

目次

	<u>頁</u>
I. 開発の経緯	I-1
II. 物理的・化学的性状	II-1
III. 生物活性	III-1
IV. 適用及び使用上の注意	IV-1
V. 残留性及び環境中予測濃度算定関係	V-1
VI. 有用動植物等に及ぼす影響	VI-1
VII. 使用時安全上の注意、解毒法等	VII-1
VIII. 毒性	VIII-1
1. 原体	
(1) 急性毒性	VIII-14
(2) 皮膚及び眼に対する刺激性	VIII-24
(3) 皮膚感作性	VIII-31
(4) 急性神経毒性	VIII-35
(5) 亜急性毒性	VIII-37
(6) 反復経口投与神経毒性	VIII-56
(7) 1年間反復経口投与毒性及び発がん性	VIII-58
(8) 繁殖性及び催奇形性	VIII-121
(9) 変異原性	VIII-142
(10) 生体の機能に及ぼす影響	VIII-161
2. 原体混在物及び代謝物	VIII-168
3. 製剤	VIII-202
3.1 グリホサートイソプロピルアミン塩 41%液剤	VIII-202
3.2 グリホサートアンモニウム塩 41%液剤	VIII-212
3.3 グリホサートカリウム塩 52%液剤	VIII-222
3.4 グリホサートカリウム塩 48%液剤	VIII-231
IX. 動植物及び土壌等における代謝分解	IX-1
 【附】 グリホサートの開発年表	 附-1

I. 開発の経緯

1. 開発の経緯

米国モンサント社は、多年生雑草に優れた防除効果を示し、かつ安全性の高い除草剤の開発への強い要望に応えるため、1960年代の中頃より、多年生雑草、灌木類等に効果が高く、かつ安全性の高い新しいタイプの茎葉処理除草剤の研究を開始した。その結果、米国モンサント社はグリホサートに代表される低毒性で、かつ除草効果の高いアミノ酸含有の新しい化合物群を発見した。このグリホサートは、従来の除草剤と異なり、茎葉の吸収移行性が極めて強く、これ迄防除困難とされてきた多年生雑草の根まで移行して、枯殺効果を発揮し、根絶するという画期的作用を有していることが認められた。また、土壌に落下すると土壌の粒子に強く吸着され、殺草作用を示さなくなるため、作物に対して吸収害を示さず、従って連用による作物への害がなく、作物に対する安全性が高い事も認められた。このような作用を有するアミノ酸含有化合物の除草剤としての実用化に成功したのは、モンサント社が最初である。1967年より米国をはじめ、世界各地で実用化試験が開始され、グリホサートはその強い茎葉吸収移行性により、一年生雑草から多年生雑草、雑灌木類まで幅広い雑草に優れた効果を発揮する除草剤である事が確認された。

グリホサート及びその製剤ラウンドアップについての安全性に関する研究は、1970年より開始された。グリホサートは、ラウンドアップ製剤中では水溶性を高めるためイソプロピルアミン塩として含有されているが、水溶液中ではイソプロピルアミンと完全に解離している。このためグリホサートそのものの評価のためにはフリー体を用いることが妥当と考えられ、グリホサートの安全性評価にかかわる試験は、主にフリー体の酸を用いて実施された。イソプロピルアミン塩を用いた犬の6ヶ月間亜急性毒性試験も実施されたが毒性学的に重大な差異は認められなかった。広範囲な毒性学的研究の結果、極めて低毒性であり、慢性毒性試験、発癌性試験等において、有害作用を示さない事が確認された。さらに環境中運命に関する研究では、土壌残留性、水質汚濁性、生物濃縮性について何ら有意なリスクを示さず、野生動物、野鳥、昆虫、魚貝類に対する毒性も極めて低く、本剤に曝露された環境に悪影響は生じないことが確認された。

日本における試験は1972年より開始され、関係各試験研究機関で広範囲の適用開発試験が行われ、その結果、幅広い雑草に対する強力な根絶効果と作物への安全性が確認され、果樹園、桑園、水田畦畔、休耕田、林地、牧野・草地等の分野で高い実用性が認められた。1980年9月にグリホサートイソプロピルアミン塩液剤の登録がかんきつ園、水田畦畔、水田耕起前、休耕田、桑園について認可され、1982年に落葉果樹、林地（地ごしらえ）、牧野・草地（更新・造成）の適用拡大が認可された。その後、1998年12月に活性成分のグリホサートの吸収移行性及び耐雨性を向上させたグリホサートアンモニウム塩液剤が登録され、さらに2006年9月にスギナ等の難防除雑草への効果を高めたグリホサートカリウム塩液剤が登録された。

現在、ラウンドアップブランドのグリホサート剤は、米国、カナダ、西欧諸国をはじめ、世界130ヶ国以上で登録されており、果樹園、コーヒー園、畑作地、非農耕地等多くの場面で使用されている。なかでも不耕起栽培での使用により土壌流亡を抑えて省資源、省力化を推進することに貢献する資材として注目されているほか、遺伝子組換え技術によるラウンドアップ・レディー（グリホサート耐性）作物への使用が急速に普及しており、本剤の農業生産における重要性及び高い安全性は国際的に広く受

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本モンサント株式会社にある。

け入れられている。

1986年9月～10月にローマで開催されたFAO/WHO残留農薬専門家委員会合同会議(JMPR)での評価においても、グリホサートの高い安全性が認められた。会議の報告書では、急性毒性が非常に低く、催奇形性、変異原性、発癌性も認められず、慢性毒性も低いとされ、合同会議の答申として0.3mg/kg/日の一日許容摂取量(ADI)が認められている。国際化学物質安全評価プログラム(IPCS)のEnvironmental Health Criteriaのモノグラム159グリホサートが1994年に発刊された(WHO,1994)。1997年のJMPRでは使用方法の拡大にともなう一部の基準値の見直しと主要代謝物アミノメチルホスホン酸(AMPA)の取り扱いについて審議され、CXLの改訂とAMPAの毒性がグリホサートと同等であると評価され、規制対象には変更なくグリホサートとされた。なお経口暴露評価に用いる残留物の定義はグリホサートとAMPAの合計をグリホサート換算で表すことにした。1998年にWHOの飲料水の水質基準が審議され、飲料水中の想定濃度に対してADIが十分に大きいことから飲料水中の水質基準を設定する必要がないと結論された。また、JMPRの審議を受けてAMPAについてもグリホサートと同様の安全性に基づき飲料水中の水質基準を設定する必要がないと結論された。さらにJMPRでは2004年に毒性の再評価を実施しADIを改訂して1mg/kg/日としたほか、2005年には残留基準値も改訂された。

わが国では1980年の登録時に設定された0.016mg/kg/日のADIに基づき米、果実に登録保留基準が設けられたのを初めとして、1994年に食品衛生法の残留基準値が120余りの作物に設定された。さらに、1999年に残留基準値の見直しが行われ、追加データの審査に基づきADIが0.75mg/kg/日に改訂されるとともにCODEX基準および米国EPAとの整合性も図られた。

その後2003年に食品基本法のもと食品安全委員会が設立され、2006年に食品衛生法の改正に伴いポジティブリスト制度が導入され、残留基準値の見直しが始まった。グリホサートは2010年2月厚生労働省から食品安全委員会に食品健康評価が諮問され、同年4月にインポートトレランス申請、同年10月から食品安全委員会の審議が開始された。

一方JMPRでは、2011年に遺伝子組換え大豆およびトウモロコシに含まれる新しい代謝物N-アセチルグリホサートとN-アセチルアミノメチルスルホン酸(N-アセチル-AMPA)の毒性評価を実施し、その結果次の値に変更された。

【規制対象となる残留物の定義】

ダイズおよびトウモロコシ：グリホサートおよびN-アセチルグリホサートの合計をグリホサート換算であらわしたもの

ダイズおよびトウモロコシ以外の作物：グリホサート

畜産物：グリホサートおよびN-アセチルグリホサートの合計をグリホサート換算であらわしたもの

【経口暴露評価に用いる残留物の定義】

作物および畜産物：グリホサート、N-アセチルグリホサート、AMPAおよびN-アセチル-AMPAの合計をグリホサート換算であらわしたもの

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本モンサント株式会社にある。

2. 諸外国での登録状況

国名	作物または適用場面	Tolerance (ppm)
アメリカ合衆国	アセロラ	0.2
	アルファルファ・種実	0.5
	アーモンド (殻つき)	25
	アロエ	0.5
	アンバレラ	0.2
	動物飼料、乾草以外 (グループ 18)	400
	アーティチョーク (グローブ)	0.2
	アスパラガス	0.5
	アテモヤ	0.2
	アボカド	0.2
	たけのこ	0.2
	バナナ	0.2
	大麦・ぬか	30
	てんさい・乾燥かす (ビートパルプ)	25
	てんさい・根部	10
	てんさい・葉部	10
	ベリー類および小粒果実 (グループ 13-07)	0.2
	ベテルナッツ	1.0
	ビリバ	0.2
	ビルンビ (ナガバノゴレンシ)	0.2
	パンノキ果実	0.2
	カカオ	0.2
	ウチワサボテン・果実	0.5
	ウチワサボテン・葉	0.5
	カニステ	0.2
	カノーラ・種	20
	にんじん	5.0
	チャヤ	1.0
	チェリモヤ	0.2
	カンキツ (乾燥果肉)	1.5
	ココナッツ	0.1
	コーヒー豆 (緑)	1.0
	とうもろこし種実 (ポップコーン)	0.1
	とうもろこし (スイートコーン、外皮を除いた軸付き種実)	3.5
	綿 (ジントラッシュ)	210
	バンレイシ	0.2
	ナツメヤシ乾燥果実	0.2
	ドクダミ	2.0
	ドリア	0.2
	エパゾーテ (アカザ科ハーブ)	1.3

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本モンサント株式会社にある。

2. 諸外国での登録状況 (つづき)

国名	作物または適用場面	Tolerance (ppm)
	フェイジョア	0.2
	いちじく	0.2
	魚類	0.25
	カンキツ類果実 (グループ 10-10)	0.5
	仁果類果実 (グループ 11-10)	0.2
	核果類果実 (グループ 12)	0.2
	バンウコンの根	0.2
	ショウガの花	0.2
	Buffalo gourd (ウリ類) の種子	0.1
	Governor' s plum (Flaucourtia indica, アフリカ産ヤナギ科の低木の果実)	0.2
	クコの葉	0.2
	穀物類の茎葉飼料およびわら (グループ 16, 飼料用とうもろこしを除く)	100
	穀類 (グループ 15, 飼料用とうもろこし、ポップコーン、 米、スイートコーンを除く)	30
	牧草類の茎葉飼料および乾草	300
	グアバ	0.2
	ハーブ (サブグループ 19A)	0.2
	ホップ	7.0
	イラマ	0.2
	インベ	0.2
	インブ	0.2
	ジャボティカバ	0.2
	ジャックフルーツ	0.2
	カバの根	0.2
	ケナフの茎葉飼料	200
	Leucaena 茎葉飼料	200
	ロンガン	0.2
	ライチー	0.2
	マミーアップル	0.2
	マンゴ	0.2
	マンゴスチン	0.2
	マーマレードボックス	0.2
	ミョウガ	0.2
	ノニ	0.2
	松の実	1.0
	木の実 (グループ 14)	1.0
	油糧種子 (カノーラを除く)	40

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本モンサント株式会社にある。

2. 諸外国での登録状況 (つづき)

国名	作物または適用場面	Tolerance (ppm)
	オクラ	0.5
	オリーブ	0.2
	オレガノの葉	2.0
	パームハート (パルミート・ヤシの芽)	0.2
	パームハート (パルミート) の葉	0.2
	ヤシ油	0.1
	パパイヤ	0.2
	マウンテンパパイヤ	0.2
	パッションフルーツ	0.2
	ポーポー	0.2
	エンドウマメ (乾燥種実)	8.0
	落花生	0.1
	落花生 (乾牧草)	0.5
	コショウの生葉	0.2
	ペパーミント	200
	シソ	1.8
	かき	0.2
	パイナップル	0.1
	ピスタチオ	1.0
	ざくろ	0.2
	ブラサン	0.2
	キノアの穀粒	5.0
	ランブータン	0.2
	米 (穀粒)	0.1
	ワイルドライス (穀粒)	0.1
	フトモモ	0.2
	サポディアラ	0.2
	サポーテ	0.2
	貝類	3.0
	トゲバンレイシ	0.2
	スパニッシュライム	0.2
	スペアミント	200
	スパイス (サブグループ 19B)	7.0
	スターアップル	0.2
	スターフルーツ	0.2
	ステビア乾燥葉	1.0
	シュガーアップル	0.2
	さとうきび茎葉	2.0
	さとうきび糖蜜	30
	スリナムチェリー	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日本モンサント株式会社にある。

2. 諸外国での登録状況 (つづき)

国名	作物または適用場面	Tolerance (ppm)
	かんしょ	3.0
	タマリンド	0.2
	茶 (乾燥)	1.0
	茶 (インスタント)	7.0
	テフ (茎葉飼料、乾牧草)	100
	テフ (種実)	5.0
	センネンボク葉	0.2
	センネンボク根	0.2
	アグリフルーツ	0.5
	球根野菜 (グループ 3-07)	0.2
	ウリ科野菜 (グループ 9)	0.5
	大豆を除くマメ科茎葉部 (グループ 7 A)	0.2
	その他の果菜類 (グループ 8-10, オクラを除く)	0.1
	アブラナ科野菜 (グループ 5)	0.2
	アブラナ科以外の葉野菜 (グループ 4)	0.2
	てんさいを除く根菜、塊茎野菜の茎葉部	0.2
	大豆、エンドウマメ (乾燥) を除くマメ科野菜 (グループ 6)	5.0
	わさび根	0.2
	ウォータースピナッチ	0.2
	クレソン	0.2
	ワックスジャンプ	0.2
	ヤコン塊茎	0.2
	牛 (肉の加工品)	5.0
	とうもろこし飼料 (茎葉部)	13
	とうもろこし飼料 (穀粒)	5.0
	とうもろこし飼料 (乾燥茎葉部)	100
	卵	0.05
	穀類 (吸引残渣)	310
	ヤギ (肉の加工品)	5.0
	豚 (肉の加工品)	5.0
	馬 (肉の加工品)	5.0
	家禽の肉	0.1
	家禽 (肉の加工品)	1.0
	羊 (肉の加工品)	5.0
	大豆 (茎葉部)	100
	大豆 (乾草)	200
	大豆 (外皮)	120
	大豆 (種実)	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日本モンサント株式会社にある。

国名	作物または適用場面
メキシコ	水路堤等、果樹（柑橘を含む）、作物の植え付け前（農業分野）、道路
アルジェリア	柑橘、休閒地
アンゴラ	柑橘、ココア、コーヒー、工業用水路、ヤシ園、牧草地更新、梨果、鉄道線路、核果、さとうきび
オーストラリア	水生雑草（排水路、水路、岸、湖、ダム）、バナナ、黒イチゴ、柑橘、林地、ぶどう、工業用地、堅果類、オリーブ、牧草地、梨果、核果
オーストリア	休閒地、林地、ぶどう、工業用地、果樹
バルバドス	アメリカの分類を是認
ベルギー	水生雑草、穀類、ぶどう、家庭園芸、果樹、牧草地更新、刈り跡
ボリビア	バナナ、柑橘、コーヒー、果樹、非農耕地
ブラジル	りんご、柑橘、コーヒー、ツバイモモ、非農耕地、牧草地、モモ、西洋なし、プラム、大豆、さとうきび
ブルガリア	りんご、林地地ごしらえ、ぶどう、非農耕地、牧草地、もも、稲株、たばこ、小麦株、くるみ、とうひ、運河
カナダ	りんご、大麦、とうもろこし、ぶどう、育苗／花木、燕麦、非農耕地、牧草地、西洋なし、ばれいしょ、大豆、核果、てん菜、小麦、耕起前
チリ	ぶどう、果樹、非農耕地、牧草地、休閒地
コロンビア	アフリカヤシ、バナナ、柑橘、ココア、コーヒー、不耕起栽培、非農耕地、バナナ
コスタリカ	各種作物、非農耕地
キプロス	柑橘、ぶどう、果樹
チェコ	ぶどう、果樹（りんご、西洋なし）、林地、水路、開墾地、すべての飼料用作物及びアマの収穫前、ばれいしょ、てんさい、そ菜類
エチオピア	コーヒー、林地及び休閒地、工業用地の水生雑草
エジプト	1年生雑草防除（綿、大豆、てん菜、メロン）

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本モンサント株式会社にある。

国名	作物または適用場面
デンマーク	りんご、大麦、林地、果樹、非農耕地、家庭園芸、飼料作物の収穫前、刈り跡（非農耕地）、牧草地
ドミニカ共和国	工業用地、非農耕地
エクアドル	バナナ、ココア、コーヒー、各種作物、果樹、非農耕地、牧野の更新、さとうきび
エルサルバドル	各種作物
フィンランド	収穫後、林地、家庭園芸、非農耕地、刈り跡、牧草地
フランス	りんご、水生雑草、ぶどう、家庭園芸、工業用地、西洋なし、畑地、刈り跡
ドイツ	穀物収穫前、林地、ぶどう、牧草地、梨果、刈り跡、家庭園芸
ギリシャ	ぶどう、果樹園、とうもろこし、綿、てん菜、たばこ、野菜、工業用地、非農耕地、水生雑草、ぶどう、耕起前、核果、刈り跡
グアテマラ	各種作物
ホンジュラス	各種作物、非農耕地
ホンコン	柑橘、花木、灌漑用水路、堅果、非農耕地、豆果、梨果、鉄道線路、稲、道路ぎわ、根菜類、野菜
ハンガリー	ぶどう、果樹、刈り跡
アイスランド	林地、果樹、非農耕地、牧草地、刈り跡
インド	茶
インドネシア	ココア、油ヤシ、ゴム、茶
イラン	水生雑草、柑橘、ぶどう、果樹（りんご、西洋なし）、非農耕地、刈り跡
アイルランド	水生雑草、林地、工業用地、各種作物、非農耕地、果樹作物、収穫前、刈り跡
イスラエル	柑橘、排水路、ぶどう、工業用地、他の非農耕地、梨花、核果、落花生、綿の刈り跡、亜熱帯果実（アボガド、マンゴー、カキ、ペカン、ナツメヤシ）、にんじん
イタリア	柑橘、ぶどう、工業用地、刈り跡、りんご、西洋なし、核果、オリーブ、野菜、アスパラガス

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本モンサント株式会社にある。

国名	作物または適用場面
ルクセンブルグ	刈り跡、ぶどう、果樹園、牧草地更新、穀物の収穫前、家庭園芸
コートジボワール	産業用大農園
ジャマイカ	各種作物
ケニア	水生雑草、コーヒー、休閒地、林地、工業用地
マレーシア	ココヤシ、コーヒー、休閒地、ヤシ油、穀物、ゴム
マルチニク	ぶどう、工業用地、各種作物、核果、刈り跡
モーリシャス	工業用地、非農耕地、さとうきび、植え付け前（すべての作物）
モロッコ	そらまめ、柑橘、林地、ぶどう、果樹、非農耕地、刈り跡
オランダ	りんご及び西洋なし、休閒地、畑地、林地、家庭園芸、公共緑地、牧草地更新、とうもろこし、てん菜、刈り跡耕起前、冬小麦、牧草収穫前、乾燥小水路、ラップスイセン
ニュージーランド	アスパラガス、大麦、いちご、管理耕地、カモジグサ、ウシノケグサ、工業用地、キウイ、家庭園芸、各種作物、果樹、穀物及びえんどうまめの収穫前、運動場、芝生、水路
ニカラグア	各種作物
ノルウェー	休閒地、林地、家庭園芸、苗床／花木、果樹、非農耕地、牧草地更新、牧野の刈り跡、春作物の収穫前、大麦、飼料用大麦の収穫前
ペルー	バナナ、コーヒー、果樹、非農耕地、牧草地、さとうきび、茶
フィリピン	バナナ、柑橘、ココナッツ、コーヒー、排水路、林地、灌漑用水路、油ヤシ、非農耕地、パイナップル、稲、ゴム、さとうきび
ポーランド	りんご、西洋なし、スグリ、セイヨウスグリ、キイチゴ、刈り跡、農道の道路ぎわ、公園
ポルトガル	りんご、西洋なし、水生雑草（小水路の土手）、バナナ、柑橘、ぶどう園、工業用地、水田畦畔、オリーブ、牧草地更新、西洋なし、稲、核果、刈り跡
プエルトリコ	バナナ、各種作物
パナマ	各種作物、非農耕地

国名	作物または適用場面
スーダン	灌漑用水路、休閒地、畦間処理
ルーマニア	りんご、西洋なし、プラム、森林地：針葉樹の植え付け前、ぶどう園、とうもろこしの収穫前、果樹作物、プラム、刈り跡、野菜の植え付け前
スペイン	りんご、西洋なし、畑地、バナナ、灌木、柑橘、ぶどう、家庭園芸、工業用地、堅果、オリーブ、非農耕地、牧草地の更新、稲、核果
スリランカ	小水路の土手、道路ぎわ、ゴム、茶
スウェーデン	りんご、休閒地、草地、林地／地上及び空中散布、工業用地、公園、家庭園芸、公共用地、果樹園（りんご、西洋なし）、鉄道線路、刈り跡、穀類、ぶどう、果樹、牧草地、野菜及びすべての作物の植え付け前
台湾	水生雑草、バナナ、柑橘、ぶどう、非農耕地、水田畦畔、西洋なし、パイナップル、さとうきび、茶
タイ	油ヤシ、ゴム等
トリニダードトバコ	アメリカの表示を是認
チュニジア	柑橘、休閒地、ぶどう、オリーブ、果樹作物、ナツメヤシの下草防除
トルコ	りんご、西洋なし、水生雑草、柑橘、非農耕地、堅果類、刈り跡、野菜の植え付け前
ロシア	柑橘、ぶどう、果樹、刈り跡、野菜、林地
イギリス	水生雑草、大麦、アブラナ、食用豆、耕地作物、針葉樹、森林地、ぶどう、家庭園芸、工業用地、燕麦、りんご、西洋なし、プラム、チェリー、西洋すもも、牧草地、えんどうまめ、アブラナ、アマ、ライ麦、いちごの収穫前、刈り跡（自生ばれいしょ防除）、てん菜、小麦の収穫前
ウルグアイ	果樹
ヴェネズエラ	各種作物
クロアチア	水生雑草、ぶどう、工業用地、非農耕地、果樹（りんご、西洋なし、もも、プラム、チェリー、あんず、オリーブ）林地、すべての作物、刈り跡
韓国	林地、果樹（りんご、西洋なし、栗）

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本モンサント株式会社にある。

国名	作物または適用場面
アルゼンチン	柑橘、綿、ぶどう、各種作物、非農耕地、果樹、牧草地、落花生、ばれいしょ、大豆
南アフリカ	工業用地、柑橘、ぶどう、りんご、西洋なし、もも、バナナ、マンゴー、黒イチゴ、さとうきび、あんず、プラム、林地、アボガド、ペカン、牧草地、水生雑草、家庭園芸
ナイジェリア	作物の植え付け前、林地、各種作物、工業用地、水生雑草
コンゴ	油ヤシ、さとうきび、コーヒー、稲、バナナ、柑橘、パイナップル

II. 物理的・化学的性状

1. 有効成分の名称及び化学構造

1) 一般名

グリホサート (glyphosate) (ISO名)

グリホサートイソプロピルアミン塩 (glyphosate-isopropylammonium)

グリホサートアンモニウム塩 (glyphosate-ammonium)

グリホサートカリウム塩 (glyphosate-potassium)

2) 別名

商品名：ラウンドアップ、ラウンドアップハイロード、ラウンドアップKロード、
ラウンドアップマックスロード

試験名：MON39、CP-67573、グリフォセート、グリホセート、MON-0573

3) 化学名 下表参照

4) 構造式 下表参照

5) 分子式 下表参照

6) 分子量 下表参照

7) CAS No. 下表参照

一般名	化学名	構造式	分子式 分子量	CAS No.
グリホサート	<i>N</i> -(ホスホノメチル)グリシン <i>N</i> -(phosphonomethyl) glycine	$\text{HO}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{CH}_2-\underset{\text{H}}{\text{N}}-\text{CH}_2-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{P}}(\text{OH})_2$	$\text{C}_3\text{H}_8\text{NO}_5\text{P}$ 169.1	1071-83-6
グリホサート イソプロピル アミン塩	イソプロピルアンモニウム= <i>N</i> -(ホスホノメチル)グリシナート isopropylammonium <i>N</i> -(phosphonomethyl) glycinate	$\left[\text{HO}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{CH}_2-\underset{\text{H}}{\text{N}}-\text{CH}_2-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{P}}(\text{OH})_2 \right]^- \left[\text{NH}_3\text{CH}(\text{CH}_3)_2 \right]^+$	$\text{C}_6\text{H}_{17}\text{N}_2\text{O}_5\text{P}$ 228.2	38641-94-0
グリホサート アンモニウム 塩	アンモニウム= <i>N</i> -(ホスホノメチル)グリシナート ammonium <i>N</i> -(phosphonomethyl) glycinate	$\left[\text{HO}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{CH}_2-\underset{\text{H}}{\text{N}}-\text{CH}_2-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{P}}(\text{OH})_2 \right]^- \text{NH}_4^+$	$\text{C}_3\text{H}_{11}\text{N}_2\text{O}_5\text{P}$ 186.1	40465-66-5
グリホサート カリウム塩	カリウム= <i>N</i> -(ホスホノメチル)グリシナート potassium <i>N</i> -(phosphonomethyl) glycinate	$\left[\text{HO}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{CH}_2-\underset{\text{H}}{\text{N}}-\text{CH}_2-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{P}}(\text{OH})_2 \right]^- \text{K}^+$	$\text{C}_3\text{H}_7\text{KNO}_5\text{P}$ 207.2	70901-12-1

2. 有効成分の物理的・化学的性状

グリホサート（N-（ホスホノメチル）グリシン）の物理的・化学的性状

項目		測定値（測定条件）	測定方法／試験機関															
色調		白色	JIS Z 8723 に準ずる/ (2000)															
形状		固体（結晶粉末）	官能法/ (2000)															
臭気		無臭	官能法/ (2000)															
密度		1.655 g/cm ³ (20°C)	比重瓶法 OECD No.109/ (GLP 1991)															
融点		189.5°C ± 0.5°C	溶融顕微鏡法/OECD No.102/ (GLP 1989)															
沸点		測定不能																
蒸気圧		1.31 × 10 ⁻⁵ Pa (25°C)	拡散法：蒸気圧天秤法 OECD No.104/ (GLP 1991)															
解離定数 (pKa)		PKa1=2.72, pKa2=5.63 PKa3=10.2 (25°C)	電位差滴定法 EPA TG D, 63-10/ (GLP 1992)															
溶解度	水	10.5 ± 0.2 g/l (20°C)	フラスコ法/OECD No.105/ (GLP 1990)															
	有機溶媒	ヘキサン	0.026 g/l (20°C)	フラスコ法/EPA TG D, 63-8/ (GLP 1991)														
		トルエン	0.036 g/l (20°C)															
		ジクロロメタン	0.233 g/l (20°C)															
		アセトン	0.078 g/l (20°C)															
		メタノール	0.231 g/l (20°C)															
		プロパノン-2-オール	0.020 g/L (20°C)															
	酢酸エチル	0.012 g/l (20°C)																
オクタノール/水分配係数 (log Pow)		log Pow < 1 (25°C、pH 5, 7, 9)	フラスコ振とう法/EPA CG1400 / (GLP 1987)															
生物濃縮性		log Pow が 3.5 未満であるため 提出除外																
土壌吸着係数 (K _{F^{ads}} , K _{F^{ads}OC})		(25 ± 1°C) <table border="1" style="margin-left: auto; margin-right: auto;"> <thead> <tr> <th></th> <th>K_{F^{ads}}</th> <th>K_{F^{ads}OC}</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>石川</td> <td>627.76</td> <td>61545</td> </tr> <tr> <td>牛久</td> <td>6859.95</td> <td>190026</td> </tr> <tr> <td>和歌山</td> <td>1269.22</td> <td>72527</td> </tr> <tr> <td>岡山</td> <td>1586.08</td> <td>229867</td> </tr> </tbody> </table>		K _{F^{ads}}	K _{F^{ads}OC}	石川	627.76	61545	牛久	6859.95	190026	和歌山	1269.22	72527	岡山	1586.08	229867	OECD106/ (1993)
	K _{F^{ads}}	K _{F^{ads}OC}																
石川	627.76	61545																
牛久	6859.95	190026																
和歌山	1269.22	72527																
岡山	1586.08	229867																
加水分解性		>32 日 t _{1/2} (35°C, 5°C, pH3, 6, 9) >30 日 t _{1/2} (25°C, pH5, 7, 9)	(1978) EPA TG N, 161-1/ (GLP 1990)															

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本モンサント株式会社にある。

項目		測定値 (測定条件)	測定方法/試験機関
水中 光分解性	蒸留水 (滅菌)	413日 $t_{1/2}$ (25℃、自然光) 光強度: 71.7W/m ² (250-800nm) 東京春季太陽光換算*: 300日 $t_{1/2}$	EPA TG N, 161-2/ (GLP 1990)
	蒸留水 (滅菌)	分解物は認められなかったため、半減期は算出できなかった。 (25±1℃、人工光、pH:8.1) 光強度: 457W/m ² (300-800nm)	EPA 160-40, MAFF 12 農産第 8147号 / (GLP 2005)
	自然水 (滅菌)	5.25~5.33日 $t_{1/2}$ (25±1℃、人工光、pH:8.0) 光強度: 457W/m ² (300-800nm) 東京春季太陽光換算: 33.9~34.4日 $t_{1/2}$	
	自然水 **	21日 で 78.6% が光分解により消失。(350-450nm 人工光) 最大光強度*: 1.5-2W/m ² (350-360nm)	(1978)
安定性	対熱	199℃±1℃で分解	溶融顕微鏡法 OECD No. 102/ (GLP 1989)
	その他	なし	
スペクトル		UV VIS/IR/NMR/MS 詳細は以下に示す。	(1989)

* 申請者が算出

** 参考資料

代謝分解物 AMPA (アミノメチルホスホン酸) の物理的・化学的性状

項目	測定値 (測定条件)		測定方法/試験機関
土壌吸着係数 (K_F^{ads} , $K_F^{ads_{oc}}$)	(20℃)		OECD / (1993)
		K_F^{ads} $K_F^{ads_{oc}}$	
	埴壤土 (SLI#1)	77.1 3640	
	砂土 (SLI#2)	1570 8310	
	砂土 (SLI#4)	15.7 1160	
	埴壤土 (SLI#5)	53.2 5650	
	壤質砂土 (SLI#9)	110 6920	
砂土 (SLI#11)	73.0 24800		

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本モンサント株式会社にある。

UV(VIS)、IR、NMR、MS等のスペクトル

試験機関

報告書作成年 1989年

検体の純度：99.9%（分析用標準品）

試験方法：紫外可視吸収（UV/VIS）、赤外吸収（IR）、核磁気共鳴（NMR）及び質量（MS）スペクトルを適切な測定用機器を用いて測定した。各測定条件は、以下のとおりである。

① 紫外可視吸収（UV/VIS）スペクトル

分光光度計：Varian Cary 219 UV-VIS

条件：

ビームインターチェンジ：	ノーマル
モード：	自動増幅
吸収範囲：	0～1.0
チャート：	5
走査スピード：	2 nm/秒
間隔：	0.5秒
スリット幅：	0.5nm
セル形状、長さ：	クォーツ、10mm

試料の濃度： $5.92 \times 10^{-5} \text{M}$ （アルカリ、中性及び酸性溶媒）

② 赤外吸収（IR）スペクトル

測定用機器：Philips PU 9514

条件：

走査時間：	2.5分
スリット幅：	中
チャート：	×1
範囲：	4000～400 cm^{-1}

方法：臭化カリウムディスク

温度：室温（22℃）

③ 核磁気共鳴（NMR）スペクトル

測定用機器：Bruker AC 200

測定モード：Gated Decoupling Mode

1) ^{31}P NMR スペクトル

試料濃度：	4g/L
溶媒：	D_2O 、pH5.4
内部指標：	リン酸 0 ppm
濃度：	室温

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本モンサント株式会社にある。

2) ^{13}C NMR スペクトル

試料濃度： 65.3 g/L
溶媒： D_2O 、pH5.4
内部指標： P-ジオキサン 67.4 ppm
温度： 室温

3) ^1H NMR スペクトル

試料濃度： 3.5 g/L
溶媒： D_2O
内部指標： TSP-d4
濃度： 室温

④ 質量 (MS) スペクトル

FAB (Fast Atom Bombardment) モード：グリセロール・マトリックス中の陽イオン FAB 及び陰イオン FAB (測定条件の詳細は図に添付した。)

結 果：添付図 1～9 のとおり

図 1～3 紫外可視吸収 (UV/VIS) スペクトル
図 4 赤外吸収 (IR) スペクトル
図 5～7 核磁気共鳴 (NMR) スペクトル
図 8、9 質量 (MS) スペクトル

T Substance : N-phosphonomethylglycine.
(glyphosate acid)
Purity : 99.9 %
Spectrophotometer : Varian Cary 219 UV-VIS.
Temperature : ambient (21°).
Solvent : distilled water.
Ref. Solvent : distilled water.
Cell : quartz, length 10 mm.
Laboratory : Central Laboratorium,
Antwerp, Belgium.

1.000 FUNCTION
[Abs]

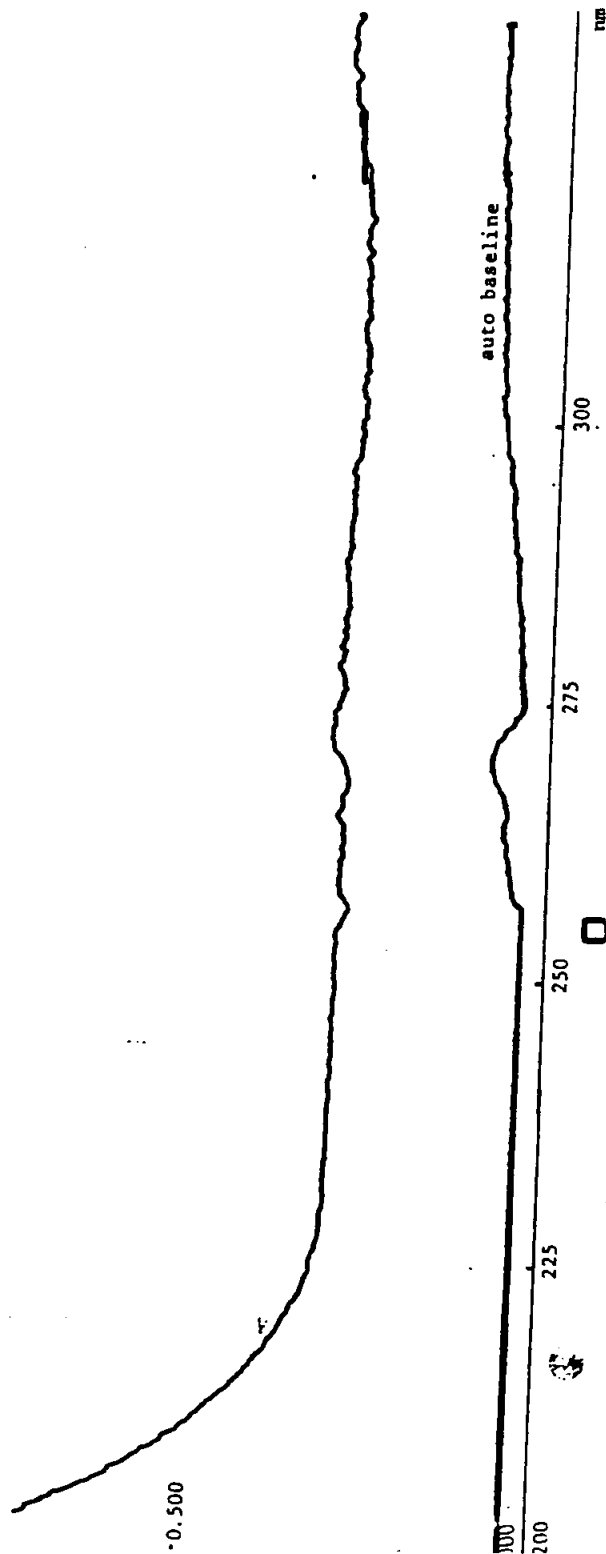


図1

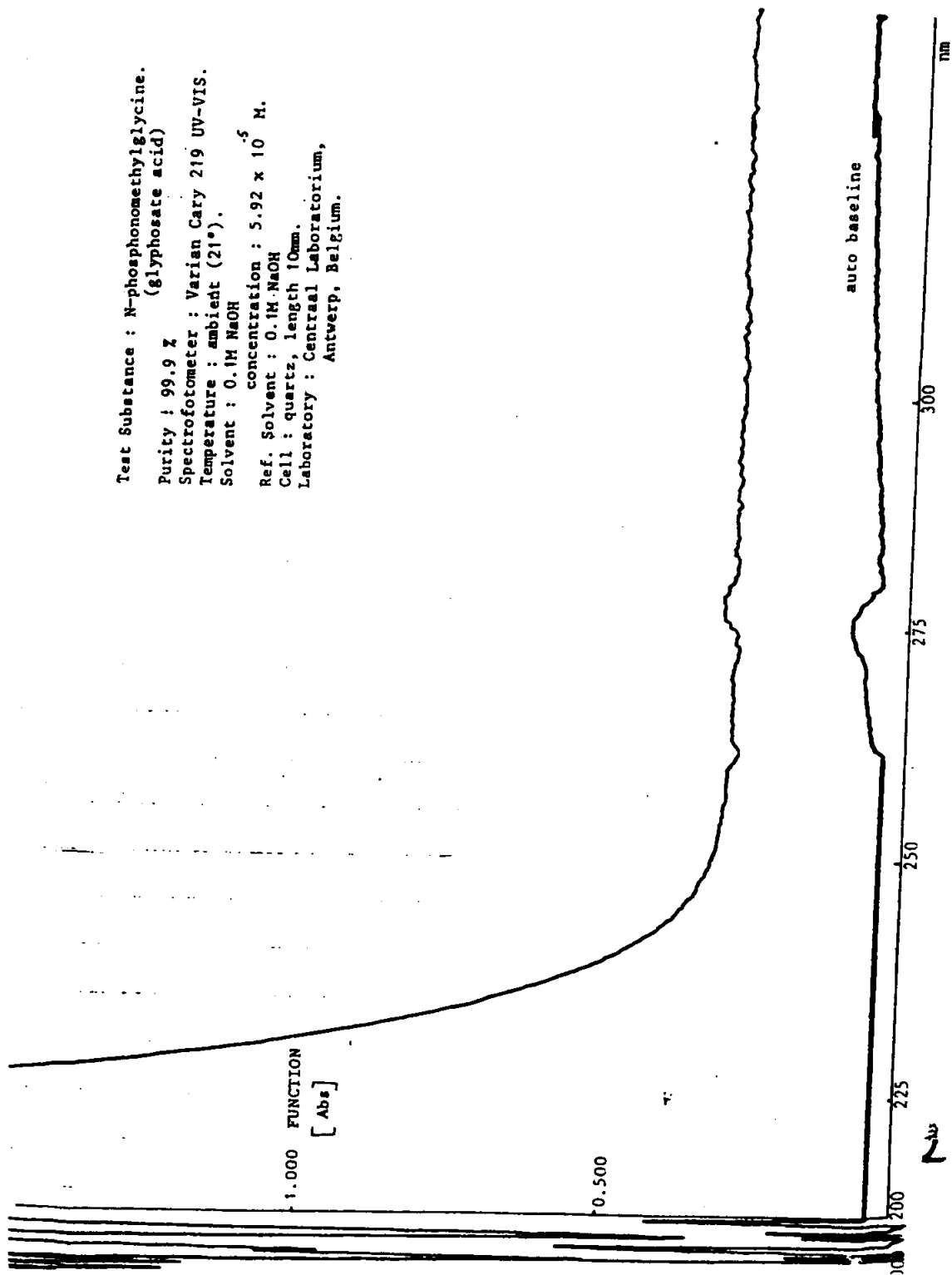


図2

Test Substance : N-phosphonomethylglycine.
(glyphosate acid)
Purity : 99.9 %
Spectrophotometer : Varian Cary 219 UV-VIS.
Temperature : ambient (21°).
Solvent : 0.1M HCl
concentration : 5.92 x 10⁻⁵ M.
Ref. Solvent : 0.1M HCl
Cell : quartz, length 10mm.
Laboratory : Centraal Laboratorium,
Antwerp, Belgium.

1.000 FUNCTION
Abs

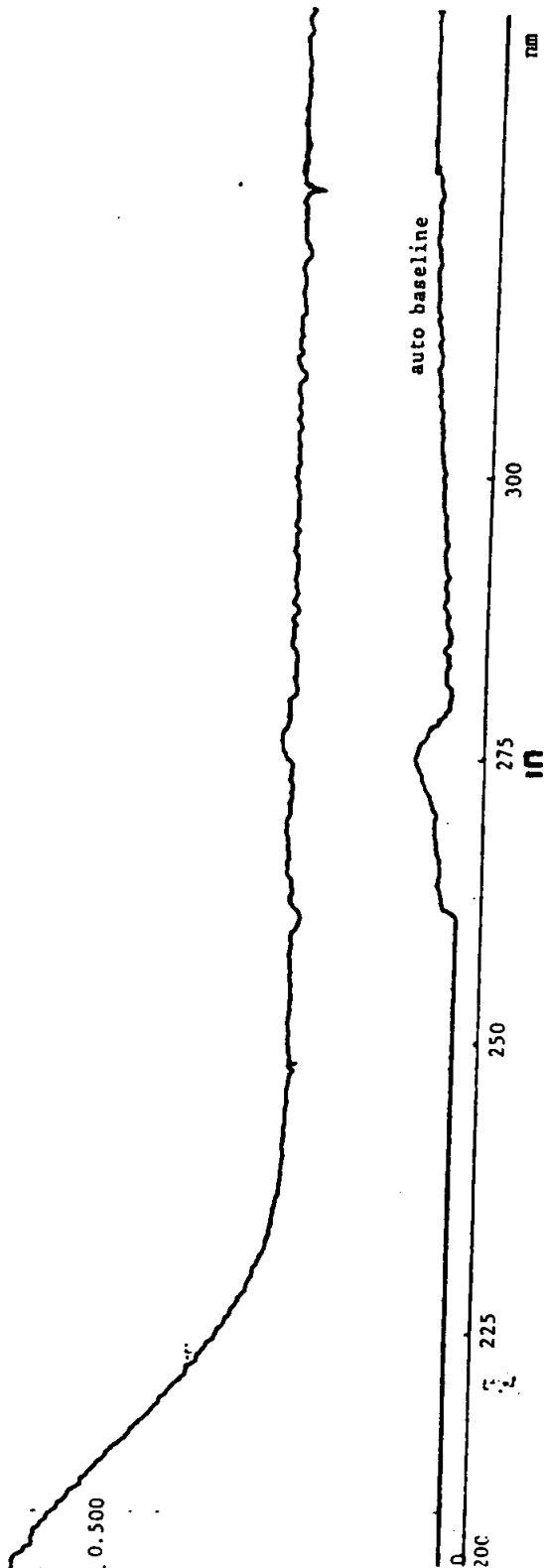
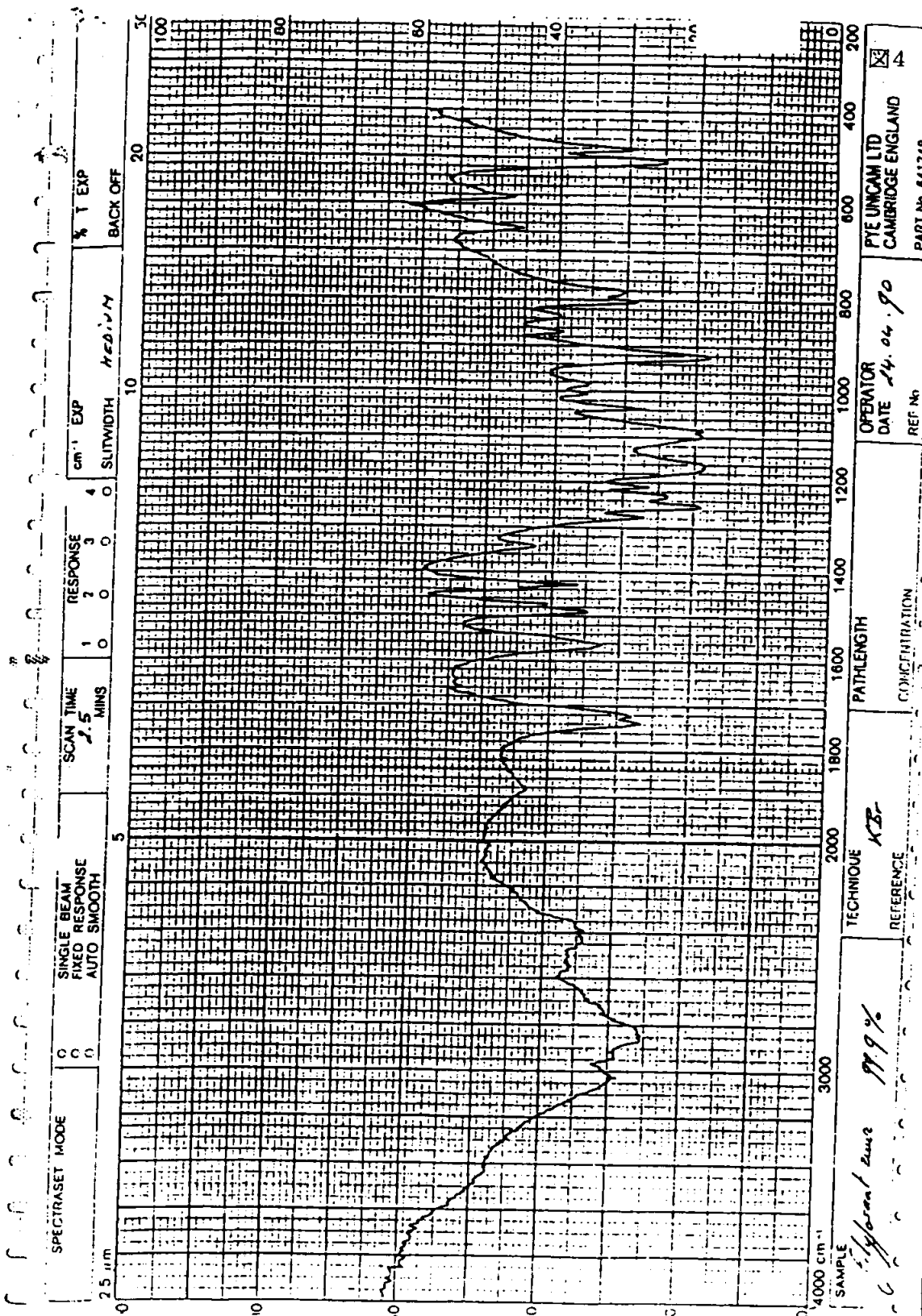


図3



☒5

T: TRIPLET

BRUKER AC 200
81 MHZ 31P SPECTRUM
GATED DECOUPLING MODE

SAMPLE: GLYPHOSATE 99.9%
CONCENTRATION: 4 GR/LITER
SOLVENT: D2O AT PH 5.4
INTERNAL REFERENCE: PHOSPHORIC ACID AT 0PPM
PROBE TEMP: AMBIENT

DATA LIST
NO. PROB: 01-013
INVENT: AUG
DATE: 10-9-88
RF0: 01-013
RF1: 01-013
RF2: 01-013
RF3: 01-013
RF4: 01-013
RF5: 01-013
RF6: 01-013
RF7: 01-013
RF8: 01-013
RF9: 01-013
RF10: 01-013
RF11: 01-013
RF12: 01-013
RF13: 01-013
RF14: 01-013
RF15: 01-013
RF16: 01-013
RF17: 01-013
RF18: 01-013
RF19: 01-013
RF20: 01-013
RF21: 01-013
RF22: 01-013
RF23: 01-013
RF24: 01-013
RF25: 01-013
RF26: 01-013
RF27: 01-013
RF28: 01-013
RF29: 01-013
RF30: 01-013
RF31: 01-013
RF32: 01-013
RF33: 01-013
RF34: 01-013
RF35: 01-013
RF36: 01-013
RF37: 01-013
RF38: 01-013
RF39: 01-013
RF40: 01-013
RF41: 01-013
RF42: 01-013
RF43: 01-013
RF44: 01-013
RF45: 01-013
RF46: 01-013
RF47: 01-013
RF48: 01-013
RF49: 01-013
RF50: 01-013
RF51: 01-013
RF52: 01-013
RF53: 01-013
RF54: 01-013
RF55: 01-013
RF56: 01-013
RF57: 01-013
RF58: 01-013
RF59: 01-013
RF60: 01-013
RF61: 01-013
RF62: 01-013
RF63: 01-013
RF64: 01-013
RF65: 01-013
RF66: 01-013
RF67: 01-013
RF68: 01-013
RF69: 01-013
RF70: 01-013
RF71: 01-013
RF72: 01-013
RF73: 01-013
RF74: 01-013
RF75: 01-013
RF76: 01-013
RF77: 01-013
RF78: 01-013
RF79: 01-013
RF80: 01-013
RF81: 01-013
RF82: 01-013
RF83: 01-013
RF84: 01-013
RF85: 01-013
RF86: 01-013
RF87: 01-013
RF88: 01-013
RF89: 01-013
RF90: 01-013
RF91: 01-013
RF92: 01-013
RF93: 01-013
RF94: 01-013
RF95: 01-013
RF96: 01-013
RF97: 01-013
RF98: 01-013
RF99: 01-013
RF100: 01-013

図6

.112.02
 ALL INTENSITY . 813 P . 11.0000 PP CS 1.0000
 INTENS. LINE . 800 WIDTH . 12221 BINS. LARG . 10023
 F1 . 1000.97 H1 . 300.0000 PPH F2 . 71.00 . 0100 PPH

F	LINE	FREQENCY	PPH	INTENSITY
1	3123	8432.071	172.2202	17.000 S
2	10487	3791.776	87.7096	1.001 T
3	11772	3046.616	51.0791	12.102 T
4	11791	2574.006	51.5367	12.644 T
5	12991	2344.134	47.6723	11.264 T
6	12277	2233.203	44.2048	10.100 T

S: SINGULET
T: TRIPLET

I
H
A

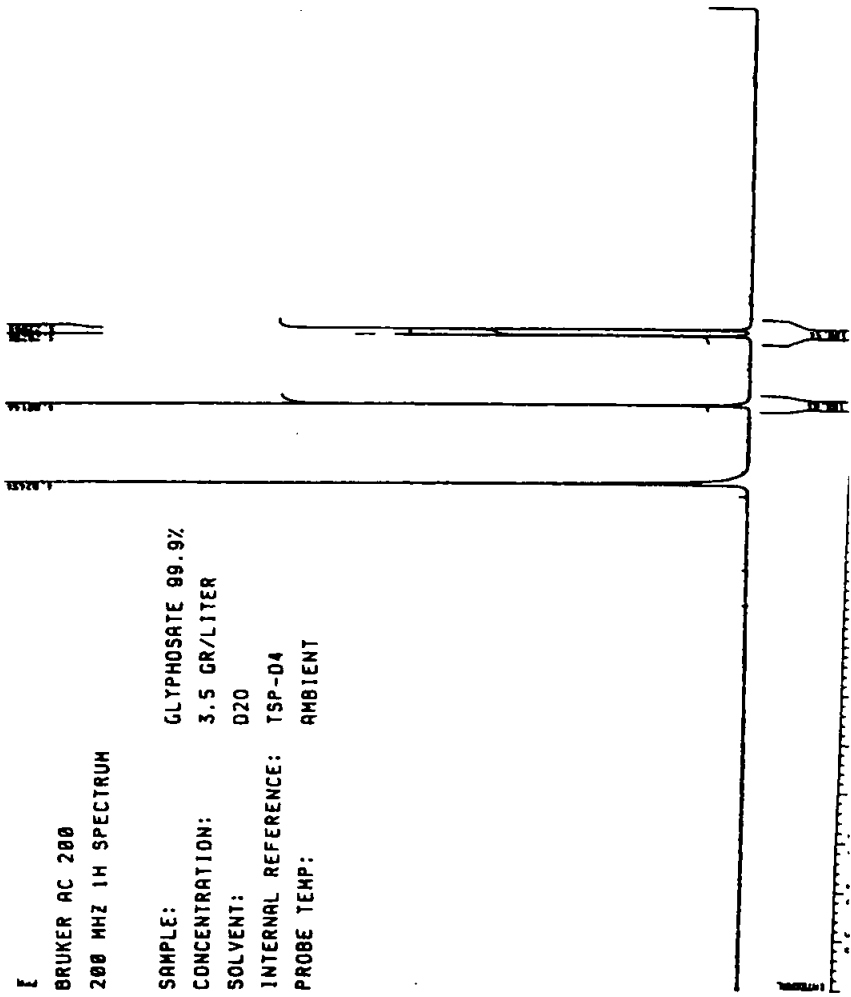
BRUKER AC 200
50 MHZ 13C SPECTRUM
GATED DECOUPLING MODE

SAMPLE: GLYPHOSATE 99.9%
 CONCENTRATION: 65.3 GR/LITER
 SOLVENT: D2O AT PH 5.4
 INTERNAL REFERENCE: P-DIOXANE AT 67.4PPH
 PROBE TEMP: AMBIENT

61713.005
 NUMBER: 000
 DATE: 10-0-80
 87 58.323
 88 58.327
 89 100.000
 90 32700.000
 91 32700.000
 92 32700.000
 93 11000.753
 94 11000.753
 95 5.0
 96 8.0
 97 1.376
 98 1.376
 99 1.376
 100 1.376
 101 1.376
 102 1.376
 103 1.376
 104 1.376
 105 1.376
 106 1.376
 107 1.376
 108 1.376
 109 1.376
 110 1.376
 111 1.376
 112 1.376
 113 1.376
 114 1.376
 115 1.376
 116 1.376
 117 1.376
 118 1.376
 119 1.376
 120 1.376
 121 1.376
 122 1.376
 123 1.376
 124 1.376
 125 1.376
 126 1.376
 127 1.376
 128 1.376
 129 1.376
 130 1.376
 131 1.376
 132 1.376
 133 1.376
 134 1.376
 135 1.376
 136 1.376
 137 1.376
 138 1.376
 139 1.376
 140 1.376
 141 1.376
 142 1.376
 143 1.376
 144 1.376
 145 1.376
 146 1.376
 147 1.376
 148 1.376
 149 1.376
 150 1.376
 151 1.376
 152 1.376
 153 1.376
 154 1.376
 155 1.376
 156 1.376
 157 1.376
 158 1.376
 159 1.376
 160 1.376
 161 1.376
 162 1.376
 163 1.376
 164 1.376
 165 1.376
 166 1.376
 167 1.376
 168 1.376
 169 1.376
 170 1.376
 171 1.376
 172 1.376
 173 1.376
 174 1.376
 175 1.376
 176 1.376
 177 1.376
 178 1.376
 179 1.376
 180 1.376
 181 1.376
 182 1.376
 183 1.376
 184 1.376
 185 1.376
 186 1.376
 187 1.376
 188 1.376
 189 1.376
 190 1.376
 191 1.376
 192 1.376
 193 1.376
 194 1.376
 195 1.376
 196 1.376
 197 1.376
 198 1.376
 199 1.376
 200 1.376
 201 1.376
 202 1.376
 203 1.376
 204 1.376
 205 1.376
 206 1.376
 207 1.376
 208 1.376
 209 1.376
 210 1.376
 211 1.376
 212 1.376
 213 1.376
 214 1.376
 215 1.376
 216 1.376
 217 1.376
 218 1.376
 219 1.376
 220 1.376
 221 1.376
 222 1.376
 223 1.376
 224 1.376
 225 1.376
 226 1.376
 227 1.376
 228 1.376
 229 1.376
 230 1.376
 231 1.376
 232 1.376
 233 1.376
 234 1.376
 235 1.376
 236 1.376
 237 1.376
 238 1.376
 239 1.376
 240 1.376
 241 1.376
 242 1.376
 243 1.376
 244 1.376
 245 1.376
 246 1.376
 247 1.376
 248 1.376
 249 1.376
 250 1.376
 251 1.376
 252 1.376
 253 1.376
 254 1.376
 255 1.376
 256 1.376
 257 1.376
 258 1.376
 259 1.376
 260 1.376
 261 1.376
 262 1.376
 263 1.376
 264 1.376
 265 1.376
 266 1.376
 267 1.376
 268 1.376
 269 1.376
 270 1.376
 271 1.376
 272 1.376
 273 1.376
 274 1.376
 275 1.376
 276 1.376
 277 1.376
 278 1.376
 279 1.376
 280 1.376
 281 1.376
 282 1.376
 283 1.376
 284 1.376
 285 1.376
 286 1.376
 287 1.376
 288 1.376
 289 1.376
 290 1.376
 291 1.376
 292 1.376
 293 1.376
 294 1.376
 295 1.376
 296 1.376
 297 1.376
 298 1.376
 299 1.376
 300 1.376
 301 1.376
 302 1.376
 303 1.376
 304 1.376
 305 1.376
 306 1.376
 307 1.376
 308 1.376
 309 1.376
 310 1.376
 311 1.376
 312 1.376
 313 1.376
 314 1.376
 315 1.376
 316 1.376
 317 1.376
 318 1.376
 319 1.376
 320 1.376
 321 1.376
 322 1.376
 323 1.376
 324 1.376
 325 1.376
 326 1.376
 327 1.376
 328 1.376
 329 1.376
 330 1.376
 331 1.376
 332 1.376
 333 1.376
 334 1.376
 335 1.376
 336 1.376
 337 1.376
 338 1.376
 339 1.376
 340 1.376
 341 1.376
 342 1.376
 343 1.376
 344 1.376
 345 1.376
 346 1.376
 347 1.376
 348 1.376
 349 1.376
 350 1.376
 351 1.376
 352 1.376
 353 1.376
 354 1.376
 355 1.376
 356 1.376
 357 1.376
 358 1.376
 359 1.376
 360 1.376
 361 1.376
 362 1.376
 363 1.376
 364 1.376
 365 1.376
 366 1.376
 367 1.376
 368 1.376
 369 1.376
 370 1.376
 371 1.376
 372 1.376
 373 1.376
 374 1.376
 375 1.376
 376 1.376
 377 1.376
 378 1.376
 379 1.376
 380 1.376
 381 1.376
 382 1.376
 383 1.376
 384 1.376
 385 1.376
 386 1.376
 387 1.376
 388 1.376
 389 1.376
 390 1.376
 391 1.376
 392 1.376
 393 1.376
 394 1.376
 395 1.376
 396 1.376
 397 1.376
 398 1.376
 399 1.376
 400 1.376
 401 1.376
 402 1.376
 403 1.376
 404 1.376
 405 1.376
 406 1.376
 407 1.376
 408 1.376
 409 1.376
 410 1.376
 411 1.376
 412 1.376
 413 1.376
 414 1.376
 415 1.376
 416 1.376
 417 1.376
 418 1.376
 419 1.376
 420 1.376
 421 1.376
 422 1.376
 423 1.376
 424 1.376
 425 1.376
 426 1.376
 427 1.376
 428 1.376
 429 1.376
 430 1.376
 431 1.376
 432 1.376
 433 1.376
 434 1.376
 435 1.376
 436 1.376
 437 1.376
 438 1.376
 439 1.376
 440 1.376
 441 1.376
 442 1.376
 443 1.376
 444 1.376
 445 1.376
 446 1.376
 447 1.376
 448 1.376
 449 1.376
 450 1.376
 451 1.376
 452 1.376
 453 1.376
 454 1.376
 455 1.376
 456 1.376
 457 1.376
 458 1.376
 459 1.376
 460 1.376
 461 1.376
 462 1.376
 463 1.376
 464 1.376
 465 1.376
 466 1.376
 467 1.376
 468 1.376
 469 1.376
 470 1.376
 471 1.376
 472 1.376
 473 1.376
 474 1.376
 475 1.376
 476 1.376
 477 1.376
 478 1.376
 479 1.376
 480 1.376
 481 1.376
 482 1.376
 483 1.376
 484 1.376
 485 1.376
 486 1.376
 487 1.376
 488 1.376
 489 1.376
 490 1.376
 491 1.376
 492 1.376
 493 1.376
 494 1.376
 495 1.376
 496 1.376
 497 1.376
 498 1.376
 499 1.376
 500 1.376
 501 1.376
 502 1.376
 503 1.376
 504 1.376
 505 1.376
 506 1.376
 507 1.376
 508 1.376
 509 1.376
 510 1.376
 511 1.376
 512 1.376
 513 1.376
 514 1.376
 515 1.376
 516 1.376
 517 1.376
 518 1.376
 519 1.376
 520 1.376
 521 1.376
 522 1.376
 523 1.376
 524 1.376
 525 1.376
 526 1.376
 527 1.376
 528 1.376
 529 1.376
 530 1.376
 531 1.376
 532 1.376
 533 1.376
 534 1.376
 535 1.376
 536 1.376
 537 1.376
 538 1.376
 539 1.376
 540 1.376
 541 1.376
 542 1.376
 543 1.376
 544 1.376
 545 1.376
 546 1.376
 547 1.376
 548 1.376
 549 1.376
 550 1.376
 551 1.376
 552 1.376
 553 1.376
 554 1.376
 555 1.376
 556 1.376
 557 1.376
 558 1.376
 559 1.376
 560 1.376
 561 1.376
 562 1.376
 563 1.376
 564 1.376
 565 1.376
 566 1.376
 567 1.376
 568 1.376
 569 1.376
 570 1.376
 571 1.376
 572 1.376
 573 1.376
 574 1.376
 575 1.376
 576 1.376
 577 1.376
 578 1.376
 579 1.376
 580 1.376
 581 1.376
 582 1.376
 583 1.376
 584 1.376
 585 1.376
 586 1.376
 587 1.376
 588 1.376
 589 1.376
 590 1.376
 591 1.376
 592 1.376
 593 1.376
 594 1.376
 595 1.376
 596 1.376
 597 1.376
 598 1.376
 599 1.376
 600 1.376
 601 1.376
 602 1.376
 603 1.376
 604 1.376
 605 1.376
 606 1.376
 607 1.376
 608 1.376
 609 1.376
 610 1.376
 611 1.376
 612 1.376
 613 1.376
 614 1.376
 615 1.376
 616 1.376
 617 1.376
 618 1.376
 619 1.376
 620 1.376
 621 1.376
 622 1.376
 623 1.376
 624 1.376
 625 1.376
 626 1.376
 627 1.376
 628 1.376
 629 1.376
 630 1.376
 631 1.376
 632 1.376
 633 1.376
 634 1.376
 635 1.376
 636 1.376
 637 1.376
 638 1.376
 639 1.376
 640 1.376
 641 1.376
 642 1.376
 643 1.376
 644 1.376
 645 1.376
 646 1.376
 647 1.376
 648 1.376
 649 1.376
 650 1.376
 651 1.376
 652 1.376
 653 1.376
 654 1.376
 655 1.376
 656 1.376
 657 1.376
 658 1.376
 659 1.376
 660 1.376
 661 1.376
 662 1.376
 663 1.376
 664 1.376
 665 1.376
 666 1.376
 667 1.376
 668 1.376
 669 1.376
 670 1.376
 671 1.376
 672 1.376
 673 1.376
 674 1.376
 675 1.376
 676 1.376
 677 1.376
 678 1.376
 679 1.376
 680 1.376
 681 1.376
 682 1.376
 683 1.376
 684 1.376
 685 1.376
 686 1.376
 687 1.376
 688 1.376
 689 1.376
 690 1.376
 691 1.376
 692 1.376
 693 1.376
 694 1.376
 695 1.376
 696 1.376
 697 1.376
 698 1.376
 699 1.376
 700 1.376
 701 1.376
 702 1.376
 703 1.376
 704 1.376
 705 1.376
 706 1.376
 707 1.376
 708 1.376
 709 1.376
 710 1.376
 711 1.376
 712 1.376
 713 1.376
 714 1.376
 715 1.376
 716 1.376
 717 1.376
 718 1.376
 719 1.376
 720 1.376
 721 1.376
 722 1.376
 723 1.376
 724 1.376
 725 1.376
 726 1.376
 727 1.376
 728 1.376
 729 1.376
 730 1.376
 731 1.376
 732 1.376
 733 1.376
 734 1.376
 735 1.376
 736 1.376
 737 1.376
 738 1.376
 739 1.376
 740 1.376
 741 1.376
 742 1.376
 743 1.376
 744 1.376
 745 1.376
 746 1.376
 747 1.376
 748 1.376
 749 1.376
 750 1.376
 751 1.376
 752 1.376
 753 1.376
 754 1.376
 755 1.376
 756 1.376
 757 1.376
 758 1.376
 759 1.376
 760 1.376
 761 1.376
 762 1.376
 763 1.376
 764 1.376
 765 1.376
 766 1.376
 767 1.376
 768 1.376
 769 1.376
 770 1.376
 771 1.376
 772 1.376
 773 1.376
 774 1.376
 775 1.376
 776 1.376
 777 1.376
 778 1.376
 779 1.376
 780 1.376
 781 1.376
 782 1.376
 783 1.376
 784 1.376
 785 1.376
 786 1.376
 787 1.376
 788 1.376
 789 1.376
 790 1.376
 791 1.376
 792 1.376
 793 1.376
 794 1.376
 795 1.376
 796 1.376
 797 1.376
 798 1.376
 799 1.376
 800 1.376
 801 1.376
 802 1.376
 803 1.376
 804 1.376
 805 1.376
 806 1.376
 807 1.376
 808 1.376
 809 1.376
 810 1.376
 811 1.376
 812 1.376
 813 1.376
 814 1.376
 815 1.376
 816 1.376
 817 1.376
 818 1.376
 819 1.376
 820 1.376
 821 1.376
 822 1.376
 823 1.376
 824 1.376
 825 1.376
 826 1.376
 827 1.376
 828 1.376
 829 1.376
 830 1.376
 831 1.376
 832 1.376
 833 1.376
 834 1.376
 835 1.376
 836 1.376
 837 1.376
 838 1.376
 839 1.376
 840 1.376
 841 1.376
 842 1.376
 843 1.376
 844 1.376
 845 1.376
 846 1.376
 847 1.376
 848 1.376
 849 1.376
 850 1.376
 851 1.376
 852 1.376
 853 1.376
 854 1.376
 855 1.376
 856 1.376
 857 1.376
 858 1.376
 859 1.376
 860 1.376
 861 1.376
 862 1.376
 863 1.376
 864 1.376
 865 1.376
 866 1.376
 867 1.376
 868 1.376
 869 1.376
 870 1.376
 871 1.376
 872 1.376
 873 1.376
 874 1.376
 875 1.376
 876 1.376
 877 1.376
 878 1.376
 879 1.376
 880 1.376
 881 1.376
 882 1.376
 883 1.376
 884 1.376
 885 1.376
 886 1.376
 887 1.376
 888 1.376
 889 1.376
 890 1.376
 891 1.376
 892 1.376

☑7

DATE: 10-0-88
RF: 200.133
P1: 200.130
P2: 200.130
P3: 200.130
P4: 200.130
P5: 200.130
P6: 200.130
P7: 200.130
P8: 200.130
P9: 200.130
P10: 200.130
P11: 200.130
P12: 200.130
P13: 200.130
P14: 200.130
P15: 200.130
P16: 200.130
P17: 200.130
P18: 200.130
P19: 200.130
P20: 200.130
P21: 200.130
P22: 200.130
P23: 200.130
P24: 200.130
P25: 200.130
P26: 200.130
P27: 200.130
P28: 200.130
P29: 200.130
P30: 200.130
P31: 200.130
P32: 200.130
P33: 200.130
P34: 200.130
P35: 200.130
P36: 200.130
P37: 200.130
P38: 200.130
P39: 200.130
P40: 200.130
P41: 200.130
P42: 200.130
P43: 200.130
P44: 200.130
P45: 200.130
P46: 200.130
P47: 200.130
P48: 200.130
P49: 200.130
P50: 200.130
P51: 200.130
P52: 200.130
P53: 200.130
P54: 200.130
P55: 200.130
P56: 200.130
P57: 200.130
P58: 200.130
P59: 200.130
P60: 200.130
P61: 200.130
P62: 200.130
P63: 200.130
P64: 200.130
P65: 200.130
P66: 200.130
P67: 200.130
P68: 200.130
P69: 200.130
P70: 200.130
P71: 200.130
P72: 200.130
P73: 200.130
P74: 200.130
P75: 200.130
P76: 200.130
P77: 200.130
P78: 200.130
P79: 200.130
P80: 200.130
P81: 200.130
P82: 200.130
P83: 200.130
P84: 200.130
P85: 200.130
P86: 200.130
P87: 200.130
P88: 200.130
P89: 200.130
P90: 200.130
P91: 200.130
P92: 200.130
P93: 200.130
P94: 200.130
P95: 200.130
P96: 200.130
P97: 200.130
P98: 200.130
P99: 200.130
P100: 200.130



F
BRUKER AC 200
200 MHZ 1H SPECTRUM

SAMPLE: GLYPHOSATE 99.9%
CONCENTRATION: 3.5 GR/LITER
SOLVENT: D2O
INTERNAL REFERENCE: TSP-D4
PROBE TEMP: AMBIENT

AGCLYPFHSE20 x1 896=1 18-SEP-90 13:47:02:18 70-E0 FB- 1.1
 BpM=168 I=922av Mz=828 TIC=16618000 SU Acnt:MONS SATO Sys:SYSTEMDEF
 GLYPMOSATE ACID (99.9%) - MATRIX GLYCEROL SUBTRACTED PTA 0 Cal:AGCSI

Mass	Abs. Mt	I Base	
59	146000	2	
63	169000	3	
79	189000	3	
80	124000	2	
89	125000	2	
91	656000	11	
94	159000	3	
110	426000	7	
122	148000	2	
123	200000	3	
124	164000	3	
132	153000	3	
135	178000	3	
167	188000	3	
168	6046000	100	M-H ⁺
169	262000	4	
171	143000	2	
202	340000	6	
259	174000	3	
260	1450000	24	M+Gly-H ⁺
261	155000	3	
279	219000	4	
294	122000	2	
337	997000	16	2M-H ⁺
352	410000	7	M+2Gly-H ⁺
444	180000	3	M+3Gly-H ⁺
506	152000	3	3M-H ⁺

File Text

System File Information

Data : AGCLYPFH Acquired at 13:47:48 on 18-SEP-90

Maximum Volts: 6000
 Instrument Mass Range (at IAV): 2294

Calibration (.CAL) File used was AGCSI
 Customer Account is MONS SATO
 Instrument Type is 70-E0

Accelerating Volts: 6000
 Scanning Sector: MAG
 High Mass: 1200
 Low Mass: 20
 F0/FAS Window High: 0
 F0/FAS Window Low: 0
 Mass Threshold for TIC, Base Intensity, Base Mass and
 Massmax TIC: 20
 Signal Threshold: 10
 Minimum Peak Width: 5
 Multiplet Threshold: 250
 Scan Time (seconds per decade): 3.00
 Inter-scan Delay (seconds): 1.00
 Solvent Delay (seconds): 0
 Centroid or Top ? CENTROID
 High Dynamic Range ? NO
 Hardware Tic ? NO
 Digital Scanner ? YES
 Scanning Mode: ANALOGUE
 Continuum or MCA ? NONE
 Resolution: 1000
 Scan Low: ED
 Run Duration (seconds): 5400

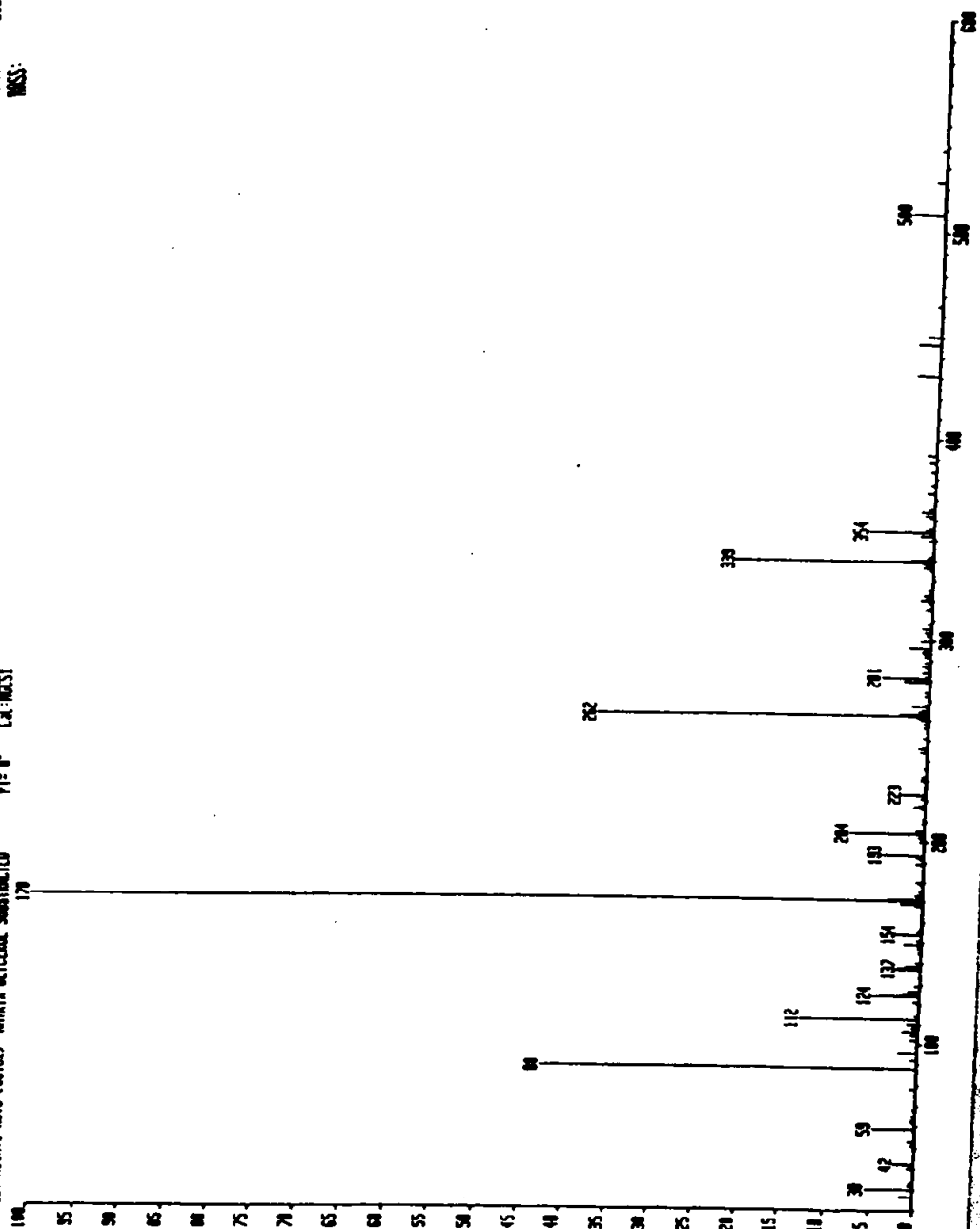
Ionisation Mode 1: FB-
 Ionisation Repeats: 0
 Ionisation Mode 2: ---
 Ionisation Repeats: 0
 Ionisation Mode 3: ---
 Ionisation Repeats: 0

3953000
179

MS:
IR:
NMR:

図9

ANALYSIS 11 04-2 10-SEP-90 0:01:34 70-10 10
DATA176 1:1.4v M=67 TIC=3953000 58 Acet:IONS SA10 Sep:SYSTEMT
GLYCOPIC ACID (30-SE)-MATRIX GLYCEROL SUBSTITUTED P1=0 CAL:MGESI



Mass	Abs. Mt	Z Base	
30	492000	5	
42	197000	2	
59	425000	5	
89	3961000	42	$Cl_2 - Cl - Cl_2 - COOH^+$
112	1195000	13	$H - Cl_2COOH + 2H^+$
124	459000	5	
137	220000	2	
138	214000	2	
154	239000	3	
169	197000	2	
170	9358000	100	$H + H^+$
171	342000	4	
193	194000	4	
204	738000	8	
223	205000	2	
262	3423000	37	$H + Cl_2 + H^+$
263	257000	3	
279	214000	2	
281	454000	5	
339	1973000	21	$2H + H^+$
339	1973000	21	
354	618000	7	$H + 2Cl_2 + H^+$
508	247000	3	$3H + H^+$

File Text

System File Information

Data : ACGLYPPF Acquired at 14:57:59 on 18-SEP-90

Maximum Volts: 5000
Instrument Mass Range (at IAV): 2284

Calibration (.CAL) File used was ACCE1
Customer Account is MONS SBT
Instrument Type is 70-EG

Accelerating Volts: 8000
Scanning Sector: MAG
High Mass: 1200
Low Mass: 20
F0/FAS Window High: 0
F0/FAS Window Low: 0
Mass Threshold for TIC, Base Intensity, Base Mass and
Maximum TIC: 20
Signal Threshold: 10
Minimum Peak Width: 6
Multiplet Threshold: 250
Scan Time (seconds per decade): 3.00
Inter-scan Delay (seconds): 1.00
Solvent Delay (seconds): 0
Centroid or top? CENTROID
High Dynamic Range? NO
Hardware TIC? NO
Digital Scanner? YES
Scanning Mode: ANALOGUE
Continuum or MCA? NONE
Resolution: 1000
Scan Law: ER
Run Duration (seconds): 5400

Ionisation Mode 1: FB+
Ionisation Repeats: 0
Ionisation Mode 2: ---
Ionisation Repeats: 0
Ionisation Mode 3: ---
Ionisation Repeats: 0

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本モンサント株式会社にある。

グリホサートの I R、NMR スペクトルにおけるピークの帰属およびMS の測定機器名について

平成 12 年 4 月

日本モンサント株式会社

(1) I R スペクトルにおけるピークの帰属

<u>吸収帯</u>	<u>対応する官能基あるいは化学結合</u>
3050 cm^{-1}	COOH 基由来の OH および-CH ₂ 基
2800 - 2900 cm^{-1}	NH 基由来の N
2500 - 2600 cm^{-1}	P-OH 結合
1720 - 1740 cm^{-1}	COOH 基
1560 cm^{-1}	P-NH 結合
1460 - 1475 cm^{-1}	C-H 結合
1420 - 1440 cm^{-1}	COOH 基
1260 - 1280 cm^{-1}	P=O 基
1080 -1100 cm^{-1}	NH 基由来の N
920 cm^{-1}	COOH 基

(2) NMR スペクトルにおけるピークの帰属

重水 (D₂O) 中 ¹H NMR スペクトル

内部シフト標準はテトラジュウテロジメチルシラペンタン酸ナトリウム塩(TSP-d₄, ASTM 標準品)。

<u>ppm</u>	<u>シグナルの帰属</u>
4.82	残存する水分
4.00	グリシル CH ₂ 基
3.29, 3.23	³¹ P と結合することによってダブルットになった メチレンホスホン酸 CH ₂ 基のプロトン

¹³C NMR スペクトル

重水 (D₂O) 中 pH5.4、サンプルの過熱を避けるためゲートモードでブロードバンド ¹H デカップリング。内部シフト標準は p-ジオキサン (水溶液について ASTM が推奨) を 67.4ppm に設定。

<u>ppm</u>	<u>シグナルの帰属</u>
172.2	グリシンのカルボキシル基の炭素
51.7, 51.5	³¹ P と結合することによってダブルットになったグリシン CH ₂ 基の炭素
47.0, 44.4	³¹ P と異核種結合することによってダブルットになった メチレンホスホン酸 CH ₂ 基の炭素

³¹P NMR スペクトル

重水 (D₂O) 中 pH5.4。ゲートモードで ¹H デカップリング。内部シフト標準はりん酸。

<u>ppm</u>	<u>シグナルの帰属</u>
8.6	分子中で化学的にユニークな ³¹ P 核種

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本モンサント株式会社にある。

(3) MSに使用した測定機器

VG Analytical 7070 EQ Mass Spectrometer (Manchester UK)

Fast Atom Bombardment Probe

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本モンサント株式会社にある。

3. 原体の成分組成（グリホサート）

<i>N</i> -（ホスホノメチル）グリシン	%（規格値）
原体混在物 硫酸、リン酸、水	%

注1) 有効成分 *N*-（ホスホノメチル）グリシンのイソプロピルアミン塩は、グリホサート（酸）をイソプロピルアミンと反応させた塩でこれは極めて吸湿性が高く、 溶液として製剤に使用されている。

有効成分 *N*-（ホスホノメチル）グリシンのアンモニウム塩はグリホサート（酸）をアンモニアと反応させた塩で 溶液または約 %の固体として製剤に使用されている。有効成分 *N*-（ホスホノメチル）グリシンのカリウム塩は約 %の水溶液として製剤に使用されている。

3. 原体の成分組成

区分	名 称		構造式	分子式	分子量	含有量 (%)	
	一般名	化学名				規格値	通常値又はレンジ
有効成分	グリホサート	N-(ホスホメチル) グリシン	$ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{HO}-\text{C}-\text{CH}_2-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{P}-\text{OH} \\ \parallel \\ \text{OH} \end{array} $	C ₃ H ₈ NO ₅ P	169.1	%	%
原体混合物							

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本モンサント株式会社にある。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本モンサント株式会社にある。

区分	名 称		構造式	分子式	分子量	含有量 (%)	
	一般名	化学名				規格値	通常値又はレンジ
原 体 混 合 物							

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本モンサント株式会社にある。

区分	名 称		構造式	分子式	分子量	含有量 (%)	
	一般名	化学名				規格値	通常値又はレンジ
原 体 混 合 物							

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本モンサント株式会社にある。

区分	名 称		構造式	分子式	分子量	含有量 (%)	
	一般名	化学名				規格値	通常値又はレンジ
原 体 混 合 物							

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本モンサント株式会社にある。

4. 製剤の組成

1) 41.0%液剤 (ラウンドアップ)	
グリホサートイソプロピルアミン塩	41.0%
水、界面活性剤 等	59.0%
2) 41.0%液剤 (ラウンドアップハイロード)	
グリホサートアンモニウム塩	41.0%
水、界面活性剤 等	59.0%
3) 66.0%水溶剤 (ラウンドアップドライ)	
グリホサートアンモニウム塩	66.0%
界面活性剤、色素 等	34.0%
4) 52.0%液剤 (ラウンドアップKロード)	
グリホサートカリウム塩	52.0%
水、界面活性剤 等	48.0%
5) 48.0%液剤 (ラウンドアップマックスロード)	
グリホサートカリウム塩	48.0%
水、界面活性剤 等	52.0%

Ⅲ. 生物活性

グリホサートに関する作用機構についてはかなり明確にされている。作用点については植物体内の芳香族アミノ酸生合成にあずかるシキミ酸経路においてホスホエノールピルビン酸 (PEP) とシキミ酸-3-リン酸から5-エノールピルボイルシキミ酸-3-リン酸 (EPSP) を産生する反応を触媒する EPSP シンターゼの阻害であることが定説となっている。以下に、マクロな作用機構とミクロな作用点の研究報告結果を要約する。

1. マクロな殺草機構

グリホサートは、生育している植物の緑色茎葉部を通じ植物体内にすみやかに吸収され、引き続き連続的に移行し、地上部はもとより根や地下茎などの地下部組織まで植物全体に移行分布してゆく。このグリホサートの移行分布は、生長生理活性の高い地上部の生長部位と地下部にとくに多く集積される。植物全体に移行分布した本剤は、それぞれの部位で後述のミクロな殺草機構により、植物全体を枯死に至らしめる。

グリホサートの殺草作用における最大の特性は、地上部の緑色茎葉部を通じて地下部へ多く移行集積し、地下部組織を含め植物全体を枯死させることである。このことは、多年生雑草や雑灌木類などの根絶防除における不可欠の特性となっている。植物体内における本剤の地下部指向性の移行作用は、植物体内の光合成産物の流れと密接な関係があり、篩部の流れに乗って移行していくとされている。特にその地下部移行量は植物の生育時期と大きな関連があり、地下部組織への光合成産物の移行貯蔵の最も盛んな時期が最も多いと報告されている。

グリホサートの可視的な殺草作用の進展は、一般にまず植物体がしおれ、生育停止し、頂端生長部の黄化やクロロシスが生じ、その後、褐色化が全体に進み、同時に地下部組織も破壊し、植物体全体が枯死する。殺草作用の完成は、一年生植物では約 4~7 日、多年生植物では約 14~30 日程度である。本剤の殺草作用は、ほとんどすべての植物に発揮され、非選択的である。なお、グリホサートは土壌表面に落下接触すると直ちに吸着不活性化され、土壌を介しての殺草作用は持たない。

2. ミクロな殺草作用点の機構

グリホサートのミクロな殺草作用点の機構：電子顕微鏡による微細構造の観察によれば、*Prosopis uniflora* (メスキート (マメ科牧草))、*Cyperus rotundus* (ハマスゲ類) 及び *Lemnagibba* (ウキクサ) の茎をグリホサート処理すると葉緑体の膨張と破壊にともない、タンパク質合成に重要な役割を果たす粗面小胞体 (RER) の膨張がみられ、またウキクサでは細胞壁の異常なわん曲が認められている。

本剤の生理化学的作用機作の分野で最初に報告を出している Jaworski (1972) によれば、グリホサートによりシキミ酸の増加が観察され、芳香族アミノ酸を合成するシキミ酸経路に関与するコリスミン酸ムターゼ及び、プレフェン酸デヒドロゲナーゼの阻害が示唆されている。

シキミ酸経路では、生体に不可欠なトリプトファン、フェニルアラニン、チロシンという芳香族アミノ酸が合成される。しかも植物の物質代謝の中でのシキミ酸経路の重要性は、ここで合成された芳香族アミノ酸がタンパク質の構成要素となっていくばかりでなく、さらに二次代謝の根源物質として多くの重要な生理活性物質にかかわっているということである。たとえば、植物ホルモン (IAA、GA、ABA など) をはじめク

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本モンサント株式会社にある。

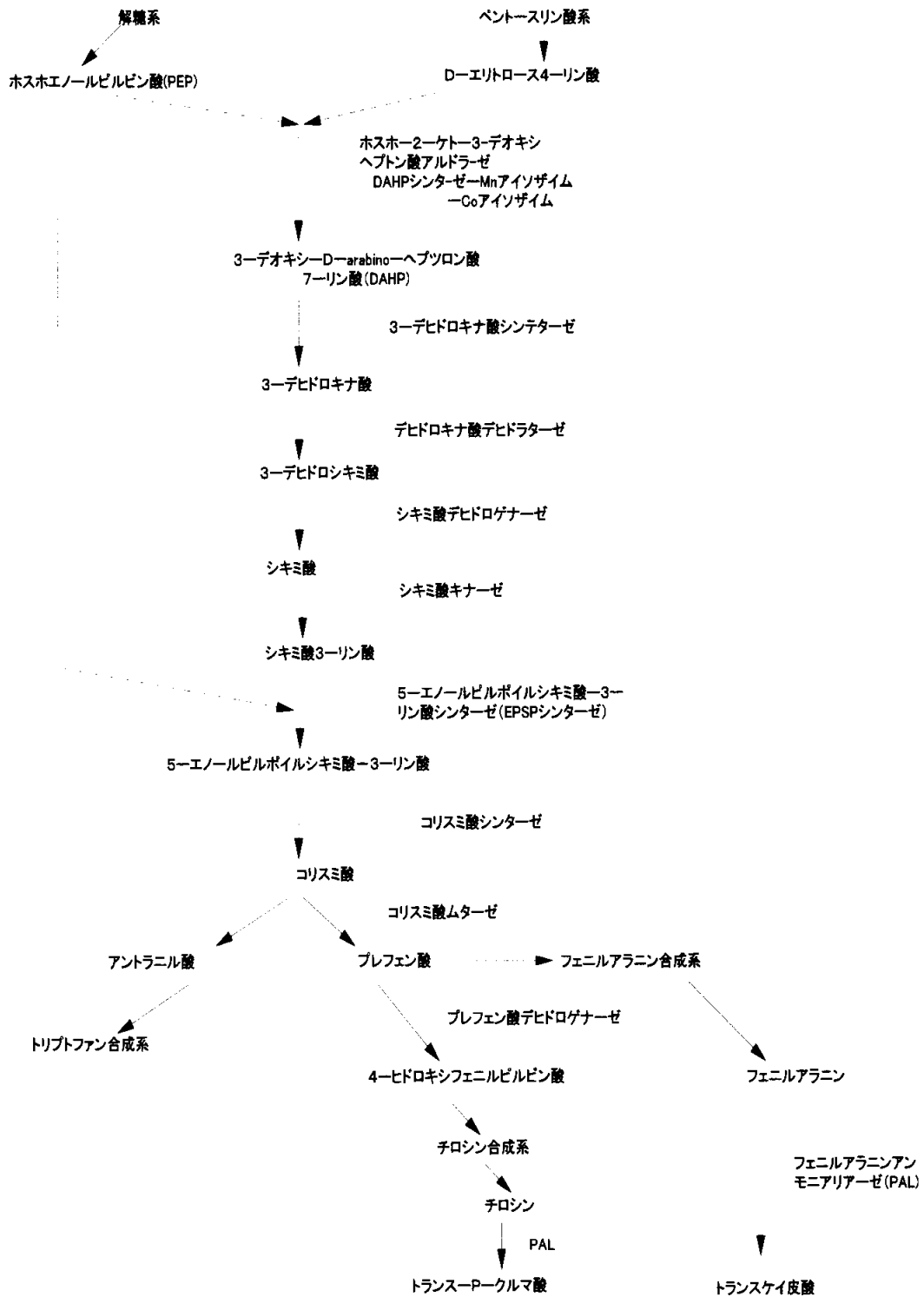
マリニン類、リグニン類やタンニン類、色素類はすべてこの経路を経て合成されている。最近の知見によれば、グリホサートは、このシキミ酸経路から生じたフェニルアラニンをフェニルプロパノイドへ代謝する律速酵素とみられ、植物の生理化学的作用に劇的変動をもたらす PAL (フェニルアラニンアンモニアリアーゼ) の活性を高めることによって、芳香族アミノ酸の欠乏と有害のフェノール類を増加させていることが示唆されている (Duke, Hoagland, 1977, Hoagland, Duke, 1980, 1982)。

一方、PAL 活性が阻害されたという報告もあるが (石倉ら、1984)、これはフェニルアラニンの添加により打ち消されるため直接の阻害効果ではないと考えられる (石倉ら、1986)。また Mousdale と Coggins (1984)、Rubin ら (1984) 及び Steinrucken と Amrhein (1980、1984) はシキミ酸からコリスミン酸へ至る系の律速酵素 5-エノールピルボイルシキミ酸-3-リン酸シンターゼ (EPSP シンターゼ) がグリホサートにより阻害されることを報告している。彼らはグリホサートによるシキミ酸の蓄積は EPSP シンターゼの阻害によるもので、しかも前駆体 3-デオキシ-D-arabino-ヘプトロン酸-7-リン酸 (DAHP) 合成酵素-Mn アイソザイム及び-Co アイソザイムのうち-Mn アイソザイムがグリホサートによる阻害を受けないためであるとしている。

グリホサートが高等植物のタンパク質合成や生理活性を持つ二次代謝産物の生合成の鍵となっている部分に激しい変化を与え、植物体を死に導いていると考えられる。

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任は日本モンサント株式会社にある。

図 シキミ酸経路



参 考 文 献

- Jaworski, E.G. (1972) Mode of action of N-phosphonomethyl glycine: Inhibition of aromatic amino-acid biosynthesis J. Agr Food Chem. 20: 1195-1198
- Duke, S.O. and Hoagland, R.E. (1978) Effects of glyphosate on metabolism of phenolic compounds - I. Induction of phenylalanine ammonia lyase activity in dark grown maize roots Plant Sci. Letters 11:185-190
- Duke, S.O. and Hoagland, R.E. (1979) Glyphosate and light effects on the induction of phenylalanine ammonia lyase activity in cotton and soybean seedlings WSSA Abstr. 202
- Amrhein, N., B. Deus, P.Gehrke and C.H.Steinrucken (1980) The site of the inhibition of the shikimate pathway by glyphosate II. Interference of glyphosate with chorismate formation in vivo and in vitro. Plant Physiol. 66:830-834.
- Steinrucken, H.C. and Amrhein, N. (1980) The herbicide glyphosate is a potent inhibitor of 5-enolpyruvylshikimate acid-3-Phosphate synthase. Biochem. Biophys. Res. Commun. 94:1207-1212.
- Duke, S.O., R.E. Hoagland and C.D.Elmore (1980) Effects of glyphosate on metabolism of phenolic compounds V. L- α -Aminoxy- β -phenylpropionic acid and glyphosate effects on phenylalanine ammonia-lyase in soybean seedlings. Plant Physiol. 65: 17-21
- Hoagland, R.E. and S.O.Duke (1982) Effects of glyphosate on metabolism of phenolic compounds VIII. Comparison of the effects of aminoxyacetate and glyphosate. Plant Cell Physiol. 23: 1081-1088.
- Ishikura, N. and Y. Takeshima (1984) Effects of glyphosate on caffeic acid metabolism in Perilla cell suspension cultures. Plant Cell Physiol. 25: 185-189.
- Rubbin, J.L., C.G. Gaines and R.A. Jensen (1984) Glyphosate inhibition of 5-enolpyruvylshikimate 3-phosphate synthase from suspension-cultured cells of *Nicotiana glauca*. Plant Physiol. 75: 839-845.
- Ishikura, N, S. Teramoto, Y. Takeshima and S. Mitsui (1986) Effects of Glyphosate on the Shikimate Pathway and Regulation of Phenylalanine Ammonia-lyase in *Cryptomeria japonica* and *Perilla frutescens* Cell Suspension Cultures. Plant Cell Physiol. 27(4): 677-684.