Ⅱ．試験結果概要

1．動物体内運命試験

ボスカリドのジフェニル環を ^{14}C で均一に標識したもの（D 標識体）及びピリジン環 3-位を ^{14}C で標識したもの（P 標識体）を用いて各種試験を行った。（他の代謝試験も同様）

（1）ラットにおける動物体内運命試験（単回投与）

D 標識体を 50mg/kg 体重（D 低用量）又は 500mg/kg 体重（D 高用量）の用量で、P 標識体を 500mg/kg 体重（P 高用量）の用量でそれぞれ単回経口投与し、ボスカリドの Wistar ラットを用いた動物体内運命試験を実施した。

投与後 168 時間の尿中及び糞中排泄率は、D 低用量投与群では投与量の 15.7～16.4%及び 79.3～84.9%、D 及び P 高用量投与群では 2.73～5.21%及び 89.6～97.4%であった。48 時間後までの胆汁中排泄は D 低用量投与群で 39.3～39.9%、D 高用量投与群で 10.7～11.9%であった。呼気中排泄は認められなかった。

D 標識体投与での血漿中放射能濃度は投与 8 時間後に最大となり、D 低用量投与群では 1.54～1.58μg eq/g、D 高用量投与群では 3.77～4.46μg eq/g であり、半減期は D 低用量投与群では 30.1～41.7 時間、D 高用量投与群では 20.2～27.4 時間であった。

投与 168 時間後の組織分布は、D 低用量投与群では甲状腺及び肝において高く、0.20～0.23μg eq/g 及び 0.10～0.13μg eq/g、D 及び P 高用量投与群では甲状腺、骨髄、肝、腎及び副腎において高く、1.21～3.03μg eq/g、0.66～2.09μg eq/g、0.30～0.90μg eq/g、0.27～0.50μg eq/g 及び 0.20～0.37μg eq/g であった。

投与 48 時間後までの尿中ではボスカリドが投与量の 0.16%以下検出され、主要代謝物は F01[1]（フェニル環 4 位の水酸化体）、F02（グルクロン酸抱合体）及び F48（S-グルクロン酸抱合体）であり、D 低用量投与群で 9.58～15.8%、2.95～4.33%及び 1.10～2.28%が、D 及び P 高用量投与群で 0.51～2.93%、0.08～2.74%及び 0.03～0.44%が検出された。糞中ではボスカリドが D 低用量投与群で投与量の 30.5～41.0%、D 及び P 高用量投与群で 68.3～80.4%検出され、主要代謝物は F01、F06（SH 化合物）、F20（S-メチル化合物）及び F48 であり、D 低用量投与群で 19.0～21.8%、4.88～7.57%、3.79～6.21%及び 2.84%以下が、D 及び P 高用量投与群で 4.10～5.5%、3.00～7.59%、不検出及び 0.63%以下が検出された。胆汁中ではボスカリドは検出されず、主要代謝物は F02 及び F05（システイン抱合体）であり、D 低用量投与群で投与量の 19.3%及び 14.2%が、D 高用量投与群で 4.78%及び 3.59%が検出された。

投与 8 時間後までの肝及び腎中ではボスカリドは投与量の 0.01～0.03%で検出された。主要代謝物は肝で F02、F43（グルタチオン抱合体）及び F46（グルタチオン抱合体）であり、0.20～0.38%、0.14～0.26%及び 0.03～0.24%が検出された。腎ではいずれの代謝物も投与量の 0.06%以下であった。

ボスカリドのラットにおける主要代謝経路は、ジフェニル環の水酸化（F1）及びグルタチオン抱合（F46）、あるいはピリジン環クロロ基とグルタチオンのチオール基との置換（F43）であると考えられる。（参照 2～3）

---

[1] 代謝物の略称は別紙 1 を参照（以下同じ）

（2）ラットにおける動物体内運命試験（反復投与）

非標識体のボスカリドを 500mg/kg 体重/日の用量で 1 日 1 回、14 日又は 28 日強制経口投与後、D 標識体を同用量で単回経口投与し、ボスカリドの Wistar ラットを用いた動物体内運命試験を実施した。

投与後 48 時間では、尿中に 8.61～14.76%、糞中に 67.67～75.65%排泄された。尿中からは主要代謝物として F01 が 0.77～2.89%、F02 が 4.29～10.75%、糞中からはボスカリドが 29.35～37.98%、主要代謝物として F01 が 12.93～24.51%検出された。

反復投与による代謝は単回投与と比較して顕著な差は認められなかった。(参照 4)

2．植物体内運命試験

（1）レタスにおける植物体内運命試験

D 標識体及び P 標識体を用いて散布液を調製し、ポット栽培のレタス（品種：Nadine）に 1 回あたり 700g a.i./ha で、1 回目の散布は移植 8 日後に、その後 14 日間隔で 2 回の計 3 回散布後、最終散布 18 日後に検体として茎葉部を採取し、ボスカリドのレタスにおける植物体内運命試験を行った。

総残留放射能 (TRR) は 17.5～17.6ppm であり、抽出された放射性物質 (TRR の 99.3%) はほぼ全てボスカリドであった。

ボスカリドはレタスにおいてほとんど代謝を受けないと考えられる。(参照 5)

（2）ぶどうにおける植物体内運命試験

D 標識体及び P 標識体を用いて散布液を調製し、ぶどう（品種：Mueller-Thurgau）に 1 回あたり 800g a.i./ha で 3 回散布後、最終処理 45 日後に検体として果房及び茎葉部を採取し、ボスカリドのぶどうにおける植物体内運命試験を行った。

果実、果柄及び葉部の TRR は 1.18～2.07ppm、12.4～19.6ppm 及び 43.7～63.4ppm であり、このうち、ボスカリドは果実、果柄及び葉部で TRR の 92.2～92.7%、96.4～97.6%及び 95.6～96.1%検出された。

ボスカリドはぶどうにおいてほとんど代謝を受けないと考えられる。(参照 6)

（3）いんげんまめにおける植物体内運命試験

D 標識体及び P 標識体を用いて散布液を調製し、1 回あたり 500 g a.i./ha でいんげんまめ（品種：Hild's Maxi）の開花始期に 1 回散布し、その後 8～10 日間隔で 2 回散布後、最終散布 14～15 日後（未成熟期）、51～53 日後（成熟期）に検体として子実、莢及び茎葉部を採取し、ボスカリドのいんげんまめにおける植物体内運命試験を行った。

未成熟期の子実、莢及び茎葉部の TRR は 0.067～0.198ppm、0.108～0.903ppm 及び 17.0～66.2ppm、成熟期では 0.126～0.205ppm、1.37～6.12ppm 及び 93.8～127ppm であった。このうち、ボスカリドは未成熟期の子実、莢及び茎葉部で TRR の 64.9～87.5%、87.0～96.7%及び 98.4～98.6%、成熟期で 36.9～72.0%、79.7～94.5%及び 93.6～95.1%検出された。同定された代謝物は、P 標識体処理群で代謝物 F47（クロロニコチン酸）が未成熟期の子実及び莢で TRR の 9.97%及び 2.15%、成熟期の子実及び莢で 1.72%及び 1.11%、D 標識体処理群で代謝物 F62（クロロフェニルアミノベンゼン）が成熟期の茎葉部で 0.50%検

出された。

ボスカリドはいんげんまめにおいてあまり代謝を受けず、代謝を受ける場合の主要代謝経路は、ジフェニル環部分とピリジン環部分のアミド結合の開裂であると考えられる。また、想定代謝物からジフェニル環またはピリジン環の水酸化とそれに続く抱合化が起こると考えられる。(参照 7)

3．土壌中運命試験

（1）好気的土壌運命試験

D 標識体及び P 標識体をそれぞれ 0.993mg/kg、1.022mg/kg の用量で砂質壌土に添加後、20℃の暗所で 364 日間インキュベーションし、ボスカリドの好気的土壌中運命試験を行った。

D 標識体処理土壌では、非抽出性放射能は試験開始 266 日目で処理放射能の 62.7%に達し、364 日目には 60.0%となった。二酸化炭素の発生量は、処理放射能の累積で 15.5%であった。P 標識体処理土壌では、非抽出放射能は 364 日目に処理放射能の 50.1%に達し、二酸化炭素は累積で 25.4%であった。

抽出性残留放射能（ERR）は経時的に減少し、364 日後では 17.8～18.4%であった。このうち、ボスカリドは 16.7～17.3%、分解物のうち F49 及び F50 が 0.1～0.2%、0.1%以下検出された。ボスカリドの半減期、90%分解期間はそれぞれ 108 日、360 日であった。

ボスカリドは好気性土壌中で緩やかな分解を受け、分解を受ける場合の主要分解経路は、ピリジン環の水酸化（F50）又はピリジン環のクロロ基の置換水酸化（F49）であると考えられる。(参照 8)

（2）嫌気的土壌運命試験

湛水にして嫌気状態の砂質壌土に D 標識体を 1mg/kg 及び 30mg/kg、P 標識体を 1mg/kg になるように添加し、20℃の暗所で 120 日間インキュベーションし、ボスカリドの嫌気的土壌中運命試験を行った。

1mg/kg 処理時の ERR は経時的に減少し、120 日後では 73.9～84.2%であった。このうち、ボスカリドは 73.6～77.0%、同定された分解物として、P 標識体処理群では F47 が 6.7%、D 標識体では 30mg/kg 処理群では F08（ピリジン環の脱塩素化合物）、F49、F50 等が確認された。二酸化炭素は 120 日後には 0.1～0.4%生成した。ボスカリドの半減期は 261～345 日であった。

ボスカリドは嫌気性土壌中であまり分解を受けず、分解を受ける場合の主要分解経路は、ジフェニル環部分とピリジン環部分のアミド結合の開裂であるとしている。また、わずかながら、ピリジン環の水酸化（F50）、ピリジン環のクロロ基の置換（F08）又は置換水酸化（F49）が起こると考えられる。(参照 9～10)

（3）土壌表層光分解試験

P 標識体を最大容水量の 40%に水分を調整した砂質壌土に乾燥土壌当たり 4.6μg/g で添加後、22±1℃で 15 日間キセノン光を照射（290nm 以上で 3mW/cm²）し、ボスカリドの土壌表層光分解試験を行った。

15 日間の光照射後、ボスカリドは 90.6%が残留していた。二酸化炭素の発生量は 15 日後に 0.2%であった。ボスカリドの半減期は 135 日であった。暗条件下では分解は認められなかった。

ボスカリドの土壌表層における光分解性は緩やかであるが、光によってその分解が促進すると考えられる。(参照 11)

(4) 土壌吸着試験

ボスカリドの土壌吸着試験を 4 種類の国内土壌（畑地土壌淡色黒ボク土、畑地土壌灰色低地土、水田土壌灰色低地土、畑地土壌砂丘未熟土）を用いて行った。

吸着係数 Kd =15.5～37.2、有機炭素含量に基づく吸着係数 $K'_{OC}=6.72\times10^2\sim1.76\times10^3$ であった。(参照 12)

4. 水中運命試験

(1) 水中加水分解試験

D 標識体を pH 4、pH 7、pH 9 の各緩衝液に濃度 3mg/L になるように加えた後、50℃で 5 日間又は 25℃で 30 日間それぞれインキュベーションし、ボスカリドの水中加水分解試験を行った。

50℃における 5 日後及び 25℃における 30 日後の緩衝液中での放射能量は処理量の 100.3～101.1%及び 99.4～99.5%であった。ボスカリドはほとんど加水分解されず半減期は算出されなかった。(参照 13)

(2) 水中光分解試験（緩衝液、自然水）

P 標識体を pH 5 の滅菌酢酸緩衝液及び非滅菌自然水にそれぞれ濃度約 3μg/mL 及び 2.33μg/mL になるように加えた後、22±1℃で 15 及び 8 日間キセノン光を照射（315～400nm の範囲で 3mW/cm²）し、ボスカリドの水中光分解試験を行った。

15 日後の緩衝液中での放射能量は処理量の 94.4%であった。また、8 日後の自然水中での放射能量は処理量の 94.4%であった。半減期は算出されなかった。(参照 14～15)

(3) 水中光分解試験（蒸留水、河川水）

ボスカリドを滅菌蒸留水及び滅菌河川水に濃度約 1mg/L になるように加えた後、24.6～24.8 及び 24.9～26.6℃で 120 時間キセノン光を照射（290～800nm の範囲で 609 及び 612W/m²）し、ボスカリドの水中光分解試験を行った。

残存濃度は 120 時間後に蒸留水及び河川水で 0.996mg/L 及び 0.944mg/L であった。半減期は算出されなかった。(参照 16)

(4) 水中光分解試験（自然条件下）

D 標識体を底質相の共存下、非滅菌自然水に 700g a.i./ha (試験系として 460μg a.i./2L) になるように加えた後、自然光暴露下で 120 日間インキュベーションし、ボスカリドの水中光分解試験を行った。

水相中放射能濃度は経時的に減少し、120 日後には 22.0%であった。一方、底質相中放

射能濃度は、103 日後に 80.3%で最大となり、120 日後には 51.2%であった。物質収支損失は 120 日後に 26.8%であり、主に CO_2 の生成によるものと思われる。

抽出された放射性物質のうち、120 日後にはボスカリドが水相及び底質相で 19.2%及び 26.5%、同定された分解物は水相中で F64（パラクロロ安息香酸）が最大 9.42%検出された。

ボスカリドの水中光分解経路として、パラクロロ安息香酸及び未知代謝物への分解、無機化等が起こると考えられる。(参照 17)

5．作物残留試験

ぶどう、いちご、トマト、なす、きゅうり、たまねぎ、小豆、いんげん、りんご、なし及びおうとうを用いて、ボスカリドを分析対象化合物とした作物残留試験が実施されている。その結果は表1のとおりであり、最高値は、最終散布後1日目に収穫したいちごの7.39ppmであったが、3日目、7日目にはそれぞれ7.00ppm、4.46ppmと減衰した。(参照18～19)

表１　作物残留試験成績

作物名 実施年	試験圃場数	剤型	使用量 (g a.i./ha)	回数 (回)	PHI 経過日数 (日)	残留値(ppm) 最高値	残留値(ppm) 平均値
ぶどう (大粒種) 2000年	2	DF	1410～1880	3	7 14 21	5.20 4.19 3.85	3.86 3.37 3.03
いちご 2000年	2	DF	735.6～1175	3	1 3 7	7.39 7.00 4.46	4.28 3.80 2.23
トマト 2000年	2	DF	940	3	1 3 7	1.09 0.561 0.656	0.85 0.51 0.54
なす 2000年	2	DF	860.1～940	3	1 3 7	0.940 0.647 0.363	0.69 0.46 0.22
きゅうり 2000年	2	DF	940～1175	3	1 3 7	2.13 1.06 0.53	1.25 0.73 0.35
たまねぎ 2000年	2	DF	705	3	1 7 14	0.070 0.036 0.007	0.023 0.012 0.0053
小豆 (乾燥小実) 2000年	2	DF	705	3	7 14 20	0.138 0.078 0.064	0.123 0.072 0.056
いんげん (乾燥小実) 2000年	2	DF	705	3	7 14 21	0.402 0.551 0.685	0.19 0.32 0.41

いんげん (乾燥小実) 2002年	2	DF	705	2	21 28 35 45	0.446 0.455 0.288 0.138	0.36 0.36 0.23 0.10
りんご 2000年	2	SE	408～425	3	1 7 14	0.579 0.530 0.409	0.40 0.41 0.30
なし 2000年	2	SE	204～272	3	1 7 14	0.569 0.403 0.459	0.45 0.32 0.34
おうとう 2000年	2	SE	340	3	1 3 7	1.32 1.31 0.83	0.84 0.80 0.61

注）a.i.：有効成分量、PHI：最終使用－収穫間隔日数、
DF：ドライフロアブル、SE：SE 剤（懸濁剤と乳濁剤が一つの製剤に含まれるもの）
・一部に検出限界以下（<0.01）を含むデータの平均値は 0.01 として計算した。

上記の作物残留試験成績に基づき、国内で栽培される農産物から摂取されるボスカリドの推定摂取量を表 2 に示した。なお、本推定摂取量の算定は、申請された使用方法からボスカリドが最大の残留を示す使用条件で、全ての適用作物に使用され、加工・調理による残留農薬の増減が全くないとの仮定の下に行った。

表２　食品中より摂取されるボスカリドの推定摂取量　（単位：μg/人/日）

作物名	残留値 (ppm)	国民平均		小児 (1～6 歳)		妊婦		高齢者 (65 歳以上)	
		ff	摂取量	ff	摂取量	ff	摂取量	ff	摂取量
ぶどう	3.86	5.8	22.4	4.4	17.0	1.6	6.2	3.8	14.7
いちご	4.28	0.3	1.3	0.4	1.7	0.1	0.4	0.3	1.3
トマト	0.85	24.3	20.7	16.9	14.4	24.5	20.8	18.9	16.1
なす	0.69	4	2.8	0.9	0.6	3.3	2.3	5.7	3.9
きゅうり	1.25	16.3	20.4	8.2	10.3	10.1	12.6	16.6	20.8
たまねぎ	0.023	30.3	0.7	18.5	0.4	33.1	0.8	22.6	0.5
小豆	0.123	1.4	0.6	0.5	0.2	0.1	0.0	2.7	1.1
いんげん	0.41								
りんご	0.41	35.3	14.5	36.2	14.8	30	12.3	35.6	14.6
なし	0.45	5.1	2.3	4.4	2.0	5.3	2.4	5.1	2.3
おうとう	0.84	0.1	0.1	0.1	0.1	0.1	0.1	0.1	0.1
合計			85.8		61.5		57.9		75.4

注）・残留値は、申請されている使用時期・使用回数による各試験区の平均残留値のうち最大のものを用いた（参照 表 1）。
・「ff」：平成 10 年～12 年の国民栄養調査（参照 20～22）の結果に基づく農産物摂取量（g/人/日）
・「摂取量」：残留値及び農産物残留量から求めたボスカリドの推定摂取量（μg/人/日）