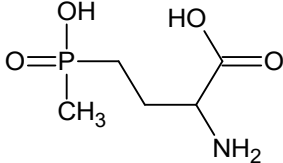


グルホシネート¹ （株式会社ハート）

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		880 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高速液体クロマトグラフ（HPLC）によりリン酸二水素カリウム水溶液で分離し、紫外吸収（UV）検出器（検出波長：195 nm）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

株式会社ハート

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)

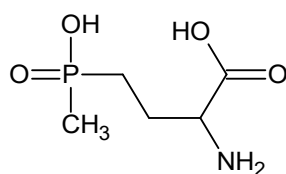
2.4 コード番号

LGO-RO2

2.5 分子式、構造式、分子量

分子式 $C_5H_{12}NO_4P$

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			98.1*	OECD 104	5.07×10 ⁻⁹ Pa (20 °C) 9.45×10 ⁻⁹ Pa (25 °C)	3-1	
融点			98.1*	OECD 102	214 °C	3-2	
沸点			98.1*	OECD 103	測定不能 (218 °Cで分解)	3-3	
熱安定性			98.1*	OECD 113	150 °Cまで安定	3-4	
溶解度	水		98.1*	OECD 105	1210 g/L (20 °C)	3-5	
	有機溶媒	ヘキサン	98.1*	OECD 105	<0.02 mg/L (20 °C)	3-6	
		トルエン			<0.02 mg/L (20 °C)		
		ジクロロメタン			<0.02 mg/L (20 °C)		
		アセトン			<0.02 mg/L (20 °C)		
		エタノール			0.132 g/L (20 °C)		
		酢酸エチル	<0.02 mg/L (20 °C)				
解離定数 (pK _a)			98.1*	OECD 112	1.81、2.95、9.82 (20 °C)	3-7	
1-オクタノール／水分配係数 (log P _{ow})			98.1*	OECD 107	-3.97 (23 °C、pH 6 ^{***})	3-8	
加水分解性			99.5*	EPA 161-1	安定 (25 °C、30日間、pH 5、7及び9)	3-9	
水中光分解性			96.6**	EPA 161-2	安定 (滅菌緩衝液、25 °C、192又は216 時間、pH 5、7及び9、523 W/m ² 、290～490 nm)	3-9	
紫外可視吸収 (UV/VIS) スペクトル			98.1*				3-10
				極大吸収波長 (nm)	吸光度	モル吸光係数 (L mol ⁻¹ cm ⁻¹)	
				中性 (pH 7.03)			
				193	1.85	293	
				酸性 (pH 1.89)			
				198	0.538	85.1	
				アルカリ性 (pH 10.2)			
193	1.64	260					

*：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

***：実験後の水相の pH

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 998～1003 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 5-1～5-18）が提出された。グルホシネートの毒性は、内閣府食品安全委員会において、製造者の異なる農薬原体の毒性試験を用いて以下のとおり評価されている（資料 5-19）。

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。

ラットを用いた 90 日間亜急性毒性試験②及び 2 年間発がん性試験において無毒性量が設定できなかったが、より低用量で実施されたラットを用いた 2 年 6 か月間慢性毒性/発がん性併合試験で無毒性量（雄：1.9 mg/kg 体重/日、雌：2.4 mg/kg 体重/日）が得られていることから、ラットにおける無毒性量は得られていると考えられた。

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/fscis/evaluationDocument/show/kya20240612079>）

また、令和 7 年度非食用農作物専用農薬安全性評価検討会（第 2 回）において、4.1 項に示した製造者の農薬原体の取扱いについて審議され、以下のとおり評価されている。

今般、新規農薬（後発剤）として非食用農作物専用農薬（グルホシネート）の申請があったところ、グルホシネートについては、既登録農薬の毒性試験データ等を基に食品安全委員会において ADI が設定されている。農薬登録申請者から提出された各種毒性試験から得られた無毒性量のうち最小となる値は、ウサギを用いた発生毒性試験の 5 mg/kg 体重/日であり、食品安全委員会における ADI の設定に用いられた無毒性量 0.91 mg/kg 体重/日²を上回る値であることが確認された。

また、農薬登録申請者から提出されたラット及びウサギを用いた発生毒性試験について、委員からの指摘を踏まえ、総胎児数ではなく同腹児数による解析値を用いて、食品安全委員会の評価書に記載されている毒性試験成績と比較した。

その結果、「非食用農作物専用農薬に係る水質汚濁に係る農薬登録保留基準の設定方針（平成 24 年 10 月 30 日中央環境審議会土壌農薬部会農薬小委員会（第 32 回）了承）」に基づき、食品安全委員会において既に設定されているグルホシネートの ADI 0.0091 mg/kg 体重/日（無毒性量 0.91 mg/kg 体重/日を安全係数 100 で除した値）を水質汚濁に係る農薬登録基準の設定に活用することとされた。

（URL：<https://www.env.go.jp/content/000372120.pdf>）

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。

² 食品安全委員会において、グルホシネートの ADI 0.019 mg/kg 体重/日及びグルホシネート P（グルホシネートの 2 種の光学異性体のうち、S 体）の ADI 0.0091 mg/kg 体重/日が設定された後、両者の総合評価として、S 体を選択的に含有し、毒性も強く現れるグルホシネート P に基づく評価を適用するのが適当であると判断され、グルホシネートの ADI 0.0091 mg/kg 体重/日が設定された（資料 5-19）

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
ー	2026	農薬原体の組成に係る審査報告書 グルホシネート（株式会社ハート） 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	2024	農薬原体中の成分の種類及びその含有濃度 株式会社ハート 未公表
3-1	2021	Determination of Vapour Pressure of Glufosinate-ammonium TC Bionees India Private Limited、BIO-PHC 1303 GLP、未公表
3-2	2021	Determination of Melting Point of Glufosinate-ammonium TC Bionees India Private Limited、BIO-PHC 1300 GLP、未公表
3-3	2021	Determination of Boiling Point of Glufosinate-ammonium TC Bionees India Private Limited、BIO-PHC 1302 GLP、未公表
3-4	2021	Screening test of Glufosinate-ammonium TC for thermal stability and stability in air Bionees India Private Limited、BIO-PHC 1308 GLP、未公表
3-5	2021	Determination of Water Solubility of Glufosinate-ammonium TC Bionees India Private Limited、BIO-PHC 1314 GLP、未公表
3-6	2024	Determination of Solubility of Glufosinate-Ammonium TC in Organic Solvents Bionees India Private Limited、BIO-PHC 2264 GLP、未公表
3-7	2023	Determination of Dissociation Constant of Glufosinate-ammonium TC Bionees India Private Limited、BIO-PHC 2006 GLP、未公表
3-8	2021	Determination of Partition Coefficient of Glufosinate-ammonium TC Bionees India Private Limited、BIO-PHC 1307 GLP、未公表
3-9	2025	農薬原体の組成に係る審査報告書 グルホシネート（BASFジャパン株式会社） 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
3-10	2021	Determination of UV-Visible Absorption Spectra of Glufosinate-ammonium TC Bionees India Private Limited、BIO-PHC 1305 GLP、未公表
4-1	2022	Qualitative and Quantitative Profile of Glufosinate-ammonium Technical (Five Batch Analysis) Bioagri Laboratórios Ltda、18435.030.017.21 GLP、未公表
4-2	2023	グルホシネートアンモニウム原体中の不純物の分析 株式会社化学分析コンサルタント、22GT056 GLP、未公表
5-1	2021	[¹⁴ C]-Glufosinate-ammonium: Pharmacokinetic study following a single oral gavage administration in male and female Sprague-Dawley rats. GLP、未公表
5-2	2021	[¹⁴ C]-Glufosinate-ammonium: Preliminary <i>in vivo</i> ADME profiling study following a single oral gavage administration in male and female Sprague-Dawley rats (pilot study). 未公表

5-3	2021	[¹⁴ C]-Glufosinate-ammonium: Tissue distribution study following a single oral gavage administration in male and female Sprague-Dawley rats. GLP、未公表
5-4	2021	[¹⁴ C]-Glufosinate-ammonium: Biliary excretion study following a single oral gavage administration in male and female Sprague-Dawley rats. GLP、未公表
5-5	2022	Glufosinate ammonium technical: Acute oral toxicity study (acute toxic class method) in Wistar rats. GLP、未公表
5-6	2022	Glufosinate ammonium technical: Acute dermal toxicity study in Wistar rats. GLP、未公表
5-7	2021	Glufosinate-ammonium technical: Acute inhalation toxicity study in Wistar rats. GLP、未公表
5-8	2022	Glufosinate-ammonium technical: Skin sensitisation study (Magnusson and Kligman test) in Guinea pigs. GLP、未公表
5-9	2022	Glufosinate ammonium technical : Combined 90-day repeated dose and neurotoxicity dietary toxicity study in Wistar rats with 28-day recovery period. GLP、未公表
5-10	2021	Glufosinate ammonium technical: 14-day repeated dose oral dietary toxicity study in Wistar rats. GLP、未公表
5-11	2022	Glufosinate ammonium technical: Bacterial reverse mutation test. GLP、未公表
5-12	2022	Glufosinate ammonium technical: <i>In vitro</i> mammalian chromosomal aberration test in CHO-K1 cells. GLP、未公表
5-13	2021	Glufosinate-ammonium technical: Mammalian erythrocyte micronucleus test following oral administration to Swiss albino mice. GLP、未公表
5-14	2022	Glufosinate-ammonium technical: Prenatal developmental toxicity study in Wistar rats by oral route. GLP、未公表
5-15	2021	Glufosinate ammonium technical: A dose range finding study for prenatal developmental toxicity study by oral gavage in Wistar rats. 未公表
5-16	2022	Glufosinate-ammonium technical: Prenatal developmental toxicity study in New Zealand white rabbits by oral route. GLP、未公表
5-17	2021	Glufosinate ammonium technical: A dose range finding study for prenatal developmental toxicity study in New Zealand white rabbits by oral route. 未公表
5-18	2022	Glufosinate ammonium technical: Acute neurotoxicity study in Wistar rats. GLP、未公表
5-19	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