

平成22年8月18日

薬事・食品衛生審議会
食品衛生分科会長 岸 玲子 殿

薬事・食品衛生審議会食品衛生分科会
農薬・動物用医薬品部会長 大野 泰雄

薬事・食品衛生審議会食品衛生分科会
農薬・動物用医薬品部会報告について

平成22年7月23日付け厚生労働省発食安0723第5号をもって諮問された、食品衛生法（昭和22年法律第233号）第11条第1項の規定に基づくスピネトラムに係る食品規格（食品中の農薬の残留基準）の設定について、当部会で審議を行った結果を別添のとおり取りまとめたので、これを報告する。

スピネトラム

今般の残留基準の検討については、農薬取締法に基づく基準値設定依頼が農林水産省からなされたこと及び関連企業から「国外で使用される農薬等に係る残留基準の設定及び改正に関する指針について」に基づく残留基準の新規の設定要請（インポートトレランス申請）がなされたことに伴い、食品安全委員会において食品健康影響評価がなされたことを踏まえ、農薬・動物用医薬品部会において審議を行い、以下の報告を取りまとめるものである。

1. 概要

(1) 品目名：スピネトラム [Spinetoram (ISO)]

(スピネトラムは、スピネトラム-J 及びスピネトラム-L の混合物で、原体中にはそれぞれ 58.1% 以上及び 8.4% 以上（2 成分の合計で 83.0% 以上）含まれる。)

(2) 用途：殺虫剤

土壌放線菌 (*Saccharopolyspora spinosa*) が産生する活性物質（スピノシン）に由来するマクロライド系殺虫剤であり、スピネトラム-J 及びスピネトラム-L の混合物である。鱗翅目、総翅目及び双翅目等の害虫に殺虫活性を示す。シナプス後膜に存在するアセチルコリン受容体と γ-アミノ酪酸 (GABA) 受容体のイオンチャンネルに作用し、神経活動に異常を引き起こすことにより殺虫効果を示すものと考えられる。

(3) 化学名：

スピネトラム-J

(1*S*, 2*R*, 5*R*, 7*R*, 9*R*, 10*S*, 14*R*, 15*S*, 19*S*)-7-(6-deoxy-3-*O*-ethyl-2,4-di-*O*-methyl- α -L-mannopyranosyloxy)-15-[(2*R*, 5*S*, 6*R*)-5-(dimethylamino) tetrahydro-6-methylpyran-2-yloxy]-19-ethyl-14-methyl-20-oxatetracyclo[10.10.0.0^{2,10}.0^{5,9}]docos-11-ene-13,21-dione (IUPAC)

1*H*-*as*-indaceno[3,2-*d*]oxacyclododecin-7,15-dione, 2-[(6-deoxy-3-*O*-ethyl-2,4-di-*O*-methyl- α -L-mannopyranosyl)oxy]-13-[[(2*R*, 5*S*, 6*R*)-5-(dimethylamino) tetrahydro-6-methyl-2*H*-pyran-2-yl]oxy]-9-ethyl-2,3,3*a*,4,5,5*a*,5*b*,6,9,10,11,12,13,14,16*a*,16*b*-hexadecahydro-14-methyl-(2*R*, 3*aR*, 5*aR*, 5*bS*, 9*S*, 13*S*, 14*R*, 16*aS*, 16*bR*) (CAS)

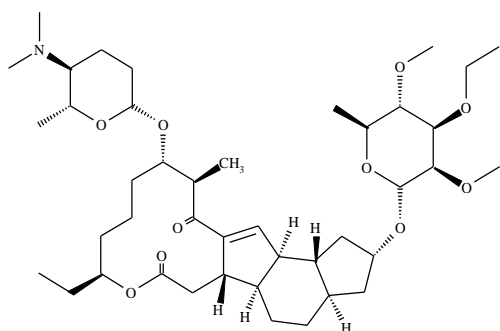
スピネトラム-L

(1*S*, 2*S*, 5*R*, 7*S*, 9*S*, 10*S*, 14*R*, 15*S*, 19*S*)-7-(6-deoxy-3-*O*-ethyl-2,4-di-*O*-methyl- α -L-mannopyranosyloxy)-15-[(2*R*, 5*S*, 6*R*)-5-(dimethylamino) tetrahydro-6-methylpyran-2-yloxy]-19-ethyl-4,14-dimethyl-20-oxatetracyclo[10.10.0.0^{2,10}.0^{5,9}]docosa-3,11-diene-13,21-dione (IUPAC)

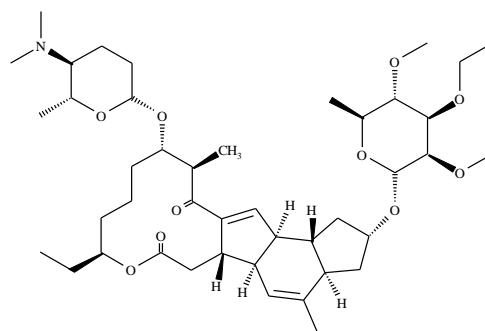
1*H-as*-indaceno[3, 2-*d*]oxacyclododecin-7, 15-dione, 2-[(6-deoxy-3-*O*-ethyl-2, 4-di-*O*-methyl- α -L-mannopyranosyl)oxy]-13-[[(2*R*, 5*S*, 6*R*)-5-(dimethylamino) tetrahydro-6-methyl-2*H*-pyran-2-yl]oxy]-9-ethyl-2, 3, 3*a*, 5*a*, 5*b*, 6, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 16*a*, 16*b*-tetradecahydro-4, 14-dimethyl-(2*S*, 3*aR*, 5*aS*, 5*bS*, 9*S*, 13*S*, 14*R*, 16*aS*, 16*bS*) (CAS)

(4) 構造式及び物性

スピネトラム-J



スピネトラム-L



分子式 $C_{42}H_{69}NO_{10}$

分子量 748.02

水溶解度 10.0 mg/L (20°C)

分配係数 $\log_{10}Pow = 2.44 \pm 0.10$ (pH 5)

$\log_{10}Pow = 4.09 \pm 0.16$ (pH 7)

$\log_{10}Pow = 4.22$ (pH 9)

分子式 $C_{43}H_{69}NO_{10}$

分子量 760.03

水溶解度 31.9 mg/L (20°C)

$\log_{10}Pow = 2.94 \pm 0.05$ (pH 5)

$\log_{10}Pow = 4.49 \pm 0.09$ (pH 7)

$\log_{10}Pow = 4.82$ (pH 9)

(メーカー提出資料より)

2. 適用の範囲及び使用方法

本剤の適用の範囲及び使用方法は以下のとおり。

本剤については、りんご、なし、もも、トマト、キャベツ等に新規登録申請、レモン、オレンジ、グレープフルーツ等に係る残留基準の設定についてインポートトレランス申請がされている。

(1) 国内での使用方法

① 25.0%スピネトラム 水和剤

| 作物名 | 適用病害虫名 | 希釈倍数 | 使用液量 | 使用時期 | 本剤の使用回数 | 使用方法 | スピネトラムを含む農薬の総使用回数 |
|-----|--|------------------|------------------|------------|---------|------|-------------------|
| りんご | キンモホカ ^g シクイムシ類 ハマキムシ類 | 5000～ 10000 倍 | 200～700 L/10a | 収穫前日 まで | 2 回以内 | 散布 | 2 回以内 |
| なし | シクイムシ類 | | | | | | |
| もも | モモハダシガ ^g | | | | | | |

② 11.7%スピネトラム 水和剤

| 作物名 | 適用病害虫名 | 希釈倍数 | 使用液量 | 使用時期 | 本剤の使用回数 | 使用方法 | スピネトラムを含む農薬の総使用回数 | | | | | |
|-------------------|---|----------------------|------------------|------------|---------|------|-------------------|------------------|------------------|----|--|----|
| トマト ミニトマト | ハダニ ^g 類 | 2500～ 5000倍 | 100～ 300L/10a | 収穫前日 まで | 2回以内 | 散布 | 2回以内 | | | | | |
| なす | アザミウマ類 | 2500倍 | | | | | | | | | | |
| キャベツ | コナガ アオムシ タマキ ^g 類 ハイマダラ ^g 類 ハスモンヨトウ ヨトウムシ | 2500～ 5000倍 | | | | | | | | | | |
| | ねぎ | ネギアザミウマ | | | | | | | | | | |
| | | ネギハダニ ^g 類 | | | | | | 2500倍 | | | | |
| レタス 非結球 レタス | ハダニ ^g 類 | 2500～ 5000倍 | | | | | | 200～ 400L/10a | 摘採 7 日前ま で | 1回 | | 1回 |
| いちご | アザミウマ類 | | | | | | | | | | | |
| 茶 | チャノキイロアザミウマ チャノコカクモンハマキ チャノホカ ^g チャハマキ ヨモギエダシヤク | | | | | | | | | | | |

③ 0.50%スピネトラム 粒剤

| 作物名 | 適用 病害虫名 | 使用量 | 使用時期 | 本剤の 使用 回数 | 使用 方法 | スピネトラム を含む農薬の 総使用回数 |
|----------------|------------|--|-----------------------|-----------------|------------------------|---------------------------|
| 稲 (箱育 苗) | コブノメイガ | 育苗箱 (30×60×3cm、 使用土壌約5L) 1箱当り 50g | は種時 (覆土前～ 移植当日) | 1回 | 育苗箱の上 から均一に 散布する | 1回 |

(2) 海外での使用方法

① 25%スピネトラム 顆粒水和剤 (米国)

| 作物名 | 適用 病害虫名 | 栽培期間中の 総使用量 | 使用時期 | 使用方法 | 本剤の 使用回数 |
|-------------------------|--|----------------|-------------|------|-------------|
| りんご | コドリンガ ナシヒメシンクイ マイマイガ ハモグリガ類 ハマキムシ類 アザミウマ類 ナシキジラミ | 500 g ai/ha | 収穫7日前 まで | 散布 | 4回以内 |
| オレンジ グレープフルーツ レモン | ミカンハモグリガ ミカンキジラミ アザミウマ類 鱗翅目幼虫 | 210 g ai/ha | 収穫前日まで | 散布 | 3回以内 |

②25%スピネトラム顆粒水和剤 (米国以外)

| 作物 | 国 | 散布 | | | | | 栽培期間中の総 使用量 (g ai/ha) | PHI (日) |
|----------|----------|----------|------------------|-----------|----------|-----|-----------------------------|------------|
| | | 方法 | 散布量 (g ai/ha) | 間隔 (日) | 最大 回数 | | | |
| 西洋 なし | オーストラリア | 茎葉 散布 | 30-100 | 14 | 4 | - | 7日 | |
| | カナダ | | 53-105 | 7 | 3 | - | | |
| | ニュージーランド | | 50 | 14 | 4 | - | | |
| | 米国 | | 79-123 | 7 | 4 | 500 | | |

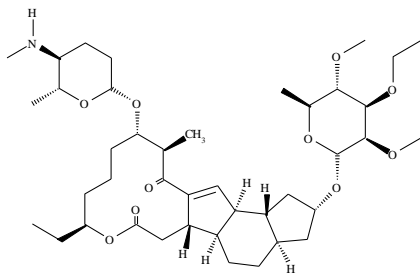
3. 作物残留試験

(1) 分析の概要

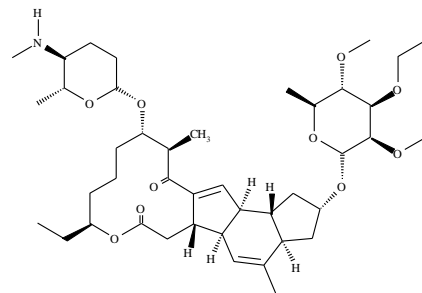
1) スピネトラムの分析

①分析対象の化合物

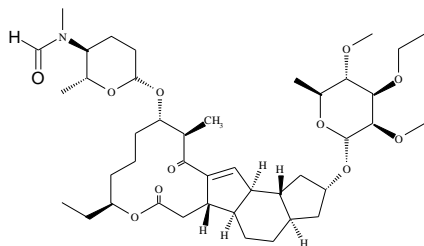
- スピネトラム-J
- スピネトラム-L
- (2*R*, 3*aR*, 5*aR*, 5*bS*, 9*S*, 13*S*, 14*R*, 16*aS*, 16*bR*)-9-ethyl-14-methyl-13-
{[(2*S*, 5*S*, 6*R*)-6-methyl-5-(methylamino) tetrahydro-2*H*-pyran-2-yl]oxy}-
7, 15-dioxo-2, 3, 3*a*, 4, 5, 5*a*, 5*b*, 6, 7, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16*a*, 16*b*-
octadecahydro-1*H*-as-indaceno[3, 2-*d*]oxacyclododecin-2-yl 6-deoxy-3-*O*-
ethyl-2, 4-di-*O*-methyl-β-*L*-mannopyranoside (代謝物B)
- (2*S*, 3*aR*, 5*aS*, 5*bS*, 9*S*, 13*S*, 14*R*, 16*aS*, 16*bS*)-9-ethyl-4, 14-dimethyl-13-
{[(2*S*, 5*S*, 6*R*)-6-methyl-5-(methylamino) tetrahydro-2*H*-pyran-2-yl]oxy}-
7, 15-dioxo-2, 3, 3*a*, 5*a*, 5*b*, 6, 7, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16*a*, 16*b*-hexadecahydro-
1*H*-as-indaceno[3, 2-*d*]oxacyclododecin-2-yl 6-deoxy-3-*O*-ethyl-2, 4-
di-*O*-methyl-β-*L*-mannopyranoside (代謝物C)
- (2*R*, 3*S*, 6*S*)-6-({(2*R*, 3*aR*, 5*aR*, 5*bS*, 9*S*, 13*S*, 14*R*, 16*aS*, 16*bR*)-2-[(6-deoxy-3-*O*-
ethyl-2, 4-di-*O*-methyl-β-*L*-mannopyranosyl)oxy]-9-ethyl-14-methyl-7, 15-
dioxo-2, 3, 3*a*, 4, 5, 5*a*, 5*b*, 6, 7, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16*a*, 16*b*-octadecahydro-
1*H*-as-indaceno[3, 2-*d*]oxacyclododecin-13-yl}oxy)-2-methyltetrahydro-2*H*-
pyran-3-yl (methyl) formamide (代謝物D)
- (2*R*, 3*S*, 6*S*)-6-({(2*S*, 3*aR*, 5*aS*, 5*bS*, 9*S*, 13*S*, 14*R*, 16*aS*, 16*bS*)-2-[(6-deoxy-3-*O*-
ethyl-2, 4-di-*O*-methyl-β-*L*-mannopyranosyl)oxy]-9-ethyl-4, 14-dimethyl-
7, 15-dioxo-2, 3, 3*a*, 5*a*, 5*b*, 6, 7, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16*a*, 16*b*-hexadecahydro-
1*H*-as-indaceno[3, 2-*d*]oxacyclododecin-13-yl}oxy)-2-methyltetrahydro-2*H*-
pyran-3-yl (methyl) formamide (代謝物E)



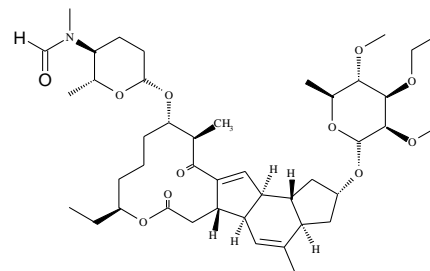
代謝物B



代謝物C



代謝物D



代謝物E

② 分析法の概要

スピネトラム、代謝物B, 代謝物C, 代謝物D及び代謝物Eの分析法

試料から含水アセトニトリルで抽出後、ポリマー系ミニカラム及びNH₂ミニカラムで精製し、液体クロマトグラフ/タンデム型質量分析計(LC/MS/MS)を用いて定量する。

以下、代謝物B、代謝物C、代謝物D及び代謝物Eの定量限界及び残留量については、次の換算係数を用いて代謝物B及び代謝物Dはスピネトラム-Jに換算した値を、代謝物C及び代謝物Eはスピネトラム-Lに換算した値を示す。

代謝物B : 1.02

代謝物C : 1.02

代謝物D : 0.98

代謝物E : 0.98

定量限界:

スピネトラム (スピネトラム-J及びスピネトラム-Lの合量) : 0.02 ppm

スピネトラム-J : 0.01 ppm

スピネトラム-L : 0.01 ppm

代謝物B : 0.011 ppm

代謝物C : 0.011 ppm

代謝物D : 0.010 ppm

代謝物E : 0.010 ppm

2) スピノサドの分析

りんご、オレンジ、グレープフルーツ及びレモンについて、スピネトラムと類似構造を持つマクロライド系殺虫剤スピノサドの作物残留試験が提出された。

スピノサドの作物残留試験結果をスピネトラムの作物残留の評価に利用することが適切かを検討するため、比較試験が実施され、水和剤を複数回、茎葉処理した後のりんご、てんさい、芝草、リーフレタス、オレンジ及びトマトにおけるスピネトラム、スピノサド及びそれらの代謝物の残留量が測定された。

分析対象の化合物、分析法の概要は、スピネトラムについては上記1)の①、②のとおり、スピノサドについては以下の①、②のとおりである。

①分析対象の化合物

スピノサドはスピノシンAとスピノシンDの混合物であり、以下の化合物を分析対象化合物とした。

スピノシンA

(2*R*, 3*aS*, 5*aR*, 5*bS*, 9*S*, 13*S*, 14*R*, 16*aS*, 16*bR*)-2-(6-デオキシ-2, 3, 4-トリ-*O*-メチ

ル- α -L-マンノピラノシルオキシ)-13-(4-ジメチルアミノ-2,3,4,6-テトラデオキシ- β -D-エリスロピラノシルオキシ)-9-エチル-2,3,3a,5a,5b,6,7,9,10,11,12,13,14,15,16a,16b-ヘキサデカヒドロ-14-メチル-1*H*-8-オキサシクロドデカ[*b*]as-インダセン-7,15-ジオン

スピノシンD

(2*S*, 3*aR*, 5*aR*, 5*bS*, 9*S*, 13*S*, 14*R*, 16*aS*, 16*bR*)-2-(6-デオキシ-2,3,4-トリ-*O*-メチル- α -L-マンノピラノシルオキシ)-13-(4-ジメチルアミノ-2,3,4,6-テトラデオキシ- β -D-エリスロピラノシルオキシ)-9-エチル-2,3,3a,5a,5b,6,7,9,10,11,12,13,14,15,16a,16b-ヘキサデカヒドロ-4,14-ジメチル-1*H*-8-オキサシクロドデカ[*b*]as-インダセン-7,15-ジオン

代謝物スピノシンB

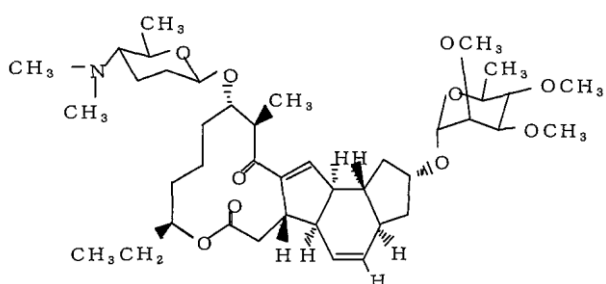
(2*R*, 3*aS*, 5*aR*, 5*bS*, 9*S*, 13*S*, 14*R*, 16*aS*, 16*bR*)-2-(6-デオキシ-2,3,4-トリ-*O*-メチル- α -L-マンノピラノシルオキシ)-13-(4-メチルアミノ-2,3,4,6-テトラデオキシ- β -D-エリスロピラノシルオキシ)-9-エチル-2,3,3a,5a,5b,6,7,9,10,11,12,13,14,15,16a,16b-ヘキサデカヒドロ-14-メチル-1*H*-8-オキサシクロドデカ[*b*]as-インダセン-7,15-ジオン

代謝物スピノシンK

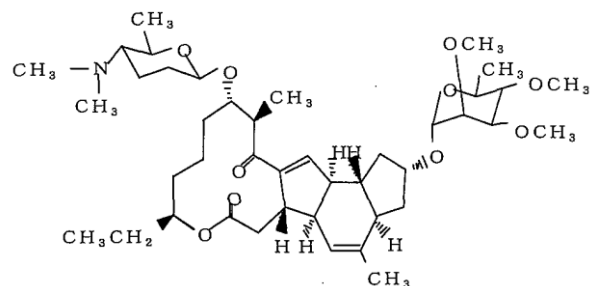
(2*R*, 3*aS*, 5*aR*, 5*bS*, 9*S*, 13*S*, 14*R*, 16*aS*, 16*bR*)-2-(6-デオキシ-2,3-ジ-*O*-メチル- α -L-マンノピラノシルオキシ)-13-(4-ジメチルアミノ-2,3,4,6-テトラデオキシ- β -D-エリスロピラノシルオキシ)-9-エチル-2,3,3a,5a,5b,6,7,9,10,11,12,13,14,15,16a,16b-ヘキサデカヒドロ-14-メチル-1*H*-8-オキサシクロドデカ[*b*]as-インダセン-7,15-ジオン

代謝物Demethyl D

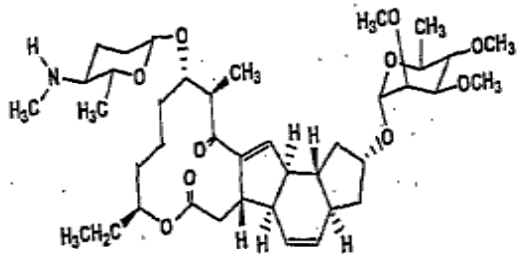
(2*S*, 3*aR*, 5*aS*, 5*bS*, 9*S*, 13*S*, 14*R*, 16*aS*, 16*bR*)-2-(6-デオキシ-2,3,4-トリ-*O*-メチル- α -L-マンノピラノシルオキシ)-13-(4-ジメチルアミノ-2,3,4,6-テトラデオキシ- β -D-エリスロピラノシルオキシ)-9-エチル-2,3,3a,5a,5b,6,7,9,10,13,14,15,16a,16b-ヘキサデカヒドロ-4,14-ジメチル-1*H*-8-オキサシクロドデカ[*b*]as-インダセン-7,15-ジオン



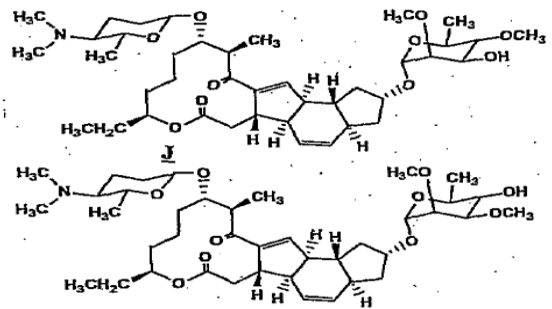
スピノシンA



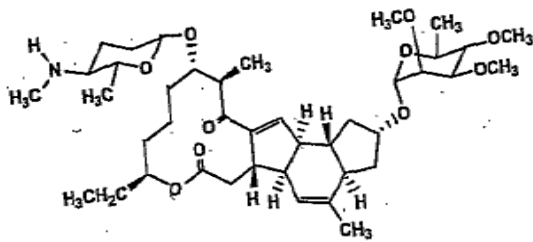
スピノシンD



代謝物スピノシンB



代謝物スピノシンK



代謝物Demethyl D

②分析法の概要

- ・HPLC分析（りんご、グレープフルーツ）

試料から含水アセトニトリルで抽出後、ジクロロメタンで分配し、固相カートリッジで精製し、高速液体クロマトグラフ(HPLC)を用いて定量する。

定量限界： 0.010～0.020 ppm

- ・イムノアッセイ（オレンジ、グレープフルーツ、レモン）

試料から含水アセトニトリルで抽出後、固相カートリッジ等で精製し、イムノアッセイキットを用いて定量する。

定量限界： 0.016 ppm

いずれも、すべての化合物の定量値をそのまま合算して残留量とする。

③比較試験結果

比較試験の結果は以下のとおりであり、総散布量の違いを考慮しても、スピネトラムとスピノサドの残留量はほぼ同様の傾向を示すと考えられ、スピノサドの残留試験結果をスピネトラムの作物残留の評価に利用することは可能であると考えられた。

なお、食品安全委員会によって作成された食品健康影響評価においても、スピノサドの残留試験結果をスピネトラムの作物残留の評価に利用することは可能と評価されている。