

農薬評価書

アゾキシストロビン

(第3版)

2010年1月

食品安全委員会

目次

	頁
○ 審議の経緯	3
○ 食品安全委員会委員名簿	5
○ 食品安全委員会農業専門調査会専門委員名簿	5
○ 要約	7
I. 評価対象農薬の概要	8
1. 用途	8
2. 有効成分の一般名	8
3. 化学名	8
4. 分子式	8
5. 分子量	8
6. 構造式	8
7. 開発の経緯	8
II. 安全性に係る試験の概要	9
1. 動物体内運命試験	9
(1) 吸収	9
(2) 分布	9
(3) 代謝	10
(4) 排泄	11
2. 植物体内運命試験	12
(1) 稲	12
(2) 小麦	13
(3) ぶどう	14
(4) らっかせい	14
3. 土壌中運命試験	15
(1) 好氣的湛水土壌中運命試験	15
(2) 好氣的及び嫌氣的湛水土壌中運命試験	15
(3) 好氣的土壌中運命試験	16
(4) 土壌表面における光分解	16
(5) 土壌吸着試験 (日本土壌)	16
(6) 土壌吸着試験 (英国土壌)	16
(7) 土壌カラムリーチング試験	17
4. 水中運命試験	17
(1) 加水分解試験	17
(2) 水中光分解試験 (滅菌緩衝液)	17

(3) 水中光分解試験 (自然水及び蒸留水)	18
5. 土壌残留試験	18
6. 作物等残留試験	19
(1) 作物残留試験	19
(2) 魚介類における最大推定残留値	19
(3) 乳汁移行試験	19
(4) 推定摂取量	19
7. 一般薬理試験	20
8. 急性毒性試験	21
(1) 急性毒性試験	21
(2) 急性神経毒性試験	21
9. 眼・皮膚に対する刺激性及び皮膚感作性試験	22
10. 亜急性毒性試験	22
(1) 90日間亜急性毒性試験 (ラット)	22
(2) 90日間亜急性毒性試験 (イヌ)	23
(3) 90日間亜急性神経毒性試験 (ラット)	23
11. 慢性毒性試験及び発がん性試験	24
(1) 1年間慢性毒性試験 (イヌ)	24
(2) 2年間慢性毒性/発がん性併合試験 (ラット)	24
(3) 2年間発がん性試験 (マウス)	25
12. 生殖発生毒性試験	26
(1) 2世代繁殖試験 (ラット)	26
(2) 発生毒性試験 (ラット)	26
(3) 発生毒性試験 (ウサギ) ①	27
(4) 発生毒性試験 (ウサギ) ②	27
13. 遺伝毒性試験	27
III. 食品健康影響評価	29
・別紙1: 代謝物/分解物略称	32
・別紙2: 検査値等略称	33
・別紙3: 作物残留試験成績	34
・別紙4: 推定摂取量	71
・参照	73

<審議の経緯>

○第1版関係

ー清涼飲料水関係ー

- | | | | |
|-------|-----|-----|--|
| 2003年 | 7月 | 1日 | 厚生労働大臣より清涼飲料水の規格基準改正に係る食品健康影響評価について要請(厚生労働省発食安第0701015号) |
| 2003年 | 7月 | 3日 | 関係書類の接受(参照1) |
| 2003年 | 7月 | 18日 | 第3回食品安全委員会(要請事項説明)(参照2) |
| 2003年 | 10月 | 8日 | 関係書類の接受(参照3)
(アゾキシストロビンを含む要請対象93農薬を特定) |
| 2003年 | 10月 | 27日 | 第1回農薬専門調査会(参照4) |
| 2004年 | 1月 | 28日 | 第6回農薬専門調査会(参照5) |
| 2005年 | 1月 | 12日 | 第22回農薬専門調査会(参照6) |

ー適用拡大申請及びポジティブリスト制度関係ー

- | | | | |
|-------|-----|-----|--|
| 1998年 | 4月 | 24日 | 初回農薬登録 |
| 2004年 | 11月 | 16日 | 農林水産省より厚生労働省へ農薬登録申請に係る連絡及び基準設定依頼(適用拡大:だいこん及びピーマン) |
| 2004年 | 11月 | 30日 | 厚生労働大臣より残留基準設定に係る食品健康影響評価について要請(厚生労働省発食安第1130001号) |
| 2004年 | 12月 | 1日 | 関係書類の接受(参照7~59) |
| 2004年 | 12月 | 9日 | 第73回食品安全委員会(要請事項説明)(参照60) |
| 2005年 | 2月 | 9日 | 第24回農薬専門調査会(参照61) |
| 2005年 | 11月 | 29日 | 残留農薬基準告示(参照62) |
| 2006年 | 2月 | 22日 | 農林水産省より厚生労働省へ農薬登録申請に係る連絡及び基準設定依頼(適用拡大:にんじん、ねぎ等) |
| 2006年 | 3月 | 6日 | 関係書類の接受(参照63~65) |
| 2006年 | 7月 | 18日 | 厚生労働大臣より残留基準設定に係る食品健康影響評価について追加要請(厚生労働省発食安第0718005号)、関係書類の接受(参照66) |
| 2006年 | 7月 | 20日 | 第153回食品安全委員会(要請事項説明)(参照67) |
| 2006年 | 10月 | 16日 | 第5回農薬専門調査会総合評価第二部会(参照68) |
| 2006年 | 11月 | 1日 | 第6回農薬専門調査会幹事会(参照69) |
| 2006年 | 11月 | 9日 | 第167回食品安全委員会(報告) |
| 2006年 | 11月 | 9日 | より12月8日 国民からの御意見・情報の募集 |
| 2006年 | 12月 | 19日 | 農薬専門調査会座長より食品安全委員会委員長へ報告 |
| 2006年 | 12月 | 21日 | 第172回食品安全委員会(報告)
(同日付け厚生労働大臣へ通知)(参照70) |

2007年 9月 21日 残留農薬基準告示 (参照 71)

○第2版関係

2007年 9月 21日 農林水産省より厚生労働省へ基準設定依頼 (魚介類)

2007年 10月 2日 厚生労働大臣より残留基準設定に係る食品健康影響評価について要請 (厚生労働省発食安第 1002002 号)、関係書類の接受 (参照 72~74)

2007年 10月 4日 第 209 回食品安全委員会 (要請事項説明) (参照 75)

2007年 11月 7日 第 30 回農薬専門調査会幹事会 (参照 76)

2007年 11月 13日 農薬専門調査会座長より食品安全委員会委員長へ報告

2007年 11月 15日 第 215 回食品安全委員会 (報告)
(同日付け厚生労働大臣へ通知) (参照 77)

○第3版関係

2009年 4月 20日 農林水産省より厚生労働省へ農薬登録申請に係る連絡及び基準設定依頼 (適用拡大: バナナ、しょうが等)

2009年 6月 8日 厚生労働大臣より残留基準設定に係る食品健康影響評価について要請 (厚生労働省発食安第 0608001 号)

2009年 6月 9日 関係書類の接受 (参照 81~83)

2009年 6月 11日 第 289 回食品安全委員会 (要請事項説明) (参照 84)

2010年 1月 28日 第 318 回食品安全委員会 (審議)
(同日付け厚生労働大臣へ通知)

<食品安全委員会委員名簿>

(2006年6月30日まで)

寺田雅昭 (委員長)
寺尾允男 (委員長代理)
小泉直子
坂本元子
中村靖彦
本間清一
見上 彪

(2006年12月20日まで)

寺田雅昭 (委員長)
見上 彪 (委員長代理)
小泉直子
長尾 拓
野村一正
畑江敬子
本間清一

(2009年6月30日まで)

見上 彪 (委員長)
小泉直子 (委員長代理*)
長尾 拓
野村一正
畑江敬子
廣瀬雅雄**
本間清一

*: 2007年2月1日から

** : 2007年4月1日から

(2009年7月1日から)

小泉直子 (委員長)
見上 彪 (委員長代理*)
長尾 拓
野村一正
畑江敬子
廣瀬雅雄
村田容常

* : 2009年7月9日から

<食品安全委員会農業専門調査会専門委員名簿>

(2006年3月31日まで)

鈴木勝士 (座長)
廣瀬雅雄 (座長代理)
石井康雄
江馬 眞
太田敏博

小澤正吾
高木篤也
武田明治
津田修治*
津田洋幸

出川雅邦
長尾哲二
林 眞
平塚 明
吉田 緑

* : 2005年10月1日から

(2007年3月31日まで)

鈴木勝士 (座長)
廣瀬雅雄 (座長代理)
赤池昭紀
石井康雄
泉 啓介
上路雅子

三枝順三
佐々木有
高木篤也
玉井郁巳
田村廣人
津田修治

根岸友恵
林 眞
平塚 明
藤本成明
細川正清
松本清司

臼井健二
江馬 眞
大澤貫寿
太田敏博
大谷 浩
小澤正吾
小林裕子

津田洋幸
出川雅邦
長尾哲二
中澤憲一
納屋聖人
成瀬一郎
布柴達男

柳井徳磨
山崎浩史
山手丈至
與語靖洋
吉田 緑
若栗 忍

(2007年4月1日から2007年11月15日まで)

鈴木勝士 (座長)
林 眞 (座長代理*)
赤池昭紀
石井康雄
泉 啓介
上路雅子
臼井健二
江馬 眞
大澤貫寿
太田敏博
大谷 浩
小澤正吾
小林裕子
三枝順三

佐々木有
代田眞理子****
高木篤也
玉井郁巳
田村廣人
津田修治
津田洋幸
出川雅邦
長尾哲二
中澤憲一
納屋聖人
成瀬一郎***
西川秋佳**
布柴達男

根岸友恵
平塚 明
藤本成明
細川正清
松本清司
柳井徳磨
山崎浩史
山手丈至
與語靖洋
吉田 緑
若栗 忍

* : 2007年4月11日から

** : 2007年4月25日から

*** : 2007年6月30日まで

**** : 2007年7月1日から

要 約

ストロビルリン系殺菌剤である「アゾキシストロビン」(CAS No.131860-33-8)について、各種試験成績等を用いて食品健康影響評価を実施した。

評価に供した試験成績は、動物体内運命(ラット)、植物体内運命(稲、小麦、ぶどう及びらっかせい)、作物等残留、亜急性毒性(ラット及びイヌ)、慢性毒性(イヌ)、慢性毒性/発がん性併合(ラット)、発がん性(マウス)、2世代繁殖(ラット)、発生毒性(ラット及びウサギ)、遺伝毒性試験等である。

試験結果から、アゾキシストロビン投与による影響は、主に体重増加量、血液及び胆管に認められた。発がん性、繁殖能に対する影響、催奇形性及び生体において問題となる遺伝毒性は認められなかった。

各試験で得られた無毒性量の最小値は、ラットを用いた2年間慢性毒性/発がん性併合試験の18.2 mg/kg 体重/日であったので、これを根拠として、安全係数100で除した0.18 mg/kg 体重/日を一日摂取許容量(ADI)と設定した。

I. 評価対象農薬の概要

1. 用途

殺菌剤

2. 有効成分の一般名

和名：アゾキシストロビン

英名：azoxystrobin (ISO名)

3. 化学名

IUPAC

和名：メチル=(*E*)-2-{2-[6-(2-シアノフェノキシ)ピリミジン-4-イルオキシ]フェニル}-3-メトキシアクリラート

英名：methyl (*E*)-2-{2-[6-(2-cyanophenoxy) pyrimidin-4-yloxy] phenyl}-3-methoxyacrylate

CAS (No.131860-33-8)

和名：メチル (*E*)-2-[[6-(2-シアノフェノキシ)-4-ピリミジニル]オキシ]- α -(メトキシメチレン) ベンゼンアセテート

英名：methyl (*E*)-2-[[6-(2-cyanophenoxy)-4-pyrimidinyl]oxy]- α -(methoxymethylene) benzeneacetate

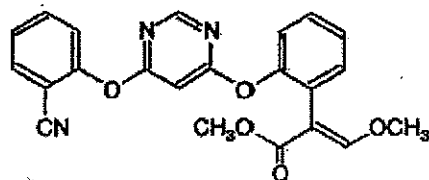
4. 分子式

$C_{22}H_{17}N_3O_5$

5. 分子量

403.4

6. 構造式



7. 開発の経緯

アゾキシストロビンは、1992年に英国ゼネカ社により開発されたストロビルリン系殺菌剤であり、ミトコンドリアのチトクローム bc1 複合体の Qo 部位に結合することで電子伝達系を阻害し、細菌の呼吸を阻害すると考えられる。なお、本化合物には立体異性体が存在しうるが、本品の有効成分は *E* 体のみである。

アゾキシストロビンは、約 50 カ国で主に米、小麦、豆類、ぶどう等に登録されており、我が国では 1998 年 4 月 24 日に初めて登録された。今回、適用拡大申請（バナナ、しょうが等）がなされている。

II. 安全性に係る試験の概要

各種運命試験[II. 1~4]は、アゾキシストロビンのピリミジン環の5位の炭素を¹⁴Cで標識したもの（以下「[pyr-¹⁴C]アゾキシストロビン」という。）、シアノフェニルのフェニル基を均一に¹⁴Cで標識したもの（以下「[cya-¹⁴C]アゾキシストロビン」という。）及びフェニルアクリレートのフェニル基を均一に¹⁴Cで標識したもの（以下「[phe-¹⁴C]アゾキシストロビン」という。）を用いて実施された。放射能濃度及び代謝物濃度は特に断りがない場合はアゾキシストロビンに換算した。代謝物/分解物略称及び検査値等略称は別紙1及び2に示されている。

1. 動物体内運命試験

(1) 吸収

① 血中濃度推移

SD ラット（一群雌雄各3匹）に[pyr-¹⁴C]アゾキシストロビンを1 mg/kg 体重（以下[1.]において「低用量」という。）又は100 mg/kg 体重（以下[1.]において「高用量」という。）で単回経口投与して、血中濃度推移について検討された。

血中放射能濃度推移は表1に示されている。

血中放射能濃度は、低用量で投与1~8時間後、高用量で投与2~12時間後に最高に達した。T_{1/2}は、低用量で約19時間、高用量で約20時間であった。血中濃度推移に性差は認められなかった。（参照8）

表1 血中放射能濃度推移

投与量	1 mg/kg 体重/日		100 mg/kg 体重/日	
	雄	雌	雄	雌
T _{max} (時間)	4~8	1~4	3~12	2~12
C _{max} (µg/g)	0.152~0.218	0.101~0.178	6.16~12.4	5.10~7.76
T _{1/2} (時間)	14~20	14~21	16~33	17~25

② 吸収率

代謝物同定・定量試験[1. (3)]において、胆汁中から親化合物は検出されなかったことから、糞中で検出されたアゾキシストロビンは未吸収の親化合物と考えられた。したがって、体内吸収率は糞中のアゾキシストロビンの検出率を100から減じて算出され、低用量で約100%、高用量で約70%であった。（参照11）

(2) 分布

SD ラット（一群雌雄各3~5匹）に[pyr-¹⁴C]アゾキシストロビンを低用量若しくは高用量で単回経口投与又は低用量で反復経口投与（非標識体を14日間反復投与後に標識体を単回投与）して、体内分布試験が実施された。

単回経口投与群における主要臓器及び組織の残留放射能濃度は表2に示されている。

単回経口投与群において、臓器及び組織中残留放射能は小腸、大腸、肝臓及び腎臓に多く分布していた。各臓器及び組織からの消失は速やかで、投与 192 時間後では T_{max} 付近の濃度の 1/2,000~1/10 以下に低下した。体内分布及び各組織からの消失プロフィールに性差は認められなかった。

反復経口投与群においても、最終投与 7 日後の組織に残留していた放射能はわずか 0.7% TAR 未満であり、放射能分布が比較的多かったのは腎臓 (雄: 0.04 $\mu\text{g/g}$ 、雌: 0.03 $\mu\text{g/g}$) 及び肝臓 (雄: 0.02 $\mu\text{g/g}$ 、雌: 0.01 $\mu\text{g/g}$) であった。(参照 8、11)

表 2 主要臓器及び組織の残留放射能濃度 ($\mu\text{g/g}$)

投与量 (mg/kg 体重)	性別	T_{max} 付近 ¹⁾	投与 192 時間後
1	雄	小腸(1.92)、大腸(0.90)、肝臓(0.78)、腎臓(0.44)、血漿(0.24)、全血(0.15)	腎臓(0.03)、肝臓、肺、心臓、大腿骨及び全血(0.01 未満)
	雌	小腸(1.85)、大腸(1.06)、肝臓(0.42)、腎臓(0.27)、血漿(0.11)、全血(0.07)	腎臓(0.03)、全血(0.01)
100	雄	大腸(138)、小腸(57.3)、肝臓(30.2)、腎臓(18.6)、血漿(13.3)、全血(9.19)	腎臓(1.73)、大腸(1.18)、小腸(1.17)、筋肉(0.90)、肝臓(0.84)、肺(0.69)、腹部脂肪(0.60)、全血(0.52)
	雌	大腸(128)、小腸(60.4)、肝臓(25.4)、腎臓(13.8)、血漿(7.09)、心臓(5.71)、全血(4.96)	腎臓(1.44)、大腸(1.20)、小腸(1.16)、筋肉(0.92)、肝臓(0.63)、肺(0.63)、全血(0.49)

1) 1 mg/kg 体重投与群では投与 4 時間後、100 mg/kg 体重投与群では投与 12 時間後

(3) 代謝

排泄試験[1. (4)①及び②]で得られた尿、糞及び胆汁を試料として、代謝物同定・定量試験が実施された。

尿、糞及び胆汁中の代謝物は表 3 に示されている。

親化合物は高用量投与群の糞中で約 30% TAR 検出されたが、尿及び胆汁中からは検出されなかった。尿及び糞中では 10% TAR を超える代謝物は認められず、多数の少量代謝物が検出された。胆汁中の主要代謝物は Y であった。

代謝物の種類には性差が認められたが、3 種類の標識体を用いて実施された胆汁排泄試験で得られた試料では、標識位置によって代謝物のプロフィールに大きな違いはみられなかった。

主要代謝反応は、①メチルエステルの加水分解とそれに続くグルクロン酸抱合化(代謝物 Y の生成)、②シアノフェニル環のグルタチオン抱合化(代謝物 Z の生成)及びそれに続くメルカプツール酸(代謝物 AA、AB 及び AC)の生成と考えられた。

(参照 12、13)

表3 尿、糞及び胆汁中の代謝物 (%TAR)

投与量 (mg/kg 体重)	1				100				100 (胆汁排泄試験)					
	雄		雌		雄		雌		雄			雌		
	尿	糞	尿	糞	尿	糞	尿	糞	尿	糞	胆汁	尿	糞	胆汁
アゾキシストロビン	—	—	—	0.9	—	32.6	—	32.1	—	15.1	—	—	13.6	—
K	0.2	1.4	0.3	0.8	0.1	—	0.4	2.1	—	—	6.5	0.3	0.1	6.8
V	—	2.7	—	1.4	—	4.1	—	2.6	0.1	—	—	—	—	1.7
W+Z ¹⁾	0.5	1.3	0.4	0.6	—	—	0.5	—	—	—	6.8	0.3	—	9.0
X+Z ¹⁾	—	0.7	3.0	—	—	—	0.5	2.1	—	—	—	0.2	0.1	1.4
Y	—	1.0	0.9	1.4	0.7	1.2	1.4	—	0.1	—	29.3	1.7	—	27.4
AA ²⁾	0.7	0.7	—	—	—	—	—	—	—	—	7.0	0.3	—	1.6
AB+AE ¹⁾	—	0.4	1.1	0.7	0.4	0.5	0.6	—	0.1	—	3.2	0.3	—	6.1
AC	0.1	1.1	1.6	0.6	0.2	—	1.0	1.1	—	—	4.5	0.4	0.1	2.4
C	—	3.1	2.2	—	—	—	—	4.0	—	—	—	0.4	—	4.8
I	—	—	0.1	—	0.2	—	0.3 ⁴⁾	—	trace	—	2.8	trace	—	0.9
M	0.8	0.4	0.8	0.3	0.6	0.3	0.5	—	0.3	0.2	4.1	0.4	0.2	1.5
未同定 代謝物 ³⁾	7.3	4.0	6.5	7.4	5.8	3.4	4.7	1.9	1.4	0.1	8.0	2.6	0.1	10.2

—: 検出されず

1) HPLC 上でピークの分離が不完全、2) 未同定代謝物を含む、3) 6~7 種類の未同定代謝物の合計、

4) 親化合物 (アゾキシストロビン) を含む

(4) 排泄

① 尿及び糞中排泄

SD ラット (一群雌雄各 5 匹) に [pyr-¹⁴C] アゾキシストロビンを低用量若しくは高用量で単回経口投与又は低用量で反復経口投与 (非標識体を 14 日間反復投与後に標識体を単回投与) して、尿及び糞中排泄試験が実施された。また、SD ラット (雌雄各 1 匹) に [pyr-¹⁴C] アゾキシストロビンを低用量で単回経口投与し、呼吸からの排泄について検討された。

投与後 168 時間の尿及び糞中排泄率は表 4 に示されている。

アゾキシストロビンの排泄は速やかで、投与後 48 時間で 86%TAR 以上が尿及び糞中に排泄された。雌雄いずれにおいても糞中が主な排泄経路であった。

呼吸中に排泄された放射能はわずかであり、投与後 48 時間で 0.6%TAR 未満であった。(参照 9~11)

表 4 投与後 168 時間の尿及び糞中排泄率 (%TAR)

投与方法 投与量 (mg/kg 体重)	単回経口				反復経口	
	1		100		1	
	雄	雌	雄	雌	雄	雌
尿	10.2	17.9	8.5	11.5	12.5	17.0
糞	83.2	72.6	89.4	84.5	89.1	86.5
ケージ洗浄液	0.3	0.9	0.4	1.2	0.5	0.1
合計	93.7	91.4	98.3	97.2	102	104

② 胆汁中排泄

胆管カニューレを挿入したSDラット（一群雌雄各2匹）に[pyr-¹⁴C]アゾキシストロビン、[phe-¹⁴C]アゾキシストロビン又は[cya-¹⁴C]アゾキシストロビンを高用量で単回経口投与して、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5に示されている。投与後48時間の胆汁中排泄量は56.6～74.2%TARであり、雌雄とも胆汁中が主な排泄経路と考えられた。排泄パターンに標識位置による差はみられなかった。（参照12）

表5 投与後48時間の胆汁、尿及び糞中排泄率(%TAR)

標識体	[pyr- ¹⁴ C] アゾキシストロビン		[phe- ¹⁴ C] アゾキシストロビン		[cya- ¹⁴ C] アゾキシストロビン	
	雄	雌	雄	雌	雄	雌
胆汁	64.4	63.6	71.6	74.2	56.6	62.5
尿	4.4	4.0	2.0	7.1	2.0	4.2
糞	18.1	29.6	18.1	18.9	29.1	28.1

2. 植物体内運命試験

(1) 稲

温室内の模擬水田に移植した稲（品種名：石狩）の苗（3葉期）に[pyr-¹⁴C]アゾキシストロビン、[phe-¹⁴C]アゾキシストロビン又は[cya-¹⁴C]アゾキシストロビンを散布し、植物体内運命試験が実施された。水面散布試験では、移植11～13日後に841～971 g ai/ha相当量で1回、さらにその36日後の出穂直前に892～946 g ai/ha相当量で1回の計2回散布し、2回目処理の95～98日後にすべての穂が採取された。穂を採取した後の株は土壌面から約2 cm上で刈り取って、稲わら試料とされた。茎葉散布試験では、苗移植69日後に355～553 g ai/ha相当量を1回散布し、処理75～95日後にすべての穂が採取された。

稲試料における放射能分布及び主要成分は表6に示されている。

植物体への吸収移行量は、水面散布では5.2～7.0%TAR、茎葉散布では19.0～28.9%TARであった。玄米への移行量はわずかで、水面散布で0.1%TAR、茎葉散布で0.2～0.3%TARであった。

玄米中の総残留放射能には、3種類の標識体間で差は認められなかった。処理方法にかかわらず、玄米中の残留放射能の主要成分は、糖（麦芽糖、ブドウ糖及び果糖）及び親化合物であった。水面散布した場合の玄米中で糖が特に多くみられたが、これは土壌中で分解されたアゾキシストロビン由来のCO₂が植物体内に取り込まれたためと考えられた。（参照14）

表 6 稲試料における放射能分布及び主要成分

処理方法	試料	総残留放射能 (mg/kg)	主要成分 (%TRR)
水面散布	玄米	0.527~0.743	糖(43.2~57.9)、親化合物(3.4~5.3)
	稲わら	8.16~10.5	親化合物(3.3~5.6)、B(3.6~6.7)、J+K(5.1~8.1)
茎葉散布	玄米	0.321~0.401	親化合物(36.3~71.5)、糖(4.9~16.5)
	稲わら	5.71~7.81	親化合物(37.6~45.9)、M*(5.2~8.5)

* : [phe-¹⁴C]アゾキシストロビン処理では不検出

(2) 小麦

小麦 (品種名 : mercia 及び apollo) の節間伸長期 (収穫約 130 日前) 及び出穂期 (収穫約 60 日前) に [pyr-¹⁴C]アゾキシストロビン、[phe-¹⁴C]アゾキシストロビン又は [cya-¹⁴C]アゾキシストロビンを 500 g ai/ha の用量で 2 回散布し、2 回目散布の 13 日後に青刈小麦を、残りは散布 61~62 日後に子実及び麦わらとして採取し、植物体内運命試験が実施された。

小麦試料における放射能分布及び主要成分は表 7 に示されている。

植物体の総残留放射能は、種実、麦わら及び青刈小麦を合わせて 5.1~11.5% TAR であった。種実への吸収移行量は 0.08~0.10% TAR とわずかであった。

種実、麦わら及び青刈小麦における代謝パターンは類似しており、主要成分は親化合物であった。種実では他にブドウ糖が認められた。これはアゾキシストロビンが無機化されて生じた ¹⁴CO₂ がブドウ糖に取り込まれたものと考えられた。

主要代謝反応は、①フェニルアクリレート環及びピリミジン環の間の開裂による代謝物 M の生成、さらにエーテル結合の開裂による代謝物 F の生成、②光化学反応による代謝物 U の生成、③光化学反応によるアゾキシストロビンの Z 異性体 (代謝物 D) の生成、④アクリル結合の酸化的開裂により代謝物 L 及び G の生成、それに引き続く酸化による N の生成、⑤エステル結合の加水分解又は酸化的 O 脱メチル化による代謝物 B の生成、アクリル結合の水酸化による代謝物 T の生成、エーテル結合の加水分解による代謝物 O の生成、⑥代謝物 B のアクリル結合の還元による代謝物 S の生成、⑦無機化による CO₂ の取り込みによる糖への同化及び転化と考えられた。(参照 15)

表 7 小麦試料における放射能分布及び主要成分

試料	総残留放射能 (mg/kg)	主要成分 (%TRR)
種実	0.075~0.077	親化合物(17.1~22.0)、ブドウ糖(9.7~20.9)
麦わら	3.06~9.41	親化合物(22.1~43.4)、M(7.4~7.6)、M の糖抱合体(0.8~2.8)、D(2.1~3.5)、B(3.0~3.4)
青刈小麦	1.02~2.79	親化合物(54.9~64.7)、D(1.9~2.9)、M の糖抱合体(2.1)、M(1.1)

(3) ぶどう

ぶどう（品種名：Merlot）の樹に[pyr-¹⁴C]アゾキシストロビン、[phe-¹⁴C]アゾキシストロビン又は[cya-¹⁴C]アゾキシストロビンを収穫 99、70、41 及び 21 日目の計 4 回散布し（1 及び 4 回目：250 g ai/ha、2 及び 3 回目：1,000 g ai/ha、総有効成分投下量：2,500 g ai/ha）、最終散布 21 日後に成熟果実を採取して植物体内運命試験が実施された。また、[pyr-¹⁴C]アゾキシストロビン処理区では、2 及び 3 回目の散布前及び果実採取時に葉も採取された。

果実中の総残留放射能は 0.382～1.43 mg/kg であった。

果実中残留放射能の主要成分は親化合物 [34.6～64.6%TRR (0.132～0.924 mg/kg)] であり、他に少なくとも 15 種類の代謝物が存在したが、主要代謝物は D [1.9～4.0%TRR (0.009～0.038 mg/kg)]、F [5.7%TRR (0.022 mg/kg)]、L [2.5～3.9%TRR (0.015～0.036 mg/kg)] 及び M [2.6～5.2%TRR (0.020～0.037 mg/kg)] であった。その他に、水溶性画分の放射能の大部分 (3.8～5.5%TRR) は糖（ブドウ糖、果糖及びショ糖）として存在し、これは分解されたアゾキシストロビン由来の CO₂ が糖に取り込まれたと考えられた。葉部試料からは代謝物 D、M、N、O 及び S が検出された。（参照 16）

(4) らっかせい

らっかせい（品種名：Florunner）に[pyr-¹⁴C]アゾキシストロビン、[phe-¹⁴C]アゾキシストロビン又は[cya-¹⁴C]アゾキシストロビンを植付け 53、95 及び 144 日後の計 3 回散布した（1 及び 2 回目：850 g ai/ha、3 回目：300 g ai/ha、総有効成分投下量：2,000 g ai/ha）。最終散布 10 日後に土壌面より少し上部で茎葉部を刈り取り、さやを採取して植物体内運命試験が実施された。

らっかせい試料における放射能分布及び主要成分は表 8 に示されている。

植物体に 22.6～23.3%TAR が吸収され、可食部である子実への移行量は 0.10～0.27%TAR とわずかであった。

子実中残留放射能の主要成分は、脂肪酸（オレイン酸及びリノレイン酸）及び糖（ショ糖等）であり、これらは分解されたアゾキシストロビン由来の CO₂ が脂肪酸又は糖に取り込まれたと考えられた。

茎葉部（乾燥）及び殻中の主要成分は親化合物であり、主要代謝物として M 及びその抱合体である R が認められた。茎葉部（生）中の総残留放射能は 16.4～19.6 mg/kg であり、その組成は茎葉部（乾燥）と類似していた。（参照 17）

表 8 らっかせい試料における放射能分布及び主要成分

採取試料	総残留放射能 (mg/kg)	主要成分(%TRR)
子実	0.241~0.650	脂肪酸(27.5~32.3)、リノレイン酸(11.2~16.3)、糖(1~6)
茎葉部 (乾燥)	39.2~46.6	親化合物(33.0~43.8)、M+R(7.0~9.0)
殻	0.68~0.87	親化合物(12.9~13.5)、M+R(4.5~5.5)

3. 土壤中運命試験

(1) 好氣的湛水土壤中運命試験

2 種類の底質土壌 [シルト質壤土及び砂壤土 (英国)] に土壌採取と同時に採取した河川水を加えた河川水-底質土壌系 (全量 200 mL のうち 10% が土壌) の水面に [pyr-¹⁴C]アゾキシストロビン、[phe-¹⁴C]アゾキシストロビン又は [cya-¹⁴C]アゾキシストロビンを 84~91 µg/L (水深 30 cm の水田に 252~273 g ai/ha を散布した場合に相当) の濃度で添加し、CO₂ を含まない空気を通気させ、20±2°C の暗条件下で最長 152 日間インキュベートして、好氣的湛水土壤中運命試験が実施された。

河川水-底質土壌系でのアゾキシストロビンの推定半減期は約 150 日であった。処理直後において 92.6~95.4% TAR が親化合物であったが、処理 120 日後には 49.3~69.8% TAR まで減少した。滅菌した試験系では、処理 120 日後においても 84.8~92.7% TAR が親化合物であったことから、親化合物の分解に対する微生物の影響が示唆された。

主要分解物として B が処理 152 日後に最大 20.3% TAR 生成した。その他、少量の分解物 C が最大 2.7% 生成した。¹⁴CO₂ の累積発生量は試験終了時で 1.5~6.2% TAR であった。(参照 18)

(2) 好氣的及び嫌氣的湛水土壤中運命試験

砂壤土 (英国及び米国) 及び砂質埴壤土 (英国) に [pyr-¹⁴C]アゾキシストロビン、[phe-¹⁴C]アゾキシストロビン又は [cya-¹⁴C]アゾキシストロビンを 1 ポットあたり 17 µg (0.56 µg/g 土壌、0.56 g/ha) の濃度で混合し、20°C の暗所で、好氣的条件下 (CO₂ を含まない空気を通気) 又は嫌氣的湛水条件下 (蒸留水を 2 cm の深さに灌水し、加湿した窒素ガスを流入) で最長 120 日間インキュベートして、好氣的及び嫌氣的湛水土壤中運命試験が実施された。

アゾキシストロビンの推定半減期は、好氣的土壌で 54~164 日であり、分解速度が遅い原因はバイオマス量 (バイオマス量が他の土壌の 1/6) によると推定された¹。嫌氣的湛水土壤中における推定半減期は、表面水中で約 2 日、表面水を含む土壌中で 50~56 日 (英国土壌) であった。

好氣的土壌における主要分解物は B で、62 日後に 7~21% TAR に達し、120 日後に 9~16% TAR に減少した。最も分解の遅かった米国土壌においてのみ、分解物 B が 120 日後に 12% TAR に増加した。この他に分解物 C、M 及び P が 3.2% TAR 以下検出された。120 日間の ¹⁴CO₂ の累積発生率は 15.1~27% TAR に達した。

嫌氣的湛水土壤中では、120 日の試験期間中、分解物 B は徐々に増加して 14~69% TAR に達した。その他に分解物 M が約 4% TAR 検出された。¹⁴CO₂ の発生はほとんどみられなかった (120 日間で 0~4.7% TAR)。(参照 19)

¹ 分解速度が最も遅かった米国土壌の圃場条件下の試験 [3. (3)] では推定半減期は約 14 日との報告があり、その原因は光分解と推定された。