◆ 专论与综述 ◆

双酰胺类等五大类热点农药的市场概况及产品研发

严 明[1],柏亚罗[2]

(1. 上海市公共绿地建设事务中心,上海 201100;2. 江苏省农药研究所股份有限公司,南京 210046)

摘要:概述了HPPD抑制剂类除草剂、其他PPO抑制剂类除草剂、双酰胺类杀虫剂、新烟碱类杀虫剂、SDHI类杀菌剂等五大类农药热点产品的市场概况、主要品种、研发产品及前景展望。

关键词:HPPD抑制剂类除草剂;其他PPO抑制剂类除草剂;双酰胺类杀虫剂;新烟碱类杀虫剂;SDHI类杀菌剂;综述

中图分类号:TQ 450.1 文献标志码:A doi:10.3969/j.issn.1671-5284.2019.01.002

Market Overview and Product R&D on Five Hot Pesticide Sectors Including Diamide Class

Yan Ming[1], Bai Ya-luo[2]

(1. Shanghai Public Green Space Construction Affairs Center, Shanghai 201100, China; 2. Jiangsu Pesticide Research Institute Co., Ltd., Nanjing 210046, China)

Abstract: Market overview, key products, R&D products and future markets on five hot pesticide sectors, including HPPD inhibiting herbicides, other PPO inhibiting herbicides, diamide insecticides, neonicotinoid insecticides, SDHI fungicides, were summarized.

Key words: HPPD inhibiting herbicide; other PPO inhibiting herbicide; diamide insecticide; neonicotinoid insecticide; SDHI fungicide; review

全球农药市场在农产品价格、天气条件、病虫害发生、生物技术发展等诸多因素的作用下起伏前进。根据Phillips McDougall的统计数据,全球作物用农药市场的销售额从2004年的322.04亿美元增至2017年的542.19亿美元,期间的复合年增长率为4.1%;包括非作物用农药在内的总销售额从2004年的368.79亿美元增至2017年的615.30亿美元,期间的复合年增长率为4.0%[1]。

2017年,除草剂的销售额为232.30亿美元,占全球作物用农药市场的42.9%;杀菌剂和杀虫剂的销售额分别为154.87亿和135.23亿美元,各占全球作物用农药市场的28.6%和24.9%[1]。

Phillips McDougall将全球上市的农药分成了50个化学类型。其中,除草剂18类,杀虫剂13类,杀菌剂16类,其他3类。

除草剂中,其他PPO抑制剂类(+11.8%)、HPPD抑制剂类(+8.2%)、其他ALS抑制剂类(+8.3%)除草剂2011—2016年的复合年增长率均超8.0%;杀虫剂中,其他杀虫剂(+12.1%)、天敌(+8.8%)、微生物(+8.5%)、生物发酵(+8.3%)产品2011—2016年的复合年增长率均超8.0%;杀菌剂中,SDHI类(+26.9%)、生物(+20.7%)杀菌剂2011—2016年的复合年增长率均超20.0%[2]。

热点产品,或因"大",或因"新",或因"市场增长快"而热。HPPD抑制剂类除草剂、其他PPO抑制剂类除草剂、SDHI类杀菌剂近年来市场增长较快;新烟碱类虽在杀虫剂市场位居第一,但近年来被"高蜂毒"推到"风口浪尖";双酰胺类杀虫剂不仅增长迅猛,而且规模优势凸显。这五大类产品近年来颇受行业关注,成为农药市场的热点产品。

收稿日期:2018-10-22

作者简介:严明(1980—),男,江苏省泰州市人,工程师,主要从事上海市大型公共绿地建设、养护管理相关工作。E-mail:18001672@qq.com

(C)1994-2019 China Academic Journal Electronic Publishing House. All rights reserved. http://www.cnki.net

1 HPPD抑制剂类除草剂

对羟基苯基丙酮酸双氧化酶(HPPD)是目前最重要的除草剂作用靶标之一。得益于广谱、高效、新产品上市、抗性发展缓慢等,HPPD抑制剂类除草剂近年来增长较快。

从化学结构来看,目前上市的13个主要HPPD抑制剂类除草剂中,有6个三酮类(硝磺草酮、环磺酮、双环磺草酮、呋喃磺草酮、磺草酮、氟吡草酮)、6个吡唑酮类(苯唑草酮、pyrasulfotole、吡草酮、吡唑特、苄草唑、tolpyralate)、1个异噁唑酮类(异噁唑草酮)产品。由于该类除草剂优秀的产品性能,人们仍在继续研发此类产品,如先正达最近上市的氟吡草酮等[3]。

HPPD抑制剂类除草剂更多聚焦玉米,并已进入谷物、水稻等市场;且拜耳、先正达等公司研发的耐HPPD抑制剂类除草剂大豆即将商品化,从而为该类产品进入大豆市场奠定了基础。

1.1 HPPD抑制剂类除草剂的全球市场

2016年,HPPD抑制剂类除草剂的销售额为13.36亿美元,同比增长3.8%,占231.04亿美元全球除草剂市场(包括非作物用,下同)的5.8%,占564.52亿美元全球农药市场的2.4%[2]。2009—2016年,该类除草剂市场的复合年增长率为8.9%,是一类市场成长性较好的产品。

HPPD抑制剂类除草剂的信息见表1。

表1 HPPD抑制剂类除草剂的品种信息[2]

有效成分	2016年销售额/亿美元	上市年份	开发公司	2011—2016年复合年增长率/%
硝磺草酮	6.50	2001	先正达	+4.0
异噁唑草酮	2.20	1996	拜耳	+5.9
环磺酮	2.10	2007	拜耳	+11.8
苯唑草酮	0.90	2006	巴斯夫	+10.4
pyrasulfotole	0.65	2007	拜耳	+16.7
呋喃磺草酮	<0.30	2008	拜耳	+16.0
磺草酮	<0.30	1990	拜耳	-16.7
氟吡草酮	<0.30	2015	先正达	
吡草酮	<0.30	1990	大冢	+4.6
吡唑特	<0.30	1979	三共	-4.4
双环磺草酮	<0.10	2001	史迪士	-17.4
苄草唑	<0.10	1985	石原	+8.4
tolpyralate		2017	石原	
总计	13.36			+5.5

在HPPD抑制剂类除草剂中,硝磺草酮、异噁唑草酮和环磺酮的销售额均超2.00亿美元。在目前上市的13个主要HPPD抑制剂类除草剂中,有4个产品(环磺酮、苯唑草酮、pyrasulfotole、呋喃磺草酮)2011—2016年的复合年增长率超过10.0%。其中,pyrasulfotole的复合年增长率高达16.7%,这是第1个用于谷物田防除阔叶杂草的HPPD抑制剂类除草剂。

1.2 HPPD抑制剂类除草剂中的重点品种

1.2.1 硝磺草酮(mesotrione)

硝磺草酮(商品名Callisto)是先正达继磺草酮之后开发的第2个三酮类除草剂,2001年上市,是目前选择性除草剂中开发最成功的产品。硝磺草酮具有内吸性,芽前或芽后用于玉米、甘蔗、水稻等作物田,防除一年生阔叶杂草和部分禾本科杂草[4]。

硝磺草酮拥有许多复配产品,配伍品种包括草甘膦、莠去津、精异丙甲草胺、烟嘧磺隆、麦草畏、氟吡草酮等。先正达开创性地将硝磺草酮应用于水稻田,2013年12月,先正达5%硝磺·丙草胺颗粒剂在我国取得登记,用于防除移栽水稻田稗草、部分一年生阔叶杂草及莎草等[5]。

受益于对抗性杂草的防除及新复配产品上市的推动,2016年,硝磺草酮的销售额同比增长6.6%,为6.50亿美元,2011—2016年的复合年增长率为4.0%[2]。其中,用于玉米田的销售额为4.53亿美元[6],占其总市场的69.6%。随着硝磺草酮在玉米、甘蔗、水稻、草坪等领域的广泛使用,其未来市场仍有望取得增长。

1.2.2 环磺酮(tembotrione)

环磺酮是由拜耳开发的三酮类化合物,主要用于玉米田,防除禾本科杂草和阔叶杂草[7]。环磺酮主要防除中、晚期芽后杂草,是对噻酮磺隆的重要补充,而噻酮磺隆主要防除芽后早期禾本科杂草。

2007年,环磺酮与安全剂双苯噁唑酸的复配产品Laudis在美国上市;继而拜耳还在美国上市了环磺酮与噻酮磺隆的复配产品Capreno、环磺酮与麦草畏的复配产品DiFlexx Duo等[8]。环磺酮现已成为美国玉米田最重要的除草剂之一。

2016年,环磺酮的销售额为2.10亿美元,2011—2016年复合年增长率为11.8%[2]。其中,用于玉米田的销售额为1.71亿美元,占其全球市场的81.3%[6]。

1.2.3 氟吡草酮(bicyclopyrone)

氟吡草酮是先正达继磺草酮、硝磺草酮之后成功上市的第3个三酮类除草剂,主要用于玉米、甘蔗、谷物等,防除阔叶杂草及部分禾本科杂草[9]。氟吡草酮种植前、芽前、芽后均可使用,有效成分用药量为50~300 g/hm^2。为了提高安全性,产品中有时加入安全剂解草酯、解草嗪等。

(C)1994-2019 China Academic Journal Electronic Publishing House. All rights reserved. http://www.cnki.net

2015年，氟吡草酮原药及氟吡草酮＋硝磺草酮＋精异丙甲草胺＋莠去津四元复配产品（Acuron）等在美国登记，同年上市。2016年，先正达在美国上市了氟吡草酮＋辛酰溴苯腈（Talinor）和氟吡草酮＋硝磺草酮＋精异丙甲草胺＋解草嗪（Acuron Flexi）；2017年在澳大利亚上市了氟吡草酮＋辛酰溴苯腈＋解草酯等。

Acuron提供3种不同的作用机理，可防除70多种阔叶杂草和一年生禾本科杂草，上市首年实现销售额1.00亿美元，先正达预测其年峰值销售额将突破5.00亿美元。Talinor可防除50多种阔叶杂草，桶混灵活性较好，可与其他多种禾本科杂草除草剂混用，达到禾阔双除的目的[3]。

氟吡草酮尚处于市场开发早期。2016年的销售额为0.20亿美元，同比增长33.3%；其中，用于玉米田的销售额为0.12亿美元，占其总市场的60.0%[6]。

1.3　HPPD抑制剂类除草剂的研发

目前，正在研发的HPPD抑制剂类除草剂主要包括：富美实的F9960，用于玉米、大豆、棉花等作物田，芽前、芽后防除阔叶杂草，具有触杀作用；组合化学的fenquinotrione（开发代号KIH 3653），用于水稻田，芽前或芽后早期使用，防除阔叶杂草和莎草，有效成分用药量为125～250 g/hm^2[3]。

国内企业也开发了多个拥有自主知识产权的HPPD抑制剂类除草剂，如清原农冠的环吡氟草酮、双唑草酮、三唑磺草酮、苯唑氟草酮，华中师范大学的喹草酮和甲基喹草酮。其中，环吡氟草酮和双唑草酮于2018年在我国登记和上市[5]；喹草酮和甲基喹草酮正由山东先达进行产业化开发[10]。

1.4　HPPD抑制剂类除草剂的市场前景

HPPD抑制剂类除草剂具有非常好的市场潜能，据Phillips McDougall预测，2021年，该类产品的销售额将提升至15.35亿美元，2016—2021年的复合年增长率为2.8%（基于2016年汇率，下同）[2]。

2　其他PPO抑制剂类除草剂

PPO即原卟啉原氧化酶，是除草剂的重要靶标。其他PPO抑制剂类除草剂是指除二苯醚类化合物之外，拥有PPO抑制作用的产品。

全球抗性发展缓慢的除草剂主要包括PPO抑制剂类、HPPD抑制剂类等，这些产品在全球抗性问题日益突出的形势下发挥了重要作用，市场取得了较快增长[11]。

2.1　其他PPO抑制剂类除草剂的全球市场

2016年，其他PPO抑制剂类除草剂的销售额为10.65亿美元，同比下降6.6%，占全球除草剂销售额的4.6%，占全球农药市场的1.9%[2]。2009—2016年，该类除草剂的复合年增长率为16.1%，在18类除草剂中增长最快。

目前上市的其他PPO抑制剂类除草剂主要有13个，其中，2011—2016年复合年增长率跑赢该类产品总体市场的有丙炔氟草胺（＋19.3%）、苯嘧磺草胺（＋23.8%）。其他PPO抑制剂类除草剂销售等情况见表2。

表 2　其他 PPO 抑制剂类除草剂的产品信息[2]

有效成分	2016年销售额/亿美元	上市年份	开发公司	2011—2016 年复合年增长率/%
丙炔氟草胺	3.50	1993	住友	＋19.3
甲磺草胺	2.10	1996	富美实	＋7.7
苯嘧磺草胺	1.60	2009	巴斯夫	＋23.8
唑草酮	1.30	1997	富美实	＋7.6
双唑草腈	0.80	2009	Kyoyu Agri	0
噁草酮	0.50	1969	拜耳	＋4.6
环戊噁草酮	＜0.30	1998	日本科研制药	-9.7
吡草醚	＜0.30	1999	日本农药	0
嗪草酸甲酯	＜0.30	1999	富美实	-5.6
丙炔噁草酮	＜0.10	1996	拜耳	-16.7
氟烯草酸	＜0.10	1994	住友	0
氟丙嘧草酯	＜0.10	2001	先正达	-21.4
吲哚酮草酯	＜0.10	1999	巴斯夫	-12.9
总计	10.65			＋9.1

2.2　其他PPO抑制剂类除草剂中的重点品种

2.2.1　丙炔氟草胺（flumioxazin）

丙炔氟草胺（商品名Sumisoya）是其他PPO抑制剂类除草剂中的领军产品。其主要用于大豆、甘蔗、棉花、玉米、谷物、花生、果蔬等，防除禾本科杂草和阔叶杂草；种植前或芽前施药，有效成分用药量为50～100 g/hm^2。

1993年，丙炔氟草胺由住友化学首先上市，目前已在全球绝大多数主要市场销售，并上市了许多复配产品，其中包括其分别与氯酯磺草胺、草铵膦、砜吡草唑等的复配。

许多公司参与丙炔氟草胺的市场开发，如杜邦、孟山都等。杜邦上市了丙炔氟草胺与噻吩磺隆、氯嘧磺隆（或苯磺隆）的三元复配产品等。

2015年，纽发姆在美国上市了丙炔氟草胺的第1个液体制剂Panther SC[11]。目前，丙炔氟草胺在我国

(C)1994-2019 China Academic Journal Electronic Publishing House. All rights reserved.　http://www.cnki.net

登记的制剂剂型皆为可湿性粉剂[5]。

近年来，丙炔氟草胺的市场增长主要受益于复配产品的开发、对草甘膦抗性杂草的防除等。2016年，其全球销售额为3.50亿美元，2011—2016年的复合年增长率为19.3%[2]。其中，用于大豆上的销售额为1.00亿美元，占其总市场的28.5%[6]。

2.2.2 苯嘧磺草胺（saflufenacil）

苯嘧磺草胺（商品名Kixor）2009年由巴斯夫上市，用于大豆、玉米、谷物、甘蔗、果蔬、水稻、棉花等许多作物，防除阔叶杂草[7]；种植前或芽前施药，有效成分用药量为18～125 g/hm^2。

2009年，巴斯夫在美国登记了基于苯嘧磺草胺的4个制剂产品。其中，2个复配产品的配伍品种分别为：咪唑乙烟酸、精二甲吩草胺。2014年，苯嘧磺草胺在加拿大作为脱叶剂登记，用于豌豆、干豆、向日葵、大豆等。2017年，基于苯嘧磺草胺的产品Detail在加拿大登记，用于非作物领域[11]。

2016年，苯嘧磺草胺的销售额为1.60亿美元，2011—2016年的复合年增长率为23.8%，在其他PPO抑制剂类除草剂中增长最快[2]。其中，用于大豆上的销售额为0.42亿美元，占其总市场的26.0%[6]。

2.3 其他PPO抑制剂类除草剂的研发

目前，正在研发的其他PPO抑制剂类除草剂主要包括巴斯夫的trifludimoxazin、沈阳中化的SYP-3356等。其中，SYP-3356代表了禾本科杂草和阔叶杂草防除的新水准[12]。

Trifludimoxazin既为PPO抑制剂，又能防除PPO抗性杂草。其高效、速效，提供触杀和持效作用，施药后1 d内便产生叶部效果，是20年来首个通过叶面触杀防除禾本科杂草的具有新颖作用机理的除草剂。该品种主要用于谷物、玉米、大豆等多种作物，以及油棕榈、果树、坚果树等，防除禾本科杂草和阔叶杂草[13]。

从化学结构来看，trifludimoxazin和丙炔氟草胺相似度较高。或许可以认为，丙炔氟草胺即为巴斯夫创制trifludimoxazin的先导化合物。

巴斯夫已向澳大利亚申请登记trifludimoxazin（商品名Tirexor），预计将于2020年上市。

2.4 其他PPO抑制剂类除草剂的市场前景

其他PPO抑制剂类除草剂未来几年仍将取得增长，据Phillips McDougall预测，2021年，该类除草剂的销售额将增长到12.67亿美元，2016—2021年复合年增长率为3.5%[2]。

3 双酰胺类杀虫剂

目前上市的双酰胺类杀虫剂主要有：氟苯虫酰胺、氯虫苯甲酰胺、溴氰虫酰胺、四氯虫酰胺、环溴虫酰胺等。双酰胺类杀虫剂主要作用于鱼尼丁受体，如氯虫苯甲酰胺、氟苯虫酰胺、溴氰虫酰胺、四氯虫酰胺等；但也有其他作用机理的化合物，如溴虫氟苯双酰胺。

近年来，双酰胺类杀虫剂市场增长迅猛，年销售额已接近20亿美元[14]。

3.1 双酰胺类杀虫剂中的重要品种

3.1.1 氯虫苯甲酰胺（chlorantraniliprole）

氯虫苯甲酰胺（商品名Rynaxypyr）由杜邦开发，2008年上市，现已在100多个国家销售。其高效、广谱、持效，具有内吸、胃毒、触杀和渗透作用，可防治大多数咀嚼式口器害虫，尤其对鳞翅目害虫有很好的防效。氯虫苯甲酰胺主要用于大豆、果蔬、水稻、棉花、玉米、谷物、马铃薯、甘蔗等[15]，有效成分用药量为35～50 g/hm^2。

根据授权协议，先正达可以开发氯虫苯甲酰胺的复配产品，并获得了该产品用于草坪和白蚁防治的权利。为此，先正达上市了氯虫苯甲酰胺分别与高效氯氟氰菊酯、噻虫嗪、阿维菌素等的复配产品。

2017年，因陶氏化学与杜邦合并的需要，杜邦的氯虫苯甲酰胺和溴氰虫酰胺等剥离给了富美实。富美实接手氯虫苯甲酰胺后，在中国提出了“康宽早用”技术，进一步提高防效，保护天敌。

2016年，氯虫苯甲酰胺的销售额为13.65亿美元，2011—2016年的复合年增长率为15.1%[2]。其中，用于大豆上的销售额为3.51亿美元，占其全球市场的25.7%[6]。

3.1.2 溴氰虫酰胺（cyantraniliprole）

溴氰虫酰胺是由杜邦开发的第1个具有交叉防治谱的双酰胺类化合物，具有内吸、渗透和传导作用，可同时防治咀嚼式和刺吸式口器害虫，包括鳞翅目、半翅目、鞘翅目和双翅目害虫等。其主要用于大豆、油菜、果蔬、水稻、玉米、棉花、马铃薯等[15]，叶面喷雾、种子处理或土壤处理均可，有效成分用药量为10～100 g/hm^2。

2008年，杜邦与先正达达成协议。根据协议，先正达获得了杜邦关于溴氰虫酰胺用于复配产品的独家授权，并可开发一些非农用市场等。

2012年，溴氰虫酰胺上市。通过不断授权和合

(C)1994-2019 China Academic Journal Electronic Publishing House. All rights reserved. http://www.cnki.net

作，拜耳、组合化学、住友化学和日本曹达等也都参与到该品种的市场开发中。开发的产品不仅包括单剂，还包括其分别与异噻菌胺、啶虫脒、噻虫嗪等的复配产品[14]。

由于溴氰虫酰胺不断取得新的登记，其销售额持续增长。2016年的销售额为0.80亿美元，同比增长77.8%[2]。其中，用于大豆上的销售额为0.34亿美元，占其总市场的42.1%[6]。

3.2　双酰胺类杀虫剂的研发

目前正在研发的双酰胺类杀虫剂主要包括：拜耳的tetraniliprol，巴斯夫和三井化学开发的溴虫氟苯双酰胺等。

Tetraniliprol，开发代号BCS-CL73507，商品名Vayego，主要用于果蔬、水稻、玉米、马铃薯及其他大田作物、园艺作物等，防治鳞翅目、鞘翅目、双翅目害虫等。其可用于叶面处理、种子处理或土壤处理。拜耳已经向新西兰提交了登记申请，美国环保署计划于2019年3月对其做出登记决定[16]。

溴虫氟苯双酰胺，通用名broflanilide，开发代号MCI-8007，是由三井化学发现的间二酰胺类杀虫剂，由三井化学和巴斯夫共同开发。它是γ-氨基丁酸（GABA）门控氯离子通道别构调节剂。国际杀虫剂抗性行动委员会（IRAC）将其归为第30组，它是目前该组中唯一的化合物[17]。

溴虫氟苯双酰胺主要用于果蔬、大豆、棉花、水稻、玉米、谷物等大田作物和特种作物，防治咀嚼式口器害虫（包括鳞翅目、鞘翅目害虫）。它对斜纹夜蛾的杀幼虫活性很高；可有效防治抗性害虫；也将用于种子处理，防治金针虫等；并可用于专用害虫防治领域，防治蚂蚁、白蚁、苍蝇和蟑螂等。叶面处理和种子处理均可[15]。

巴斯夫已经向美国、加拿大、墨西哥、澳大利亚、印度等国申请登记溴虫氟苯双酰胺，2020年或将上市。

3.3　双酰胺类杀虫剂的市场展望

据Phillips McDougall预测，双酰胺类杀虫剂仍将领涨杀虫剂市场，其2016—2021年的复合年增长率将大于5.8%。

4　烟碱乙酰胆碱受体作用剂

新烟碱类杀虫剂在将自己缔造成为全球第一大类杀虫剂的同时，又承受着来自以欧盟为首的多个国家和地区的禁限用风潮。

20世纪90年代以来，新烟碱类杀虫剂得到了快速发展，是目前防治粉虱、飞虱、蚜虫等刺吸式口器害虫最有效的一类药剂，同时也是抗性治理领域的重要工具。

烟碱乙酰胆碱受体（nAChR）是杀虫剂的重要靶标，新烟碱类杀虫剂多为nAChR激动剂。

1991年，第1个新烟碱类杀虫剂吡虫啉上市，开创了杀虫剂发展的新纪元，并一路领跑市场。8年后的1999年，噻虫嗪进入市场，两产品共同创造了新烟碱类杀虫剂的辉煌。2011年，噻虫嗪超越了吡虫啉，并一直以微弱优势领军市场。

然而，近年来，新烟碱类杀虫剂被“高蜂毒”纠缠不清，尤其在欧洲地区，禁限用管理措施接连出台。

针对烟碱乙酰胆碱受体这一重要靶标，开发低蜂毒的产品，成为农药行业迫切研究的新课题。陶氏益农的氟啶虫胺腈、拜耳的氟吡呋喃酮、杜邦的三氟苯嘧啶先后上市，它们对蜜蜂的毒性显著低于新烟碱类杀虫剂中的龙头产品。

一方面，噻虫嗪和吡虫啉等“高蜂毒”产品统领市场，另一方面，氟啶虫胺腈、氟吡呋喃酮、三氟苯嘧啶等先后加盟。烟碱乙酰胆碱受体作用剂在市场需求和高蜂毒的博弈中负重前行[18]。

4.1　新烟碱类杀虫剂的全球市场

2016年，新烟碱类杀虫剂的销售额为30.00亿美元，同比下降0.3%，占164.59亿美元杀虫剂销售额的18.2%，占全球农药市场的5.3%[2]。2009—2016年，该类杀虫剂的复合年增长率为3.2%。

目前上市的新烟碱类杀虫剂主要有7个，其中前六大品种的销售额均超1.00亿美元，噻虫嗪和吡虫啉更是突破了10.00亿美元。新烟碱类杀虫剂的产品信息见表3。

表 3　新烟碱类杀虫剂的产品信息[2]

有效成分	2016年销售额/亿美元	上市年份	开发公司	2011—2016 年复合年增长率/%
噻虫嗪	10.60	1999	先正达	-0.2
吡虫啉	10.20	1991	拜耳	0
噻虫胺	3.80	2002	拜耳、住友	-1.3
啶虫脒	2.50	1996	日本曹达	＋4.0
噻虫啉	1.50	2000	拜耳	＋6.0
呋虫胺	1.05	2002	三井化学	0
烯啶虫胺	0.35	1995	住友	＋23.9
合计	30.00			＋0.5

近年来，新烟碱类杀虫剂市场总体维稳，但有一些品种增长良好，2011—2016年复合年增长率跑赢该类产品（＋0.5%）的有啶虫脒（＋4.0%）、噻虫啉（＋6.0%）、烯啶虫胺（＋23.9%）等。在中国水稻上的

(C)1994-2019 China Academic Journal Electronic Publishing House. All rights reserved.　http://www.cnki.net

使用增加，对烯啶虫胺的市场增长贡献最大。

4.2 新烟碱类杀虫剂的研发

目前正在研发的新烟碱类杀虫剂主要有明治制果的flupyrimin（开发代号ME5382）。该品种主要用于水稻，防治稻飞虱和螟虫等，并能防治对现有杀虫剂（包括吡虫啉等）产生抗性的害虫，而且对传粉昆虫安全性较高，对蜜蜂毒性较低。该品种已在日本申请登记，预计将于2019年上市[18]。

4.3 新烟碱类杀虫剂的禁限用

新烟碱类杀虫剂可能会引起蜂群崩溃症，并有神经毒性，可能导致智力障碍等。因此，全球多个国家或地区对新烟碱类杀虫剂采取了禁限用措施[19]。

从2013年12月1日起，欧盟对吡虫啉、噻虫嗪和噻虫胺实施限用政策。2018年4月，欧盟成员国通过投票表决，禁止噻虫嗪、吡虫啉、噻虫胺在户外使用，仅限用于永久性温室。

作为欧盟第一大农业国，法国对新烟碱类杀虫剂的管控更加严苛。法国自2018年9月1日起，禁止销售与使用噻虫胺、吡虫啉、噻虫嗪、噻虫啉、啶虫脒等5种新烟碱类杀虫剂。

在巴西，新烟碱类杀虫剂在棉花花期的叶面应用已遭到禁止；在加拿大的部分地区，新烟碱类杀虫剂也遭到限用；我国正在开展新烟碱类杀虫剂对蜜蜂慢性和迷向影响的试验研究，以评估该类产品对蜜蜂的风险。

由表4可见，噻虫嗪、吡虫啉、噻虫胺、呋虫胺和烯啶虫胺皆对蜜蜂高毒，噻虫啉对蜜蜂低毒，啶虫脒对蜜蜂的毒性比噻虫啉稍高。新上市的3个烟碱乙酰胆碱受体作用剂对蜜蜂的毒性虽然比噻虫嗪低很多，但其中的氟啶虫胺腈和三氟苯嘧啶仍对蜜蜂高毒，而氟吡呋喃酮对蜜蜂的毒性很低[18]。

表 4 烟碱乙酰胆碱受体作用剂对蜜蜂的毒性及在欧盟的登记情况[19-21]

有效成分	LD_{50}值/(μg·蜂$^{-1}$)		毒性	在欧盟的登记情况（有效期截止时间）
	经口	接触		
噻虫嗪	0.005	0.024	高毒	登记（2019-04-30）
吡虫啉	0.005～0.070	0.024	高毒	登记（2022-07-31）
噻虫胺	0.004	＞0.044	高毒	登记（2019-01-31）
啶虫脒	14.500	8.100	低毒～中等毒	登记（2033-02-28）
噻虫啉	17.320	38.830	低毒	登记（2019-04-30）
呋虫胺	0.023	0.047	高毒	未登记
烯啶虫胺	0.138		高毒	未登记
氟啶虫胺腈	0.146	0.379	高毒	登记（2025-08-18）
氟吡呋喃酮	1.200	＞200		登记（2025-12-09）
三氟苯嘧啶	0.510	0.390	高毒	未登记

4.4 3个新的烟碱乙酰胆碱受体作用剂

氟啶虫胺腈、氟吡呋喃酮、三氟苯嘧啶虽都作用于烟碱乙酰胆碱受体，但都与新烟碱类杀虫剂分在不同的亚组。

IRAC将烟碱乙酰胆碱受体作用剂归为第4组，组内共有11个化合物，分属于5个亚组。4A亚组包括：啶虫脒、噻虫胺、呋虫胺、吡虫啉、烯啶虫胺、噻虫啉和噻虫嗪；4B亚组：烟碱；4C亚组：氟啶虫胺腈；4D亚组：氟吡呋喃酮；4E亚组：三氟苯嘧啶[17]。

4.4.1 氟啶虫胺腈（sulfoxaflor）

氟啶虫胺腈是由陶氏益农研发的亚砜亚胺类杀虫剂中的第1个化合物，为nAChR激动剂，但与新烟碱类等杀虫剂无交互抗性。

氟啶虫胺腈广谱、高效、速效，持效期长，提供胃毒和触杀作用，并拥有内吸传导性和渗透作用。其用于谷物、棉花、马铃薯、玉米、水稻、大豆、果树、蔬菜、梨果、油菜、葡萄、草坪和观赏植物等，防治同翅目、半翅目等害虫，如蚜虫、蓟马、飞虱、粉虱、木虱、叶蝉、介壳虫、盲蝽蟓等。有效成分用药量为12～150 g/hm^2[18]。

氟啶虫胺腈于2012年上市，目前已在40多个国家登记和上市，包括韩国、巴拿马、印度尼西亚、危地马拉、中国、美国、加拿大、澳大利亚、越南、新西兰等。

2016年，氟啶虫胺腈的销售额为1.05亿美元[2]，同比增长31.3%。陶氏杜邦预计，氟啶虫胺腈的年峰值销售额将突破4.00亿美元。

4.4.2 氟吡呋喃酮（flupyradifurone）

在新烟碱类杀虫剂开发中，拜耳的参与度最高。为了解决该类杀虫剂对蜜蜂的毒性问题，拜耳开发了对蜜蜂安全的新型丁烯酸内酯类化合物——氟吡呋喃酮。

氟吡呋喃酮也为nAChR激动剂，但与新烟碱类杀虫剂几乎没有或没有交互抗性。其高效、速效、持效，具有内吸、触杀、胃毒和渗透作用，对环境友好，毒性低。其主要用于蔬菜、马铃薯、番茄、黄瓜、西瓜、果树、咖啡、可可、棉花、大豆等，防治刺吸式口器害虫，如蚜虫、粉虱、木虱、叶蝉、介壳虫、甲虫、潜叶蝇、粉蚧、软蚧、柑橘木虱、象甲和蓟马等。有效成分用药量为50～200 g/hm^2[18]。

长期以来，拜耳对基于氟吡呋喃酮的产品进行了广泛的试验，使用了高度吸引蜜蜂的作物作为供试作物。结果表明，氟吡呋喃酮对蜜蜂低毒。它是所有11个烟碱乙酰胆碱受体作用剂中，对蜜蜂接触毒

(C)1994-2019 China Academic Journal Electronic Publishing House. All rights reserved. http://www.cnki.net

性（LD_{50}值＞200 μg/蜂）最低的化合物[21]。

2014年，氟吡呋喃酮上市。目前登记和上市的国家主要包括：洪都拉斯、危地马拉、多米尼加、哥斯达黎加、美国、墨西哥、尼加拉瓜、加拿大、澳大利亚、中国等。

氟吡呋喃酮尚处于市场开发的早期阶段，2016年的销售额为500万美元[2]。

4.4.3　三氟苯嘧啶（triflumezopyrim）

三氟苯嘧啶是杜邦历时10年研发、专为亚太地区打造的新型介离子类杀虫剂。在所有烟碱乙酰胆碱受体作用剂中，三氟苯嘧啶是唯一一个抑制剂，而非激活剂。其广谱、高效、内吸、渗透、持效，用量低，适用于水稻、棉花、玉米和大豆等，防治同翅目、鳞翅目等害虫。叶面喷雾、土壤处理均可[18]。

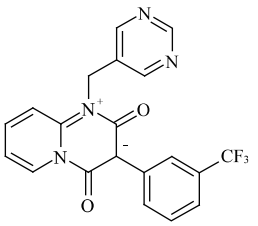

图 1　三氟苯嘧啶的结构式

陶氏杜邦首先将三氟苯嘧啶开发用于水稻，防治飞虱、叶蝉等。该产品对各种稻飞虱都有较好的防效，能高效持久防治若虫和成虫，持效期比同类产品长7～10 d。

三氟苯嘧啶对环境友好，微毒、低残留，对蜘蛛、寄生蜂、黑肩绿盲蝽等天敌影响极小，对传粉昆虫无不利影响。

2017年1月7日，杜邦96%三氟苯嘧啶原药和10%三氟苯嘧啶悬浮剂（商品名佰靓珑）在我国获准登记；2018年8月21日，诺普信等3家国内企业登记了基于三氟苯嘧啶的3个复配产品[5]。

陶氏杜邦已向全球主要水稻种植国申请登记三氟苯嘧啶，目前已在印度、中国、新加坡、菲律宾等国取得登记，美国即将作出登记决定；未来，三氟苯嘧啶还将靶标马来西亚、印度尼西亚、日本、越南、泰国、韩国和我国台湾等市场[18]。

三氟苯嘧啶尚处于市场开发早期，2016年的销售额为100万美元[2]。陶氏杜邦预计，三氟苯嘧啶的年峰值销售额将突破1.50亿美元。

4.5　新烟碱类杀虫剂的市场前景

据Phillips McDougall预测，新烟碱类杀虫剂市场中期或将保持稳定，2021年的销售额预计为30.21亿美元，2016—2021年的复合年增长率为0.1%[2]。

5　SDHI类杀菌剂

琥珀酸脱氢酶抑制剂（SDHI）类杀菌剂热度不减。巴斯夫的氟唑菌酰胺连续2年高居榜首；先正达的苯并烯氟菌唑以超过30%的增长率逼近啶酰菌胺；最新上市的氟唑菌酰羟胺更是引发全球关注。

2011—2017年，共有7个SDHI类杀菌剂上市，还有5个吡唑酰胺结构的杀菌剂正在开发。这些产品将成为推动SDHI类杀菌剂进一步增长的新生力量。

5.1　SDHI类杀菌剂的全球市场

2016年，SDHI类杀菌剂的销售额为16.91亿美元，同比增长7.3%，占152.68亿美元杀菌剂市场的11.1%，占全球农药市场的3.0%[2]。2009—2016年，SDHI类杀菌剂的复合年增长率高达22.4%，7年间市场增长了3倍有余（＋310.4%）。

在SDHI类杀菌剂中，最新上市的品种市场增长更快。然而，因为它们往往在2011年之后上市，所以还无法计算其2011—2016年的复合年增长率。即便如此，仍有多个产品展示了非常高的复合年增长率，如联苯吡菌胺（＋23.2%）、氟唑环菌胺（＋67.0%）、吡噻菌胺（＋40.4%）、吡唑萘菌胺（＋32.0%）等。表5列出SDHI类杀菌剂主要品种信息。

表 5　SDHI 类杀菌剂的品种信息[2]

有效成分	2016年销售额/亿美元	上市年份	开发公司	2011—2016年复合年增长率/%
氟唑菌酰胺	4.10	2012	巴斯夫	
啶酰菌胺	3.30	2003	巴斯夫	-0.6
苯并烯氟菌唑	3.00	2013	先正达	
联苯吡菌胺	1.70	2010	拜耳	＋23.2
氟唑菌苯胺	1.50	2012	拜耳	
氟吡菌酰胺	0.65	2012	拜耳	
氟唑环菌胺	0.65	2011	先正达	＋67.0
吡噻菌胺	0.60	2009	三井化学、杜邦	＋40.4
萎锈灵	0.50	1966	爱利思达、拜耳	-7.8
吡唑萘菌胺	0.40	2010	先正达	＋32.0
氟酰胺	＜0.30	1984	日本农药	-4.4
噻呋酰胺	＜0.30	1997	日产	-15.0
呋吡菌胺	＜0.10	1997	住友化学	＋9.9
灭锈胺	＜0.10	1980	组合	-16.7
异丙噻菌胺	＜0.10	2014	石原产业	
氟唑菌酰羟胺		2017	先正达	
总计	16.91			＋23.8

5.2　SDHI类杀菌剂中的重点品种

5.2.1　氟唑菌酰胺（fluxapyroxad）

2015年，氟唑菌酰胺（商品名Xemium）取代啶酰菌胺，成为SDHI类杀菌剂中的领军产品。氟唑菌酰

(C)1994-2019 China Academic Journal Electronic Publishing House. All rights reserved.　http://www.cnki.net

胺高效、广谱、持效、选择性强，具有优异的内吸传导性，预防和治疗作用兼备。其主要用于谷物、大豆、玉米、棉花、油菜、果树、蔬菜、甜菜、花生、草坪和特种作物等，防治由壳针孢菌、灰葡萄孢菌、丝核菌、白粉菌、柄锈菌、尾孢菌、核腔菌等引起的病害。有效成分用药量为100～200 g/hm²[22]。

在氟唑菌酰胺上市的多个复配产品中，配伍品种包括：氟环唑、吡唑醚菌酯、苯醚甲环唑、氟环唑＋吡唑醚菌酯、吡唑醚菌酯＋甲霜灵等。

2012年，氟唑菌酰胺上市。巴斯夫计划将其引入世界上70多个国家，用于100多种作物。氟唑菌酰胺现已在绝大多数主要市场取得登记和上市。

氟唑菌酰胺上市以来，销售额逐年递增，2016年增至4.10亿美元，2012—2016年的复合年增长率为44.1%[2]。其中，谷物和大豆市场分别占其总市场的50.1%和31.3%。巴斯夫预测氟唑菌酰胺的年峰值销售额将达6.00亿欧元。

5.2.2 苯并烯氟菌唑（benzovindiflupyr）

苯并烯氟菌唑（商品名Solatenol）由先正达研发，是SDHI类杀菌剂中最重要的产品之一。其广谱、高效、持效，主要用于大豆、棉花、谷物、玉米等，防治叶面病害和土壤病原菌，尤其对小麦叶枯病、全蚀病、基腐病、白粉病，花生黑斑病，玉米小斑病、灰霉病，大豆亚洲锈病等防效突出[22]。

2013年，苯并烯氟菌唑上市；2014年，先正达在巴西登记和上市了Elatus（苯并烯氟菌唑＋嘧菌酯），主要用于大豆。Elatus上市首年，销售额即突破4.00亿美元，年峰值销售额将超10.00亿美元。先正达还开发了苯并烯氟菌唑与丙硫菌唑的复配产品等。

2016年，苯并烯氟菌唑的全球销售额为3.00亿美元，同比增长30.4%[2]。其中，用于大豆上的销售额为2.15亿美元，占其总市场的71.7%[6]。

5.2.3 氟唑菌酰羟胺（pydiflumetofen）

氟唑菌酰羟胺（商品名Adepidyn）是先正达继吡唑萘菌胺、氟唑环菌胺、苯并烯氟菌唑之后上市的第4个SDHI类杀菌剂。其高效、广谱，适用于谷物、玉米、大豆、油菜、蔬菜、果树、特种作物、草坪、观赏植物等，防治镰刀菌、尾孢菌、葡萄孢菌、链格孢菌等许多病原菌引起的病害；有效成分用药量为30～200 g/hm²[9]。

据先正达介绍，氟唑菌酰羟胺对多种作物上叶斑病（如褐斑病、黑斑病和黑星病等）和白粉病防效卓越。其还能高效防治多种难治病害，如赤霉病、灰霉病、菌核病和靶斑病等。

2017年，氟唑菌酰羟胺在阿根廷首先上市。2018年5月23日，先正达基于氟唑菌酰羟胺的17个产品在美国取得登记[23]；其系列产品也已在加拿大获准登记。氟唑菌酰羟胺在欧盟的登记仍悬而未决；在中国已开展登记试验。

先正达亦已向美国、加拿大、澳大利亚等国申请登记基于氟唑菌酰羟胺的杀菌种子处理剂Saltro。该产品对油菜黑胫病、大豆猝死综合症、水稻恶苗病等均有卓越防效[15]。

先正达预测，氟唑菌酰羟胺的年峰值销售额将突破7.50亿美元。它是SDHI类杀菌剂中最具市场价值的产品之一。

5.3 SDHI类杀菌剂的研发

目前正在开发的SDHI类杀菌剂主要有意赛格和富美实共同开发的fluindapyr（开发代号IR9792、F9990）等。该品种主要用于谷物、大豆、水稻、坚果树、油菜、玉米和葡萄等，有效成分用药量为60 g/hm²。预计将于2020年上市[22]。

另外，pyraziflumid（开发代号NNF-0721，日本农药）、pyrapropoyne（开发代号NC-241、A1664，日产化学）、isoflucypram（开发代号BCS-CN88460，拜耳）和inpyrfluxam（开发代号S-2399，住友化学）均在研发中[22]。它们的分子中都含有吡唑酰胺基团，作用机理可能与SDHI类杀菌剂一样，这一点还有待进一步证实。

5.4 SDHI类杀菌剂的市场前景

近年来，SDHI类杀菌剂市场大幅增长，引发全球高度聚焦。未来几年，该类产品仍具备大幅增长的潜力。据Phillips McDougall预测，2021年，SDHI类杀菌剂的销售额将达21.44亿美元，2016—2021年的复合年增长率为4.9%[2]。

6 结束语

“热点产品”远远不是文中五大类产品所能涵盖的，像三唑类杀菌剂氯氟醚菌酯（mefentrifluconazole，商品名Revyso）、拥有“奇葩”化学结构的全新卵菌纲杀菌剂氟噻唑吡乙酮（oxathiapiprolin）、合成激素类除草剂氯氟吡啶酯（florpyrauxifen）、生物源杀虫剂双丙环虫酯（afidopyropen）、全新化学结构的杀线虫剂tioxazafen（商品名NemaStrike）、在中国市场很受欢迎的杀螨剂乙唑螨腈（商品名宝卓）等，这些产品也备受市场关注。总之，独具特征的这些产品的上市，将提升市场活力，激发市场潜能，为农药市场打造新的增长极。

(C)1994-2019 China Academic Journal Electronic Publishing House. All rights reserved. http://www.cnki.net

参考文献

[1] Rana S. Global Crop Protection Market Up 3% in 2017 [J]. Agrow weekly briefing, 2018 (28): 1-2.

[2] Phillips McDougall. AgriService Products Section—2016 Market [R]. Phillips McDougall, 2017.

[3] 柏亚罗. 新产品持续上市/抗性发展缓慢，HPPD抑制剂类除草剂实现较快增长 [J/OL]. [2018-9-11]. http://www.agroinfo.com.cn/other_detail_5779.html.

[4] 柏亚罗, 陈燕玲. 除草剂硝磺草酮的应用与开发进展 [J]. 现代农药, 2016, 15 (2): 42-47.

[5] 农业农村部农药检定所. 中国农药信息网 [DB/OL]. [2018-08-01]. http://www.chinapesticide.org.cn/hysj/index.jhtml.

[6] Phillips McDougall. Search by Active Ingredient Data 2016 [DB/OL]. [2018-09-11]. http://www.agraspire.com/searchByProduct.asp.

[7] Tomlin C D S. The e-Pesticide Manual [DB/CD]. 16th ed. Brighton: British Crop Production Council, 2011.

[8] 顾林玲, 汪徐生. 除草剂环磺酮应用研究与开发进展 [J]. 现代农药, 2017, 16 (5): 40-44.

[9] 顾林玲, 柏亚罗. 极具发展潜力的十大农药新品种的应用与开发 [J]. 现代农药, 2018, 17 (2): 6.

[10] 杨光富. 绿色农药分子设计与5个成果转让的创制新品种 [J/OL]. [2018-08-20]. http://www.agroinfo.com.cn/other_detail_3705.html.

[11] 柏亚罗. 丙炔氟草胺领军“其他PPO抑制剂类除草剂”，巴斯夫新产品为20年首创 [J/OL]. [2018-09-20]. http://www.agroinfo.com.cn/other_detail_5816.html.

[12] 刘长令. 农药行业产学研联合实现创新发展的思考和体会 [J/OL]. [2018-08-24]. http://www.agroinfo.com.cn/other_detail_4884.html.

[13] 柏亚罗. 巴斯夫两个全新除草剂拟将上市——化学结构独特，作用机理新颖 [J/OL]. [2018-08-25]. http://www.agroinfo.com.cn/news_detail_10794.html.

[14] 柏亚罗. 氯虫苯甲酰胺等双酰胺类杀虫剂市值接近20亿美元 [J/OL]. [2018-08-27]. http://www.agroinfo.com.cn/other_detail_5567.html.

[15] 顾安乐, 柏亚罗. 水稻用农药市场概况、产品开发及重点品种（II） [J]. 现代农药, 2018, 17 (6): 1-6.

[16] Birkett R. Bayer Outlines Post-Monsanto Acquisition Vision [J]. Agrow Weekly Briefing, 2018 (41): 2.

[17] IRAC International MoA Working Group. IRAC Mode of Action Classification Scheme [DB/OL]. [2018-10-10]. http://www.irac-online.org/documents/moa-classification/?ext=pdf.

[18] 柏亚罗. 噻虫嗪领军市场，三氟苯嘧啶重磅加盟——烟碱乙酰胆碱受体作用剂负重前行 [J/OL]. [2018-09-30]. http://www.agroinfo.com.cn/other_detail_5857.html.

[19] 柏亚罗. 噻虫啉, 受命于危难之时 [J]. 农药快讯, 2014 (24): 28-29.

[20] European Commission. EU Pesticides Database [EB/OL]. [2018-09-12]. http://ec.europa.eu/food/plant/pesticides/eu-pesticides-database/public/?event=activesubstance.selection&language=EN.

[21] 朱亚娟, 顾林玲. 作用于烟碱乙酰胆碱受体的杀虫剂新品种的应用开发进展 [J]. 现代农药, 2018, 17 (4): 1-5.

[22] 柏亚罗. SDHI类杀菌剂续写“牛市”，研发管道后继“有人” [J]. 农药快讯, 2018 (4): 40-44.

[23] EPA. Chemical Name: Pydiflumetofen [DB/OL]. [2018-09-30]. https://iaspub.epa.gov/apex/pesticides/f?p=113:6:::NO::P6_XCHEMICAL_ID:29191.

（责任编辑：陈晨）

欧盟延长 42 个有效成分登记期限

由于欧盟再评审进展缓慢，欧盟对42个农药有效成分的登记期限将延长1年。杀菌剂氟啶胺（fluazinam）、氟酰胺（flutolani），除草剂乙丁氟灵（benfluralin），植物生长调节剂甲哌鎓（mepiqua）的登记期限将延长至2020年2月29日。杀菌剂嘧菌环胺（cyprodini）、氟环唑（epoxiconazole）、三乙膦酸铝（fosetyl-aluminium）、嘧菌胺（mepanipyrim）、叶菌唑（metconazole）、苯菌酮（metrafenone）、嘧霉胺（pyrimethani）、甲基立枯磷（tolclofos-methy）、灭菌唑（triticonazole）、福美锌（ziram），除草剂炔草酯（clodinafop-propargy）、二氯吡啶酸（clopyralid）、精2,4-滴丙酸（dichlorprop-P）、砜嘧磺隆（rimsulfuron）、三氯吡氧乙酸（triclopyr），杀虫剂抗蚜威（pirimicarb）、多杀霉素（spinosad）、噻虫啉（thiacloprid），杀虫/杀螨剂阿维菌素（abamectin），杀螨剂唑螨酯（fenpyroximate），植物生长调节剂抗倒酯（trinexapac）的登记期限将延长至2020年4月30日。

登记期限同样延长至2020年4月30日的生物农药有：生物杀菌剂枯草芽孢杆菌QST 713（*Bacillus subtilis* strain QST 713）、大隔孢伏革菌（*Phlebiopsis gigantea*）、绿假单胞杆菌MA 342（*Pseudomonas chlororaphis* strain MA 342）、寡雄腐霉菌（*Pythium oligandrum*）、链霉菌K61（*Streptomyces* K61）、棘孢木霉（*Trichoderma asperellum*）、深绿木霉（*Trichoderma atroviride*）、盖姆斯木霉（*Trichoderma gamsii*）、哈茨木霉（*Trichoderma harzianum*）、黑白轮枝菌（*Verticillium alboatrum*）；生物杀虫剂苏云金杆菌亚种（*B thuringiensis* subsp *aizawai*）、苏云金杆菌以色列变种（*B thuringiensis* subsp *israeliensis*）、苏云金杆菌库斯塔变种（*B thuringiensis* subsp *kurstaki*）、球孢白僵菌（*Beauveria bassiana*）、苹果蠹蛾颗粒体病毒（*Cydia pomonella* granulovirus）、蝇蛆疥霉（*Lecanicillium muscarium*）；生物杀虫/杀螨剂金龟子绿僵菌（*Metarhizium anisopliae*）。

2018年12月，欧盟成员国投票通过延期决定，该决定将在欧盟官方发布公告后生效。（王晓岚译自《AGROW》）

(C)1994-2019 China Academic Journal Electronic Publishing House. All rights reserved. http://www.cnki.net