

刘长令 编

世界农药信息手册



化学工业出版社



世界农药信息手册

刘长令 编

化学工业出版社

·北京·

(京) 新登字 039 号

图书在版编目(CIP)数据

世界农药信息手册/刘长令编. —北京: 化学工业出版社, 2000.3
ISBN 7-5025-2786-9

I . 世 … II . 刘 … III . 农药 - 信息 - 手册
IV . TQ45-62

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2000) 第 03227 号

世界农药信息手册

刘长令 编

责任编辑: 杨立新

责任校对: 陈 静

封面设计: 于 兵

*

化学工业出版社出版发行

(北京市朝阳区惠新里 3 号 邮政编码 100029)

<http://www.cip.com.cn>

*

新华书店北京发行所经销

北京市密云云浩印制厂印刷

北京市密云同文印刷厂装订

开本 787×1092 毫米 1/16 印张 13 1/4 字数 304 千字

2000 年 3 月第 1 版 2000 年 3 月北京第 1 次印刷

印 数: 1—2500

ISBN 7-5025-2786-9/TQ · 1047

定 价: 35.00 元

版权所有 违者必究

该书如有缺页、倒页、脱页者, 本社发行部负责退换

前　　言

众所周知，新农药创制研究具有周期长、投资惊人、成功率低、风险高、利润丰厚、竞争激烈等特点。据统计，一个新农药品种的开发从研制到最终商品化，通常需要8~10年，目前需要合成和筛选8万个化合物，耗资8000万~1.5亿美元。经数年的开发，不管被选中的待开发化合物生物活性多么优异，一旦发现其不利于人类或环境，即停止开发，前功尽弃，因此新农药开发的风险是很大的。若产品开发成功，通常不仅可收回所有投资，而且可获得丰厚的利润，因此其竞争非常激烈。正因如此，使得一些公司或退出农药行业或与其它公司合并或被其它大公司兼并，结果使得从事农药研究的公司规模越来越大、竞争也越来越激烈。

我国是个农业大国，农药在农业生产中占有相当重要的地位。目前我国生产的农药品种，基本上是仿制国外的，随着我国对外开放的深入发展、新专利法的实施以及世界贸易一体化步伐的加快，使得我们可以仿制的新农药品种日益减少，研制出我国自己的、具有专利权的高效的、安全的农药新品种势在必行。但新农药品种的开发并不那么容易，岂是一朝一夕即能研制成功的？为了解决我国土地占世界7%、而人口占世界22%的13亿人口的吃与穿问题，就必须在专利法允许的范围内，走出一条适宜于我国国情的路子。

专利不仅具有时间性，而且具有区域性。我国在1985年4月1日以前未实施专利法，因专利申请时优先权的享用只有一年，大部分专利从申请到公开的时间为18个月，故大多数于1983年10月1日前、部分于1984年4月1日前（若不要优先权的，仍可申请专利，也可能获准专利）在国外申请的专利，不可能在我国申请专利，即使申请了，由于其失去新颖性，也得不到专利。对在1993年1月1日以前批准的专利，从申请日开始计保护15年（不管申请后是两年还是五年获准专利权），如1986年5月5日申请的，1990年10月12日获得专利权，该专利到期的时间是2001年5月4日。对在1993年1月1日后在我国获得授权的专利，从申请日开始计保护20年，当然在专利保护期内，由于种种原因，申请人放弃专利权的，自放弃专利权之日起，即不受法律保护；若申请了专利，但（从来）没有授权，可认为该专利不存在，只有授权的专利，才受法律保护。若在1993年1月1日后（即申请日在1993年1月1日后）虽在国外申请了专利，未在我国申请专利，该专利亦不受我国专利法保护。对在1993年1月1日前依照中国专利法规定其独占权不受保护的，1986年1月1日至1993年1月1日期间，获得禁止他人在申请人所在国制造、使用或者销售的独占权，以及在提出行政保护前尚未在中国销售的农药品种实施行政保护，保护期为七年零六个月。仿制专利过期的以及不受我国专利法保护的农药品种，是合乎我国国情的。编者在多年从事新农药创制的过程中，积累了大量的资料，现整理成此书，且大多数品种可在“十·五”期间实施，故书名为《世界农药信息手册》，供大家参考。

本书共收集了我国尚未生产的农药品种143个：杀菌剂40个，杀虫杀螨剂33个，除草剂70个。内容包括产品简介、专利概况（国外申请专利情况，我国登记、专利申请以及行政保护等）、合成方法、应用以及主要参考文献。书后附有《农业化学品行政保护条例》、《中华人民共和国专利法》选摘以及完善的索引备查：CA登录号索引、分子式索引、试验代号索引、中文通用名称索引、通用名称索引、英文商品名称索引（如查中文通用名称时，可立即知道

其对应的试验代号、通用名称、英文商品名称以及国外公司在我国销售用的中文商品名称等)。

参加本书编写的还有沈阳化工研究院信息中心张敏恒、姜雅君、夏彩云、谢心宏和严秋旭等同志。在本书编写过程中,自始至终得到胡耐冬、刘子祎的大力支持,在此表示感谢。由于编者水平有限,书中存在失误或不足,敬请读者给予指正。

编者

2000年1月5日 沈阳

目 录

| | |
|-----------------------------------|----|
| 一、如何使用本书专利概况之内容 | 1 |
| 二、杀虫、杀螨剂 | 2 |
| 1. 氯唑磷 (isazofos) | 2 |
| 2. 吡唑硫磷 (pyraclofos) | 3 |
| 3. 甲基吡噁磷 (azamethiphos) | 4 |
| 4. 噹唑磷 (fosthiazate) | 5 |
| 5. 乙硫苯威 (ethiofencarb) | 6 |
| 6. 丁硫克百威 (carbosulfan) | 7 |
| 7. 丙硫克百威 (benfuracarb) | 8 |
| 8. 棉铃威 (alanycarb) | 10 |
| 9. 乙氰菊酯 (cycloprothrin) | 11 |
| 10. 氟氯菊酯 (bifenthrin) | 12 |
| 11. 氟氯氰菊酯 (beta-cyfluthrin) | 14 |
| 12. 七氟菊酯 (tefluthrin) | 15 |
| 13. 氟酯菊酯 (acrinathrin) | 17 |
| 14. 氟胺氰菊酯 (tau-fluvalinate) | 18 |
| 15. 酰菊酯 (etofenprox) | 20 |
| 16. 蚊蝇醚 (pyriproxyfen) | 21 |
| 17. 灭蝇胺 (cyromazine) | 22 |
| 18. 氟虫脲 (flufenoxuron) | 23 |
| 19. 定虫隆 (chlorfluazuron) | 25 |
| 20. 伏虫隆 (teflubenzuron) | 26 |
| 21. 吡虫隆 (fluazuron) | 27 |
| 22. 虫酰肼 (tebufenozide) | 28 |
| 23. 杀虫磺 (bensultap) | 29 |
| 24. 杀虫环 (thiocyclam) | 30 |
| 25. 灭螨酮 (acequinocyl) | 31 |
| 26. 噹螨酮 (hexythiazox) | 32 |
| 27. 哮螨酯 (fenpyroximate) | 33 |
| 28. 喘螨醚 (fenazaquin) | 34 |
| 29. 氟螨脲 (flucycloxuron) | 35 |
| 30. 杀螨隆 (diafenthiuron) | 37 |
| 31. 吡螨胺 (tebufenpyrad) | 38 |
| 32. 氟虫腈 (fipronil) | 40 |
| 33. 溴虫腈 (chlorfenapyr) | 41 |
| 三、杀菌剂 | 42 |
| 1. 戊菌隆 (pencycuron) | 42 |
| 2. 氟酰胺 (flutolanil) | 43 |
| 3. 噹氟酰胺 (trifluzamide) | 44 |
| 4. 环丙酰胺 (carpropamid) | 45 |
| 5. 氟啶胺 (fluazinam) | 47 |
| 6. 高效甲霜灵 (metalaxyl-M) | 48 |
| 7. 乙菌利 (chlozolinate) | 49 |
| 8. 磷菌胺 (flusulfamide) | 50 |
| 9. 磷菌威 (methasulfocarb) | 51 |
| 10. 拌种咯 (fenpiclonil) | 52 |
| 11. 氟咯菌腈 (fludioxonil) | 53 |
| 12. 抑霉唑 (imazalil) | 55 |
| 13. 咪鲜安 (prochloraz) | 56 |
| 14. 氟菌唑 (triflumizole) | 57 |
| 15. 稻瘟酯 (pefurazoate) | 59 |
| 16. 酰胺唑 (imibenconazole) | 60 |
| 17. 氟醚唑 (tetraconazole) | 61 |
| 18. 哮菌腈 (fenbuconazole) | 62 |
| 19. 己唑醇 (hexaconazole) | 64 |
| 20. 粉唑醇 (flutriafol) | 65 |
| 21. 环唑醇 (cycloconazole) | 66 |
| 22. 戊唑醇 (tebuconazole) | 67 |
| 23. 糠菌唑 (bromuconazole) | 68 |
| 24. 丙环唑 (propiconazol) | 70 |
| 25. 恶唑唑 (difenoconazole) | 71 |
| 26. 环氧菌唑 (epoxiconazole) | 73 |
| 27. 羟菌唑 (metconazole) | 74 |
| 28. 氟硅唑 (flusilazole) | 75 |
| 29. 哒斑肟 (pyrifenoxy) | 77 |
| 30. 哒菌清 (diclomezin) | 78 |
| 31. 氯苯嘧啶醇 (fenarimol) | 79 |
| 32. 氟苯嘧啶醇 (nuarimol) | 80 |
| 33. 甲基嘧菌胺 (pyrimethanil) | 81 |
| 34. 噩菌胺 (mepanipyrim) | 83 |

| | | | |
|---------------------------------------|-----------|---|-----|
| 35. 噻菌脲 (ferimzone) | 84 | 29. 氟胺黄隆 (triflulsulfuron-methyl) | 125 |
| 36. 苯锈啶 (fenpropidin) | 85 | 30. 玉嘧磺隆 (rimsulfuron) | 126 |
| 37. 丁苯吗啉 (fenpropimorph) | 87 | 31. 氯吡嘧磺隆 (halosulfuron-methyl) | 127 |
| 38. 苯氧菌酯 (kresoxim-methyl) | 88 | 32. 乙氧嘧磺隆 (ethoxysulfuron) | 129 |
| 39. 噻菌酯 (azoxystrobin) | 90 | 33. 三氟丙磺隆 (prosulfuron) | 130 |
| 40. 噁唑菌酮 (famoxadone) | 92 | 34. 四唑嘧磺隆 (azimsulfuron) | 132 |
| 四、除草剂 | 94 | 35. 磺酰三唑酮 (sulfentrazone) | 133 |
| 1. 高2-甲-4-氯丙酸 (mecoprop-P) | 94 | 36. 三唑酮草酯 (carfentrazone-ethyl) | 135 |
| 2. 高2,4-滴丙酸 (dichlorprop-P) | 95 | 37. 哌啶草酮 (azafenidin) | 137 |
| 3. 稗草胺 (clomeprop) | 95 | 38. 哌嘧磺草胺 (flumetsulam) | 138 |
| 4. 萍氧丙草胺 (napropamide) | 96 | 39. 甲氧咪草烟 (imazamox) | 140 |
| 5. 吡氟禾草灵 (fluazifop-P-butyl) | 97 | 40. 噻硫草醚 (pyrithiobac-sodium) | 142 |
| 6. 吡氟氯禾灵 (haloxyfop) | 99 | 41. 双嘧草醚 (bispyribac-sodium) | 144 |
| 7. 喹草酯 (propaquizafop) | 100 | 42. 哌草胺 (cafenstrole) | 145 |
| 8. 苯草醚 (aclonifen) | 102 | 43. 氟噻乙草酯 (fluthiacet-ethyl) | 147 |
| 9. 乙羧氟草醚 (fluoroglycofen-ethyl) | 103 | 44. 丙炔氟草胺 (flumioxazin) | 148 |
| 10. 乳氟禾草灵 (lactofen) | 104 | 45. 氟亚胺草酯 (flumiclorac-penty) | 150 |
| 11. 氯氟草醚乙酯 (ethoxyfen-ethyl) | 105 | 46. 氟咯草酮 (fluorochloridone) | 151 |
| 12. 吡草胺 (metazachlor) | 106 | 47. 吡草酮 (benzofenap) | 152 |
| 13. 二甲噁草胺 (dimethenamid) | 107 | 48. 苄草唑 (pyrazoxyfen) | 154 |
| 14. 甲氧噁草胺 (thenylchlor) | 108 | 49. 绿草定 (triclopyr) | 155 |
| 15. 异恶草胺 (ixoxaben) | 109 | 50. 氟草烟 (fluroxypyr) | 156 |
| 16. 吡氟草胺 (diflufenican) | 110 | 51. 氟硫草定 (dithiopyr) | 157 |
| 17. 溴丁酰草胺 (bromobutide) | 111 | 52. 噻草啶 (thiazopyr) | 158 |
| 18. 二甲戊乐灵 (pendimethalin) | 112 | 53. 呋草酮 (flurtamone) | 160 |
| 19. 甲氧苯草隆 (metobenzuron) | 113 | 54. 乙呋草黄 (ethofumesate) | 161 |
| 20. 苄草隆 (cumyluron) | 115 | 55. 呋草黄 (benfuresate) | 162 |
| 21. 氟吡草腙 (diflufenopyr) | 116 | 56. 异恶草酮 (clomazone) | 163 |
| 22. 喹草丹 (dimepiperate) | 116 | 57. 恶草酮 (oxadiazon) | 164 |
| 23. 稗草畏 (pyributicarb) | 117 | 58. 丙炔恶草酮 (oxadiargyl) | 165 |
| 24. 禾草畏 (esprocarb) | 119 | 59. 环庚草醚 (cinmethylin) | 167 |
| 25. 酚苯黄隆 (triasulfuron) | 120 | 60. 肠草酮 (tralkoxydim) | 168 |
| 26. 氟嘧黄隆 (primisulfuron-methyl) | 121 | 61. 噻草酮 (cycloxydim) | 169 |
| 27. 烟嘧黄隆 (nicosulfuron) | 122 | 62. 稀禾定 (sethoxydim) | 170 |
| 28. 哌嘧黄隆 (flazasulfuron) | 123 | | |

| | | | |
|------------------------------|------------|-------------------------------|-----|
| 63. 烯草酮 (clethodim) | 172 | 2. 分子式索引 | 181 |
| 64. 磺草酮 (sulcotrione) | 173 | 3. 试验代号索引 | 182 |
| 65. 草铵膦 (glufosinate) | 174 | 4. 中文通用名称索引 | 183 |
| 66. 麦草畏 (dicamba) | 175 | 5. 通用名称索引 | 188 |
| 67. 解草酮 (benoxacor) | 176 | 6. 英文商品名称索引 | 190 |
| 68. 解草啶 (fenclorim) | 177 | 7. 农业化学物质产品行政保护条例 ... | 192 |
| 69. 解草安 (flurazole) | 178 | 8. 中华人民共和国专利法选摘 | 194 |
| 70. 调环酸 (prohexadione) | 179 | 9. 国外部分农药品种在我国的知识产权保护状况 | 196 |
| 五、附录 | 180 | | |
| 1. CAS 登录号索引 | 180 | | |

一、如何使用本书专利概况之内容

目前国内部分农药科研单位或企业对许多农药品种非常感兴趣，但对专利权问题了解的不多，有的农药企业对许多农药品种本身就不甚了解，这就是编写本书的目的所在。本书专利概况部分要解决的问题就是专利问题，那么，如何使用该部分内容呢？

在专利概况中最基本的内容有三部分：专利号、专利公开日、专利申请日。专利号除美国专利外，其它均为专利公开号，即未授权；有的已给出相应的中国专利号（指公开号），但由于这些农药品种绝大多数已商品化，专利授权是无疑的。大家目前关心的应是某些农药品种在我国是否申请专利，有无专利权问题？

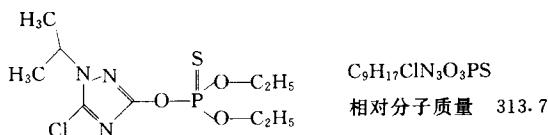
最简单、最经济的方法是利用 CA 专利索引。（1）在专利概况中已给出相应中国专利号（指公开号）的，利用 CA 专利索引即可知道该专利是否授权，即在该专利公开号后括号内若有 xxxxxxxxB 或 C 的均授权，但是否放弃，需要到我国知识产权局咨询。常识告诉我们，绝大多数农药品种的专利权是轻易不会放弃的。也可进入中国专利网（www@patent.com.cn），输入专利公开号，即可知道是否授权。从专利说明书的第一页即可查到申请日期，申请日期在 1993 年 1 月 1 日前的，保护 15 年；申请日期在 1993 年 1 月 1 日后的，保护 20 年。（2）在专利概况中未给出相应中国专利号的，如给出欧洲专利公开号，亦利用 CA 专利索引，查该欧洲专利公开号，即可知道该专利是否授权，即在该专利公开号后括号内若有 xxxxxxxxB 的均授权，在同一条目下可以看到该专利是否申请了中国专利，中国专利是否授权，即如果在同一条目下看到 CN，就表明该专利申请了中国专利，若该专利公开号后括号内若有 xxxxxxxxB 或 C 的，表明已授权；若无 CN，则表明没有申请中国专利。对没有申请中国专利的，在其它国家申请专利且申请日期在 1986 年 1 月 1 日至 1993 年 1 月 1 日之间的，如唑草胺于 1990 年 8 月 3 日申请了世界专利 WO 92 02512，则有可能按行政保护对待；对没有申请中国专利的，在其它国家申请专利，且申请日期在 1986 年 1 月 1 日之前和 1993 年 1 月 1 日之后的，将不受我国法律保护。

编者

2000 年 1 月 6 日 沈阳

二、杀虫、杀螨剂

1. 氯唑磷 (isazofos)



产品简介

氯唑磷(实验代号 CGA 12223, 通用名称 isazofos, 商品名称 Miral, 米乐尔)为诺华公司开发的杀虫剂, 兼有杀线虫活性。

化学名称: *O*-5-氯-1-异丙基-1*H*-1,2,4-三唑-3-基-*O*,*O*-二乙基硫代磷酸酯; 英文化学名为 *O*-(5-chloro-1-isopropyl-1*H*-1,2,4-triazol-3-yl)-*O*,*O*-diethyl phosphorothioate; 美国化学文摘(CA)主题索引名及 CAS 登录号分别为: *O*-[5-chloro-1-(1-methylethyl)-1*H*-1,2,4-triazol-3-yl]-*O*,*O*-diethyl phosphorothioate 和 [42509-80-8]。

纯品为黄色液体, 沸点 120℃/32Pa, 20℃时蒸气压 7.45mPa, 20℃时相对密度为 1.23。20℃水中溶解度为 168mg/L, 溶于苯、氯仿、己烷和甲醇。20℃时水解半衰期: pH5 时为 85d, pH7 时为 48d, pH9 时为 19d。在 200℃时分解。

毒性: 大白鼠急性经口 LD₅₀ 40~60mg 原药/kg; 雄大白鼠急性经皮 LD₅₀>3100mg/kg (雄), 118mg/kg (雌)。对兔皮肤有中等刺激作用, 对眼睛有很轻的刺激作用。大白鼠吸入 LC₅₀ (4h) 为 0.24mg/L 空气。90 天饲喂试验的无作用剂量: 大白鼠 2mg/kg 饲料(每天 0.2mg/kg), 狗 2mg/kg 饲料(每天 0.05mg/kg)。鳟鱼 LC₅₀(96h) 0.008mg/L, 鲤鱼 0.22mg/L, 蓝鳃鱼 0.01mg/L。对鸟和蜜蜂有毒。

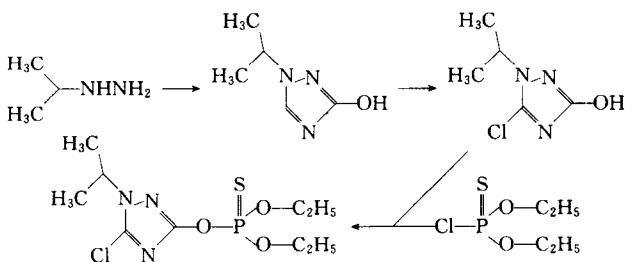
专利概况

专利号 DE-OS 2260015(1973)不存在专利权问题

专利拥有者 诺华公司

合成方法

以异丙基肼为原料, 经如下反应制得。



应用

本品是有机磷杀虫剂和杀线虫剂, 有触杀、胃毒和内吸作用。用于玉米、棉花、水稻、甜

菜、草皮和蔬菜上，防治长蝽象、南瓜十二星叶甲、日本丽金龟、线虫、种蝇等害虫。可作土壤处理剂，也可以进行种子处理或叶面喷施，剂量一般为0.5~2kg/ha。不能在烟草和马铃薯地施用，以防出现药害。该药的半衰期在土壤中为1~3个月，在作物上1~2d。

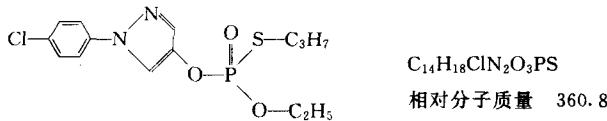
在我国登记情况

LS 92007, Miral 3G, 米乐尔3%颗粒剂。防治甘蔗蔗龟、蔗螟，150~180g/亩沟施；防治水稻稻瘿蚊、稻飞虱、三化螟，30g/亩撒施。瑞士汽巴-嘉基公司。

主要参考文献

- 1 The Pesticide Manual. 11th Ed. 1997. 726
- 2 BE 792452.
- 3 GB 1419131.

2. 吡唑硫磷 (pyraclofos)



产品简介

吡唑硫磷(实验代号 TIA-230, 通用名称 pyraclofos, 商品名称 Boltage, Voltage)为日本武田制药公司开发的三元不对称有机磷类杀虫剂。

化学名称：(RS)[O-1-(4-氯苯基)吡唑-4-基]-O-乙基-S-丙基硫代磷酸酯；英文化学名称为(RS)-[O-1-(4-chlorophenyl)pyrazol-4-yl]-O-ethyl S-propyl phosphorothioate；美国化学文摘(CA)主题索引名及CAS登录号分别为：(±)O-[1-(4-chlorophenyl)-1*H*-pyrazol-4-yl]-O-ethyl-S-propyl phosphorothioate 和[77458-01-6]。

其纯品为淡黄色油状液体，沸点164℃/1.33Pa，蒸气压1600nPa(20℃)，相对密度1.271(28℃)。溶解度(20℃)：水33mg/L，与大多数有机溶剂互溶。稳定性：水解(25℃)半衰期29d(pH7)，土壤中半衰期50d(室温下、好气和厌氧条件下)。

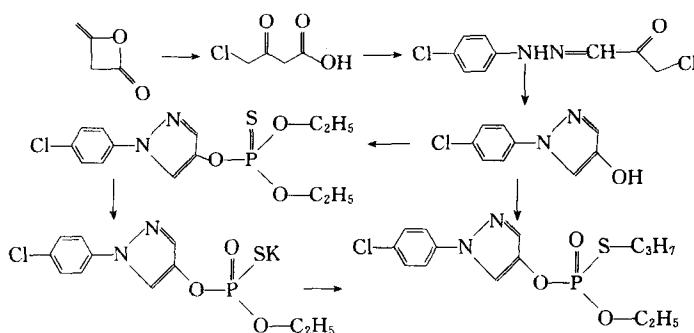
毒性：大鼠急性经口LD₅₀237mg/kg；小鼠急性经口LD₅₀575mg/kg(雄)、420mg/kg(雌)；大鼠急性经皮LD₅₀>2000mg/kg；大鼠急性吸入LC₅₀1.69mg/L(雄)、1.46mg/L(雌)；大鼠饲喂试验的无作用剂量为3mg/kg 饲料，鹌鹑LC₅₀164mg/kg 饲料，野鸭LC₅₀348mg/kg 饲料。鲤鱼LC₅₀(74h)0.028mg/L。对兔眼睛和皮肤无刺激作用，对豚鼠皮肤无过敏性，无致癌、致畸、致突变性。

专利概况

| | |
|--------|---------------------------|
| 专利名称 | Pyrazole phosphate esters |
| 专利号 | DE-OS 3012193. |
| 专利公开日期 | 1980.10.9 |
| 专利申请日期 | 1981.3.30 |
| 专利拥有者 | 日本武田制药公司 |

合成方法

以为双乙烯酮、对氯苯胺原料，制得3-氯丙酮醛对氯苯腙。然后在氢氧化钠存在下，于甲醇中环合，生成1-(4-氯苯基)-4-羟基吡唑，最后在三乙胺存在下，在乙腈中，与O-乙基-S-丙基磷酰氯在50℃反应3h，即制得本品，收率78%以上。或用转位方法制得。反应式如下。



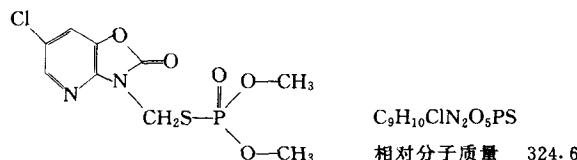
应用

本品属有机磷杀虫剂，是胆碱酯酶抑制剂。以0.25~1.5kg(a.i.)/ha施用，可有效防治蔬菜上的鳞翅目害虫(实夜蛾属和灰翅夜蛾属)。对棉花的埃及棉夜蛾、棉铃虫、棉斑实蛾、红铃虫、飞虱、蓟马，马铃薯的马铃薯甲虫、块茎蛾，甘薯的甘薯烦夜蛾、麦蛾，茶的茶叶细蛾、黄蓟马等田间防治用量为0.5~1.5kg(a.i.)/ha。

主要参考文献

- 1 The Pesticide Manual. 11th Ed. 1997. 1046
- 2 Pestic. Biochem. Physiol. 1983, 20: 225
- 3 US 4474775. 1984
- 4 Japan Pesticide Information. 1988, 53: 27~31
- 5 日本農薬学会誌, 1990, 15 (4): 635~640
- 6 特开昭 59-112970. 1984

3. 甲基吡噁磷 (azamethiphos)



产品简介

甲基吡噁磷(实验代号 CGA 18809, 通用名称 azamethiphos, 商品名称 Alfracron)为汽巴-嘉基公司开发的杀虫、杀螨剂。

化学名称: *S*-6-氯-2,3-二氢-2-氧-1,3-噁唑[4,5b]吡啶-3-基 甲基-*O,O*-二甲基硫代磷酸酯; 英文化学名称为 *S*-6-chloro-2,3-dihydro-2-oxo-1,3-oxazolo[4,5b]pyridin-3-ylmethyl-*O,O*-dimethyl phosphorothioate; 美国化学文摘(CA)主题索引名及 CAS 登录号分别为: *S*-[(6-chloro-2-oxooxazolo[4,5b]pyridin-3-(2*H*)-yl)methyl]-*O,O*-dimethyl phosphorothioate 和 [35575-96-3]。

其纯品为无色晶体, 熔点89℃, 20℃蒸气压为0.0049mPa, 20℃密度1.60g/L。20℃时溶解性: 水1.1g/L, 20℃在有机溶剂中溶解度(g/kg)苯13、二氯甲烷61、甲醇10、正辛醇5.8。20℃时水解半衰期: pH5时为800h, pH7时为260h, pH9时为4.3h。

毒性: 大白鼠急性经口 LD₅₀>1180mg/kg, 大白鼠急性经皮 LD₅₀>2150mg/kg。对兔皮肤

无刺激作用，但对眼睛有轻微刺激作用。90天饲喂试验无作用剂量：大白鼠 20mg/kg 饲料（每天 2mg/kg），狗 10mg/kg 饲料（每天 0.3mg/kg）。虹鳟鱼 LC₅₀ (96h) 0.2mg/L，鲤鱼 6.0mg/L，蓝鳃鱼 8.0mg/L。对蜜蜂有毒，对日本鹌鹑无毒。

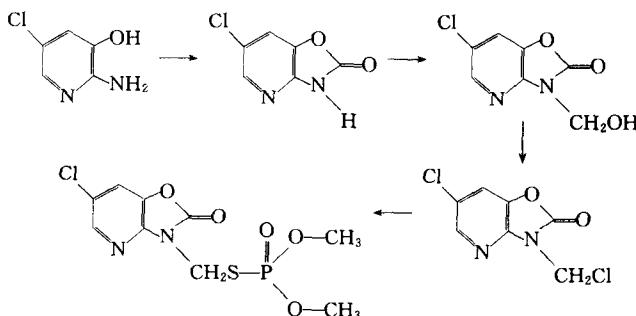
专利概况

专利号 DE-OS 2131734(1972)不存在专利权问题

专利拥有者 諾华公司

合成方法

以 2-氨基-5-氯-4-吡啶醇为原料，与光气合环、羟甲基化、氯化、缩合等反应制得。反应式如下。



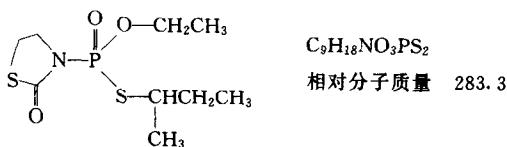
应用

本品有触杀和胃毒作用，是广谱性杀虫剂，其击倒作用快和持效期长，主要在棉花、果树和蔬菜地以及卫生方面，防治苹果蠹蛾、螨、蚜虫、叶蝉、木虱、梨小食心虫、马铃薯甲虫、家蝇、蚊子、蟑螂等害虫。剂量为 0.56~1.12kg/ha。

主要参考文献

- 1 Proc. Brit. Crop Prot. Conf. Pests Dis. 1977. 1025
- 2 The Pesticide Manual. 11th Ed. 1997. 61
- 3 BE 769051.
- 4 GB 1347373.

4. 噻唑磷 (fosthiazate)



产品简介

噻唑磷(实验代号 IKI 1145，通用名称 fosthiazate，商品名称 Nemathorin)为日本石原产业公司共同开发的杀线虫剂。

化学名称：(RS)-S-仲丁基-O-乙基-2-氧代-1,3-噻唑烷-3-基硫代膦酸酯或(RS)-3-[仲丁硫基(乙氧基)膦酸]-1,3-噻唑烷-2-酮；英文化学名称为(RS)-S-sec-butyl-O-ethyl-2-oxo-1,3-thiazolidin-3-ylphosphonothioate 或 (RS)-3-sec-butylthio(ethoxy)phosphinoyl]-1,3-thiazolidin-2-one；美国化学文摘(CA)主题索引名及 CAS 登录号分别为：O-ethyl-S-(1-methylpropyl)(2-oxo-3-thiazolidinyl) phosphonothioate 和[98886-44-3]。

其纯品为浅棕色油状物；沸点 198℃/66.66Pa，蒸气压 $>5.6 \times 10^{-4}$ Pa(25℃)，溶解度(20℃, mg/L)水 9.85、正己烷 15.14。

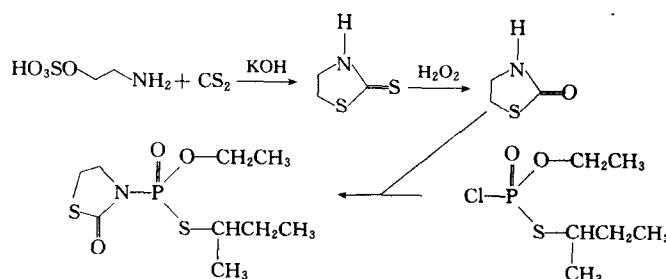
毒性：大鼠急性经口 LD₅₀(mg/kg)：雄 73、雌 57，大鼠急性经皮 LD₅₀(mg/kg)：雄 2396、雌 861，本品对兔眼睛有刺激，而对皮肤无刺激。

专利概况

| | |
|--------|---|
| 专利名称 | Organophosphorus compounds and insecticidal, miticidal or nematocidal composition containing them |
| 专利号 | EP 146748. |
| 专利公开日期 | 1985. 7. 3 |
| 专利申请日期 | 1983. 11. 11 |
| 专利拥有者 | 日本石原产业公司 |

合成方法

1-氨基-2-乙基硫酸酯与二硫化碳和氢氧化钾的水溶液在乙醇中反应，生成 2-噻唑烷硫酮，该化合物用过氧化氢在甲醇中于室温下氧化，生成 2-噻唑烷酮，再用丁基锂在四氢呋喃中锂化，然后与磷酰氯在室温下反应 3h，即制得产品。反应式如下。



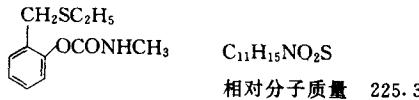
应用

主要用于防治线虫、蚜虫等。

主要参考文献

- 1 The Pesticide Manual. 11th Ed. 1997. 631
- 2 EP 146748. 1985
- 3 US 4590182. 1985

5. 乙硫苯威 (ethiofencarb)



产品简介

乙硫苯威(实验代号 HOX 1901, 通用名称 ethiofencarb、ethiophencarbe, 商品名称 Croneton)为拜耳公司开发的杀虫剂。

化学名称： α -乙硫基-邻-甲苯基甲基甲酸酯；英文化学名称为 α -ethylthio-*o*-tolylmethylcarbamate 或 2-ethylthiomethylphenylmethylcarbamate；美国化学文摘(CA)主题索引名及 CAS 登录号分别为：2-[(ethylthio)methyl]phenyl methylcarbamate 和 [29973-13-5]。

其纯品为无色结晶，熔点 33.4℃，蒸气压 0.45mPa(20℃)，相对密度 1.231，溶解度

(20℃)：水中 1.8g/L，二氯甲烷、异丙醇、甲苯中 >200g/L。稳定性：在土壤和水中有光存在下快速分解。

毒性：急性经口 LD₅₀(mg/kg)：大鼠约 200、小鼠约 240、狗约 50；雄大鼠急性经皮 LD₅₀ >1000mg/kg；大鼠急性吸入 LD₅₀(4h) 0.24mg/L 空气。大鼠两年饲喂试验的无作用剂量为 330mg/kg 饲料。对人的 ADI 为 0.1mg/kg 体重。日本鹌鹑急性经口 LD₅₀ 155mg/kg，对金丝雀的急性经口 LD₅₀ 约为 100mg/kg，对母鸡急性经口 LD₅₀ 1000mg/kg。鱼毒 LC₅₀(96h, mg/L) 鲤鱼 10~20、金鱼 20~40。

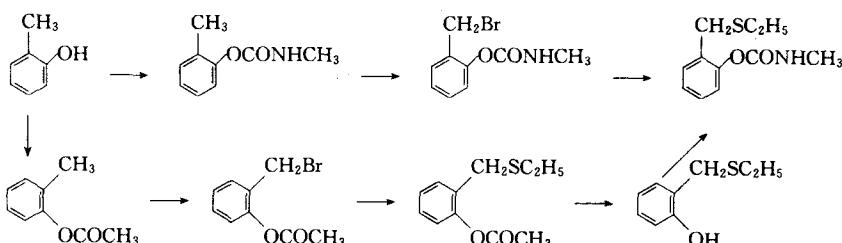
专利概况

专利号 DE-OS 1910588(1970)不存在专利权问题

专利拥有者 日本特殊农药公司

合成方法

以邻甲酚为原料，经如下反应制得。



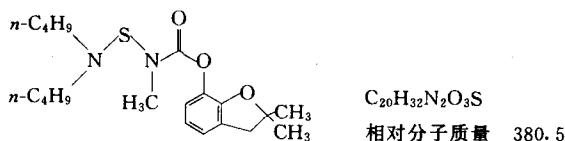
应用

本品是土壤和叶面施用的内吸性杀虫剂，以约 50g(a.i.)/ha 对蚜科特别有效。可在禾谷类作物、棉花、果树、玉米、观赏植物、马铃薯、糖甜菜、烟草和蔬菜上使用。

主要参考文献

- 1 The Pesticide Manual. 11th Ed. 1997. 479
- 2 DE 1910588.
- 3 BE 746649.

6. 丁硫克百威 (carbosulfan)



产品简介

丁硫克百威(实验代号 FMC 35 001，通用名称 carbosulfan，商品名称 Marshall, Adrantage，好年冬)为 FMC 公司开发的杀虫剂。

化学名称：2,3-二氢-2,2-二甲基苯并呋喃-7-基(二丁基氨基硫)甲基氨基甲酸酯；英文化学名称为 2,3-dihydro-2,2-dimethylbenzofuran-7-yl(dibutylaminothio)methylcarbamate；美国化学文摘(CA)主题索引名及 CAS 登录号分别为：2,3-dihydro-2,2-dimethyl-7-benzofuranyl[(dibutylamino)thio]methylcarbamate 和 [55285-14-8]。

其纯品为褐色黏稠液体，沸点 124~128℃，蒸气压 0.041mPa。相对密度 1.056(20℃)，溶解度(25℃)：水中 0.03mg/L，与丙酮、二氯甲烷、乙醇、二甲苯互溶。稳定性：在乙酸乙

酯中 60℃下稳定，在 pH<7 时分解。

毒性：雄、雌大鼠急性经口 LD₅₀ 分别为 250 mg(a. i.)kg 和 185mg/kg，兔急性经皮 LD₅₀ >2000mg/kg，雄、雌大鼠急性吸入 LC₅₀(1h) 分别为 1.53mg/L 空气和 0.61mg/L 空气，大鼠和小鼠两年饲喂无作用(致突变)剂量为 20mg/kg 饲料。对人的 ADI 为 0.01mg/kg 体重。雉、野鸭、鹌鹑的急性经口 LD₅₀(mg/kg) 分别为 26、8.1、82。鱼毒 LC₅₀(96h, mg/L)：蓝鳃鱼 0.015、鳟鱼 0.042、鲤鱼(48h)0.55mg/kg。

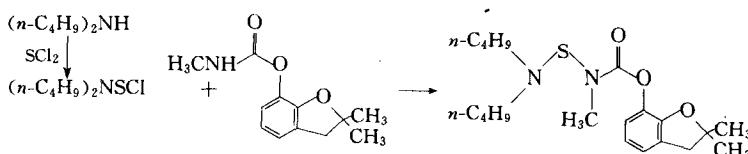
专利概况

专利号 DE-OS 2433680 不存在专利权问题

专利拥有者 FMC

合成方法

以二丁基胺为原料，与二氯化硫反应，生成物与 2,3-二氢-2,2-二甲基苯并呋喃-7-基甲基氨基甲酸酯反应，即制得丁硫克百威。反应式如下。



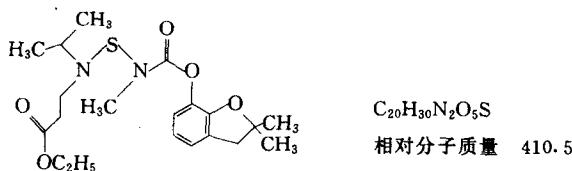
应用

本品为氨基甲酸酯类杀虫剂，胆碱酯酶抑制剂。系克百威低毒化衍生物，杀虫谱广，能防治蚜虫、螨、金针虫、甜菜隐食甲、甜菜跳甲、马铃薯甲虫、果树卷叶蛾、苹瘿蚊、苹果蠹蛾、茶微叶蝉、梨小食心虫和介壳虫等，剂量 0.1~1.5kg/ha。作土壤处理，可防治地下害虫(倍足亚纲、叩甲科、综合纲)和防治柑橘、马铃薯、水稻、甜菜等作物的叶面害虫(蚜科、马铃薯甲虫)。剂量：马铃薯为 1~3kg/ha，甜菜为 0.3~1.0kg/ha，水稻为 0.15~0.5kg/ha。

主要参考文献

- 1 Proc. Br. Crop Prot. Conf. Pest and Dis. 1979. 557~564
- 2 The Pesticide Manual. 11th Ed. 1997. 188
- 3 DE 2433680 (1975); CA 82: 156050.
- 4 DE 2655212 (1977); CA 88: 6344.

7. 丙硫克百威 (benfuracarb)



产品简介

丙硫克百威(实验代号 OK 174，通用名称 benfuracarb，商品名称 Oncol、呋喃威、安克力)是由日本大冢化学药品公司开发的杀虫剂。

化学名称：*N*-[2,3-二氢-2,2-二甲基苯并呋喃-7-基氧羰基(甲基)氨基硫基]-*N*-异丙基-β-丙氨酸乙酯；英文化学名称为 ethyl *N*-[2,3-dihydro-2,2-dimethylbenzofuran-7-yloxycarbonyl (methyl)aminothio]-*N*-isopropyl-β-alaninate；美国化学文摘(CA)主题索引名及 CAS 登录号

分别为: 2,3-dihydro-2,2-dimethyl-7-benzofuranyl-2-methyl-4-(1-methylethyl)-7-oxo-8-oxa-3-thia-2,4-diazadecanoate 和[82560-54-1]。

其纯品为红棕色黏稠液体, 蒸气压 0.0267 mPa(20℃), 相对密度(20℃)1.142。溶解度(20℃): 水 8mg/L, 溶于大多数有机溶剂。稳定性: 日光下, 在玻璃板上降解, DT₅₀为 3h。

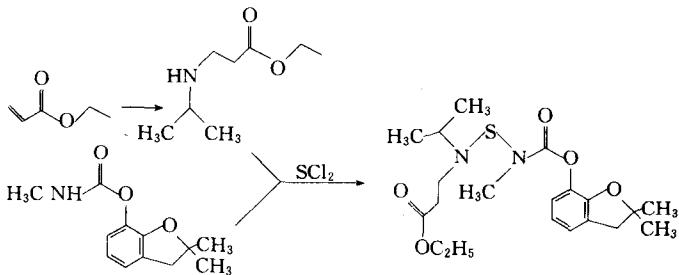
毒性: 大、小鼠急性经口 LD₅₀(mg/kg)分别为 138、175, 狗急性经口 LD₅₀为 300mg/kg; 小鼠皮下注射 LD₅₀>288mg/kg; 急性经皮 LD₅₀>2000mg/kg; 对皮肤和眼睛无刺激作用。大鼠 2 年饲喂试验中, 无作用剂量为 1.5mg/(kg·d), 无诱变性。母鸡急性经口 LD₅₀为 92mg/kg; 鱼毒 LC₅₀(48h)0.65mg/L, 水蚤 LC₅₀(3h)>10mg/L。

专利概况

| | |
|--------|--|
| 专利名称 | Insecticidal, acaricidal or nematocidal carbamate derivatives and compositions containing them |
| 专利号 | FR 2489329. |
| 专利公开日期 | 1982. 3. 5 |
| 专利申请日期 | 1980. 9. 1 |
| 专利拥有者 | 日本大冢化学药品公司 |

合成方法

以丙烯酸乙酯为原料, 经如下反应制得。



应用

本品属氨基甲酸酯类杀虫剂, 胆碱酯酶抑制剂, 是具有触杀和胃毒作用的内吸杀虫剂。田间试验证明, 防治长角叶甲、跳甲、玉米黑独角仙、苹果蠹蛾、马铃薯甲虫、金针虫、小菜蛾、稻象甲和蚜虫等活性高、持效期长。主要用于防治柑橘、玉米、水稻、甜菜和蔬菜上的害虫(叶甲科、金针虫科、稻根象和菜蛾)。使用方式主要作土壤处理, 玉米用 0.5~2.0kg(a.i.)/ha, 蔬菜用 1.0~2.5kg/ha, 甜菜用 0.5~1.0kg/ha; 也可用作种子处理, 每 100kg 种子用药 0.4~0.5kg, 蔬菜和果树也可进行茎叶喷雾, 剂量为 0.3~1.0kg/ha; 育苗箱移植水稻, 每箱 1.5~4.0g 处理。

主要参考文献

- 1 Proc. 10th Int. Congress of Plant Prot. 1983. 360~367
- 2 FR 2489329. 1982; CA 97: 72246.
- 3 BE 892670. 1982; CA 98: 34224.
- 4 The Pesticide Manual. 11th ed. 1997. 96