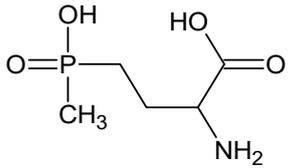


グルホシネート¹ （日本アグロサービス株式会社）

I. 農薬の製造に用いられる農薬原体の規格（案）

有効成分			
一般名又は略称	化学名	構造式	含有濃度
グルホシネート酸	DL-ホモアラニン-4-イル(メチル)ホスフィン酸		900 g/kg 以上

農薬原体の分析法

農薬原体中のグルホシネート酸の分析法

グルホシネートの農薬原体を水に溶解し、陰イオン交換カラムを用いてイオンクロマトグラフ（IC）により水酸化カリウム水溶液で分離し、電気伝導度検出器（CD）によりグルホシネート酸を検出及び定量する。定量には絶対検量線法を用いる。

¹ ISO名のグルホシネートは酸体、登録名のグルホシネートはアンモニウムとの塩を指している。本報告書においては、酸体を「グルホシネート酸」、アンモニウムとの塩を「グルホシネートアンモニウム塩」と表記する。

II. グルホシネートの農薬原体の組成に係る評価概要

1. 申請者

日本アグロサービス株式会社

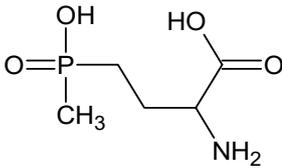
2. 有効成分の基本情報

(資料 2-1)

- 2.1 登録名** グルホシネート
 アンモニウム=DL-ホモアラニン-4-イル(メチル)ホスフィネート
- 2.2 一般名** glufosinate (ISO)
- 2.3 化学名**
IUPAC 名 : (2*RS*)-2-amino-4-[hydroxy(methyl)phosphinoyl]butanoic acid

CAS 名 : 2-amino-4-(hydroxymethylphosphinyl)butanoic acid

 (CAS No. 51276-47-2)
- 2.4 コード番号** SCC-010
- 2.5 分子式、構造式、分子量**
分子式 C₅H₁₅NO₄P

構造式


分子量 181.13

3. 有効成分の物理的・化学的性状

表 3-1：有効成分の物理的・化学的性状

試験項目		純度 (%)	試験方法	試験結果	資料																					
蒸気圧		99.4*	OECD 104	4.59×10 ⁻⁶ Pa (20 °C) 6.05×10 ⁻⁶ Pa (25 °C)	3-1																					
融点		99.4*	OECD 102	213 °C	3-2																					
沸点		99.3*	OECD 103	測定不能 (241 °C以上で分解)	3-3																					
熱安定性		99.2*	OECD 113	223 °Cで分解	3-4																					
溶解度	水	99.2*	OECD 105	716 g/L (pH 4、20 °C) 734 g/L (pH 7、20 °C) 771 g/L (pH 9、20 °C) 726 g/L (蒸溜水(pH 7.42)、20 °C)	3-5																					
	有機溶媒	アセトン	99.2*	OECD105	< 0.0005 g/L (20 °C)	3-6																				
		n-ヘプタン			< 0.0005 g/L (20 °C)																					
		メタノール			3.99 g/L (20 °C)																					
		酢酸エチル			< 0.0005 g/L (20 °C)																					
		キシレン			< 0.0005 g/L (20 °C)																					
		ジクロロメタン			< 0.0005 g/L (20 °C)																					
解離定数 (pKa)		99.4*	OECD 112	7.88 (20 °C)	3-7																					
1-オクタノール／水分配係数 (log P _{ow})		99.2*	OECD 107	-4.20 (20 °C、pH 5.2)	3-8																					
加水分解性		96.6*	OECD111	安定 (50 °C、5 日間、pH 4、pH 7 及び pH 9)	3-9																					
水中光分解性		>98**	OECD316	安定 (pH 4 及び pH 7、25 °C、12 日間、 31.52 W/m ² 、300~400 nm) (pH 9、25 °C、12 日間、 35.75 W/m ² 、300~400 nm)	3-10																					
紫外可視吸収 (UV/VIS) スペクトル		99.2*	<table border="1"> <thead> <tr> <th>極大吸収波長 (nm)</th> <th>吸光度</th> <th>モル吸光係数 (L mol⁻¹ cm⁻¹)</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td colspan="3">中性 (pH 7.0)</td> </tr> <tr> <td>201</td> <td>0.768</td> <td>118</td> </tr> <tr> <td colspan="3">酸性 (pH 1.8)</td> </tr> <tr> <td>204</td> <td>1.18</td> <td>81.8</td> </tr> <tr> <td colspan="3">アルカリ性 (pH 10.5)</td> </tr> <tr> <td>200</td> <td>1.33</td> <td>431</td> </tr> </tbody> </table>		極大吸収波長 (nm)	吸光度	モル吸光係数 (L mol ⁻¹ cm ⁻¹)	中性 (pH 7.0)			201	0.768	118	酸性 (pH 1.8)			204	1.18	81.8	アルカリ性 (pH 10.5)			200	1.33	431	3-11
極大吸収波長 (nm)	吸光度	モル吸光係数 (L mol ⁻¹ cm ⁻¹)																								
中性 (pH 7.0)																										
201	0.768	118																								
酸性 (pH 1.8)																										
204	1.18	81.8																								
アルカリ性 (pH 10.5)																										
200	1.33	431																								

*：被験物質はグルホシネートアンモニウム塩であり、純度はグルホシネートアンモニウム塩としての純度。

**：被験物質は ¹⁴C 標識グルホシネートアンモニウム塩であり、純度はグルホシネートアンモニウム塩としての放射化学的純度

4. 農薬原体の組成分析

グルホシネートの農薬原体の組成分析に用いられた分析法は、グルホシネート酸及び1 g/kg以上含有されている不純物について、選択性、検量線の直線性、精確さ及び併行精度が確認されており、科学的に妥当であった。

農薬の製造に用いられる農薬原体の組成分析において、定量された分析対象の含有濃度の合計は1005～1008 g/kgであった。

5. 有効成分の毒性

グルホシネートの農薬原体を用いた各種毒性試験（資料5-1～5-24）が提出された。有効成分の毒性は、内閣府食品安全委員会において、以下のとおり評価された（資料5-25）。

¹⁴Cで標識したグルホシネートのラットを用いた動物体内動態試験の結果、経口投与されたグルホシネートの吸収率は雄で6.9%～30.7%、雌で7.8%～27.5%と算出され、ほとんどが未変化のグルホシネートとして主に糞中に排泄された。体内に吸収されたグルホシネートは主に腎臓、肝臓及び脾臓に分布し、経時的に減少した。主要代謝物はB、G及びZであった。¹⁴Cで標識した代謝物B及びZのラットを用いた動物体内動態試験では、Bの消化管吸収率は高く90%程度であったが、Zの吸収率は5%～6%と低かった。

各種毒性試験結果から、グルホシネート投与による影響は、主に中枢神経系（鎮静、円背位、自発運動亢進等）、腎臓（重量増加等）及び血液（貧血等）に認められた。発がん性、繁殖能に対する影響、催奇形性、遺伝毒性及び免疫毒性は認められなかった。

中枢神経系への影響については、本剤のグルタミン合成酵素活性阻害が関連している可能性が示唆され、メカニズム試験が実施された。その結果、中枢神経系の病理組織学的変化又は神経症状の変化と、グルタミン合成酵素活性低下並びにアンモニア及びグルタミン酸の蓄積との関係性は明らかにならなかった。

各試験で得られた無毒性量のうち最小値はイヌを用いた28日間強制経口投与毒性及びメカニズム試験の雌の1 mg/kg 体重/日であり、最小毒性量は8 mg/kg 体重/日であった。より長期の試験であるイヌを用いた90日間亜急性毒性試験①の無毒性量は雄で2.1 mg/kg 体重/日、雌で2.0 mg/kg 体重/日、1年間慢性毒性試験①の無毒性量は雄で5.0 mg/kg 体重/日、雌で5.5 mg/kg 体重/日であり、各試験における無毒性量の差は用量設定の違いによるもので、イヌにおける無毒性量は5.0 mg/kg 体重/日であると考えられた。

以上のことから、食品安全委員会は、各動物種で得られた無毒性量のうち最小値は、ラットを用いた2年6か月間慢性毒性/発がん性併合試験の1.9 mg/kg 体重/日であったことから、これを根拠として、安全係数100で除した0.019 mg/kg 体重/日を許容一日摂取量（ADI）と設定した。

また、グルホシネートの単回経口投与等により生ずる可能性のある毒性影響に対する無毒性量及び最小毒性量のうち最小値は、ウサギを用いた発生毒性試験②の無毒性量5 mg/kg 体重/日であったことから、これを根拠として、安全係数100で除した0.05 mg/kg 体重を急性参照用量（ARfD）と設定した。

（URL：<https://www.fsc.go.jp/fsciis/evaluationDocument/show/kya20240612079>）

6. 不純物の毒性

農薬の製造に用いられるグルホシネートの農薬原体中に含有されている不純物には、考慮すべき毒性を有する不純物は認められなかった。

7. 農薬原体の同等性

農薬の製造に用いられるグルホシネートの農薬原体と毒性試験に用いられた農薬原体は、その組成及び毒性を比較した結果、同等であった。

評価資料

資料番号	報告年	表題、出典（試験施設以外の場合） 試験施設、報告書番号 GLP 適合状況（必要な場合）、公表の有無
—	2025	農薬原体の組成に係る審査報告書 グルホシネート（日本アグロサービス株式会社） 農林水産省消費・安全局農産安全管理課、独立行政法人農林水産消費安全技術センター 未公表
2-1	2022	農業原体中の成分の種類及びその含有濃度 日本アグロサービス株式会社 未公表
3-1	2018	Determination of vapour pressure of glufosinate ammonium technical Eurofins Advinus Limited、G9229 GLP、未公表
3-2	2018	Determination of melting point of glufosinate ammonium technical Eurofins Advinus Limited、G9224 GLP、未公表
3-3	2017	Determination of boiling point of glufosinate ammonium technical RCC Laboratories India Private Limited、6647 GLP、未公表
3-4	2020	Glufosinate-ammonium: Determination of the thermal stability by Differential Scanning Calorimetry (DSC) analysis ChemService S.r.l.、CH-0591/2020 GLP、未公表
3-5	2018	Determination of water solubility of glufosinate ammonium technical Eurofins Advinus Limited、G9225 GLP、未公表
3-6	2018	Glufosinate ammonium Technical : Determination of the Solubility in Organic Solvents ChemService S.r.l.、CH-055/2018 GLP、未公表
3-7	2018	Determination of dissociation constant(s) of glufosinate ammonium technical Eurofins Advinus Limited、G9230 GLP、未公表
3-8	2017	Glufosinate ammonium Technical : Determination of the Partition Coefficient (n-octanol/water) ChemService S.r.l.、CH-584/2017 GLP、未公表
3-9	2014	Hydrolysis as a function of pH of glufosinate ammonium technical. Advinus Therapeutics Limited、G9233 GLP、未公表
3-10	2019	Aqueous photolysis of [¹⁴ C] glufosinate ammonium in sterile buffers under artificial sunlight. Concord Biosciences、035089-01 GLP、未公表
3-11	2017	IR, NMR, MASS AND UV-VIS ABSORPTION SPECTRA of glufosinate ammonium technical Advinus Therapeutics Limited、G11890 GLP、未公表
4-1	2013	Glufosinate ammonium technical: complete analysis of five batch samples ChemService S.r.l.、CH-290/2013 GLP、未公表
5-1	2019	Glufosinate ammonium: Pharmacokinetic study following a single oral gavage administration in male and female Wistar rats. GLP、未公表
5-2	2019	[¹⁴ C] Glufosinate ammonium: Tissue distribution study following a single oral gavage administration in male and female Wistar rats. GLP、未公表

5-3	2020	[¹⁴ C] Glufosinate ammonium: Mass/excretion balance study following a single oral gavage administration in male and female Wistar rats. GLP、未公表
5-4	2020	[¹⁴ C] Glufosinate ammonium: Biliary excretion study following a single oral gavage administration in male and female Wistar rats. GLP、未公表
5-5	2017	Glufosinate ammonium technical: A validation of analytical method for the determination of glufosinate ammonium in gavage solution and demonstration of homogeneity and stability. GLP、未公表
5-6	2014	Glufosinate ammonium technical: Acute oral toxicity study (acute toxic class method) in Wistar rats. GLP、未公表
5-7	2014	Glufosinate ammonium technical: Acute dermal toxicity study in Wistar rats. GLP、未公表
5-8	2014	Glufosinate ammonium technical: Acute inhalation toxicity study in Wistar rats. GLP、未公表
5-9	2021	Glufosinate ammonium technical: Acute inhalation toxicity study in Wistar rats. GLP、未公表
5-10	2014	Glufosinate ammonium technical: Skin sensitisation study (Magnusson and Kligman test) in Guinea pigs. GLP、未公表
5-11	2017	Glufosinate ammonium technical : 90-day dietary toxicity study in Wistar rats. GLP、未公表
5-12	2017	Glufosinate ammonium technical: 90-day dietary dose range finding toxicity study in Swiss albino mice. GLP、未公表
5-13	2017	A 13-Week Oral Toxicity Study in Beagle Dogs. GLP、未公表
5-14	2018	A 52-Week Oral Toxicity Study in Beagle Dogs. GLP、未公表
5-15	2014	Glufosinate ammonium technical: Bacterial reverse mutation test. GLP、未公表
5-16	2015	Glufosinate ammonium technical: in vitro mammalian chromosome aberration test in CHO cells. GLP、未公表
5-17	2015	Mammalian erythrocyte micronucleus test following oral administration of glufosinate ammonium technical to Swiss albino mice. GLP、未公表
5-18	2019	Combined Chronic toxicity and carcinogenicity study in the Wistar rat. GLP、未公表
5-19	2019	18 Months oral carcinogenicity study in Swiss albino mice. GLP、未公表
5-20	2020	Glufosinate ammonium technical: Two generation reproduction toxicity study through diet in Wistar rats. GLP、未公表
5-21	2018	Glufosinate Ammonium Technical: Embryo-fetal developmental toxicity study in Wistar rats. GLP、未公表
5-22	2018	Glufosinate Ammonium technical: Embryo-fetal developmental toxicity study in New Zealand white rabbits. GLP、未公表
5-23	2018	Glufosinate ammonium technical: Acute neurotoxicity study in Wistar rats. GLP、未公表
5-24	2018	Glufosinate ammonium technical: 90-day dietary neurotoxicity study in Wistar rats. GLP、未公表

グルホシネート（日本アグロサービス株式会社）の農薬原体の組成に係る評価報告書

令和7年10月30日 農業資材審議会農薬分科会農薬原体部会（第26回）

5-25	2025	農薬評価書 グルホシネート（第6版）、食品安全委員会 公表
------	------	----------------------------------