

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

## 2. 植物体内運命に関する試験

オリサストロピンの水稻における代謝試験

(資料 M-3)

試験機関：BASF 農業研究所 (ドイツ)

[GLP 対応]

報告書作成年：2002 年

供試標識化合物：オリサストロピン (以降 F000 と称す) のフェニル環及び 1-methyl 基並びに butylidene 基 (側鎖) の両方に  $^{14}\text{C}$  を標識した標識体 ( $^{14}\text{C}$  オリサストロピンと称す) を  $^{13}\text{C}$  標識体で希釈して用いた。

フェニル環標識体及び側鎖標識体は培養細胞を用いた試験にのみ使用した。

化学名：(2E)-2-(methoxyimino)-2-[2-[2-(3E, 5E, 6E)-5-(methoxyimino)-4, 6-dimethyl-2, 8-dioxa-3, 7-diazanona-3, 6-dien-1-yl]phenyl]-N-methylacetamide

分子式： $\text{C}_{18}\text{H}_{25}\text{N}_5\text{O}_5$

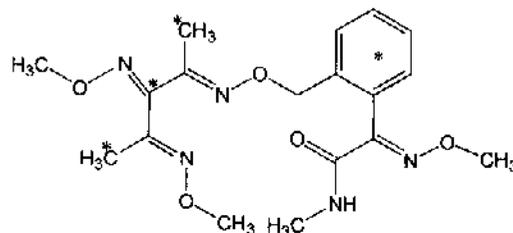
分子量：391.4

	$^{14}\text{C}$ オリサストロピン	フェニル環標識体	側鎖標識体	$^{13}\text{C}$ -標識体
標識体	$^{14}\text{C}$	$^{14}\text{C}$	$^{14}\text{C}$	$^{13}\text{C}$
比放射能 [MBq/mg] 比放射能 [dpm/ $\mu\text{g}$ ]				
放射化学的純度 <sup>a</sup>				
化学的純度 <sup>a</sup>				

<sup>a</sup> 99%は純度証明書から。

化学構造：

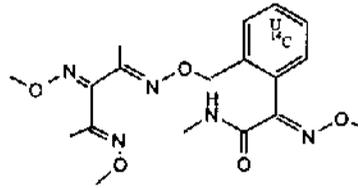
$^{14}\text{C}$  オリサストロピン



\* : phenyl- $^{14}\text{C}$ , 1-methyl- $^{14}\text{C}$  及び butylidene-2, 4- $^{14}\text{C}$  標識部位

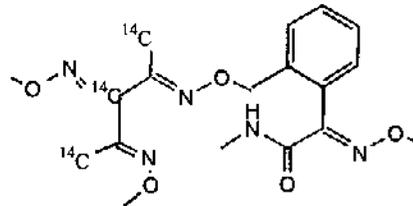
本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は BASF アグロ株式会社にある。

フェニル環標識体；



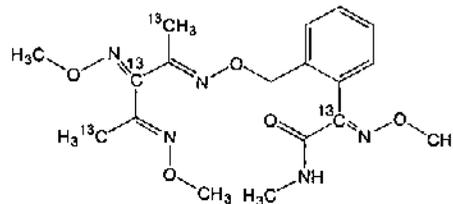
$U^{14}C$  : 標識部位

側鎖標識体 (1-methyl- $^{14}C$  及び butyliden-2, 4- $^{14}C$ ) ;



$^{14}C$  : 標識部位

$^{13}C$ -標識体 (1-methyl- $^{13}C$ , butylidene-2, 4- $^{13}C$ , acetamide-2- $^{13}C$  標識化合物) ;



$^{13}C$  : 標識部位

標識位置の設定理由；

供試植物： 水稻（品種名：こしひかり）

栽培環境：

土壌：Limburgerhof 砂土

播種：1999年3月12日，育苗箱（60 x 30 cm, 0.18 m<sup>2</sup>）

移植：1999年4月19日，ワグネルポット（表面積 0.16 m<sup>2</sup>）10個

育成：ワグネルポットを温室（ファイトトロン）内に設置。ポットは土壌表面から約 1 cmの深さに水を張った。

栽培管理：栽培終了時には，土壌表面を干した。

方法：

1) 処理原液

製剤：フロアブル製剤

調製方法：

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

## 2) 処 理

実使用場面では、育苗箱処理は徐放性粒剤を移植前に育苗箱に1回処理し、移植後に製剤が徐々に根部近くの土壌中に放出される。植物代謝試験でこの製剤の放射性被験物質を調製するのは、不可能なので、放出パターンを模しながら模擬育苗箱処理として処理原液または希釈した処理溶液を8回(育苗箱処理として1回)に分けて処理した。

[処理区1(育苗箱処理+田面水処理+茎葉散布の体系処理)]

処理時期及び試料採取時期について下表に纏める。

処理形態	処理日 (日/月/年)	処理部位	処理回数	処理原液の 処理量 (mL)	処理量 (mg)	処理面積 (m <sup>2</sup> )	実処理 濃度 (g/ha)	
育苗箱 (模擬 育苗箱 処理)	19.04.1999	育苗箱の 土壌	1	9	2.25			
	20.04.1999		2	14	3.50			
	21.04.1999		3	7	1.75			
	22.04.1999		4	6	1.50			
	26.04.1999		ワグネル ポットの 田面水 表面	5	9	2.25		
	28.04.1999			6	7	1.75		
	03.05.1999			7	5	1.25		
	12.05.1999			8	8	1.75		
			計	65	16.0	0.18	889	
田面水 処理	28.05.1999 (移植後38日)	ワグネル ポットの 田面水 表面	1	336	84.0			
	17.06.1999 (移植後58日)		2	336	84.0			
			計	672	168.0	1.12	1500	
茎葉 散布	13.07.1999 (移植後83日)	茎葉	1	267	66.8	2.08	321	

処理原液の濃度： 250.0 mg/L。

育苗箱からワグネルポットへの移植日：1999年4月19日

処理面積：0.18 m<sup>2</sup>/育苗箱、移植後0.16 m<sup>2</sup>/ワグネルポット X 7個(計1.12 m<sup>2</sup>)

名目処理量：模擬育苗箱処理；1000 g 成分/ha

田面水処理；750 g 成分/ha X 2回

茎葉散布；約300 g 成分/ha

処理量設定根拠：想定される最大使用時の残留量評価と代謝物の単離同定を行う為。

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

処理方法：

模擬育苗箱処理：処理原液 65 mL を 8 回に分けて処理する為に 8 個に分割し、各 1 個を水で 100 mL とした処理溶液を土壌表面直接処理(1 回目)及び移植後は  
ワグネルポットの田面水表面に処理

田面水処理：処理原液 336 mL を水で 420 mL とした処理溶液をワグネルポットの田面水に処理

茎葉散布：ワグネルポットの生育中の稲に処理原液 267 mL を自動散布装置で散布

[処理区 2(育苗箱処理)]

処理時期及び試料採取時期について下表に纏める。

処理形態	処理日 (日/月/年)	処理部位	処理回数	処理原液の 処理量 (mL)	処理量 (mg)	処理面積 (m <sup>2</sup> )	実処理 濃度 (g/ha)
育苗箱 (模擬 育苗箱 処理)	19.04.1999	育苗箱の 土壌	1	9	2.25		
	20.04.1999	ワグネル ポットの 田面水 表面	2	14	3.50		
	21.04.1999		3	7	1.75		
	22.04.1999		4	6	1.50		
	26.04.1999		5	9	2.25		
	28.04.1999		6	7	1.75		
	03.05.1999		7	5	1.25		
	12.05.1999		8	8	1.75		
				計	65	16.0	0.18

処理原液の濃度： 250.0 mg/L。

育苗箱からワグネルポットへの移植日：1999 年 4 月 19 日

処理面積：0.18 m<sup>2</sup>/育苗箱，移植後 0.16 m<sup>2</sup>/ワグネルポット X 3 個

名目処理濃度：模擬育苗箱処理；1000 g 成分/ha

処理量設定根拠：現実的実使用量での残留量の確認と吸収移行性調査の為。

処理方法：模擬育苗箱処理；処理区 1 と同様に処理した。

3) 試料採取

各試験区の試料採取時期及び採取部位を次頁の表に示す。

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

[処理区 1 (体系処理)]

試料採取時点 (日)	処理回数	試料採取部位	生育段階	調査項目
移植直後 (1回目処理後1日) 移植当日	模擬育苗箱 処理 1回	茎葉 根	2-3葉期	TRR* 残留放射能の同定/ 特徴づけ 代謝物パターン
茎葉散布前 (田面水に2回目処理後 25日) 移植後48日	育苗箱処理 1 回 + 田面水処 理 2回 (計3回)	茎葉 根	未成熟期	
収穫時 (茎葉散布後16日) 移植後99日	育苗箱処理 1 回 + 田面水処 理 2回 + 茎葉散布1回 (計4回)	籾 わら 根	登熟期	TRR 残留放射能の同定/ 特徴づけ 代謝物パターン 代謝物の単離 試料保存時安定性

\*TRR: 総残留放射能

[処理区 2 (育苗箱処理)]

試料採取時点 (日)	処理回数	試料採取部位	生育段階	調査項目
模擬育苗箱最終処理後33 日 移植後56日	育苗箱 処理 1回	茎葉 根	未成熟期	TRR 残留放射能の同定/ 特徴づけ 代謝物パターン 試料保存時安定性
収穫時 (模擬育苗箱最終処理後 70日) 移植後93日	育苗箱 処理 1回	籾 わら 根 土壌	登熟期	
移植後27, 59, 83日		植物全体		放射能の移行調査 オートラジオグラフィ

[対照試料]

試料採取時点 (日)	試料採取部位	生育段階	調査項目
1999年6月30日 移植後72日	茎葉	未成熟期	バックグラウンド 放射能
—	玄米	市販試料	

4) 試料の保存

各試料は採取後直ちに約-18°Cの冷凍庫で保存した。試料抽出物は冷蔵庫に保存したが、長期間の場合には冷凍庫に保存した。

分析方法:

(1) 総残留放射能 (TRR) の測定

採取した植物及び土壌の均質化試料を燃焼処理後 LSC で放射能を測定した。

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

(2) 残留放射能の分画

各試料を抽出し、抽出液と残渣に分けた。

抽出液は LSC で放射能を測定後、

液々分配した。

抽出残渣は凍結乾燥後、燃焼処理して LSC で放射能を測定した。さらに、抽出残渣については抽出した。

籾の特徴付け試料については、

抽出した。抽出残渣について

は抽出した。さらに

蛋白質沈殿化処理後、酵素処理した。抽

出残渣はさらに数種の酵素処理を行い、

抽出して分画し、抽出不能残渣の特徴付けを

した。

籾（処理区 1）は玄米と籾殻に分離し、各試料の TRR を測定した後、玄米を抽出した。

(3) 代謝物パターンの調査

抽出液を

HPLC で分析して代謝物パターンを調査した。

(4) 代謝物の単離・同定

わら（処理区 1）の

調査した。分画後の

HPLC で分画・単離した画分と

を LC/MS (MS) 及び LC/NMR 分析して代謝物の構造を解

析した。その他の試料についてはわら試料で同定された代謝物の HPLC クロマトグラムの保持時間と比較して同定した。

(5) 保存安定性の調査

籾（処理区 1）及び茎葉試料（処理区 2）とそれらの

抽出液を約  $-18^{\circ}\text{C}$  で一定期間保存

した。保存開始時と終了時にそれぞれ分析して、分析値の比較検討をした。

分析法のスキームを図 1~3 に示す。各試料は図 1~3 の抽出、分画、あるいは酵素処理を適宜組み合わせて操作し、その後 HPLC、LSC、LC/MS (MS) 及び LC/NMR 等を適切に使用して分析した。

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

図 1 分析操作スキーム

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

図 2 分析操作スキーム (粉試料の特徴付け)

### 図 3 分析操作スキーム

稲の培養細胞を用いた試験：フェニル環及び側鎖標識体を用いて、フェニル環または側鎖部位の間で開裂が起きるか否かについて検討するために、稲の培養細胞を用い、処理後2、4、7、10及び14日間培養、ろ過して、ろ液をHPLC条件の最適化に用いた。さらに、側鎖標識体を用いた14日間の培養ろ液を用い、HPLCで主要ピークを分画・単離し、LC/MS/MS分析に供した。

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

結果：

(1) 吸収及び移行

水稻の各生育段階における試料の総残留放射能 (TRR) を求め、結果を表 1 に纏めた。茎葉、わら及び籾試料は抽出可能放射能と抽出不能放射能の合計を算出して求めた TRR を使用した。根及び土壌試料は燃焼分析値を使用した。

この結果から体系処理 (処理区 1, 育苗箱+田面水+茎葉処理) 後の BAS 520 F は茎葉、稲わら及び籾殻の残留は玄米中よりかなり多く、育苗箱 1 回処理 (処理区 2) に比し極めて高かった。また根部や土壌中、育苗箱処理の籾中の残留量は非常に少なかった。このことは本剤は水稻に吸収され、主に茎と葉に移行することを示している。

処理区 2 の水稻を移植後 27、59 及び 83 日に採取し、そのオートラジオグラムから、土壌または田面水に処理した本剤は根部から吸収され、地上部に容易に移行するが、花序への移行は茎葉よりも少ないことを確認した (図 5、6 及び 7 を参照)。

表 1 水稻及び土壌の TRR

試料採取時点	処理回数	最終処理後経過日数	試料名	TRR (燃焼分析) [mg/kg]	算出 TRR* [mg/kg]
処理区 1					
移植直後 (育苗箱 1 回処理 1 日後)	1	1	茎葉	0.118	0.106
			根	0.161	n. a. *
茎葉散布前 (2 回田面水散布後 25 日後)	3	25	茎葉	15.906	16.191
			根	0.638	n. a.
収穫時 (茎葉処理後 16 日)	4	16	籾	5.414	5.228
			わら	32.286	31.361
			玄米	1.229	1.219
			籾殻	29.351	n. a.
			根	0.524	n. a.
処理区 2					
最終模擬育苗箱処理 33 日後	1	33	根	0.208	n. a.
			茎葉	0.585	0.594
収穫時	1	70	籾	0.174	0.163
			わら	1.487	1.211
			根	0.037	n. a.
			土壌	0.013	n. a.

\*算出 TRR: 茎葉・わら・籾・玄米については溶媒抽出可能放射能+抽出不能残渣の合計とした (表 2 参照)。

根・籾殻・土壌については非計算のため n. a. (該当せず) と表記した。

(2) 残留放射能の分布

① 残留放射能の溶媒抽出可能放射能と抽出不能残渣の分離

水稻試料を 及び水で抽出し、溶媒抽出可能放射能と抽出不能残渣に分離した (表 2 と 3)。

茎葉及びわら中の放射能は TRR の約 78~94%, さらに TRR の約 1~6% が抽出された。抽出可能放射能は TRR の約 80~95%, 抽出不能残渣は TRR の約 5~20% であった。

籾・玄米中放射能は TRR の約 35~74%, TRR の約 6~11% が抽出された。抽出可

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

能放射能は TRR の約 43~82%、抽出不能残渣は TRR の約 18~57%であった。

表 2 水稲中残留放射能：処理区 1

試料 (試料識別)	算出 TRR [mg/kg]	抽出物 [mg/kg] (%TRR)	抽出物 [mg/kg] (%TRR)	溶媒抽出可能 放射能 [mg/kg] (%TRR)	抽出不能残渣 [mg/kg] (%TRR)	
茎葉 (移植直後採取)	0.106 (100.0%)	0.099 (93.7%)	0.001 (0.9%)	0.100 (94.6%)	0.006 (5.4%)	
茎葉 (田面水処理後採取)	16.191 (100.0%)	14.569 (89.9%)	0.354 (2.2%)	14.923 (92.1%)	1.268 (7.8%)	
籾	保存開始時分析 (定量)	5.228 (100.0%)	3.807 (72.8%)	0.321 (6.1%)	4.128 (78.9%)	1.100 (21.0%)
	保存終了時分析 (安定性)	5.070 (100.0%)	3.740 (73.8%)	0.300 (5.9%)	4.040 (79.7%)	1.030 (20.3%)
玄米	1.219 (100.0%)	0.860 (70.5%)	0.137 (11.2%)	0.997 (81.7%)	0.223 (18.3%)	
わら	31.361 (100.0%)	27.919 (89.0%)	0.803 (2.5%)	28.722 (91.5%)	2.639 (8.4%)	

TRR は計算値。( ) は TRR に対する%。抽出可能放射能 = 抽出物 + 抽出物。

表 3 水稲中残留放射能：処理区 2

試料 (試料識別)	算出 TRR [mg/kg]	抽出物 [mg/kg] (%TRR)	抽出物 [mg/kg] (%TRR)	溶媒抽出可能 放射能 [mg/kg] (%TRR)	抽出不能残渣 [mg/kg] (%TRR)	
茎葉	保存開始時分析 (定量)	0.594 (100.0%)	0.464 (77.9%)	0.015 (2.5%)	0.479 (80.4%)	0.116 (19.5%)
	保存終了時分析 (安定性)	0.545 (100.0%)	0.448 (82.3%)	0.013 (2.5%)	0.461 (84.8%)	0.083 (15.2%)
籾	0.163 (100.0%)	0.057 (35.2%)	0.013 (8.0%)	0.070 (43.2%)	0.093 (56.9%)	
わら	1.211 (100.0%)	0.951 (78.5%)	0.066 (5.5%)	1.017 (84.0%)	0.194 (16.0%)	

TRR は計算値。( ) は TRR に対する%。抽出可能放射能 = 抽出物 + 抽出物。

② 抽出物の液々分配

わら・籾試料を液々分配して精製し、抽出液中の放射能の分布/特性を調査した(表 4 と 5)。有機溶媒可溶放射能は体系処理(処理区 1, 4 回処理)で TRR の約 71~81%、育苗箱処理(処理区 2, 1 回処理)で TRR の約 26%であった。水溶性放射能は TRR の約 3~6%であった。

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

表 4 抽出物の液々分配後の放射能分布：処理区 1

試料	抽出物 [mg/kg]	有機溶媒可溶物				計 [mg/kg]	水溶性物 [mg/kg]
		[mg/kg]	[mg/kg]	[mg/kg]	[mg/kg]		
籾	4.282 (81.2%)	3.125 (59.7%)	0.508 (9.7%)	0.096 (1.8%)	3.729 (71.2%)	0.260 (5.0%)	
わら	26.584 (84.8%)	18.745 (59.8%)	5.657 (18.0%)	1.061 (3.4%)	25.463 (81.2%)	1.739 (5.5%)	

( )は TRR に対する%。

表 5 抽出物の液々分配後の放射能分布：処理区 2

試料	抽出物 [mg/kg]	有機溶媒可溶物				計 [mg/kg]	水溶性物 [mg/kg]
		[mg/kg]	[mg/kg]	[mg/kg]	[mg/kg]		
籾	0.060 (36.5%)	0.031 (18.9%)	0.010 (6.2%)	0.002 (1.3%)	0.043 (26.4%)	0.005 (3.2%)	

( )は TRR に対する%。

③ 溶媒抽出後の残渣の調査

抽出不能残渣を で抽出し、残渣を酵素処理し、さらにアルカリ処理して分画し、抽出不能残渣の特徴付けを行った(表 6 と 7)。

処理区 2 の茎葉とわら試料では TRR の約 10~15%が で抽出され、抽出残渣は TRR の約 9~16%であった。

籾試料では TRR の約 5~7%が で抽出され、抽出残渣では TRR の約 14~58%が存在した。抽出残渣をさらに酵素処理し分画した。セルロース画分 には TRR の約 2~23%が検出され、そのうち に 1.0~1.2%, に 0.6~22.5%が分布していた。

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

表 6 溶媒抽出後の抽出不能放射能の分画/特徴：処理区 1 n. a. : 該当せず, n. p. : 実施せず

処理	試料	茎葉 1) [mg/kg] (%TRR)	茎葉 2) [mg/kg] (%TRR)	籾* [mg/kg] (%TRR)	わら [mg/kg] (%TRR)
処理回数		1	3	4	4
	溶媒抽出後の残留物	0.006 (5.4%)	1.268 (7.8%)	1.021 (20.8%)	2.639 (8.4%)
	抽出物	n. p.	n. p.	0.246 (5.0%)	n. p.
	蛋白画分	n. p.	n. p.	0.037 (0.7%)	n. p.
	その他画分	n. p.	n. p.	0.200 (4.1%)	n. p.
	処理	n. p.	n. p.	0.134 (2.7%)	n. p.
	処理	n. p.	n. p.	0.095 (1.9%)	n. p.
	層			0.048 (1.0)	
	層			0.029 (0.6)	
	処理	n. p.	n. p.	0.072 (1.5%)	n. p.
	NaOH 画分	n. p.	n. p.	0.112 (2.3%)	n. p.
	最終残留物	0.006 (5.4%)	1.268 (7.8%)	0.369 (7.5%)	2.639 (8.4%)
	処理操作の回収率	n. a.	n. a.	101%	n. a.

\* TRR= 4.919 mg/kg, 抽出方法 :

1) 移植直後採取試料。 2) 田面水処理後採取試料。

表 7 溶媒抽出後の抽出不能放射能の分画/特徴：処理区 2 n. a. : 該当せず, n. p. : 実施せず

処理	試料	茎葉 [mg/kg] (%TRR)	籾* [mg/kg] (%TRR)	わら [mg/kg] (%TRR)
処理回数		1	1	1
	溶媒抽出後の残留物	0.116 (19.5%)	0.093 (65.8%)	0.194 (16.0%)
	抽出物	0.088 (14.8%)	0.010 (6.8%)	0.124 (10.2%)
	蛋白画分	n. p.	0.002 (1.5%)	n. p.
	その他画分	n. p.	0.007 (4.9%)	n. p.
	処理	n. p.	0.004 (2.9%)	n. p.
	処理	n. p.	0.034 (23.2%)	n. p.
	層		0.002 (1.2)	
	層		0.033 (22.5)	
	処理	n. p.	0.019 (13.3%)	n. p.
	NaOH 画分	n. p.	0.005 (3.7%)	n. p.
	最終残留物	0.095 (16.0%)	0.020 (13.8%)	0.104 (8.6%)
	処理操作の回収率	158%	96%	118%

\* TRR= 0.147 mg/kg, 抽出方法 :

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

(3) 抽出可能残留放射能の同定/特徴付け及び定量

各種溶媒の抽出液及び分配液を HPLC で特徴付け及び定量し、LC/MS/MS で同定/特徴付けした結果を表 8~11 に示す。

① 茎葉試料の同定/特徴付け(表 8)

体系処理(処理区 1)では、田面水処理 25 日後において茎葉試料の抽出可能放射能の主要成分は親化合物(TRR の 41.5%)と (F001, TRR の 19.7%)であった。その他に数種化合物またはそれらの異性体が同定された(TRR の約 2-8%)。同定/特徴づけられた放射能総量は TRR の約 86%であった。抽出不能放射能は TRR の約 8%であった。

育苗箱処理(処理区 2)では、最終処理 33 日後において茎葉試料の抽出可能放射能の主要成分は親化合物(TRR の 18.7%)とその (F001, TRR の 9.5%)であった。また、さらに抽出残渣を で抽出し、TRR の約 15%の放射性成分を分離した。その主要成分も親化合物(TRR の 2.2%)とその (F001, TRR の 0.8%)であった。

② 籾試料の同定/特徴付け(表 9)

体系処理(処理区 1)では、籾試料の抽出可能放射能の主要成分は親化合物(TRR の 51.7%)と (TRR の 17.0%)であった。茎葉試料と同様にその他数種化合物またはそれらの異性体が同定された (TRR の約 0.3-7%)。同定/特徴づけられた放射能総量は TRR の約 88%TRR であった。抽出不能放射能は TRR の 21%であった。さらに抽出残渣を 抽出し、TRR の約 6%の放射性成分を分離した。その主要成分も親化合物(TRR の 3.1%)と (F001, TRR の 0.7%)であった。

育苗箱処理(処理区 2)では、籾試料の抽出可能放射能の主要成分は親化合物(TRR の 5.6%)と (F001, TRR の 2.6%)及び F030 とその異性体(TRR の 4.0%)であった。同定/特徴づけられた放射能総量は TRR の約 45%であった。抽出不能残渣は TRR の約 57%であった。さらに、この抽出残渣を で抽出し、TRR の約 11%の放射性成分を分離した。その主要成分も親化合物(TRR の 1.5%)とその (F001, TRR の 0.5%)であった。

③ わら試料の同定/特徴付け(表 10)

体系処理(処理区 1)では、わら試料の抽出可能放射能の主要放射性成分は親化合物(TRR の 42.6%)であり、第 2 の成分は (F001, TRR の 17.2%)であった。さらに数種化合物またはそれらの異性体が同定された(TRR の 2-9%)。同定/特徴づけられた放射能総量は TRR の約 87%であった。抽出不能残渣は TRR の 8.4%であった。

育苗箱処理(処理区 2)では、抽出可能放射能の主要成分は親化合物(TRR の 21.4%)と (F001, TRR の 11.3%)であった。さらに数種化合物またはそれらの異性体が同定された(TRR の 2.5-9%)。同定/特徴づけられた放射能総量は TRR の約 82%であった。さらに、この抽出残渣を で抽出し、TRR の約 16 %の放射性成分を分離した。その主要成分も親化合物(TRR の 3.1%)と (F001, TRR の 1.3%)であった。

④ 玄米試料(体系処理:処理区 1)の同定/特徴付け(表 11)

玄米試料の抽出可能放射能の主要成分は親化合物(TRR の 35.1%)と (F001, TRR の 6.3%)であった。他の試料で同定された数種化合物またはそれらの異性体は HPLC クロマトグラム上多くの微量未知化合物ピークを含んでいるため、分離が困難であり、明確な帰属を決定できなかった(TRR の 40.2%)。同定/特徴づけられた放射能総量は TRR の約 82%であった。抽出不能残渣は TRR の約 18%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 BASF アグロ株式会社にある。

表 8 茎葉試料の残留放射能の同定/特徴付け

n. d. : 検出せず, n. a. : 該当せず

	移植時採取 試料 (処理区 1) 茎葉	田面水処理 25 日後採取試料 (処理区 1) 茎葉			最終育苗箱処理 33 日後採取試料 (処理区 2) 茎葉		
処理回数	1 (初回土壌 処理後)	3			1		
TRR	0.106 (100.0)	16.191 (100.0)			0.594 (100.0)		
抽出物				計			計
同定化合物							
F000 (BAS 520 F)	0.079 (74.6)	6.596 (40.8)	0.120 (0.7)	6.716 (41.5)	0.111 (18.7)	n. a. (n. a.)	0.111 (18.7)
F001	0.001 (0.5)	3.148 (19.5)	0.047 (0.3)	3.195 (19.7)	0.057 (9.5)	n. a. (n. a.)	0.57 (9.5)
F026		0.409 (2.5)	0.018 (0.1)	0.427 (2.6)	0.014 (2.3)	n. a. (n. a.)	0.014 (2.3)
F025		0.442 (2.7)	0.015 (0.1)	0.457 (2.8)	0.014 (2.4)	n. a. (n. a.)	0.014 (2.4)
F027		0.355 (2.2)	n. d. (n. d.)	0.355 (2.2)	0.011 (1.8)	n. a. (n. a.)	0.011 (1.8)
F027, F028, F029		0.418 (2.6)	0.018 (0.1)	1.327 (8.2)	0.002 (0.3)	n. a. (n. a.)	0.034 (5.7)
		0.374 (2.3)	0.019 (0.19)		0.010 (1.7)		
		0.498 (3.1)			0.004 (0.7)		
					0.018 (3.0)		
F030 異性体					0.006 (1.0)	n. a. (n. a.)	0.006 (1.0)
					0.008 (1.3)	n. a. (n. a.)	0.008 (1.3)
総同定抽出可能 放射能	0.080 (75.1)			12.477 (77.1)			0.254 (42.7)
総特徴付け抽出可能放 射能	0.007 (6.6)	1.335 (8.2)	0.109 (0.7)	1.444 (8.9)			0.118 (19.9)
総同定/特徴付け放射能	0.086 (81.7)			13.921 (86.0)			0.372 (62.6)
抽出残渣	0.006 (5.4)			1.268 (7.8)			0.116 (19.5)
抽出残渣から遊離した放射能の同定/特徴付け							
同定代謝物							
F000	n. a. (n. a.)	n. a. (n. a.)	n. a. (n. a.)	n. a. (n. a.)	n. a. (n. a.)	0.013 (2.2)	0.013 (2.2)
F001	n. a. (n. a.)	n. a. (n. a.)	n. a. (n. a.)	n. a. (n. a.)	n. a. (n. a.)	0.005 (0.8)	0.005 (0.8)
総同定放射能							0.018 (3.0)
総特徴付け放射能							0.070 (11.8)
総同定/特徴付け放射能							0.088 (14.8)
最終残渣							0.095 (16.0)
総分析回収放射能	0.092 (87.1)			15.189 (93.8)			0.555 (93.4)

上段 : mg/kg。下段 : (%TRR)。

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

表 9 初試料の残留放射能の同定/特徴付け

n. a. : 該当せず, n. p. : 実施せず

	初 処理区 1				初 処理区 2			
	4				1			
処理回数	5.228 (100.0)				0.163 (100.0)			
TRR								
抽出物				計				計
同定化合物								
F000 (BAS 520 F)	2.559 (48.9)	0.145 (2.8)	n. a. (n. a.)	2.704 (51.7)	0.009 (5.3)	0.000 (0.3)	n. a. (n. a.)	0.009 (5.6)
F001	0.854 (16.3)	0.036 (0.7)	n. a. (n. a.)	0.890 (17.0)	0.004 (2.6)	0.000 (0.1)	n. a. (n. a.)	0.004 (2.6)
F026	0.060 (1.1)	0.001 (0.0)	n. a. (n. a.)	0.061 (1.2)	0.000 (0.2)	n. d. (n. d.)	n. a. (n. a.)	0.000 (0.2)
F025	0.113 (2.2)	n. d. (n. d.)	n. a. (n. a.)	0.113 (2.2)	0.002 (1.4)	n. d. (n. d.)	n. a. (n. a.)	0.002 (1.4)
未知物質	—	—	—	—	0.001 (0.6)	n. d. (n. d.)	n. a. (n. a.)	0.001 (0.6)
F027	0.055 (1.1)	0.001 (0.0)	n. a. (n. a.)	0.056 (1.1)	—	—	—	—
F027, F028, F029 及び未知物質#	n. d. (n. d.)	0.006 (0.1)	n. a. (n. a.)	0.388 (7.4)	0.001 (0.6)	n. d. (n. d.)	n. a. (n. a.)	0.002 (1.5)
	0.068 (1.3)	0.005 (0.1)	n. a. (n. a.)		0.001 (0.5)	n. d. (n. d.)	n. a. (n. a.)	
	0.065 (1.2)	0.007 (0.1)	n. a. (n. a.)		0.001 (0.4)	n. d. (n. d.)	n. a. (n. a.)	
	0.231 (4.4)	0.007 (0.1)	n. a. (n. a.)		—	—	—	
F030. 異性体	n. d. (n. d.)	0.013 (0.3)	n. a. (n. a.)	0.013 (0.3)	0.003 (1.6)	0.001 (0.4)	n. a. (n. a.)	0.006 (4.0)
					0.003 (2.0)	n. d. (n. d.)	n. a. (n. a.)	
総同定抽出可能放射能				4.225 (80.7)				0.026 (15.8)
総特徴付け抽出可能放射能				0.370 (7.1)				0.047 (28.8)
総同定/特徴付け放射能				4.595 (87.8)				0.073 (44.6)
抽出残渣				1.100 (21.0)				0.093 (56.9)
抽出残渣から遊離した放射能の同定/特徴付け								
同定代謝物								
F000	n. a. (n. a.)	n. a. (n. a.)	0.162 (3.1)	0.162 (3.1)	n. a. (n. a.)	n. a. (n. a.)	0.002 (1.5)	0.002 (1.5)
F001	n. a. (n. a.)	n. a. (n. a.)	0.035 (0.7)	0.035 (0.7)	n. a. (n. a.)	n. a. (n. a.)	0.001 (0.5)	0.001 (0.5)
総同定放射能				0.197 (3.8)				0.003 (2.0)
総特徴付け放射能				0.111 (2.1)				0.014 (8.6)
総同定/特徴付け放射能				0.308 (5.9)				0.017 (10.6)
最終残渣				0.654 (12.5)				0.087 (53.2)
総分析回収放射能				5.557 (106.2)				0.177 (108.4)

上段 : mg/kg。下段 : (%TRR)。

#クロマトグラム上の分離・同定が困難のため混合物として記載

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

表 10 わら試料の残留放射能の同定/特徴付け n. a. :該当せず, n. p. :実施せず

処理回数	わら 処理区 1			わら 処理区 2			
	4			1			
TRR	31.361 (100.0)			1.211 (100.0)			
抽出物			計				計
同定化合物							
F000 (BAS 520 F)	12.880 (41.1)	0.483 (1.5)	13.363 (42.6)	0.252 (20.8)	0.008 (0.6)	n. a. (n. a.)	0.259 (21.4)
F001	5.197 (16.6)	0.211 (0.7)	5.408 (17.2)	0.132 (10.9)	0.005 (0.4)	n. a. (n. a.)	0.136 (11.3)
F026	1.147 (3.7)	0.004 (0.0) 0.008 (0.0)	1.158 (3.7)	0.046 (3.8)	n. d. (n. d.)	n. a. (n. a.)	0.046 (3.8)
F025	0.429 (1.4)	n. d. (n. d.)	1.063 (3.4)	0.027 (2.2)	n. d. (n. d.)	n. a. (n. a.)	0.063 (5.2)
未知物質	0.634 (2.0)	n. d. (n. d.)		0.036 (3.0)	n. d. (n. d.)	n. a. (n. a.)	
F027	0.632 (2.0)	n. d. (n. d.)	0.632 (2.0)	0.031 (2.6)	n. d. (n. d.)	n. a. (n. a.)	0.031 (2.6)
F030, 異性体	0.172 (0.5)	n. d. (n. d.)	0.638 (2.0)	0.030 (2.5)	n. d. (n. d.)	n. a. (n. a.)	0.030 (2.5)
	0.133 (0.4)	n. d. (n. d.)					
	0.053 (0.2)	n. d. (n. d.)					
	0.280 (0.9)	n. d. (n. d.)					
F027, F028, F029 及び未知物質#	0.244 (0.8)	n. d. (n. d.)	2.628 (8.4)	0.011 (0.9)	n. d. (n. d.)	n. a. (n. a.)	0.107 (8.8)
	0.257 (0.8)	n. d. (n. d.)		0.020 (1.7)	n. d. (n. d.)	n. a. (n. a.)	
	0.536 (1.7)	n. d. (n. d.)		0.007 (0.5)	n. d. (n. d.)	n. a. (n. a.)	
	0.853 (2.7)	n. d. (n. d.)		0.047 (3.9)	n. d. (n. d.)	n. a. (n. a.)	
	0.738 (2.4)	n. d. (n. d.)		0.022 (1.8)	n. d. (n. d.)	n. a. (n. a.)	
総同定抽出可能放射能			24.890 (79.4)				0.673 (55.6)
総特徴付け抽出可能放射能			2.487 (7.9)				0.322 (26.6)
総同定/特徴付け放射能			27.377 (87.3)				0.996 (82.2)
抽出残渣			2.639 (8.4)				0.194 (16.0)
抽出残渣から遊離した放射能の同定/特徴付け							
F000				n. a. (n. a.)	n. a. (n. a.)	0.038 (3.1)	0.038 (3.1)
F001				n. a. (n. a.)	n. a. (n. a.)	0.016 (1.3)	0.016 (1.3)
総同定放射能							0.053 (4.4)
総特徴付け放射能							0.070 (5.8)
総同定/特徴付け放射能							0.124 (10.2)
最終残渣							0.104 (8.6)
総分析回収放射能			30.016 (95.7)				1.223 (101.0)

上段: mg/kg。下段: (%TRR)。#クロマトグラム上の分離・同定が困難のため混合物として記載

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

表 11 玄米中残留放射能の同定/特徴付け

		玄米 処理区 I	
処理回数	4		
TRR	1.219 (100.0)		
抽出物			計
同定化合物			
F000 (BAS 520 F)	0.413 (33.8)	0.016 (1.3)	0.428 (35.1)
F001 (BAS 520 F, EZE 体)	0.075 (6.1)	0.002 (0.2)	0.077 (6.3)
総同定抽出可能 放射能			0.506 (41.5)
総特徴付け抽出可能放 射能			0.491 (40.2)
総同定/特徴付け放射能			0.997 (81.7)
抽出残渣			0.223 (18.3)
総分析回収放射能			1.220 (100.0)

上段：mg/kg。下段：(%TRR)。

⑤ 試料の保存時安定性

茎葉及び籾試料とそれらの抽出液中における放射性成分の保存時安定性を調査した。試料の保存期間を下表に纏めた。その結果放射性成分のパターン及び量に有意な差は認められなかった(表 2 と 3)。

試料		保存期間 (日)
茎葉	抽出物	342
	実試料	287
穀粒	抽出物	328
	実試料	287

(4) 代謝

分析方法：(4)項に示す様に HPLC で単離・分画した画分を LC/MS 分析または LC/NMR 分析で同定/特徴付けた。主要放射性成分は分子量 391 の親化合物 (BAS 520 F, EEE 異性体) であり、第 2 の成分は LC/NMR で標準品と比較検討し、(F001) と同定した。その他の同定代謝物は LC/MS により同定した。

(5) 稲の培養細胞を用いた試験：側鎖標識体を用いた 14 日間の培養ろ液を用い、HPLC で分画・単離したピークの代謝物は F027, F031, F027, F028 と同定された。F031 は水稻植物体からは検出されなかったが、グルコース抱合体 F030 を生成するまでの中間体と考えられる。培養細胞を用いた試験において、親化合物の分子が開裂する証拠は得られなかった。

水稻試料(茎葉, 籾, わら)中で同定された放射性化合物の一覧を表 12, 13 に示す。推定代謝経路を図 4 に示す。

表 12 同定放射性化合物の一覧：体系処理（処理区 1）

化合物 コード名 (参照物質 番号)	同定放射性化合物	茎葉	莖葉	籾	わら
		移植当日	移植後 48 日	移植後 99 日	
		mg/kg (%TRR)	mg/kg (%TRR)	mg/kg (%TRR)	mg/kg (%TRR)
BAS 520 F F000  (334904)		0.079 (74.6)	6.716 (41.5)	2.866 (54.8)	13.363 (42.6)
F001  (n. a.)		0.001 (0.5)	3.195 (19.7)	0.925 (17.7)	5.408 (17.2)
F025  (n. a.)		n. d.	0.457 (2.8)	0.113 (2.2)	1.063 (3.4)
F026  (n. a.)		n. d.	0.427 (2.6)	0.061 (1.2)	1.158 (3.7)
F027  (n. a.)		n. d.	0.355 (2.2)	0.056 (1.1)	0.632 (2.0)
異性体混合物 (n. a.)		n. d.	1.327 (8.2)	0.388 (7.4)	2.628 (8.4)
F030 及び 異性体  (n. a.)		n. d.	n. d.	0.013 (0.3)	0.638 (2.0)

n. a. : 参照物質番号なし    n. p. : 検出せず

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

表 13 同定放射性化合物の一覧：育苗箱処理（処理区 2）

化合物 コード名  (参照物質 番号)	同定放射性化合物	茎葉	籾	わら
		移植後 56 日	移植後 93 日	
		mg/kg (%TRR)	mg/kg (%TRR)	mg/kg (%TRR)
BAS 520 F F000  (334904)		0.124 (20.9)	0.011 (7.1)	0.297 (24.5)
F001  (n. a.)		0.062 (10.3)	0.005 (3.1)	0.152 (12.6)
F025  (n. a.)		0.014 (2.4)	0.003 (2.0)	0.063 (5.2)
F026  (n. a.)		0.014 (2.3)	<0.001 (0.2)	0.046 (3.8)
F027  (n. a.)		0.011 (1.8)	n. d.	0.031 (2.6)
異性体混合物  (n. a.)		0.034 (5.7)	0.002 (1.5)	0.107 (8.8)
F030 及び 異性体  (n. a.)		0.014 (2.3)	0.006 (4.0)	0.030 (2.5)

n. a. : 参照物質番号なし n. p. : 検出せず

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

図 4 BAS 520 F の水稲における推定代謝経路

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

BAS 520 F は水稻中で次のように主要分解経路により代謝される。

第 1 の分解経路は、F027 と中間体を経  
て F030 になる。また (F029)。  
F027 は F025 となる。

第 2 の分解経路は , F028 となる。  
第 3 の分解経路としては F026 と  
なる。

また BAS 520 F およびその代謝物は数種類の E/Z 異性体を生成する。これら代謝物はさらに代謝され、最終的には蛋白質、炭水化物、セルロース及びリグニンなどの天然成分に取り込まれる。

#### [結 論]

BAS 520 F の水稻における代謝をフェニル環及び側鎖を放射能標識した化合物を用いて調査した。玄米中の主要残留物は未変化の BAS 520 F であった。育苗箱または田面水処理後の BAS 520 F は根から吸収され、主に茎および葉に移行した。玄米中の残留量は低かった。水稻中の BAS 520 F の代謝は比較的緩やかであり、BAS 520 F 及び数種の代謝物及びそれらの異性体が生成された。主要代謝経路は、脱メチル化、水酸化、脱メチル化後のグルコシド化であった。これら代謝物はさらに代謝され、最終的には蛋白質、炭水化物、セルロース及びリグニンなどの天然成分に取り込まれたが、各々の代謝物残留量は TRR の 5% を超えることはなくマイナー化合物であった。

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

図 5. 処理区-2, 移植 27 日後の水稻における BAS 520F の移行—水稻のオートラジオグラム

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

図 6. 処理区-2, 移植 59 日後の水稲における BAS 520F の移行—水稲のオートラジオグラム

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

図 7. 処理区-2, 移植 83 日後の水稻における BAS 520F の移行—水稻のオートラジオグラム

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

### 3. 土壤中運命に関する試験

#### 3-1 オリサストロピンの好氣的湛水土壤中運命試験

(資料 M-4)

試験機関：BASF 農業研究所 (ドイツ)

[GLP 対応]

報告書作成年：2002 年

供試標識化合物：オリサストロピンのフェニル環または 1-methyl 基及び butylidene 基を  $^{14}\text{C}$  標識した標識化合物を使用した。

化学名； (2E)-2-(methoxyimino)-2-[2-[(3E, 5E, 6E)-5-(methoxyimino)-4, 6-dimethyl-2, 8-dioxo-3, 7-diazanona-3, 6-dien-1-yl]phenyl]-N-methylacetamide

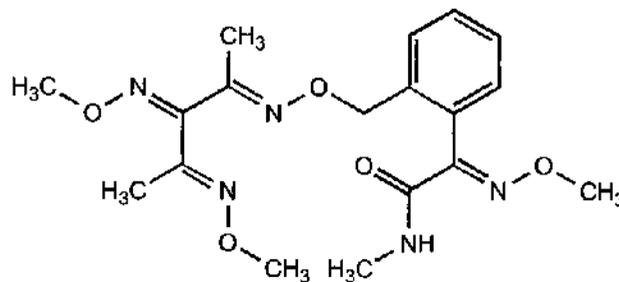
分子式；  $\text{C}_{18}\text{H}_{25}\text{N}_5\text{O}_5$

分子量； 391.4

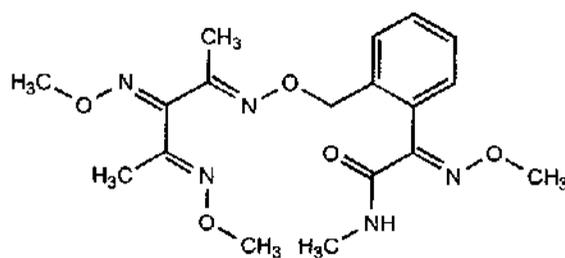
標識部位	Pheny- $\text{U-}^{14}\text{C}$	1-methyl- $^{14}\text{C}$ 、 butylidene-2, 4- $^{14}\text{C}$
標識同位体	$^{14}\text{C}$	$^{14}\text{C}$
比放射能 [MBq/mg]		
比放射能 [dpm/ $\mu\text{g}$ ]		
放射化学的純度*		
化学的純度		

\*： 散布液調製時に有効成分であるオリサストロピンの純度を測定し、方法の項に記載した。

化学構造； \*： phenyl- $\text{U-}^{14}\text{C}$  標識部位



#： 1-methyl- $^{14}\text{C}$ 、butylidene-2, 4- $^{14}\text{C}$  標識部位



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

標識位置の設定理由；

供試土壌：シルト質砂土 (Bruch West, Limburgerhof, ドイツ)

インキュベーション環境：

容器：フラスコ 30 個

土壌量：生土 108 g (=100 g 乾土量)/フラスコ

フラスコの調製：生土及び水約 65 mL 入れ、水層は土壌表面から上 1 cm に調整し、予備平衡化した。その後施用前に 4 フラスコを選び乾熱滅菌した。

装置調整：通気システム付きの代謝装置 (インキュベーター) でインキュベートし、揮発性物質採取装置 (0.5M NaOH、0.5M H<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>、フレングトリール) をフラスコに連結し、揮発性物質を 182 日間採取した。

期間：予備平衡化期間：20 日

インキュベート期間：182 日

温度：予備平衡化期間：25±3°C、暗所

インキュベート期間：25±1°C、暗所

方法：

1) 散布液

調製方法：各標識被験物質 (メタノール溶液、2.25 mg) と非標識被験物質 (メタノール溶液、2.25 mg) を混合して調製した。

Phenyl-[<sup>14</sup>C] 標識被験物質調製液：

放射化学的純度；

1-methyl-<sup>14</sup>C, butylidene-2, 4-[<sup>14</sup>C] 標識被験物質調製液：

放射化学的純度；

2) 処理

処理回数：1 回

処理濃度：名目被験物質量 150 μg/容器 (濃度 1.5 mg/kg 乾土)

使用量設定根拠：慣行圃場使用量 1500 g a. i. /ha に基づいた。

処理方法：散布液 60.1 μL を田面水に添加

3) 試料採取

採取時点：処理後 0, 3, 7, 14, 30, 59, 90, 120 及び 182 日

滅菌試料は処理後 182 日

採取試料数：1 標識につき 1 フラスコ/時点

4) 試料の保存

各試料は採取後直ちに水と土壌を分離し、土壌は溶媒抽出した。試料およびその抽出物は冷蔵庫または冷凍庫に保存した。

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

分析方法：

(1) 水試料

直接 LSC で放射能を測定及び HPLC 分析した。

(2) 土壌試料

で抽出し、抽出液と残渣に分ける。

抽出液は LSC で放射能を測定した(抽出可能放射能, ERR)。

に溶解し、HPLC 分析した。

抽出残渣は室温で乾燥後、燃焼処理、LSC で放射能を測定した(抽出不能放射能, RRR I)。  
土壌中の総放射能は ERR と RRR I の合計とした。

(3) 揮発性物質捕集試料

直接 LSC で放射能を測定した。NaOH トラップの放射能は BaCl<sub>2</sub> を添加し遠心分離で沈殿させ、  
上澄液を再度 LSC で測定し、<sup>14</sup>CO<sub>2</sub> であることを確認した。

(4) 結合残留物の特徴付け

底質試料の抽出残渣をさらに NaOH で抽出し、抽出不能放射能の特徴付けを行った。NaOH 抽出物を塩酸で沈殿させ沈殿物と上澄液に分離し、上澄液は液々分配により、有機溶媒可溶画分と水溶性画分に分画した。

分析法のスキームを図 1 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 BASF アグロ株式会社にある。

図 1 分析操作スキーム

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

## 結果

### (1) 残留放射性の分布および物質収支

各標識被験物質の水田土壌系における放射能分布および物質収支の推移を表 1～ 2 に示す。

物質収支はフェニル標識体では 93.9～99.3%TAR であり、側鎖標識体では 92.6～105.1%TAR の範囲であった。両標識体の水相の放射能は土壌に結合して着実に減少し、182 日後で水相に検出されたのは約 12～15%TAR であった。試験終了時における土壌の抽出可能放射能は、約 62～70%TAR であり、その大部分は抽出された。またその時点での抽出不能放射能は約 11～12%TAR であった。

無機化速度は遅く、試験終了時における CO<sub>2</sub> の生成は、フェニル標識体で 3.4%TAR および側鎖標識体で 7.8% であった。CO<sub>2</sub> 以外の揮発性物質は検出されなかった。

表 1 フェニル環標識オリサストロピンの水田土壌系における放射能分布および物質収支の推移

経過日数	μg (%TAR)					物質収支
	水相	土壌			CO <sub>2</sub>	
		ERR	RRR I	総計		
0	131.0 (87.3)	10.8 (7.2)	0.1 (0.1)	10.9 (7.3)	n. d. (n. d.)	141.9 (94.6)
3	81.7 (54.5)	66.1 (44.1)	1.1 (0.7)	67.2 (44.8)	n. d. (n. d.)	148.9 (99.3)
7	50.4 (33.6)	93.3 (62.2)	1.9 (1.3)	95.2 (63.5)	0.1 (0.1)	145.7 (97.1)
14	38.1 (25.4)	100.9 (67.3)	6.4 (4.3)	107.3 (71.5)	0.2 (0.1)	145.6 (97.1)
30	24.9 (16.6)	110.1 (73.4)	7.9 (5.3)	118.0 (78.7)	0.5 (0.3)	143.4 (95.6)
59	22.6 (15.1)	105.1 (70.1)	11.7 (7.8)	116.8 (77.9)	1.4 (0.9)	140.8 (93.9)
90	21.0 (14.0)	105.9 (70.6)	14.8 (9.9)	120.7 (80.5)	2.1 (1.4)	143.8 (95.9)
120	22.5 (15.0)	102.7 (68.5)	19.1 (12.7)	121.8 (81.2)	3.1 (2.1)	147.4 (98.3)
182	18.5 (12.3)	105.5 (70.3)	15.8 (10.5)	121.3 (80.9)	5.1 (3.4)	144.9 (96.6)
182 (滅菌土 壌)	27.8 (18.5)	109.6 (73.1)	4.2 (2.8)	113.8 (75.9)	n. d. (n. d.)	141.6 (94.4)

TAR : 総処理放射能 (100% = 150 μg/100 g 乾土/容器)。ERR : 抽出可能放射能。

RRR I : 抽出不能放射能。

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

表 2 1-methyl-<sup>14</sup>C, butyliden-2, 4-<sup>14</sup>C 標識オリサストロピンの水田土壌系における放射能分布および物質収支の推移

経過日数	μg (%TAR)					物質収支
	水相	土壌			CO <sub>2</sub>	
		ERR	RRR I	総計		
0	142.1 (94.7)	15.5 (10.3)	0.1 (0.1)	15.6 (10.4)	n. d. (n. d.)	157.7 (105.1)
3	78.0 (52.0)	69.9 (46.6)	1.3 (0.9)	71.2 (47.5)	n. d. (n. d.)	149.2 (99.5)
7	64.1 (42.7)	78.5 (52.3)	2.4 (1.6)	80.9 (53.9)	0.1 (0.1)	145.1 (96.7)
14	51.6 (34.4)	90.5 (60.3)	3.5 (2.3)	94.0 (62.6)	0.2 (0.1)	145.8 (97.1)
30	29.8 (19.9)	105.6 (70.4)	5.0 (3.3)	110.6 (73.7)	0.9 (0.6)	141.3 (94.2)
59	25.5 (17.0)	106.0 (70.7)	8.9 (5.9)	114.9 (76.6)	3.2 (2.1)	143.6 (95.7)
90	21.5 (14.3)	99.6 (66.4)	12.1 (8.1)	111.7 (74.5)	5.7 (3.8)	138.9 (92.6)
120	25.3 (16.9)	95.2 (63.5)	13.6 (9.1)	108.8 (72.6)	8.6 (5.7)	142.7 (95.2)
182	21.9 (14.6)	93.2 (62.2)	17.3 (11.5)	110.5 (73.7)	11.7 (7.8)	144.1 (96.1)
182 (滅菌土壌)	25.4 (16.9)	117.0 (78.0)	4.4 (2.9)	121.4 (80.9)	n. d. (n. d.)	146.8 (97.9)

TAR : 総処理放射能 (100% = 150 μg/100 g 乾土/容器)。ERR : 抽出可能放射能。

RRR-I : 抽出不能放射能。

(2) 残留放射性の特徴付け

抽出液を HPLC で分析した。結果を表 3~4 に示す。

水相中放射能の大部分は未変化の親化合物であった。放射能は経時的に水相から土壌に移行し、水相中のオリサストロピン濃度は試験開始時の 79.3/85.4%TAR (フェニル/側鎖標識体) から試験終了時 (182 日後) には 10.1/10.9%TAR (フェニル/側鎖標識体) に減少した。

土壌中放射能の大部分も未変化の親化合物であり、試験開始時の 6.3/8.9%TAR (フェニル/側鎖標識体) から 30 日後に最高値の 58.8/58.2%TAR (フェニル/側鎖標識体) に達した。その後緩やかに減少し、182 日後で 53.7/47.4%TAR (フェニル/側鎖標識体) となった。

その他に多数のピークが認められ、合計で最高 6.1%TAR となったが、個々のピークで 2.5%TAR を越えるものはなかった。

(申請者注) :

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

表3 フェニル環標識オリサストロビン処理後の残留放射性の特徴付け

経過日数	%TAR					
	計	オリサストロビン	異性体 1	異性体 2	異性体 3	その他*
水						
0	87.3	79.3	0.5	4.3	3.3	0.0
3	54.5	49.4	0.0	2.3	2.6	0.2
7	33.6	30.7	0.3	1.3	1.1	0.1
14	25.4	23.1	0.2	1.0	0.9	0.1
30	16.6	13.6	0.1	0.7	0.5	1.7
59	15.1	11.3	0.1	0.5	0.5	2.7
90	14.0	10.6	0.1	0.4	0.3	2.6
120	15.0	11.3	0.1	0.5	0.4	2.7
182	12.3	10.1	0.1	0.5	0.3	1.3
182 滅菌土壌	18.5	16.7	0.1	0.7	0.6	0.4
土壌(抽出物)						
0	7.0	6.3	0.0	0.4	0.3	0.1
3	42.8	37.4	0.3	2.0	2.5	0.5
7	60.3	52.2	0.6	3.3	3.2	1.0
14	65.5	56.0	0.9	3.4	4.5	0.7
30	71.5	58.8	0.8	3.3	6.5	2.0
59	67.7	54.5	0.5	3.3	4.3	5.2
90	67.8	54.9	0.5	3.1	2.2	7.1
120	65.5	49.1	0.5	2.6	6.9	6.3
182	66.9	53.7	0.5	2.9	3.1	6.8
182 滅菌試料	70.4	59.9	0.6	3.8	4.3	1.8

TAR : 総処理放射能(100%=150  $\mu$ g/100 g 乾土/容器)。

\* 16 ピークの合計(個々のピーク  $\leq$  2.5%TAR)。

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

表4 1-methyl-<sup>14</sup>C, butyliden-2,4 標識オリサストロビン処理後の残留放射性の特徴付け

経過日数	%TAR					
	計	オリサストロビン	異性体 1	異性体 2	異性体 3	その他*
水						
0	94.7	85.4	1.3	3.8	2.7	1.5
3	52.0	46.0	0.7	1.9	2.7	0.8
7	42.7	39.2	0.3	1.8	1.2	0.2
14	34.4	31.9	0.3	1.4	0.7	0.0
30	19.9	15.5	0.3	0.6	0.5	2.8
59	17.0	13.7	0.2	0.4	0.4	2.2
90	14.3	10.7	0.1	0.3	0.2	3.1
120	16.9	12.3	0.1	0.5	0.3	3.7
182	14.6	10.9	0.1	0.3	0.3	3.0
182 滅菌土壌	16.9	15.3	0.2	0.5	0.4	0.6
土壌(抽出物)						
0	10.1	8.9	0.2	0.4	0.4	0.2
3	45.2	39.9	0.4	2.1	1.9	0.9
7	50.8	45.7	0.5	2.5	2.2	0.0
14	59.0	52.1	0.8	2.7	3.1	0.3
30	68.3	58.2	1.1	3.2	3.8	2.0
59	68.3	55.9	0.7	2.1	4.3	5.3
90	63.9	49.3	0.8	2.5	5.2	6.1
120	60.9	47.0	0.6	2.4	3.6	7.2
182	59.3	47.4	0.6	2.0	1.9	7.3
182 滅菌土壌	76.3	66.5	0.8	3.3	3.3	2.4

TAR : 総処理放射能(100%=150 μg/100g 乾土/容器)。

\* 18 ピークの合計(個々のピーク ≤ 2.1%TAR)。

表5 結合残留放射能の特徴づけ

土壌	%TAR							
	RRR I	NaOH	H <sub>2</sub> O 洗液	フマル酸			フミン酸	RRR II (ヒウミン)
				計				
フェニル環標識 120 日後	12.7	5.5	0.2	4.5	2.7	2.1	0.9	5.8
側鎖標識 182 日後	11.5	4.8	0.1	3.7	2.4	1.2	0.8	4.7
フェニル環標識 182 日後	10.5	5.0	0.1	3.9	2.3	1.5	0.9	4.7

RRR I : 溶媒抽出後の土壌残渣。NaOH : RRR I の NaOH 抽出液。

H<sub>2</sub>O : RRR I の H<sub>2</sub>O 抽出液。RRR II : NaOH 抽出後の土壌残渣。

: フマル酸画分の液々分配後の画分。TAR : 総処理放射能

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

結合残留物は最大約 12~13%TAR であり(表 1, 2), その約半量が 0.5 M NaOH で抽出でき, さらにフルボ酸画分(4~5%TAR)とフミン酸画分(1%TAR 未満)に分画された。NaOH 抽出不能放射能(ヒュウミン)は 5~6%TAR であった(表 5)。

### (3) 滅菌土壌の結果

滅菌試験での水相と土壌間の放射能分布は非滅菌試験と同じであった。処理放射能は水から土壌に移行し, 大部分の放射能(73~78%TAR)は溶媒で抽出できた。結合残留物は非滅菌土壌よりも有意に低かった(最大 3%TAR)。水及び土壌抽出物中の全放射能は未変化の親化合物であった。

### (4) 代謝

全試料において検出された放射能の主要化合物は未変化の親化合物であった。HPLC 分析で多くの化合物が検出されたが, 何れも 2.5%TAR 未満であり, 多くは 0.1~1.0%TAR であった。

### (5) 分解速度

オリサストロピンの水中及び土壌中における分解速度(消失速度)を下表及び図 2 に示す。水相および土壌中の BAS 520 F の消失は擬似一次反応式を適用できず, 図から求めた。

試料	DT <sub>50</sub> (日)
水	6
土壌	318

申請者注) 計算の結果、水+土壌としての半減期は 313 日であった。

図 2 オリサストロピンの水中及び土壌中における減衰曲線

[結 論] <sup>14</sup>C-オリサストロピンの分布及び分解を水田土壌系で試験した。

オリサストロピンは極めて速く水相から土壌に移行した。182 後の水中には約 11%TAR のオリサストロピンが検出された。DT<sub>50</sub> は水中で 6 日および土壌中で 318 日であった。水相中あるいは土壌中には有意な量の代謝物は検出されなかった。CO<sub>2</sub> の生成は 182 日間で 3~8%TAR 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 BASF アグロ株式会社にある。

3-2 オリサストロビンの好氣的湛水及び好気土壌中運命試験

(資料 M-5)

試験機関：(財) 残留農薬研究所

[GLP 対応]

報告書作成年：2002 年

[目的]：日本の水田圃場由来の土壌における運命試験を実施した。

供試標識化合物：オリサストロビン(BAS 520 F と略す)のフェニル環または 1-methyl 基及び butylidene 基を  $^{14}\text{C}$  標識した標識化合物を使用した。

下記に被験物質について要約する。

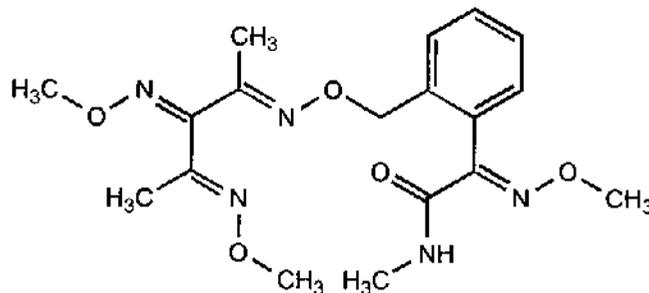
化学名：(2E)-2-(methoxyimino)-2-[2-[(3E, 5E, 6E)-5-(methoxyimino)-4, 6-dimethyl-2, 8-dioxo-3, 7-diazanona-3, 6-dien-1-yl]phenyl]-N-methylacetamide

分子式： $\text{C}_{18}\text{H}_{25}\text{N}_5\text{O}_5$

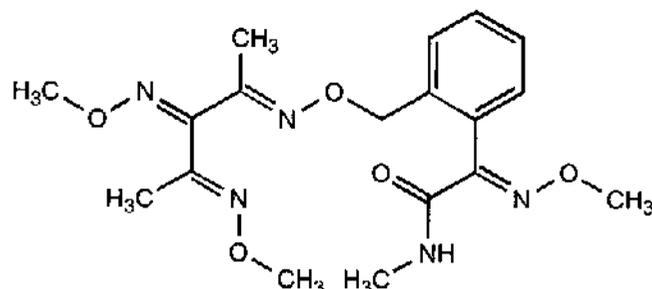
分子量：391.4

標識体識別 (略称)	Phenyl 環 U 標識 ([P- $^{14}\text{C}$ ]BAS 520 F)	1-methyl- $^{14}\text{C}$ , butylidene-2, 4- $^{14}\text{C}$ ([S- $^{14}\text{C}$ ]BAS 520 F)
標識体	$^{14}\text{C}$	$^{14}\text{C}$
比放射能 [MBq/mg]		
放射化学的純度		

化学構造： \* : phenyl-U- $^{14}\text{C}$  標識部位



# : 1-methyl- $^{14}\text{C}$ , butylidene-2, 4- $^{14}\text{C}$   $^{14}\text{C}$  標識部位



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

標識位置の設定理由：

供試土壌： 軽埴土， LiC (熊谷， 埼玉県農業試験場水田圃場， 日本)

インキュベーション環境：

1) 湛水条件試験区

土壌容器：200 mL 容ガラス瓶(直径 5 cm)

土壌量：生土 84.9 g (=70 g 乾土重)/容器

容器の調製：生土及び水 50 mL を入れ，水層は土壌表面から上 1 cm に調整し，予備平衡化した。  
土壌層は約 4 cm であった。

装置調整：通気システム付きの代謝装置(インキュベーター)でインキュベートし，揮発性物質採取装置を容器に連結して CO<sub>2</sub> 除去湿潤空気を通気し，揮発性物質を 84 日間採取した。

予備平衡化は土壌インキュベーターで行った。

期 間：予備平衡化期間 14~16 日

インキュベート期間；84 日

温 度：予備平衡化期間；25°C，暗所

インキュベート期間；25±2°C，暗所

2) 好気条件試験区

土壌容器：250 mL 容ガラス瓶(直径 6 cm)

土 壌 量：生土 60.6 g (=50 g 乾土重)/容器

容器の調製：生土を入れ，水分含量を試験土壌の最大容水量の 40% に調整し，予備平衡化した。  
土壌層は約 2.3 cm であった。

装置調整：湛水条件と同じ。

期 間：湛水条件と同じ。

温 度：湛水条件と同じ。

方法：

1) 散布液

各標識体の調製原液を下表にまとめる。

化合物	溶 媒	放射化学的濃度/化学的濃度
[P- <sup>14</sup> C]BAS 520 F 標識体		0.611 MBq (16.51 μCi)/mL
[S- <sup>14</sup> C]BAS 520 F 標識体		0.725 MBq (19.59 μCi)/mL
非標識体 BAS 520 F( )		1.0 mg/mL

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

散布液の調製： $[^{14}\text{C}]$  標識被験物質原液と非標識被験物質原液を混合し、を留去後、に溶解して名目濃度 1500 mg/L 濃度の散布液を調製した。  
下表に各標識体調製散布液分析結果をまとめる。

標識体	実測濃度 (mg/L)	比放射能 (dpm/ $\mu\text{g}$ )	放射化学的純度 (%)
$[\text{P-}^{14}\text{C}]$ BAS 520 F	1485.5		
$[\text{S-}^{14}\text{C}]$ BAS 520 F	1491.7		

## 2) 処理

処理回数：1回

処理濃度：名目被験物質濃度 1.5 mg/kg 乾土

使用量設定根拠：慣行圃場使用量 1500 g a. i. /ha に基づいた。

処理方法：湛水条件土壌：散布液 70  $\mu\text{L}$  を水相に添加、直ちに土壌相と水相を軽く混和し、両相に被験物質が接触するようにした。

好気条件土壌：散布液 50  $\mu\text{L}$  を土壌表面に添加後、土壌を軽く混和した。

## 3) 試料採取

### ① $[\text{P-}^{14}\text{C}]$ BAS 520 F 標識体試験区

採取時点：処理後 0, 28 及び 84 日

採取試料数：2 容器/時点

### ② $[\text{S-}^{14}\text{C}]$ BAS 520 F 標識体試験区

採取時点：湛水土壌試験区：処理後 75 日

好気土壌試験区：処理後 84 日

採取試料数：2 容器/時点

### ③ 揮発性物質捕集剤

採取時点：処理後 28, 75, 84 日

## 4) 試料の保存

各試料は採取後直ちに水と土壌を分離後、水は固相カラムで精製濃縮し、土壌は溶媒抽出した。抽出物は冷凍庫に保存した。

## 分析方法：

### (1) 水試料

土壌と分離後 LSC で放射能を測定し、その後固相カラムにかけ溶出した。

溶出液は HPLC 分析した。

### (2) 土壌試料

で抽出し、抽出液と残渣に分けた。

抽出液は LSC で放射能を測定後 (抽出可能放射能)、濃縮し、HPLC で分析した。

抽出残渣は室温で乾燥後、燃焼処理、LSC で放射能を測定した (抽出不能放射能)。

湛水条件下の 0 日試料については

抽出液を混合後、濃縮

し、HPLC 分析に供した。

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

(3) 揮発性物質捕集試料

ポリウレタンフォームは抽出し、放射能を測定したが検出限界未満であった。NaOH 捕集液のみを揮発性物質捕集試料とし、直接 LSC で放射能を測定した。

分析法のスキームを図 1 と 2 に示す。

図 1 湛水土壤試験区試料分析操作スキーム

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

## 図 2 土壌試料分析操作スキーム

### (4) 代謝物の同定

土壌抽出物及び田面水の溶出物を濃縮し、HPLC 分析した。参照標品との HPLC 保持時間の比較により放射性化合物の同定をした。さらに、分取した HPLC 画分を参照標品との TLC コクロマトグラフィーに供し、同定・確認した。

### (5) 半減期の算定法：

下記の一次反応式を使用した。

$$-dC/dt = kC$$

または

$$\ln (C/C_0) = -kt$$

C=各時点における被験物質の濃度

C<sub>0</sub>=被験物質の初期濃度

K=速度定数

従って 半減期  $T_{1/2} = 0.693/k$

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

[P-<sup>14</sup>C] BAS 520 F 標識体試験区の結果

1. 湛水土壌試験系

(1) 残留放射能の分布

[P-<sup>14</sup>C]BAS 520 F 標識体を湛水土壌試験系に処理後の放射能分布および物質収支の結果を表 1 に示す。

物質収支は処理放射能 (AR) の 100~101%であった。抽出放射能は徐々に減少し、84 日後に 72.3%AR であった。一方、田面水及び抽出残渣中の放射能は増加して 84 日後でそれぞれ 16.9% AR と 11.5%AR であった。また <sup>14</sup>CO<sub>2</sub> は痕跡程度であった (0.5%AR, 84 日後)。

表 1 [P-<sup>14</sup>C] 520 F 処理後の水田土壌における放射能分布及び物質収支

画 分	試料採取時		
	0 日	28 日	84 日
田面水	5.19 (0.0771)	% of AR 13.17 (0.1956)	16.87 (0.2505)
抽出物	95.28 (1.4146)	78.91 (1.1715)	72.25 (1.0726)
抽出残渣	0.99 (0.0147)	7.63 (0.1132)	11.47 (0.1703)
揮発性物質- <sup>14</sup> C	—	0.26	0.49
総 <sup>14</sup> C-回収率	101.46	99.97	101.09

分析の結果は 2 点の平均

( )内の値は mg/L.

AR : 処理放射能

(2) 田面水中放射能の固相カラムからの回収

田面水を固相カラムにより精製・分画した結果を表 2 に示す。

固相カラムに供した放射能は 99.8%以上回収された。

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

表 2 [P-<sup>14</sup>C]BAS 520 処理後の田面水試料の固相カラムからの回収

区分	試料採取時点		
	0 日	28 日	84 日
	% of AR		
水中の初期 <sup>14</sup> C	5.19 (100.00)	13.17 (100.00)	16.87 (100.00)
水流出液	0.01 (0.29)	0.10 (0.74)	0.15 (0.88)
溶出液	5.18 (99.76)	13.82 (104.93)	17.24 (102.18)
総回収率	5.20 (100.04)	13.92 (105.67)	17.39 (103.06)

分析結果は 2 点の平均値。  
 () の値は初期値に対する回収%。  
 AR: 処理放射能

(3) 残留放射性の同定/特徴付け

田面水の 溶出液及び土壌の 抽出液を HPLC で調査した結果を表 3 に示す。

田面水及び土壌中放射能のパターンは類似しており、両試料中での主要放射能は未変化の親化合物であった。系全体における BAS 520 F は 経時的に緩やかに減少し (0 日 ; 99.4%AR, 84 日 ; 80.7%AR), その半減期は 294 日であった。他の同定放射性化合物は F011 (358104) と F032 (4091091) であった (84 日 ; 0.92%AR)。F011 と F032 は [P-<sup>14</sup>C]BAS 520 F 標識体に特有の放射性化合物であった。

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

表 3 [<sup>14</sup>C]BAS 520 F 処理後の田面水及び土壌抽出物の HPLC 分析結果

画分/識別	採取時点						
	0 日	28 日			84 日		
		FW	EXT	Total	FW	EXT	Total
		% of AR					
1	< 0.78 < (0.0117)	< 0.15 < (0.0023)	< 0.69 < (0.0103)	< 0.89 < (0.0103)	< 0.12 < (0.0017)	< 0.49 < (0.0073)	< 0.49 < (0.0073)
2 (358104 + 4091091)	< 0.16 < (0.0023)	0.06 (0.0009)	< 0.16 < (0.0023)	0.06 (0.0009)	0.26 (0.0038)	0.66 (0.0098)	0.92 (0.0136)
3	< 0.18 < (0.0027)	0.06 (0.0008)	< 0.16 < (0.0024)	0.06 (0.0008)	0.08 (0.0012)	0.27 (0.0040)	0.35 (0.0052)
4	< 0.45 < (0.0067)	< 0.09 < (0.0013)	< 0.40 < (0.0059)	< 0.40 < (0.0059)	0.09 (0.0014)	< 0.29 < (0.0043)	0.09 (0.0014)
5	< 0.22 < (0.0033)	0.11 (0.0016)	0.55 (0.0081)	0.65 (0.0097)	0.27 (0.0040)	0.45 (0.0067)	0.72 (0.0107)
6	< 0.34 < (0.0050)	< 0.07 < (0.0010)	0.34 (0.0050)	0.34 (0.0050)	< 0.05 < (0.0007)	0.24 (0.0035)	0.24 (0.0035)
7	< 0.34 < (0.0050)	0.17 (0.0026)	0.38 (0.0057)	0.56 (0.0083)	0.41 (0.0060)	1.16 (0.0173)	1.57 (0.0234)
8	< 0.34 < (0.0050)	0.12 (0.0018)	0.63 (0.0093)	0.75 (0.0112)	0.21 (0.0032)	0.49 (0.0073)	0.71 (0.0105)
9	< 0.34 < (0.0050)	0.15 (0.0022)	0.50 (0.0075)	0.65 (0.0097)	0.32 (0.0048)	0.99 (0.0147)	1.31 (0.0195)
10	< 0.45 < (0.0067)	< 0.09 < (0.0013)	< 0.41 < (0.0061)	< 0.41 < (0.0061)	< 0.06 < (0.0009)	0.44 (0.0066)	0.44 (0.0066)
11	< 0.22 < (0.0033)	0.12 (0.0019)	0.54 (0.0081)	0.67 (0.0099)	0.33 (0.0049)	1.17 (0.0174)	1.50 (0.0223)
12	< 0.67 < (0.0100)	0.14 (0.0020)	< 0.59 < (0.0088)	0.14 (0.0020)	< 0.10 < (0.0015)	< 0.43 < (0.0064)	< 0.43 < (0.0064)
13	< 0.67 < (0.0100)	< 0.14 < (0.0021)	< 0.56 < (0.0084)	< 0.56 < (0.0084)	< 0.08 < (0.0012)	0.36 (0.0054)	0.36 (0.0054)
14 (BAS 520 F)	99.42 (1.4769)	12.41 (0.1844)	75.65 (1.1238)	88.06 (1.3082)	14.80 (0.2199)	65.86 (0.9784)	80.67 (1.1983)
15	1.06 (0.0157)	0.15 (0.0023)	1.51 (0.0225)	1.67 (0.0248)	0.15 (0.0022)	0.79 (0.0117)	0.93 (0.0138)
16	< 0.67 < (0.0100)	< 0.13 < (0.0019)	< 0.59 < (0.0088)	< 0.59 < (0.0088)	< 0.10 < (0.0015)	< 0.43 < (0.0064)	< 0.43 < (0.0064)
Sum	100.48 (1.4926)	13.17 (0.1957)	78.91 (1.1722)	92.08 (1.3679)	16.87 (0.2507)	72.25 (1.0732)	89.12 (1.3239)

分析値は HPLC2 回測定の平均値

( ) の値は放射能濃度 (mg BAS 520 F eq./kg 乾土)

FW: 田面水の固相カラム 溶出液

EXT: 土壌の 抽出物

AR: 処理放射能

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

## 2. 好気土壌試験系

### (1) 放射能の分布及び物質収支

[P-<sup>14</sup>C]BAS 520 F 標識体を好気土壌試験系に処理した後の放射能分布および物質収支の結果を表 4 に示す。

物質収支は 104~105%AR であった。抽出放射能は僅かに減少し、84 日後に 97.6%AR であった。一方抽出残渣中の放射能は増加して 84 日後で 6.5% AR であった。また <sup>14</sup>CO<sub>2</sub> は痕跡程度であった(0.4%AR, 84 日後)。

表 4 [P-<sup>14</sup>C]BAS 520 F 処理後の好気土壌における放射能の分布及び物質収支

画分	採取時点		
	0 日	28 日	84 日
	% of AR		
抽出物	104.82 (1.5572)	98.53 (1.4639)	97.59 (1.4499)
抽出残渣	0.43 (0.0064)	4.87 (0.0723)	6.52 (0.0969)
揮発性物質- <sup>14</sup> C	—	0.16	0.35
総 <sup>14</sup> C-回収率	105.24	103.57	104.47

分析結果は 2 点の平均値

( ) の値は mg/L

AR : 処理放射能

### (2) 残留放射性の同定/特徴付け

土壌の抽出液を HPLC で調査した結果を表 5 に示す。

土壌中の主要放射能は未変化の親化合物であり、有意な代謝物は検出されなかった。

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

表 5 [P-<sup>14</sup>C]BAS 520 F 処理後の好気土壌抽出物の HPLC 分析結果

画分/識別	採取時点		
	0 日	28 日	84 日
	% of AR		
1	< 0.76 < (0.0114)	< 0.83 < (0.0123)	< 0.69 < (0.0102)
2 (358104 + 4091091)	< 0.15 < (0.0023)	< 0.17 < (0.0025)	0.29 (0.0043)
3	< 0.17 < (0.0026)	< 0.19 < (0.0028)	< 0.16 < (0.0023)
4	< 0.44 < (0.0065)	< 0.47 < (0.0070)	< 0.39 < (0.0058)
5	< 0.22 < (0.0032)	< 0.24 < (0.0035)	< 0.20 < (0.0029)
6	< 0.33 < (0.0049)	< 0.35 < (0.0053)	< 0.29 < (0.0044)
7	< 0.33 < (0.0049)	< 0.35 < (0.0053)	< 0.29 < (0.0044)
8	< 0.33 < (0.0049)	< 0.35 < (0.0053)	< 0.29 < (0.0044)
9	< 0.33 < (0.0049)	< 0.35 < (0.0053)	< 0.29 < (0.0044)
10	< 0.44 < (0.0065)	< 0.47 < (0.0070)	< 0.39 < (0.0058)
11	< 0.22 < (0.0032)	< 0.24 < (0.0035)	0.33 (0.0049)
12	< 0.65 < (0.0097)	< 0.71 < (0.0105)	< 0.59 < (0.0087)
13	< 0.65 < (0.0097)	< 0.71 < (0.0105)	< 0.45 < (0.0067)
14 (BAS 520 F)	102.95 (1.5294)	97.43 (1.4473)	95.49 (1.4185)
15	1.86 (0.0277)	1.11 (0.0164)	1.79 (0.0266)
16	< 0.65 < (0.0097)	< 0.71 < (0.0105)	< 0.59 < (0.0087)
Sum	104.82 (1.5570)	98.53 (1.4637)	97.59 (1.4496)

分析は HPLC2 回測定の平均値

( ) の値は放射能濃度 (mgBAS 520 F eq./kg 乾土)

AR : 処理放射能

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

[S-<sup>14</sup>C]BAS 520 F 標識体試験区の結果

(1) 残留放射能の分布

[S-<sup>14</sup>C]BAS 520 F 標識体を湛水土壤又は好気土壤試験系に処理後の放射能分布および物質収支の結果を表 6 に示す。

物質収支は 99%AR(湛水)及び 103%AR(好気)であった。抽出放射能は 73.0%AR(湛水)及び 96.5%AR(好気)であった。湛水条件下で、田面水及び抽出残渣中の放射能は 75 日後でそれぞれ 16.1%AR と 8.4%AR であった。好気条件の抽出残渣中放射能は 6.6%であった。これらの結果はフェニル標識体と類似していたが、<sup>14</sup>CO<sub>2</sub>はフェニル標識体での抽出量よりも側鎖標識体で若干多かった(1.7%)。

表 6 [S-<sup>14</sup>C] BAS 520 F 処理後の湛水土壤又は好気性土壤における放射能分布及び物質収支

画分	湛水土壤	好気土壤
	75 日	84 日
	% of AR	
田面水	16.07 (0.2395)	---
抽出物	72.96 (1.0877)	96.52 (1.4400)
抽出残渣	8.35 (0.1245)	6.57 (0.0980)
揮発性物質 <sup>14</sup> C	1.73	0.35
総 <sup>14</sup> C-回収率	99.11	103.45

分析結果は 2 点の平均値。

()の値は mg/L。

AR: 処理放射能

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

(2) 田面水中放射能の固相カラムからの回収

田面水を固相カラムにより精製・分画した結果を表 7 に示す。

固相カラムに供した放射能は 99.1%回収された。

表 7 [S-<sup>14</sup>C]BAS 520 F 処理後の田面水の固相カラムからの回収率

画分	75 日
	% of AR
田面水中初期 <sup>14</sup> C	16.07 (100.00)
水流出液	0.10 (0.63)
溶出液	15.92 (99.08)
総回収率	16.02 (99.71)

分析結果は 2 点の平均

() 内の値は固相カラムに供した初期値に対する%

AR: 処理放射能

(3) 残留放射性の同定/特徴付け

田面水の固相からの 溶出液及び土壌の 抽出液を HPLC で調査した結果を表 8 に示す。

田面水及び土壌中放射能のパターンは[P-<sup>14</sup>C]BAS 520 F 標識体と類似していた。両試料中での主要放射能は未変化の親化合物であった。

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

表 8 [S-14C]BAS 520 F 処理後の 湛水土壤及び好気土壤の HPLC 分析結果

画分/画別	湛水土壤			好気土壤
	75 日			84 日
	FW	EXT	Total	
	% of AR			
1	< 0.12 < (0.0018)	< 0.48 < (0.0071)	< 0.48 < (0.0071)	< 0.66 < (0.0099)
2	0.12 (0.0018)	0.20 (0.0030)	0.32 (0.0048)	0.46 (0.0068)
3	0.10 (0.0016)	0.14 (0.0021)	0.24 (0.0036)	< 0.14 < (0.0020)
4	0.12 (0.0017)	< 0.27 < (0.0041)	0.12 (0.0017)	0.45 (0.0067)
5	0.20 (0.0030)	0.43 (0.0064)	0.63 (0.0094)	0.32 (0.0048)
6	0.07 (0.0010)	0.22 (0.0033)	0.29 (0.0044)	< 0.28 < (0.0042)
7	0.37 (0.0055)	1.35 (0.0202)	1.72 (0.0257)	0.40 (0.0060)
8	0.28 (0.0042)	0.74 (0.0110)	1.01 (0.0151)	0.26 (0.0039)
9	0.30 (0.0045)	0.88 (0.0131)	1.18 (0.0176)	0.32 (0.0048)
10	< 0.07 < (0.0010)	< 0.27 < (0.0041)	< 0.27 < (0.0041)	< 0.38 < (0.0057)
11	0.20 (0.0030)	1.06 (0.0158)	1.26 (0.0188)	0.46 (0.0068)
12	0.09 (0.0014)	< 0.42 < (0.0063)	0.09 (0.0014)	0.77 (0.0115)
13	< 0.08 < (0.0011)	< 0.33 < (0.0049)	< 0.33 < (0.0049)	0.76 (0.0114)
14 (BAS 520 F)	14.11 (0.2105)	67.10 (1.0010)	81.21 (1.2115)	91.29 (1.3617)
15	0.20 (0.0030)	0.82 (0.0123)	1.02 (0.0153)	1.78 (0.0265)
16	< 0.10 < (0.0016)	0.45 (0.0067)	0.45 (0.0067)	0.73 (0.0109)
Sum	16.07 (0.2397)	72.96 (1.0883)	89.03 (1.3280)	96.52 (1.4399)

分析値は HPLC2 回測定 averages

() の値は放射能濃度 (ng BAS 520 F eq. /kg 乾土)

FW: 田面水の固相カラム 溶出液

EXT: 土壤の 抽出物

AR: 処理放射能

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

#### [代謝物の同定結果]

土壤抽出物又は田面水の固相カラムからの 溶出液中で下記の 3 化合物が同定された。各化合物は非標識標準品との HPLC 保持時間の比較及び TLC コクロマトグラフィーにより同定した。F011 及び F032 は [P-<sup>14</sup>C]BAS 520 F 試験区で検出された。

同定化合物 : BAS 520 F, F011, F032

図 3 に 湛水土壤中の BAS 520 F の推定代謝経路を示す。

#### [分解速度]

BAS 520 F の [P-<sup>14</sup>C]BAS 520 F 処理後の湛水土壤試験系における半減期は 294 日であった。

試料	DT <sub>50</sub> (日)
水+土壤	294

#### [結 論]

全試料中の主要放射性化合物は BAS 520 F であった。

湛水土壤中の <sup>14</sup>C-BAS 520 F は緩やかに減少する。これは BAS 520 F が土壤有機物へ移行及びまたは取り込まれる為である。

BAS 520 F の代謝物として F011 及び F032 が同定された (1%AR 未満)。両代謝物ともその後徐々に無機化された。無機化率は側鎖標識体で若干速かった。

好気土壤中での <sup>14</sup>C-BAS 520 F の分解は湛水土壤中経路と類似していたがその速度は湛水土壤条件下よりもはるかに遅かった。

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

図3 オリサストロピンの土壌中における推定代謝経路

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

#### 4. 水中運命に関する試験

##### 4-1 オリサストロピンの加水分解運命試験

(資料 M-7)

試験機関：(財)残留農薬研究所

[GLP 対応]

報告書作成年：2002 年

供試標識化合物：オリサストロピン(以降 BAS 520 F と略す)のフェニル環を均一に<sup>14</sup>C 標識した標識化合物を使用した。

化学名：(2E)-2-(methoxyimino)-2-[2-[(3E, 5E, 6E)-5-(methoxyimino)-4, 6-dimethyl-2, 8-dioxa-3, 7-diazanona-3, 6-dien-1-yl]phenyl]-N-methylacetamide

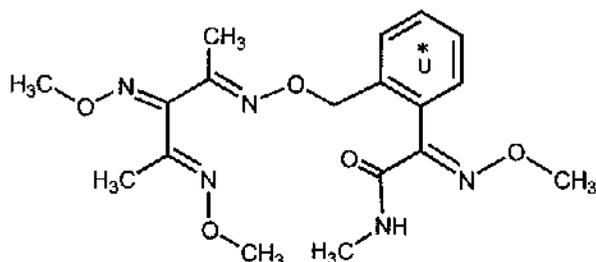
分子式：C<sub>18</sub>H<sub>25</sub>N<sub>5</sub>O<sub>5</sub>

分子量：391.4

比放射能：

放射化学的純度：

化学構造：\*：フェニル環均一<sup>14</sup>C 標識部位



標識位置の設定理由：

緩衝液：pH 4, 5, 7 および 9 の緩衝液は下記のように調製し、窒素ガスを吹き付けて溶存酸素を除去した後、ろ過滅菌した。

pH	調製方法
4.0	(0.1M 水酸化ナトリウム 18 mL + 0.1M ケン酸一加水 100 mL)/1000 mL 水
5.0	(0.2M 氷酢酸 14.5 mL + 0.2M 酢酸ナトリウム 35.5 mL)/1000 mL 水
7.0	(0.1M 水酸化ナトリウム 59.3 mL + 0.1M リン酸一加水 100 mL)/1000 mL 水
9.0	(0.1M 水酸化ナトリウム 42.6 mL + 0.1M 塩化ナトリウム/酢酸 100 mL)/1000 mL 水

試験溶液の調製： [<sup>14</sup>C] 標識被験物質と非標識被験物質

を混合後、溶

媒を留去し、 に再溶解して、以下の名目濃度の溶液を調製した。

名目濃度：500 mg/L (実測濃度； )

比放射能；

この溶液を緩衝液で希釈して、水溶解度 (80.6 mg/L, 20°C) の 1/2 以下である 5 mg/L の試験溶液 (溶媒濃度約 1%) 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 BASF アグロ株式会社にある。

インキュベーションの条件:

試験温度: 25±1°C  
装置: 振とう恒温水槽  
光条件: アルミホイルで被覆して遮光  
試料採取時点: 処理直後(0日), 処理後1, 3, 7, 14, 21 および30日  
反復数: 2

分析方法:

1) 試験系の滅菌維持の確認

各採取時点で微生物平板培養法により確認した。対照試料には非滅菌緩衝液を用いた。

2) 総放射能及び放射性成分の同定/特徴づけ

試料を直接 LSC で放射能を測定および HPLC で分析した。

3) 試験水の pH 確認

添加直後と 30 日後の採取試料で確認。

半減期の算定法: 下記の一次反応式を使用した。

$$\ln(C/C_0) = -k \cdot t$$

または

$$\ln(C) = -k \cdot t + \ln(C_0)$$

C=各時点における被験物質の濃度

C<sub>0</sub>=被験物質の初期濃度

K=速度定数; ln(C)と時間との直線回帰式の傾き

[結果]

1) 試験溶液の pH

各試験溶液の pH は各設定値の±0.1であった。

2) 滅菌維持の確認

各試験溶液は有意な微生物汚染は認められなかった。

3) 物質収支の推移

各採取時点における物質収支の結果を表 1 に示す。

物質収支は各試験溶液で 96.7~101.1% AR であり、放射能の消失はなかった。

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

表 1. [<sup>14</sup>C]BAS 520 F の 25°C における 試験溶液 (pH 4, 5, 7 及び 9) 中の物質収支の推移

pH	初期濃度 (mg/L)	反応期間 (日)						
		0	1	3	7	14	21	30
		%AR* (mg/L)						
4	4.76	100.0 (4.76)	102.0 (4.86)	98.6 (4.69)	98.9 (4.71)	98.1 (4.67)	98.0 (4.66)	98.9 (4.71)
5	4.71	100.0 (4.71)	101.6 (4.79)	99.8 (4.70)	100.9 (4.75)	101.3 (4.77)	100.3 (4.72)	99.8 (4.70)
7	4.70	100.0 (4.70)	102.3 (4.81)	99.3 (4.67)	100.3 (4.71)	101.1 (4.75)	100.9 (4.74)	100.1 (4.70)
9	4.81	100.0 (4.81)	99.3 (4.78)	96.7 (4.65)	98.5 (4.74)	98.9 (4.76)	99.8 (4.80)	97.3 (4.68)

分析結果は 2 点分析の平均値、\*：初期濃度 (処理放射能, AR) に対するパーセント

#### 4) 放射性成分の同定/特徴付け及び代謝

各試験溶液を HPLC で分析した結果を表 2 に示す。

放射性成分の同定/特徴付けはオリサストロビン標準品との HPLC 保持時間の比較で確認した。

各試験溶液中に検出された主要放射能はオリサストロビンのみであり、最終採取時点におけるオリサストロビンは 95.7~98.0% AR 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 BASF アグロ株式会社にある。

表 2 各試験溶液の HPLC 分析結果

HPLC ピーク	反応期間 (日)						
	0	1	3	7	14	21	30
	%AR* (mg/L)						
pH 4 試験溶液							
リサトピ <sup>®</sup>	96.9 (4.61)	101.1 (4.81)	96.4 (4.59)	96.7 (4.60)	95.4 (4.54)	95.7 (4.56)	96.4 (4.59)
その他 #	3.1 (0.15)	0.9 (0.04)	2.2 (0.10)	2.2 (0.10)	2.7 (0.13)	2.2 (0.10)	2.5 (0.12)
計 (総 <sup>14</sup> C)	100.0 (4.76)	102.0 (4.86)	98.6 (4.69)	98.9 (4.71)	98.1 (4.67)	98.0 (4.66)	98.9 (4.71)
pH 5 試験溶液							
リサトピ <sup>®</sup>	97.8 (4.61)	99.7 (4.70)	97.3 (4.58)	99.6 (4.69)	99.4 (4.68)	98.8 (4.65)	98.0 (4.62)
その他 #	2.2 (1.90)	1.9 (0.09)	2.5 (0.12)	1.3 (0.06)	1.9 (0.09)	1.6 (0.08)	1.8 (0.08)
計 (総 <sup>14</sup> C)	100.0 (4.71)	101.6 (4.79)	99.8 (4.70)	100.9 (4.75)	101.3 (4.77)	100.3 (4.72)	99.8 (4.70)
pH 7 試験溶液							
リサトピ <sup>®</sup>	98.1 (4.61)	99.8 (4.69)	94.8 (4.46)	99.3 (4.67)	98.2 (4.62)	99.0 (4.65)	96.8 (4.55)
その他 #	1.9 (0.09)	2.6 (0.12)	4.5 (0.21)	1.0 (0.05)	2.8 (0.13)	1.9 (0.09)	3.3 (0.16)
計 (総 <sup>14</sup> C)	100.0 (4.70)	102.3 (4.81)	99.3 (4.67)	100.3 (4.71)	101.1 (4.75)	100.9 (4.74)	100.1 (4.70)
pH 9 試験溶液							
リサトピ <sup>®</sup>	98.2 (4.72)	97.7 (4.70)	95.2 (4.58)	97.0 (4.67)	95.2 (4.58)	97.9 (4.71)	95.7 (4.60)
その他 #	1.8 (0.09)	1.6 (0.08)	1.5 (0.07)	1.5 (0.07)	3.7 (0.18)	1.9 (0.09)	1.6 (0.08)
計 (総 <sup>14</sup> C)	100.0 (4.81)	99.3 (4.78)	96.7 (4.65)	98.5 (4.74)	98.9 (4.76)	99.8 (4.80)	97.3 (4.68)

分析結果は 2 点分析の平均値、#: HPLC 未同定ピークの合計、\*: 初期濃度 (処理放射能, AR) に対するパーセント。

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

5) 推定半減期

試験温度	pH	DT <sub>50</sub> (days)	DT <sub>90</sub> (days)
25°C	4	829	2752
	5	13541	44981
	7	5635	18720
	9	1880	6245

【結 論】

25°Cにおける pH4, 5, 7 及び 9 の滅菌緩衝液中における [<sup>14</sup>C]-オリサストロピンの加水分解運命を名目濃度 5 mg/L で実施した。

試験期間中のオリサストロピンの消失は僅かであり、試験 30 日後に 95% AR 以上のオリサストロピンが回収された。分解生成物は未同定の HPLC ピークの合計として最大 4.5% AR が検出されたのみであった。

25°Cにおける pH4, 5, 7 及び 9 の滅菌緩衝液中でのオリサストロピンの推定半減期は 1 年以上であり、加水分解的に安定である。

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

4-2 オリサストロピンの水中光分解運命試験

(資料 M-8)

試験機関: (財) 残留農薬研究所

[GLP 対応]

報告書作成年: 2002 年

供試標識化合物: オリサストロピン (BAS 520 F と略す) のフェニル環を均一に  $^{14}\text{C}$  標識した標識化合物を使用した。

化学名: (2E)-2-(methoxyimino)-2-[2-[(3E, 5E, 6E)-5-(methoxyimino)-4, 6-dimethyl-2, 8-dioxa-3, 7-diazanona-3, 6-dien-1-yl]phenyl]-N-methylacetamide

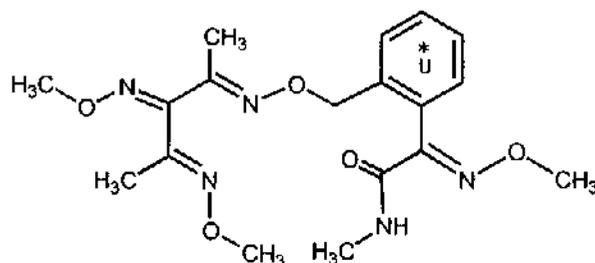
分子式:  $\text{C}_{18}\text{H}_{25}\text{N}_5\text{O}_5$

分子量: 391.4

比放射能:

放射化学的純度:

化学構造: \*: フェニル環均一  $^{14}\text{C}$  標識部位



標識位置の設定理由:

供試水溶液: 緩衝液: pH 7  
 自然水: 田面水

下表に緩衝液の調製方法と田面水の特性について纏める。

試験水	調製方法/特性
pH 7.0 滅菌 緩衝液	調製方法: (0.1M 水酸化ナトリウム 59.3 mL + 0.1M リン酸一カリウム 100 mL)/1000 mL 水 pH: 6.95 電気伝導率: 153 mS/m (25°C)
滅菌 田面水	採取場所: 埼玉県農業試験場 水田圃場 採取年月日: 2001年7月31日 pH: 7.02 電気伝導率: 18.9 mS/m (25°C) 蒸発残留物: 132 mg/L 浮遊物質: < 2 mg/L 溶存酸素: 10.2 mg/L COD: 2.4 mg/L BOD: 1.4 mg/L

水は HPLC 用蒸留水を使用。田面水はガラス繊維ろ紙でろ過して使用した。両供試水ともろ過滅菌した。

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

試験溶液の調製： [<sup>14</sup>C] 標識被験物質と非標識被験物質 を混合後、溶媒を留去し、再溶解して、以下の名目濃度の溶液を調製した。

名目濃度； 500 mg/L (実測濃度； )  
比放射能；  
放射化学的純度；

この溶液を緩衝液で希釈して、水溶解度 (80.6 mg/L, 20°C) の 1/2 以下である 5 mg/L の試験溶液 (溶媒濃度約 1%) を調製した。

インキュベーションの条件：

試験温度： 25±1°C  
装置： キセノン光照射装置  
光条件： 光源： 6.5 kW のキセノンアークランプ  
照射波長範囲； 290 nm ~800 nm (フィルターでカットした)  
暗所対照区は恒温室内に静置した。  
試料採取時点： 処理直後 (0), 処理後 3, 8 及び 24 時間と 3, 7 及び 14 日  
反復数： 2

分析方法：

1) 試験系の滅菌維持の確認

各採取時点で微生物平板培養法により確認した。対照試料には非滅菌緩衝液を用いた。

2) 総放射能の測定

試料を直接 LSC で放射能を測定した。

3) 放射性成分の分離及び定量

試料を直接 HPLC/FSA で分析し、放射性成分の分離及び定量を行った。

4) 放射性成分の同定/特徴づけ

試料を参照標品との HPLC コクロマトグラフィーに供し、保持時間の比較及び HPLC で分画した画分の LC/ESI/MS, LC/MS/MS スペクトルと参照標品のスペクトルとの比較により同定した。

半減期の算定法：

1) 暗所対照区の試料： 下記の一次反応式を使用した。

$$\ln (C/C_0) = -k \cdot t$$

または

$$\ln (C) = -k \cdot t + \ln (C_0)$$

または

$$C = C_0 \cdot e^{-k \cdot t}$$

C=各時点における被験物質の濃度

C<sub>0</sub>=被験物質の初期濃度

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

K=速度定数；ln(C)と時間との直線回帰式の傾き

2) 光照射区の試料：下記の2相性一次反応式(フェザリング法)を使用した。

$$C = C_1 * e^{-k_1 * t} + C_2 * e^{-k_2 * t}$$

C=各時点における被験物質の濃度

C<sub>1</sub>=第1相の切片

K<sub>1</sub>=第1相の速度定数

C<sub>2</sub>=第2相の切片

K<sub>2</sub>=第2相の速度定数

[結果]

1) 滅菌維持の確認

各試験溶液は有意な微生物汚染は認められなかった。

2) キセノン光の強度

290-800 nm の平均光強度は 152.0 W/m<sup>2</sup> であった。従って 300-400 nm における試験期間中(14日間)の積算放射照度は 18.842 MJ/m<sup>2</sup> となる。これは 28 日間の太陽光照射(東京、春(4月~6月))に相当した。

3) 残留放射性的物質収支

各採取時点における放射能物質収支の結果を表1に示す。

物質収支は各試験溶液で 98.1 AR 以上であり、放射能の消失はなかった。

表 1. [<sup>14</sup>C]BAS 520 F の 25 °C における試験溶液中放射能の物質収支

	初期濃度 (mg/L)	反応期間						
		0 hrs	3 hrs	8 hrs	1 day	3 days	7 days	14 days
		%AR* (mg/L)						
緩衝水								
照射区	4.75	100.0 (4.75)	99.6 (4.73)	100.6 (4.78)	100.1 (4.76)	100.1 (4.75)	101.7 (4.83)	100.6 (4.78)
暗所 対照区	4.75	100.0 (4.75)	99.3 (4.72)	100.2 (4.76)	99.7 (4.74)	98.1 (4.66)	100.3 (4.76)	100.3 (4.76)
田面水								
照射区	4.77	100.0 (4.77)	98.1 (4.68)	99.7 (4.76)	99.1 (4.73)	100.8 (4.81)	101.1 (4.82)	99.2 (4.73)
暗所 対照区	4.77	100.0 (4.77)	100.5 (4.79)	100.8 (4.81)	98.5 (4.70)	99.8 (4.76)	99.5 (4.75)	99.1 (4.73)

分析結果は2点分析の平均値、\*：初期濃度(処理放射能, AR)に対するパーセント

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

4) 放射性成分の同定/特徴づけ

各試験溶液の HPLC 分析結果を表 2 に示す。

放射性成分の同定/特徴付けは参照標品との HPLC 保持時間の比較及び LC/MS (ESI/MS, MS/MS) スペクトルで確認した。下表に本試験で用いた参照標品をまとめる。

表 2-1. 緩衝液暗所対照区試料中放射性成分の HPLC 分析

HPLC ピーク No.	識別名	HPLC $t_R$ <sup>2)</sup> (min)	反応期間						
			0 hrs	3 hrs	8 hrs	1 day	3 days	7 days	14 days
			%AR <sup>1)</sup> (mg/L)						
1		4.5	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)
2		15.9	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)
3	P4 <sup>4)</sup>	17.4	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)
4	F011	23.3	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)
5	F032	26.8	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)
6		45.0	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)
7	F033	46.3	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)
8		46.8	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)
9		47.6	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)
10	オリサストロビン	49.1	98.23 (4.67)	97.60 (4.64)	98.37 (4.67)	98.05 (4.66)	96.22 (4.57)	98.25 (4.67)	98.19 (4.66)
11		50.1	1.50 (0.07)	1.51 (0.07)	1.40 (0.07)	1.32 (0.06)	1.75 (0.08)	1.88 (0.09)	1.60 (0.08)
12	F049	52.6	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)
13	F001	53.4	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	0.39 (0.02)	0.19 (0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	0.36 (0.02)
14		56.2	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)
その他 <sup>3)</sup>			0.16 (0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)
計			100.00 (4.75)	99.27 (4.72)	100.16 (4.76)	99.69 (4.74)	98.12 (4.66)	100.27 (4.76)	100.25 (4.76)

1): 分析結果は 2 点分析の平均値。初期濃度(処理放射能, AR)に対するパーセント。  
mg/L 値は BAS 520 F 相当値

2): 代表的な HPLC 保持時間

3): 未同定 HPLC ピークの合計

4): IET コード名

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

表 2-2. 田面水暗所対照区試料中放射性成分の HPLC 分析

HPLC ピーク No.	識別名	HPLC $t_R$ <sup>2)</sup> (min)	反応期間						
			0 hrs	3 hrs	8 hrs	1 day	3 days	7 days	14 days
			%AR <sup>1)</sup> (mg/L)						
1		4.5	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)
2		15.9	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)
3	P4 <sup>4)</sup>	17.4	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)
4	F011	23.3	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)
5	F032	26.8	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)
6		45.0	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)
7	F033	46.3	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)
8		46.8	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)
9		47.6	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)
10	BAS 520 F	49.1	98.29 (4.69)	98.22 (4.69)	99.24 (4.73)	96.69 (4.61)	97.89 (4.67)	97.70 (4.66)	97.58 (4.65)
11		50.1	1.43 (0.07)	1.98 (0.09)	1.42 (0.07)	1.52 (0.07)	1.42 (0.07)	1.48 (0.07)	1.35 (0.06)
12	F049	52.6	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)
13	F001	53.4	0.28 (0.01)	0.23 (0.01)	< 0.15 (<0.01)	0.17 (0.01)	0.47 (0.02)	0.36 (0.02)	< 0.15 (<0.01)
14		56.2	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)
その他 <sup>3)</sup>			< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)
Total			100.00 (4.77)	100.51 (4.79)	100.78 (4.81)	98.46 (4.70)	99.77 (4.76)	99.54 (4.75)	99.13 (4.73)

1): 分析結果は 2 点分析の平均値。初期濃度(処理放射能, AR)に対するパーセント。  
mg/L 値は BAS 520 F 相当値

2): 代表的な HPLC 保持時間

3): 未同定 HPLC ピークの合計

4): IET コード名

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

表 2-3. 緩衝液光照射区試料中放射性成分の HPLC 分析

HPLC ピーク → No.	識別名	HPLC t <sub>R</sub> <sup>2)</sup> (min)	反応期間						
			0 hrs	3 hrs	8 hrs	1 day	3 days	7 days	14 days
			%AR <sup>1)</sup> (mg/L)						
1		4.5	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	0.44 (0.02)	1.11 (0.05)	1.96 (0.09)	4.54 (0.22)
2		15.9	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	0.53 (0.03)	1.52 (0.07)	3.02 (0.14)
3	P4 <sup>4)</sup>	17.4	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	0.21 (0.01)	0.92 (0.04)	3.95 (0.19)
4	F011	23.3	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	0.25 (0.01)	1.25 (0.06)	2.83 (0.13)	5.75 (0.27)
5	F032	26.8	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	0.35 (0.02)	1.67 (0.08)	3.10 (0.15)	5.77 (0.27)
6		45.0	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	0.49 (0.02)	0.90 (0.04)	0.92 (0.04)	1.29 (0.06)	1.11 (0.05)
7	F033	46.3	< 0.15 (<0.01)	0.49 (0.02)	1.55 (0.07)	4.25 (0.20)	9.59 (0.46)	12.68 (0.60)	11.41 (0.54)
8		46.8	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	1.51 (0.07)	3.35 (0.16)	5.28 (0.25)	4.86 (0.23)	4.15 (0.20)
9		47.6	< 0.15 (<0.01)	3.38 (0.16)	5.50 (0.26)	5.57 (0.26)	4.48 (0.21)	3.97 (0.19)	3.77 (0.18)
10	BAS 520 F	49.1	98.23 (4.67)	87.56 (4.16)	71.26 (3.38)	51.97 (2.47)	33.62 (1.60)	26.01 (1.24)	18.20 (0.86)
11		50.1	1.50 (0.07)	3.08 (0.15)	4.09 (0.19)	4.72 (0.22)	2.87 (0.14)	2.44 (0.12)	1.96 (0.09)
12	F049	52.6	< 0.15 (<0.01)	0.33 (0.02)	1.81 (0.09)	4.98 (0.24)	9.17 (0.44)	12.41 (0.59)	11.39 (0.54)
13	F001	53.4	< 0.15 (<0.01)	4.64 (0.22)	13.50 (0.64)	21.16 (1.01)	26.05 (1.24)	22.91 (1.09)	17.00 (0.81)
14		56.2	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	0.74 (0.04)	1.73 (0.08)	2.63 (0.12)	1.92 (0.09)	1.66 (0.08)
その他 <sup>3)</sup>			0.16 (0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	0.34 (0.02)	0.71 (0.03)	2.89 (0.14)	6.89 (0.33)
Total			100.00 (4.75)	99.57 (4.73)	100.59 (4.78)	100.14 (4.76)	100.08 (4.75)	101.72 (4.83)	100.57 (4.78)

1): 分析結果は 2 点分析の平均値。初期濃度 (処理放射能, AR) に対するパーセント。  
mg/L 値は BAS 520 F 相当値

2): 代表的な HPLC 保持時間      3): 未同定 HPLC ピークの合計      4): IET コード名

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

表 2-4. 田面水光照射区試料中放射性成分の HPLC 分析

HPLC ピーク No.	識別名	HPLC $t_r$ <sup>2)</sup> (min)	反応期間						
			0 hrs	3 hrs	8 hrs	1 day	3 days	7 days	14 days
			%AR <sup>1)</sup> (mg/L)						
1		4.5	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	0.33 (0.02)	0.68 (0.03)
2		15.9	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	0.27 (0.01)	0.61 (0.03)
3	P4 <sup>4)</sup>	17.4	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	1.61 (0.08)	4.29 (0.20)
4	F011	23.3	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	0.29 (0.01)	1.05 (0.05)	2.60 (0.12)	5.58 (0.27)
5	F032	26.8	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	0.44 (0.02)	0.91 (0.04)	1.82 (0.09)	3.34 (0.16)
6		45.0	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	0.54 (0.03)	0.69 (0.03)	1.13 (0.05)	1.13 (0.05)	0.87 (0.04)
7	F033	46.3	< 0.15 (<0.01)	0.43 (0.02)	1.42 (0.07)	3.75 (0.18)	7.97 (0.38)	10.39 (0.50)	9.24 (0.44)
8		46.8	< 0.15 (<0.01)	0.23 (0.01)	1.75 (0.08)	3.86 (0.18)	5.25 (0.25)	4.74 (0.23)	4.37 (0.21)
9		47.6	< 0.15 (<0.01)	2.92 (0.14)	5.41 (0.26)	4.86 (0.23)	4.33 (0.21)	4.15 (0.20)	3.78 (0.18)
10	BAS 520 F	48.1	98.29 (4.69)	82.59 (3.94)	64.29 (3.07)	47.42 (2.26)	35.23 (1.68)	27.14 (1.29)	21.09 (1.01)
11		50.1	1.43 (0.07)	2.67 (0.13)	3.76 (0.18)	3.91 (0.19)	3.21 (0.15)	2.55 (0.12)	2.10 (0.10)
12	F049	52.6	< 0.15 (<0.01)	0.27 (0.01)	1.64 (0.08)	3.95 (0.19)	7.99 (0.38)	10.66 (0.51)	10.00 (0.48)
13	F001	53.4	0.28 (0.01)	8.87 (0.42)	19.59 (0.93)	27.27 (1.30)	28.33 (1.35)	23.20 (1.11)	18.76 (0.89)
14		56.2	< 0.15 (<0.01)	< 0.14 (<0.01)	1.19 (0.06)	2.30 (0.11)	2.61 (0.12)	2.49 (0.12)	1.91 (0.09)
その他 <sup>3)</sup>			N.D. (N.D.)	< 0.14 (<0.01)	< 0.15 (<0.01)	0.39 (0.02)	2.58 (0.12)	8.02 (0.38)	12.64 (0.60)
Total			100.00 (4.77)	98.11 (4.68)	99.69 (4.76)	99.14 (4.73)	100.79 (4.81)	101.11 (4.82)	99.24 (4.73)

1): 分析結果は 2 点分析の平均値。初期濃度 (処理放射能, AR) に対するパーセント。  
mg/L 値は BAS 520 F 相当値

2): 代表的な HPLC 保持時間      3): 未同定 HPLC ピークの合計      4): IET コード名

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

暗所対照区：

緩衝液および田面水中の主な放射性成分は BAS 520 F であり、14 日後で 95%AR 以上の BAS 520 F が回収された。この結果より BAS 520 F は暗所条件下の水中で安定であった。

光照射区：

BAS 520 F は 1 日後で処理放射能の 47% (田面水) ~52% (緩衝液) に、14 日後には処理放射能の 18% (緩衝液) ~21% (田面水) に減少した。主要光分解生成物は F001 であり、3 日後に最大 (緩衝液：処理放射能の 26%、田面水：処理放射能の 28%) となり、その後減少した。その他に F033 及び F049 が認められ、7 日後に処理放射能の 10~13% となり、その後ほぼ一定であった。これら 4 種放射性成分はオリサストロピンの幾何学的異性体であり、これらの化合物の生成及び減衰は両試験液中で類似のパターンを示した。

他の光分解生成物として 14 日後に F011 が両試験液で処理放射能の 6%、ならびに F032 が緩衝液で 6% 及び田面水で 3% 認められた。

以上の結果から水中におけるオリサストロピンの光分解想定経路を図 1 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 BASF アグロ株式会社にある。

図 1 オリサストロピンの水中光分解想定経路

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

5) 推定半減期

オリサストロピンの減衰曲線を図 2~3 及び光分解キネティクスパラメーターを表 3 に示す。

図 2-1 pH 7 緩衝液暗所対照区試料中のオリサストロピン減衰曲線

図 2-2 田面水暗所対照区試料中のオリサストロピン減衰曲線

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

図 3-1 pH 7 緩衝液光照射区試料中のオリサストロビン減衰曲線

図 3-2 田面水光照射区試料中のオリサストロビン減衰曲線

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

表3 オリサストロピンの光分解キネティクスパラメーター

供試水	照射区				暗所対照区
	DT <sub>50</sub> (日)	DT <sub>90</sub> (日)	太陽光換算(東京, 春)		
			DT <sub>50</sub> (日)	DT <sub>90</sub> (日)	
pH 7 緩衝液	1.1	24.7	2.2	49.5	> 1
田面水	0.8	30.0	1.7	60.1	> 1

滅菌緩衝液及び滅菌田面水の照射区ではオリサストロピンは2相性を示して減衰し、第1相の分解速度は速く、第2相は緩やかであった。滅菌緩衝液及び滅菌田面水におけるオリサストロピンの半減期(DT<sub>50</sub>)はそれぞれ1.1日及び0.8日であった。これを東京における春の太陽光線に換算すると、それぞれ2.2日及び1.7日となった。

[結論]

25°Cにおける pH 7 の滅菌緩衝液及び滅菌田面水中での [<sup>14</sup>C]-オリサストロピンの光分解運命を名目濃度 5 mg/L で調査した。

試験期間中の処理放射能の消失は滅菌緩衝液及び滅菌田面水何れにおいても見られなかった。しかも滅菌緩衝液及び滅菌田面水の暗所対照区ではオリサストロピンの顕著な分解は見られなかった。

滅菌緩衝液及び滅菌田面水の照射区ではオリサストロピンは2相性を示して減衰し、第1相の分解速度は速く、第2相は緩やかであった。滅菌緩衝液及び滅菌田面水におけるオリサストロピンの半減期(DT<sub>50</sub>)はそれぞれ1.1日及び0.8日であった。これを東京における春の太陽光線に換算すると、それぞれ2.2日及び1.7日となった。

照射区における主要な光分解生成物はオリサストロピンの幾何学的異性体である F001, F033 及び F049 であり、その他に側鎖が脱離した F011 とその閉環した F032 が認められた。

以上のことから自然水環境中のオリサストロピンは光により二段階の過程を経て分解される。第一段階の光反応としてオリサストロピンは比較的短期間で幾何学的異性体の混合物の平衡状態となり、次いで側鎖部位の脱離が徐々に起き、多くの光分解生成物が生成される。

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

## 5. 土壌吸着性試験

### 5-1 オリサストロピンの土壌吸着性試験

(資料 M-6)

試験機関：(財)残留農業研究所

[GLP 対応]

報告書作成年：2002 年

供試化合物：オリサストロピン

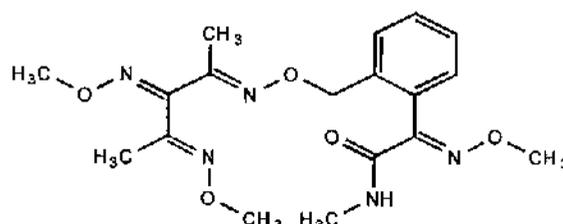
化学名：(2E)-2-(methoxyimino)-2-[2-[(3E, 5E, 6E)-5-(methoxyimino)-4, 6-dimethyl-2, 8-dioxa-3, 7-diazanona-3, 6-dien-1-yl]phenyl]-N-methylacetamide

分子式：C<sub>18</sub>H<sub>25</sub>N<sub>5</sub>O<sub>5</sub>

分子量：391.4

化学的純度：

化学構造：



供試土壌：試験土壌として Hatzenbeler 土壌, Oregon 土壌, 栃木土壌および宮崎土壌を使用した。試験土壌の特性を表 1 に示す。

表 1 試験土壌の特性

土壌識別	EFS-192	EFS-150	IET-002	JPPA-20
土壌名	Hatzenbeler	Oregon	栃木	宮崎
採取場所	Painesville, Ohio St., USA	Washington County, Oregon St., USA	栃木県鹿沼市	宮崎県宮崎郡砂土原町
土性 (USDA)	埴壤土	微砂質壤土	埴壤土	微砂質埴土
砂	32%	22%	31.0%	90.1%
シルト	36%	60%	44.5%	5.2%
粘土	32%	18%	24.5%	4.7%
有機炭素含有率	3.1%	2.2%	11.0%	0.96%
有機物含有率	5.4%	3.8%	19.0%	1.67%
窒素含有率	0.211%	0.154%	0.416%	0.09%
pH 0.01 mol/L CaCl <sub>2</sub>	7.1	5.5	4.6	4.6
土壌水分量 <sup>h)</sup> (乾土 20 g 相当重)	6.76% (21.35 g)	3.02% (20.60 g)	40.81~41.38% (28.16~28.28 g)	0.67~1.35% (20.13~20.27 g)
陽イオン交換容量 (me/100g)	18.9	13.1	16.8	6.4
リン酸吸収係数	740	910	2590	510
粘土鉱物の種類	イライト, クロライト	クロライト	アロフェン	アロフェン, ハロイサイト
OECD 土壌タイプ	2	3	4	5
土壌群	—	—	火山灰	砂丘未熟土

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

試験方法：

1) 試験条件

- 試験温度： 25°C±0.5°C  
 平衡化媒体： 0.01 mol/L CaCl<sub>2</sub> 溶液  
 試験容器： 内面テフロンコーティング処理した 200 mL 容のネジ蓋付ステンレス製遠心管  
 土壌/水比： 1:5 (10 g 乾土重/50 mL)；土壌/水比の設定試験  
 2:5 (4 g 乾土重/10 mL)；吸着平衡時間の設定試験  
 2:5 (20 g 乾土重/50 mL)；吸着等温線の作成試験  
 オリサストロピンの名目濃度：初期水相中濃度  
 5.00 mg/L；土壌/水比及び吸着平衡時間の設定試験  
 0.08, 0.20, 0.50, 2.00, 5.00 mg/L；吸着等温線の作成試験  
 溶解補助剤： 使用せず  
 光条件： 暗所条件

2) 試験土壌の調整

試験土壌は、各試験段階で第 1) 項に記載の土壌/水比になるように生土と 0.01 mol/L CaCl<sub>2</sub> 溶液(オリサストロピン添加溶液量を差し引く)を混合して調製した。これを室温または 25°C で 12 時間以上予備平衡化して、試験土壌を調整した。

3) 試験溶液の調製

オリサストロピンを 0.01 mol/L CaCl<sub>2</sub> 溶液に溶解して 50, 20, 5, 2 および 0.8 mg/L の原液を調製し、さらに、次表のように CaCl<sub>2</sub> 溶液で希釈して、各名目濃度の試験溶液を調製した。

試験溶液の 初期名目濃度	原液の理論濃度	試験系の水相の量		
		試験系に添加し た原液の量	0.01 mol/L CaCl <sub>2</sub> 溶液の量	計
0.08 mg/L	0.8 mg/L	5 mL	45 mL	50 mL
0.20 mg/L	2 mg/L	5 mL	45 mL	50 mL
0.50 mg/L	5 mg/L	5 mL	45 mL	50 mL
2.00 mg/L	20 mg/L	5 mL	45 mL	50 mL
5.00 mg/L	50 mg/L	5 mL	45 mL	50 mL
5.00 mg/L <sup>a)</sup>	50 mg/L <sup>a)</sup>	1 mL <sup>a)</sup>	9 mL <sup>a)</sup>	10 mL <sup>a)</sup>

<sup>a)</sup> 吸着平衡状態の設定試験。

4) 土壌/水比の設定試験

試験土壌： 栃木土壌, 宮崎土壌

土壌選択根拠： 有機炭素含有率の最高(栃木)と最低(宮崎)を選択

測定項目： 土壌/水比の設定, 物質収支, コントロール(土壌無添加)試料, オリサストロピンの安定性

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

試験方法：

名目濃度； 5.00 mg/L  
土 壤 量； 10 g/乾土量  
水相溶液量； 50 mL  
振とう時間； 20 時間

試験系を予備平衡化後、試験溶液を調製し、25°Cで振とうした後、上澄液及び土壌中のオリサストロピン濃度を測定した。オリサストロピンと 0.01mol/L CaCl<sub>2</sub> 溶液のみ(土壌を除く)の対照試料を同様に調整して分析した。各測定項目は以下のように評価した。

土壌/水比の決定：

水相中のオリサストロピン濃度から吸着率 (A) および吸着係数 ( $K_d$ ) を計算し、 $K_d$  値から吸着率が 20%以上となるように土壌/水比を決定した。

物質収支： 水及び土壌中のオリサストロピン濃度から評価

オリサストロピンの安定性： 物質収支および対照試料の濃度結果から予備的に評価

5) 吸着平衡時間の設定

試験土壌： Hatzenbeler 土壌, Oregon 土壌, 栃木土壌, 宮崎土壌  
測定項目： 水相中オリサストロピン濃度, 対照試料, 吸着率 ( $A_{eq}$ ),  
吸着係数 ( $K_d(eq)$ ), 有機炭素補正した吸着係数 ( $K_{oc}$ )

試験方法：

名目濃度； 5.00 mg/L  
土 壤 / 水 比； 2 : 5 (4 g 乾土重 / 10 mL)  
振とう時間； 4, 8, 16, 24, 48 時間

6) 吸着試験

試験土壌： Hatzenbeler 土壌, Oregon 土壌, 栃木土壌, 宮崎土壌  
測定項目： 水及び土壌相中オリサストロピン濃度, 物質収支, 対照試料の測定, オリサストロピンの安定性, Freundlich の吸着等温式, Freundlich の吸着係数 ( $K_f$ )  
Freundlich の定数 ( $1/n$ )

試験方法：

名目濃度； 0.08, 0.20, 0.50, 2.00, 5.00 mg/L  
土 壤 / 水 比； 2 : 5 (20 g 乾土重 / 50 mL)  
振とう時間； 48 時間

分析方法：

試料は採取後直ちに分析した。

① 水試料の分析

試料を C<sub>18</sub> ミニカラム, 次いでシリカゲルミニカラムで精製後 HPLC 分析した。

② 土壌試料の分析

試料を 抽出し, 留去後  
精製し, HPLC 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 BASF アグロ株式会社にある。

分析法のスキームを図 1 に示す。

図 1 試料の分析法スキーム

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

[結果]

1) 土壌／水比の設定試験

結果を表 1 に示す。

表 1 土壌／水比の設定試験の結果

試験土壌	初期濃度 (mg/L)	分析値 <sup>a)</sup> (mg/L)	吸着率 (A)	吸着係数 (K <sub>d</sub> )
栃木	4.5461	3.4184	25	1.65
宮崎	4.5461	3.5054	23	1.49

<sup>a)</sup> 2点分析の平均値。

この結果から、全試験において適切な土壌／水比は 2:5 (20g/50mL) とした。

2) 吸着平衡時間の設定

結果を表 2 及び図 2 に示す。

表 2 吸着平衡時間の設定試験の結果

試験土壌	初期濃度 (mg/L)	振とう時間 (h)	分析値 <sup>a)</sup> (mg/L)	変動率 <sup>b)</sup> (%)
Hatzenbeler	4.4577	4	1.75	—
		8	1.44	18
		16	1.33	8
		24	1.18	11
		48	1.03	13
Oregon	4.4577	4	2.47	—
		8	2.18	12
		16	2.01	8
		24	1.79	11
		48	1.59	11
栃木	4.4724	4	3.19	—
		8	3.13	2
		16	2.90	7
		24	2.70	7
		48	2.44	10
宮崎	4.4724	4	3.58	—
		8	3.43	4
		16	3.35	2
		24	3.22	4
		48	3.10	4

<sup>a)</sup> 2点分析の平均値。

<sup>b)</sup> 当該時点と1つ前の時点との濃度差の前時点濃度に対する割合。

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

図2 オリサストロピンの水中濃度(吸着平衡設定試験)

栃木土壌及び宮崎土壌の変動率は、全時点で10%以内であったが、Hatzenbeler 土壌及びOregon 土壌の変動率は、48時間振とう後で10%以上であった。従って吸着平衡時間は48時間と決定し、48時間での吸着パラメーターは下表に示した。

試験土壌	初期濃度 (mg/L)	吸着平衡時間 (h)	水中濃度分析値 <sup>a)</sup> (mg/L)	吸着率 (A <sub>eq</sub> , %)	吸着係数 (K <sub>d</sub> (eq))	有機炭素含有率 (%)	有機炭素吸着係数 (K <sub>oc</sub> )
Hatzenbeler	4.4577	48	1.03	77	8.32	3.1	268
Oregon	4.4577	48	1.59	64	4.51	3.2	141
栃木	4.4724	48	2.44	45	2.08	11.0	18.9
宮崎	4.4724	48	3.10	31	1.11	0.96	116

<sup>a)</sup> 2点分析の平均値。

### 3) 吸着試験

結果を表3と4及び図3に示す。Freundlichの吸着等温式の相関係数 ( $r^2$ ) は全試験土壌において0.996以上であり、オリサストロピンの吸着性はFreundlichの式で表わせる。

Freundlichの吸着係数( $K_f$ )と土壌特性との相関を調査した結果を表5に示す。有機炭素含有率と $K_f$ の相関係数は0.015であり、オリサストロピンの吸着性は、有機炭素含量の影響を受けないといえる。

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

表 3 吸着試験の結果

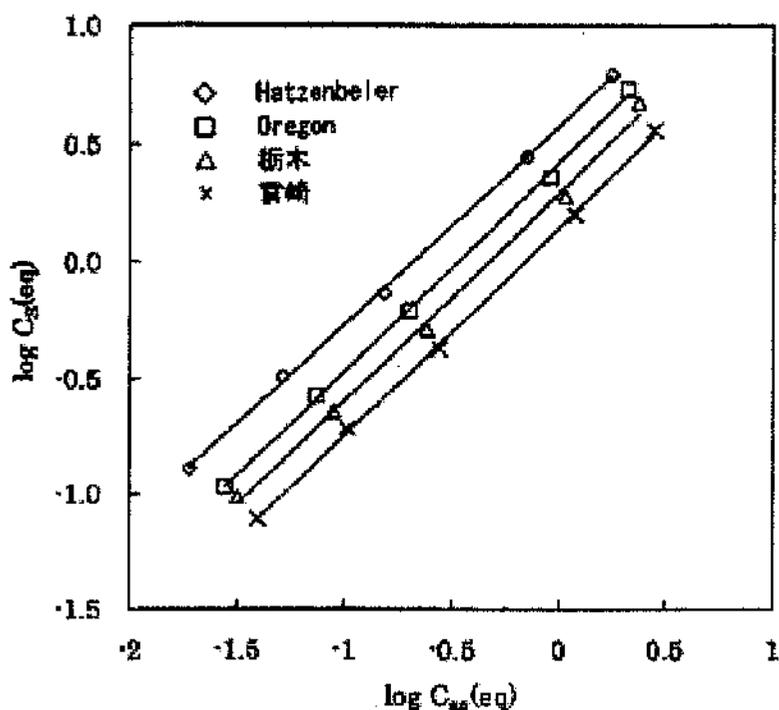
試験土壌	初期濃度 (mg/L)	水中濃度 分析値 <sup>a)</sup> (mg/L)	土壌濃度 計算値 (ppm)	Freundlich 吸着等温式 $\log C_s(\text{eq}) = \log K_f + 1/n \times \log C_{s0}(\text{eq})$
Hatzenbeler	0.0706	0.0189	0.129	$\gamma^2 = 0.999$ $1/n = 0.848$ $\log K_f = 0.58$
	0.1801	0.0514	0.322	
	0.4465	0.1527	0.735	
	1.8220	0.7023	2.799	
	4.2543	1.7663	6.220	
Oregon	0.0706	0.0279	0.107	$\gamma^2 = 0.999$ $1/n = 0.896$ $\log K_f = 0.42$
	0.1801	0.0738	0.266	
	0.4465	0.2002	0.616	
	1.8220	0.9034	2.297	
	4.2543	2.0960	5.396	
栃木	0.0706	0.0319	0.097	$\gamma^2 = 0.996$ $1/n = 0.893$ $\log K_f = 0.30$
	0.1801	0.0892	0.227	
	0.4465	0.2417	0.512	
	1.8220	1.0663	1.889	
	4.2543	2.3488	4.764	
宮崎	0.0706	0.0396	0.078	$\gamma^2 = 0.999$ $1/n = 0.894$ $\log K_f = 0.15$
	0.1801	0.1035	0.192	
	0.4465	0.2771	0.424	
	1.8220	1.1887	1.583	
	4.2543	2.7965	3.645	

<sup>a)</sup> 2点分析の平均値。

表 4 Freundlich 吸着等温式パラメーターの要約

試験土壌	1/n	$K_f$	$\gamma^2$	有機炭素 含有率 (%)	有機炭素 吸着係数 $K_{Fuc}$
Hatzenbeler	0.848	3.79	0.999	3.1	122
Oregon	0.896	2.65	0.999	2.2	120
栃木	0.893	1.97	0.996	11.0	17.9
宮崎	0.896	1.40	0.999	0.96	146

図3 Freundlich 吸着等温線



$C_s(eq)$  : 吸着平衡時の土壤に吸着された被験物質濃度 (ppm)  
 $C_{aq}(eq)$  : 吸着平衡時の水層中被験物質濃度 (mg/L)

表5 Freundlich 吸着係数と土壤特性との相関

試験土壤	$K_f$	土性			有機炭素含有率 (%)	窒素含量 (%)	pH/0.01 mol/L $CaCl_2$	陽イオン交換容量 (me/100g)	リソ酸吸収係数
		砂 (%)	シルト (%)	埴土 (%)					
Hatzenbeler	3.79	32	36	32	3.1	0.211	7.1	18.9	740
Oregon	2.65	22	60	18	2.2	0.154	5.5	13.1	910
栃木	1.97	31.0	44.5	24.5	11.0	0.416	4.6	16.8	2590
宮崎	1.40	90.1	5.2	4.70	0.96	0.09	4.6	6.4	510
	$\gamma^2 =$	0.424	0.216	0.687	0.015	0.002	0.939	0.593	0.044
	$a =$	-0.02	0.02	0.07	-0.03	0.29	0.84	0.14	0.00
	$b =$	3.39	1.70	1.00	2.57	2.39	-2.15	0.46	2.72

$Y = aX + b$ , X: 土壤パラメーター, Y: Freundlich 吸着係数 ( $K_f$ )

4) 物質収支

土壤/水比の設定試験及び吸着試験 (2.00 mg/L 初期オリサストロピン濃度) で物質収支を測定した。結果を表6と7に示す。物質収支は、97%~104%の範囲であった。この結果は、オリサストロピンが本試験における試験条件下において安定であるといえた。

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

表 6 物質収支の結果(名目濃度 5.00 mg/L; 土壌/水比の設定試験)

試験土壌	試験溶液 初期濃度 (mg/L)	水相濃度 <sup>a)</sup> (mg/L)	土壌相量 <sup>b)</sup> ( $\mu$ g)	物質収支 (%)	平均物質 収支 (%)
栃木	4.5461	3.6952	95.3	100	99
		3.6562	90.1	98	
宮崎	4.5461	3.8281	59.6	102	104
		4.0492	58.1	106	

a) 回収率(栃木=93%, 宮崎=89%)で補正した。

b) 回収率(栃木=82%, 宮崎=76%)で補正した。

表 7 物質収支の結果(名目濃度 2 mg/L; 吸着試験)

試験土壌	試験溶液 初期濃度 (mg/L)	水相濃度 <sup>a)</sup> (mg/L)	土壌相量 <sup>b)</sup> ( $\mu$ g)	物質収支 (%)	平均物質 収支 (%)
Hatzenbeler	1.8220	0.7999	61.821	103	102
		0.7782	59.769	100	
Oregon	1.8220	1.0110	51.636	102	103
		1.0190	52.935	103	
栃木	1.8220	1.1564	58.827	96	97
		1.1871	59.627	98	
宮崎	1.8220	1.2820	36.962	98	100
		1.3596	37.139	102	

a) 回収率(Hatzenbeler=89%, Oregon=89%, 栃木=91%, 宮崎=90%)で補正した。

b) 回収率(Hatzenbeler=78%, Oregon=77%, 栃木=75%, 宮崎=79%)で補正した。

#### 5) 対照試料

対照試料の分析結果を表 8 に示す。対照試料中オリサストロビンの残存率は、初期値の 92%~102% の範囲であった。この結果からオリサストロビンは試験容器表面に吸着されず、試験条件下において安定であると示唆された。

表 8 対照試料の結果

初期濃度 (mg/L)	振とう時間 (h)	分析値 <sup>a)</sup> (mg/L)	回収率 (%)
4.5461	20	4.1794	92
4.4724	4	4.47	100
4.4724	8	4.48	100
4.4724	16	4.56	102
4.4724	24	4.53	101
4.4724	48	4.42	99
0.4465	48	0.4470	100

a) 2点分析の平均値。

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

【結 論】

オリサストロピンは土壌吸着試験条件下で安定であり、その物質収率は 97%~104%であった。オリサストロピンの Hatzenbeler 土壌、Oregon 土壌、栃木土壌及び宮崎土壌における Freundlich の吸着係数 ( $K_f$ ) は 1.40~3.79、 Freundlich の定数 ( $1/n$ ) は 0.848~0.896、及び有機炭素含有率により補正した吸着係数 ( $K_{foc}$ ) は 17.9~146 であった。有機炭素含有率と Freundlich の吸着係数 ( $K_f$ ) の相関係数は 0.015 であり、オリサストロピンの吸着性は、有機炭素含量の影響を受けない。

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

### <代謝分解のまとめ>

オリサストロビンの動物、植物、土壤中、および水中における代謝・分解・残留の要約は次の通りであり、代謝分解経路を 422 頁に、結果の概要を 421 頁にそれぞれ示す。

#### 動物中代謝運命：

フェニル環と側鎖の両方を  $^{14}\text{C}$ -標識したオリサストロビンを用いて実施したラットにおける吸収・分布・排泄試験（資料 M-1）と代謝試験（資料 M-2）の結果は次のように纏められる。

25~250 mg/kg の用量で単回経口投与されたオリサストロビンは消化管からほぼ完全に吸収され、分子内の数箇所に代謝変化を受けて分子開裂体と 抱合体を含む比較的微量の極めて多数の代謝物に急速に代謝され、過半が胆汁に排泄される。全身循環系には主に代謝物の形で入って全身に分布し、蓄積されることなく比較的短時間で体外に排泄される。体外への主たる排泄経路は尿経路であり、その約半分の量が主に胆汁を介して糞にも排泄される。二酸化炭素として呼気にも微量ではあるが排泄される。胆汁排泄物は腸肝循環していると考えられる。用量に比例して吸収量も増加し、顕著な性差はないと考えられる。

#### 排泄：

25 mg/kg と 250 mg/g の 2 種用量で単回経口投与されたオリサストロビンの排泄パターンは雌雄の間で類似していた。また、高用量では排泄がやや遅れることを除いて、2 種用量間でも類似していた。雌雄と両用量のいずれにおいても投与後 168 時間までに投与量の約 60%が尿に、29~38%が糞に、約 4~6%が呼気中に二酸化炭素として排泄され、1%未満が 168 時間後の体内に残留した。排泄は急速であり、雌雄いずれにおいても 48 時間で低用量の約 90~94%、高用量の約 85~90%が排泄された。糞への排泄は主に胆汁経路であり、糞排泄量の約 2 倍量が胆汁からされた。

#### 血中濃度推移：

25, 80, 250 mg/kg の 3 用量で単回経口投与後 120 時間または 144 時間まで調査した血漿および全血中の濃度推移ならびにキネティックパラメーターは、雌雄間で類似していた。雌雄およびいずれの用量とも 2 峰性で、血漿中及び全血中濃度とも投与後 1 時間後のほかに 8 時間後または 24 時間後に第 2 のピークが認められた。吸収は速いものの、用量が高くなるに従って最高濃度到達時間 ( $T_{\text{max}}$ ) は遅延し、雌雄とも低用量では 1 時間であった血漿中濃度  $T_{\text{max}}$  が高用量では 24 時間となった。血漿中濃度の AUC は用量にほぼ正比例しており、雌雄および 25~250 mg/kg の用量範囲で吸収率に顕著な差がないこと、および吸収後の動態が雌雄とも線形となることを示していた。血漿中濃度の半減期は初期相で 8~15 時間、最終相で 32~42 時間であった。

#### 体内分布：

25 mg/kg と 250 mg/kg の 2 用量で単回経口投与後 1 時間から 168 時間までの 5 時点で体内分布を調査した。低用量群の体内分布濃度とその推移は雌雄で概ね類似していた。雌雄とも血漿中濃度最高時点である投与 1 時間後に大部分の臓器・組織中で放射能濃度は最高値を示し、経時的に低下するが、胃、腸管、肝臓、脾臓、腎臓に比較的高濃度で分布し、脳、骨、精巣中濃度が最も低かった。168 時間後の濃度は甲状腺、肝臓、副腎で高かった。高用量群の体内分布濃度とその推移も雌雄で概ね類似していた。多くの臓器・組織が投与後 40 時間で最高濃度を示したが、卵巣と子宮のほか、消化管、脂肪、脾臓は雌雄とも投与後 24 時間の方が高濃度であった。最高濃度

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

の分布は消化管を除いて、雄では甲状腺、肝臓、腎臓が最も高濃度であり、雌では甲状腺よりも卵巣、子宮、肝臓の方が高かった。全ての臓器・組織で放射能濃度は投与後 24 または 40 時間以降概ね経時的に低下した。168 時間後の濃度分布は雄では甲状腺と肝臓が、雌では肝臓が最も高く、血液中では主に赤血球に分布していた。

代謝：

単回経口投与後の尿、糞、胆汁のほか、Tmax 時点の血漿、肝臓、腎臓中の代謝物が分析された。

未変化のオリサストロピンは糞に少量（高用量群で投与量の約 2%）と血漿から痕跡程度検出されたのみであり、尿、糞、胆汁、血漿、肝臓、腎臓中の放射能の全量または大部分は極めて多数の代謝物に由来していた。投与量の 0.1%または 0.2%以上を占める 31 種類の代謝物が同定または特徴付けされた。これらは尿、糞、胆汁中の放射能のそれぞれ、28~53%、26~29%、61~75%に相当した。

吸収されたオリサストロピンは主に次の 3 つの経路で代謝された：① 脱メチル化または水酸化とそれに引き続く抱合化、② 酸化と引き続く還元、次いで開裂で生じるカルボン酸への酸化、③オキシムエーテル結合の開裂  
引き続く抱合化または N-メチル基の更なる水酸化もしくは抱合化。

糞及び胆汁中の代謝物パターンは未変化のオリサストロピンを除いて、低用量と高用量、ならびに雌雄の間で類似していた。また、尿中の代謝物パターンも 2 用量の間で類似していたが、一部の代謝物は雌雄間で量的な差が認められた。

#### 植物における代謝運命（資料 M-3）：

フェニル環と側鎖の両方を<sup>14</sup>Cで標識したオリサストロピンSC剤を被験物質とし、実使用と同様に育苗箱処理（100 g ai/10a）のみを行った試験区（処理区-2）と、本田での使用も考慮して育苗箱処理（100 g ai/10a）と2回の田面水処理（2×75 g ai/10a）および最後に茎葉散布（30 g ai/10a；収穫前16日）を行った試験区（処理区-1）の2種類の方法で処理し、オリサストロピンの稲体各部への分布と代謝を経時的に調査した。

土壌または田面水に処理したオリサストロピンは根部から速やかに吸収され、地上部に容易に移行するものの穂への移行性は少なく、処理区-1と-2の稲わら中のTRRがそれぞれ31.4 mg/kgと1.21 mg/kgであるのに対し、玄米ではそれぞれ、5.23 mg/kgおよび0.16 mg/kgであった。玄米中では主に糠に分布しており、精米中のTRR濃度は玄米中のその約1/4（23%）であった（処理区-2）。

処理区-1と-2の玄米中TRRのそれぞれ84%と50%が抽出され、TRRの約55%（処理区-2）から大部分（処理区-1）に相当する抽出性成分が同定または特徴付けされた（同定：処理区-2で84.5%TRR、処理区-1で17.8%TRR）ほか、残渣中残留物（処理区-1：15.8%TRR、処理区-2：59%TRR）についてもその約1/2（処理区-1）～2/3（処理区-2）が酵素処理により特徴付けられた。わら中では両処理区ともTRRの90%以上が抽出可能成分であり、両処理区ともTRRの約88%の抽出性成分が同定または特徴付けられた。

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

玄米およびわら中の残留物の特性は処理区-1と-2で同じであった。水稻においてオリサストロピンが受ける主な代謝変換は (F001) と、それら分子内の数箇所で行われる脱メチル化

とメチル基の水酸化、ならびに*o*-脱メチル化代謝物の抱合体であり、これらが組み合わさって多数の代謝物が生成された。抱合体は更に代謝され、最終的に炭水化物、セルロース、蛋白質、リグニンなどの天然成分に取り込まれた。

代謝速度は比較的遅く、玄米中の主な残留物は未変化のオリサストロピン（処理区-1で 54.8%TRR；2.9 mg/kg、処理区-2で7.1%TRR；0.011 mg/kg）と F001（処理区-1で17.7%TRR；0.93 mg/kg；処理区-2で3.1%TRR；0.005 mg/kg）であり、その他の代謝物はそれぞれTRRの5%未満の微量成分（処理区-1で $\leq$ 0.2 mg/kg、処理区-2で $\leq$ 0.01 mg/kg）であった。精米（処理区-1）およびわら中の主要残留物も同様にオキサストロピン（精米：35.1% TRR、わら：処理区-1で42.6%TRR、処理区-2で24.5%TRR）とF001（精米：6.3%TRR、わら：処理区-1で17.2%TRR、処理区-2で12.6%TRR）であった。

#### 土壤中における代謝運命：

シルト質砂土を用いて好氣的湛水土壤代謝運命を調査（試験-1；資料M-4）したほか、その補足として、軽塩土水田土壤を用いて湛水状態と乾田状態での代謝運命を調査した（試験-2；資料M-5）。

#### 水田条件における代謝運命：

フェニル環と側鎖のそれぞれを<sup>14</sup>Cで標識した2種類のオリサストロピン標識体を1.5 mg/kg乾土の用量で、水田条件としたドイツ産の非滅菌と滅菌シルト質砂土（試験-1）および日本産非滅菌水田土壤（試験-2）にそれぞれ処理し、25°Cで好氣的湛水土壤代謝運命を調査した。

試験-1の非滅菌土壤による2種標識体の動態はほぼ同一であった。水相に添加されたオリサストロピンは、水相から6日の半減期で消失して土壤相に移行したが、182日後においても処理放射能の約12~15%が水相から検出された。土壤中からはオキサストロピンは318日の半減期で消失した。オリサストロピンの一部は二酸化炭素にまで無機化されたがその速度は遅く、二酸化炭素生成量は182日後で処理放射能の3%（フェニル環標識体）~8%（側鎖標識体）にとどまった。土壤抽出液および水相中から未変化のオリサストロピンのほかに、オリサストロピンの異性体3種（それぞれ処理放射能の1~7%）と処理放射能のそれぞれ3%未満の微量物質18種類（総量で処理放射能の11%未満）も検出された。土壤抽出残渣はほぼ経時的に増加し、処理放射能の12~13%となった。同抽出残渣中の放射性成分の約1/2は0.5M NaOHで抽出され、残部は主にフルボ酸画分とヒューミン画分に分布していた。滅菌土壤での動態は非滅菌土壤とほぼ同じであったが、抽出残渣の生成は最大で処理放射能の3%であり、非滅菌土壤に比べて顕著に低かった。また水相および土壤抽出液中の全放射能が未変化のオリサストロピンであったことから、非滅菌土壤における抽出残渣成分と水および土壤抽出液から検出された微量物質の生成には土壤微生物による代謝が関与していると推測される。

試験-2の非滅菌土壤でも2種標識体の動態はほぼ同一であった。オリサストロピンの分解は遅く、その50%消失期は294日と推定された。水相に分布するオリサストロピンの割合は高く、84日後で処理放射能の17%が水相に分布していた。抽出残渣は経時的に増加して処理放射能の8~11%となった。二酸化炭素まで無機化されるオリサストロピンの量はフェニル環標識体よりも側鎖標識体の方が高いものの、75日間で処理放射能の1.7%にとどまった。土壤相および水相の抽出液からい

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

いずれも処理放射能の1.6%以下の微量な代謝物が少なくとも7種類検出され、うちフェニル標識体から2種類がF011およびF032と同定された。

以上のように、容器内遮光下の好氣的湛水土壤中ではオリサストロピンは緩慢な速度ではあるが、分子開裂によりF011、F032を生成する経路で土壤微生物によって代謝され、最終的にはフェニル環と側鎖部分のいずれもが二酸化炭素にまで無機化されるほか、土壤結合残留物を生成する。

#### 畑条件における代謝運命：

二酸化炭素生成量は両標識体とも84日間で処理放射能の0.4%に過ぎず、土壤抽出液からも有意な量の代謝物は検出されなかった。容器内遮光下の非滅菌畑状態土壤におけるオリサストロピンの代謝は湛水状態におけるよりも遅いと考えられる。

#### 水中における分解運命：

##### 加水分解運命（資料M-7）：

25°C、pH 4~9の条件下で、30日間でオリサストロピンの有意 (>5%) な消失ならびに分解物の生成は認められなかった。オキサストロピンは環境中pH条件では加水分解に対して安定と考えられる。

##### 光分解（資料M-8）：

フェニル環を<sup>14</sup>Cで標識したオリサストロピン標識体を5 mg/Lの濃度で添加したpH7.0の滅菌緩衝液とpH 7.0の滅菌田面水に25°Cでキセノン光（カットオフ波長290 nm）を東京地方の初夏の太陽光下の28日間に相当する14日間連続照射した。

オリサストロピンは緩衝液中と田面水中のいずれにおいても急速に光分解された。オリサストロピンの光分解は緩衝液中と田面水中のいずれにおいても初期量の約40%迄への分解が主体となる急速な相と、以降の緩慢な分解の相との2つの相から成る疑似一次反応に対応したものであり、50%消失期および90%消失期はそれぞれ緩衝液中では1.1日と24.7日、田面水中では0.8日と30.0日であった。これは東京地方の初夏の太陽光下では、それぞれ、2.2日、50日、1.7日、60日に相当した。

緩衝液と田面水のいずれにおいても十数種の光分解物が生成した。処理放射能の5%以上の割合で生成する分解生成物は緩衝液と田面水に共通しており、オリサストロピンの異性体3種（F001、F033、F049）と2種の分子開裂体（F011とF032）であった。その他の未同定生成物はいずれも処理放射能の5%未満であった。主分解生成物はF001で、その最大生成量は処理放射能の26~28%を占めた。F001に次ぐ光分解物はF033とF049で、両者ともその最大生成量は処理放射能の10~13%であった。

オリサストロピンの光分解は緩衝液と田面水のいずれにおいても2段階から成っており、オリサストロピンが先ずそれらの異性体約8種類（うち主要なもの：F001、F033、F049）に急速に変換され、次いで、それらの側鎖の脱離と閉環によってそれぞれF011とF032のほか多数の微量物質に緩慢な速度で分解される。

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

以上のように環境水中でオリサストロピンは有意な加水分解を受けないが、太陽光によって急速に光分解(異性体化および分解)され、主要な生成物としてオリサストロピンの異性体(F001, F033, F049)を生成し、それらが開裂して微量代謝物(F011, F032)を生成した。



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

オリサストロピンの動植物等における代謝分解経路図

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

オリサストロピンの開発年表