

新杂环农药

NEW
HETEROCYCLIC
PESTICIDE

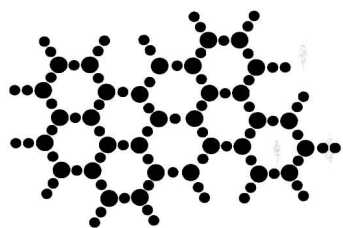
除草剂

Herbicide

宋宝安 吴 剑 主编



化学工业出版社



新杂环农药

NEW
HETEROCYCLIC
PESTICIDE

除草剂

Herbicide

宋宝安 吴 剑



化学工业出版社

· 北京 ·

本书以杂环化合物结构为分类标准,系统介绍了杂环类除草剂的最新研究进展,主要包括各种杂环类化合物的合成、波谱化学、立体化学、天然杂环化合物、生物活性与构效关系、手性分离、残留与代谢及作用机理、抗性、加工等内容,反映了当前国内外杂环类除草剂研究的新成果。

本书可作为大专院校农药学、精细化工、应用化学、植物保护、环境专业师生、科研院所研究工作者以及农业推广部门及化工生产、农资经营单位人员的参考书。

图书在版编目(CIP)数据

除草剂/宋宝安,吴剑主编. —北京:化学工业出版社, 2011.2
(新杂环农药)
ISBN 978-7-122-10467-0

I. 除… II. ①宋…②吴… III. 除草剂-研究
IV. TQ457

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2011) 第 013932 号

责任编辑:刘 军

文字编辑:孙凤英

责任校对:蒋 宇

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 刷:北京永鑫印刷有限责任公司

装 订:三河市万龙印装有限公司

710mm×1000mm 1/16 印张36¼ 字数852千字 2011年5月北京第1版第1次印刷

购书咨询:010-64518888(传真:010-64519686) 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:99.00 元

版权所有 违者必究

《新杂环农药》

除草剂

编写人员名单

主 编	宋宝安	吴 剑			
副 主 编	杨 松	杨光富	吴文君	沈晋良	贺红武
	杨 红	王鸣华	欧晓明	柏 松	
参编人员	(按姓名汉语拼音排序)				
	蔡 凯	柴立业	陈 卓	高 勇	管贵华
	何雪峰	贺 鸣	胡德禹	戢风琴	金林红
	靳 义	李 良	李 娜	林 鹏	刘 杰
	刘克明	罗 会	阮银伟	石 青	宋泽规
	孙 伟	谭效松	王安平	王文昌	吴 琴
	吴志兵	徐 帅	徐维明	薛 伟	杨 超
	杨 凌	张侃侃	张晓燕	张钰萍	章 浩
	周 军	周万维	曾 松	邹立伟	

前言

在国内外的农药研究中，杂环化合物以其选择性好、活性高、用量少、毒性低以及在有害物生化生理反应中的特异性而成为研究的主体。先后涌现出一些具有超高效活性和环境友好的含杂环（如：吡唑、吡啶、嘧啶、噻唑、咪唑及三唑等）的新颖药剂，杂环化合物也因此成为农药领域开发的热点之一，也是除草剂研究开发的主体。

从除草剂进入有机化合物领域以来，杂环就起到了举足轻重的作用，是农药除草剂领域研究的热点和重点。近年来，高效、低毒、低残留除草剂在世界范围内发展很快，新产品不断开发成功，并迅速得到推广应用，如杂环类除草剂中的咪草烟、禾草克、精噁唑禾草灵、环酯草醚、环苯草酮、甲磺胺磺隆、丙苯磺隆、氟吡嗪草酯、氟丙嘧草酯等。由于这些新品种具有结构新颖、作用机制独特、生物活性高、对环境比较友好且不易产生抗性等特点，已逐步取代传统常规的农药而成为除草剂的重要组成部分。现代技术手段的飞速发展和生物科学理论的完善提高，更促进了以天然活性物质为来源的杂环化学合成农药的发展。在除草剂方面，以天然产物为先导化合物开发的除草剂有来自植物内源激素的植物生长调节剂如2,4-滴、乙烯利、萘乙酸，其他的还有草铵膦、苯草酮、环庚草醚、磺草酮等。以1,4-桉叶素为先导开发的环庚草醚，以核桃醌为先导开发的醚磺胺以及由莎草为先导开发的三氟羧草醚等均为杂环农药。目前基本上不进行大豆田、玉米田等除草剂的研制；某些杂草对除草剂草甘膦的抗性已经存在，因此仍需要研制开发抗草甘膦的杂草的新产品；孟山都等公司承诺不进行直接食用的小麦和水稻转基因品种的研制（也许出于安全性考虑），仍可进行新的麦田和水稻田除草剂的研发。为此，全球最新开发了五氟磺草胺、氟吡磺隆、环酯草醚、环苯草酮、甲磺胺磺隆、丙苯磺隆、氟吡嗪草酯、氟丙嘧草酯等一批新农药品种。生物源化学合成杂环除草剂是以天然毒素为先导化合物，经结构改造和优化开发的新化合物，这种方法的成功率相对较高，目前已成为开发新型高效除草剂的主要途径之一，有望在除草剂开发中得到新的突破。

虽然农药创制和农药新品种介绍书籍较多，但目前介绍或反映杂环类除草剂合成、生物活性、构效关系等研究进展方面的专业图书很少，特别是介绍近十年杂环类除草剂国内外研究进展详细资料的书更少，国内尚未见到系统全面述及杂环类除草剂有关书籍。为此，我们组织了《新杂环农药》丛书编审委员会，在本分册中邀请了农药与植保学术界知名专家西北农林科技大学吴文君教授编写了第9章，华中师范大学贺红武教授和谭效松高级工程师编写了第6章，湖南化工研究院欧晓明教授编写了第10章，南京农业大学杨红教授编写了第12章，南京农业大学王鸣华教授编写了第13章，南京农业大学沈晋良教授编写了第16章，华中师范大学杨光富教授及戢风琴博士编写了第17章，我们课题组成员宋宝安、杨松、吴剑、柏松、金林红、陈卓、贺鸣、张钰萍、胡德

禹、吴志兵、杨凌、薛伟、曾松和博士生徐维明、张侃侃、李向阳、王贞超、吴琴、罗会及硕士生蔡凯、李良、李娜、林鹏、靳义、孙伟、宋泽规、管贵华、阮银伟、石青、王安平、李为华、周军、刘杰、邹立伟、杨超、潘聪、高勇、刘克明等编写了第 1 章至第 8 章及第 11 章、第 14 章、第 15 章。本书系统介绍了各类有机杂环化合物在绿色除草剂中的应用, 选用国内外当前最新材料和研究成果, 为我国在跟踪创新取得进展的同时, 在农药理论研究的原始创新方面 (如除草剂领域、农药靶标及作用机制方面等) 提供积极的参考。希望此书的出版对我国除草剂农药研究, 特别是对我国绿色农药创制具有积极的参考价值。

借本书出版之际, 感谢国家自然科学基金项目、国家“973”计划项目、国家“十一五”科技支撑计划项目、教育部新世纪优秀人才项目、贵州省农药学国家重点学科人才基地建设项目、贵州省农业攻关项目、贵州省优秀人才省长资金对我们研究工作的资助。

编 者

2010 年 8 月

目 录

绪论	1
第 1 章 三元杂环类除草剂	4
1.1 含氮丙啶环的除草剂	4
1.2 含二氮环甲烷的除草剂	5
1.3 含环硫乙烷的除草剂	5
1.4 环氧乙烷类除草剂	6
1.5 结论与展望	9
参考文献	10
第 2 章 四元杂环类除草剂	12
2.1 含氮杂丁烷的衍生物	12
2.2 含 1,3-硫氮杂丁烷的化合物	12
2.3 含环硫丁烷的化合物	13
2.4 含 1,3-二硫杂丁烷的化合物	14
2.5 含环氧丁烷的化合物	16
2.6 结论与展望	18
参考文献	18
第 3 章 五元杂环类除草剂	19
3.1 单杂原子杂环	19
3.1.1 呋喃类化合物	19
3.1.2 噻吩类化合物	24
3.1.3 吡咯类化合物	31
3.2 多杂原子杂环	35
3.2.1 吡唑类化合物	35
3.2.2 噁二唑类化合物	49
3.2.3 噻二唑类化合物	54
3.2.4 噁唑类化合物	68
3.2.5 异噁唑类化合物	72
3.2.6 噻唑类化合物	79

3.2.7 异噻唑类化合物	85
3.2.8 咪唑类化合物	91
3.2.9 三唑类化合物	97
参考文献	111
第4章 六元杂环类除草剂	125
4.1 单元子杂环	125
4.1.1 吡啶类	125
4.1.2 吡喃类	139
4.1.3 噻喃类	141
4.2 多杂原子杂环	143
4.2.1 吡嗪类	143
4.2.2 哒嗪类	150
4.2.3 三嗪类	159
4.2.4 噁嗪类	169
4.2.5 吗啉类	175
4.2.6 嘧啶类	185
参考文献	195
第5章 苯并稠环衍生物	206
5.1 吡啶类衍生物	206
5.1.1 取代基吡啶类	206
5.1.2 四氢吡啶类	207
5.1.3 磺酰胺(脲)类	209
5.1.4 小结	209
5.2 吡啶类衍生物	209
5.2.1 取代吡啶类	209
5.2.2 吡啶酮类	211
5.3 苯并三唑类衍生物	213
5.3.1 芳醚类	213
5.3.2 烷氧基取代类	214
5.3.3 取代芳基类	215
5.3.4 吡啶类	215
5.3.5 其他类	216
5.4 喹啉类衍生物	217
5.4.1 喹啉醚类化合物	217
5.4.2 二氮氧化喹啉类化合物	219

5.4.3	其他喹喔啉类化合物	220
5.4.4	小结	221
5.5	苯并(异)噻唑类衍生物	221
5.5.1	苯并噻唑类	221
5.5.2	苯并异噻唑类	225
5.5.3	苯并噻唑啉酮类	226
5.5.4	小结	226
5.6	苯并噻吩类衍生物	226
5.6.1	含三嗪环衍生物类	226
5.6.2	2-甲酸衍生物类	227
5.6.3	醚衍生物类	228
5.6.4	2,3-二氢类	229
5.6.5	小结	231
5.7	苯并噁嗪类衍生物	231
5.7.1	4 <i>H</i> -3,1-苯并噁嗪类	232
5.7.2	2 <i>H</i> -1,4-苯并噁嗪类	234
5.8	苯并噻嗪类衍生物	238
5.9	酞嗪类衍生物	239
5.10	喹啉类衍生物	240
5.11	异喹啉衍生物	242
5.12	苯并噁唑及异噁唑类衍生物	242
5.12.1	苯并噁唑类	242
5.12.2	苯并异噁唑类	247
5.12.3	结论与展望	248
5.13	苯并噻二唑类衍生物	248
5.13.1	1,2,3-苯并噻二唑	248
5.13.2	2,1,3-苯并噻二唑	250
5.13.3	结论与展望	252
5.14	苯并咪唑类衍生物	253
5.15	苯并三嗪类衍生物	254
5.16	吩嗪类衍生物	256
5.17	喹唑啉类衍生物	256
5.17.1	喹唑啉(硫)酮类衍生物	257
5.17.2	喹唑啉(硫)醚类衍生物	258
5.17.3	其他类喹唑啉衍生物	259

5.17.4 结论与展望	259
参考文献	259
第6章 稠杂环类除草剂	268
6.1 三唑并杂环类化合物	268
6.2 噻二唑并杂环类化合物	283
6.3 吡唑并杂环类化合物	286
6.4 噻唑并杂环类化合物	293
6.5 噻吩并杂环类化合物	295
6.6 吡啶并杂环类化合物	297
6.7 结论与展望	299
参考文献	300
第7章 七元杂环类除草剂	303
7.1 含氮七元杂环类化合物	303
7.2 含氧七元杂环类化合物	305
7.3 有机磷类化合物	306
7.4 内酰胺类化合物	306
7.5 小结	307
参考文献	307
第8章 手性杂环类除草剂	309
8.1 杂环手性化合物	309
8.1.1 芳氧苯氧羧酸类手性除草剂	309
8.1.2 二苯醚类手性除草剂	311
8.1.3 杂环类手性除草剂	312
8.1.4 酯或酰胺类手性除草剂	318
8.1.5 小结	320
8.2 杂环类除草剂手性分离	321
8.2.1 芳氧苯氧羧酸类除草剂	322
8.2.2 咪唑啉酮类除草剂	327
8.2.3 三唑啉酮类除草剂	329
8.2.4 酰胺类除草剂	331
8.2.5 结论与展望	332
参考文献	332
第9章 杂环类植物源除草剂	335
9.1 含氧杂环类除草活性化合物	335

9.1.1 桉叶素	335
9.1.2 黄花蒿素	335
9.1.3 苦木素类	336
9.1.4 向日葵属类	336
9.1.5 稻壳酮类	336
9.1.6 独角金内酯	337
9.2 含氮杂环类除草活性化合物	338
9.2.1 芦竹碱	338
9.2.2 糖苷生物碱	338
9.2.3 三氧氮杂壬烷衍生物	339
9.2.4 均三嗪衍生物	339
9.3 小结	340
参考文献	340
第 10 章 杂环类除草剂的生物活性与作用机理	342
10.1 除草剂生物测定技术	342
10.1.1 常规筛选技术	342
10.1.2 高通量筛选技术	346
10.1.3 除草剂筛选技术发展趋势	353
10.2 杂环类除草剂作用机理研究进展	354
10.2.1 除草剂作用靶标的类型	354
10.2.2 杂环除草剂的作用机理	356
10.3 结论与展望	384
参考文献	384
第 11 章 杂环类除草剂分析方法研究进展	388
11.1 磺酰脲类	388
11.2 嘧啶水杨酸类	392
11.3 三氮苯类	393
11.4 吡啶类	395
11.5 环状亚胺类	397
11.6 咪唑啉酮类	398
11.7 芳氧苯氧丙酸类	399
11.8 其他杂环	400
11.9 结论与展望	402
参考文献	402

第 12 章 杂环类除草剂残留分析	405
12.1 磺酰脲类除草剂	405
12.1.1 水体中的残留分析方法	406
12.1.2 农作物及农产品中的残留分析方法	409
12.1.3 土壤中残留分析	412
12.2 咪唑类除草剂	418
12.3 三氮苯类(三嗪类)除草剂	421
12.4 联吡啶类除草剂	427
12.5 苯氧基及杂环氧基苯氧基丙酸类除草剂	429
12.6 其他种类的杂环除草剂	432
12.7 展望	435
参考文献	435
第 13 章 酶免疫技术在杂环类除草剂残留分析中的应用	440
13.1 农药酶联免疫方法	440
13.1.1 分子模拟	440
13.1.2 酶免疫分析方法分类	443
13.1.3 抗体的制备	446
13.2 杂环类除草剂的酶免疫分析	450
13.2.1 磺酰脲类除草剂半抗原的合成	450
13.2.2 有机杂环类除草剂半抗原的合成	451
13.2.3 芳氧苯氧羧酸酯类除草剂半抗原的合成	453
13.2.4 均三氮苯类除草剂半抗原的合成	454
13.3 酶联免疫分析技术的展望	456
参考文献	456
第 14 章 杂环类除草剂代谢及降解	459
14.1 杂环类除草剂在植物体内代谢研究进展	459
14.1.1 农药植物体内代谢过程	459
14.1.2 农药氧化还原代谢途径	461
14.1.3 农药水解代谢途径	468
14.1.4 其他代谢途径	470
14.1.5 结论与展望	471
14.2 杂环类除草剂的非生物降解研究进展	472
14.2.1 磺酰脲类	472
14.2.2 吡啶类	477
14.2.3 均三氮苯类	478

14.2.4	咪唑啉酮类	480
14.2.5	联吡啶类	482
14.2.6	三氮苯酮类	482
14.2.7	其他类	483
14.2.8	结论与展望	486
参考文献		487
第 15 章 杂环类除草剂剂型加工		491
15.1	悬浮剂	491
15.2	微乳剂	494
15.3	水乳剂	495
15.4	水分散性粒剂	497
15.5	结论与展望	499
参考文献		499
第 16 章 杂草对杂环类除草剂的抗性		500
16.1	杂草抗药性的历史与现状	501
16.2	杂草对除草剂的抗性类型	508
16.2.1	乙酰乳酸合成酶抑制剂	508
16.2.2	光系统II抑制剂	514
16.2.3	乙酰辅酶 A 羧化酶抑制剂	517
16.2.4	合成激素类	519
16.2.5	联吡啶类	521
16.2.6	二硝基苯胺类	523
16.2.7	有机磷类	524
16.2.8	原卟啉原氧化酶抑制剂	525
16.2.9	杂草对其他类除草剂的抗性	525
16.3	杂草的交互抗性和多抗性	526
16.4	杂草抗性形成的原因与生物适合度	527
16.4.1	杂草抗性形成的原因	527
16.4.2	生物适合度	528
16.5	杂草抗性机制	529
16.6	除草剂的抗性治理	532
16.6.1	农业防治	532
16.6.2	严格检疫,实时监控	533
16.6.3	生物防治	533
16.6.4	科学合理用药	533

参考文献 535

第 17 章 以乙酰羟酸合成酶为靶标的除草剂 545

17.1 乙酰羟酸合成酶的结构及生物学功能 545

17.1.1 AHAS 的生物功能 545

17.1.2 AHAS 的结构生物学 546

17.2 AHAS 酶抑制剂的分类 553

17.2.1 磺酰脲类除草剂 553

17.2.2 咪唑啉酮类除草剂 554

17.2.3 三唑并嘧啶类除草剂 555

17.2.4 嘧啶（氧）硫苯甲酸类除草剂 555

17.2.5 磺酰胺羰基三唑酮类除草剂 556

17.3 新型 AHAS 酶抑制剂的分子设计 557

参考文献 558

缩略语 560

绪 论

除草剂是指防除农业（林业）杂草，可使杂草彻底地或选择地发生枯死的化学药剂。除草剂的作用方式不同，使用方法也各异，但从根本上来说，除草剂按作用方式可分为两类。①触杀性除草剂。药剂喷施后只能杀死直接接触到药剂的杂草部位，这类除草剂只能杀死杂草的地上部分，对杂草地下部分或有地下繁殖器官的多年生杂草效果差或无效，因而主要用于防除一年生较幼小的杂草，施药时要求喷洒均匀使所有杂草个体都能接触到药剂才能收到好的防治效果。②内吸性除草剂。这类除草剂可以被杂草的根、茎、叶或芽鞘等部位吸收并在植株体内输导运送到全株，破坏杂草的内部结构和生理平衡从而使之枯死。某些内吸性除草剂（如2,4-滴丁酯、草甘膦）可向下输导到地下根、茎杀死或抑制地下根、茎繁殖，因而内吸剂可防治一年生和多年生杂草，对大草也有效。

按使用方法分类可分为三类。①茎叶处理剂。将除草剂溶液兑水，以细小的雾滴均匀地喷洒在植株上，这种喷洒法使用的除草剂叫茎叶处理剂，如氟吡甲禾灵、草甘膦等。②土壤处理剂。将除草剂均匀地喷洒到土壤上形在一定厚度的药层，当杂草种子的幼芽、幼苗及其根系被接触吸收而起到杀草作用，这种作用的除草剂，叫土壤处理剂，如西玛津、扑草净等。③茎叶、土壤处理剂。可作茎叶处理，也可作土壤处理，如阿特拉津等。按来源和化学结构分类可分为：无机和矿物除草剂，植物性除草剂，微生物除草剂，有机除草剂（主要由杂环、苯、醇、脂肪酸、有机胺等有机化合物合成）如杂环除草剂、醚类、取代脲类、苯氧乙酸类、二硝基苯胺类、酰胺类、酚类等。杂环除草剂是指对农业（林业）杂草具有毒杀、抑制或调控作用的杂环化合物。

化学除草是从20世纪40年代发展起来的，是现代农业技术上的一大革新。除草剂研究和应用发展的主要原因是由于杂草危害严重，作物损失巨大，而除草剂防除杂草效果显著、及时省工、经济效益高。据联合国有关部门统计，化学除草剂的销售量不断增加，在农药生产量中所占比重逐年增加，目前，除草剂的种类已达近千种，用于不同的作物。施用除草剂的面积也在不断扩大。从美国农业生产作业过程看：人工除草占50%，机械除草占40%，化学除草占55%，可见化学除草在农业中已占主导地位。目前世界除草剂年产量近百万吨原药，可供近百亿亩耕地使用。由于应用了除草剂可以节省大批劳动力，提高劳动生产率，使一般机械难以除掉的苗间杂草得到清除，从而使机械化进一步完善。同时，传统的耕作栽培法也得到改进。免耕、少耕法也因化学除草的发展而逐渐推广应用。

我国从20世纪50年代开始用2,4-D防除麦田杂草，60年代2,4-D、敌稗（propanil）等在水稻田大面积应用，1980年全国生产除草剂20余种。主要有2,4-D、除草醚（nitrofen）、敌稗、禾草丹（thiobencarb）、扑草净（prometryn）、莠去津（atrazine）、

敌草隆 (diuron)、茅草枯 (dalapon)、草甘膦 (glyphosate)、甲草胺 (alachlor)、氟乐灵 (trifluralin) 等。到 1989 年我国已能生产 30 多种除草剂, 进口品种也有几十种。如国产的有: 丁草胺 (butachlor)、敌草胺 (napropamide)、地乐胺 (dibutalrin)、胺草磷、克草胺、野麦畏 (triallate)、野燕枯 (difenzoquat)、绿麦隆 (chlortoluron)、西草净 (simetryn)、苯达松 (bentazon)、莎扑隆 (cyperon)、氯磺隆 (chlorsulfuron)、苄嘧磺隆 (bensulfuron methyl)、甲磺隆 (metsulfuronmethyl) 等。进口品种主要有: 精吡氟禾草灵 (fluazifop-*p*-butyl)、麦草畏 (dicamba)、乙氧氟草醚 (oxyfluorfen)、氟磺胺草醚 (fomesafen)、异丙甲草胺 (metolachlor)、萘氧丙草胺 (napropamide)、禾草特 (molinate)、灭草敌 (vernolate)、甜菜宁 (phenmedipham)、环草敌 (cycloate)、噻磺隆 (thifensulfuronmethyl)、苯磺隆 (tribenuronmethyl)、二氯喹啉酸 (quinclorac)、吡氟氯禾灵 (haloxyfop)、苄嘧磺隆、哌草丹 (dimepiperate)、禾草克 (quizalofop-ethyl)、噁草酮 (oxadiazon)、烯禾啉 (sethoxydim) 等。除草剂已成为农业现代化生产中不可缺少的一个组成部分。现正发展高效、低毒、低残留的除草剂品种, 使除草剂效果更大、副作用更小。

几十年来农药市场发生了很大变化, 20 世纪 50 年代初期, 2, 4-D 与 2 甲 4 氯的大面积使用, 既促进了农田化学除草的迅速发展, 也推进了杂环除草剂品种的筛选与开发, 如 1951 年发现灭草隆 (monuron) 后, 促使迅速合成与试验了数千个脲类化合物, 因为脲分子易被多种取代基取代。1952 年发现了均三氮苯的活性, 导致迅速开发出一系列新品种, 20 世纪 70 年代中期发现禾草灵 (diclofopmethyl) 活性后, 通过结构改造及衍生物合成, 很快开发出芳氧苯氧丙酸及环己烯二酮两类除草剂, 1979 年磺酰脲类除草剂第一个品种氯磺隆发现后, 磺酰脲类除草剂是除草剂发展史上最重要的里程碑之一, 它开创了超高效除草剂的新时代, 迅速掀起以 ALS 为靶标的新品种的筛选与合成, 开发出一系列高活性杂环品种。

目前全国农田化学除草面积已达 0.53 亿公顷, 较 1980 年增加了 10 多倍, 除草剂的需求以每年 200 万公顷的速度增加, 国内每年使用除草剂有效成分达 8 万吨以上。目前农药市场中先后有 100 多个除草剂产品投入使用, 使用面积前 20 位的产品在 2006 年占到全国农田化学除草总面积的 75% 左右, 磺酰脲类的杂环除草剂苄嘧磺隆、甲磺隆, 三嗪类的杂环除草剂莠去津、扑草净、西草净是市场的主流品种。近年来, 随着耕作制度的变化和农田杂草抗药性的日趋严重, 新型杂环除草剂农田化学除草中的比例增大, 约占除草剂使用量的 30%~40%。

目前国际的发展趋势是创新芳香杂环超高效化学除草剂, 如近年来新上市的除草剂中, 最有代表性化合物包括拜耳公司报道的三嗪类除草剂 indaziflam、日本住友化学报道的磺酰脲类除草剂 iopropisulfuron (据报道该化合物对某些已知磺酰脲类除草剂产生抗性的杂草有很好的活性)、日本北行化学公司报道的三唑啉酮类除草剂艾分卡斑唑 (ipfencarbazone)、巴斯夫公司报道的脲嘧啶类除草剂嘧啶肟草醚 (saflufenacil) 以及先正达公司报道的唑啉草酯 (pinoxaden)。值得强调的是, 尽管唑啉草酯的作用靶标也是乙酰辅酶 A 羧化酶, 但它的化学结构与芳氧苯氧及环己二酮类除草剂完全不同。因此, 唑啉草酯可以说是近年来为数不多的具有全新化学骨架的杂环除草剂。除此之外, 由上海有机化学研究所创制的新型除草剂丙酯草醚和异丙酯草醚也是结构比较新颖的杂环除草剂。研究表明, 丙酯草醚和异丙酯草醚实际上是一种潜药, 其真正的有效成分是代谢

物 2-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-氧基) 苯甲酸, 这种代谢物对植物乙酰羟酸合成酶具有很强的抑制活性。因此, 代谢差异是该类化合物在作物和杂草之间产生选择性的主要机制。

2008 年公开的新农药品种报道的除草剂有 4 个是新杂环化合物, 另外一个已知品种的单一杂环化合物的异构体。拜耳公司报道的三嗪类除草剂的 indaziflam, 猜测是在除草剂三嗪氟草胺 (triaziflam) 基础上经优化得到。杜邦公司报道的嘧啶胺类除草 aminocyclopyrachlor, 主要用于棉花等收获前脱叶。日本住友化学报道的磺酰脲类除草剂 propyrisulfuron, 对某些已知磺酰脲类除草剂产生抗性的杂草有很好的活性。日本北行化学公司报道的三唑啉酮类除草剂 ipfencarbazone, 猜测是在除草剂四唑啉草胺的基础上, 参照除草剂氟噻草胺等的化学结构, 经优化得到。主要用于防治稻田杂草如稗草等。巴斯夫公司报道的脲嘧啶类除草 saflufenacil, 除可用于多种作物防治杂草外, 与草甘膦一起施用, 可有效地防除对草甘膦产生抗性的杂草。Meiji Seika Kaisha 报道了草胺膦的异构体 glufosinate-*p*。防除杂草的迫切性引起各级政府和国内各专业科研单位的高度重视, 近年来杂草防治上的新问题也频频出现, 如市场上除草剂的除草谱较窄等。近年来, 水稻轻型栽培发展很快。免耕直播、免耕抛秧和旱直播都有了较大面积的推广。免耕和直播稻田易生各类杂草, 市场对既能除杂草、又能除稗草的除草剂有明显的需求。长期连续使用苄嘧磺隆及其复配制剂, 杂草的抗性越来越严重, 这已成为当前直播水稻生产上亟待解决的难题。因此, 能用于解决难防治杂草问题和新一代高效除草剂产品的出现, 无疑是业界普遍关注的热点。上述事实说明我国的除草剂农药创制是来自农业生产和化学工业的需要, 市场的需求量大。我国绿色农药先导结构及作用靶标的研究工作尚处于起步阶段, 相应自主知识产权极其缺乏, 这是制约我国自主创新农药研究开发的瓶颈。

本书以杂环化合物结构为分类标准, 进行杂环类除草剂研究进展介绍, 主要包括杂环类型化合物的合成、波谱化学、不对称合成、立体化学、天然杂环化合物、生物活性、分子设计构效关系、手性分离、残留、残留免疫印记分析、代谢、作用机理、抗性、加工等, 反映了杂环除草剂研究的新成果。与现有其他书籍比较具有如下特点: 系统性更强, 对我国除草剂创制有益性和针对性更强, 对研究与生产部门实用性更强, 重点更加突出, 信息量大, 是杂环药物介绍内容齐全、索引完备的书。