

水域の生活環境動植物の被害防止に係る農薬登録基準として
環境大臣が定める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					

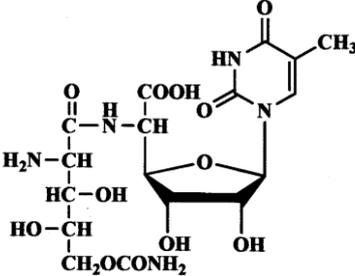
ポリオキシンG

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					

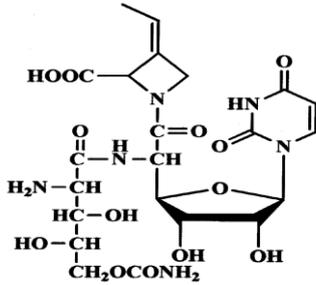
ポリオキシンH

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®)	不明
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 [®])	不明
構造式					

※ポリオキシン複合体原体中には、11種類のポリオキシン類が入っ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成分合計の力価への寄与率は約80%であることが分かっている。試験水の分析においては、ポリオキシンBを標準品を用いた生物学的定量法により試験水中の全てのポリオキシン類の含量をポリオキシンBとしての力価として求めており、ポリオキシン複合体の有効成分の全てを分析対象としている。

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、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1967年である。

製剤は水和剤、水溶剤、乳剤が、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、121.5t（平成28年度^{*}）、79.7t（平成29年度^{*}）、30.6t（平成30年度^{*}）、原体の輸入量は19.7t（平成28年度^{*}）、55.4t（平成29年度^{*}）47.8t（平成30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-2019-（（一社）日本植物防疫協会）

3. 各種物性

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	$\geq 1.00 \times 10^8 \mu\text{g/L}$ (25℃、蒸留水)
水中光分解性	7日間安定 (滅菌蒸留水、25℃、人工光、133-176W/m ² 、280-500nm) 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℃、29.79W/m ² 、300-400nm) 1.55日 (東京春季太陽光換算 5.94日) (滅菌自然水、pH6.1、25℃、29.79W/m ² 、300-400nm) 3.10日 (東京春季太陽光換算 11.9日) (滅菌緩衝液、pH7、25℃、29.79W/m ² 、300-400nm) 6.22日 (東京春季太陽光換算 23.8日) (滅菌緩衝液、pH9、25℃、29.79W/m ² 、300-400nm)		
pKa	$pK_{a1} = 7.27$ (20℃)、 $pK_{a2} = 9.62$ (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	$\log D_{ow} < -2.31$ (25°C, pH4) < -2.30 (25°C, pH7) < -2.29 (25°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	8×10^{-4} Pa (20°C、25°C)	密度	1.5g/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	$5.80 \times 10^7 \mu\text{g/L}$ (25°C、蒸留水)
水中光分解性	半減期 8.25 日 (滅菌緩衝液、42W/m ²) 0.72 日 (滅菌自然水、42W/m ²)		
pKa	$pK_{a1} = 7.32$ (20°C) 、 $pK_{a2} = 9.58$ (20°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	$K_{F_{oc}}^{ads} = 0.65 - 9.3$
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	1.6g/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	$\geq 1.00 \times 10^8 \mu\text{g/L}$ (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	$K_{F_{OC}}^{ads} = 2.96 - 800$
融点	175℃で分解するため測定不能	オクタノール／水分配係数	$\log D_{ow} < -2.53$ (25℃、pH4) < -2.59 (25℃、pH7) < -2.60 (25℃、pH9)
沸点	175℃で分解するため測定不能	生物濃縮性	—
蒸気圧	9×10^{-5} Pa (20℃、25℃)	密度	1.7g/cm ³ (20℃)
加水分解性	安定 (25℃、pH4) 半減期 1,157 時間 (50℃、pH4) 502 時間 (60℃、pH4) 450 時間 (25℃、pH7) 173 時間 (50℃、pH7) 112 時間 (60℃、pH7) 1,074 時間 (25℃、pH9) 624 時間 (50℃、pH9) 381 時間 (60℃、pH9)	水溶解度	$\geq 1.00 \times 10^8 \mu\text{g/L}$ (25℃、蒸留水)
水中光分解性	半減期 15.2 日 (滅菌緩衝液、48.7W/m ²) 0.42 日 (滅菌自然水、48.7W/m ²)		
pKa	pKa ₁ = 7.28 (20℃)、pKa ₂ = 9.55 (20℃)		

II. 水域の生活環境動植物への毒性

1. 魚類

(1) 魚類急性毒性試験 [i] (コイ)

コイを用いた魚類急性毒性試験が実施され、96hLC₅₀ > 100,000 μg/Lであった。

表1 魚類急性毒性試験結果

被験物質	原体	
供試生物	コイ (<i>Cyprinus carpio</i>) 10尾/群	
暴露方法	半止水式 (暴露開始 48 時間後に換水)	
暴露期間	96h	
設定濃度 (μg/L) ※	0	100,000
実測濃度 (μg/L) (時間加重平均、 ポリオキシシンB 力価換算) ※	0	87,400
死亡数/供試生物数 (96h 後 ; 尾)	0/10	0/10
助剤	なし	
LC ₅₀ (μg/L)	>100,000 (設定濃度に基づく算出値をポリオキシシンBの力価で換算した値)	

※ : ポリオキシシン複合体としての値。

2. 甲殻類等

(1) ミジンコ類急性遊泳阻害試験 [i] (オオミジンコ)

オオミジンコを用いたミジンコ類急性遊泳阻害試験が実施され、48hEC₅₀ >400 μg/Lであった。

表2 ミジンコ類急性遊泳阻害試験結果

被験物質	原体							
供試生物	オオミジンコ (<i>Daphnia magna</i>) 20 頭/群							
暴露方法	止水式							
暴露期間	48h							
設定濃度 (μg/L) ※	0	100	400	1,600	6,300	25,000	100,000	
実測濃度 (μg/L) (時間加重平均値、 ポリオキシンB 力価換算) ※	0	107	416	1,630	6,520	25,000	102,000	
遊泳阻害数/供試生物数 (48h 後 ; 頭)	0/20	0/20	9/20	8/20	13/20	9/20	14/20	
助剤	なし							
EC ₅₀ (μg/L)	>400 (設定濃度に基づく算出値をポリオキシンBの力価で換算した値)							

※：ポリオキシン複合体としての値。

3. 藻類

(1) 藻類生長阻害試験 [i] (ムレミカヅキモ)

Raphidocelis subcapitata (旧名 : *Pseudokirchneriella subcapitata*) を用いた藻類生長阻害試験が実施され、72hErC₅₀ > 100,000 μg/L であった。

表3 藻類生長阻害試験結果

被験物質	原体	
供試生物	<i>R. subcapitata</i> 初期生物量 1.2×10 ⁴ cells/mL	
暴露方法	振とう培養	
暴露期間	72h	
設定濃度 (μg/L) ※	0	100,000
実測濃度 (μg/L) (時間加重平均値 ポリオキシンB 力価換算) ※	0	87,200
72h 後生物量 (×10 ⁴ cells/mL)	55.8	51.4
0-72h 生長阻害率 (%)		2.1
助剤	なし	
ErC ₅₀ (μg/L)	>100,000 (設定濃度に基づく算出値をポリオキシンBの力価で換算した値)	

※：ポリオキシン複合体としての値。

Ⅲ. 水域環境中予測濃度（水域 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（（独）農林水産消費安全技術センター）によれば、本農薬は製剤として水和剤、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。

2. 水域 PEC の算出

(1) 非水田使用時の PEC

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。

表 4 PEC 算出に関する使用方法及びパラメーター
(非水田使用第 1 段階：河川ドリフト)

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	果 樹	I : 単回・単位面積当たりの有効成分量 (有効成分 g/ha) (左側の最大使用量に、有効成分濃度を乗じた上で、単位を調整した値 (製剤の密度は 1g/mL として算出))	1,400
剤 型	10%水和剤	D_{river} : 河川ドリフト率 (%)	3.4
当該剤の単回・単位面積当たり最大使用量	1,400mL/10a (500 倍に希釈した薬液を 10a 当たり 700L 使用)	Z_{river} : 1 日河川ドリフト面積 (ha/day)	0.12
		N_{drift} : ドリフト寄与日数 (day)	2
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 (%)	—
使用方法	散 布	A_u : 農薬散布面積 (ha)	—
		f_u : 施用法による農薬流出係数 (-)	—

これらのパラメーターより、非水田使用時の PEC は以下のとおりとなる。

非水田 PEC _{Tier1} による算出結果	0.022 μ g/L
----------------------------------	-----------------

(2) 水域 PEC 算出結果

(1) より水域 PEC は 0.022 μ g/L となる。

IV. 総合評価

1. 水域の生活環境動植物の被害防止に係る登録基準値

各生物種の LC_{50} 、 EC_{50} は以下のとおりであった。

魚類 [i]	(コイ急性毒性)	$96hLC_{50}$	>	100,000 $\mu g/L$
甲殻類等 [i]	(オオミジンコ急性遊泳阻害)	$48hEC_{50}$	>	400 $\mu g/L$
藻類 [i]	(ムレミカツキモ生長阻害試験)	$72hErC_{50}$	>	100,000 $\mu g/L$

魚類急性影響濃度 (AECf) については、魚類 [i] の LC_{50} ($>100,000 \mu g/L$) を採用し、不確実係数 10 で除した $>10,000 \mu g/L$ とした。

甲殻類等急性影響濃度 (AECd) については、甲殻類等 [i] の EC_{50} ($>400 \mu g/L$) を採用し、不確実係数 10 で除した $>40 \mu g/L$ とした。

藻類急性影響濃度 (AECa) については、藻類 [i] の ErC_{50} ($>100,000 \mu g/L$) を採用し、 $>100,000 \mu g/L$ とした。

これらのうち最小の AECd より、登録基準値は $40 \mu g/L$ とする。

2. リスク評価

水域 PEC は $0.022 \mu g/L$ であり、登録基準値 $40 \mu g/L$ を超えないことを確認した。

<検討経緯>

平成30年12月7日 平成30年度水産動植物登録保留基準設定検討会 (第5回)

令和2年6月18日 令和2年度水域の生活環境動植物登録基準設定検討会 (第2回)