

中文普通名稱：特酮草氟胺 11.6% GR (tefuryltrione特酮草+triafamone草氟胺)

英文普通名稱：tefuryltrione 10% + triafamone 1.6%

防治對象：水稻水田雜草

作用機制：(1)特酮草 tefuryltrione：Inhibition of Hydroxyphenyl Pyruvate Dioxygenase

(2)草氟胺 triafamone：Inhibition of acetolactate synthase ALS (acetohydroxyacid synthase AHAS)

建議使用方法：每公頃每次施藥量 1.2 公斤，插秧後 3~7 日，雜草 0-3 葉期施用，田區保持水深 3-5 公分，均勻撒於水田 1 次，施藥後保持積水 5-7 天。防除對象：稗草、雙穗雀稗、芒稷、螢蘭及鴨舌草等。

安全採收期：不須訂定安全採收期。

標示加註：無。

## A. 有效成分

中文名稱：特酮草

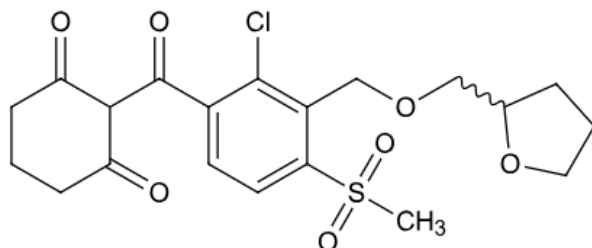
化學名稱：2-[2-chloro-4-(methylsulfonyl)-3-({[(2RS)-tetrahydro-2-furyl]methoxy}methyl)benzoyl]cyclohexane-1,3-dione

分子式：C<sub>20</sub>H<sub>23</sub>ClO<sub>7</sub>S

分子量：442.91

化學分類：triketone

化學結構：



中文名稱：草氟胺

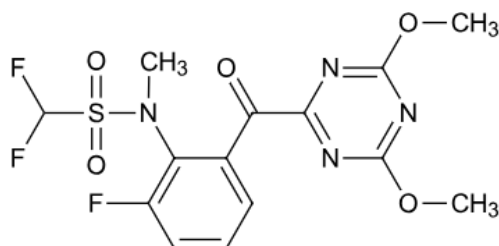
化學名稱：2'-[(4,6-dimethoxy-1,3,5-triazin-2-yl)carbonyl]-1,1,6'-trifluoro-N-methylmethanesulfonanilide

分子式：C<sub>14</sub>H<sub>13</sub>F<sub>3</sub>N<sub>4</sub>O<sub>5</sub>S

分子量：406.34

化學分類：sulfonanilide

化學結構：



## B. 理化性質

	特酮草(原體)	草氟胺(原體)	成品
物理型態	淡米色粉末	米色粉末	約 0.3cm 棕色圓柱 顆粒 (25°C)
氣味	無氣味	微弱酮類氣味	溫和酸味
酸鹼度	pH 3.5 (21°C, 1% w/v)	pH 4.3 (23°C, 1% w/v)	pH 5.91 (25.2°C, 1% w/v)
熔點	熔點 115°C, 135°C開始分解	熔點 100°C	成品不適用
密度(比重)	$D_4^{20} = 1.41$	$D_4^{20} = 1.52$	鬆裝密度 0.41 g/ml, 振實密度 0.46 g/ml
蒸氣壓	$1.8 \times 10^{-10}$ Pa (20°C), $6.9 \times 10^{-10}$ Pa (25°C), $2.7 \times 10^{-7}$ Pa (50°C)	$1.1 \times 10^{-6}$ Pa (20°C), $2.3 \times 10^{-4}$ Pa (25°C), $8.1 \times 10^{-5}$ Pa (50°C)	成品不適用
溶解度	水(20°C) 0.106 g/L (pH 2.0 buffer), 64.2 g/L (pH7.0 buffer), 57.5 g/L (pH9.0 buffer)  溶劑(20°C) n-Heptan 33.5 mg/L, Dichloromethane >600 g/L, Toluene 48.2 g/L, Ethanol 6.7 g/L, Acetone 200-300 g/L, Ethyl Acetate 70 g/L, Dimethyl sulfoxide 300-600 g/L	水(20°C) 41 mg/L (pH 6.8 water) , 36 mg/L (pH 4.0 buffer), 33 mg/L (pH 7.0 buffer), 34 mg/L (pH 9.0 buffer)  溶劑(20°C) n-Heptane 0.028 g/L, Toluene 19 g/L, Methanol 30 g/L, Acetone >250 g/L, Ethyl acetate 140g/L, Dichloromethane >250 g/L, Dimethyl sulfoxide >250 g/L	成品不適用
黏性	固體不適用	固體不適用	固體不適用
安定性	熱流分析測試 135-380°C , 放熱峰 416 J/g ; 對鐵、鋁金屬及其離子 (ferric citrate monohydrate, aluminium acetate)安定 (54°C 14 天) ;	熱流分析測試 145-415 °C ,放熱峰 1726 J/g ; 對鐵、鋁金屬及其離子 (ferric citrate monohydrate, aluminium acetate)安定(54°C 14 天) ;	成品不適用

	特酮草(原體)	草氟胺(原體)	成品
	吸光特性 中性下: $\epsilon=1.27 \times 10^4$ (291 nm), 酸性下: $\epsilon=1.31 \times 10^4$ (291 nm), 鹼性下: $\epsilon=1.32 \times 10^4$ (291 nm)	光安定性 $DT_{50}=14.8$ 天 (pH 5 buffer)	
燃燒性	非易燃固體 (延燒性測試)	非易燃固體 (延燒性測試)	非易燃固體 (延燒性測試)
爆炸性	無爆炸性 (熱、撞擊、摩擦)	無爆炸性 (熱、撞擊、摩擦)	無爆炸性 (熱、撞擊、摩擦)
腐蝕性	對鋁、銅、黃銅、鋼、不 銹鋼、PE、PP 無腐蝕性 (54°C 14 天)	對鋁、銅、黃銅、鋼、不 銹鋼、PE、PP 無腐蝕性 (54°C 14 天)	對鋁箔袋包材無腐 蝕性 (54°C 14 天)
貯存安定性	54°C 14 天安定 (貯存前有效成分含量 98.7%，貯存後 99.6%)	54°C 14 天安定 (貯存前有效成分含量 92.7%，貯存後 93.2%)	54°C 14 天安定 (Triafamone: 處理組 1.67%, 對照組 1.62%, 變化率 <5% ; Tefuryltrione: 處理組 9.41%, 對照組 9.90%, 變化率 <5%)

## C. 毒理評估

### 一、急毒性試驗

	特酮草(原體)	草氟胺(原體)	成品
口服急毒性	輕毒(大鼠, 雌)	輕毒(大鼠)	輕毒(大鼠, 雌)
皮膚急毒性	輕毒(大鼠)	輕毒(大鼠)	輕毒(大鼠)
呼吸急毒性	輕毒(大鼠)	低毒(大鼠)	-
眼刺激性	未分級(白兔)	未分級(白兔)	具中度眼刺激性(白兔)
皮膚刺激性	未分級(白兔)	未分級(白兔)	未分級(白兔)
皮膚過敏性	不具皮膚過敏性 (天竺鼠)	不具皮膚過敏性 (小鼠)	不具皮膚過敏性 (天竺鼠)

### 二、亞慢毒性試驗

	特酮草(原體)	草氟胺(原體)
90 日餵食毒性	NOAEL = 0.08 mg/kg bw/day (Rat, male) NOAEL = 0.09 mg/kg bw/day (Rat, female) NOAEL = 411 mg/kg bw/day (Mouse, male) NOAEL = 559 mg/kg bw/day (Mouse, female) NOAEL < 0.564 mg/kg bw/day (Dog, male) NOAEL < 0.591 mg/kg bw/day (Dog, female)	NOAEL = 16.4 mg/kg bw/day (Rat, male) NOAEL = 20.0 mg/kg bw/day (Rat, female) NOAEL = 1001 mg/kg bw/day (Mouse, male) NOAEL = 1170 mg/kg bw/day (Mouse, female)
28 天皮膚毒性	NOAEL = 10 mg/kg bw/day (Rat, male) NOAEL = 10 mg/kg bw/day (Rat, female)	NOAEL = 500 mg/kg bw/day (Rat, male) NOAEL = 500 mg/kg bw/day (Rat, female)

### 三、慢毒性試驗

	特酮草(原體)	草氟胺(原體)
長期餵食毒性	NOAEL = 0.102 mg/kg bw/day (Beagle Dog 52 週, male) NOAEL = 0.102 mg/kg bw/day	NOAEL = 2.8 mg/kg bw/day (Beagle Dog 1 年, male) NOAEL = 3 mg/kg bw/day

	(Beagle Dog 52 週, female) NOAEL = 0.08 mg/kg bw/day (Wistar Rat 2 年, male) NOAEL = 0.11 mg/kg bw/day (Wistar Rat 2 年, female) NOAEL < 21 mg/kg bw/day (CD-1 Mouse 80 週, male) NOAEL < 27.1 mg/kg bw/day (CD-1 Mouse 80 週, female)	(Beagle Dog 1 年, female) NOAEL = 1.96 mg/kg bw/day (Wistar Rat 24 個月, male) NOAEL = 2.81 mg/kg bw/day (Wistar Rat 24 個月, female) NOAEL = 70 mg/kg bw/day (ICR Mouse 78 週, male) NOAEL = 89 mg/kg bw/day (ICR Mouse 78 週, female)
致腫瘤性	NOAEL = 214 mg/kg bw/day (Wistar Rat 2 年, male) NOAEL = 296 mg/kg bw/day (Wistar Rat 2 年, female) NOAEL = 583 mg/kg bw/day (CD-1 Mouse 80 週, male) NOAEL = 743 mg/kg bw/day (CD-1 Mouse 80 週, female)	NOAEL = 9.86 mg/kg bw/day (Wistar Rat 24 個月, male) NOAEL = 14.2 mg/kg bw/day (Wistar Rat 24 個月, female) NOAEL = 710 mg/kg bw/day (ICR Mouse 78 週, male) NOAEL = 871 mg/kg bw/day (ICR Mouse 78 週, female)
生殖毒性	NOAEL = 0.126 mg/kg bw/day (Wistar Rat 親代毒性, male ) NOAEL = 0.202 mg/kg bw/day (Wistar 親代毒性, female) NOAEL = 0.142 mg/kg bw/day (Wistar Rat 子代毒性, male ) NOAEL = 0.204 mg/kg bw/day (Wistar Rat 子代毒性, female) NOAEL = 13.1 mg/kg bw/day (Wistar Rat 生殖毒性, male) NOAEL = 20.4 mg/kg bw/day (Wistar Rat 生殖毒性, female)	NOAEL = 6.3 mg/kg bw/day (Wistar Rat 親代毒性, male ) NOAEL = 7.4 mg/kg bw/day (Wistar 親代毒性, female) NOAEL = 39.5 mg/kg bw/day (Wistar Rat 子代毒性) NOAEL = 32.4 mg/kg bw/day (Wistar Rat 生殖毒性, male) NOAEL = 36.6 mg/kg bw/day (Wistar Rat 生殖毒性, female)
出生前發育毒性	NOAEL = 1 mg/kg bw/day (Wistar Rat, 親代) NOAEL = 1 mg/kg bw/day (Wistar Rat, 仔代) NOAEL = 1000 mg/kg bw/day (Wistar Rat, 發育) NOAEL = 10 mg/kg bw/day (NZW Rabbit, 親代)	NOAEL = 20 mg/kg bw/day (SD Rat, 親代) NOAEL = 600 mg/kg bw/day (SD Rat, 仔代) NOAEL = 600 mg/kg bw/day (SD Rat, 發育) NOAEL = 75 mg/kg bw/day (NZW Rabbit, 親代)

	NOAEL = 0.1 mg/kg bw/day (NZW Rabbit, 仔代) NOAEL = 1000 mg/kg bw/day (NZW Rabbit, 發育)	NOAEL = 75 mg/kg bw/day (NZW Rabbit, 仔代) NOAEL = 75 mg/kg bw/day (NZW Rabbit, 發育)
--	---	--

#### 四、致變異性試驗

	特酮草(原體)	草氟胺(原體)
細菌基因逆向變異試驗	負反應	負反應
哺乳動物細胞染色體 體外試驗	負反應	負反應
哺乳動物細胞遺傳學 體內試驗	負反應	負反應

## 五、生物體代謝試驗

### (一)動物體代謝(原體)

#### 1. 有效成分 1(特酮草 tefuryltrione)

- (1) 試驗物口服投予雄/雌大鼠後，放射線試驗物質被迅速吸收，廣泛分佈到器官和組織中，並通過尿液和糞便於 48 小時內可排泄>97%藥劑迅速排出體外。
- (2) 除肝臟和腎臟外，大多數器官和組織中的殘留較低，低劑量測試殘留在 0.0005 至 0.016 ppm 之間，高劑量測試的殘留在 0.04 至 0.65 ppm 之間。
- (3) AF0173473 大多數代謝反應為氧化反應，主要發生在四氫呋喃環(tetrahydrofuran ring)分子上。最重要代謝物是 AE 0173473-hydroxy-pentanoic acid (M4)。
- (4) 水稻稻稈(成熟期採收)中最主要殘留組成為主成分 AE 0173473 約 0.012-0.026 mg eq/kg (7.4-10.6%TRR)，是唯一高於 10%TRR 的組成，其餘代謝產物 Unk. ABC3 (5.9-6.8%TRR)、Benzoic acid (6.1%TRR)及 Benzylic alcohol (5.9%TRR)殘留量均低於 10%TRR。水稻稻葉(中期採收)中的殘留物分布與稻稈中相似，包含主成分在內，沒有任何代謝物組成殘留量高於 10%TRR。因沒有代謝物 >10%TRR，故無需額外植物代謝物之毒理試驗報告。

#### 2. 有效成分 2(草氟胺 triafamone)

- (1) 試驗物口服投予雌/雄大鼠後，會被廣泛快速吸收進入血漿中且會被快速排除，雄性和雌性在 24 小時和 48 小時內排泄了超過 90%的給藥劑量，並在給藥後 48 小時幾乎排泄完全，於兩性別間無顯著差異，無潛在組織累積性。排泄速率快速且主要經由尿液排泄，其次為糞便，主要代謝路徑是透過還原、去甲基化、羥基化和少量葡糖醛酸結合等完成廣泛且全面性代謝，主要代謝物 AE 1887196-N-desmethyl 和 AE 1887196-dihydro-N-desmethyl 。
- (2) 植物體主要代謝物有 AE 1887196-dihydro 及 AE 1887196-dihydro glucoside (>10%TRR)，其中 AE 1887196-dihydro 於大鼠代謝途徑中出現，而 AE 1887196-dihydro glucoside 存在非可食用部位，故無需額外植物代謝物之毒理試驗報告。

### (二)植物體代謝(原體)

#### 1. 有效成分 1(特酮草 tefuryltrione)

- (1) 水稻(穀類)代謝報告，標定位置為[cyclohexane-ring <sup>14</sup>C] tefuryltrione、[phenyl-ring

$^{14}\text{C}$ ]tefuryltrione、[tetrahydrofuran-ring  $^{14}\text{C}$ ]tefuryltrione。施藥方式為田水處理，施藥 1 次，總施藥量 300 g ai/ha，溫室栽培。水稻青貯於施藥後第 42 天採樣，成熟稻稈、稻殼、根部及糙米於施藥後第 91 天採樣。

- (2) 總放射性殘留量：可食部位水稻糙米低於成熟期非可食部位(根部及稻稈)。殘留量最高為成熟根部(1.137-1.548 mg/kg)，其次是稻稈(0.140-0.280 mg/kg)，糙米及稻殼較低(0.016-0.063 mg/kg 及 0.027-0.061 mg/kg)。
- (3) 殘留組成：可食部位水稻糙米因可萃取量過低未鑑定。水稻成熟期稻稈以主成分 tefuryltrione 為主要殘留。
- (4) 代謝途徑：水稻主要代謝途徑為由主成分 tefuryltrione(AE-0173473) 的苯甲基水解產生代謝物 benzoic acid 及 tetrahydrofuran-ring 氧化裂解產生代謝物 Unk. ABC3，接著以脫羧基作用生成代謝物 Benzylic alcohol。部分代謝物進一步共軛形成高極性代謝物，推測水稻土壤中 AE 0173473 被降解為二氧化碳後，接著水稻植株吸收，由二氧化碳的同化及三羧酸循環，最終成為水稻植株的澱粉、蛋白質及纖維素等正常生物組成，糙米中幾乎所有的殘留都由這些天然產物構成。

## 2. 有效成分 2(草氟胺 triafamone)

- (1) 水稻(穀類)代謝報告，標定位置為[phenyl-UL- $^{14}\text{C}$ ] triafamone。施藥方式為田水處理及葉面噴施，施藥 1 或 2 次，每次施藥量 49-52 g ai/ha，溫室栽培。水稻青貯於移植本田後第 41 天採樣，稻稈、稻殼及糙米於移植本田後第 149-152 天採樣。
- (2) 總放射性殘留量：可食部位水稻糙米低於成熟期非可食部位(稻稈及稻殼)。殘留量最高為成熟稻稈(1.016-3.342 mg/kg)，其次是稻殼(0.182-0.322 mg/kg)，糙米最低(0.014-0.028 mg eq/kg)。
- (3) 殘留組成：可食部位水稻糙米以 AE 1887196-dihydro 為主要殘留。
- (4) 代謝途徑：(1) 主成分 triafamone 酮基降解形成 AE 1887196-dihydro；(2) 透由葡萄糖或硫酸鹽的共軛形成 AE 1887196- dihydro- glucoside 或 AE 1887196- dihydro- sulfate；(3) 主成分 triafamone 的氧化裂解形成苯甲酸衍生物 AE 1887196-benzoic acid。

## 六、環境影響及殘留消退試驗

	特酮草(原體)	草氟胺(原體)	成品
水解	不易水解	不易水解	-
光分解	水中光分解緩慢 土表光分解中等快速	水中不易光分解 土表不易光分解	-
土壤代謝	厭氣土不易降解 好氣土中無持久性	土壤中易代謝 好厭氣水域降解快速	-
水域代謝	好氣水域中等快速降解 厭氣水域不易降解	好厭氣水域降解快速	
移動性	中等移動性	-	-
消散性	-	-	無持久性到中等持久性
作物殘留消退試驗	-	-	依據國內 3 場次水稻殘留試驗結果(1.2 kg/ha 藥劑處理，141.72g ai/ha)，特酮草及草氟胺殘留量皆<LOQ(0.02 mg/kg)，建議增訂 Tefuryltrione 及 Triafamone 米類容許量各為 0.02 ppm，「特酮草氟胺 11.6% GR」於水稻水田雜草依使用方法用藥，不須訂定 PHI。

## 七、非目標生物毒性試驗

	特酮草(原體)	草氟胺(原體)	成品
水生生物毒性	淡水魚(歐洲鯉)，低毒 無脊椎生物(水蚤)，低毒	淡水魚(虹鱒)，輕毒 無脊椎生物(水蚤)，輕毒	淡水魚(歐洲鯉)，低毒 無脊椎生物(水蚤)，低毒
鳥類毒性	口服毒性(鵪鶉)，低毒 餵食毒性(山齒鶉)，低毒	口服毒性(鵪鶉)，低毒 餵食毒性(山齒鶉)，低毒	-
蜜蜂毒性	口服毒性，輕毒 接觸毒性，低毒	口服毒性，輕毒 接觸毒性，低毒	口服毒性，低毒 接觸毒性，低毒
蚯蚓毒性	低毒	低毒	-
植物藻類生長抑制毒性	中等毒	中等毒	輕毒

## 八、參考資料：

1. 中國食品安全國家標準-食品中 2,4-滴丁酸鈉鹽等 112 種農藥最大殘留限量。MRL-中國公告容許量 GB 2763.1-2022 (2023.05.11 實施)。
2. 中國食品安全國家標準-食品中農藥最大殘留限量。MRL-中國公告容許量 GB 2763-2021 (2021.09.03 實施)。
3. 中華人民共和國農業產業標準農藥每日允許攝取量 NY/T 2874-2015 報告。呋喃磺草酮(Tefuryltrione)。
4. 日本食品安全委員會。2009 年 2 月。農藥評價書テフリルトリオン。
5. 日本食品安全委員會。2015 年 5 月。農藥評價書トリアファモン。
6. 行政院農業部動植物防疫檢疫署-植物保護圖鑑系列 8-水稻保護(伍、雜草)。
7. 行政院衛生福利部。中華民國 113 年 3 月 29 日公告修正「農藥殘留容許量標準」，自 113 年 4 月 1 日施行。
8. 行政院衛生福利部。食品中殘留農藥檢驗方法—多重殘留分析方法(五)。中華民國 111 年 8 月 17 日衛授食字第 1111901537 號公告修正。
9. 南韓《農藥及原料登記標準》部分修訂(草案)(2023)農藥每日允許攝取量附加設定(提案第 3(2)條及附錄 4-2)。테퓨릴트리온(Tefuryltrione)。
10. 食品安全委員會農藥專門調查會. 2013. 農藥評價書トリアファモン。
11. 食品安全委員會(2009)。日本農藥評價書テフリルトリオン。
12. 臺灣良好農業規範(TGAP)-米類-水稻。2021 年版。
13. 蒲玠涵、徐慈鴻、費雯綺 譯。2015。殘留定義評估指引。OECD 授權，行政院農業委員會農業藥物毒物試驗所印行。OECD 環境、健康及安全刊物系列，農藥專輯第 31 篇。
14. 「Tefuryltrione + Triafamone 11.6% GR」防治水稻水田雜草田間殘留試驗。(報告編號：0972G19RFT08)
15. Australia New Zealand Food Standards Code – Schedule 20 – Maximum residue limits. <https://www.legislation.gov.au/F2015L00468/latest/text>
16. Codex : Pesticide Residues in Food and Feed. <https://www.fao.org/fao-who-codexalimentarius/codex-texts/dbs/pestres/pesticides/en/>

17. EU Pesticides Database. <https://ec.europa.eu/food/plant/pesticides/eu-pesticides-database/start/screen/mrls>
18. Fernandez N. J., Kidney B.A. (2007) Alkaline phosphatase: beyond the liver (Review) Veterinary Clinical Pathology. Vol 36. Pages 223–233.
19. Hall, A.P. et al (2012) Liver Hypertrophy: A Review of Adaptive (Adverse and Non-adverse) Changes—Conclusions from the 3rd International ESTP Expert Workshop Toxicologic Pathology. Vol 40 Pages 971-994
20. Japan Maximum Residue Limits (MRLs) List of Agricultural Chemicals in Foods. <http://db.ffcr.or.jp/front/>
21. Korea Pesticides and Veterinary Drugs Information-MRLs in Pesticide. <https://residue.foodsafetykorea.go.kr/>
22. Leeling, J. L., et al. (1975). Influence of a benzoquinoliziny derivative on serum and hepatic alkaline phosphatase activity in the dog and rat. Toxicology vol. 4. Pages 223–29.
23. Maki K., (2007). AE 0173473 technical overtime assessment of changes in plasma tyrosine concentration after single administration in dogs. Report No. IET06-0092, Bayer CropScience Documentation No. M-398581-01-2.
24. Masahito W., (2006). Time course changes of tyrosine concentrations in the plasma of rats fed the diet containing technical grade of AE 0173473. Report No. NR06304, Bayer CropScience Documentation No. M-398575-01-2.
25. Naoto I., Kenji S., Masahito W., Shin K., (2006). Analysis of tyrosine, 4-HPPA and 4-HPLA in plasma and urine after single administration of AE 0173473 to rat and mouse. Report No. NR 06070, Bayer CropScience Documentation No. M-399482-01-2.
26. Roland Solecki. et. al. (2005). Guidance on setting of acute reference dose (ARfD) for pesticides. Food and Chemical Toxicology 43 (2005) 1569–1593
27. Sayuri K., (2007). AE 0173473 technical: In vitro inhibition assay to 4-hydroxyphenylpyruvate dioxygenase (4-HPPDase). Report No. IET06-0089, Bayer CropScience Documentation No. M-398583-01-2.
28. Totis M., (2006). AE 0173473: In Vitro evaluation of tyrosine metabolism in the

- Liverbeads TM from different species after inhibition of HPPDase. Report No. SA 06020, Bayer CropScience France. Documentation No. M-281188-01-2.
29. USEPA Electronic Code of Federal Regulations. e-CFR Database.  
<https://www.ecfr.gov/current/title-40/chapter-I/subchapter-E/part-180>
  30. Yasushi S., (2006). The time course changes of the tyrosine-concentration in the plasma of rats, mice and rabbits after single oral administration of AE 0173473 technical. Report No. HCR06052, Bayer CropScience Documentation No. M-398580-01-2.
  31. Yasushi S., (2007). Time course changes of tyrosine concentrations in the plasma of mice fed the diet containing technical grade of AE 0173473. Report No. HCR07075, Bayer CropScience Documentation No. M-398573-01-2.
  32. Yokoyama Y et al. (2019) Toxicological significance of increased serum alkaline phosphatase activity in dog studies of pesticides: Analysis of toxicological data evaluated in Japan. *Regulatory Toxicology and Pharmacology*. Vol 109, 104482
  33. Yokoyama Y et al. (2021) Refinement of decision tree to assess the consequences of increased serum ALP in dogs: Additional analysis on toxicity studies of pesticides evaluated recently in Japan. *Regulatory Toxicology and Pharmacology*. Vol 124, 104963