	放射能回収率	98.41	91.80	91.98	83.64

NA: 分析せず

表2 葉面処理代謝試験におけるジノテフランの経時変化

(残存放射能量に対する割合(%)、( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物	分析対象	処理後時間(日)			
		0	20	30	55
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	処理葉	94.29 (130.21)	38.81 (21.03)	57.15 (41.90)	30.82 (20.96)
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	処理葉	93.22 (88.19)	50.94 (40.16)	36.90 (30.74)	27.91 (11.07)

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

表 3 葉面処理代謝試験における代謝物組成  
(残存放射能量に対する割合(%)、( )内はジノテフラン換算濃度(ppm))

供試化合物	[F- <sup>14</sup> C]ジノテフラン		[G- <sup>14</sup> C]ジノテフラン	
処理後時間	20日	55日	20日	55日
分析対象	処理葉	処理葉	処理葉	処理葉
代謝物組成	ジノテフラン 38.81(21.03)	30.82(20.96)	50.94(40.16)	27.91(11.07)
合計				

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

りんごにおける代謝試験

(資料 11-1-12)

試験機関:Ricerca, LLC

[GLP 対応]

報告書作成年:2002 年

供試標識化合物:

構造式;

[F-<sup>14</sup>C]ジノテフラン

[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン

化学名(IUPAC);(RS)-1-メチル-2-ニトロ-3-(テトラヒドロ-3-フリルメチル)グアニジン

(RS)-1-methyl-2-nitro-3-(tetrahydro-3-furylmethyl)guanidine

(CAS); N-メチル-N'-ニトロ-N''-[(テトラヒドロ-3-フラニル)メチル]グアニジン

N-methyl-N'-nitro-N''-[(tetrahydro-3-furanyl)methyl]guanidine

放射化学的純度および比放射能;

略称 [F-<sup>14</sup>C]ジノテフラン;

略称:[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン;

供試植物:りんご(品種:Granny Smith)、樹齢 14 年生、樹の直径約 4~5 m、樹高約 4 m、

処理区面積 1.39 m<sup>2</sup>

試験方法:

処理溶液の調製; [ ] および[ ]ジノテフランを非標識ジノテフランと混合して比放射能が  
の各標識体のアセトニトリル溶液を調製した。これらの溶液を 1:1 で混合した後、  
製剤ブランク試料に添加し、アセトニトリルを蒸発させた。ついで、残渣を磨碎し、水を添加して  
均質化し、処理用溶液を調製した。この溶液の所定量を水で希釈して散布液とした。

処理量; 通常量処理区:200 g a.i./ha

10 倍量処理区:2000 g a.i./ha

処理方法; 区当たり 1 樹とし、収穫 21 日前に加圧式実験用噴霧器を用いて樹の一部(1.39 m<sup>2</sup>/処理  
区)に噴霧処理した。

試料の採取; 葉 - 処理(葉面乾燥)直後および処理 21 日後

果実 - 処理 21 日後

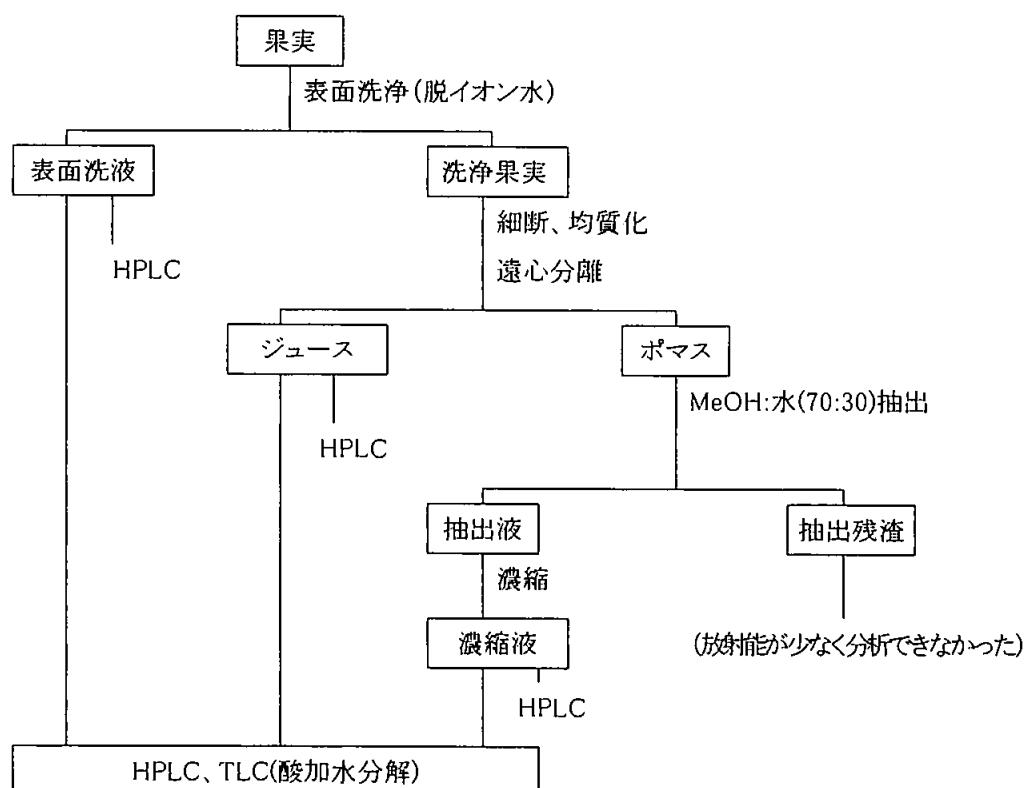
本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

#### 放射能の抽出・測定:

葉:葉はドライアイスと共に粉碎し、均質化した後、燃焼して放射能を測定した。

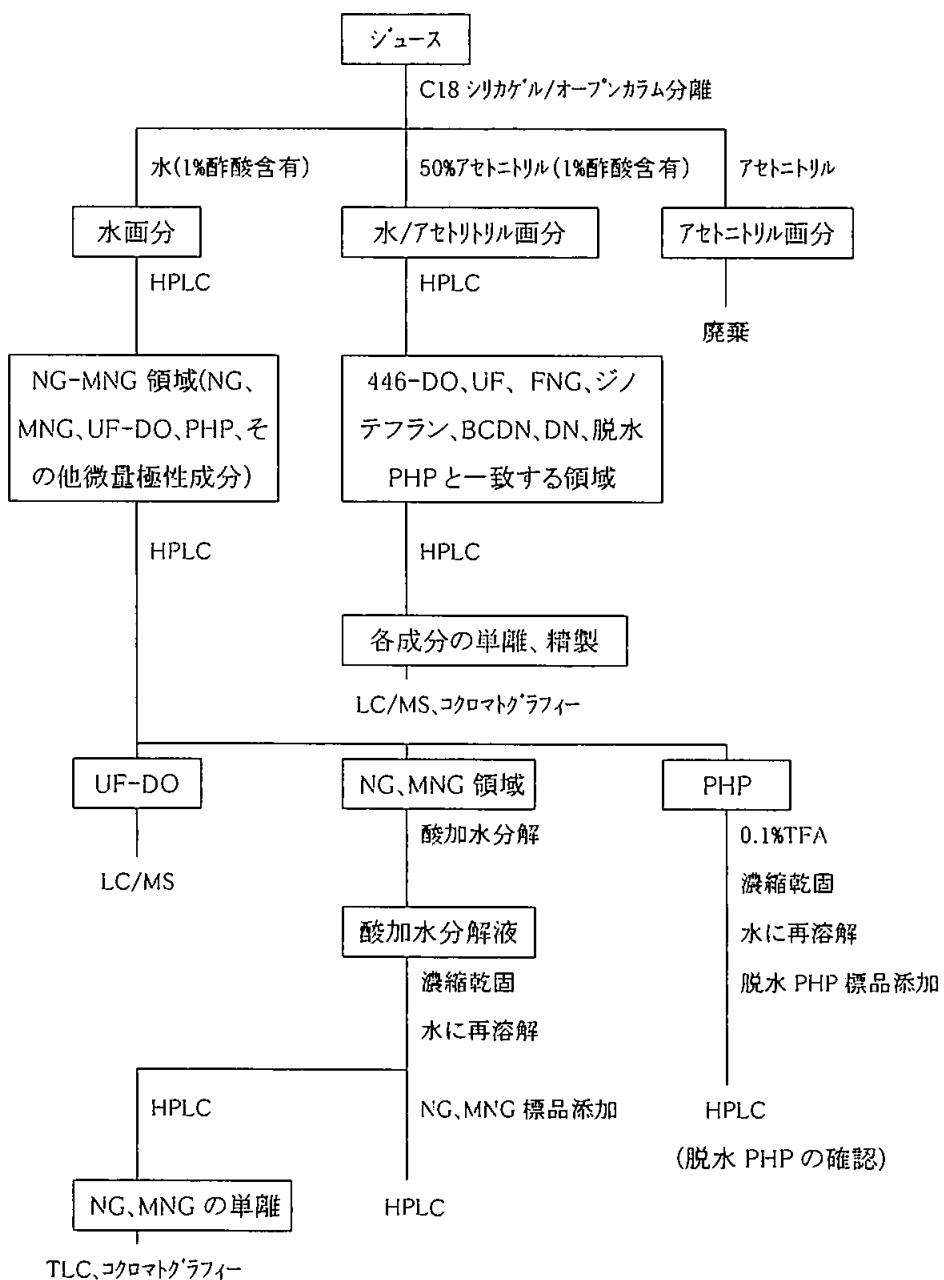
果実中放射能の抽出;以下のスキームにしたがって残留放射能を分画・抽出し、HPLC、TLCで分析した。

果実は脱イオン水で2回表面洗浄し、洗浄果実は細断、均質化後、遠心分離した。ジュース(上清)はさらに2回遠心分離を繰り返し、ポマス(絞りかす)を除去した。ポマスはドライアイスと共に粉碎し、溶媒抽出に供した。ポマスの残留放射能は抽出性放射能と非抽出性放射能の合計とした。さらに、均質化ポマスを直接燃焼して残留放射能を求めた。



本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

代謝物の単離・精製・同定;代謝物の単離・精製は以下のスキームに従い 10 倍量(2,000 g a.i./ha)処理区のジュースを用いて行った。分離/単離した各画分は HPLC で再分析して、標品との保持時間の比較、HPLC および TLC コクロマトグラフィー、LC/MS で同定した。



放射能の計測;液体試料はシンチレーションカクテルを添加後 LSC で計測した。葉、ポマスの抽出残渣は燃焼して発生した  $^{14}\text{CO}_2$  を捕集した後、液体試料と同様にして LSC で計測した。

試験結果:

果実残留放射能; 果実を水で表面洗浄した表面洗液、ジュース、ポマスの抽出および抽出残渣の燃焼による放射能の分布を次表に示す。また、ポマスの直接燃焼による測定値も示す。

画分	200 g/ha		2000 g/ha	
	濃度(ppm)	%TRR	濃度(ppm)	%TRR
表面洗液	0.106	69.1	1.194	62.1
ジュース	0.033	21.3	0.530	27.5
ポマス	0.015	9.5	0.200 (0.197)	10.4
MeOH/水抽出液	0.009	6.1	0.154	8.0
抽出残渣	0.005	3.4	0.046	2.4
合計	0.153 (0.153)	100.0	1.924 (1.921)	100.0

表中の濃度は親化合物換算濃度(ppm)。

( )内の数値はポマスの直接燃焼による値。

無処理区の果実の放射能は検出限界未満であった。

ポマスの抽出液および抽出残渣の燃焼により計測した残留放射能とあるいはポマスの直接燃焼により計測した残留放射能は良く一致していた。抽出に基づく残留放射能は 200 g.a.i./ha 処理区で 0.153 ppm、10 倍量処理区(2000 g/ha)で 1.924 ppm であった。

両処理区とも果実の表面洗浄により総回収放射能の約 60~70%、ジュースから約 20~30%、ポマスから約 10% の放射能が認められた。ポマス中の残留は非常に少なく、200 g/ha 処理区で 0.015 ppm、10 倍量処理区で 0.200 ppm であった。

ポマスでは総回収放射能の 6~8% がメタノール/水で抽出され、抽出残渣 2~3% と少なかった。

総回収放射能の 97% が表面洗液、ジュースおよびポマスの抽出により可溶化した。

葉の残留放射能: 処理の検証のために、直接燃焼による葉の分析を行ったが、葉の抽出は行わなかった。直接燃焼による残留放射能は次表のとおりで、処理は適切に行われていたことが認められた。

収穫時期	200 ga.i./ha	2000 ga.i./ha
処理直後(処理 0 日)	16.412 ppm	139.569 ppm
収穫時期(処理 21 日後)	10.769 ppm	117.680 ppm

表中の数値は親化合物換算濃度(ppm)。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

果実中の代謝物の分布;果実の表面洗液、ジュースおよびポマス抽出液中の代謝物の分布を次表に示す。

代謝物	表面洗液		ジュース		ポマス		合計	
	濃度 (ppm)	%TRR	濃度 (ppm)	%TRR	濃度 (ppm)	%TRR	濃度 (ppm)	%TRR
[200 ga.i./ha 处理]								
抽出液	0.106	69.1	0.033	21.3	0.009	6.1	0.148	96.6
ジノテフラン	0.038	24.6	0.005	3.1	0.002	1.0	0.044	28.8
抽出残渣								
合計								
[2000 ga.i./ha 处理]								
抽出液	1.194	62.1	0.530	27.5	0.154	8.0	1.878	97.6
ジノテフラン	0.536	27.9	0.073	3.8	0.024	1.2	0.633	32.9
抽出残渣								
合計								

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

代謝物の分布は 200 g/ha および 10 倍量処理区とも代謝物のパターンにはほとんど差がなく、質的に同じであった。

200 g/ha および 10 倍量処理区ともジノテフランが主要な残留物で、大部分は表面洗液(総回収放射能の 25~28%)にあり、ポマスおよびジュース中では少量(4~5%)であった。果実中のジノテフランは 200 g/ha 処理区で総回収放射能の 29%(0.044 ppm)、10 倍量処理区で 33%(0.633 ppm)を占めていた。

想定代謝経路を以下に示す。

レタスにおける代謝試験

(資料 11-1-13)

試験機関:Ricerca, LLC

[GLP 対応]

報告書作成年:2002 年

供試標識化合物:

構造式;

[F-<sup>14</sup>C]ジノテフラン

[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン

化学名(IUPAC);(RS)-1-メチル-2-ニトロ-3-(テトラヒドロ-3-フリルメチル)グアニジン

(RS)-1-methyl-2-nitro-3-(tetrahydro-3-furylmethyl)guanidine

(CAS); N-メチル-N'-ニトロ-N''-[(テトラヒドロ-3-フラニル)メチル]グアニジン

N-methyl-N'-nitro-N''-[(tetrahydro-3-furanyl)methyl]guanidine

放射化学的純度および比放射能;

略称 [F-<sup>14</sup>C]ジノテフラン:

略称 [G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン:

供試植物:レタス(品種:Nevada Green)

栽培; 土壌(silt loam)を詰めた直径 28 cm ポット 8 個にそれぞれ 20 種子ずつ播種した。発芽後、各ポット当たり 3 植物に間引いた。栽培は環境制御温室内で行った。

試験方法:

処理溶液の調製; [ ] および[ ]ジノテフランを非標識ジノテフランと混合して比放射能が  
の各標識体のアセトニトリル溶液を調製した。これらの溶液を 1:1 で混合した後、  
製剤ブランク試料に添加し、アセトニトリルを蒸発させた。ついで、残渣を摩碎し、水を添加して  
均質化し、処理用溶液を調製した。この溶液の所定量を水で希釈して散布液とした。

処理量; 通常量処理区: 150 g a.i./ha (3 ポット)

10 倍量処理区: 1500 g a.i./ha (3 ポット)

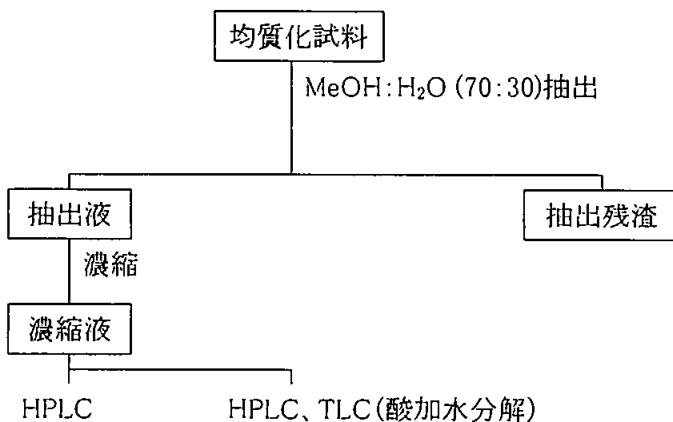
処理方法; 播種 8 週間後(収穫 14 日前)、温室からポットを取り出し、手動噴霧器を用いて各 3 ポット  
の全面に噴霧処理した。散布表面が乾燥後、ポットを温室に戻した。

試料の採取; 処理 14 日後に成熟レタスを地際部で刈り取り収穫した。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

放射能の抽出・測定; 試料はドライアイス中で粉碎し、冷凍庫中でドライアイスを昇華させた後、燃焼して放射能を測定した。また、抽出物および抽出残渣についても燃焼により総残留放射能を計測した。

以下のスキームにしたがって残留放射能を分画・抽出した。



代謝物の単離・定量: 代謝物の単離・精製は上記のスキームに従い HPLC または TLC で単離・同定した抽出残渣は残留放射能が少なく、これ以上分析しなかった。

放射能の計測; 液体試料はシンチレーションカクテルを添加後 LSC で計測した。抽出残渣は燃焼して発生した  $^{14}\text{CO}_2$  を捕集した後、液体試料と同様にして LSC で計測した。

#### 試験結果:

レタス残留放射能; 抽出および抽出残渣の燃焼による放射能の分布を次表に示す。また、試料の直接燃焼による測定値も示す。

画分		150 g a.i./ha		1500 g a.i./ha	
		濃度(ppm)	%TRR	濃度(ppm)	%TRR
抽出	MeOH:H <sub>2</sub> O 抽出液	1.748	97.6	10.399	98.0
	抽出残渣	0.044	2.4	0.218	2.0
	合計	1.791 (1.668)	100	10.616 (10.206)	100

表中の濃度は親化合物換算濃度(ppm)。

( )内の値は、試料の直接燃焼による測定値。

抽出および抽出残渣の燃焼と直接燃焼により計測した放射能濃度は一致していた。抽出に基づく放射能濃度は通常量処理区(150 g a.i./ha)で 1.791 ppm、10 倍量処理区(1500 g a.i./ha)で 10.616 ppm であった。

両処理区とも総回収放射能の 97%以上が抽出され、抽出残渣は約2%のみであった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

代謝物の分布、抽出液中の代謝物のプロファイルを次表に示す。

代謝物	150 g a.i./ha		1500 g a.i./ha	
	濃度(ppm)	%TRR	濃度(ppm)	%TRR
抽出液 ジノテフラン	1.103	61.57	6.864	64.66
抽出残渣				
合計				

分布率は総回収放射能に対する割合(%)。

通常量処理区及び 10 倍量処理区とも代謝物のパターンにほとんど差がなく、質的に同じであった。酸加水分解前後の HPLC プロファイルにはわずかな差がみられ、代謝物の一部は抱合体を形成していることを示唆していた。したがって、これらは遊離体と抱合体の合計を示した。

150 g.a.i./ha および 10 倍量処理区でそれぞれジノテフランは総回収放射能の約 62% (1.103 ppm) および 65% (6.864 ppm) を占めていた。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

想定代謝経路を以下に示す。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

ばれいしょにおける代謝試験

(資料 11-1-14)

試験機関: RCC Ltd.

[GLP 対応]

報告書作成年: 2002 年

供試標識化合物:

構造式;

[F-<sup>14</sup>C]ジノテフラン

[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン

化学名(IUPAC); (RS)-1-メチル-2-ニトロ-3-(テトラヒドロ-3-フリルメチル)グアニジン

(RS)-1-methyl-2-nitro-3-(tetrahydro-3-furylmethyl)guanidine

(CAS); N-メチル-N'-ニトロ-N''-[(テトラヒドロ-3-フラニル)メチル]グアニジン

N-methyl-N'-nitro-N''-[(tetrahydro-3-furanyl)methyl]guanidine

放射化学的純度および比放射能;

[F-<sup>14</sup>C]ジノテフラン:

[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン:

供試植物: ばれいしょ(品種:Nicola)

試験方法:

供試土壌; 表面積 1 m<sup>2</sup>、高さ 120 cm の円柱状土壌モノリス(土壌;sand)2 個を 2.2 x 4 m の区域の圃場に埋設し、一冬経過した土壌。

さらに、直径約 50 cm(面積 2080 cm<sup>2</sup>)、深さ 55 cm のポットに 50 cm まで土壌(0-40cm; foam-clay、40-50cm;silt loam)を詰めた。

ばれいしょの植え付け; 土壌モノリスにはそれぞれ 6 個、モノリスの周囲には 36 個(対照区)、ポットには 1 個を植え付けた。

処理溶液の調製; 両標識体の放射能量が同じになるように混合した標識ジノテフランと、ジノテフラン 20% SG 製剤中の非標識ジノテフランと 1 : 2 で混合し、27.3% SG 製剤とし、水で希釈して散布液とした。

処理量; 通常量処理区: 100 および 200 g ai/ha(各土壌モノリスに処理)

5 倍量処理区: 1000 g ai/ha(ポットに処理)

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

処理方法;ばれいしょ植え付け 50 日後[BBCH 生育段階 50~59;開花直前)、被土約 50%]に処理区の土壤表面はプラスチックシートで、土壤モノリスおよびポットの周囲は高さ約 80 cm のプラスチックシートで覆い、散布液量 600 L/ha で茎葉全体に噴霧処理した。

試料の採取:

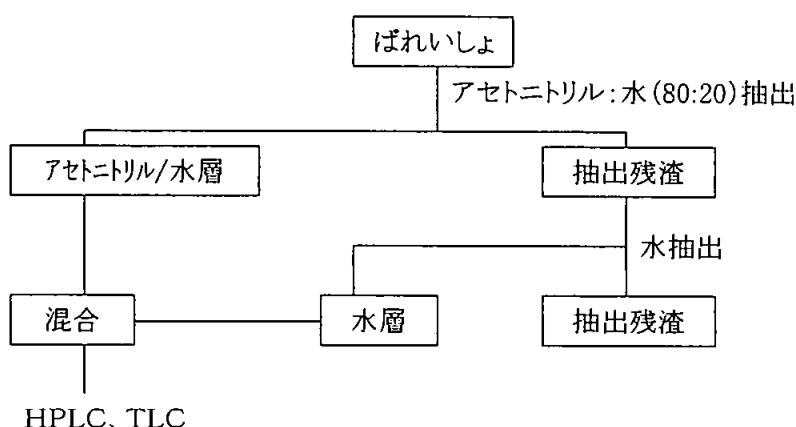
		1回目収穫	2回目収穫
植付後日数		104	125
処理後日数(PHI)		54	75
収穫時期		ばれいしょ形成期から枯凋期の間(新じゃが)	成熟時
処理 植物収穫	土壤モノリス 21	1 植物	5 植物
	土壤モノリス 22	1 植物	5 植物
	ポット	収穫せず	1 植物
無処理 植物収穫	(対照区)	1 植物	5 植物

1 回目採取試料:ばれいしょおよび地上部(茎葉部)に分け、ばれいしょは洗浄して土壤を除去した。ばれいしょの 1/2 は薄く剥皮した。皮、パルプおよび残りのばれいしょは用事まで冷凍保存した。

2 回目採取試料:2 回目収穫の 2 週間前に、枯れた茎葉は切り取り、試験区毎に用事まで冷凍保存した。ばれいしょは 1 週間冷蔵保存後、洗浄して土壤を除去した。ばれいしょの 1/2 は薄く剥皮した。皮、パルプおよび塊茎は凍結乾燥後、粉碎して分析に供した。

放射能の抽出・精製:

均質化試料は、以下のスキームに従い抽出した。アセトニトリル/水(8/2; 4 回)、さらに水(3 回)を用い、室温で各抽出時に 30 分間ずつ振盪抽出した。抽出後、遠心分離し、上清を濾取した。抽出液をプール後、濃縮し、固相抽出(C-18)あるいはシリカゲルカラムで精製した。



分析方法:

放射能の計測;液体試料はシンチレーションカクテルを添加後 LSC で計測した。茎葉、ばれいしょは細断し、凍結乾燥後、均質化し、燃焼して発生した  $^{14}\text{CO}_2$  を捕集した後、液体試料と

同様にして LSC で計測した。また、抽出残渣は乾燥後、均質化し、燃焼法で同様に計測した。

代謝物の分析；代謝物のプロフィールは HPLC で標品との保持時間の比較で定量・同定した。

さらに、HPLC 画分を溶媒系の異なる TLC(シリカゲルカラムあるいは逆相カラム)で一次元および二次元展開して HPLC 分析結果の確認および HPLC 画分の再分離・定量に用いた。

標品を分析試料に混合あるいは分析試料の近くにスポットして展開した。

#### 試験結果：

ばれいしょ中の残留放射能；均質化試料の直接燃焼による茎葉、塊茎、皮、パルプ中の残留放射能を次表に示す。

処理量(g ai/ha) 分析試料	1回目収穫(新じゃが)			2回目収穫(成熟時)		
	分布率 (%TAR)	濃度		分布率 (%TAR)	濃度	
		(ppm 試料)	(ppm 塊茎)		(ppm 試料)	(ppm 塊茎)
100	茎葉	5.02	0.706	-	4.21	1.053
	塊茎	0.76	0.029	0.029	0.38	0.007
	皮	0.03	0.017	0.002	0.08	0.010
	パルプ	0.16	0.015	0.013	0.40	0.009
	皮+パルプ合計	0.19	na	0.016	0.48	0.009
200	茎葉	1.89	0.499	-	2.98	0.664
	塊茎	0.45	0.036	0.036	0.36	0.013
	皮	0.01	0.012	0.001	0.08	0.023
	パルプ	0.07	0.012	0.010	0.35	0.015
	皮+パルプ合計	0.08	na	0.012	0.43	0.016
1000	茎葉				1.73	3.014
	塊茎				0.36	0.078
	皮			(試料なし)	0.13	0.158
	パルプ				0.38	0.098
	皮+パルプ合計				0.51	0.109

表中の分布率は処理放射能(TAR)に対する割合(%)、濃度は親化合物換算濃度(ppm)。

na:該当なし -:算出せず

1回目収穫(処理 54 日後)で 100g/ha 処理区のばれいしょ残留は、皮の塊茎における濃度は 0.002 ppm(皮のみにおいては 0.017 ppm)、パルプの塊茎における濃度は 0.013 ppm(パルプのみにおいては 0.015 ppm)であり、塊茎の濃度は 0.016~0.029 ppm であった。200g/ha 処理区では、皮の塊茎における濃度は 0.001 ppm(皮のみにおいては 0.012 ppm)、パルプの塊茎における濃度は 0.010 ppm(パルプのみにおいては 0.012 ppm)であり、塊茎の濃度は 0.012~0.036 ppm であった。

2回目収穫(処理 75 日後)時のばれいしょ残留は 1回目収穫に比較して、少なかった。100g/ha 処理区では、皮の塊茎における濃度は 0.002 ppm(皮のみにおいては 0.010 ppm)、パルプの塊茎における濃度は 0.007 ppm(パルプのみにおいては 0.009 ppm)であり、塊茎の濃度は 0.007~0.009 ppm であった。200g/ha 処理区では、皮の塊茎における濃度は 0.003 ppm(皮のみにおいては 0.023 ppm)、パルプの塊茎における濃度は 0.013 ppm(パルプのみにおいては 0.015 ppm)であり、塊茎の濃度は 0.013~0.016 ppm 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三井化学アグロ株式会社にある。

1000 g/ha(5倍量)区の PHI 75日のばれいしょ残留は、皮の塊茎における濃度は 0.028 ppm(皮のみにおいては 0.158 ppm)、パルプの塊茎における濃度は 0.081 ppm(パルプのみにおいては 0.098 ppm)であり、塊茎の濃度は 0.078~0.109 ppm であった。

処理 54 日後の茎葉残留は 100 および 200g/ha 処理区でそれぞれ 0.706 および 0.499 ppm であった。処理 75 日後の残留は 100、200 および 1000g/ha 処理区でそれぞれ 1.053、0.664 および 3.014 ppm であった。

収穫時ばれいしょの洗浄液中放射能：ばれいしょ付着土壌の水洗時の洗液中放射能を次表に示す。

処理量(g ai/ha)	洗液中濃度(ppb 塊茎)	
	1回目収穫	2回目収穫
100	0.2	0.2
200	<0.1	0.5
1000	-	4.7

表中の洗液中濃度は親化合物換算濃度(ppb)。 - : 試料なし

10 および 200g/ha 処理区において洗浄除去された放射能は 1 および 2 回目収穫でそれぞれ 0.2 および 0.5 ppb ばれいしょ以下であった。1000 g/ha 処理区では 4.7 ppb ばれいしょであった。洗液については、残留放射能濃度が低く、これ以上分析はできなかった。

ばれいしょの放射能の分布；

塊茎の抽出および残渣の燃焼による残留放射能の分布を次表に示す。

処理量(g ai/ha)	画分	1回目収穫(新じゃが)		2回目収穫(成熟時)	
		%TRR	濃度(ppm)	%TRR	濃度(ppm)
100	抽出性画分 アセトニトリル/水 水	97.5 70.6 26.9	0.029 0.021 0.008	94.5 71.4 23.1	0.007 0.005 0.002
	非抽出性画分	2.5	0.001	5.5	<0.001
	合計残留	100.0	0.029	100.0	0.007
	抽出性画分 アセトニトリル/水 水	97.7 63.5 34.2	0.035 0.023 0.012	94.9 69.7 25.2	0.013 0.009 0.003
200	非抽出性画分	2.3	0.001	5.2	0.001
	合計残留	100.0	0.036	100.0	0.013
	抽出性画分 アセトニトリル/水 水	(試料なし)	96.4 79.6 16.8	96.4	0.078
	非抽出性画分			79.6	0.062
	合計残留			16.8 3.6	0.013 0.003
1000				100.0	0.078

濃度は親化合物換算濃度(ppm)。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

塊茎の残留放射能の分布に処理量による顕著な差はなく、総回収放射能の約 95~98%がアセトニトリル/水および水で抽出され、抽出性放射能の大部分(約 65~83%)はアセトニトリル/水で抽出された。非抽出性放射能は総回収放射能の約 2~6%であった。

代謝物の同定・定量; 塊茎の抽出液中の代謝物の分布および濃度を次表に示す。

代謝物	1回目収穫				2回目収穫					
	100g/ha		200g/ha		100g/ha		200g/ha		1000g/ha	
	%TRR	濃度(ppm)	%TRR	濃度(ppm)	%TRR	濃度(ppm)	%TRR	濃度(ppm)	%TRR	濃度(ppm)
ジノテフラン	13.1	0.004	8.5	0.003	13.0	0.001	14.5	0.002	10.8	0.009

濃度は親化合物換算濃度(ppm)。

1回目収穫(処理 54 日後)ばれいしょ中におけるジノテフランおよび代謝物の濃度は非常に低かった。100g/ha 処理区では、ジノテフランは総回収放射能の 13.1%(0.004 ppm)を占めていた。

2回目収穫(処理 75 日後)ばれいしょでは1回目収穫ばれいしょに比較して、ジノテフランおよび代謝物の濃度は 100 および 200g/ha 処理区とも低く、また、5 倍量処理区(1000g/ha 処理区)のパターンとも質的に同じであった。100g/ha 処理区において、ジノテフランは総回収放射能の 13.0%(0.001 ppm)を占めていた。

200g/ha 処理区では、ジノテフランは総回収放射能の 14.5%(0.002 ppm)を占めていた。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

想定代謝経路を以下に示す。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

なたねにおける代謝試験

(資料 11-1-15)

試験機関: RCC Ltd.

[GLP 対応]

報告書作成年: 2002 年

供試標識化合物:

構造式:

[F-<sup>14</sup>C]ジノテフラン

[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン

化学名(IUPAC); (RS)-1-メチル-2-ニトロ-3-(テトラヒドロ-3-フリルメチル)グアニジン

(RS)-1-methyl-2-nitro-3-(tetrahydro-3-furylmethyl)guanidine

(CAS); N-メチル-N'-ニトロ-N''-[(テトラヒドロ-3-フラニル)メチル]グアニジン

N-methyl-N'-nitro-N''-[(tetrahydro-3-furanyl)methyl]guanidine

放射化学的純度および比放射能;

[F-<sup>14</sup>C]ジノテフラン: 放射化学的純度:

[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン: 放射化学的純度:

供試植物: なたね(品種: Express)

試験方法:

供試土壌; 表面積 1 m<sup>2</sup>、高さ 120 cm の円柱状土壌モノリス(土壌; sand)2 個を 2.2 x 4 m の区域の圃場に埋設した。この土壌モノリスは、本剤のばれいしょ代謝試験(資料 11-1-14)に用いたもので、ばれいしょを植え付け、生育期に土壌表面をプラスチックシートで覆った後、標識ジノテフランを茎葉散布した。処理約 1 年後に本試験に供した。

さらに、73x36 cm(面積 0.263 m<sup>2</sup>)、深さ 40 cm のポットに土壌(foam clay)を 10 cm、その上に 28 cm 土壌(silt loam)を詰め、ライシメーター中に埋設した。

なたねの播種; 条間 20 cm、株間約 2~3 cm(播種密度 1 g/m<sup>2</sup>)で秋に播種した。

処理溶液の調製; 両標識体の放射能量が同じになるように混合した標識ジノテフランと非標識ジノテフランを混合した。これをジノテフラン 20% SG 製剤ブランク試料に混合して、20% SG 製剤とし、水で希釈して散布液とした。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

処理量;通常量処理区:100 および 200g ai/ha(各土壤モノリスに処理)

5 倍量処理区:1000g ai/ha(ポットに処理)

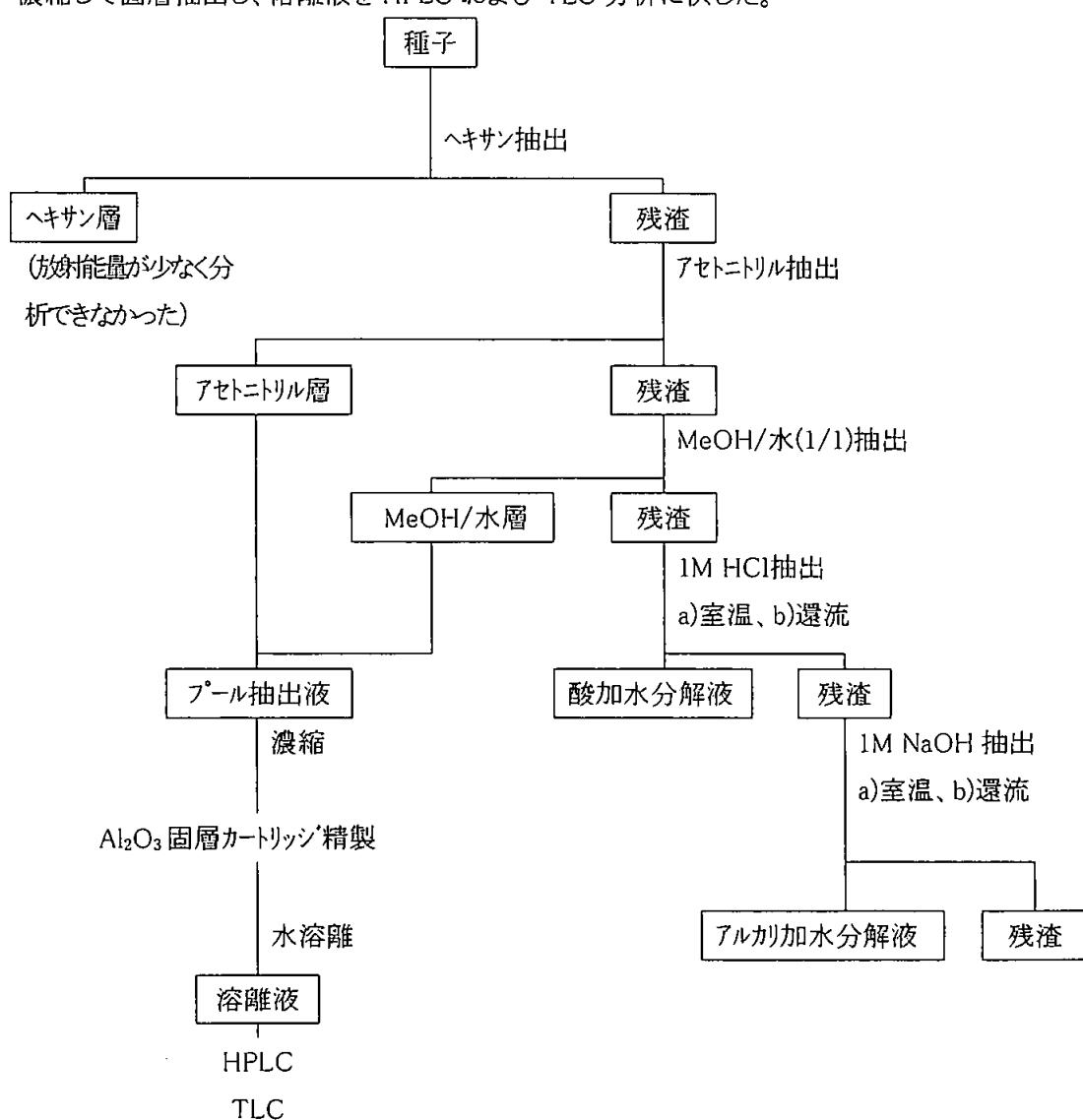
処理方法;なたね播種 214 日後[BBCH 生育段階 50~59;開花前)、被土約 50%]に土壤モノリスおよびポットの周囲は高さ約 80 cm のプラスチックシートで覆い、散布液量 600L/ha で茎葉全体に噴霧処理した。

試料の採取: 5 倍量(1000 g/ha) 処理区は処理 65 日後、通常量処理区(100 および 200 g/ha)は処理 70 日後の成熟時に収穫し、地上部と根に分離した後、-20°C で約 3 ヶ月間用事まで冷凍保存した。

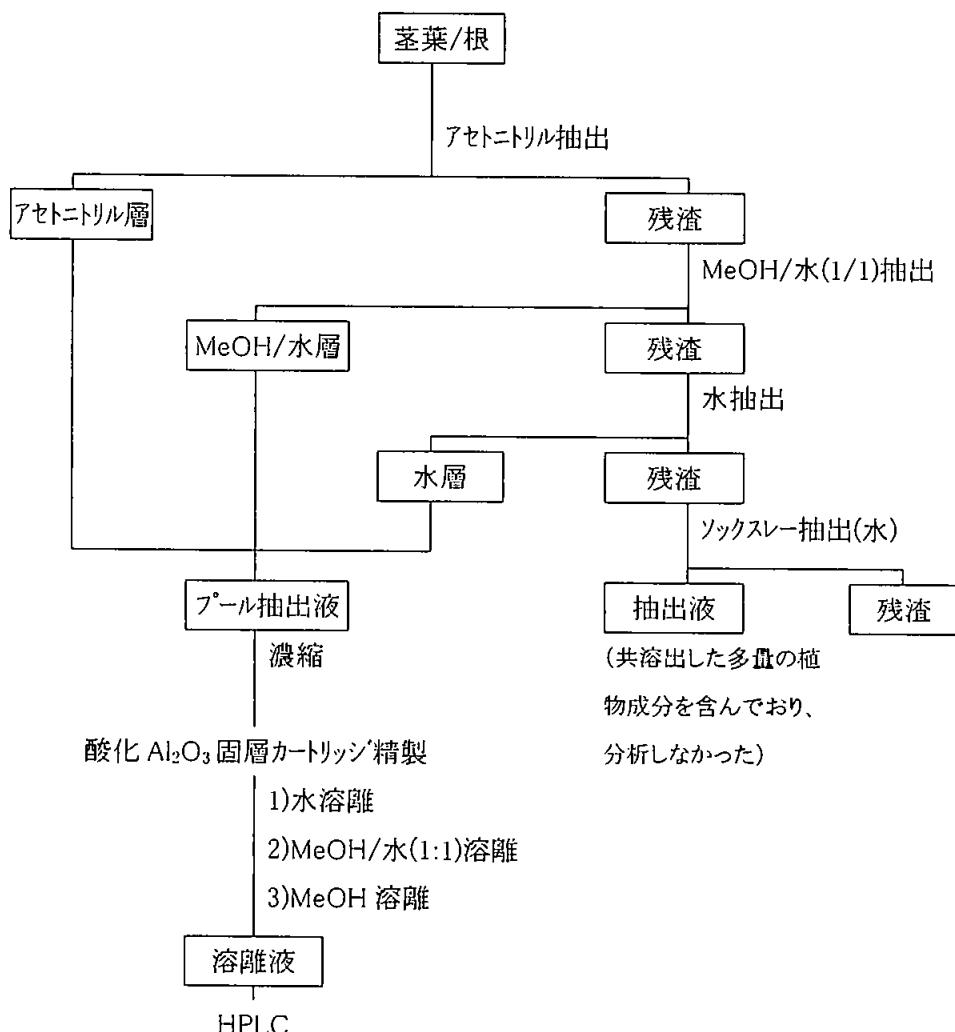
放射能の抽出・精製;冷凍試料は種子、茎葉および根に分離した。

種子の抽出:乳鉢で摩碎して以下のスキームに従い抽出した。

均質化試料は各溶媒で約 30 分間抽出後、遠心分離、ろ過した。極性抽出液はプール後、濃縮して固層抽出し、溶離液を HPLC および TLC 分析に供した。



茎葉および根の抽出: 根は水洗して付着土壌を除去した。均質化試料は各溶媒で約 30 分間抽出後、遠心分離、ろ過した。さらに、残渣は水でソックスレー抽出(4 時間)を行った。極性抽出液(3 抽出液)はプール後、濃縮して固層抽出し、溶離液を HPLC 分析に供した。抽出残渣はソックスレー抽出に供した。



#### 分析方法:

**放射能の計測:** 液体試料はシンチレーションカクテルを添加後 LSC で計測した。茎葉、根は細断し、均質化し、燃焼して発生した <sup>14</sup>CO<sub>2</sub>を捕集した後、液体試料と同様に LSC で計測した。また、抽出残渣は乾燥後、均質化し、燃焼法で同様に計測した。

**代謝物の分析:** 代謝物のプロフィールは HPLC で標品との保持時間の比較で定量・同定した。さらに、HPLC 画分を溶媒系の異なる TLC (シリカゲルカラムあるいは逆相カラム)で一次元展開して HPLC 分析結果の確認および HPLC 画分の再分離・定量に用いた。標品を分析試料に混合あるいは分析試料の近くにスポットして展開した。

試験結果：

なたね中の残留放射能；均質化試料の直接燃焼による種子、茎葉、根の残留放射能を次表に示す。

処理量( g /ha)	分析試料	分布率(%)	濃度(ppm)
100	種子	0.14	0.055
	茎葉	3.98	0.259
	根	0.36	0.097
	合計	4.48	0.207
200	種子	0.17	0.127
	茎葉	5.31	0.650
	根	0.32	0.138
	合計	5.80	0.491
1000	種子	0.12	0.696
	茎葉	3.25	2.351
	根	0.16	1.077
	合計	3.53	2.073

表中の分布率は処理放射能(TAR)に対する割合(%)、濃度は親化合物換算濃度(ppm)。

なたね植物全体の残留放射能は 100、200 および 1000 g/ha 処理区とも非常に少なく、それぞれ処理放射能に対して 4.5% (0.207 ppm)、5.8% (0.491 ppm) および 3.5% (2.073 ppm) であった。

各植物部位とも残留量は処理量の増加につれて増加し、茎葉の残留が最も多かった (100、200 および 1000 g/ha 処理区でそれぞれ、0.259、0.650 および 2.351 ppm)。ついで、根が多く (100、200 および 1000 g/ha 処理区でそれぞれ、0.097、0.138 および 1.077 ppm)、種子は最も少なかった (100、200 および 1000 g/ha 処理区でそれぞれ、0.055、0.127 および 0.696 ppm)。

放射能の分布;放射能の抽出性を次表に示す。

処理量 (g/ha)	画分	種子		茎葉		根	
		%TRR	濃度 (ppm)	%TRR	濃度 (ppm)	%TRR	濃度 (ppm)
100	抽出性	75.8	0.042	95.3	0.247	87.2	0.084
	ヘキサン	5.4	0.003	-	-	-	-
	アセトニトリル	31.4	0.017	58.8	0.152	55.5	0.054
	メタノール/水	39.0	0.021	23.2	0.060	21.3	0.020
	水	-	-	4.5	0.012	3.5	0.003
	ソックスレー(水)	-	-	8.8	0.023	7.0	0.007
	非抽出性	24.2	0.013	4.7	0.012	12.8	0.012
200	合計	100.0	0.055	100.0	0.259	100.0	0.097
	抽出性	74.8	0.095	94.4	0.614	88.3	0.122
	ヘキサン	5.8	0.008	-	-	-	-
	アセトニトリル	22.9	0.029	55.8	0.363	61.5	0.085
	メタノール/水	45.9	0.058	24.4	0.158	19.4	0.027
	水	-	-	5.4	0.035	2.4	0.003
	ソックスレー(水)	-	-	8.8	0.058	5.0	0.007
1000	非抽出性	25.2	0.032	5.6	0.036	11.7	0.016
	合計	100.0	0.127	100.0	0.650	100	0.138
	抽出性	81.9	0.570	95.9	2.256	80.0	0.862
	ヘキサン	5.9	0.042	-	-	-	-
	アセトニトリル	18.8	0.131	56.3	1.323	32.7	0.352
	メタノール/水	57.1	0.398	27.8	0.654	31.7	0.341
	水	-	-	5.4	0.127	6.3	0.068
	ソックスレー(水)	-	-	6.5	0.152	9.3	0.101
	非抽出性	18.1	0.126	4.1	0.095	20.0	0.215
	合計	100.0	0.696	100	2.351	100.0	1.077

濃度は親化合物換算濃度(ppm)。 -:該当なし

種子:抽出性放射能は 100 および 200 g/ha 処理区でそれぞれ総回収放射能の 75.8%(0.042 ppm) および 74.8%(0.095 ppm)、ヘキサン可溶性の油性物質は少なく 5.4~5.8%( $\leq 0.008$  ppm) であった。したがって、極性の抽出液(アセトニトリルおよびメタノール/水)をプール(100 g/ha 処理区で 70.4%、200 g/ha 処理区で 68.9%)し、固層カートリッジで精製して HPLC で分析した。抽出後の残渣にはそれぞれ総回収放射能の 24.2% および 25.2% が残っていた。

茎葉:残留放射能の大部分(両処理区で 94.4~95.3%)がアセトニトリル、メタノール/水および水で抽出され、濃度は 100 および 200 g/ha 処理区でそれぞれ 0.247 および 0.614 ppm であった。抽出後の残渣にはそれぞれ総回収放射能の 4.7% および 5.6% が残っていた。

根:茎葉と同じ溶媒で残留放射能の大部分(87.2~88.3%)が抽出され、濃度は 100 および 200 g/ha 処理区でそれぞれ 0.084 および 0.122 ppm であった。抽出後の残渣にはそれぞれ総回収放射能の 12.8% および 11.7% が残っていた。

5 倍量(1000 g/ha)処理区:通常量処理区と同様に抽出性放射能の割合は種子で総回収放射能 81.9%(0.570 ppm)、茎葉で 95.9%(2.256 ppm)、根で 80.0%(0.862 ppm) であった。抽出後の残渣にはそれぞれ総回収放射能の 18.1%(0.126 ppm)、4.1%(0.095 ppm) および 20.0%(0.215 ppm) が残っていた。



本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

種子：代謝物のパターンは異なる3処理量とも同様であった。ジノテフランは100、200及び1000 g/ha 処理区でそれぞれ 0.006 ppm(総回収放射能の 14.8%)、0.016 ppm(18.7%)および 0.095 ppm(18.0%)検出され、種子中で最も主要な残留であった。

茎葉：代謝物のパターンは異なる3処理量とも同様であった。ジノテフランは100、200及び1000 g/ha 処理区でそれぞれ 0.025 (総回収放射能の 11.3%)、0.094 (16.9%)および 0.222 ppm (10.6%)検出された。

根：ジノテフランは 100、200 および 1000 g/ha 処理区でそれぞれ 0.008 (総回収放射能の 10.8%)、0.021 (18.4%)および 0.100 ppm (13.1%)検出された。

抽出後残渣の特徴づけ：種子の溶媒抽出後残渣の室温条件および還流条件化における加水分解処理後の放射能の抽出結果を次表に示す。

抽出条件		100 g/ha		200 g/ha	
		%TRR	濃度(ppm)	%TRR	濃度(ppm)
非抽出性放射能		24.2	0.013	25.2	0.032
室温条件	酸加水分解	9.0	0.005	12.7	0.016
	アルカリ加水分解	12.7	0.007	12.6	0.016
	非抽出性	2.6	0.001	<0.1	<0.001
還流条件	酸加水分解	16.0	0.009	24.6	0.031
	アルカリ加水分解	8.2	0.004	0.6	<0.001
	非抽出性	0.0	<0.001	<0.1	<0.001

表中の分布率は総回収放射能に対する割合(%)、濃度は親化合物換算濃度(ppm)。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

室温条件化では酸およびアルカリ加水分解で同程度の放射能が抽出され、非抽出性放射能は総回収放射能の 2.6%(0.001 ppm)を越えることはなかった。

想定代謝経路を以下に示す。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

### 3. 土壌中運動に関する試験

#### (1) 好気的土壌代謝試験

(資料 12-1-1)

試験機関：三井化学(株)

報告書作成年：2000年

供試標識化合物：

略称：[F-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 放射化学的純度：

略称：[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 放射化学的純度：

供試土壌：茨城畑土壌、高知畑土壌および大阪畑土壌

試験方法：

##### 1) インキュベーション

ガラス製ビーカーに土壌(乾土 50g 相当量)を入れ、水分を最大容水量の 60%に調整した後、恒温器(25°C)内で 2~3 週間プレインキュベーションした。その後、[F-<sup>14</sup>C]ジノテフランまたは[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 50 μg をアセトン溶液で、土壌に添加後、混合し、ガラス製デシケーターに入れ、恒温器内でインキュベーションした。茨城畑土壌および高知畑土壌ではデシケーターにトラップ(二酸化炭素捕集用：2N 水酸化カリウム水溶液、他の揮発性成分捕集用：エチレングリコール)を接続し、揮発性成分の捕集を行った。また、茨城畑土壌について、オートクレーブ滅菌した土壌における試験を行った。

##### 2) 試料の採取

茨城畑土壌および高知畑土壌については 16 週後まで、大阪畑土壌については 20 週後まで、試料を経時的に採取した。

##### 3) 分析方法

各試料は抽出後に、放射能量の測定と成分の解析、定量を行った。代謝物の解析は LC/MS および TLC により、定量は HPLC および TLC により行った。茨城畑土壌の 6 および 12 週後の試料について、抽出残渣中放射能の分析を行った。

試験結果：放射能分布の経時変化を表 1~3 に、抽出部のジノテフランおよび代謝物の経時変化を表 4~6 に示した。抽出残渣中放射能の分析結果を表 7 に示した。滅菌条件下における抽出部の放射能量およびジノテフランの経時変化を表 8 に示した。

##### 1) 放射能分布

揮発性成分の捕集を行った試験における 16 週後の放射能回収率は[F-<sup>14</sup>C]ジノテフランで 88~92%、[G-<sup>14</sup>C]ジノテフランで 95% であった。抽出部の放射能量は経時的に減少し、試験終了時には、[F-<sup>14</sup>C]ジノテフランで 16~32%、[G-<sup>14</sup>C]ジノテフランで 47~56% であった。抽出残渣中の放射能量は経時的に増加し、試験終了時には、[F-<sup>14</sup>C]ジノテフランで 9~19%、[G-<sup>14</sup>C]ジノテフランで 13~23% であった。

2) 挥発性成分

二酸化炭素は、[F-<sup>14</sup>C]ジノテフランにおいて、より多く検出された。16週後の検出量は[F-<sup>14</sup>C]ジノテフランで56~62%、[G-<sup>14</sup>C]ジノテフランで26~28%であった。その他の揮発性成分は検出されなかった。

3) ジノテフランの半減期

各土壤ともにジノテフランは経時的に減衰した。半減期は茨城畑土壤では5~6週、高知畑土壤では約6週、大阪畑土壤では10~11週であった。

4) 代謝物

代謝物組成について、土壤による顕著な差は認められなかった。

また、二酸化炭素の生成が確認された。

5) 抽出残渣中放射能の分析

茨城畑土壤、6および12週後の抽出残渣中放射能を分析した。

6) 減菌条件下での代謝

ジノテフランは減菌条件下においては殆ど減衰しなかった。したがって、ジノテフランの好気的条件下での土壤代謝には微生物が関与すると考えられた。

7) 代謝経路

ジノテフランは好気的土壤においてテトラヒドロフラン部とグアニジン部の開裂、メチル基の脱離およびニトロイミノ基の加水分解などの代謝を受けると考えられた。これらの代謝物はさらに代謝を受け、二酸化炭素にまで分解された。

表1 茨城畑土壤における放射能分布の経時変化(処理量に対する割合(%))

供試化合物	分析対象	処理後時間(週)						
		0	1	4	6	8	12	16
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	抽出部	95.25	87.54	58.61	48.65	36.96	26.00	17.79
	抽出残渣	0.80	6.20	16.60	18.65	18.30	17.45	18.60
	二酸化炭素	<0.005	<0.005	13.41	22.44	32.24	48.07	55.86
	放射能回収率	96.05	93.74	88.62	89.74	87.50	91.52	92.25
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	抽出部	96.82	89.05	72.73	68.00	63.44	56.02	46.51
	抽出残渣	0.60	7.35	15.85	19.50	16.75	18.30	22.55
	二酸化炭素	<0.005	<0.005	7.75	10.24	13.86	21.25	25.63
	放射能回収率	97.42	96.40	96.33	97.74	94.05	95.57	94.69

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

表2 大阪畑土壤における放射能分布の経時変化(処理量に対する割合(%))

供試化合物	分析対象	処理後時間(週)						
		0	1	4	6	8	12	16
[F- <sup>14</sup> C] ジ'ノテフラン	抽出部	98.35	90.65	71.55	67.05	60.75	49.60	37.45
	抽出残渣	0.75	3.37	6.71	7.85	11.47	12.32	12.44
	放射能回収率	99.10	94.02	78.26	74.90	72.22	61.92	49.89
[G- <sup>14</sup> C] ジ'ノテフラン	抽出部	99.20	94.60	85.50	82.90	76.90	74.40	63.30
	抽出残渣	0.62	2.28	5.78	7.37	8.51	9.91	7.05
	放射能回収率	99.82	96.88	91.28	90.27	85.41	84.31	70.35

表3 高知畑土壤における放射能分布の経時変化(処理量に対する割合(%))

供試化合物	分析対象	処理後時間(週)						
		0	1	4	6	8	12	16
[F- <sup>14</sup> C] ジ'ノテフラン	抽出部	99.89	87.88	67.87	48.35	41.78	33.24	16.39
	抽出残渣	0.63	3.29	6.97	7.97	8.80	13.77	9.26
	二酸化炭素	<0.005	7.03	27.66	36.79	45.32	55.28	62.18
	放射能回収率	100.52	98.20	102.50	93.11	95.90	102.29	87.83
[G- <sup>14</sup> C] ジ'ノテフラン	抽出部	99.15	92.11	87.39	77.10	73.99	61.52	49.63
	抽出残渣	0.44	2.72	7.39	8.05	10.09	14.25	16.63
	二酸化炭素	<0.005	1.34	7.93	11.69	15.90	20.96	28.45
	放射能回収率	99.59	96.17	102.71	96.84	99.98	96.73	94.71

表4 茨城畑土壤における抽出部のジ'ノテフランおよび代謝物の経時変化(処理量に対する割合(%))

供試化合物	化合物名	処理後時間(週)						
		0	1	4	6	8	12	16
[F- <sup>14</sup> C] ジ'ノテフラン	ジ'ノテフラン	93.63	85.49	55.82	45.68	34.48	23.92	16.45
[G- <sup>14</sup> C] ジ'ノテフラン	ジ'ノテフラン	95.44	84.20	58.60	48.55	40.26	24.80	16.57

表5 大阪畑土壤における抽出部のジ'ノテフランおよび代謝物の経時変化(処理量に対する割合(%))

供試化合物	化合物名	処理後時間(週)						
		0	1	4	6	8	12	16
[F- <sup>14</sup> C] ジ'ノテフラン	ジ'ノテフラン	94.35	85.55	67.60	64.02	57.98	47.23	35.55
[G- <sup>14</sup> C] ジ'ノテフラン	ジ'ノテフラン	95.35	86.94	66.49	66.79	54.86	52.88	39.80

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

表 6 高知畑土壤における抽出部のジノテフランおよび代謝物の経時変化(処理量に対する割合(%))

供試化合物	化合物名	処理後時間(週)						
		0	1	4	6	8	12	16
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	ジノテフラン	97.86	81.73	61.71	43.00	36.49	28.74	12.30
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	ジノテフラン	97.70	83.62	63.93	36.90	37.39	29.71	19.10

表 7 茨城畑土壤における抽出残渣中放射能の分析結果(抽出残渣中放射能量に対する割合(%))

供試化合物	処理後時間(週)	塩酸抽出部	アセトニトリル抽出部	フルボ酸部	フミン酸部	フミン部	放射能回収率
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	6	57.7	7.7	19.7	3.0	12.3	100.4
	12	33.4	5.1	18.9	5.1	36.7	99.2
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	6	44.0	6.2	17.9	5.4	20.7	94.2
	12	49.2	4.3	29.5	6.3	17.4	106.7

表 8 茨城畑土壤抽出残渣における塩酸抽出部放射能の代謝物組成  
(抽出残渣中放射能量に対する割合(%))

供試化合物	処理後時間(週)	ジノテフラン					
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	6	13.5					
	12	7.1					
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	6	8.6					
	12	9.1					

表 9 茨城畑土壤の滅菌条件下における抽出部の放射能量およびジノテフランの経時変化  
(処理量に対する割合(%))

供試化合物	分析対象	処理後時間(週)				
		0	2	4	8	16
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	抽出部 ジノテフラン	99.86 97.89	96.72 95.27	96.79 94.66	96.30 93.93	97.76 95.43
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	抽出部 ジノテフラン	97.23 95.29	99.85 97.88	97.73 95.64	98.07 95.42	98.94 96.43

ジノテフランの好氣的土壤における  
想定代謝経路図

(2) 好気的湛水土壤代謝試験

(資料 12-1-2)

試験機関：三井化学(株)

報告書作成年：2000年

供試標識化合物：

略称：[F-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 放射化学的純度：

略称：[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 放射化学的純度：

供試土壤：青森水田土壤、千葉水田土壤および三重水田土壤

試験方法：

1) インキュベーション

ガラス製平底試験管に土壤(乾土 50g 相当量)を入れ、蒸留水を加えて水深を 2~4cm に調整した後、恒温器(25°C)内で 5~7 週間プレインキュベーションした。[F-<sup>14</sup>C]ジノテフランまたは[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 20 μg をアセトン溶液で、田面水に添加後、土壤と共に攪拌し、ガラス製デシケーターに入れ、恒温器内でインキュベーションした。青森水田土壤および千葉水田土壤ではデシケーターにトラップ(二酸化炭素捕集用：2N 水酸化カリウム水溶液、その他の揮発性成分捕集用：エチレングリコール)を接続し、揮発性成分の捕集を行った。また、千葉水田土壤について、オートクレーブ滅菌した土壤における試験を行った。

2) 試料の採取

試料は 16 週後まで経時的に採取した。

3) 分析方法

田面水は直接、土壤は抽出後に、放射能量の測定と成分の解析、定量を行った。代謝物の解析は LC/MS および TLC により、定量は HPLC および TLC により行った。青森水田土壤の 6 週後の試料について、抽出残渣中放射能の分析を行った。

試験結果：放射能分布の経時変化を表 1~3 に、抽出部のジノテフランおよび代謝物の経時変化を表 4~6 に示した。また、青森水田土壤における抽出残渣中放射能の分析結果を表 7 に、千葉水田土壤での滅菌条件下における抽出部の放射能量およびジノテフランの経時変化を表 8 に示した。

1) 放射能分布

揮発性成分の捕集を行った試験における 16 週後の放射能回収率は、[F-<sup>14</sup>C]ジノテフランで 85~90%、[G-<sup>14</sup>C]ジノテフランで 93~96% であった。抽出部の放射能量は経時的に減少し、16 週後には[F-<sup>14</sup>C]ジノテフランで 21~35%、[G-<sup>14</sup>C]ジノテフランで 19~35% であった。抽出残渣中の放射能量は経時的に増加し、16 週後には、[F-<sup>14</sup>C]ジノテフランで 50~57%、[G-<sup>14</sup>C]ジノテフランで 58~67% 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三井化学アグロ株式会社にある。

## 2) 挥発性成分

二酸化炭素は、16週後、[F-<sup>14</sup>C]ジノテフランで8~11%、[G-<sup>14</sup>C]ジノテフランで6~10%検出された。その他の揮発性成分は検出されなかった。

## 3) ジノテフランの半減期

各土壤ともにジノテフランは経時的に減衰した。半減期は青森水田土壤では約4週、千葉水田土壤では4~5週、三重水田土壤では約5週であった。

## 4) 代謝物

代謝物組成について、土壤による顕著な差は認められなかった。

また、二酸化炭素の生成が確認された。

## 5) 抽出残渣の分析

青森水田土壤、6週後の抽出残渣の塩酸抽出部に残渣中放射能量の76~83%が存在した。

## 6) 減菌条件下での代謝

ジノテフランは減菌条件下においては殆ど減衰せず、ジノテフランの好気的湛水条件下での土壤代謝には微生物が関与すると考えられた。

## 7) 代謝経路

表1 青森水田土壤における放射能分布の経時変化(処理量に対する割合(%))

供試化合物	分析対象	処理後時間(週)						
		0	1	4	6	8	12	16
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	抽出部	99.06	91.55	65.40	52.77	44.19	32.02	24.81
	田面水	49.88	32.69	17.41	12.27	7.95	3.26	2.65
	土壤抽出部	49.18	58.86	47.99	40.50	36.24	28.76	22.16
	抽出残渣	0.79	4.50	26.13	35.66	41.45	52.75	57.12
	二酸化炭素	<0.005	0.27	1.57	3.33	4.66	6.25	7.82
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	放射能回収率	99.85	96.32	93.10	91.76	90.30	91.02	89.75
	抽出部	99.03	90.13	57.67	45.96	38.48	28.62	21.00
	田面水	47.98	34.06	13.27	8.72	6.32	3.20	1.68
	土壤抽出部	51.05	56.07	44.40	37.24	32.16	25.42	19.32
	抽出残渣	0.77	6.27	35.68	45.57	50.11	58.42	65.41
	二酸化炭素	<0.005	0.16	1.36	2.43	3.40	4.95	6.19
	放射能回収率	99.80	96.56	94.71	93.96	91.99	91.99	92.60

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

表2 千葉水田土壤における放射能分布の経時変化(処理量に対する割合(%))

供試化合物	分析対象	処理後時間(週)						
		0	1	4	6	8	12	16
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	抽出部	98.99	94.31	70.73	54.24	42.81	28.59	21.18
	田面水	70.72	53.69	29.53	19.98	11.30	4.25	1.77
	土壤抽出部	28.27	40.62	41.20	34.26	31.51	24.34	19.41
	抽出残渣	0.98	4.05	20.56	31.28	37.72	48.06	52.77
	二酸化炭素	<0.005	0.64	2.10	4.46	6.37	9.34	11.11
	放射能回収率	99.97	99.00	93.39	89.98	86.90	85.99	85.06
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	抽出部	99.77	95.13	67.56	49.11	41.48	23.27	19.39
	田面水	71.34	53.97	26.27	16.31	11.77	2.77	1.27
	土壤抽出部	28.43	41.16	41.29	32.80	29.71	20.50	18.12
	抽出残渣	0.57	4.77	28.13	44.69	52.43	65.91	66.74
	二酸化炭素	<0.005	0.23	1.39	2.60	3.90	7.15	9.71
	放射能回収率	100.34	100.13	97.08	96.40	97.81	96.33	95.84

表3 三重水田土壤における放射能分布の経時変化(処理量に対する割合(%))

供試化合物	分析対象	処理後時間(週)						
		0	1	4	6	8	12	16
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	抽出部	102.65	88.76	74.16	65.41	49.04	39.95	34.61
	田面水	70.71	43.90	30.66	22.95	17.26	9.45	6.20
	土壤抽出部	31.94	44.86	43.50	42.46	31.78	30.50	28.41
	抽出残渣	1.13	2.24	17.67	27.98	35.95	48.43	50.20
	放射能回収率	103.78	91.00	91.83	93.39	84.99	88.38	84.81
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	抽出部	98.22	88.70	61.07	62.39	50.08	40.05	35.08
	田面水	64.86	40.71	17.65	20.59	14.71	9.32	6.60
	土壤抽出部	33.36	47.99	43.42	41.80	35.37	30.73	28.48
	抽出残渣	0.32	2.54	18.83	31.23	40.73	52.54	58.46
	放射能回収率	98.54	91.24	79.90	93.62	90.81	92.59	93.54

表4 青森水田土壤における抽出部のジノテフランおよび代謝物の経時変化

(処理量に対する割合(%))

供試化合物	化合物名	処理後時間(週)						
		0	1	4	6	8	12	16
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	ジノテフラン	99.06	88.67	52.41	38.34	27.98	12.40	7.24
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	ジノテフラン	97.59	84.27	40.98	30.74	21.29	10.32	5.16

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

表 5 千葉水田土壤における抽出部のジノテフランおよび代謝物の経時変化  
(処理量に対する割合(%))

供試化合物	化合物名	処理後時間(週)						
		0	1	4	6	8	12	16
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	ジノテフラン	97.40	90.64	58.77	40.86	27.10	15.00	6.28
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	ジノテフラン	98.66	90.72	52.95	31.69	22.28	6.78	3.82

表 6 三重水田土壤における抽出部のジノテフランおよび代謝物の経時変化  
(処理量に対する割合(%))

供試化合物	化合物名	処理後時間(週)						
		0	1	4	6	8	12	16
[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	ジノテフラン	101.69	86.88	63.01	44.92	28.09	14.66	7.29
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	ジノテフラン	97.41	86.98	51.91	41.64	27.18	15.50	7.68

表 7 青森水田土壤における抽出残渣中放射能の分析結果  
(処理 6 週後、抽出残渣中放射能量に対する割合(%))

供試化合物	塩酸抽出部	アセトニトリル抽出部	フルボ酸部	フミン酸部	フミン部	放射能回収率
[F- <sup>14</sup> C]ジノテフラン	83.12	1.20	8.78	1.71	10.17	104.98
[G- <sup>14</sup> C]ジノテフラン	75.82	1.39	8.47	2.57	11.05	99.30

表 8 千葉水田土壤での滅菌条件下における抽出部の放射能量およびジノテフランの経時変化  
(処理量に対する割合(%))

供試化合物	分析対象	処理後時間(週)				
		0	2	4	8	16
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	抽出部 ジノテフラン	96.80 94.78	97.50 94.86	97.89 95.41	95.01 92.17	94.81 92.14

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

(3) 嫌氣的土壤代謝試験

(資料 12-1-3)

試験機関：三井化学(株)

報告書作成年：2000年

供試標識化合物：

略称：[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 放射化学的純度：

供試土壤：茨城畑土壤

試験方法：

1) インキュベーション

ガラス製平底試験管に土壤(乾土 50g 相当量)を入れ、蒸留水を加えて水深を 2cm に調整した。窒素ガス交換下、恒温器(26°C)内で 4 週間プレインキュベーションを行った。[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 20 μg をアセトン溶液で、表面水に添加後、土壤と共に攪拌し、平底試験管をガラス製デシケーター内に静置し、窒素ガス交換下、恒温器内でインキュベーションした。トラップ(二酸化炭素捕集用：2N 水酸化カリウム水溶液、その他の揮発性成分捕集用：エチレングリコール)を接続し、揮発性成分の捕集を行った。

2) 試料の採取

試料は 26 週後まで経時的に採取した。

3) 分析方法

表面水は直接、土壤は抽出後、放射能量の測定と成分の解析、定量を行った。代謝物の解析は LC/MS および TLC により、定量は TLC により行った。16 週後の試料について、抽出残渣中放射能の分析を行った。

試験結果：放射能分布の経時変化を表 1 に、抽出部におけるジノテフランおよび代謝物の経時変化を表 2 に示した。抽出残渣中放射能の分析結果を表 3 に示した。

1) 放射能分布

26 週後の放射能回収率は 100% であった。抽出部の放射能量は経時的に減少し、26 週後には 49% となった。抽出残渣中の放射能量は経時的に増加し、26 週後には 49% となつた。

2) 挥発性成分

26 週後に二酸化炭素が 1% 検出された。その他の揮発性成分は検出されなかった。

3) ジノテフランの半減期

ジノテフランの半減期は約 9 週であった。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

4) 代謝物

また、二酸化炭素の生成が確認された。

5) 抽出残渣の分析

抽出残渣の塩酸抽出部に残渣中放射能量の 81%が存在した。

6) 代謝経路

表 1 放射能分布の経時変化(処理量に対する割合(%))

供試 化合物	分析対象	処理後時間(週)				
		0	4	8	16	26
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	抽出部	99.46	89.84	74.14	51.72	49.38
	表面水	70.77	19.78	14.24	4.69	4.05
	土壤抽出部	28.69	70.06	59.90	47.03	45.33
	抽出残渣	0.97	11.38	25.75	43.19	49.25
	二酸化炭素	<0.005	0.20	0.33	0.69	1.21
	放射能回収率	100.43	101.42	100.22	95.60	99.84

表 2 抽出部におけるジノテフランおよび代謝物の経時変化(処理量に対する割合(%))

供試 化合物	化合物名	処理後時間(週)				
		0	4	8	16	26
[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	ジノテフラン	97.24	79.87	57.25	21.39	17.75

表 3 抽出残渣中放射能の分析結果(処理 16 週後、抽出残渣中放射能量に対する割合(%))

供試 化合物	塩酸 抽出部	アセトニトリル 抽出部	フルボ 酸部	フミン 酸部	フミン部	放射能 回収率
[G- <sup>14</sup> C]ジノテフラン	80.58	3.15	4.26	1.21	14.27	103.48

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

ジノテフランの嫌気的土壤における  
想定代謝経路図

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学株アグロ式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学株アグロ式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学株アグロ式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

#### 4. 土壌吸着性試験

##### (1)ジノテフランの土壌吸着係数試験

(資料 17-1-1)

試験機関 : (株)化学分析コンサルタント

[GLP 対応]

報告書作成年 : 2000 年

供試化合物:

名称: ジノテフラン

化学名: (*RS*)-1-メチル-2-ニトロ-3-(テトラヒドロ-3-フリルメチル)グアニジン

供試土壤: 4 種類の土壌を使用した。各土壌は(社)日本植物防疫協会から分譲されたものである。各土壌の特性を表 1 に示した。表中の土壌番号は(社)日本植物防疫協会で使用されている番号である。また、表中の採取場所の正確な場所は以下に示す通りである。

##### 土壌番号及び採取場所

No.6: 日植調研究所(茨城県牛久市柏田町)

No.8: 日植防高知試験場(高知県香美郡野市町)

No.14: 日植防研究所(茨城県牛久市結束町)

No.20: 日植防宮崎試験場(宮崎県宮崎郡佐土原町)

試験方法: 各土壌 5g(乾土相当量)に精製水 5ml を加えて 24 時間静置した。その後、ジノテフラン 1ppm を含む 0.01M 塩化カルシウム溶液 20ml を添加し、25°C、遮光下で 16 時間振とう(100rpm)した。遠心分離(3000rpm、20 分)後、水相及び固相を分析した。

試験結果: 求められた各土壌における結果を表 2 に示した。土壌吸着割合は 7.0~18.0%、K' は 0.38~1.12、K'cc は 23.3~33.6 の範囲であった。

物質収支を表 3 に示した。回収率は 96~98% であった。

いずれの土壌においても 25% 以上の吸着が認められなかったため、高次試験を実施しなかった。したがって、フロイントリッヒ式による K' および K'cc の算出は行わなかつた。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

表 1: 供試土壤の特性

土壤番号	No.6	No.8	No.14	No.20
分類	水田土壤	水田土壤	畠地土壤	畠地土壤
土壤群名	沖積埴壤土	沖積鉱質土壤	淡色黒ボク土	砂丘未熟土土壤
採取場所	茨城	高知	茨城	宮崎
土性	LiC	LiC	HC	SiCL
砂%	28.0	42.2	24.8	86.0
シルト%	35.4	31.9	27.5	7.1
粘土%	36.6	25.9	47.7	6.9
有機炭素含有量%	2.60	1.21	3.33	1.5
全炭素含有量%	-	-	4.01	1.67
pH				
H <sub>2</sub> O	6.7	7.5	7.0	5.9
KCl	6.0	6.5	6.2	5.3
CaCl <sub>2</sub>	-	-	6.4	5.4
陽イオン交換容量	21.5	11.3	29.8	9.7
リン酸吸収係数	820	390	2220	1030
粘土鉱物の種類	モンモリナイト	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

表中の-は報告書に記載なし

表 2: スクリーニング試験結果

土壤番号	No.6	No.8	No.14	No.20
吸着後の溶液中ジノテフラン濃度 Ce(μg/ml)	0.71	0.74	0.64	0.74
全水分量 V <sub>0</sub> (ml)	25.2	25.1	25.7	25.2
対照試験におけるジノテフラン回収量 G(μg)	20.0	20.0	20.0	20.0
土壤吸着量 X(μg)	2.2	1.4	3.6	1.4
土壤吸着割合 A(%)	10.8	7.0	18.0	7.0
土壤の乾燥重量 m(g)	5.00	5.00	5.00	5.00
吸着係数 K'	0.60	0.38	1.12	0.38
有機炭素含有率 oc(%)	2.60	1.21	3.33	1.50
有機炭素含量を基にした吸着係数 K' <sub>oc</sub>	23.3	31.4	33.6	25.3

表中の数値は二連の平均値を示す

表 3: 物質収支

土壤番号	No.6	No.8	No.14	No.20
添加ジノテフラン量(μg)	20.0	20.0	20.0	20.0
回収液量(ml)	21.3	21.9	20.8	22.8
未回収液量(ml)	4.0	3.2	5.0	2.5
全水分中のジノテフラン量(μg)	17.9	18.6	16.5	18.6
固相中のジノテフラン量(μg)	4.4	3.2	6.0	2.8
吸着量(μg)	1.6	0.9	2.8	1.0
物質収支(回収率)(%)	97	98	96	98

表中の数値は二連の平均値を示す

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

## 5. 水中運命に関する試験

### 5.1 加水分解運命試験

#### (1)ジノテフランの加水分解性試験

(資料 19-1-1)

試告書作成機関 : (株)化学分析コンサルタント

[GLP 対応]

報成年 : 2000 年

供試化合物:

名称: ジノテフラン

化学名: (*RS*)-1-メチル-2-ニトロ-3-(テトラヒドロ-3-フリルメチル)グアニジン

供試水溶液: 精製水を用いて 3 種類の CLARK and LUBS の緩衝液を使用直前に調製した。

酸素を除去し、ろ過滅菌後使用した。

pH4.0: フタル酸水素カリウム/水酸化ナトリウム

pH7.0: リン酸一カリウム/水酸化ナトリウム

pH9.0: ホウ酸/塩化カリウム/水酸化ナトリウム

試験方法:

- 1)予備試験 減菌緩衝液で調製したジノテフラン 5ppm 溶液を、遮光下、50°C の恒温器内に保持した。0 及び 5 日後に分析を行った。三井化学(株)における試験で分解生成物と確認された UF の濃度も合わせて分析した。
- 2)長期試験 予備試験と同様に調製したジノテフラン 5ppm 溶液を、遮光下、25°C 及び 40°C の恒温器内に保持した。0、7、16、30、45 及び 60 日後にジノテフラン及び UF の分析を行った。

試験結果:

- 1)予備試験 結果を表 1 に示した。pH4.0 及び 7.0 においてジノテフランの分解は認められず、UF も検出されなかった。pH9.0 において 6.7% の分解が認められ、UF の微量な生成が確認された。
- 2)長期試験 結果を表 2 及び 3 に示した。温度条件 25°C ではいずれの pH においてもジノテフランの分解は認められなかった。40°C では pH4.0 及び 7.0 において分解は認められなかった。40°C、pH9.0 でのみ分解が認められ、60 日後に 78.3% に減衰した。この際、UF が微量検出された。

推定半減期を表 4 に示した。50°C、5 日間の予備試験において分解が 0 ~ 6.7% であったことにより、室温相当に変換した半減期はいずれの pH においても 1 年以上と推定された。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

表 1: 予備試験結果

分析対象	ジノテフラン			UF	
	0 日	5 日	残存率	0 日	5 日
pH4.0	4.96	4.96	100%		
pH7.0	4.90	4.94	101%		
pH9.0	4.94	4.61	93.3%		

表中の数値は濃度(μg/ml)、二連の平均値を示す

表 2: 長期試験結果(25°C)

ジノテフラン	経過日数					
	0 日	7 日	16 日	30 日	45 日	60 日
pH4.0	4.96	4.86	4.93	4.90	4.86	4.93
pH7.0	4.91	4.76	4.90	4.83	4.83	4.95
pH9.0	4.88	4.85	4.85	4.75	4.68	4.82

UF	経過日数					
	0 日	7 日	16 日	30 日	45 日	60 日
pH4.0						
pH7.0						
pH9.0						

表中の数値は濃度(μg/ml)、二連の平均値を示す

表 3: 長期試験結果(40°C)

ジノテフラン	経過日数					
	0 日	7 日	16 日	30 日	45 日	60 日
pH4.0	4.96	4.90	4.92	4.86	4.82	4.74
pH7.0	4.91	4.86	4.90	4.76	4.80	4.75
pH9.0	4.88	4.68	4.60	4.27	3.98	3.82

UF	経過日数					
	0 日	7 日	16 日	30 日	45 日	60 日
pH4.0						
pH7.0						
pH9.0						

表中の数値は濃度(μg/ml)、二連の平均値を示す

表 4: 推定半減期

	長期試験		予備試験
試験温度	25°C	40°C	50°C
pH4.0	>1年	>1年	>1年
pH7.0	>1年	>1年	>1年
pH9.0	>1年	170日	>1年

長期試験の半減期は計算による、予備試験はOECD ガイドライン 111 に従い、25°C相当に変換

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

(2)ジノテフランの加水分解性試験(強アルカリ性を含む)

(資料 19-1-2)

試験機関 : Huntingdon Life Sciences Ltd.

[GLP 対応]

報告書作成年 : 1998 年

供試化合物:

名称: ジノテフラン

化学名: (*RS*)-1-メチル-2-ニトロ-3-(テトラヒドロ-3-フリルメチル)グアニジン

供試水溶液: 純水を用いて以下の 5 種類の緩衝液を調製し、オートクレーブ滅菌後使用した。

pH4.0 : クエン酸/リン酸一水素二ナトリウム/塩酸

pH7.0 : リン酸二水素一カリウム/水酸化ナトリウム/塩酸

pH9.0 : テトラホウ酸二ナトリウム/リン酸二水素一カリウム/塩酸

pH11.0 : グリシン/塩化ナトリウム/水酸化ナトリウム

pH13.0 : グリシン/塩化ナトリウム/水酸化ナトリウム

試験方法: 滅菌緩衝液にジノテフランを加えて 0.01M とし、窒素通気後、遮光下、50°C の恒温器内に保持した。経時的に 170 時間まで分析を行った。また、三井化学(株)における試験で分解生成物と確認された UF の LC/MS による定性分析を行った。

試験結果: 結果を表 1 に示した。pH4.0、7.0 及び 9.0 において 50°C、5 日間でのジノテフランの分解はほとんど認められなかった。10%未満の分解率であったことにより、室温相当に変換した半減期は pH4.0、7.0 及び 9.0 において 1 年以上と推定された。

pH11.0 及び 13.0 においては分解が認められ 50°C における半減期はそれぞれ 45 時間及び 4.2 時間であった。pH13.0 における分解液中の主成分は UF と確認された。

表 1: ジノテフラン濃度の経時変化

pH	経過時間(時間)					
	0	2.4	24	96	120	170
4.0	1.85	1.85	1.87	1.83 * <sup>1</sup>	1.84 * <sup>2</sup>	1.83
7.0	1.91	1.89	1.91	分析せず	1.88 * <sup>2</sup>	1.84
9.0	2.05	2.07	2.01	分析せず	1.93 * <sup>2</sup>	1.84
11.0	2.10	1.97	1.34	0.46	0.32	分析せず
13.0	2.05	1.48	0.04	分析せず	分析せず	分析せず

表中の数値は g/l で記載した二連の平均値

\*<sup>1</sup>: 95 時間の値/\*<sup>2</sup>: 118 時間の値

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

## 5.2 水中光分解運命試験

### (1)ジノテフランの水中光分解試験

(資料 18-1-1)

試験機関 : (株)化学分析コンサルタント

[GLP 対応]

報告書作成年 : 2000 年

供試化合物:

名称: ジノテフラン

化学名: (*RS*)-1-メチル-2-ニトロ-3-(テトラヒドロ-3-フリルメチル)グアニジン

供試水: 2 種類の試験水を使用した。滅菌精製水は純水製造装置により製造したものを使用直前にろ過滅菌して使用した。自然水は荒川中流の河川水を使用した。埼玉県志木市秋ヶ瀬取水口付近で河川水を採取し、低温で保存していたものをろ過後使用した。

光源: キセノンランプ(1800W)、UV カットフィルター使用、分光分布 290nm 以上

光量: 測定値: 400～416W/m<sup>2</sup>(300～800nm)、36.0～36.9W/m<sup>2</sup>(300～400nm)

試験方法: 滅菌精製水で調製したジノテフラン 5ppm 溶液を石英ガラス製試験管に入れ、25°Cでキセノン光を連続照射した。0、1、2、3、4、6、24 時間及び 3、5、7 日後に濃度分析を行った。また、光分解生成物の経時変化を確認するため、5 種類の光分解生成物について 0、1、3、6、24 時間及び 3、5、7 日後に分析を行った。

試験結果: 結果を表 1～3 に示した。ジノテフランは光照射によって経時的に減衰し、その半減期は滅菌精製水及び自然水のいずれにおいても 3.8 時間であった。大部分の光分解生成物は一旦増加した後、減衰した。暗所対照区において分解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三井化学アグロ株式会社にある。

表 1: ジノテフランの経時変化

試験水	滅菌精製水		自然水	
	光照射区	暗所対照区	光照射区	暗所対照区
0 時間	4.92	4.92	4.94	4.90
1 時間	3.70	分析せず	3.70	分析せず
2 時間	2.90	分析せず	2.75	分析せず
3 時間	2.12	分析せず	2.02	分析せず
4 時間	1.67	分析せず	1.50	分析せず
6 時間	0.82	分析せず	0.77	分析せず
24 時間	<0.05	4.94	<0.05	4.93
3 日	分析せず	4.98	分析せず	4.92
5 日	分析せず	4.93	分析せず	5.00
7 日	分析せず	4.95	分析せず	4.92
最終分析時残存率	<1%	101%	<1%	100%

表中の数値は濃度(  $\mu\text{g}/\text{ml}$  )、二連の平均値を示す

表 2: 滅菌精製水中の光分解生成物の経時変化

経過時間					
0 時間					
1 時間					
3 時間					
6 時間					
24 時間					
3 日					
5 日					
7 日					

表中の数値は濃度(  $\mu\text{g}/\text{ml}$  )、二連の平均値を示す

\*: 平均値が算出できず最大値を記載

表 3: 自然水中の光分解生成物の経時変化

経過時間					
0 時間					
1 時間					
3 時間					
6 時間					
24 時間					
3 日					
5 日					
7 日					

表中の数値は濃度(  $\mu\text{g}/\text{ml}$  )、二連の平均値を示す

\*: 平均値が算出できず最大値を記載

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

(2) 水中光分解試験

(資料 14-1-2)

試験機関：三井化学(株)

報告書作成年：2000年

供試標識化合物：

略称：[F-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 放射化学的純度：

略称：[G-<sup>14</sup>C]ジノテフラン 放射化学的純度：

試験方法：

1) 田面水中光分解試験

①供試水：濾過滅菌田面水

②光源：メタルハライドランプ(400W)、フィルター無し、分光分布 300nm 以上

③光量：実測値；13.1W/m<sup>2</sup> (315~400nm)、50000 lux

④試験方法：[F-<sup>14</sup>C]ジノテフランまたは[G-<sup>14</sup>C]ジノテフランの2ppm水溶液を石英ガラス製試験管に入れ、明条件(人工気象室)または暗条件(恒温機)、25°Cで、15日後まで経時的に試料を採取した。

2) 田面水中光分解試験(揮発性成分捕集試験)

①供試水：濾過滅菌田面水

②光源：キセノンランプ(1500W)、UV カットフィルター使用、分光分布 290nm 以上

③光量：調整値；600W/m<sup>2</sup> (300~800nm)

④試験方法：[F-<sup>14</sup>C]ジノテフランまたは[G-<sup>14</sup>C]ジノテフランの2ppm水溶液を石英ガラス製丸底フラスコに入れ、トラップ(二酸化炭素捕集用：2N 水酸化カリウム水溶液、他の揮発性成分捕集用：エチレングリコール)を接続して、揮発性成分を捕集した。明条件(光分解装置)、25°Cで、16時間後まで経時的に試料を採取した。

3) 蒸留水中光分解試験

①供試水：蒸留水

②光源：メタルハライドランプ(400W)、フィルター無し、分光分布 300nm 以上

③光量：実測値；13.1W/m<sup>2</sup> (315~400nm)、50000 lux

④試験方法：[F-<sup>14</sup>C]ジノテフランまたは[G-<sup>14</sup>C]ジノテフランの2ppm水溶液を石英ガラス製試験管に入れ、明条件(人工気象室)または暗条件(恒温機)、25°Cで、16日後まで経時的に試料を採取した。

4) 分析方法

各試料は、放射能量の測定と成分の解析、定量を行った。代謝物の解析はLC/MSにより、定量はHPLCおよびTLCにより行った。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

試験結果：放射能回収率およびジノテフランの経時変化を表1～3に、分解物組成を表4および5に示した。

1) 放射能回収率

- ① 田面水中光分解試験(メタルハライドランプ) 15日後の放射能回収率は98～99%であった。暗条件における放射能回収率は98%であった。
- ② 田面水中光分解試験(揮発性成分捕集試験：キセノンランプ) 16時間後の放射能回収率は97～99%であった。16時間後の明条件では、[F-<sup>14</sup>C]ジノテフランにおいては二酸化炭素が0.1%、その他の揮発性成分が0.1%、[G-<sup>14</sup>C]ジノテフランにおいては二酸化炭素が0.5%、その他の揮発性成分が0.01%検出された。
- ③ 蒸留水中光分解試験(メタルハライドランプ) 16日後の放射能回収率は95～97%であった。暗条件における放射能回収率は100%であった。

2) ジノテフランの半減期

- ① 田面水中光分解試験(メタルハライドランプ) 明条件におけるジノテフランの半減期は5日であった。暗条件においてジノテフランは殆ど分解しなかった。
- ② 田面水中光分解試験(キセノンランプ) 明条件におけるジノテフランの半減期は3～4時間(東京、春の屋外条件で1日に相当する)であった。
- ③ 蒸留水中光分解試験(メタルハライドランプ) 明条件におけるジノテフランの半減期は5～6日であった。暗条件においてジノテフランは殆ど分解しなかった。

3) 分解物

各試験における主な分解物を以下に示した。

- ① 田面水中光分解試験
  - ② 蒸留水中光分解試験
- 4) 分解経路

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

表 1 田面水中光分解試験(メタルハライドランプ、明条件)における放射能回収率とジノテフランの経時変化(処理量に対する割合(%))

供試化合物	項目	処理後時間(日)					
		0	2	4	8	12	15
[F- <sup>14</sup> C]	放射能回収率	100.00	98.64	98.61	98.95	99.25	98.66
ジノテフラン	ジノテフラン	98.70	75.72	54.68	33.26	20.36	12.24
[G- <sup>14</sup> C]	放射能回収率	100.00	99.22	98.23	98.87	98.31	97.58
ジノテフラン	ジノテフラン	96.90	76.28	58.33	35.21	21.13	15.52

表 2 田面水中光分解試験(キセノンランプ、明条件)におけるジノテフランの経時変化(試料中放射能量に対する割合(%))

供試化合物	処理後時間(時間)						
	0	1	2	4	8	12	16
[F- <sup>14</sup> C]ジノテフラン	95.08	73.64	58.82	46.75	26.42	10.56	4.94
[G- <sup>14</sup> C]ジノテフラン	96.00	66.74	59.20	42.41	19.55	9.93	4.52

表 3 蒸留水中光分解試験(メタルハライドランプ、明条件)における放射能回収率とジノテフランの経時変化(処理量に対する割合(%))

供試化合物	項目	処理後時間(日)					
		0	2	4	8	12	16
[F- <sup>14</sup> C]	放射能回収率	100.00	98.84	96.77	98.23	97.07	94.65
ジノテフラン	ジノテフラン	99.25	85.11	65.14	37.22	21.24	14.58
[G- <sup>14</sup> C]	放射能回収率	100.00	100.29	98.71	97.81	97.39	97.02
ジノテフラン	ジノテフラン	99.35	83.76	66.79	38.82	21.76	8.41

表 4 田面水中光分解試験(明条件)における分解物組成(処理量に対する割合(%)) \*1)

供試化合物	[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン
光源	メタルハライド ランプ	メタルハライド ランプ	キセノンランプ	キセノンランプ
処理後時間	8 日	8 日	4 時間	4 時間
分解物組成	ジノテフラン			
合計				

-: 該当せず

\*1: キセノンランプにおける試験結果は試料中放射能量に対する割合(%)

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

表 5 蒸留水中光分解試験(明条件)における  
8日後の分解物組成(処理量に対する割合(%))

供試化合物		[F- <sup>14</sup> C] ジノテフラン	[G- <sup>14</sup> C] ジノテフラン
分解物組成	ジノテフラン	37.22	38.82
	合計		

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

#### 〈代謝分解のまとめ〉

ジノテフランの動物、植物、土壤中および光照射下における代謝・分解・残留の要約は下記の通りであり、代謝分解経路を 頁に、結果の概要を 頁に示した。

ジノテフランは動物体内、植物体中、土壤中および光照射下において、

により比較的容易に代謝分解され、これらの代謝分解物はさらに二酸化炭素などの揮発性成分にまで分解された。

いくつかの代謝分解物は動物体内および植物体中において、各種の抱合体を形成した。また、植物体では代謝物の一部が生体成分に取り込まれる事も明らかになった。

#### 動物代謝:

試験の結果を資料 10-1-1～10-2-3 に示した。ラットにおける吸収、排泄試験の結果から、ジノテフランは容易に吸収され、短時間に排泄される事が明らかとなった。すなわち、50mg/kg(混餌投与で約 700ppm に相当: 資料 4-1-1 の結果に基づく設定用量)をラットに単回投与(静脈内、経口)した場合、雌雄とも 24 時間後までに投与放射能の 96%以上が尿を中心に排泄された。この傾向は、影響が予想される用量である 1000mg/kg(混餌投与で約 14000ppm に相当)の場合も同様で、雌雄とも 24 時間後までに 86%以上が排泄された。胆汁排泄試験の結果から算出したジノテフランの吸収率は 98%であった。また、排泄における胆汁経路の関与は僅かであった。

血中濃度試験の結果に投与量、投与回数、投与経路、性差による顕著な差は認められなかった。投与後の血中濃度は、0.3～2 時間後に最高値に達した後、速やかに低下した。半減期は 3.64～16.1 時間であった。従って、ジノテフランおよび代謝物には、生体内での蓄積性はないと考えられた。AUC と投与量の比を比較すると、投与量による大きな差が認められなかったことから、50～1000mg/kg の投与量において、薬物動態と薬量の関係がほぼ直線的であると考えられた。

各臓器中の残留放射能は 50mg/kg・単回投与の場合、投与 0.5～1.5 時間後で最高濃度となり、投与終了後 168 時間には、皮膚(0.05ppm)および乳腺(0.02ppm)以外のほとんどの臓器で検出限界以下であった。1000mg/kg・単回投与では、168 時間後、いずれの臓器においても 0.7ppm 以下であった。50mg/kg・7 日間反復投与の場合では、168 時間後、いずれの臓器においても 0.3ppm 以下であった。

ラットの全身オートラジオグラフィーの結果より、投与放射能の速やかな吸収と腎臓を経由した排泄が認められた。

母動物にジノテフランを投与した場合、胎仔への移行が認められたが投与量に対して 0.1%程度であり、投与後に速やかに減衰した。また母動物の乳汁中に移行が認められたが、乳汁中放射能量は投与終了後血漿中の濃度変化とほぼ同様に速やかに減衰した。

ジノテフランは動物体内において一部代謝を受け、多種類の代謝物を生成した。

植物:

試験の結果を資料 11-1-1～11-2-4 に示した。ジノテフランは植物の葉面に処理した場合、水稻で移行が認められたが、その他の植物では処理葉以外への移行は少なく、特定部位への移行なども認められなかった。葉面処理での可食部への移行は僅かであった。ジノテフランは土壤に処理した場合、植物体に容易に吸収され、地上部全体に分布した。土壤処理での果実部あるいは根部での分布は僅かであった。結実期の果樹において未熟果実に処理した場合、処理放射能のほとんどは処理部にとどまった。果実内部への移行は認められたが、その濃度は低かった。

植物に処理したジノテフランは経時的に減衰し多くの代謝物を生成した。

土壤:

代謝試験の結果を資料 12-1-1～13-2-5 に示した。ジノテフランは土壤中で代謝され、その半減期は、好気的土壤代謝試験で 5～11 週、好気的湛水土壤代謝試験で 4～5 週、嫌気的土壤代謝試験では約 9 週であった。

また、土壤吸着試験の結果、ジノテフランの土壤吸着係数( $K'_{\infty}$ )は 23.3～33.6 であった(資料 17-1-1)。

光分解:

人工光照射(キセノンランプおよびメタルハライドランプ)の光分解試験の結果を資料 14-1-1~14-2-4 および 18-1-1 に示した。

滅菌環境水を用いたキセノンランプ照射下における試験の結果、水中での半減期は約4時間で、これは春の屋外条件で約1日に相当する。メタルハライドランプ照射下の土壤表面での光分解では、半減期は約 50 日であった。揮発性成分の捕集を行った薄膜および水中における試験では、二酸化炭素およびその他の揮発性成分が検出された。

ジノテフランは薄膜状態、水中、土壤表面で光による分解を受け、

加水分解:

試験の結果を資料 18-1-1~18-1-2 に示した。室温での pH4.0、7.0 および 9.0 の緩衝液中におけるジノテフランの半減期は 1 年以上と推定された。アルカリ条件下(pH11、13)では速やかに加水分解を受け主として を生成した。

ジノテフランは動物、植物、土壤中および光照射下において各種の代謝分解を受け、その結果、多種類の代謝分解物が生成した。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。










本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

## II. の代謝分解


本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

処理量に対する割合(%)

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

### III. の代謝分解

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

#### IV. の代謝分解

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

## V. の代謝分解


本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

VII. ジノテフランの環境挙動


本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は三井化学アグロ株式会社にある。

(付)

ジノテフランの開発年表