

新农药研究开发文集

刘长令 著



化学工业出版社

新农药研究开发文集

刘长令 著

化学工业出版社

·北京·

(京)新登字 039 号

图书在版编目 (CIP) 数据

新农药研究开发文集/刘长令著. —北京: 化学工业出版社, 2002.1
ISBN 7-5025-3500-4

I. 新… II. 刘… III. 农药-研制-文集
IV. TQ45-53

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2001) 第 077273 号

新农药研究开发文集

刘长令 著

责任编辑: 杨立新

责任校对: 李 丽

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)

发行电话: (010) 64918013

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

*

新华书店北京发行所经销

北京市燕山印刷厂印刷

三河市延风装订厂装订

开本 787×1092 毫米 1/16 印张 17½ 字数 432 千字

2002 年 2 月第 1 版 2002 年 2 月北京第 1 次印刷

ISBN 7-5025-3500-4/TQ·1450

定价: 48.00 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

京朝工商广字第 740 号

序 言 (1)

在没有发明农药以前，人类对历史上频频发生的严重病、虫、鼠害的泛滥束手无策，例如我国历史上经常发生的蝗虫灾害曾造成全国粮食歉收，饿殍遍野，导致封建皇朝的更迭。农药的发明和使用使人类第一次能人工控制各种社会传染病的传播媒介如鼠、蚊、蝇、虱、血吸虫等，也对严重危害各种重要作物的病、虫、草等进行了有效的控制。可以毫不夸张地说，农药在保障人类文明和社会进步方面立下了不可磨灭的功勋。

解放后经过广大干部、科技人员和工人们的共同努力，我国农药产量已进入世界前列，为我国工农业生产的稳步增长作出了突出的贡献，但遗憾的是我们生产的绝大多数品种都是外国发明的。随着我国改革开放后取得令世界瞩目的经济成就，创制具有自主知识产权的新农药品种的任务已提到议事日程上来了。

农药创制涉及化学、生物、物理、农学、医学、环保学及化学工程、计算机技术、同位素技术等，新农药创制涉及的学科跨度大、投资巨、周期长、风险高，其复杂性往往不被人们所认识和理解，在国外有人称之为“遗憾的科学”。目前发展趋势是创制环境友好的、超高效的、高选择性的绿色农药，如今世界上仅有少数发达国家才有如此创制新农药的实力。

解放五十年来，农药科技从无到有，老一辈的科技工作者在条件比较艰苦的环境下，无私奉献、挚意追求，在农药科技和培养人才方面作出了很大的贡献。可喜的是近年来我国一批青年农药科技工作者正在崛起，他们勇于接受挑战、努力拼搏，在我国具有悠久的光荣传统的沈阳化工研究院中的刘长令同志即是其中十分活跃的一位。他坚持不懈、辛勤耕耘，已取得不少科技成果，这里汇总了他发表过的论文和论述。一方面对他自己前期的工作进行了回顾和总结，另一方面也促进农药科技界的学术交流。我初阅后也有不少启发和收获。我深信我国青年农药科技工作者，必将继承我国知识分子的光荣传统，开拓创新，奋发图强，为我国农药科技早日跻身于世界强国之林而做出重要的贡献。

中国工程院 院士
南开大学教授
国家农药工程中心（天津）主任

李正名

2001年2月6日

序 言 (2)

刘长令先生是我国农药事业的一位新秀，但从其所取得的成果、发表的文章及对我国农药事业发展的见解来看，则可谓是我国农药事业中一位难得的人才。

刘长令先生参加工作虽仅十多年，但获得的成果之多，撰写文章之广令人惊赞。

本书为刘长令先生所发表的百余篇文章的汇集。其中有专利多篇，这是他科研工作的瑰晶，内包括了已工业化的杀菌剂氟吗啉，此也是我国仅有的几个创制农药之一。余下的百余篇文章中，有刘长令的科研总结，也有对国外文献资料的汇集。文章不仅有化学方面的，也涉及了生物领域，由此可见他的知识面之宽。刘长令先生的这本文集无疑对我国农药的研究开发具有相当的参考价值。

此本文集，使我们看到了我国农药科研事业的希望，充分说明了我国农药事业后继有人。目前，我国即将进入 WTO，为了适应国际交流、必须要加强新农药研究的力度，尽快尽多地创制出我国自己的新农药。对此，作为农药事业的老兵，殷切希望出现更多的像刘长令那样致力于我国农药事业的年青科技人员，并能“出于蓝而胜于蓝”，从而使我国农药事业得到更大、更快的发展，真正跻身于世界农药的先进行列。

中国工程院 院士 沈寅初

2001 年 2 月 8 日

序 言 (3)

我院新农药创制室副主任刘长令的论文集（第一集）出版了，共收集论文一百一十六篇。由于篇幅所限，其中六十三篇为全文，另外五十三篇仅列出论文题目和刊物的名称、卷期等；若读者有兴趣可从有关杂志中找到原文，也可向作者索取原文，长令乐于与大家分享他的成果，同时也虚心接受来自各方面的批评指正。

刘长令是已故著名农药专家张少铭先生和我的研究生，1989年以优异成绩毕业后留在院新农药创制组。十几年如一日，寒窗苦读潜心研究，终于取得学识和研究成果的双丰收。

论文所涉及的范围极广，包括综述、专论、译文和研究成果，尤其是化学合成农药及其中间体各类型都做了详实的论述。从这些论文可以看出长令读书范围之广、捕捉信息能力之强是同龄人所不及的。

长令不只是个会读书的人，他对研究也是锲而不舍孜孜以求，终于创制出新杀菌剂氟吗啉（SYP-L190）。该项目被列入“九五”科技攻关，国家给予很大力度的支持，由于防治效果突出，而被院里选作工业化开发品种，同时取得农业部药检所临时登记。

长令的进步除了他本人的刻苦努力之外，也得益于多次获得出国的机会。我院1994年和美国罗门-哈斯公司合作共同开发新农药，他是合作组的重要成员，五年来他四次赴美工作。这对他的学术水平、思维方法、外语水平的提高大有裨益。

对于长令来讲，学识的长进、事业的成功仅仅是开始，我希望长令能一如既往，努力学习、刻苦钻研、谦虚谨慎、戒骄戒躁。要知道满招损谦受益的道理。

沈阳化工研究院（原）副院长
南方农药创制中心首席顾问

李宗成

2001年2月10日

内 容 提 要

本文集收集刘长令先生论文 116 篇，其中 63 篇为全文，另外 53 篇仅列出论文题目和在版刊物的名称、卷期等。内容涉及的范围较广，包括新农药创制、综述、专论、译文和研究成果，尤其是对化学合成农药及其中间体各类型都做了详实的论述。新农药创制 40 篇、农药研究进展 37 篇、农药品种 16 篇、中间体 15 篇、专利 8 篇。新农药创制及专利是其科研工作的瑰晶，既有化学方面的，也涉及了生物领域。每篇论文后均附有参考文献。对我国农药的研究开发具有较大的参考价值。

该文集可供从事农药管理、新农药创制、农药产品及其中间体的研究与开发、信息或资料收集等有关人员以及高等院校有关师生参考。

目 录

1. 新型内吸性杀菌剂氟吗啉 (SYP-L190)	1
2. 21 世纪农药的创制与展望	8
3. 选择发明在新农药创制中的应用	13
4. 含氟农药的创制途径	18
5. 生物电子等排及其在新农药创制中的应用	24
6. 新型吡唑甲酰胺类化合物的合成及其生物活性 (I)	32
7. 新型吡唑甲酰胺类化合物的合成及其生物活性 (II)	35
8. 1-(2,6-二甲苯基)-1-苯乙酰基-4-丁基氨基脲的合成与表征	39
9. N-芳(烷)磺酰基-N'-[1-氟(环)烷基]脲的合成与杀菌活性	41
10. 新型 3-吡唑-1,2,4-噁二唑类化合物的合成	44
11. 新型吡唑肟类化合物的合成	45
12. 新型甲氧基丙烯酸酯类化合物的合成与生物活性	46
13. 新型肟类化合物的合成与杀菌活性	47
14. 取代胂基甲酸酯类化合物的合成与生物活性	48
15. 合成苯氧吡唑脒的新方法	53
16. 开发农用化学品的新方法	55
17. 如何获得信息和选择先导化合物	58
18. 浅谈国内外农药开发现状与发展趋势	62
19. 用于植物保护中的天然产物	64
20. 含氟农药的研究进展	69
21. 含氟农药开发的新进展	79
22. 嘧啶类农药的研究进展	84
23. 吡啶类农药的研究进展	93
24. 让作物更加健康——国际化学杀菌剂开发状况	101
25. 新型嘧啶胺类杀菌剂的研究进展	102
26. 新型吡啶类杀菌剂的开发	106
27. 甲氧基丙烯酸酯类杀菌剂的研究进展	109
28. 防治灰霉病用杀菌剂的开发	115
29. 卵菌纲病害用杀菌剂的开发进展	123
30. 农用杀菌剂研究开发的新进展	128
31. 安全高效促进可持续发展——国外化学杀虫杀螨剂开发近况	135
32. 国内外植物杀虫剂开发现状与发展趋势	136
33. 杀虫剂研究的黄金时代: 过去、现在和将来	138
34. 杀虫剂及杀螨剂的研究进展	144
35. 昆虫生长调节剂的开发现状与发展趋势	148

36. 斩草除根保丰收——国际除草剂的开发近况与发展	151
37. 三唑类除草剂的研究进展	152
38. 需光性除草剂的开发	157
39. 芽后除草剂的研究进展	163
40. 对羟基苯基丙酮酸酯双氧化酶抑制剂的研究进展	167
41. 除草剂的解毒剂的开发	174
42. 磺酰脲类除草剂开发的新进展	176
43. 除草剂研究开发的新进展与发展趋势	181
44. 抗除草剂作物对杂草科学的影响	190
45. 2000 年英国 Brighton 植保会议简介	193
46. 国外部分农药品种在我国的知识产权保护状况	196
47. 国外农药开发现状与中间体需求	201
48. 浅谈农药中间体的共用性	209
49. 含氟农药及中间体	211
50. 新型氟化剂 <i>N</i> -氟代吡啶鎓盐开发与应用	220
51. 新型氟化剂 <i>N</i> -氟代吡啶鎓盐合成与应用	226
52. 2,4-二氯苯胺和 2,6-二氯苯胺的合成及应用	230
53. 氟苯及其衍生物在农药合成中的应用	235
54. 3-甲基吡啶及其衍生物在农药合成中的应用	238
55. 2,3-吡啶二羧酸二乙酯类化合物的新合成法	242
56. 2-甲氧羰基-3-噻吩磺酰氯合成方法述评	245
57. 新型稻田除草剂唑吡啶磺隆	249
58. 新颖三唑类稻田除草剂——CH900	254
59. 超高效除草剂烟嘧磺隆 (SL-950) 的合成研究	258
60. 新型杀螨剂唑螨酯的合成研究	261
61. 含氟拟除虫菊酯的合成方法	264
62. 苯氧吡唑醛的合成	267
63. 3,5-二氯-1-甲基-4-吡唑羧酸的制备	268
附录 其他 53 篇论文题目	269
I 新农药创制	269
II 新农药研究进展	269
III 农药品种与中间体	270
IV 专利申请	270

1. 新型内吸性杀菌剂氟吗啉 (SYP-L190)^①

摘要: 氟吗啉 (SYP-L190) 是由沈阳化工研究院刘长令等人于 1994 年研制的新型内吸性杀菌剂。通过 6 年多的实验室、温室、大田试验, 结果表明氟吗啉在 100~200mg/L (相当于 100~200g a.i./hm²) 剂量下对黄瓜霜霉病、白菜霜霉病、番茄晚疫病、辣椒疫病、葡萄霜霉病等具有优异的活性。毒理 (性) 结果表明其对哺乳动物低毒。氟吗啉对酰胺类杀菌剂如甲霜灵抗性或敏感的菌株均有活性, 具有优异的保护活性、治疗活性和抑制孢子萌发活性, 持效期长, 无药害、对植物安全, 增产效果明显 (通常增产 30%~50%); 其生物活性尤其是治疗活性、抑制孢子萌发活性以及持效期等明显优于同类品种烯酰吗啉。氟吗啉已获中国和美国发明专利 (中国专利号: ZL 96 115551.5, 美国专利号: US 6020332), 并于 1999 年商品化。氟吗啉是我国有史以来第一个创制的、第一个获得中国发明专利的农用杀菌剂, 第一个获得美国发明专利的农药品种。

关键词: 杀菌剂 氟吗啉 创制

1. 前言

甲霜灵是第一个用于防治卵菌纲病害的内吸性杀菌剂, 不幸的是一经使用即有抗性报道^[1]。随着抗性的产生与发展, 近几年由卵菌纲病原菌产生的病害的防治变得越来越难治。

氟吗啉 (SYP-L190) 是由沈阳化工研究院刘长令等人于 1994 年发现的一种新型内吸性杀菌剂。主要用于防治霜霉属和疫霉属病害, 尤其用于防治抗性病害。氟吗啉已获中国和美国发明专利 (中国专利号: ZL 96 115551.5, 美国专利号: US 6020332), 已于 1999 年商品化。氟吗啉是我国有史以来第一个创制的、第一个获得中国发明专利的农用杀菌剂, 第一个获得美国发明专利的农药品种。由于其性能优异, 深受用户的欢迎。

氟吗啉的优异杀菌性能经实验室、温室、大田试验得到确认与验证。

2. 创制经緯

为了研制更好的防治卵菌纲病害的新药, 我们对国外研制开发的防治该类病害的农药品种的化学结构和生物活性等进行了比较与分析。因杀菌剂烯酰吗啉 (dimethomorph) 源于天然产物、具有独特的作用机理, 且与现有杀菌剂无交互抗性, 故选作先导化合物。

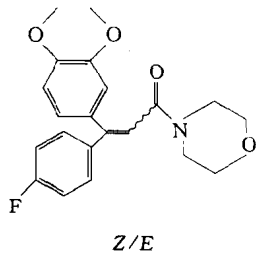
文献报道烯酰吗啉具有很好的治疗活性和优异的抑制孢子萌发活性^[2], 但我们的试验结果与报道差异较大: 在 150mg/L 剂量下其治疗活性低于 50%, 在 50mg/L 剂量下其对孢子萌发抑制率低于 45%。由于氟原子具有渗透效应、模拟效应、电子效应和阻碍效应等性能, 故含氟化合物通常具有较好的生物活性^[4,5,6]。为了克服先导化合物烯酰吗啉存在的不足, 我们在其化学结构中引入氟原子, 合成了一系列的含氟化合物^[3], 其中部分化合物具有比先导化合物烯酰吗啉更优的治疗活性和抑制孢子萌发活性, 并选出化合物氟吗啉 (SYP-L190) 进行商业化开发。

① 本文相对的英文已收录于 2000 年英国 Brighton 植保会议论文集。

3. 理化性质

试验代号：SYP-L190，分子式：C₂₁H₂₂FNO₄，相对分子质量：371.4，外观（25℃）：无色结晶，熔点：105~110℃

化学结构：（由 Z/E 异构体组成，比例 Z/E = 55:45）



化学名称：4-[3-(3,4-二甲氧基苯基)-3-(4-氟苯基)丙烯酰]吗啉，结构类型：肉桂酸衍生物，溶解性：易溶于乙酸乙酯、丙酮等有机溶剂，稳定性：在 20~40℃，实际应用情况下水解、光解、热稳定，原药：10%EC 和 20%WP，混剂：50%WP 和 60%WP。

4. 毒性

急性毒性：经口 LD₅₀(大鼠) > 2710mg/kg (雄)，> 3160g/kg (雌)；经皮 LD₅₀(大鼠) > 2150mg/kg (雄)，> 2150mg/kg (雌)；对眼睛（兔）无刺激，对皮肤（兔）无刺激。Ames 试验、微核诱发试验等表明氟吗啉无致癌、无致突变、无致畸性。

5. 生物活性

5.1 黄瓜霜霉病孢子囊萌发试验

供试药剂 SYP-L190（10%EC）配制 100、50、25mg/L 三个浓度，以烯酰吗啉（50%WP）50mg/L 为对照药剂，另设空白对照。挑取黄瓜病叶上新鲜霉层配制孢子囊悬浮液与药液混合，每处理重复 6 次，24h 后调查 18 个视野，记录萌发孢子与未萌发孢子个数，记录抑制孢子萌发率（%），结果见表 1。

表 1 SYP-L190 抑制孢子囊萌发试验结果

杀 菌 剂	浓度/(mg/L)	孢子萌发率/%	抑制孢子萌发率/%
SYP-L190	25	23.1	65.2
	50	4.3	93.5
	100	1.6	97.6
烯酰吗啉	50	38.2	42.5
CK	—	66.4	—

孢子囊萌发试验表明：SYP-L190 具有较高的抑制孢子囊萌发作用，且抑制作用明显优于烯酰吗啉。SYP-L190 在 25mg/L 剂量下抑制孢子萌发率为 65.2%，而烯酰吗啉在 50mg/L 剂量下仅为 42.5%。

5.2 药害试验

供试药剂 SYP-L190（20%WP）设五个浓度（mg/L）500、800、1000、2000、4000 以烯酰吗啉（50%WP）2000mg/L 做对照药剂，另设空白对照。试材选用 2~3 叶期黄瓜健苗，每处理三次重复，作物喷雾机处理，晾干后放置温室观察药害情况。结果见表 2。

药害试验结果表明：SYP-L190 在 1000~2000mg/L 范围内对黄瓜安全，没有任何药害症状发生，但 SYP-L190 在 2000mg/L 以上处理时黄瓜苗明显比对照矮，部分叶片边缘发黄，4000mg/L 对生长点有明显抑制作用。因 SYP-L190 推荐用量为 100~200mg/L，故对

作物很安全。

表 2 SYP-L190 药害试验结果^①

杀 菌 剂	浓度/(mg/L)	观察天数/天						
		1	3	5	7	9	12	14
SYP-L190	500	-	-	-	-	-	-	-
	800	-	-	-	-	-	-	-
	1000	-	-	-	-	-	-	-
	2000	-	-	-	-	+	+	+
	4000	-	-	+	++	++	+++	+++
烯酰吗啉	2000	-	-	-	+	+	+	+
CK	-	-	-	-	-	-	-	-

① 药后第 n 天药害分级标准：- 表示正常；+ 表示叶边缘轻微发黄或矮化；+++ 表示生长点受抑制，株矮，叶片灼黄。

5.3 治疗活性与保护活性比较试验

供试药剂 SYP-L190(10% EC)和烯酰吗啉(50% WP)分别设两个浓度(mg/L)150、100,另设空白对照。试材选用 2~3 叶期黄瓜健苗,三次重复,保护试验处理后 24h 接种,治疗试验接种后 24h 药剂处理。放置人工气候箱(24℃,湿度 100%)培养,7 天后调查,病情分九级制记载,计算病情指数及防效,结果见表 3。

表 3 SYP-L190 和烯酰吗啉对黄瓜霜霉病的保护和治疗活性比较

杀 菌 剂	浓度/(mg/L)	保护活性试验		治疗活性试验	
		病情指数	防效/%	病情指数	防效/%
SYP-L190	100	0.07	93	0.37	63
	150	0.05	95	0.26	74
烯酰吗啉	100	0.39	61	0.98	2
	150	0.21	79	0.76	24
CK	—	1.00	—	1.00	—

治疗活性与保护活性比较试验结果表明：SYP-L190 治疗活性与保护活性均优于烯酰吗啉，尤其是治疗活性更优。SYP-L190 的保护活性优于其治疗活性。

5.4 与其他常规药剂活性比较试验

供试药剂 SYP-L190 设 25、50、75、100、200mg/L 五个浓度，以常规药剂 20% 甲霜灵可湿性粉剂 500mg/L、80% 乙磷铝可湿性粉剂 1000mg/L、75% 百菌清可湿性粉剂 1000mg/L、72% 克露可溶性粉剂 1000mg/L、66.5% 普力克 1000mg/L，80% 代森锰锌 1000mg/L 作对照药剂，每处理三次重复，另设空白对照。试验分治疗与保护作用两种，试材选用 2~3 叶期黄瓜健苗，处理调查方法同上。结果见表 4。

表 4 与其他常规药剂活性比较试验（黄瓜霜霉病）

杀 菌 剂	浓度/(mg/L)	保护活性试验防效/%	治疗活性试验防效/%
SYP-L190	25	40	0
	50	60	40
	75	75	60
	100	90	75
	200	100	90
甲霜灵	500	60	40

续表

杀 菌 剂	浓度/(mg/L)	保护活性试验防效/%	治疗活性试验防效/%
乙磷铝	1000	75	40
百菌清	1000	90	75
克露	1000	86	64
普力克	1000	90	0
代森锰锌	1000	74	0
CK		0	0

结果表明 SYP-L190 在 100mg/L 剂量下对黄瓜霜霉病的保护和治疗活性与百菌清在 100mg/L 相当, 明显优于甲霜灵、乙磷铝、代森锰锌和普力克。

5.5 对甲霜灵抗性菌株的活性试验

常年种植黄瓜且发病较重地块采集菌株经室内分离培养选取抗性较重的菌株供该试验用。供试药剂 SYP-L190 设 100、200mg/L, 以甲霜灵, 百菌清 500 或 1000mg/L 做对照药剂, 另设空白对照。试验为保护性试验, 试材选用 2~3 叶期黄瓜健苗, 处理, 保存培养、调查方法同上。结果见表 5。

表 5 SYP-L190 对甲霜灵抗性菌株的活性试验

杀 菌 剂	浓度/(mg/L)	病 情 指 数	防效/%
SYP-L190	100	0.09	91
	200	0	100
甲霜灵	500	1.0	0
	1000	1.0	0
百菌清	1000	0.42	58
CK	—	1.0	—

结果表明: SYP-L190 对甲霜灵产生抗性的菌株有很好的活性, 也即 SYP-L190 与甲霜灵无交互抗性。

5.6 大棚防治黄瓜霜霉病 (保护活性) 试验 (1996 年)

大棚防治黄瓜霜霉病 (保护活性) 试验在东陵区浑河乡后寨村一大棚中进行。供试药剂 SYP-L190 设 200、400、600mg/L 三个浓度, 对照药剂普力克设 800、1000、1200mg/L 三个浓度, 另设空白对照, 小区面积 20m², 每处理 4 次重复, 采用背负式喷雾器, 喷液量 100kg/亩, 每小区随机定点 5 株调查。第一次处理 4 月 5 日, 见中心病株, 第二次处理 4 月 17 日, 初见侵染点, 第三次处理 4 月 22 日。第一次防效调查 4 月 22 日, 第二次防效调查 4 月 29 日, 第三次防效调查 5 月 5 日, 结果见表 6。

表 6 SYP-L190 防治黄瓜霜霉病 (保护活性) 试验

杀 菌 剂	浓度/(mg/L)	4 月 22 日		4 月 29 日		5 月 5 日	
		病情指数	防效/%	病情指数	防效/%	病情指数	防效/%
SYP-L190	200	0	100	0	100	0.03	97.0
	400	0	100	0	100	0	100
	600	0	100	0	100	0	100
普力克	800	0.09	89.2	0.21	77.2	0.59	41.0
	1000	0.06	91.9	0.16	82.6	0.42	58.0
	1200	0.03	95.9	0.10	89.1	0.32	68.0
CK	—	0.74	—	0.92	—	1.00	—

从表中结果可以看出：SYP-L190 于 200mg/L 剂量下作为保护剂使用即可完全控制霜霉病的发生，且防治效果明显优于普力克 1200mg/L，随着施药间隔期的延长两种药剂间效果差异更明显。

5.7 大棚防治黄瓜霜霉病（治疗活性）试验（1996 年）

大棚防治黄瓜霜霉病（治疗试验）在苏家屯一大棚中进行。供试药剂 SYP-L190 设 100、200、300mg/L 三个浓度，克露 1500mg/L 作对照药剂，另设空白对照，小区面积 20m²，每处理 3 次重复，第一次处理 5 月 13 日，第二次处理 5 月 20 日，第三次处理 5 月 27 日。6 月 3 日进行防效调查。调查时每小区随机调查 10 株，自上而下调查 10 片叶片，结果见表 7。

表 7 SYP-L190 防治黄瓜霜霉病（治疗活性）试验^①

杀 菌 剂	浓度/(mg/L)	病情指数	防效/%
SYP-L190	100	0.049	88.4
	200	0.011	97.7
	300	0	100.0
克露	1500	0.076	81.9
CK	—	0.422	—

① 试药前经目测棚内各小区发病基数均匀，因此未做基数调查。

从表 7 试验结果可以看出：SYP-L190 具有优异的治疗作用，100mg/L 略优于克露 1500mg/L 防效，200、300mg/L SYP-L190 的治疗效果明显优于克露。

5.8 大棚防治黄瓜霜霉病（治疗活性）试验（1997 年）

试验在朝阳市朝阳县尚志乡车户沟村进行，黄瓜品种为山东密刺，温室面积 0.5 亩，壤土，室内湿度较大，1996 年建棚，重茬栽培黄瓜，病害较重。供试药剂 SYP-L190 160mg/L、对照药剂普力克 667mg/L，4 月 28 日调查室内普遍发病，病害很重。4 月 29 日、5 月 6 日用两种药剂喷雾防治，小区面积 50m²，3 次重复，5 月 14 日调查。（此结果是利用病害发病率计算校正防效）结果见表 8。

表 8 SYP-L190 防治黄瓜霜霉病（治疗活性）试验

杀 菌 剂	浓度/(mg/L)	4 月 28 日药前病叶率/%	5 月 14 日药后病叶率/%	校正防效/%
SYP-L190	160	81.4	21.6	75.5
普力克	667	79.8	57.8	33.2
CK	—	83.3	90.3	—

试验结果表明：SYP-L190 具有极强的治疗作用，在发病率 80% 以上的情况下施药两次 SYP-L190 于 200mg/L 防效仍达到 75.5%，明显好于普力克防治效果。

农户反映：该大棚发病十分严重，几乎每片叶都发病，且大多数开始干枯，用 SYP-L190 两次后中上部叶片霉层开始消失，新生叶片长势良好，病情马上得以控制。普力克用药成本高，治疗作用明显差于 SYP-L190，周围农户得到这一消息纷纷前来参观，很多农户即到农技站来买药。

5.9 大棚防治黄瓜霜霉病（治疗活性）试验（1997 年）

试验在朝阳市朝阳县尚志乡米家沟村进行，黄瓜品种为山东密刺温室面积 0.5 亩，壤土，室内湿度较大，1996 年新建温室，于发病初期应用 SYP-L190 160mg/L、克露 1200mg/L 两种药剂喷雾防治，亩喷液量 60kg，采用工农-16 型喷雾器，小区面积 200m²，不设重

复。4月5日见病斑，4月8日、16日两次施药，4月26日调查，结果见表9。

表 9 SYP-L190 防治黄瓜霜霉病（治疗活性）试验

杀 菌 剂	浓度/(mg/L)	4月7日(药前)			4月26日	
		病叶率/%	病情指数	病叶率/%	病情指数	防效/%
SYP-L190	160	28.6	0.40	13.2	0.09	91.3
克露	1200	24.4	0.32	14.5	0.16	80.6
CK	—	26.8	0.26	55.7	0.67	—

从试验结果可以看出：SYP-L190 在 160mg/L 剂量下对黄瓜霜霉病治疗活性为 91.3%，优于克露 1200mg/L 的防效。

5.10 大田防治白菜霜霉病（治疗活性）试验（1998 年）

供试药剂 SYP-L190 设 200mg/L，克露 1200mg/L 作对照药剂，另设空白对照，小区面积 30m²，每处理 3 次重复，第一次处理 8 月 20 日，第二次处理 8 月 29 日。9 月 2 日和 16 日进行防效调查。结果见表 10。

表 10 SYP-L190 防治白菜霜霉病（治疗活性）试验

杀 菌 剂	浓度/(mg/L)	9月2日		9月16日	
		病情指数	防效/%	病情指数	防效/%
SYP-L190	200	0.84	94.3	2.63	92.8
克露	1200	4.28	70.8	8.41	77.1
CK	—	14.64	—	36.75	—

5.11 大田防治番茄晚疫病试验（1996 年）

供试药剂 SYP-L190（20% WP）设 200、400、600mg/L，代森锰锌（80% WP）设 1300mg/L。另设空白对照，小区面积 20m²，每处理 4 次重复，第一次处理 5 月 21 日，第二次处理 5 月 28 日，第三次处理 6 月 5 日。6 月 20 日进行防效调查。结果见表 11。

表 11 SYP-L190 防治番茄晚疫病试验

杀 菌 剂	浓度/(mg/L)	病情指数(处理前)	病情指数(处理后)	防效/%
SYP-L190	200	0.74	5.56	80.9
	400	0.74	2.59	91.1
	600	1.11	2.22	94.9
代森锰锌	1300	1.11	5.56	87.3
CK	—	1.11	43.70	—

结果表明：SYP-L190 对番茄晚疫病具有很好的治疗作用。

5.12 大田葡萄霜霉病保护性试验

供试药剂 SYP-L190（20% WP）设 67、100、200mg/L，嘧菌酯（azoxystrobin，25% WDG）设 100mg/L。每处理 3 次重复，第一次处理 7 月 29 日，第二次处理 8 月 11 日，第三次处理 8 月 18 日。8 月 25 日进行防效调查。结果见表 12。

表 12 SYP-L190 对葡萄霜霉病保护性试验

杀 菌 剂	浓度/(mg/L)	病情指数	防效/%
SYP-L190	67	7.03	76.93
	100	4.17	86.97
	200	4.14	87.52
嘧菌酯	100	5.81	81.39
CK	—	32.3	—

试验结果表明：在 100mg/L 剂量下，SYP-L190 与噁菌酯具有相似的活性。

6. 结论

通过 6 年多的实验室、温室、大田试验，结果表明氟吗啉（SYP-L190，商品名称：灭克）在 100~200mg/L（相当于 100~200g a.i./hm²）剂量下对黄瓜霜霉病、白菜霜霉病、番茄晚疫病、辣椒疫病、葡萄霜霉病等具有优异的活性，活性优于对照药剂。

氟吗啉对酰胺类杀菌剂如甲霜灵抗性或敏感的菌株均有活性，具有优异的保护活性、治疗活性和抑制孢子萌发活性，持效期长，无药害、对植物安全，增产效果明显（通常增产 30%~50%）。因其具有极强的治疗作用，即使在发病率 80% 以上的情况下防效仍达到 75% 以上。

氟吗啉生物活性尤其是治疗活性、抑制孢子萌发活性以及持效期等均明显优于同类品种烯酰吗啉。

参 考 文 献

- 1 Georgopoulos S G. Grigoriu A C. Plant Disease. 1981, 65: 729~731
- 2 Albert A. Curtze J. Drandarevski CH A. Proceedings of the Brighton Crop Protection Conference-Pests and diseases. 1988. 17
- 3 李宗成，刘长令，刘武成 . US 6020332. 2000
- 4 刘长令. 农药. 1998, 8: 1~5
- 5 刘长令. 化工科技动态 . 1998, 8: 5~9
- 6 Seisaku K. Fine Chemicals. 1994, 7: 18

2. 21 世纪农药的创制与展望

1. 前言

农药的诞生与发展一直与人类生存活动紧密相连，且受到人类生存活动正反两方面需求的制约：一方面是农业上新发生的和难治的病虫草害等的防治对新农药提出了不断需求；另一方面是随着人类生活水平的不断提高，对赖以生存的环境质量的要求也越来越高，对农药本身的毒性和对环境的影响日益关注，从而人们对农药的安全性要求也不断提高，对农药登记注册标准的要求也越来越严格。正基于此，农药品种一直在不断更新，以满足人类对粮食和物质如天然纤维和优美环境日益增长的需求。

如前所述，不同时期，对植物保护概念的理解和对农药要求的标准是不一样的。21 世纪的农药该是如何存在和发展呢？作者将对 21 世纪于植物保护中起重要作用的农药创制与展望予以简介。

2. 21 世纪植物保护的特点

为了人类更好的生存和持续发展之需要，植物保护必须遵从“综合害物治理”的原则。21 世纪植物保护的特点是：将害物造成的损失控制在经济允许的范围内，重要的是调节和控制有害生物种群的密度，确保生态平衡，而不是最大限度地灭杀有害生物。因此，与环境友好的农药如昆虫生长调节剂、植物生长调节剂、植物活化剂以及生化技术包括传统的生物农药（微生物农药）、天然植物农药、生物学防治剂、信息素、特别是转基因作物的发展将会加速，但它们不能相互替代，而是相互补充，相辅相成，生化技术也将会促进新农药的发现。

虽然公认 21 世纪是生物技术的天下，但 21 世纪的植物保护仍离不开农药，农药在 21 世纪仍将继续发展，“人类需要粮食，农业需要农药”。

3. 21 世纪农药的特点

21 世纪农药——环境相容农药或绿色农药或生物调控剂（Bioregulator），是影响、控制和调节各种有害生物的生长、发育和繁殖的过程，在保障人类健康和合理的生态平衡的前提下，使有益生物得到保护，有害生物得到较好的抑制，以促进农业现代化向更高层次发展的特殊生物活性物质。其特点可以用 6 个字概括：高效、安全、经济。

高效：生物活性高且可靠、选择性高、作用方式独特、内吸性强（即在植物中可均匀分布）、持效期适度、作物耐受性好、抗性产生几率低。

安全：对环境而言，对有益生物低毒、易于降解、土壤中移动性低、在食品和饲料中极少或无明显残留。对使用者而言，施用剂量低、急性毒性低、积蓄毒性低、包装安全、制剂性能优良、使用方便、长期贮存稳定。

经济：花费少效益高、适宜于综合作物管理体系、应用范围广、产品性能独一无二、具有竞争力、具有专利权。理想的农药是如下矛盾对立的最佳统一。

（1）如果针对数千种有害物中的每一种开发相应的化学品，就可以保护有益生物、避免不必要的副作用；若这样做的话，研究开发费用将更高，就无经济而言。

（2）如要一味追求低残留，即活性物快速的降解为无害物，虽在土壤、水资源和食品等