

試験	標識体	投与量 ²⁾	試料	親化合物 ³⁾	代謝物
			腎臓	0.93~1.2	LA3⑥(0.04~0.05)、LA3⑦(0.02~0.04)、 LA3③(0.02~0.03)、LA3②+④(0.01~0.02)、 1種の未同定代謝物(0.02)
			肝臓	7.1~7.4	LA3⑥(0.37~0.43)、LA3⑦(0.33~0.34)、 LA3②+④(0.10~0.26)、LA3③(0.14~0.17)、 1種の未同定代謝物(0.16~0.31)
			脂肪	97.3~98.1	LA3②+⑥(1.2~1.9)、 1種の未同定代謝物(0.87)

注) - : 検出されず

- 1) 血漿、脂肪：総残留放射能 (TRR) に対する割合 (%)
- 2) 単位は、mg/kg 体重
- 3) LA4 または LA3
- 4) 糞由来の LA4 が混入したと考えられる。

②反復経口投与

体内分布試験[1. (2)②]及び排泄試験[1. (4)①b.]での尿、糞、血漿、腎、肝及び脂肪における代謝物同定・定量試験が実施された。

尿、糞、血漿及び組織における代謝物は表 11 に示されている。

結果は単回経口投与試験の結果と同様であり、反復経口投与による影響はみられなかった。尿中放射能を除き、各試料中放射能の主成分は親化合物 (LA4 または LA3) であり、主要代謝物は LA4 (LA3) -⑥及び LA4 (LA3) -⑦であった。反復投与における代謝経路は 26、27 及び 30 位の酸化、オキシム部位の異性化及び側鎖部分のエステル結合の加水分解と考えられ、単回経口投与時との違いはみられなかった。(参照 3)

表 11 尿、糞、血漿及び組織における代謝物 (反復経口投与、%TAR¹⁾)

標識体	投与量 ²⁾	試料	親化合物 ³⁾	代謝物
[ben- ¹⁴ C] LA4	1	尿	-	⑨(29.9~31.4)、⑩(27.4~29.9)、 ⑩(23.5~23.6)、⑪(12.4~14.8)、 1種の未同定代謝物(1.5)
		糞	79.9~83.5	LA4⑥(2.6~3.0)、LA4③(1.2~2.1)、 LA4②+④(1.3~1.9)、LA4⑧(1.0~1.6)、 LA4⑦(0.91~1.5)、 1種の未同定代謝物(0.72~1.1)
		血漿	77.0~77.9	LA4⑦(4.8~5.3)、LA4③(3.9~4.7)、 LA4⑥(3.7~4.0)、LA4②+④(2.9~3.5)、 4種の未同定代謝物(0.48~1.8)
		腎	81.9~88.0	LA4⑥(4.1~4.7)、LA4⑦(3.3)、 LA4②+④(1.2~3.3)、LA4③(1.1~1.5)、 3種の未同定代謝物(0.37~0.84)

標識体	投与量 ²⁾	試料	親化合物 ³⁾	代謝物
		肝	77.5~82.5	LA4⑥(4.8~5.2)、LA4②+④(2.2~4.5)、 LA4⑦(2.8~2.9)、LA4③(1.6~2.0)、 3種の未同定代謝物(0.33~1.3)
		脂肪	97.6~98.0	1種の未同定代謝物(1.4~1.7)
[ben- ¹⁴ C] LA3	0.5	尿	—	③(35.1~42.5)、⑩(21.9~22.9)、 ⑨(16.8~17.6)、⑪(12.0~18.1)、 1種の未同定代謝物(2.6以下)
		糞	72.5~73.6	LA3⑥(5.4~5.8)、LA3⑦(4.0~4.2)、 LA3②+④(1.5~1.7)、LA3③(1.1~1.3)、 2種の未同定代謝物(0.96~2.0)
		血漿	84.5~86.9	LA3②+④(4.7~5.7)、LA3⑦(3.4~3.8)、 LA3⑥(1.8~2.6)、1種の未同定代謝物(1.1)
		腎	89.0~89.1	LA3⑦(2.9~3.4)、LA3⑥(2.6~3.2)、 LA3②+④(1.9~3.0)
		肝	88.2~88.9	LA3②+④(2.0~3.1)、LA3⑥(2.2~2.9) LA3⑦(2.3~2.9)
		脂肪	97.7~98.4	1種の未同定代謝物(1.1~1.5)

注) — : 検出されず

1) 血漿、脂肪 : %TRR 2) 単位は、mg/kg 体重/日 3) LA4 または LA3

(4) 排泄

①尿及び糞中排泄

a. 単回経口投与

Fischer ラット (一群雌雄各 3~5 匹) を用い、試験区分[A]~[F]に準じて、分布試験が実施された。

24 及び 168 時間後の尿及び糞中排泄率は、表 12 に示されている。

標識位置、投与量及び性別にかかわらず、いずれの投与群も投与放射能の大部分は糞中に排泄された。投与 168 時間後において、総投与放射能 (TAR) の 4.1~29.9 %が体内に残存した。

表 12 尿及び糞中排泄率 (単回経口投与、%TAR)

標識体	[ben- ¹⁴ C]LA4							
	1 mg/kg 体重				10 mg/kg 体重			
投与量	雄		雌		雄		雌	
性別	雄		雌		雄		雌	
試料	尿	糞	尿	糞	尿	糞	尿	糞
24 時間後	0.74	47.1	0.73	57.1	0.75	46.0	0.70	43.3
168 時間後	1.1	85.4	1.1	91.3	1.3	76.4	1.1	91.8
標識体	[mac- ¹⁴ C]LA4							
投与量	1 mg/kg 体重				10 mg/kg 体重			

性別	雄		雌		雄		雌	
試料	尿	糞	尿	糞	尿	糞	尿	糞
24 時間後	0.07	55.1	0.03	61.5	0.04	57.8	0.03	54.6
168 時間後	0.20	81.9	0.08	85.3	0.16	80.3	0.07	84.8
標識体	[ben- ¹⁴ C]LA3							
投与量	0.5 mg/kg 体重				5 mg/kg 体重			
性別	雄		雌		雄		雌	
試料	尿	糞	尿	糞	尿	糞	尿	糞
24 時間後	1.2	35.1	1.1	39.7	1.2	18.7	1.2	9.06
168 時間後	1.6	76.2	1.5	87.2	1.7	63.2	1.9	68.6

注)168 時間後の尿サンプルにはケージ洗浄液を含む。

b. 反復経口投与

Fischer ラット (一群雌雄各 3 匹) を用い、試験区分[G]及び[H]に準じて、排泄試験が実施された。

尿及び糞中排泄率は表 13 に示されている。

標識位置、投与量、性別にかかわらず、投与放射能の大部分は糞中に排泄され、最終投与後 21 日の尿中排泄量は 2.3% TAR 以下であった。投与終了後も放射能の排泄は継続し、投与後 21 日で尿糞中の排泄量は 94.7~98.7% TAR に達した。

表 13 尿及び糞中排泄率 (反復経口投与、%TAR)

標識体	[ben- ¹⁴ C]LA4				[ben- ¹⁴ C]LA3				
投与量	1 mg/kg 体重/日				0.5 mg/kg 体重/日				
性別	雄		雌		雄		雌		
試料	尿	糞	尿	糞	尿	糞	尿	糞	
投 与 後 日 数	1 日	1.33	76.6	1.19	81.2	2.02	68.0	1.68	73.4
	7 日	1.43	86.0	1.28	89.5	2.17	84.1	1.82	88.4
	21 日	1.50	93.3	1.29	93.4	2.25	94.5	1.86	96.9

c. 静脈内投与

Fischer ラットを用い、試験区分[G]及び[H]に準じて、排泄試験が実施された。

投与後 24 及び 168 時間の尿及び糞中排泄率は、表 14 に示されている。

静脈内投与の場合も経口投与と同様に、投与された大部分の放射能は糞中に排泄された。投与 168 時間後の体内残量が多くなったのは、投与部位である尾での高い放射能残留がみられたため、すべてが血流に移行しきれずに、投与部位付

近の組織に留まったためと考えられた。

表 14 尿及び糞中排泄率 (単回静脈内投与、%TAR)

標識体		[ben- ¹⁴ C]L.A4			
投与量		1 mg/kg 体重			
性別		雄		雌	
試料		尿	糞	尿	糞
投与後 時間	24 時間	0.38	4.1	0.45	7.8
	168 時間	1.2	60.8	1.3	64.3
体内残量		31.1		25.3	

注) 168 時間後の尿サンプルにはケージ洗浄液を含む。

②胆汁中排泄

胆管カニユーレを挿入した Fischer ラット (一群雌雄各 3 匹) を用い、試験区分 [I]~[L] に準じて、胆汁中排泄試験が実施された。

投与後 48 時間の胆汁、尿及び糞中排泄率は表 15 に示されている。胆汁中に排泄された放射能は [ben-¹⁴C]L.A4 投与群で 1.0~4.5%TAR、[ben-¹⁴C]L.A3 投与群で 0.3~1.9%TAR であった。本試験では胆管カニユーレ挿入ラットをケージに固定したため、摂餌量及び糞の排泄量自体が少なく、糞中への放射能排泄が少なくなったと考えられた。(参照 2)

表 15 投与後 48 時間の胆汁、尿及び糞中排泄率 (%TAR)

標識体	[ben- ¹⁴ C]L.A4			
	1 mg/kg 体重		10 mg/kg 体重	
性別	雄	雌	雄	雌
胆汁	4.5	1.2	1.2	1.0
尿	2.4	0.42	1.0	0.44
糞	9.6	<0.01	6.4	<0.01
標識体	[ben- ¹⁴ C]L.A3			
投与量	0.5 mg/kg 体重		5 mg/kg 体重	
性別	雄	雌	雄	雌
胆汁	1.9	1.5	0.41	0.28
尿	2.1	0.82	0.47	0.62
糞	10	4.4	0.54	0.65

2. 植物体内運命試験

(1) 茶

乳剤に調製した各種標識体について、[ben-¹⁴C]L.A4 は 70 g ai/ha、[mac-¹⁴C]L.A4 は 59.5 g ai/ha、[ben-¹⁴C]L.A3 は 31.5 g ai/ha の処理量で茶（品種：やぶきた）の葉に塗布し、植物体内運命試験が実施された。

茶は温室内で栽培され、[ben-¹⁴C]L.A4 及び[ben-¹⁴C]L.A3 処理区では処理 0、1、3、7、14 及び 28 日（摘採期）後に、また[mac-¹⁴C]L.A4 処理区では処理後 0、7、14 及び 28 日後に葉を採取し、試料とした。放射能の移行性を確認するため、処理した茶樹の一部の葉には検体を塗布せず無処理区とし、28 日後に採取した。

茶葉試料中残留放射能濃度は表 16 に示されている。各処理区における残留放射能濃度（洗浄液及び抽出液の含量）は経時的な減少が認められた。また、葉内部への移行は経時的に増加した。これらの変化に標識位置等による差は認められなかった。

表 16 茶葉試料中残留放射能濃度 (mg/kg)

標識体 (処理量)	[ben- ¹⁴ C]L.A4、 (70 g ai/ha)		[mac- ¹⁴ C]L.A4 (59.5 g ai/ha)		ben- ¹⁴ C-L.A3 (31.5 g ai/ha)	
	洗浄液	抽出液	洗浄液	抽出液	洗浄液	抽出液
処理 0 日後	3.68(98.4)	0.061(1.6)	8.27(100)	—	5.41(100)	—
7 日	3.53(84.2)	0.56(12.8)	5.90(95.7)	0.197(3.2)	3.30(95.0)	0.154(4.5)
28 日	0.84(61.5)	0.38(26.2)	3.34(81.4)	0.443(11.3)	2.58(81.2)	0.491(15.8)

注) () 内は%TRR、—: 検出されず

各標識体を処理した茶樹における無処理葉の、処理 28 日後における放射能濃度はいずれも 0.005 mg/kg 未満であり、放射能の移行は認められなかった。

親化合物はいずれの標識体処理においても処理 0 日後に最も高濃度に存在し、3.59~8.02 mg/kg (95.9~98.6%TRR) であったが、処理 7 日後には 0.181~0.97 mg/kg (4.6~15.7%TRR)、処理 28 日後には 0.013~0.029 mg/kg (0.3~1.8%TRR) となった。処理 7 日後にはいずれの標識体処理区においても極性代謝物群（多成分で微量の代謝物群）で放射能濃度が最も高くなり、処理 7 日後で 1.44~2.89 mg/kg (41.6~61.3%TRR)、28 日後で 0.95~3.64 mg/kg (63.5~89.2%TRR) となった。

各標識体処理区の葉において、親化合物の他同定された代謝物は、[ben-¹⁴C]L.A4 及び[ben-¹⁴C]L.A3 処理で代謝物 L.A4 (L.A3) -②、⑤、⑫、⑨、⑩、[mac-¹⁴C]L.A4 処理では L.A4-②、⑤、⑫であった。このうち代謝物②は[ben-¹⁴C]L.A4 処理区では処理 3 日後に最高値 0.268 mg/kg (10.3%TRR)、[mac-¹⁴C]L.A4 処理区では処理 7 日後に最高値 1.20 mg/kg (19.3%TRR)、[ben-¹⁴C]L.A3 処理区では処理 3 日後に最高値 0.758 mg/kg (22.4%TRR) を示し、また、代謝物⑩は[ben-¹⁴C]L.A4 処理区

では処理 7 日後に最高値 0.735 mg/kg (15.1%TRR)、[ben-¹⁴C]L.A3 処理区で処理 28 日後に最高値 0.647 mg/kg (20.6%TRR) を示した。その他の代謝物はいずれの標識体処理及び時期においても 10%TRR 未満であった。(参照 7)

(2) みかん

乳剤に調製した各種標識体について、[ben-¹⁴C]L.A4 または [mac-¹⁴C]L.A4 は 210 g ai/ha、[ben-¹⁴C]L.A3 は 64 g ai/ha の処理量で温州みかんの葉及び果実に塗布し、植物体内運命試験が実施された。

みかんは温室内で栽培され、[ben-¹⁴C]L.A4 及び [ben-¹⁴C]L.A3 処理区では処理 0、1、3、7、14、30 及び 56 日 (収穫期) 後に、また、[mac-¹⁴C]L.A4 処理区では処理後 0 及び 56 日後に葉及び果実を採取し、試料とした。検体の移行性を確認するため、処理したみかん樹の一部の葉及び果実には放射能を塗布せず無処理区とした。

みかん試料中残留放射能濃度は表 17 に示されている。

葉では表面 (洗浄液) における放射能濃度は、すべての標識体処理区で経時的に減少した。一方、葉抽出液中の放射能濃度は経時的に増加し、葉内部への移行が認められた。これらの変化に標識位置等による差は認められなかった。

表 17 みかん試料中残留放射能濃度 (mg/kg)

標識体 (処理量)	[ben- ¹⁴ C]L.A4 (210 g ai/ha)		[mac- ¹⁴ C]L.A4 (210 g ai/ha)		[ben- ¹⁴ C]L.A3 (64 g ai/ha)	
	葉	果実	葉	果実	葉	果実
処理 0 日後	6.67(100)	0.757(100)	6.45(100)	0.726(100)	3.82(100)	0.383(100)
7 日	5.81(80.4)	0.894(88.8)	/		2.22(84.0)	0.343(96.5)
56 日	3.35(62.7)	0.339(81.9)	5.77(81.5)	0.484(87.3)	1.48(66.7)	0.125(87.2)

注) () 内は%TRR、斜線: 試料採取せず

果実では処理 56 日後においても、いずれの標識体処理区も果実中の放射能の 97.3%TRR 以上は果皮に分布し、果肉への移行はわずかであった。

各標識体を処理したみかん樹における無処理の葉及び果実の処理 56 日後における放射能濃度はいずれも 0.002 mg/kg 未満であり、放射能の移行は認められなかった。

処理葉では、3 種の標識体処理区における親化合物は処理 0 日後で 3.75~6.17 mg/kg (89.1~98.1%TRR) であったが、処理 56 日後には 0.002~0.014 mg/kg (0.06~0.22%TRR) となった。処理 56 日後最も放射能濃度が高かったのは極性代謝物群であり、1.06~5.32 mg/kg (67.8~92.3%TRR) であった。また、各標識体処理区で、極性代謝物群に分布した放射能濃度は、最大で 2.27~5.32 mg/kg (85.3~88.1%TRR) に達した。各標識体処理区の葉において、親化合物の他同定された代

代謝物は、[ben-¹⁴C]L.A4 及び[ben-¹⁴C]L.A3 処理区で代謝物 L.A4 (L.A3) -②、⑤、⑨、⑩、⑫、[mac-¹⁴C]L.A4 処理区では L.A4-②、⑤、⑫であった。このうち代謝物②は、[ben-¹⁴C]L.A4 処理区及び[ben-¹⁴C]L.A3 処理区で、処理 1 日後にそれぞれ最高値 0.730 及び 0.369 mg/kg (9.8 及び 11.6%TRR) を示し、[mac-¹⁴C]L.A4 処理区では、処理 0 日後の 0.131 mg/kg (2.0%TRR) が最高値であった。また、代謝物⑩は処理 0～56 日後までに[ben-¹⁴C]L.A4 処理区では 0.058～0.736 mg/kg (0.87～18.2%TRR)、[ben-¹⁴C]L.A3 処理区で 0.080～0.218 mg/kg (3.8～14.7%TRR) を示し、いずれも処理 56 日後に存在比が最も大きかった。その他の代謝物は、いずれの標識体処理及び時期においても 10%TRR 未満であった。(参照 7)

処理果実では、3 種の標識体処理区における親化合物は、処理 0 日後で 0.366～0.702 mg/kg (89.7～96.6%TRR) であったが、処理 56 日後には 0.005～0.017 mg/kg (3.2～3.7%TRR) となった。葉と同様、処理 56 日後に最も放射能濃度が高かったのは極性代謝物群であり、0.074～0.363 mg/kg (56.6～74.6%TRR) であった。各標識体処理区の果実において、親化合物の他検出された代謝物は、[ben-¹⁴C]L.A4 及び[ben-¹⁴C]L.A3 処理で代謝物 L.A4 (L.A3) -②、⑤、⑨、⑩、⑫、[mac-¹⁴C]L.A4 処理では L.A4-②、⑤、⑫であった。このうち代謝物②は[ben-¹⁴C]L.A4 処理区では、処理 3 日後に最高値 0.130 mg/kg (13.5%TRR)、[ben-¹⁴C]L.A3 処理区で、処理 7 日後に最高値 0.041 mg/kg (10.8%TRR) を示した後減衰し、[mac-¹⁴C]L.A4 処理区では処理 0 日の 0.017 mg/kg (2.4%TRR) が最高値であった。また、代謝物⑩は、[ben-¹⁴C]L.A4 処理区では処理 7 日後に最高値 0.062 mg/kg (7.0%TRR)、[ben-¹⁴C]L.A3 処理区では処理 1 日後に最高値 0.028 mg/kg (7.6%TRR) を示した。その他の代謝物はいずれの標識体処理及び時期においても 10%TRR 未満であった。(参照 8)

(3) だいこん

乳剤に調製した各種標識体について、[ben-¹⁴C]L.A4 または[mac-¹⁴C]L.A4 は 76.5 g ai/ha、[ben-¹⁴C]L.A3 は 27.0 g ai/ha の処理量でだいこん (品種 : [ben-¹⁴C]L.A4 処理区では源助及び時無、[mac-¹⁴C]L.A4 処理区では源助、[ben-¹⁴C]L.A3 処理区では時無) の葉に塗布し、植物体内運命試験が実施された。

だいこんは温室内で栽培され、処理葉の他、放射能の移行性を確認するため検体を塗布しない葉 (無処理葉) 及び根を採取して試料とした。試料採取時期は表 18 に示されている。

表 18 だいこんを用いた植物体内運命試験における試料採取時期

標識体	品種	処理葉	根	無処理葉
[ben- ¹⁴ C]LA4	源助	0、1、3、7、14、28	7、14、28	/
	時無	0、3、7、14、28	7、14、28	28
[mac- ¹⁴ C]LA4	源助	0、28	7、14、28	/
[ben- ¹⁴ C]LA3	時無	0、1、3、7、14、28	7、14、28	28

注) 数値は処理後日数、斜線：試料採取せず 28日は収穫期

だいこん試料中残留放射能濃度は、表 19 に示されている。

葉表面（洗浄液）における放射能濃度は、いずれの標識体処理区でも速やかに減少する一方、抽出液における放射能濃度が増加した。品種間で放射能の葉内部への移行量に若干の違いがみられたが、これは試験時期（源助：11月処理、時無：3月処理）及びだいこんの生育状況の違いによると考えられた。消失や移行性に LA4、LA3 及び標識位置による差は認められなかった。

表 19 だいこん試料中残留放射能濃度 (mg/kg)

標識体 (処理量)	[ben- ¹⁴ C]LA4 (76.5 g ai/ha)			
	源助		時無	
品種	源助		時無	
試料	洗浄液	抽出液	洗浄液	抽出液
処理 0 日後	0.438(97.9)	0.008(2.06)	3.90(99.8)	0.009(0.23)
7 日	0.283(75.6)	0.120(22.1)	1.29(61.8)	0.736(35.5)
28 日	0.125(66.9)	0.056(28.8)	0.743(43.0)	0.871(50.0)
標識体 (処理量)	[mac- ¹⁴ C]LA4 (76.5 g ai/ha)		[ben- ¹⁴ C]LA3 (27.0 g ai/ha)	
	源助		時無	
品種	源助		時無	
試料	洗浄液	抽出液	洗浄液	抽出液
処理 0 日後	0.580(98.3)	0.010(1.68)	1.85(99.0)	0.019(1.03)
7 日	/	/	0.468(41.7)	0.610(54.1)
28 日	0.154(62.3)	0.073(30.5)	0.101(21.0)	0.371(75.7)

() 内は%TRR 斜線：試料採取せず

各標識体を処理しただいこんの、処理 28 日後の根部における放射能濃度はいずれもわずか (0.0002 mg/kg 未満) であり、根部への移行は極めて少ないと考えられた。

処理葉では、3 種の標識体処理区における親化合物は、処理 0 日後に 0.405~3.73 mg/kg (91.0~96.3 %TRR) であったが、処理 28 日後には 0.031~0.334 mg/kg (13.4

～24.2%TRR) となった。処理 28 日後最も放射能濃度が高かったのは極性代謝物群であり、0.088～0.857 mg/kg (39.6～62.8%TRR) であった。各標識体処理区の葉において、親化合物の他検出された代謝物は、[ben-¹⁴C]L.A4 及び[ben-¹⁴C]L.A3 処理で代謝物 L.A4 (L.A3) -②、⑤、⑨、⑩、⑫、[mac-¹⁴C]L.A4 処理では L.A4-②、⑤、⑫であった。このうち代謝物②は[ben-¹⁴C]L.A4 処理区及び[ben-¹⁴C]L.A3 処理区で処理 7 日後に最高値 0.069～0.401 mg/kg (18.1～19.4%TRR) を示し、[mac-¹⁴C]L.A4 処理区では処理 28 日の 0.032 mg/kg (12.8%TRR) が最高値であった。また、代謝物⑩は、[ben-¹⁴C]L.A4 処理区 (品種：源助) において処理 14 日後に 0.07 mg/kg (18.7%TRR) であった他は、いずれの標識体及び試料採取時期においても 10%TRR 未満であった。その他 10%TRR を超える代謝物は同定されなかった。(参照 9)

茶、みかん及びだいごんの間で代謝の差は認められず、代謝物としてオキシム部位及び二重結合の異性体 (②、⑤、⑫)、側鎖エステル部分の加水分解物 (⑩、⑨) 等が確認され、次いでより極性の高い多数の化合物になることが明らかになった。なお、光分解試験結果から、植物におけるレピメクチンの代謝は主に光によるものと考えられた。

(4) はつかだいごん (土壌から植物体への移行試験)

乳剤に調製した各種標識体について、[ben-¹⁴C]L.A4 では 95.5 g ai/ha、[mac-¹⁴C]L.A4 では 83.4 g ai/ha、[ben-¹⁴C]L.A3 では 34.0 g ai/ha の処理量で混和した土壌に、それぞれはつかだいごん (品種：ホワイトチェリッシュ) を播種し、植物体内運命試験が実施された。

はつかだいごんは温室内で栽培され、3 種類の標識体処理区で播種 21 及び 33 日後 (収穫期) にはつかだいごんの植物体及び土壌を採取し、植物体は葉と根に分けて試料とした。無処理区では播種 33 日後にのみ植物体と土壌を採取した。

はつかだいごん試料中放射能濃度は表 20 に示されている。いずれも 8.64 µg/kg 以下 (総処理放射能 (TAR) の 0.017%以下) と微量であった。

表 20 はつかだいごん試料中放射能濃度 (µg/kg)

標識体 (処理量)	[ben- ¹⁴ C]L.A4 (95.5 g ai/ha)		[mac- ¹⁴ C]L.A4 (83.4 g ai/ha)		[ben- ¹⁴ C]L.A3 (34.0 g ai/ha)	
	葉	根	葉	根	葉	根
播種21日後	8.64(0.005)	2.67(<0.001)	5.67(0.006)	1.76(<0.001)	7.68(0.017)	<1.79(<0.001)
33日後	1.22(0.006)	1.20(0.003)	<1.20(<0.006)	1.20(0.001)	<1.62(<0.015)	0.807(0.006)

() 内は%TAR

3種類の各標識体処理区において、播種33日後の土壤中に親化合物(LA4またはLA3)が14.1~45.3 µg/kg (54.8~75.2% TAR)、代謝物LA4 (LA3) -③が1.2~3.4 µg/kg (4.45~5.69% TAR) 存在した。これらの結果から、LA4またはLA3及びそれらの土壌分解物の土壌からはつかだきこんへの移行はほとんどないと考えられた。(参照10)

3. 土壌中運命試験

(1) 好氣的土壌中運命試験

砂壤土(滋賀)に、[ben-¹⁴C]LA4(乾土あたり69.7 µg/kg)、[mac-¹⁴C]LA4(乾土あたり63.3 µg/kg)または[ben-¹⁴C]LA3(乾土あたり56.6 µg/kg)を添加し、25±2°C、暗所でインキュベートし、好氣的土壌中運命試験が実施された。インキュベート期間は[ben-¹⁴C]LA4添加区では120日、[mac-¹⁴C]LA4及び[ben-¹⁴C]LA3添加区では180日であった。

土壌より抽出された放射能は経時的に減少し、[ben-¹⁴C]LA4処理土壌では処理120日後に61.9% TAR、[mac-¹⁴C]LA4及び[ben-¹⁴C]LA3処理土壌では処理180日後にそれぞれ47.8及び46.9% TARとなった。非抽出性放射能及び¹⁴CO₂の発生量は徐々に増加し、試験終了時の¹⁴CO₂発生量は[ben-¹⁴C]LA4処理土壌で14.3% TAR、[mac-¹⁴C]LA4処理土壌で27.3% TAR、[ben-¹⁴C]LA3処理土壌で40.5% TARであった。

親化合物は経時的に減少し、試験終了時には12.1~21.6% TARになった。検出された分解物はいずれの標識体処理土壌においてもLA4(LA3)-③、④、⑬、⑭、⑮、⑯であった。分解物③は3種類の各標識体処理土壌で処理15~60日に10.8~15.2% TAR存在したが、それ以外の時期には10% TAR未満であった。また③以外の分解物は最大で1.4~9.8% TAR存在した。その他極性化合物群が最大で5.0~11.0% TAR存在した。

親化合物及び分解物③の土壌中推定半減期は、それぞれ53~59及び67~75日と算出された。土壌に処理されたLA4及びLA3は好氣的条件下で速やかに分解された。

好氣的土壌においてレピメクチンは、水酸化により主要分解物LA4(LA3)-③あるいは分解物⑮を生成した後、酸化等により最終的には¹⁴CO₂にまで無機化されると考えられた。(参照11)

(2) 土壌吸着試験

[ben-¹⁴C]LA4及び[ben-¹⁴C]LA3について、5種類の国内土壌[砂土(宮崎)、壤土(埼玉、栃木、茨城)及びシルト質埴土(埼玉)]を用いて土壌吸着試験が実施された。

LA4ではFreundlichの吸着係数K_{ads}は71.9~154、有機炭素含有率により補正した吸着係数K_{oc}は1,420~19,500であった。LA3ではFreundlichの吸着係数

K_{ads} は16.5~64.1、有機炭素含有率により補正した吸着係数 K_{oc} は313~10,200であり、LA4及びLA3ともに高い土壌吸着性が認められた。なお、脱着試験も実施され、LA4及びLA3はいずれの土壌においても徐々に脱着することが認められた。(参照12)

4. 水中運命試験

(1) 加水分解試験① (標識体)

[ben-¹⁴C]LA4、[mac-¹⁴C]LA4または[ben-¹⁴C]LA3をpH 4 (酢酸緩衝液)、pH 7及び9 (リン酸二水素/ホウ酸緩衝液)の各滅菌緩衝液にそれぞれ添加し、25±1℃の暗所下で31日間インキュベートし、加水分解試験が実施された。検体の添加濃度は水溶解度の1/2以下に設定し、[ben-¹⁴C]LA4及び[mac-¹⁴C]LA4で23 µg/L、[ben-¹⁴C]LA3で48 µg/Lとした。

pH4、7及び9における推定半減期は、[ben-¹⁴C]LA4でそれぞれ26.0、93.7及び55.9日、[mac-¹⁴C]LA4でそれぞれ45.6、83.5及び54.6日、[ben-¹⁴C]LA3でそれぞれ23.2、49.2及び34.3日と算出された。

分解物として[ben-¹⁴C]LA4及び[ben-¹⁴C]LA3添加区でLA4(LA3)-④、⑨が、いずれのpHでも生成された。LA4-④は[mac-¹⁴C]LA4添加区のpH4及び9でも検出されたが、いずれも10%TAR未満であった。その他LA4(LA3)-②、③、⑦が10%TAR未満生成した。(参照13)

(2) 加水分解試験② (非標識体)

LA4またはLA3をpH 1.2 (塩酸緩衝液)、pH 4 (酢酸緩衝液)、pH 7及びpH 9 (リン酸二水素/ホウ酸緩衝液)の各滅菌緩衝液に添加し、pH 4、7及び9の緩衝液はそれぞれ25±0.1℃及び37±0.1℃、pH 1.2の緩衝液はいずれも37±0.1℃、暗所で30日間インキュベートし、加水分解試験が実施された。検体の添加濃度は、LA4で25.6 µg/L、LA3で48.2 µg/Lとした。

LA4及びLA3の推定半減期は表21に示されている。(参照14)

表21 LA4及びLA3の推定半減期(日)

温度(℃)	pH	LA4	LA3
25	4	75.2	71.6
	7	86.0	71.6
	9	97.1	56.8
37	4	14.8	11.5
	7	36.7	23.5
	9	22.5	11.7
	1.2	5.4	6.2