



普通高等教育农业部“十三五”规划教材

农药化学 合成基础

第三版

NONGYAO HUAXUE
HECHENG JICHU



孙家隆 主编

非
外
借



化学工业出版社



普通高等教育农业部“十三五”规划教材

农药化学 合成基础

第三版

孙家隆 主编



化学工业出版社

· 北京 ·

本书在第二版的基础上,除进一步完善了农药合成体系、增加了相关重要农药品种外,还有针对性的在农药品种合成中增加了“逆合成分析”等内容。本书系统地介绍了农药化学合成基础知识,主要包括杀虫剂、杀鼠剂、杀菌剂、除草剂以及植物生长调节剂等类农药品种的性能、结构及化学合成思路。通过对重要品种的合成路线及相关实例分析,展现给读者一个完整的农药化学合成研究知识体系。

本书适合作为大学农药相关专业的本科教材,也可作为农药学专业研究生及企业基层技术人员和相关研究人员参考。

图书在版编目(CIP)数据

农药化学合成基础/孙家隆主编. —3版. —北京: 化学工业出版社, 2018.11

普通高等教育农业部“十三五”规划教材

ISBN 978-7-122-33028-4

I. ①农… II. ①孙… III. ①农药-化学合成
IV. ①TQ450.1

中国版本图书馆CIP数据核字(2018)第214090号

责任编辑: 刘 军 张 艳
责任校对: 王鹏飞

文字编辑: 向 东
装帧设计: 王晓宇

出版发行: 化学工业出版社(北京市东城区青年湖南街13号 邮政编码100011)

印 装: 大厂聚鑫印刷有限责任公司

787mm×1092mm 1/16 印张23½ 字数604千字 2019年1月北京第3版第1次印刷

购书咨询: 010-64518888 售后服务: 010-64518899

网 址: <http://www.cip.com.cn>

凡购买本书,如有缺损质量问题,本社销售中心负责调换。

定 价: 60.00 元

版权所有 违者必究

本书编写人员名单

主 编：孙家隆

副主编：姜 林 张晓梅

编写人员：（按姓名汉语拼音排序）

姜 林 山东农业大学

李兴海 沈阳农业大学

彭大勇 江西农业大学

孙家隆 青岛农业大学

徐鲁斌 青岛农业大学

张 炜 青岛农业大学

张晓梅 安徽理工大学

前言

Preface

2017年注定是个值得记忆的历史年份，在“十九大”伟大光芒的照耀下，一切都显得那么美好、祥和，令人留恋。也就是在这一年秋天，本书被审定为普通高等教育农业部“十三五”规划教材，令人鼓舞。

业界的肯定，是鞭策和鼓励，也是一种质量的要求；对作者来说，更是一种责任的担当。鉴于此，作者根据农药学的最新发展，结合自己在教学中发现的问题，在第二版的基础上进行了比较全面的修订、更新和规范。这一版除完善农药体系、增加了相关农药品种外，还对大部分示例农药品种增加了“逆合成分析”等内容，希望能够达到启发思维、授人以渔的目的。

“农药管理条例”将“虫”界定为：昆虫、蜚、螨。因此，这次修订中杀螨剂不再单列，而是归并到杀虫剂一章。另外，由于大部分杀线虫剂同时属于杀虫剂，而且结构鲜有特殊，为便于系列讲授，也并入杀虫剂中讲解。书中涉及的农药品种较多，希望就此能在本科基础阶段形成化学农药的整体轮廓。

作为教材，本书适合32~56学时的课程，使用者可根据本校具体情况适当增删。就本质上讲，农药合成反应属于有机化学反应的具体应用和拓展，因此对本课程的建议是先开有机化学课程，有条件的院校还可以增加药物合成反应课程。

虽然是第三版，但作者依然初心不改：真诚地希望这本书能引起农药初学者研究农药学的兴趣，作为未来农药大师们的启蒙读物，成为他们成长道路上一块合格的垫脚石。若能如此，作者心愿足矣。

十年的时间，《农药化学合成基础》由一株不怎么看好、有点不被待见的小苗，成长为颇引人注目的大树，这与化学工业出版社这个现代化果园密不可分。因为这里不但有科学而又人性的管理，还有适合各种果树、名贵苗木、稀世花草的成长环境。

教育发展到今天，教材已经成为传道、授业的重要载体。作为规划教材，笔者可谓诚惶诚恐、呕心沥血，唯恐考虑不周或因书中疏漏而误人子弟。虽然如此，限于作者的水平和经验，难免挂一漏万。因此，恳请广大读者将宝贵意见发送至 qauyaoxue12345@163.com，以便重印和再版时做进一步的修改和充实。

孙家隆

2018年10月

第一版前言

2001年,青岛农业大学(原莱阳农学院)创办了面向农药的制药工程本科专业。此后,于2005年又创办了面向农药的药学本科专业,“农药合成化学”成为这两个专业的必修课程。为配合教学工作,本人参考各农药学专家的著作,于2003年编写了“农药化学合成讲义”,经过五年的教学试用,普遍反映良好。现在呈现在读者面前的《农药化学合成基础》是在“农药化学合成讲义”的基础上经过整理、修改而成。《农药化学合成基础》的出版,是各位农药专家关心以及各位农药同仁支持的结果。

现代农药的概念为:农药是指用于防治、消灭或控制危害农业、林业的病、虫、草和其他有害生物,有目的地调节植物及昆虫生长的化学合成,或者来源于生物、其他天然物的一种化合物或者几种物质的混合物及其制剂。根据目前我国农药发展现状以及当前农药学教学需求,本书内容为杀虫剂、杀螨剂、杀线虫剂、杀鼠剂、杀菌剂、除草剂以及植物生长调节剂,即只讲述“农药”中的“一种化合物”。考虑到制药工程专业和药学专业学生化学基础状况和农药化学合成的要求,适当补充了“农药化学合成基础知识”。依据高等教育关于“厚基础、宽口径”的要求,本书围绕“农药化学合成”主题展开讲述。从系列到重要品种,力求系统阐述各类农药的结构特点与合成方法,展现给读者一个全面而系统的当前农药的化学合成知识体系,从而为下一步农药研究与开发打下比较深厚的基础。由于农药品种很多,且各具体品种的合成各具特色,希望通过重要品种合成路线的示例,作为其所在类别农药的合成方法的补充,并进一步体现该类农药的合成思路。在不影响知识体系的系统性与完整性的情况下介绍代表性品种、当前生产的重要品种和新品种。

书中收进一些新农药品种的合成思路或路线设计,以期毕业生以及相关从事农药工作的读者进行农药研发时有所借鉴和启发。由于所收录的某些农药品种还在知识产权保护期内,准确的合成路线和方法尚在保密阶段,本书给出的合成路线或思路未必成熟,仅供参考。

本书按照平时讲课的思路和顺序,共分七章:1 绪论,2 农药化学合成基础知识,3 杀虫剂,4 杀螨、杀线虫及杀鼠剂,5 杀菌剂,6 除草剂,7 植物生长调节剂。将杀螨、杀线虫及杀鼠剂单列为一章只是个尝试。有机氯农药在农药发展过程以及农业生产中曾起过重要作用,但由于残留等问题,目前大部分品种被禁止或限制使用,本书不再专门讲述。

导师陈万义先生在编写思路及结构框架方面给予了细致的指导,先生的淳

淳教诲和严谨的治学态度使学生受益终生。安徽理工大学张晓梅博士和青岛农业大学郝双红博士通审了全部书稿，并提出了很多建设性意见。研究生任鹏宇同学校对了全部书稿。在此一并表示真诚感谢。

由于作者水平所限，书中疏漏与不妥之处在所难免，希望得到广大读者的指正，同时也希望本书能起到抛砖引玉的作用。

孙家隆

2008.1.17

第二版前言

本书自 2008 年初版，已历四年。同仁的肯定，实为对作者的鼓励和鞭策。初版书稿基本上是讲义直接付印，相当粗糙，甚至还有许多错误，十分汗颜。

这次修订，除了纠正原书中错误及不妥、精简和更新农药品种之外，还做了如下调整：首先是删除原书第二章“农药化学合成基础知识”，将必须的内容融会于各章节；再者是引入先导化合物的优化及新农药分子设计的初步概念，以期读者为以后的相关研究奠定基础；第三是增加了与生产实践有关的实例，希望能让读者对某些产品的开发有所借鉴。

这本小书，一如其他诸多书籍，表达了作者期待已久的愿望，即若宗师高手们当年的启蒙读物一般，为对农药化学合成研究或开发有兴趣的读者打下必要的基础知识。归根结底，作者真诚地期望本书会使已经或即将在奇妙而迷人的农药合成研究领域工作的同仁产生兴趣。

需要说明的是，本书读者需要有一定的有机化学知识。对于化学基础薄弱者来说，若在一定水平农药研究者指导下阅读，或许会有事半功倍的效果。

本书再版之际，首先衷心感谢化学工业出版社的大力支持以及广大读者的关心和鼓励，尤其是刘军博士在本书编写过程中提供的热情帮助。青岛农业大学杜春华博士通审了全部书稿，并提出了很多建设性意见，在此表示诚挚的谢意。

农药合成研究发展极快，文献材料极其丰富。限于作者的水平和经验，这次修订也只能从手头和感兴趣的资料中做一些选择与加工，难免挂一漏万、谬误百出。恳请广大读者将宝贵意见赐予 qauyaoxue12345@163.com，以便在重印和再版时做进一步修改和充实。

孙家隆

2012.8.1

缩 略 语

缩略语	英文名称	中文名称
Ac	acetyl	乙酰基
Ar	aryl	芳基
b.p.	boiling point	沸点
Bu	butyl	丁基
<i>n</i> -Bu	<i>n</i> -butyl	正丁基
<i>t</i> -Bu	<i>t</i> -butyl	叔丁基
Bz	benzoyl	苯甲酰基
Bzl	benzyl	苄基
Cbz	benzoxycarbonyl	苄氧羰基
cat.	catalyst	催化剂
DCC	<i>N,N'</i> -dicyclohexylcarbodiimide	二环己基碳二亚胺
DHP	3,4-dihydro-2 <i>H</i> -pyran	3,4-二氢-2 <i>H</i> -吡喃
DMF	dimethylformamide	<i>N,N'</i> -二甲基甲酰胺
DMSO	dimethyl sulfoxide	二甲亚砜
Et	ethyl	乙基
FGI	functional group inversion	官能团转换
h	hour(s)	小时
HMPA	hexamethylphosphoric triamide	六甲基磷酰胺
<i>hν</i>	light irradiation	光照
LD ₅₀	dose that is lethal in 50% of test subjects or median lethal dose	致死中量(半致死量)
MCPBA	<i>m</i> -chloroperbenzoic acid	间氯过氧苯甲酸
Me	methyl	甲基
min	minute(s)	分钟
mol	mole(s)	摩尔
m.p.	melting point	熔点
NBS	<i>N</i> -bromosuccinimide	<i>N</i> -溴丁二酰亚胺
Nu	nucleophile	亲核试剂
Ph	phenyl	苯基
PPA	poly(phosphoric acid)	多聚磷酸
Pr	propyl	丙基
Py	pyridine	吡啶
<i>i</i> -Pr	isopropyl	异丙基
<i>R</i>	rectus	<i>R</i> 构型
r.t.	room temperature	室温
<i>S</i>	sinister	<i>S</i> 构型
TFA	trifluoroacetic acid	三氟乙酸
Tbeoc	2,2,2-tribromoethoxycarbonyl	2,2,2-三溴乙氧羰基
Tceoc	2,2,2-trichloroethoxycarbonyl	2,2,2-三氯乙氧羰基
Tfac	trifluoroacetyl	三氟乙酰基
THF	tetrahydrofuran	四氢呋喃
<i>p</i> -Ts	<i>p</i> -toluenesulfonyl	对甲苯磺酰基

第 1 章 绪论 001

- 1.1 农药合成与农药工业 001 1.2 农药化合物合成路线设计基本方法 003

第 2 章 杀虫剂 005

- 2.1 概述 005
- 2.2 有机磷杀虫剂 006
- 2.2.1 结构特点与合成设计 007
- 2.2.2 代表性品种的结构与合成 013
- 对氧磷 (paraoxon) 013
- 敌敌畏 (dichlorvos) 014
- 辛硫磷 (phoxim) 016
- 甲基吡啶磷 (azamethiphos) 018
- 丙溴磷 (profenofos) 019
- 稻丰散 (phenthoate) 021
- 甲拌磷 (phorate) 023
- 丙线磷 (ethoprophos) 024
- 丙硫磷 (prothiofos) 025
- 马拉硫磷 (malathion) 026
- 异柳磷 (isofenphos) 027
- 苯线磷 (fenamiphos) 028
- 乙酰甲胺磷 (acephate) 029
- 敌百虫 (trichlorfon) 030
- 苯硫磷 (EPN) 031
- 磷亚威 (U-47319) 032
- 2.3 氨基甲酸酯杀虫剂 033
- 2.3.1 结构特点与合成设计 035
- 2.3.2 代表性品种的结构与合成 037
- 甲萘威 (carbaryl) 037
- 丁酮砜威 (butoxycarboxim) 039
- 抗蚜威 (pirimicarb) 040
- 丁硫克百威 (carbosulfan) 041
- 硫双灭多威 (thiodicarb) 043
- 茚虫威 (indoxacarb) 044
- 2.4 拟除虫菊酯杀虫剂 046
- 2.4.1 结构特点与合成设计 048
- 2.4.2 代表性品种的结构与合成 055
- 胺菊酯 (tetramethrin) 055
- 高效氯氟菊酯 (*beta*-cypermethrin) 057
- 溴氟菊酯 (deltamethrin) 060
- 高效氯氟菊酯 (*lambda*-cyhalothrin) 062
- 甲氟菊酯 (fenpropathrin) 063
- 高氟戊菊酯 (esfenvalerate) 065
- 四溴菊酯 (tralomethrin) 066
- 甲氧苄氟菊酯 (metofluthrin) 068
- 乙氟菊酯 (cycloprothrin) 069
- 醚菊酯 (ethofenprox) 070
- 氟酯菊酯 (acrinathrin) 071
- 2.5 苯甲酰脲类杀虫剂 073
- 2.5.1 结构特点与合成设计 073
- 2.5.2 代表性品种的结构与合成 076
- 氟啶脲 (chlorfluazuron) 076

氟铃脲 (hexaflumuron)·····	077	噻虫酰胺 (tolfenpxrad)·····	100
氟螨脲 (flucyloxuron)·····	079	2.10 其他重要杀虫剂的合成·····	102
2.6 双酰胺类杀虫剂·····	081	噻嗪酮 (buprofezin)·····	102
2.6.1 结构特点与合成设计·····	081	溴虫腈 (chlorfenapyr)·····	103
2.6.2 代表性品种的结构与合成·····	082	蚊蝇醚 (pyriproxyfen)·····	104
虫酰肼 (tebufenozide)·····	082	吡蚜酮 (pymetrozine)·····	105
呋喃虫酰肼 (JS118)·····	083	三氯杀螨醇 (dicofol)·····	107
2.7 沙蚕毒素杀虫剂·····	084	三氯杀螨砜 (tetradifon)·····	107
2.7.1 结构特点与合成设计·····	084	双甲脒 (amitraz)·····	108
2.7.2 代表性品种的结构与合成·····	085	三唑锡 (azocyclotin)·····	109
杀虫双 (bisultap)·····	085	苯丁锡 (fenbutatin oxide)·····	109
杀螟丹 (cartap)·····	086	克螨特 (propargite)·····	110
杀虫磺 (besultap)·····	086	哒螨酮 (pyridaben)·····	111
2.8 烟碱类杀虫剂·····	087	四螨嗪 (clofentezine)·····	112
2.8.1 结构特点与合成设计·····	087	噻螨酮 (hexythiazox)·····	113
2.8.2 代表性品种的结构与合成·····	089	唑螨酯 (fenpyroximate)·····	115
吡虫啉 (imidacloprid)·····	089	螺螨酯 (spirodiclofen)·····	116
啉虫脒 (acetamiprid)·····	090	啉螨酯 (fluacrypyrim)·····	117
烯啉虫胺 (nitenpyram)·····	091	丁氟螨酯 (cyflumetofen)·····	119
呋虫胺 (dinotefuran)·····	092	溴螨酯 (bromopropylate)·····	120
氟啉虫胺腈 (sulfoxaflor)·····	093	啉虫丙醚 (pyridalyl)·····	121
氟啉虫酰胺 (flonicamid)·····	094	三氟苯啉啉 (triflumezopyrim)·····	122
氟吡呋喃酮 (flupyradifurone)·····	095	氟噻虫砜 (fluensulfone)·····	124
2.9 酰胺类杀虫剂·····	096	三氟咪啉酰胺 (fluazaindolizine)·····	125
2.9.1 结构特点·····	096	fluhexafon·····	125
2.9.2 代表性品种的结构与合成·····	097	fluxametamide·····	126
氯虫酰胺 (chlorantraniliprole)·····	097	flometoquin·····	127
氟虫双酰胺 (flubendiamide)·····	098		

第3章 杀鼠剂

128

3.1 杀鼠剂分类与作用机理·····	128	敌鼠隆 (brodifacoum)·····	132
3.2 代表性品种的结构与合成·····	130	敌鼠 (diphacinone)·····	133
灭鼠安·····	130	溴鼠胺 (bromethalin)·····	134
杀鼠灵 (warfarin)·····	131		

- 4.1 概述136
- 4.2 无机及金属、非金属有机杀菌剂137
- 石硫合剂 (lime sulphur)137
- 波尔多液 (Bordeaux mixtue)137
- 4.3 氨基甲酸衍生物类杀菌剂138
- 4.3.1 结构特点与合成设计138
- 4.3.2 代表性品种的结构与合成139
- 福美双 (thiram)139
- 代森锌 (zineb)140
- 代森锰锌 (mancozeb)141
- 乙霉威 (diethofencard)142
- 霜霉威 (propamocarb)143
- 苯噻菌胺
(benthiavalicarb-isopropyl)144
- 四唑吡啶酯 (picarbutrazox)145
- 4.4 二羧酰亚胺类杀菌剂146
- 4.4.1 结构特点与合成设计146
- 4.4.2 代表性品种的结构与合成147
- 腐霉利 (procymidone)147
- 异菌脲 (iprodione)148
- 乙烯菌核利 (vinclozolin)149
- 4.5 酰胺类杀菌剂150
- 4.5.1 结构特点与合成设计150
- 4.5.2 代表性品种的结构与合成152
- 甲霜灵 (metalaxyl) 与高效甲
霜灵 (metalaxyl-M)152
- 噁霜灵 (oxadixyl)154
- 烯酰吗啉 (dimethomorph)155
- 噻唑菌胺 (ethaboxam)156
- 噻酰菌胺 (tiadinil)157
- 硅噻菌胺 (silthiopham)158
- 呋吡菌胺 (furametpyr)159
- 联苯吡菌胺 (bixafen)161
- 苯并烯氟菌唑 (benzovindiflupyr)162
- pyraziflumid163
- 双炔酰菌胺 (mandipropamid)163
- 萎锈灵 (carbendazim)165
- 氟菌胺 (zarilamid)166
- 4.6 嘧啶类杀菌剂167
- 4.6.1 结构特点与合成设计167
- 4.6.2 代表性品种的结构与合成168
- 啉菌环胺 (cyprodinil)168
- 啉菌胺 (mepanipyrim)169
- 啉霉胺 (pyrimethanil)170
- 氟苯嘧啶醇 (fenarimol)171
- 4.7 三唑类杀菌剂172
- 4.7.1 品种与结构特点172
- 4.7.2 代表性品种的结构与合成174
- 三唑醇 (triadimenol)174
- 三唑酮 (triadimefon)175
- 烯唑醇 (diniconazole) 与高效烯
唑醇 (diniconazole-M)176
- 苄氯三唑醇 (diclobutrazol)178
- 腈菌唑 (myclobutanil)179
- 三环唑 (tricyclazole)180
- 唑啉菌胺 (ametoctradin)182
- 苯醚甲环唑 (difenoconazole)183
- 氟环唑 (epoxiconazole)184
- 氟硅唑 (flusilazole)187
- 戊唑醇 (tebuconazole)188
- 叶菌唑 (metconazole)189
- 丙硫菌唑 (prothioconazole)190
- 硅氟唑 (simeconazole)191
- mefentrifluconazole192

三氟苯唑 (fluotrimazole)·····	193	4.10.1 噁唑与噻唑类杀菌剂·····	219
啉唑磺菌胺 (amisulbrom)·····	194	噁霉灵 (hymexazol)·····	220
4.8 咪唑类杀菌剂·····	195	叶枯唑 (bismethiazol)·····	221
4.8.1 结构特点·····	195	dichlobentiaxoz·····	222
4.8.2 代表性品种的结构与合成·····	196	4.10.2 有机磷类杀菌剂·····	222
多菌灵 (carbendazim)·····	196	异稻瘟净 (iprobenfos)·····	223
噻菌灵 (thiabendazole)·····	199	吡菌磷 (pyrazophos)·····	224
抑霉唑 (imazalil) 与高效抑		乙磷铝 (phosethy-Al/fosetyl)·····	225
霉唑 (imazalil-S)·····	200	毒氟磷·····	225
咪酰胺 (prochloraz)·····	201	4.10.3 吗啉类杀菌剂·····	226
氟菌唑 (triflumizole)·····	202	丁苯吗啉 (fenpropimorph)·····	226
氟霜唑 (cyazofamid)·····	203	十三吗啉 (fenpropimorph)·····	227
咪唑菌酮 (fenamidone)·····	205	4.10.4 吡啶类杀菌剂·····	227
噁咪唑 (oxpoconazole)·····	205	氟啶胺 (fluazinam)·····	228
稻瘟酯 (pefurazoate)·····	206	啉斑脒 (pyrifenox)·····	228
4.9 甲氧基丙烯酸酯类杀菌剂·····	207	4.10.5 其他杀菌剂品种的结构与	
4.9.1 结构特点与合成设计·····	207	合成·····	229
4.9.2 代表性品种的结构与合成·····	209	稻瘟灵 (isoprothiolane)·····	229
啉菌酯 (azoxystrobin)·····	209	戊菌隆 (pencycuron)·····	230
氟啉菌酯 (fluoxystrobin)·····	211	啉菌酮 (diclomezine)·····	230
醚菌酯 (kresoxim-methyl)·····	212	螺环菌胺 (spiroxamine)·····	231
啉菌胺酯 (pyraclostrobin)·····	214	灭螨猛 (chinomethionate)·····	231
脒菌酯 (trifloxystrobin)·····	216	百菌清 (chlorothalonil)·····	232
mandestrobin·····	218	dipymetitrone·····	233
4.10 其他类杀菌剂·····	219		

第 5 章 除草剂 234

5.1 苯氧羧酸类除草剂·····	234	吡氟禾草灵 (fluazifop-butyl)·····	241
5.1.1 结构特点与合成设计·····	234	噁唑禾草灵 (fenoxaprop)·····	242
5.1.2 代表性品种的结构与合成·····	237	氟吡甲禾灵 (haloxyfop-methyl)	
2,4-滴 (2,4-D) 与 2,4-滴丁酯		与高效氟吡甲禾灵	
(2,4-D-butylate)·····	237	(haloxyfop-P-methyl)·····	244
啉禾灵 (quizalofop-ethyl) 与精喹		异噁草醚 (isoxapyrifop)·····	245
禾灵 (quizalofop-p-ethyl)·····	238	氟噻乙草酯 (fluthiacet-methyl)·····	246

吡草醚 (pyraflufen-ethyl)·····	247	5.4.2 代表性品种的结构与合成·····	289
新燕灵 (benzolprop-ethyl)·····	248	乳氟禾草灵 (lactofen)·····	289
5.2 脲类及磺酰脲类除草剂·····	249	三氟羧草醚 (acifluorfen) 与氟磺胺	
5.2.1 脲类除草剂·····	249	草醚 (fomesafen)·····	291
异丙隆 (isoproturon)·····	251	氟氟草醚 (ethoxyfen-ethyl)·····	291
杀草隆 (daimuron)·····	252	嘧啶脞草醚 (pyribenzoxim)·····	293
5.2.2 磺酰脲类除草剂·····	254	嘧草醚 (pyriminobac-methyl)·····	294
苄嘧磺隆 (bensulfuron-methyl)·····	256	嘧草硫醚 (pyrithiobac-sodium)·····	296
吡嘧磺隆 (pyrazosulfuron)·····	257	5.5 杂环类除草剂·····	297
胺苯磺隆 (ethametsulfuron-methyl)·····	258	5.5.1 三嗪类除草剂·····	297
酰嘧磺隆 (amidosulfuron)·····	260	环嗪酮 (hexazinone)·····	298
环丙嘧磺隆 (cyclosulfamuron)·····	261	嗪草酮 (mtribuzin)·····	299
烟嘧磺隆 (nicosulfuron)·····	262	5.5.2 吡啶 (喹啉) 类除草剂·····	300
氟磺隆 (prosulfuron)·····	265	甲氧咪草烟 (imazamox)·····	301
砒嘧磺隆 (rimsulfuron)·····	266	咪唑喹啉酸 (imazaquin)·····	303
噻吩磺隆 (thifensulfuron-methyl)·····	267	氟草烟 (fluroxypyr)·····	304
苯磺隆 (tribenuron-methyl)·····	269	百草枯 (paraquat)·····	305
四唑嘧磺隆 (azimsulfuron)·····	270	二氯喹啉酸 (quinclorac)·····	305
磺酰磺隆 (sulfosulfuron)·····	271	喹草酸 (quinmerac)·····	306
氟酮磺隆 (flucarbazone-sodium)·····	273	5.5.3 唑及类唑啉酮除草剂·····	307
5.3 酰胺及氨基甲酸酯除草剂·····	274	唑草胺 (cafenstrole)·····	310
5.3.1 结构特点与合成设计·····	274	异丙吡草酯 (fluazolate)·····	311
5.3.2 代表性品种的结构与合成·····	276	磺草唑胺 (metosulam)·····	312
乙草胺 (acetochlor)·····	276	唑啶草酮 (azafenidin)·····	314
高效二甲噻草胺 (dimethenamid- <i>p</i>)·····	278	唑酮草酯 (carfentrazone-ethyl)·····	314
异丙甲草胺 (metolachlor) 与高效		四唑酰草胺 (fentrazamide)·····	317
异丙甲草胺 (<i>S</i> -metolachlor)·····	279	异噁唑草酮 (isoxaflutole)·····	317
氟吡草胺 (picolinafen)·····	280	噁草酮 (oxadiazon)·····	318
异噁草胺 (isoxaben)·····	280	5.5.4 酰亚胺类除草剂·····	320
燕麦敌 (diallate)·····	282	氟丙嘧草酯 (butafenacil)·····	320
禾草丹 (thiobencard)·····	283	丙炔氟草胺 (flumioxazin)·····	321
甜菜宁 (phenmedipham)·····	284	环戊噁草酮 (pentoxazone)·····	323
5.4 二苯醚类除草剂·····	285	氟胺草酯 (flumiclorac-pentyl)·····	323
5.4.1 结构特点与合成设计·····	285	5.6 其他类除草剂·····	324
		5.6.1 环酮类除草剂·····	324

烯草酮 (clethodim)·····	326	5.6.2 二硝基苯胺类除草剂·····	332
烯禾定 (sethoxydim)·····	327	二甲戊乐灵 (dinitroanilines)·····	333
硝磺草酮 (mesotrione)·····	327	5.6.3 有机磷除草剂·····	334
异噁草酮 (clomazone)·····	329	草甘膦 (glyphosate)·····	335
吡草酮 (flurtamone)·····	330	草铵膦 (glufosinate)·····	336
茚草酮 (indanofan)·····	330	莎稗磷 (anilofos)·····	336
噁嗪草酮 (oxaziclomefone)·····	331		

第 6 章 植物生长调节剂———— 338

6.1 概述·····	338	萘乙酸 (1-naphthylacetic acid)·····	346
6.2 重要品种的结构与合成·····	340	苄基腺嘌呤 (6-benzyladenine)·····	347
吲哚丁酸 [4-(indol-3-yl)-butyric acid]·····	340	氯吡脲 (forchlorfenuron)·····	347
吡啶醇 (pyripropanol)·····	340	赛苯隆 (thidiazuron)·····	348
乙烯利 (ethephon)·····	341	环丙酰胺酸 (cycilanilide)·····	348
矮壮素 (chlormequat chloride)·····	342	增甘膦 (glyphosine)·····	349
氟节胺 (flumetralin)·····	342	双丁乐灵 (butralin)·····	349
烯效唑 (uniconazole)·····	343	抗倒胺 (inabenfide)·····	350
多效唑 (paclobutrazol)·····	344	抗倒酯 (trinexapac-ethyl)·····	351
芸薹素内酯 (brassinolide)·····	345	杀雄啉 (sintofen)·····	351
		杀雄嗪酸 (clofencet)·····	352

参考文献———— 353

索引———— 354

中文农药通用名称索引·····	354	英文农药通用名称索引·····	357
-----------------	-----	-----------------	-----

际意义不大的反应得以改进。

(7) 与环境科学的结合方面 与环境科学的结合是农药合成中的绿色化学合成问题,即合成过程的零排放或少排放,合成试剂无毒、无害,对环境友好。这对农药合成与生产工作者来说,现在与将来都是艰难又具有挑战性的课题。

农药化学合成已经有了很大发展,但自然界和人类社会又不断向农药研究工作者提出新的要求,因此顺应时代要求的农药化学合成将是其发展的总的趋势。

1.2 农药化合物合成路线设计基本方法

(1) 逆合成法

① 合成 指从某些起始原料 (starting material, SM) 出发,经过若干步反应,最后合成出所需的产物,即目标物或称目标分子 (target molecule, TM),用 $\longrightarrow$ 表示过程,整个合成过程可表示为:

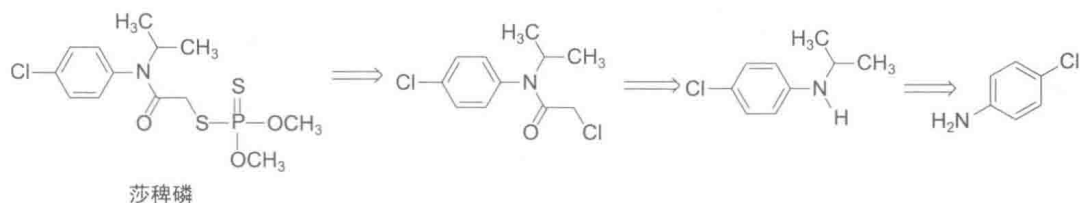


② 逆合成 从目标分子的结构出发,逐步分析合成目标分子的中间体,再分析合成中间体的结构,最后分析到起始原料,用 $\Longrightarrow$ 表示过程,整个分析过程可表示为:

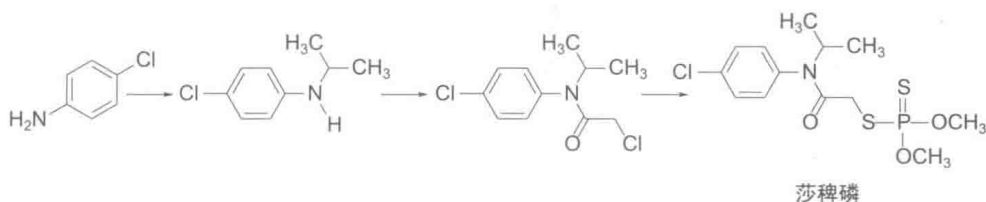


逆合成分析的基本原则:每步都有合适又合理的反应机理和合成方法;整个合成做到最大的简单化;有被认可的(即市场能供应的)原料。例如除草剂莎稗磷的逆合成分析与合成路线:

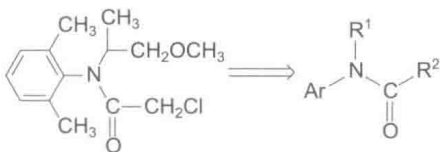
逆合成分析



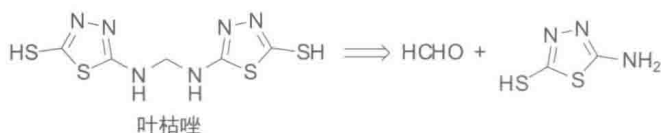
合成路线



(2) 分子简化法 有时一个农药分子看上去结构比较复杂,这就需要找出分子结构的关键部位,将目标分子中与反应物非密切关联的部分简化,然后进行逆合成分析。例如,就整个分子化合物来讲,异丙甲草胺属于酰胺,在逆合成分析时可作如下简化:



具有明显对称性的农药分子在进行逆合成分析时,则要充分利用其对称性来简化合成方法。例如叶枯唑的逆合成分析。



(3) 官能团的置换或消去法 目标物结构比较复杂, 含有多个官能团 (functional group, FG), 在进行合成反应时, 为避免官能团之间可能的相互干扰, 可以将某个官能团互换 (functional group interconversion, FGI) 或官能团消去 (functional group remove, FGR), 等反应完成之后再行恢复。如氯虫酰胺逆合成分析:



(4) 分子拆解法

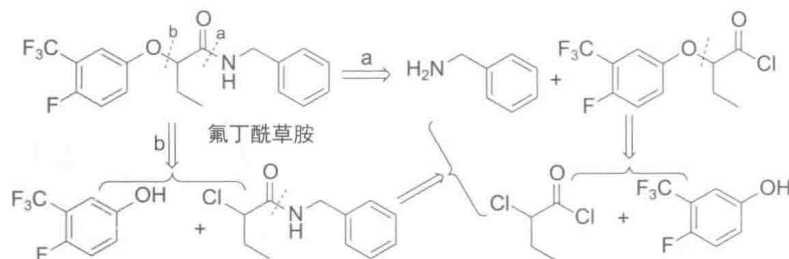
① 会集法 逆合成分析时要尽量把目标分子拆分成两大部分, 再分别拆解成次大部分, 从而避免将目标分子按照小段逐一拆解。假设每一步的反应产率是 80%, 比较下列两种拆解分析:

方法一				方法二			
TM	A-B-C-D	64%		TM	A-B-C-D	51%	
	↓				↓		
	A-B+C-D	80%			A-B-C+D	64%	
	↓ ↓				↓		
	A+B C+D	100%			A-B+C	80%	
					↓		
					A+B	100%	

方法一先拆分成两大部分, 再拆分成四部分, 总产率为 64%; 方法二逐步将分子按照小段拆分开, 总产率为 51%。两种拆分中方法一比较好。

通常合成路线越短越好, 最好一步完成。即便是由多步反应构成的合成路线, 最好不将中间体分离出来, 在同一反应器中连续进行, 实现“一锅合成法”。

② 在杂原子的位置拆开 很多农药分子中含有 O、N、S 等杂原子, 在进行逆合成分析时, 杂原子往往是重要线索, 其所在部位通常是逆合成分析需要拆开的地方。例如氟丁酰草胺的逆合成分析:



(5) 反应次序的合理安排 在多步农药合成反应中, 合理安排反应次序可以降低成本、缩短生产周期, 其基本原则为:

① 产率低的反应尽量安排在前面。如果将产率低的安排在后面, 则前面产率高的反应产物作为后一步的原料将会有更大的损失, 合成成本将提高。

② 先难后易。难度大的反应排在前面进行, 可以提高合成效果。

③ 原料价格高的反应尽量安排在后面。价格高的原料使用得越晚, 合成总成本越低。