

水質汚濁に係る農薬登録基準の設定に関する資料

ポリオキシン複合体

I. 評価対象農薬の概要

1. 物質概要

ポリオキシン A

化学名 (IUPAC)	1-[5-(2-アミノ-5-O-カルバモイル-2-デオキシ-L-キシロンアミド)-1,5-ジデオキシ-1-(1,2,3,4-テトラヒドロ-5-ヒドロキシメチル-2,4-ジオキソピリミジニル)-β-D-アロフランウロノイル]-3-エチリデン-2-アゼチジンカルボン酸				
分子式	C ₂₃ H ₃₂ N ₆ O ₁₄	分子量	616.5	CAS 登録番号 (CAS RN [®])	19396-03-3
構造式					

ポリオキシン B

化学名 (IUPAC)	5-(2-アミノ-5-O-カルバモイル-2-デオキシ-L-キシロンアミド)-1,5-ジデオキシ-1-(1,2,3,4-テトラヒドロ-5-ヒドロキシメチル-2,4-ジオキソピリミジニル)-β-D-アロフランウロン酸				
分子式	C ₁₇ H ₂₅ N ₅ O ₁₃	分子量	507.4	CAS 登録番号 (CAS RN [®])	19396-06-6
構造式					

ポリオキシン G

化学名 (IUPAC)	5-(2-アミノ-5-O-カルバモイル-2,3-ジデオキシ-L-キシロンアミド)-1,5-ジデオキシ-1-(1,2,3,4-テトラヒドロ-5-ヒドロキシメチル-2,4-ジオキソピリミジニル)-β-D-アロフランウロン酸				
分子式	C ₁₇ H ₂₅ N ₅ O ₁₂	分子量	491.4	CAS 登録番号 (CAS RN®)	22976-88-1
構造式					

ポリオキシン H

化学名 (IUPAC)	1-[5-(2-アミノ-5-O-カルバモイル-2-デオキシ-L-キシロンアミド)-1,5-ジデオキシ-1-(1,2,3,4-テトラヒドロ-5-メチル-2,4-ジオキソピリミジニル)-β-D-アロフランウロノイル]-3-エチリデン-2-アゼチジンカルボン酸				
分子式	C ₂₃ H ₃₂ N ₆ O ₁₃	分子量	600.5	CAS 登録番号 (CAS RN®)	24695-54-3
構造式					

ポリオキシン J

化学名 (IUPAC)	5 - (2-アミノ-5-O-カルバモイル-2-デオキシ-L-キシロンアミド) - 1, 5-ジデオキシ-1 - (1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-5-メチル-2, 4-ジオキソピリミジニル) - β-D-アロフランウロン酸				
分子式	C ₁₇ H ₂₅ N ₅ O ₁₂	分子量	491.4	CAS 登録番号 (CAS RN [®])	22976-89-2
構造式					

ポリオキシン K

化学名 (IUPAC)	1 - [5 - (2-アミノ-5-O-カルバモイル-2-デオキシ-L-キシロンアミド) - 1, 5-ジデオキシ-1 - (1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2, 4-ジオキソピリミジニル) - β-D-アロフランウロノイル] - 3-エチリデン-2-アゼチジンカルボン酸				
分子式	C ₂₂ H ₃₀ N ₆ O ₁₃	分子量	586.5	CAS 登録番号 (CAS RN [®])	22886-46-0
構造式					

ポリオキシン L

化学名 (IUPAC)	5-(2-アミノ-5-O-カルバモイル-2-デオキシ-L-キシロンアミド)-1,5-ジデオキシ-1-(1,2,3,4-テトラヒドロ-2,4-ジオキソピリミジニル)-β-D-アロフランウロン酸				
分子式	C ₁₆ H ₂₃ N ₅ O ₁₂	分子量	477.4	CAS 登録番号 (CAS RN®)	22976-90-5
構造式					

ポリオキシン M

化学名 (IUPAC)	5-(2-アミノ-5-O-カルバモイル-2,3-ジデオキシ-L-キシロンアミド)-1,5-ジデオキシ-1-(1,2,3,4-テトラヒドロ-2,4-ジオキソピリミジニル)-β-D-アロフランウロン酸				
分子式	C ₁₆ H ₂₃ N ₅ O ₁₁	分子量	461.4	CAS 登録番号 (CAS RN®)	34718-88-2
構造式					

※ポリオキシン複合体原体中には、有効成分として 8 種類のポリオキシン類が含まれていることが分かっている。中でも、ポリオキシン A、ポリオキシン B、ポリオキシン K、ポリオキシン L の主要 4 成分が重量%で約 20%を占め、4 成分合計 (*Alternaria mali* Roberts ACI-1157 に対する力価を用いてポリオキシン B に換算した値) への寄与率は約 80%であることが分かっている。

2. 作用機構等

ポリオキシシン複合体は、ポリオキシシン A、ポリオキシシン B、ポリオキシシン K、ポリオキシシン L の 4 成分を主要成分とする殺虫殺菌剤であり、糸状菌細胞壁構成成分であるキチンの生合成中間体（UDP-N-アセチルグルコサミン）の構造とポリオキシシンの構造が類似しているために、キチン合成酵素の拮抗的阻害が引き起こされることによるものと、考えられている。

本邦での初回登録は 1968 年である。

製剤は水和剤、水溶剤、乳剤があり、適用農作物等は果樹、野菜、樹木、花き等がある。

原体の国内生産量は、79.7t（平成 29 年度[※]）、30.6t（平成 30 年度[※]）、原体の輸入量は 55.4t（平成 29 年度[※]） 47.8t（平成 30 年度[※]）、82.0t（令和元年度[※]）であった。

※年度は農薬年度（前年 10 月～当該年 9 月）、出典：農薬要覧-2020-（（一社）日本植物防疫協会）

3. 各種物性等
 ポリオキシン B

外観・臭気	白色結晶性粉末、無臭 (常温常圧)	土壌吸着係数	$K_{F^{ads}_{OC}} = 23-12,000$
融点	195.4℃で分解するため 測定不能	オクタノール /水分配係数	$\log D_{ow} < -2.28$ (pH4、25℃) < -2.31 (pH7、25℃) < -2.31 (pH9、25℃)
沸点	195.4℃で分解するため 測定不能	生物濃縮性	—
蒸気圧	$< 2 \times 10^{-4}$ Pa (20℃、25℃)	密度	1.7 g/cm ³ (20℃)
加水分解性	半減期 347 日 (25℃、pH4) 178 日 (25℃、pH5) 19.3 日 (25℃、pH7) 8.32 日 (25℃、pH9)	水溶解度	$\geq 1.00 \times 10^5$ mg/L (25℃、蒸留水)
水中光分解性	7 日間安定 (滅菌蒸留水、25℃、人工光、133–176 W/m ² 、280–500 nm) 半減期 18.9 日 (東京春季太陽光換算 72.4 日) (滅菌緩衝液、pH5、25℃、29.79 W/m ² 、300–400 nm) 1.55 日 (東京春季太陽光換算 5.94 日) (滅菌自然水、pH6.1、25℃、29.79 W/m ² 、300–400 nm) 3.10 日 (東京春季太陽光換算 11.9 日) (滅菌緩衝液、pH7、25℃、29.79 W/m ² 、300–400 nm) 6.22 日 (東京春季太陽光換算 23.8 日) (滅菌緩衝液、pH9、25℃、29.79 W/m ² 、300–400 nm)		
pKa	pKa ₁ = 7.27 (20℃) 、 pKa ₂ = 9.62 (20℃)		

【参考情報】

ポリオキシン A

外観・臭気	白色綿状、一部塊を含む固体、無臭（常温常圧）	土壌吸着係数	$K_{F^{ads}OC} = 2.0 - 2.6$
融点	209°Cで分解するため測定不能	オクタノール／水分配係数	$\log Dow < -2.31 (25^\circ C, pH4)$ $< -2.30 (25^\circ C, pH7)$ $< -2.29 (25^\circ C, pH9)$
沸点	209°Cで分解するため測定不能	生物濃縮性	—
蒸気圧	$8 \times 10^{-4} Pa$ (20°C、25°C)	密度	$1.5 g/cm^3$ (20°C)
加水分解性	半減期 3,013 時間 (25°C、pH4) 2,318 時間 (50°C、pH4) 1,308 時間 (60°C、pH4) 2,739 時間 (25°C、pH7) 430 時間 (50°C、pH7) 224 時間 (60°C、pH7) 1,003 時間 (25°C、pH9) 158 時間 (50°C、pH9) 104 時間 (60°C、pH9)	水溶解度	$5.80 \times 10^4 mg/L$ (25°C、蒸留水)
水中光分解性	半減期 8.25 日 (滅菌緩衝液、42 W/m ²) 0.72 日 (滅菌自然水、42 W/m ²)		
pKa	$pKa_1 = 7.32 (20^\circ C)$ 、 $pKa_2 = 9.58 (20^\circ C)$		

ポリオキシン K

外観・臭気	白色、一部塊を含む結晶性固体、無臭（常温常圧）	土壌吸着係数	$K_{r^{ads}_{oc}} = 0.65 - 9.3$
融点	205℃で分解するため測定不能	オクタノール／水分配係数	$\log Dow < -2.60$ (25℃、pH4) < -2.54 (25℃、pH7) < -2.42 (25℃、pH9)
沸点	205℃で分解するため測定不能	生物濃縮性	—
蒸気圧	4×10^{-4} Pa (20℃、25℃)	密度	1.6 g/cm ³ (20℃)
加水分解性	安定 (25℃、50℃、60℃; pH4) 半減期 2,739 時間 (25℃、pH7) 568 時間 (50℃、pH7) 258 時間 (60℃、pH7) 717 時間 (25℃、pH9) 95 時間 (50℃、pH9) 80 時間 (60℃、pH9)	水溶解度	$\geq 1.00 \times 10^5$ mg/L (25℃、蒸留水)
水中光分解性	半減期 12.5 日 (滅菌緩衝液、48.8W/m ²) 0.45 日 (滅菌自然水、48.8W/m ²)		
pKa	$pK_{a1} = 7.36$ (20℃) 、 $pK_{a2} = 9.50$ (20℃)		

ポリオキシンL

外観・臭気	乳白色、一部塊を含む結晶性粉末、無臭（常温常圧）	土壌吸着係数	$K_{r^{ads}OC} = 2.96 - 800$
融点	175°Cで分解するため測定不能	オクタノール／水分配係数	$\log Dow < -2.53$ (25°C、pH4) < -2.59 (25°C、pH7) < -2.60 (25°C、pH9)
沸点	175°Cで分解するため測定不能	生物濃縮性	—
蒸気圧	9×10^{-5} Pa (20°C、25°C)	密度	1.7 g/cm ³ (20°C)
加水分解性	安定 (25°C、pH4) 半減期 1,157 時間 (50°C、pH4) 502 時間 (60°C、pH4) 450 時間 (25°C、pH7) 173 時間 (50°C、pH7) 112 時間 (60°C、pH7) 1,074 時間 (25°C、pH9) 624 時間 (50°C、pH9) 381 時間 (60°C、pH9)	水溶解度	$\geq 1.00 \times 10^5$ mg/L (25°C、蒸留水)
水中光分解性	半減期 15.2 日 (滅菌緩衝液、48.7 W/m ²) 0.42 日 (滅菌自然水、48.7 W/m ²)		
pKa	$pK_{a1} = 7.28$ (20°C)、 $pK_{a2} = 9.55$ (20°C)		

II. 安全性評価

一日摂取許容量 (ADI)	2.5 mg/kg 体重/日
<p>食品安全委員会は、令和3年6月8日付で、ポリオキシン複合体のADIを2.5 mg/kg 体重/日と設定する食品健康影響評価の結果を厚生労働大臣に通知した。</p> <p>なお、この値は各試験で得られた無毒性量のうち最小値 250 mg/kg 体重/日を安全係数100で除して設定された。</p>	

III. 水質汚濁予測濃度 (水濁 PEC)

1. 製剤の種類及び適用農作物等

農薬登録情報提供システム (<https://pesticide.maff.go.jp>) によれば、本農薬は製剤として水和剤、水溶剤及び乳剤があり、適用農作物等は果樹、野菜、樹木、花き等がある。

2. 水濁 PEC の算出

(1) 非水田使用時の水濁 PEC (第1段階)

非水田使用時において、PECが最も高くなる使用方法(下表左欄)について、第1段階のPECを算出する。算出に当たっては、農薬取締法テストガイドラインに準拠して下表右欄のパラメーターを用いた。

PEC 算出に関する使用方法		各パラメーターの値	
適用農作物等	からまつ	I : 単回・単位面積当たりの有効成分量 (有効成分 g /ha) (左欄の最大使用量に、有効成分濃度を乗じた上で、単位を調整した値)	1,400
剤 型	10%水和剤	N_{app} : 総使用回数 (回)	8
当該剤の単回・単位面積当たり最大使用量	1,400 mL/10a (500倍希釈液、700L/10a)	D_{river} : 河川ドリフト率 (%)	5.8
		Z_{river} : 河川ドリフト面積 (ha)	0.11
地上防除/航空防除の別	地上防除	R_u : 畑地からの農薬流出率 (%)	0.02
使用方法	散布	A_p : 農薬使用面積 (ha)	37.5
総使用回数	8回	F_u : 施用方法による農薬流出補正係数	1

(2) 水濁 PEC 算出結果

使用場面	水濁 PEC (mg/L)
水田使用時	適用なし
非水田使用時 (第 1 段階)	0.0001643...
うち地表流出寄与分	0.0001453...
うち河川ドリフト寄与分	0.0000190...
合 計 ¹⁾	0.0001643... ÷ <u>0.00016 (mg/L)</u>

¹⁾ 水濁 PEC の値は有効数字 2 桁とし、3 桁目を四捨五入して算出した。

IV. 総合評価

1. 水質汚濁に係る登録基準値

登録基準値	6.6 mg/L
以下の算出式により登録基準値を算出した。 ¹⁾	
2.5 (mg/kg 体重/日) ADI	× 53.3 (kg) × 0.1 / 2 (L/人/日) = 6.6625 (mg/L) 体重 10%配分 飲料水摂取量

¹⁾ 登録基準値は、体重を 53.3kg、飲用水を 1 日 2L、有効数字は 2 桁（ADI の有効数字桁数）とし、3 桁目を切り捨てて算出した。

<参考> 水質に関する基準値等

(旧)水質汚濁に係る農薬登録保留基準 ¹⁾	なし
水質要監視項目 ²⁾	なし
水質管理目標設定項目 ³⁾	なし
ゴルフ場指導指針 ⁴⁾	なし
WHO 飲料水水質ガイドライン ⁵⁾	なし

¹⁾ 平成 17 年 8 月 3 日改正前の「農薬取締法第 3 条第 1 項第 4 号から第 7 号までに掲げる場合に該当するかどうかの基準を定める等の件」（昭和 46 年 3 月 2 日農林省告示 346 号）第 4 号に基づき設定された基準値。

²⁾ 水質汚濁に係る要監視項目として、直ちに環境基準とはせず、引き続き知見の集積に努めるべきとされた物質に係る指針値。

³⁾ 水道法に基づく水質基準とするには至らないが、水道水質管理上留意すべき項目として設定された物質に係る目標値。

⁴⁾ 「ゴルフ場で使用される農薬による水質汚濁の防止及び水域の生活環境動植物の被害防止に係る指導指針について」（令和 2 年 3 月 27 日付け環水大土発第 2003271 号環境省水・大気環境局長通知）において設定された水濁指針値。

⁵⁾ Guidelines for drinking-water quality, fourth edition

2. リスク評価

水濁 PEC は 0.00016 mg/L であり、登録基準値 6.6 mg/L を超えないことを確認した。

(参考) 食品経由の農薬理論最大一日摂取量と対 ADI 比

農薬理論最大一日摂取量 (mg/人/日)	対 ADI 比 (%)
0.0567	0.0

出典:令和4年2月10日 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