



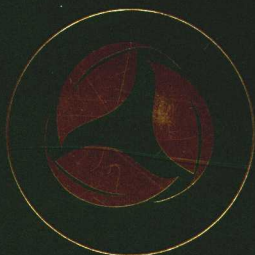
“十三五”国家重点出版物
出版规划项目

中国农药研究与应用全书
Books of Pesticide Research and Application in China

农药创新

Pesticide Innovation

李忠 邵旭升 主编



化学工业出版社

中国农药研究与应用全书
Books of Pesticide Research and Application in China



农药创新

Pesticide Innovation

ISBN 978-7-122-33892-1



9 787122 338921 >

定价: 168.00元

销售分类建议: 农业/农药; 化工/农药



“十三五”国家重点出版物
出版规划项目

中国农药研究与应用全书

Books of Pesticide Research and Application in China

农药创新

Pesticide Innovation

李忠 邵旭升 主编



化学工业出版社

· 北京 ·

本书详细介绍了中国农药创制发展历史、农药创制现状、农药创新体系以及主要农药研发单位等情况，重点介绍了农药筛选、细胞靶标水平测试技术、作用机制研究技术和氟化学技术等农药创新研究新技术，以及类同合成、分子设计和靶标发现等农药创新研究新理论。同时，介绍了中国创制的农药新品种，并介绍了杀线虫药物的研究状况、非农用农药和生物农药等内容。

本书可为从事新农药研究、开发、应用的农林科技人员提供指导和参考，也可供大专院校相关专业师生参考。

图书在版编目 (CIP) 数据

中国农药研究与应用全书. 农药创新/李忠, 邵旭升主编.
—北京: 化学工业出版社, 2019. 4
ISBN 978-7-122-33892-1

I. ①中… II. ①李… ②邵… III. ①农药-研制-研究-
中国 IV. ①S48②TQ450.6

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2019) 第 028306 号

责任编辑: 刘 军 冉海滢 张 艳
责任校对: 王素芹

文字编辑: 向 东
装帧设计: 王晓宇

责任印制: 薛 维

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: 中煤 (北京) 印务有限公司

787mm×1092mm 1/16 印张 29¼ 彩插 1 字数 718 千字 2019 年 10 月北京第 1 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: 168.00 元

版权所有 违者必究

《中国农药研究与应用全书》

编辑委员会

- 顾问： 罗锡文 华南农业大学，中国工程院院士
李 玉 吉林农业大学，中国工程院院士
吴孔明 中国农业科学院，中国工程院院士
陈剑平 宁波大学，中国工程院院士
朱有勇 云南农业大学，中国工程院院士
康振生 西北农林科技大学，中国工程院院士
郑裕国 浙江工业大学，中国工程院院士
- 主任： 宋宝安 贵州大学，中国工程院院士
钱旭红 华东师范大学，中国工程院院士

委员：（按姓名汉语拼音排序）

- 陈 卓 贵州大学，教授
董丰收 中国农业科学院植物保护研究所，研究员
高希武 中国农业大学，教授
何雄奎 中国农业大学，教授
金林红 贵州大学，教授
李 忠 华东理工大学，教授
李钟华 中国农药工业协会，研究员
林荣华 农业农村部农药检定所，研究员
刘绍仁 农业农村部农药检定所，研究员
欧晓明 湖南化工研究院，研究员
钱旭红 华东师范大学，中国工程院院士
任天瑞 上海师范大学，教授
单炜力 农业农村部农药检定所，研究员
邵旭升 华东理工大学，教授
宋宝安 贵州大学，中国工程院院士
魏启文 全国农业技术推广服务中心，研究员
吴 剑 贵州大学，教授
杨 松 贵州大学，教授
叶贵标 农业农村部农药检定所，研究员
郑永权 中国农业科学院植物保护研究所，研究员
周国庆 化学工业出版社，编审
周普国 农业农村部农药检定所，研究员
周伟斌 化学工业出版社，编审

本书编写人员名单

主 编： 李 忠 邵旭升

编写人员：（按姓名汉语拼音排序）

曹晓峰	陈 刚	陈睿嘉	陈信飞	陈修雷
程家高	杜 康	杜少卿	杜瑶瑶	韩 體
何鲁珏	侯晴晴	胡 建	贾浩武	荆一飞
李久辉	李 威	李晓阳	李 忠	栗广龙
刘鹏建	梅倩倩	乔 治	任 超	邵旭升
沈昱君	谭 都	王福凯	王俊杰	王 蓉
王轶平	吴 桐	须志平	徐 琪	徐晓勇
袁鹏涛	张瑞峰	张 晓	周 聪	周存存
朱 玲				

序

农药作为不可或缺的农业生产资料和重要的化工产品组成部分，对于我国农业和大化工实现可持续的健康发展具有举足轻重的意义，在我国农业向现代化迈进的进程中，农药的作用不可替代。

我国的农药工业 60 多年来飞速地发展，我国现已成为世界农药使用与制造大国，农药创新能力大幅提高。近年来，特别是近十五年来，通过实施国家自然科学基金、公益性行业科研专项、“973”计划和国家科技支撑计划等数百个项目，我国新农药研究与创制取得了丰硕的成果，农药工业获得了长足的发展。“十二五”期间，针对我国农业生产过程中重大病虫害防治需要，先后创制出四氯虫酰胺、氯氟醚菊酯、噻唑锌、毒氟磷等 15 个具有自主知识产权的农药（小分子）品种，并已实现工业化生产。5 年累计销售收入 9.1 亿元，累计推广使用面积 7800 万亩。目前，我国农药科技创新平台已初具规模，农药创制体系形成并稳步发展，我国已经成为世界上第五个具有新农药创制能力的国家。

为加快我国农药行业创新，发展更高效、更环保和更安全的农药，保障粮食安全，进一步促进农药行业和学科之间的交叉融合与协调发展，提升行业原始创新能力，树立绿色农药在保障粮食丰产和作物健康发展中的权威性，加强正能量科普宣传，彰显农药对国民经济发展的贡献和作用，推动农药可持续发展，通过系统总结中国农药工业 60 多年来新农药研究、创制与应用的新技术、新成果、新方向和新思路，更好解读国务院通过的《农药管理条例（修订草案）》；围绕在全国全面推进实施农药使用量零增长行动方案，加快绿色农药创制，推进绿色防控、科学用药和统防统治，开发出贯彻国家意志和政策导向的农药科学应用技术，不断增加绿色安全农药的生产比例，推动行业的良性发展，真正让公众对农药施用放心，受化学工业出版社的委托，我们组织目前国内农药、植保领域的一线专家学者，编写了本套《中国农药研究与应用全书》（以下简称《全书》）。

《全书》分为八个分册，在强调历史性、阶段性、引领性、创新性，特别是在反映农药研究影响、水平与贡献的前提下，全面系统地介绍了近年来我国农药研究与应用领域，包括新农药创制、农药产业、农药加工、农药残留与分析、农药生态环境风险评估、农药科学使用、农药使用装备与施用、农药管理以及国际贸易等领域所取得的成果与方法，充分反映了当前国际、国内新农药创制与农药使用技术的最新进展。《全书》通过成功案例分析和经验总结，结合国际研究前沿分析对比，详细分析国家“十三五”农药领域的研究趋势和对策，针对解决重大病虫害问题和行业绿色发展需要，对中国农药替代技术和品种深入思考，提出合理化建议。

《全书》以独特的论述体系、编排方式和新颖丰富的内容，进一步开阔教师、学生和产业领域研究人员的视野，提高研究人员理性思考的水平和创新能力，助其高效率地设计与开发出具有自主知识产权的高活性、低残留、对环境友好的新农药品种，创新性地开展绿色、清洁、可持续发展的农药生产工艺，有利于高效率地发挥现有品种的特长，尽量避免和延缓抗性和交互抗性的产生，提高现有农药的应用效率，这将为我国新农药的创制与科学使用农药提供重要的参考价值。

《全书》在顺利入选“十三五”国家重点出版物出版规划项目的同时，获得了国家出版基金项目的重点资助。另外，《全书》还得到了中国工程院绿色农药发展战略咨询项目（2018-XY-32）及国家重点研发计划项目（2018YFD0200100）的支持，这些是对本书系的最大肯定与鼓励。

《全书》的编写得到了农业农村部农药检定所、全国农业技术推广服务中心、中国农药工业协会、中国农业科学院植物保护研究所、贵州大学、华东理工大学、华东师范大学、中国农业大学、上海师范大学、湖南化工研究院等单位的鼎力支持，这里表示衷心的感谢。

宋宝安，钱旭红

2019年2月

前言

在国家的大力支持下，我国农药创新整体水平稳步提升，创制能力及国际影响力大大增强，取得多项具有国际影响力的原创性成果。建立了涵盖分子设计、化学合成、生物测试、靶标发现、产业推进等环节的较完整的农药创制体系，自主创制的病虫草害防治品种开始走向应用，组建了一支绿色农药创制队伍，使中国成为第五个具有创制新农药能力的国家。

农药发展经历了低效高毒→高效高毒→高效低毒→绿色农药的发展过程，现代农药创制更加关注生态安全。生态兴则文明兴，低生态风险的绿色杀虫剂创制是未来发展的方向。针对绿色农药发展，立足我国农药创新现状，在化学工业出版社的支持下，我们编写了《农药创新》，介绍了中国农药创制发展历史、农药创制现状、农药创新体系、主要农药研发单位；重点介绍了农药筛选、细胞靶标水平测试技术、作用机制研究技术和氟化学技术等农药创新研究新技术，以及类同合成、分子设计和靶标发现等农药创新研究新理论。同时还介绍了中国创制的农药新品种、杀线虫药物、非农用农药和生物农药的研究状况。本书力图反映我国目前的农药创新现状和技术，内容丰富，将为农药创制的发展起到积极的促进作用。

全书共分7章。第1章绪论，介绍中国农药创制发展历史、现状、创新体系和主要农药研发机构；第2章主要介绍农药创新技术，包括常规筛选技术、新型筛选技术、细胞水平测试技术、靶标水平测试技术、氟化学技术、作用机制研究新技术及其他新技术；第3章介绍了农药创新理论，包括类同合成、分子设计、靶标发现等；第4章介绍农药创新品种，主要是杀虫剂、杀菌剂和除草剂；第5章介绍农药在工业、花卉、卫生、园林等非农业领域中的应用以及杀线虫药物的研究概况；第6章介绍了生物农药状况；第7章总结了中国农药的发展历程、国内外差距及中国农药未来的发展趋势。

本书编写分工如下：第1章由李忠、邵旭升、陈信飞、刘鹏建和杜康编写；第2章由李忠、邵旭升、程家高、徐晓勇、须志平、朱玲、梅倩倩、侯晴晴、荆一飞、周存存、任超、周聪和沈昱君编写；第3章由李忠、邵旭升、袁鹏涛、何鲁珏、李久辉和王蓉编写；第4章由李忠、邵旭升、李威、陈睿嘉、王福凯和贾浩武编写；第5章由陈刚和陈修雷编写；第6章由李忠、邵旭升、朱玲、袁鹏涛、张晓、王俊杰、王轶平、曹晓峰、张瑞峰、徐琪和乔治编写；第7章由李忠、邵旭升、韩醴、谭都、杜瑶瑶、栗广龙、吴桐、李晓阳、胡建和杜少卿编写，全书最后由李忠和邵旭升统稿。

在编写本书时，力求做到科学性、实用性、操作性强，文字通俗易懂，以便于读者参考

应用。在编写过程中，参考了大量有关文献资料。另外，本书的编写得到了化学工业出版社、华东理工大学农药学团队等的大力支持。在此一并致以衷心的感谢。

鉴于本书涉及内容广泛，编撰方式也有一些新的尝试，加之编者水平有限，书中难免有疏漏和不当之处，敬请读者批评指正。

李忠、邵旭升

2019年5月

目录

第 1 章 绪论	001
1.1 引言	001
1.2 中国农药创制发展历史	002
1.2.1 中国农药创新起源	002
1.2.2 中国农药创新发展	004
1.2.3 中国农药创制现状	006
1.2.4 中国农药创新体系	012
1.3 主要农药研发单位	016
1.3.1 南开大学	016
1.3.2 中国农业大学	016
1.3.3 贵州大学	017
1.3.4 华中师范大学	018
1.3.5 华东理工大学	018
1.3.6 中国农业科学院植物保护研究所	019
1.3.7 西北农林科技大学	020
1.3.8 南京农业大学	022
1.3.9 中国科学院上海有机化学研究所	023
1.3.10 沈阳化工研究院有限公司	024
1.3.11 湖南化工研究院有限公司	024
1.3.12 浙江省化工研究院有限公司	026
1.3.13 上海市农药研究所有限公司	026
1.3.14 江苏省农药研究所股份有限公司	026
参考文献	028
第 2 章 农药创新技术	029
2.1 概论	029
2.2 生物筛选技术	029
2.2.1 杀虫剂生物测定方法	030
2.2.2 杀菌剂生物测定方法	031
2.2.3 除草剂生物测定方法	031
2.3 新型筛选技术	033
2.3.1 微量筛选技术	034

2.3.2	高通量筛选技术	035
2.3.3	虚拟筛选技术	039
2.3.4	固定化酶技术	043
2.3.5	药效团连接碎片虚拟筛选	048
2.4	细胞水平测试技术	050
2.4.1	细胞水平药物筛选	050
2.4.2	微流控芯片系统	052
2.5	氟化学技术在农药中的应用	053
2.6	作用机制研究新技术	056
2.6.1	化学生物学技术	056
2.6.2	电生理技术	062
2.6.3	细胞压电膜片钳技术	066
2.6.4	同位素示踪技术	072
2.7	其他新技术	073
2.7.1	卵母细胞表达技术	073
2.7.2	DNA 芯片技术	075
2.7.3	纳米农药技术	078
2.7.4	荧光标记技术	083
2.7.5	RNA 干扰技术	087
2.7.6	记录钙微电流膜片钳技术	090
2.7.7	荧光偏振技术	095
2.8	毒理预测技术	098
2.8.1	常规毒理测定技术	099
2.8.2	计算毒理学	099
2.9	手性农药技术	104
	参考文献	105

第 3 章	农药创新理论	111
3.1	概论	111
3.2	类同合成	111
3.2.1	片段拼接法	112
3.2.2	中间体衍生法	114
3.3	分子设计	121
3.3.1	QAAR	121
3.3.2	MB-QSAR	125
3.3.3	DFT/QSAR	126
3.3.4	构象柔性度分析	128
3.3.5	定量结构-毒性关系	131
3.3.6	活性碎片法	136

3.3.7 构型控制	140
3.4 靶标发现	144
3.4.1 几丁质合成酶	144
3.4.2 几丁质酶	150
3.4.3 β -N-乙酰己糖胺酶	163
3.4.4 细胞质苏氨酸转移核糖核酸合成酶	169
3.4.5 气味结合蛋白	174
3.4.6 咽侧体受体	179
3.4.7 HrBP1	183
3.4.8 瞬时受体电位通道	184
3.4.9 烟碱乙酰胆碱受体	188
3.4.10 电压门控钠离子通道	196
3.4.11 鱼尼丁受体	200
3.4.12 GABA 受体	210
参考文献	215

第 4 章 农药创新品种 224

4.1 概论	224
4.2 杀虫剂	224
4.2.1 哌虫啉	224
4.2.2 环氧虫啉	229
4.2.3 氯噻啉	232
4.2.4 戊吡虫胍	234
4.2.5 环氧啉	236
4.2.6 硫氟肟醚	238
4.2.7 氯溴虫腈	239
4.2.8 丁烯氟虫腈	241
4.2.9 四氯虫酰胺	243
4.3 杀菌剂	246
4.3.1 毒氟磷	246
4.3.2 丁吡吗啉	248
4.3.3 唑菌酯	251
4.3.4 唑胺菌酯	254
4.3.5 苯噻菌酯	257
4.3.6 草酸二丙酮胺铜	259
4.3.7 甲磺酰菌唑	260
4.4 除草剂	260
4.4.1 单嘧磺酯	260
4.4.2 丙酯草醚和异丙酯草醚	263

4.4.3 甲硫嘧磺隆	266
4.5 其他	267
4.5.1 乙螨唑	267
4.5.2 乙唑螨腈	269
4.5.3 氟唑活化酯	270
4.5.4 甲噻诱胺	271
参考文献	272

第 5 章 非农用及杀线虫农药 277

5.1 非农用农药概况	277
5.1.1 非农用农药的概念	277
5.1.2 非农用农药的分类	278
5.1.3 杀虫剂、杀菌剂和除草剂在非农领域的应用	280
5.1.4 非农用农药的管理规范	281
5.1.5 非农用农药的市场	282
5.1.6 非农用农药的机遇和挑战	285
5.1.7 展望	289
5.2 工业杀菌剂	289
5.2.1 工业杀菌剂的发展历史	290
5.2.2 工业常用杀菌剂的种类	291
5.2.3 异噻唑啉酮衍生物类杀菌剂	295
5.2.4 新型杀菌剂	299
5.2.5 杀菌增效剂	300
5.2.6 新型杀菌剂的发展趋势	300
5.3 园艺用农药	301
5.3.1 草坪用农药	301
5.3.2 花卉用农药	303
5.3.3 果园用农药	306
5.3.4 园艺作物中农药剂型的使用分析	316
5.3.5 总结	317
5.4 林木用农药	317
5.4.1 林业防治	317
5.4.2 林木用杀虫剂	319
5.4.3 林木用杀菌剂	323
5.4.4 林木用除草剂	326
5.5 卫生用农药	331
5.5.1 卫生用产品登记现状	336
5.5.2 卫生用农药登记管理政策	338
5.6 杀线虫农药	340

5.6.1	概论	340
5.6.2	根结线虫简介	341
5.6.3	根结线虫的防治	344
5.6.4	杀线虫剂的研究概况	346
	参考文献	355
第 6 章	生物农药	362
6.1	概论	362
6.1.1	生物农药的概念	363
6.1.2	生物农药的分类	364
6.1.3	生物农药的特点	364
6.1.4	生物农药与化学农药的辩证关系	365
6.1.5	生物农药的发展历史	366
6.1.6	我国生物农药的发展历程	367
6.1.7	我国生物农药的登记情况	368
6.1.8	生物农药的应用	369
6.1.9	我国生物农药的现状	370
6.1.10	我国生物农药的创新方向	372
6.1.11	国内生物农药的未来发展策略	373
6.2	转基因技术在农药中的应用	374
6.2.1	转基因技术介绍	375
6.2.2	转基因技术在全球农药中的应用与发展	375
6.2.3	转基因技术在我国的发展	377
6.2.4	转基因技术在害虫防治中的应用	378
6.2.5	转基因技术在除草中的应用	384
6.3	RNAi 干扰技术在农药中的应用	386
6.3.1	引言	386
6.3.2	RNAi 干扰技术在防治农业害虫中的应用	386
6.3.3	RNAi 干扰技术在防治植物线虫中的应用	392
6.3.4	RNAi 干扰技术在植物抗病中的应用	393
6.4	生物源农药	397
6.4.1	生物源农药简介	397
6.4.2	植物源农药	397
6.4.3	动物源农药	400
6.4.4	微生物农药	403
6.5	基因组编辑 (CRISPR) 技术	421
6.5.1	CRISPR 技术概述	421
6.5.2	CRISPR/Cas9 系统的作用	423
6.5.3	对 CRISPR/Cas9 技术的改进	424

6.5.4	CRISPR/Cas9 技术的优缺点	425
6.5.5	CRISPR 的研究进展	426
6.5.6	CRISPR 技术的前景与展望	433
6.5.7	结语	434
	参考文献	435
第 7 章	总结	443
7.1	中国农药的发展历史	443
7.2	农药发展的国内外差距	444
7.3	农药未来的发展趋势	447
	参考文献	449
索引		450

第 1 章

绪论

1.1 引言

环境、人口、粮食是 21 世纪持续发展所面临的三个重大问题，其中人口增长与粮食短缺之间的矛盾更是尤为突出。目前，全球可用耕地面积仅为 18.29 亿公顷，且由于自然和人为因素，这一数值还在逐年下降。在耕地面积减少的同时，全球人口数量却在不断地增长。联合国的一项人口预测显示：世界人口将在 2050 年超过 90 亿，届时的食物需求将会是目前粮食产量的一倍以上。粮食危机已成为当今世界面临的重大挑战，人口的持续增长、食品结构的改变、种植面积及种植结构的变化、可再生的生物质能源用农作物的栽培面积不断扩大，以及水源紧缺、自然灾害、沙漠化、全球气候变化异常等因素，导致粮食供应日趋紧张。因此，如何提高耕地单位面积的产能已经成为国家、政府以及科学家们亟待解决的重大问题。

在粮食生产过程中，病害、虫害、杂草和其他有害生物是影响农作物生产，降低粮食产量和品质的主要因素。据联合国粮食及农业组织（Food and Agriculture Organization of the United Nations, FAO）估计，这些农业有害生物所引起的农产品损失约为世界农业生产量的 1/3，其中虫害所引起的损失占 12.3%，病害所引起的损失占 11.8%，草害所引起的损失占 9.7%。故控制病害、虫害、杂草和其他有害生物的发生发展是提高粮食产量和质量的关键，而农药正是实现这一目标的重要“武器”。农药的使用不但可挽回作物的损失，提高经济效益，还可以节省劳动力，降低生产成本。

农药是现代农业、生态保护和卫生防护不可缺少的药剂。农药的创新和应用与生态保护、粮食安全、食品安全等息息相关，不仅影响着化学工业和农业动植物保护产业的竞争力，也影响着人民生活，牵动着千家万户的注意力，是建设美丽中国和生态文明需要直接面对的重大产业发展和民生改善的关键问题之一。由于科技的进步，现代农药已经进入超高效、低用量、无公害的绿色农药时代，新的种植形态和生态理念对农药发展及其应用提出了更高的要求。美国、日本、德国、瑞士、英国、法国等发达国家，在农药的创新能力和产业发展水平、应用水平方面处于世界的领先地位。