

《现代农药》编辑部组织编写

专利农药新品种 手册

ZHUANLI NONGYAO XINPINZHONG SHOUCE



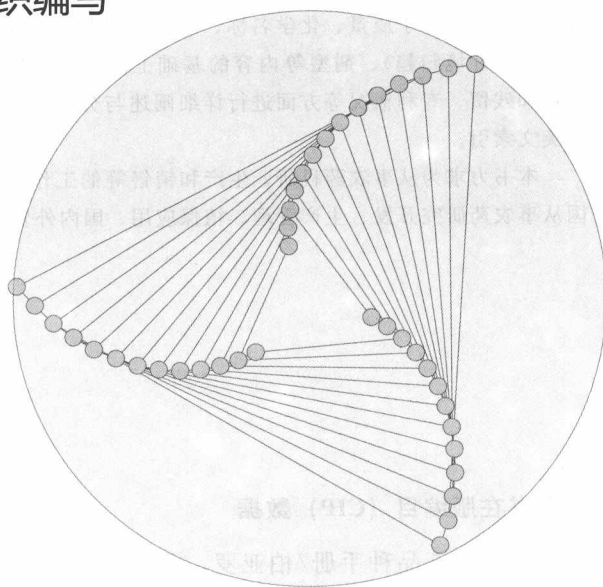
NLIC 2970701570

柏亚罗 张晓进 顾群 等编



化学工业出版社

《现代农药》编辑部组织编写



专利农药新品种 手册

ZHUANLI NONGYAO XINPINZHONG SHOUCHE

柏亚罗 张晓进



NLIC 2970701570



化学工业出版社

· 北京 ·

本书收录了71个农药品种,包括杀虫杀螨剂17个,杀菌剂22个,除草剂30个,植物生长调节剂1个以及除草剂安全剂1个。针对每个品种,在收录中英文通用名称、结构式、分子式、相对分子质量、化学名称、CAS登录号、理化性质、毒性(包括哺乳动物毒性、生态毒性、环境归趋)、剂型等内容的基础上,对开发与登记、合成路线(包括重要中间体)、分析和残留、专利概况等方面进行详细阐述与分析。为方便查找,本书列出了各农药品种的中英文索引。

本书力求为从事农药科研、生产和销售等的工作人员提供较为全面的参考资料,可供我国从事农药研究开发、生产管理、植保应用、国内外贸易等方面的相关人员查阅。

图书在版编目(CIP)数据

专利农药新品种手册/柏亚罗,张晓进,顾群等编;《现代农药》编辑部组织编写. —北京:化学工业出版社, 2011.4

ISBN 978-7-122-10771-8

I. 专… II. ①柏…②张…③顾…④现… III. 农药-手册 IV. S48-62

中国版本图书馆CIP数据核字(2011)第043448号

责任编辑:刘军
责任校对:宋夏

文字编辑:刘志茹
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24¼ 字数458千字 2011年6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:98.00元

版权所有 违者必究

本书编写人员名单

柏亚罗 张晓进 顾 群
彭玉宁 万红梅 冯 坚

前 言

自 1994 年我国农药出口大于进口以来，“出口”已经成为我国农药工业点击的热点关键词。随着国内农药产量的逐年、快速提升，我国的农药企业比以往任何时候、比任何国家都渴望走出国门。而欧美农药市场销售总额占据了全球农药市场的近一半，加之欧美严格的农药管理制度使其成为全球农药管理的典范，因此，欧美市场专利过期农药产品自然成为全球非专利产品公司关注的焦点。

农药产品基本上可以分为三类：①专利产品（proprietary products），这类产品仍处于强制性的专利保护期内，市场份额约占 30%。②专利技术产品（off-patent proprietary products），这类产品其活性成分的专利保护期已经届满，但终端制剂产品或有一些专利技术（如表面活性剂或安全剂等），或与转基因作物相关联（如孟山都公司的耐农达作物），或与有专利保护的活性成分复配，或有资料保护，从而阻止非专利产品生产商涉足这片市场。这些产品约占全球农药市场 42.5% 的份额。③非专利产品（generic products），这类产品所占市场份额为 27.5%。近年来，专利产品的市场份额已经收缩，显然，每年进入市场的新有效成分的数目在减少。据统计，获得 ISO 通用名的活性成分的数目由 20 世纪 90 年代后期的平均每年 20 个降至近 6 年来的每年 7 个。因此，专利新近过期或即将过期的农药品种必将成为农药企业追捧的热点。

在这样的市场背景和发展形势下，《现代农药》编辑部的全体工作人员组织编写了这本《专利农药新品种手册》。

20 世纪 80 年代中期至 90 年代初期，世界农药工业的创制工作达到了巅峰阶段，从而诞生了许多新的拥有专利保护的农药品种，转眼 20 年过去了，当时开发的一批产品都将在 2007~2013 年专利期满。本书收录了国际市场中 71 个这样的活性成分，这些产品已经或行将退去保护的外衣，逐步转入非专利产品市场，成为众多农药公司竞相角逐的对象。

农药品种在欧盟的保护往往包括三个方面：专利保护、补充保护证书（SPCs）和资料保护，其中补充保护证书并不是每个专利产品都能拥有的。为了弥补专利申请公司由于等待过程而造成的损失，欧盟设立了具有浓厚地方特色的补充保护证书，从而可以使专利保护延长最多 5 年时间。一旦一个农药品种被列入欧盟农药登记指令（91/414），那么其登记资料就可以获得 5 年（现有活性成分）或 10 年（新活性成分）的保护。所以，在三重（或两重）保护的共同作用下，常常使一个产品的保护期超过 20 年，从而使专利到期时间落在 2007~2013

年。而美国的产品保护只包括专利保护（20年）和资料保护（10年）两个方面。

在本书收录的71个农药品种中，包括了杀虫杀螨剂17个，杀菌剂22个，除草剂30个，植物生长调节剂1个以及除草剂安全剂1个。针对每个品种，本书在收录中英文通用名称、结构式、分子式、相对分子质量、化学名称、CAS登录号、理化性质、毒性（包括哺乳动物毒性、生态毒性、环境归趋）、剂型等内容的基础上，对开发与登记、合成路线（包括重要中间体）、分析和残留、专利概况等方面进行阐述，力求为从事农药科研、生产和销售等的工作人员提供较为全面的参考资料。

在对71个品种的汇总中，我们查阅了大量的参考资料，其中部分已在国内期刊以单品种列出，而一些通用性的资料则呈现在“主要参考文献”一页中。本书的大多数内容来自于对国外资料的翻译，尽管在编写过程中我们尽量仔细，并力求忠实于原文，但由于编者水平有限，加之时间仓促，疏漏与不当之处在所难免，恳望读者不吝赐教。

编者

2010年12月

目 录

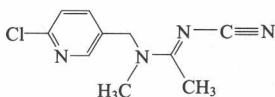
杀虫杀螨剂	1
啉虫脒 (acetamiprid)	1
联苯肼酯 (bifenazate)	7
虫螨腈 (chlorfenapyr)	12
噻虫胺 (clothianidin)	18
甲氨基阿维菌素苯甲酸盐 (emamectin benzoate)	25
乙螨唑 (etoxazole)	30
啶螨醚 (fenazaquin)	34
啉螨酯 (fenpyroximate)	38
氟虫腈 (fipronil)	43
噻唑磷 (fosthiazate)	52
茚虫威 (indoxacarb)	56
虱螨脲 (lufenuron)	64
氟酰胺 (novaluron)	69
吡蚜酮 (pymetrozine)	73
多杀霉素 (spinosad)	79
吡螨胺 (tebufenpyrad)	86
噻虫啉 (thiacloprid)	92
杀菌剂	98
活化酯 (acibenzolar-S-methyl)	98
啉菌酯 (azoxystrobin)	104
氰霜唑 (cyazofamid)	113
啉菌环胺 (cyprodinil)	120
烯酰吗啉 (dimethomorph)	125
噁唑菌酮 (famoxadone)	130
咪唑菌酮 (fenamidone)	136
腈苯唑 (fenbuconazole)	141
环酰菌胺 (fenhexamid)	146
咯菌腈 (fludioxonil)	151
缬霉威 (iprovalicarb)	157
醚菌酯 (kresoxim-methyl)	161

叶菌唑 (metconazole)	167
啉氧菌酯 (picoxystrobin)	171
嘧霉胺 (pyrimethanil)	177
苯氧喹啉 (quinoxifen)	183
硅噻菌胺 (silthiofam)	188
螺环菌胺 (spiroxamine)	192
四氟醚唑 (tetraconazole)	197
肟菌酯 (trifloxystrobin)	202
灭菌唑 (triticonazole)	210
苯酰菌胺 (zoxamide)	215
除草剂	220
氨基草酮 (amicarbazone)	220
氟丁酰草胺 (beflubutamid)	224
唑草胺 (cafenstrole)	228
唑草酮 (carfentrazone-ethyl)	231
吲哚酮草酯 (cinidon-ethyl)	238
环丙嘧磺隆 (cyclosulfamuron)	242
吡氟酰草胺 (diflufenican)	246
乙氧磺隆 (ethoxysulfuron)	252
双氟磺草胺 (florasulam)	257
氟噻草胺 (flufenacet)	263
氟啶嘧磺隆 (flupyr-sulfuron-methyl-sodium)	268
呋草酮 (flurtamone)	273
甲氧咪草烟 (imazamox)	277
茛草酮 (indanofan)	283
异噁唑草酮 (isoxaflutole)	286
硝磺草酮 (mesotrione)	291
磺草唑胺 (metosulam)	297
烟嘧磺隆 (nicosulfuron)	302
烯草胺 (pethoxamid)	310
氟吡酰草胺 (picolinafen)	313
丙苯磺隆 (propoxycarbazone)	317
吡草醚 (pyraflufen-ethyl)	321
嘧草硫醚 (pyrithiobac-sodium)	327
砒嘧磺隆 (rimsulfuron)	332
磺草酮 (sulcotrione)	338

甲磺草胺 (sulfentrazone)	343
磺酰磺隆 (sulfosulfuron)	347
噻唑烟酸 (thiazopyr)	352
氟胺磺隆 (triflusulfuron-methyl)	356
三氟甲磺隆 (tritosulfuron)	360
植物生长调节剂	364
环丙酰草胺 (cyclanilide)	364
除草剂安全剂	367
吡唑解草酯 (mefenpyr-diethyl)	367
附录 1 2009~2013 年过专利保护期的农药品种	371
附录 2 农药剂型名称及代码	373
主要参考文献	374
农药英文名称索引	375

杀虫杀螨剂

啉虫脒 (acetamiprid)



$C_{10}H_{11}ClN_4$, 222.7

【化学名称】 (E)-N¹-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-N²-氰基-N¹-甲基乙脒 (IUPAC)

(E)-N-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-N'-氰基-N-甲基乙脒 (CA)

【CAS 登录号】 [135410-20-7]; [160430-64-8], 未标明立体化学结构

【其他名称】 Mospilan、Assail、Gazel、Gazelle、Intruder、Profil、Rescate、Saurus、Supreme、Tristar (曹达); Vapcomore (Vapco); Adjust (拜耳作物科学); Epik (Sipcam Inagra)

【理化性质】 原药含量 $\geq 990g/kg$ (欧盟的要求); 外观: 无色晶体; 熔点: $98.9^{\circ}C$; 蒸气压: $<1 \times 10^{-3} mPa (25^{\circ}C)$; 分配系数: $K_{ow} \lg P = 0.80 (25^{\circ}C)$; 亨利常数: $<5.3 \times 10^{-8} Pa \cdot m^3/mol$ (计算值); 相对密度: 1.330 ($20^{\circ}C$)。溶解度: 在 $25^{\circ}C$ 水中溶解度为 $4250mg/L$; 可溶于丙酮、甲醇、乙醇、二氯甲烷、氯仿、乙腈和四氢呋喃等有机溶剂。

稳定性: 在 $pH=4、5$ 和 7 的缓冲溶液中稳定, 在 $pH=9$ 和 $45^{\circ}C$ 时缓慢降解, 对光稳定。 $pK_a=0.7$, 弱碱性。

【毒性】

(1) 哺乳动物毒性 急性经口 LD_{50} : 雄性大鼠 $217mg/kg$, 雌性大鼠 $146mg/kg$, 雄性小鼠 $198mg/kg$, 雌性小鼠 $184mg/kg$ 。急性经皮 LD_{50} : 雄性和雌性大鼠均 $>2000mg/kg$ 。对兔皮肤和眼睛无刺激性。对豚鼠皮肤无致敏作用。吸入 $LC_{50}(4h)$: 雄性和雌性大鼠均 $>0.29mg/L$ 。NOEL: 大鼠 (2年) $7.1mg/kg$ (bw); 小鼠 (18个月) $20.3mg/kg$ (bw); 狗 (1年) $20mg/kg$ (bw)。ADI (日本): $0.066mg/kg$ 。Ames 试验为阴性。

(2) 生态毒性 鸟类: 鹌鹑 LD_{50} 为 $180mg/kg$, 鹌鹑 $LC_{50} > 5000mg/L$ 。鱼类 $LC_{50}(24 \sim 96h)$: 鲤鱼 $>100mg/L$ 。水蚤 $LC_{50}(24h) > 200mg/L$ 。藻类 $EC_{50}(72h) >$

98.3mg/L; NOEC(72h) 为 98.3mg/L。

(3) 环境归趋 植物：在植物表面或体内缓慢降解，生成 5 种确定的代谢产物。

土壤/环境：在黏壤土中 DT_{50} 为 1d；在轻黏土中 DT_{50} 为 1~2d。总残留物 DT_{50} 为 15~30d。

【剂型】 主要剂型有：颗粒剂 (GR, 2%)、可溶液剂 (SL, 22.5%)、可湿性粉剂 (WP, 70%) 和可溶粉剂 (SP, 20%)、粉剂 (DP)、泡腾片剂 (EB)、乳油 (EC)、水分散粒剂 (WG)、水乳剂 (EW)、微乳剂 (ME) 和悬浮剂 (SC) 等。

国内对啶虫脒单剂及其混配制剂加工方面的研究报道很多，剂型涉及乳油、微乳剂、水分散粒剂、可溶液剂等。

【开发与登记】 啶虫脒是由日本曹达公司发现、并由 H. Takahashi 等于 1992 年在英国布赖顿植保会议上报道的广谱内吸性杀虫剂，对半翅目和鳞翅目害虫有杀卵和杀幼虫活性，并可有效防治缨翅目成虫和鞘翅目害虫。

啶虫脒用于防治叶菜、果菜、甘蓝类作物、柑橘、梨果、葡萄、棉花、观赏植物和花卉上的吮吸式口器害虫，土壤和叶面应用皆可，并适宜用作种子处理剂。

1995 年，日本曹达公司在日本开发 20% 啶虫脒 WP。

1996 年，啶虫脒进入中国和韩国市场。

1999 年，日本曹达向欧盟递交了啶虫脒作为新产品的登记申请；2000 年 6 月，欧委会（欧盟委员会 European Commission 的简称，全书同）宣布资料完成；由于欧盟登记缓慢，所以啶虫脒在欧盟的临时登记有效期延长至 2005 年 4 月；2005 年 1 月 1 日，啶虫脒列入欧盟农药登记指令 (91/414) 附录 1，登记公司因此获得了其后 10 年的登记资料保护权。

2001 年，啶虫脒进入希腊市场；2002 年，进入法国、西班牙及比利时、荷兰、卢森堡市场。

美国和加拿大根据减风险程序对啶虫脒进行了联合评估，以期作为有机磷和林丹的潜在替代品种使用。2002 年初，啶虫脒在这两个国家获准登记。根据“联邦杀虫剂、杀菌剂和杀鼠剂法案”，为了支持新农药化学品或现有农药新使用的登记，啶虫脒登记商可以获得 10 年期的登记资料保护权，起始时间为新活性物质的首个登记日。没有资料拥有者的许可，其他登记商无权使用保护期内的登记资料。

2002 年，啶虫脒在美国以商品名 Assail 销售用于水果和蔬菜，以商品名 Intruder 销售用于棉花。

杜邦公司获得了啶虫脒在美国棉花上叶面应用的开发权。

2003 年，Cerexagri 公司获得了啉虫脒在美国园艺上应用的销售权。

日本曹达公司将啉虫脒在比利时、法国、英国和荷兰的销售权授予了 Certis Europe 公司，在意大利、西班牙和葡萄牙的销售权授予 Sipcam 公司，而 Efthymiadis 公司获得了啉虫脒在希腊的销售权。

杜邦公司获得了啉虫脒在墨西哥、中美和加勒比海国家的销售权。

住友化学拥有啉虫脒在阿根廷、哥伦比亚和厄瓜多尔的销售权。

曹达授权巴斯夫公司在秘鲁和智利销售啉虫脒。

Calliope（现在的爱利思达生命科学公司）获得了啉虫脒在非洲北部、东西部的销售权。

2004 年，杜邦和 Rallis 公司达成协议，根据协议他们将合作开发茚虫威（由杜邦公司提供）和啉虫脒（由 Rallis 公司提供）。

2005 年，曹达公司在市场上推出啉虫脒与甲基硫菌灵（thiophante-methyl）的复配制剂 Mosiplan-Topsin M Spray。

2005 年，富美实与曹达达成了在非作物市场独家开发和销售啉虫脒的协议；2006 年，富美实将啉虫脒产品引入家庭和白蚁市场。

2005 年 1 月 1 日，啉虫脒列入欧盟农药登记指令（91/414）附录 1，在其后的 10 年里，啉虫脒的登记资料在欧盟得到保护。

2006 年，啉虫脒以商品名 Gazelle 在英国上市，用于果树和保护地作物。

2006 年，啉虫脒活性成分在德国登记。

2007 年，富美实开发了啉虫脒与联苯菊酯（bifenthrin）的复配制剂 Transport，并在美国上市，用于防治白蚁。

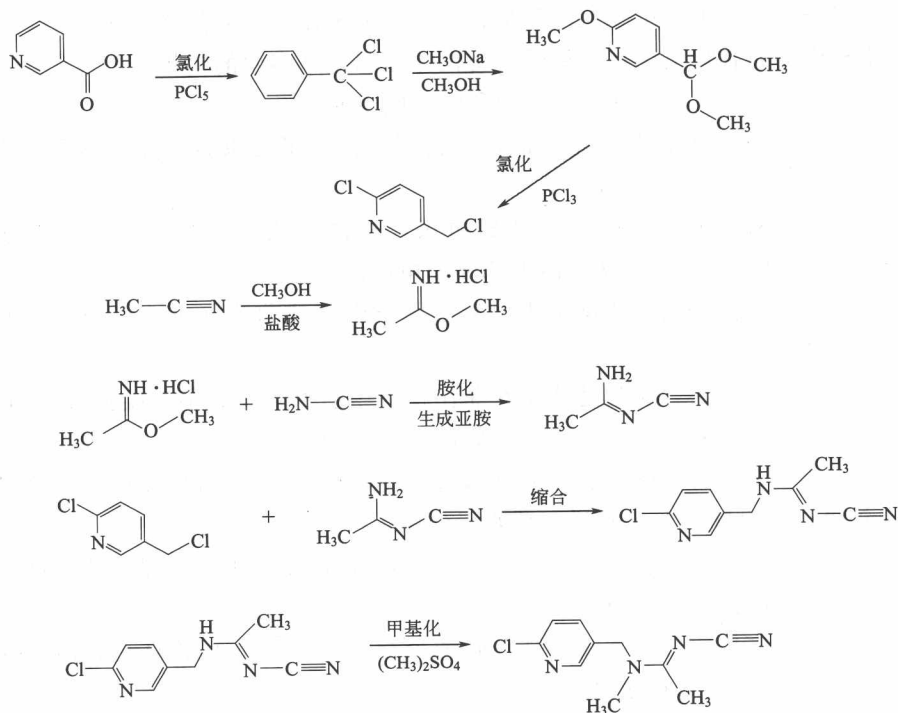
2008 年，德国 Staehler 公司获准以商品名 Mospilan 登记啉虫脒，用于梨果、观赏植物、莴苣、黄瓜和番茄。

根据 2010 年 7 月中国官方公布的信息，共有 332 家企业（包括日本曹达株式会社）取得临时登记证 147 个，正式登记证 368 个。其中，原药产品 33 个；制剂加工产品 482 个，包括粉剂、可溶粉剂、可溶液剂、可湿性粉剂、泡腾片剂、乳油、水分散粒剂、水乳剂、微乳剂、悬浮剂等剂型，含复配制剂 61 个，分别与阿维菌素、敌百虫、毒死蜱、二嗪磷、高效氯氰菊酯、甲氨基阿维菌素、联苯菊酯、氯氰菊酯、氯氰菊酯、杀虫单、辛硫磷、仲丁威等进行复配；分装产品 4 个。

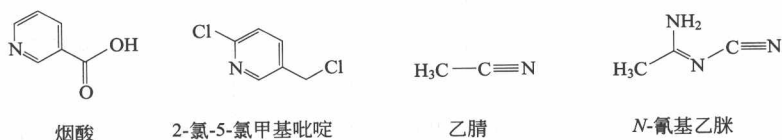
总的来说，目前啉虫脒的覆盖范围已相当大，其主要市场包括：澳大利亚、比利时、巴西、保加利亚、加拿大、中国、捷克、法国、德国、希腊、印度、印度尼西亚、以色列、意大利、科特迪瓦、日本、马来西亚、缅甸、巴基斯坦、波兰、罗马尼亚、韩国、西班牙、瑞士、荷兰、土耳其、美国、英国、乌兹别克斯坦等。其主要适用作物包括：苹果、茄子、甘蓝、卷心菜、油菜、谷物、柑橘、

芸苔类作物、棉花、黄瓜、开花植物、果菜、葡萄、叶菜、莴苣、西瓜、洋葱、观赏植物、棕榈果、桃、辣椒、梨果、马铃薯、水稻、核果、草莓、甜菜、茶、烟草和番茄等。

【合成路线】



◆ 关键中间体：烟酸、2-氯-5-氯甲基吡啶、乙腈和 *N*-氰基乙脒。



【分析和残留】 原药分析采用高效液相色谱法 (HPLC)；残留测定采用气-液色谱法 (GLC)。

国内对啶虫脒原药及其制剂的分析主要采用高效液相色谱法，也有采用气相色谱法、大口径毛细管柱、光散射技术等进行有关啶虫脒的分析研究。

在残留研究方面，我国科研人员分别对啶虫脒在小麦、棉花、油菜、水果、蔬菜、大豆、茶叶、枸杞等作物上的残留量测定方法或残留消解动态进行了大量研究。

【专利概况】 欧洲专利：日本曹达-EP 0456826，专利申请日为 1990 年 10 月 4 日，专利终止日为 2010 年 10 月 3 日。

英国补充保护证书 (SPCs): SPC/GB06/028 EP0456826-啮虫脒, 最长有效期至 2015 年 1 月 26 日。

美国专利: 日本曹达-US 5304566, 专利终止日为 2011 年 4 月 18 日。

1990 年 10 月 6 日, 日本曹达株式会社向中国专利局提出申请, 2000 年 10 月 4 日, 国家专利局公告授权日本曹达株式会社“杀虫剂组合物及其应用”(即啮虫脒组合物)专利。2002 年 6 月, 国家知识产权局专利复审委员会宣告该专利无效。

【应用】 啮虫脒为烟碱乙酰胆碱受体拮抗剂, 作用于昆虫中枢神经系统的突触。具有内吸、触杀和胃毒作用。

啮虫脒可用于防治多种作物(尤其是蔬菜、水果和茶树)上的半翅目(尤其是蚜虫)、缨翅目和鳞翅目害虫, 在土壤和叶面应用。蔬菜上的用量为 $75 \sim 300\text{g}/\text{hm}^2$ ($1\text{hm}^2 = 10^4\text{m}^2$), 果园里的用量为 $100 \sim 700\text{g}/\text{hm}^2$ 。

国内对啮虫脒的应用做了大量研究和田间药效试验, 包括用于多种作物防治各种虫害, 如水稻象甲、稻飞虱、麦蚜、棉蚜、蔬菜蚜虫、小菜蛾、菜青虫、桃蚜、苹果黄蚜和苹果棉蚜、柑橘蚜虫、柑橘潜叶蛾、梨木虱、烟蚜、烟粉虱和茶小绿叶蝉等。此外也对啮虫脒防治白蚁、蟑螂等的效果进行了研究。

【小结】 啮虫脒是一种广谱内吸性杀虫剂, 可用于叶菜、果菜、芸薹属作物、柑橘、梨果、葡萄、棉花以及观赏植物和花卉等, 防治吮吸式口器害虫。该产品自 1995 年在日本市场首先开发以来, 目前已在世界上许多国家登记用于作物和非作物两大市场。

啮虫脒的欧洲专利已于 2010 年 10 月 3 日终止, 美国专利有效期至 2011 年 4 月 18 日。然而, 由于登记公司拥有英国补充保护证书 (SPCs), 所以, 啮虫脒在欧盟的专利有效期延长至 2015 年 1 月 26 日。

2002 年, 啮虫脒首次在美国获准登记, 并获得了从登记日起算的、为期 10 年的登记资料保护权。2005 年 1 月 1 日, 啮虫脒被列入欧盟农药登记指令 (91/414), 并获得了这一天起算的 10 年期资料保护权。非专利产品生产公司如果要进入欧盟或美国市场, 要么自行准备一套完整的登记资料, 要么与日本曹达公司协商使用其登记资料, 并支付一定的补偿费用。

啮虫脒的生产工艺相对简单, 所以, 许多非专利农药生产商和合同制造商都可以生产。目前, 已经有 40 多家公司声称生产啮虫脒, 虽然实际公司数量可能稍有出入, 但从一个侧面反映出许多公司可以比较容易地生产出符合标准的啮虫脒产品。

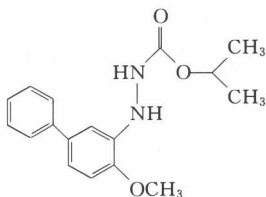
很显然, 啮虫脒的专利过期对许多非专利产品生产来说是一个很好的机遇, 但是, 短期内这些生产商所能涉入的市场可能仅限于登记相对容易且费用不高的国家。

日本曹达公司已将基于啶虫脒产品的开发权授予给很多公司，以追求最大程度地渗入作物和非作物市场，目前，市场已经拥有许多啶虫脒的品牌产品，这一战略的实施以及主要市场昂贵的登记费用有助于曹达公司在啶虫脒的后专利环境中仍能保持一定的市场份额。

参 考 文 献

- [1] 农药, 2005, (11): 523.
- [2] 中国茶叶, 2006, (2): 24.
- [3] 中国卫生杀虫药械, 2006, (4): 275.
- [4] 温州农业科技, 2008, (1): 22.
- [5] 天津化工, 2009, (3): 44.
- [6] 新华日报, 2004-1-8: B1.
- [7] 现代农药, 2008, (6): 22.
- [8] 农药, 2005, (11): 514.

联苯肼酯 (bifenazate)



$C_{17}H_{20}N_2O_3$, 300.4

【化学名称】 3-(4-甲氧基联苯-3-基)肼基甲酸异丙酯 (IUPAC)

2-[4-甲氧基(1,1'-联苯)-3-基]肼基甲酸异丙酯 (CA)

【CAS 登录号】 [149877-41-8]

【其他名称】 Acramite、Floramite (科聚亚); Mito-kohne (日产化学)

【理化性质】 原药纯度 $\geq 95\%$ (质量分数); 外观: 白色、无嗅晶体 (原药为米色固体); 熔点: $123\sim 125^\circ\text{C}$ (纯有效成分); 蒸气压: $< 1\times 10^{-2}\text{ mPa}$ (25°C); 分配系数: $K_{ow}\lg P=3.4$ (25°C , pH7); 亨利常数: $1\times 10^{-3}\text{ Pa}\cdot\text{m}^3/\text{mol}$; 相对密度: 1.31。溶解度: 20°C 时在水中溶解度为 2.06 mg/L ; 在乙腈中溶解度为 95.6 g/L , 乙酸乙酯中为 102 g/L , 甲醇中为 44.7 g/L , 甲苯中为 24.7 g/L , 正己烷中为 0.232 g/L 。

稳定性: 20°C 时贮存 1 年以上稳定; 在 50% 相对湿度和 25°C 条件下, 水解 DT_{50} 为 9.10 d (pH 4)、 5.4 d (pH 5)、 0.8 d (pH 7) 和 0.08 d (pH 9); 光解 DT_{50} 为 17 h (25°C , pH 5)。 pK_a : 12.94 (23°C); 闪点: $\geq 110^\circ\text{C}$; 表面张力 64.9 mN/m (22°C)。

【毒性】

(1) 哺乳动物毒性 大鼠急性经口 $LD_{50} > 5000\text{ mg/kg}$; 大鼠急性经皮 $LD_{50} > 2000\text{ mg/kg}$ 。对兔皮肤有极轻微的刺激性, 对兔眼有轻微的刺激性。根据美国环保署和欧盟的标准, 联苯肼酯没有被列为对皮肤或眼睛有刺激性的物质。对豚鼠皮肤无致敏作用。大鼠吸入 $LC_{50} > 4.4\text{ mg/L}$ 。NOEL(90d): 大鼠为 40 mg/kg [雄性每日 2.7 mg/kg(bw) , 雌性每日 3.2 mg/kg(bw)], 狗为 40 mg/kg [雄性每日 0.9 mg/kg(bw) , 雌性每日 1.3 mg/kg(bw)]; (1 年) 狗为 40 mg/kg [雄性每日 1.014 mg/kg(bw) , 雌性每日 1.051 mg/kg(bw)]; (2 年) 大鼠为 20 mg/kg [雄性每日 1.0 mg/kg(bw) , 雌性每日 1.2 mg/kg(bw)]; (78 周) 小鼠为 10 mg/kg [雄性每日 1.5 mg/kg(bw) , 雌性每日 1.9 mg/kg(bw)]。ADI: 0.01 mg/kg 。Ames 试验呈阴性, 对大鼠和兔无致突变、无致畸作用。对大鼠和小鼠无致癌

作用。

(2) 生态毒性 鸟类：鹌鹑急性经口 LD_{50} 为 1142mg/kg；饲喂 LC_{50} (5d)：鹌鹑为 2298mg/kg (饲料)，野鸭为 726mg/kg (饲料)。鱼类 LC_{50} (96h)：蓝鳃太阳鱼为 0.58mg/L，虹鳟鱼为 0.76mg/L。水蚤 EC_{50} (48h) 为 0.50mg/L。藻类：羊角月牙藻 (*Selenastrum capricornutum*) E_rC_{50} (96h) 为 0.9mg/L。蜜蜂： LD_{50} (48h, 经口) > 100 μ g/蜂；(接触) 为 8.5 μ g/蜂。蠕虫 LC_{50} (14d) > 1250mg/kg。对伪钝绥螨 (*Amblyseius fallacis*)、*Galendromus occidentalis* 和 *Zetzellia mali* 等捕食性螨类无害，对草蛉 (*Chrysoperla carnea*)、丽蚜小蜂 (*Encarsia formosa*) 和步甲 (*Poecilus cupreus*) 等昆虫也无害 (IOBC)。

(3) 环境归趋 动物：在动物中，联苯胼酯被认为其生物利用率很低，绝大多数给服药剂随粪便排出体外。吸收程度随剂量而变化，当给服剂量为 10mg/kg 时，可吸收 80%~85%；当给服剂量为 1000mg/kg 时，可吸收 22%~29%。吸收的药剂在动物体内发生氧化作用，生成相应的含氮化合物，也可发生羟基化作用。羟基化代谢物以硫酸盐型结合物或葡萄糖苷酸型结合物出现在尿液中。

植物：由于联苯胼酯为非内吸性化合物，所以施药后，绝大多数残留物滞留于作物表面或表皮上，几乎不发生代谢作用。极微量药剂渗入表皮，其在植物体内的代谢过程与在动物体内相同。

土壤/环境：在需氧土壤中 DT_{50} 约为 7h；在厌氧土壤中 DT_{50} 约 < 1d。联苯胼酯及其降解物在许多土壤中不发生淋溶。 K_{oc} (高效液相色谱法测定) 为 1778。在天然水中 DT_{50} 为 45min；田间消散 DT_{50} \leq 5d。

【剂型】 主要剂型有：悬浮剂 (SC, 20% 和 43%)、水分散粒剂 (WG, 80%) 以及可湿性粉剂 (WP, 50%) 等。

【开发与登记】 联苯胼酯是一个新颖的杀螨剂，开发用于农业和园艺作物，杀螨谱广，具有快速击倒作用。该产品由尤尼罗尔公司 (现科聚亚公司) 发现，1996 年报道，尤尼罗尔和日产化学联合开发，2000 年首次进入市场。

联苯胼酯比科聚亚公司之前开发的杀螨剂炔螨特 (propargite) 效果更好，有望弥补炔螨特在美国抗性治理方面的不足。

1999 年，联苯胼酯在美国首次登记。根据“联邦杀虫剂、杀菌剂和杀鼠剂法案”，为了支持新农药化学品或现有农药新使用的登记，联苯胼酯登记商可以获得 10 年期的登记资料保护权，起始时间为新活性物质的首个登记日。没有资料所有权公司的许可，其他登记商无权使用保护期内的登记资料。

2005 年 12 月 1 日，联苯胼酯被列入欧盟农药登记指令 (91/414) 附录 1，因此，联苯胼酯登记商获得了从这一天起算的 10 年期登记资料保护权。

根据我国 2010 年 8 月公布的信息，美国科聚亚公司的 97% 联苯胼酯原药和 43% 联苯胼酯悬浮剂在我国取得正式登记。