

◆ 综述与专论 ◆

# 小麦赤霉病防治药剂研究进展

董吉卫, 黄敏, 宋浩

(沭阳县植物保护站, 江苏宿迁 223600)

**摘要:**小麦赤霉病是造成小麦减产、品质下降且极具破坏性的病害之一。本文简要介绍了防治小麦赤霉病的现有药剂,如三唑类、苯并咪唑类、丙烯酸酯类等,并对戊唑醇、氟唑菌酯、多菌灵等常用品种的防效、抗性、对DON毒素防效等以及文献报道的部分活性化合物结构进行综述,为小麦赤霉病的防治工作和新农药研发提供参考。

**关键词:**小麦;小麦赤霉病;DON毒素;药剂防治;作用机理;氟唑菌酯酰胺

中图分类号:S 432;TQ 455 文献标志码:A doi:10.3969/j.issn.1671-5284.2022.01.004

## Research Progress of Fungicides for *Fusarium* head blight

DONG Jiwei, HUANG Min, SONG Hao

(Plant Protection Station of Shuyang County, Jiangsu Suqian 223600, China)

**Abstract:** *Fusarium* head blight is one of the serious diseases that causes low yields and quality. This paper briefly introduced the existing fungicides for *Fusarium* head blight, such as triazole, benzimidazoles, acrylates pesticides, etc. The control efficiency, resistance, DON control of tebuconazole, phenamacril and carbendazim etc., and some active compounds that have been reported in the literatures were summarized. The review will provide the basis for the research and development of controlling *Fusarium* head blight and new pesticides.

**Key words:** Wheat; *Fusarium* head blight; deoxynivalenol; chemical control; mechanism; pydiflumetofen

小麦(*Triticum aestivum* L.)是重要的粮食作物,在全世界广泛种植,不仅给人类提供充足的能量,而且提供丰富的维生素、蛋白质、矿物质和膳食纤维等。全球超过40%的人口以小麦为主粮,2016年全球小麦种植面积为22 010.76万hm<sup>2</sup>,约占谷物种植面积的30.7%,远超玉米、大豆和水稻种植面积<sup>[1]</sup>。2021年全球小麦产量为7.769亿t,比2020年度增加107万t,我国为主要的小麦生产国,产量为1.34亿t<sup>[2]</sup>。

小麦赤霉病(*Fusarium* head blight)是最具有破坏性的小麦病害之一,被视为小麦的“癌症”,是由小麦镰刀菌引起的真菌病害,也是一种气候型流行性病害,在全球大部分小麦种植区均有发生,特别是在温暖潮湿的小麦产区<sup>[3]</sup>。在我国赤霉病主要发生在长江中下游和华南冬麦区及东北春麦区东部,黄河流域及其他地区也有发生<sup>[4]</sup>,随着气温和耕作方式的改变,小麦赤霉病的发生越来越严重。近年

来,20%的小麦种植区发生小麦赤霉病,2016—2020年度全国赤霉病发生面积为1亿~1.5亿亩次<sup>[5-6]</sup>。该病在小麦的整个生育期均可以发生,根、茎基、穗都可能被侵染,引起根腐、茎基腐和穗腐病害。小麦赤霉病严重影响产量,据相关报道显示,2000—2018年由于小麦赤霉病导致年均产量损失超过341万t<sup>[7]</sup>,而且影响小麦品质,造成麦粒积累大量脱氧雪腐镰刀菌烯醇(DON)、3-乙酰基脱氧雪腐镰刀菌烯醇(3-AcDON)等毒素,这些毒素不仅会影响麦粒的萌发,而且会导致人畜中毒,严重时会导致胎儿畸形,致孕妇流产,致癌,甚至致死<sup>[8]</sup>。

目前,在有关小麦赤霉病防治报道中,培育抗病品种、农业防治和化学农药防治等措施为常见的防治手段<sup>[9]</sup>。廖森等<sup>[10]</sup>从育种角度出发,发掘了小麦赤霉病的抗性种质资源和抗性基因,发现‘镇麦12号’‘宁麦27’‘镇麦13’‘宁麦17108’等品种具有赤

收稿日期:2021-11-25

作者简介:董吉卫(1986—),男,江苏盱眙人,硕士,农艺师,主要从事农作物病虫害监测预警与防治技术推广指导。E-mail:380750202@qq.com

霉菌抗性基因,可以作为抗赤霉病遗传改良的种质资源。有关近缘种抗赤霉病基因导入小麦的研究也颇多,如将鹅观草的*Fhb6*基因<sup>[1]</sup>转到小麦上,获得抗性品种,且能稳定性遗传。选育抗性品种虽然可以从根本上解决赤霉病的危害,但是育种周期长,成本高,且转基因品种还存在很大争议。目前赤霉病的防治主要还是依赖于化学农药,其见效快、成本低。汪永安等<sup>[2]</sup>开展了筛选小麦赤霉病不同药剂组合试验,发现戊唑醇与多菌灵及丙硫菌唑混配、氟唑菌酰胺+丙环唑对小麦赤霉病有较好的综合防效。李雷雷等<sup>[3]</sup>发现氰烯菌酯和戊唑醇对小麦赤霉病的毒力强,均可以作为防治小麦赤霉病的主要药剂。

然而,长期大量使用单一农药品种,导致不少地区已经有关于赤霉病抗药性报道,如河南省已经出现了多菌灵存在抗药性的小麦赤霉病菌<sup>[4]</sup>,以

及安徽定远、寿县和芜湖等地小麦赤霉病菌株对丙硫菌唑具有一定的抗药性<sup>[5]</sup>。因此,对小麦赤霉病的防治一方面需要开发新型、高效、低残留的农药;另一方面加强混配制剂的研究,配制合理、高效、延缓产品抗性并能扩大杀菌谱的混剂产品。因此,本文对我国登记用于小麦赤霉病防治的药剂及具有潜在开发价值的部分活性化合物结构进行综述,为小麦赤霉病防治工作和产品研发提供参考。

## 1 防治小麦赤霉病药剂登记现状

截至2021年12月2日,我国登记注册并且仍在有效使用期限内防治小麦赤霉病的农药共有368种,其中单剂有153种,混剂有215种,单剂有效成分仅有22种(表1)。按结构类型划分有三唑类、苯并咪唑类、氨基丙烯酸酯类等8类农药。

表 1 小麦赤霉病上单剂的 22 种有效成分登记情况

有效成分	单剂数量/个	混剂数量/个	有效成分	单剂数量/个	复配数量/个
戊唑醇	7	104	噻霉酮	1	2
多菌灵	35	83	醚菌酯	1	2
咪鲜胺(盐)	11	49	氟唑菌酰胺	2	0
吡唑醚菌酯	4	29	枯草芽孢杆菌	4	0
福美双	11	24	低聚糖素	4	0
甲基硫菌灵	60	22	申嗟霉素	1	0
氟环唑	1	21	粉唑醇	1	0
氰烯菌酯	1	3	叶菌唑	1	0
己唑醇	2	2	四霉素	1	0
啞菌酯	2	2	氨基寡糖素	1	0
丙硫菌唑	1	2	多粘类芽孢杆菌KN-03	1	0

### 1.1 三唑类

三唑类杀菌剂为C<sub>14</sub>-脱甲基化抑制剂,通过阻止麦角甾醇的生物合成,破坏菌体细胞膜功能,达到抑菌作用。目前登记用于小麦赤霉病上的三唑类农药有戊唑醇、丙硫菌唑、叶菌唑、三唑酮、氟环唑、丙环唑、己唑醇、苯醚甲环唑、烯唑醇、粉唑醇,其中三唑酮、丙环唑、苯醚甲环唑、烯唑醇仅以复配形式登记。三唑类杀菌剂机制独特并有较好的防效功能,以及具有广谱、内吸、低毒等优良特性<sup>[6]</sup>。国内外已经有几十年有关三唑类农药防治小麦赤霉病的历史,虽然已经有报道显示三唑类杀菌剂防效降低现象,甚至产生抗药性<sup>[7-8]</sup>,但其复配药剂仍然能有效防治小麦赤霉病<sup>[9-20]</sup>。王平山等<sup>[20]</sup>对粉唑醇、环丙唑醇、氟环唑和戊唑醇混用防治小麦赤霉病进行了田间药效试验,发现粉唑醇与戊唑醇、氟环唑与戊唑醇混用对赤霉病具有一定的防效,并且环丙唑醇与戊唑醇复配对于赤霉病的防效较好。相关

研究表明,室内毒力和田间药效高的杀菌剂有戊唑醇、丙硫菌唑、叶菌唑等<sup>[21]</sup>。

(1) 戊唑醇。戊唑醇英文通用名:Tebuconazole,分子式:C<sub>16</sub>H<sub>22</sub>ClN<sub>3</sub>O,由拜耳公司于1986年开发,是市面上防治小麦赤霉病常见药剂,在我国主要以混剂形式登记,与其复配的有咪鲜胺、甲基硫菌灵、肟菌酯、吡唑醚菌酯、醚菌酯等17种有效成分。张海燕等<sup>[22]</sup>研究发现戊唑醇单剂或复配剂1次用药既能高效控制小麦赤霉病,又能有效控制小麦籽粒DON毒素不超标。2021年,陈莉等<sup>[23]</sup>报道戊唑醇对采集自河南省北部和中部地区的小麦赤霉病菌有较高的抑菌效果,EC<sub>50</sub>值分别为0.332 4和0.351 2 mg/L。朱保平等<sup>[9]</sup>研究表明戊唑醇与咪鲜胺的复配能够极好的防治小麦赤霉病,显著提高小麦产量。宋阳阳等<sup>[24]</sup>研究了湖北省小麦赤霉病菌对戊唑醇等的敏感性,发现戊唑醇对湖北省小麦赤霉病菌依然具有较高的敏感性,EC<sub>50</sub>平均值为0.181 μg/mL。2020年,周华飞

等<sup>[25]</sup>报道,利用LAMP-PCR技术检测江苏盐城市、溧阳市和南通市通州区小麦赤霉病原菌的优势种群,发现亚细亚镰孢为优势小种,占比100%,禾谷镰孢占比仅为11.33%,并且未发现戊唑醇产生抗药性。但相关研究表明河南省等已经出现了对戊唑醇敏感性下降的小麦赤霉病菌亚群体<sup>[26]</sup>。

(2) 丙硫菌唑。丙硫菌唑的英文通用名: Prothioconazole, 分子式:  $C_{14}H_{15}Cl_2N_3OS$ , 由拜耳公司研发,并于2004年在英国和德国上市,2018年才在我国获得登记。截至2021年12月,仅有3个产品登记用于防治小麦赤霉病,其中有2个混剂,分别与多菌灵和戊唑醇复配。2021年王栓等<sup>[27]</sup>报道了丙硫菌唑对禾谷镰孢菌具有较好的抑制效果,  $EC_{50}$  值为  $1.747\ 0\ \mu\text{g/mL}$ , 与氰烯菌酯、咯菌腈和氟唑菌酰胺等作用机制不同的杀菌剂复配对小麦赤霉病均表现为增效或者相加作用,与上述3种药剂进行交替或者复配使用,延缓药剂抗性产生。2021年,殷毅凡等<sup>[28]</sup>报道用植保无人飞机喷施丙硫菌唑纳米水性化制剂对小麦赤霉病的防效优异,显著优于多菌灵、甲基硫菌灵等不同有效成分,并且在减量前提下还优于有效成分相同的常规农药。目前丙硫菌唑在我国登记用于小麦赤霉病防治的剂为悬浮剂和可分散油悬浮剂,因此新型剂型的研发可以在提高防治防效的同时,适用于新型植保机械。虽然丙硫菌唑在我国登记时间较短,但是由于其与戊唑醇等药剂作用机制相同等因素,不少地区已有抗药性报道记录。2021年,李梦婷<sup>[15]</sup>报道了不同地区菌株对丙硫菌唑敏感性差异较大,其中安徽定远、寿县和芜湖等地的菌株已经对丙硫菌唑产生了抗药性,并且发现因长期使用丙硫菌唑药剂而对小麦赤霉病产生抗性的菌株会导致菌株DON毒素含量上升,应与其无交互抗性的氰烯菌酯和咪鲜胺交替使用。

(3) 叶菌唑。叶菌唑的英文通用名: Metconazole, 分子式  $LC_{17}H_{22}ClN_3O$ 。1986年首次合成成功,由壳牌和日本吴羽于1993年上市,2005年被巴斯夫收购。目前,仅安道麦辉丰(江苏)有限公司的8%叶菌唑悬浮剂登记用于防治小麦赤霉病。2020年,李永平等<sup>[29]</sup>报道了安徽凤台、江苏宜兴地区利用叶菌唑防治小麦赤霉病取得优异防效,平均防效大于85%,均有保产增产效果。2020年,刘程程等<sup>[30]</sup>报道了叶菌唑对禾谷镰孢菌有较好的抑制效果,  $EC_{50}$  值为  $0.016\ 3\sim 0.038\ 3\ \mu\text{g/mL}$ , 与戊唑醇、咪鲜胺、丙硫菌唑和氟啶胺混配表现出相加及增效作用,与上述药剂混配可以延缓抗药性。2018年王长青等<sup>[31]</sup>报道克菌丹与叶菌唑

复配对小麦赤霉病有一定防效,防效在86%以上,并且对小麦没有药害,使用安全,增产明显。叶菌唑防治谱广,并对小麦赤霉病防效优异,其专利已经过保护期,近年来其与戊唑醇等药剂复配在麦区的市场前景进一步凸显,但我国暂无混配制剂登记,因此应加强对混剂登记,以扩大防治谱及延缓抗药性。

## 1.2 苯并咪唑类

苯并咪唑类农药是一类以具有杀菌活性的苯并咪唑环为母体的有机杀菌剂,其作用机制是与真菌 $\beta$ -微管蛋白结合,阻止细胞纺锤丝的形成,进而干扰有丝分裂,达到杀死小麦赤霉病原菌的目的。目前登记用于防治小麦赤霉病的苯并咪唑类农药有多菌灵、甲基硫菌灵、丙硫唑,共有201个产品登记。

(1) 多菌灵。多菌灵英文通用名: Carbendazim, 分子式:  $C_9H_9N_3O_2$ 。多菌灵为目前登记用于防治小麦赤霉病最多的药剂,其中混剂有83个,主要与三唑酮、福美双、戊唑醇、咪鲜胺锰盐等14种有效成分复配。此类药剂抗性比较突出,王晋丽<sup>[32]</sup>测定了2018—2020年采自河南、安徽和江苏等省份的赤霉病原菌对多菌灵等常用药剂的抗药性,发现江苏省的多菌灵抗性菌株比例平均值为38.07%;安徽省均值为12.50%;河南省平均值为4.95%。2020年,周华飞等<sup>[29]</sup>报道了江苏地区小麦赤霉病原菌种群对传统药剂的抗性结果,发现江苏地区已经对多菌灵产生了严重抗性,抗性频率为26.3%~54.5%。张穗等<sup>[33]</sup>研究了2013—2015年上海小麦赤霉病对多菌灵抗性水平,虽然对多菌灵敏感的小麦赤霉病菌株的平均 $EC_{50}$ 值呈逐年递减趋势,但是对于抗性病株 $EC_{50}$ 值的抗性呈递增趋势,2015年达到高抗水平,且抗药性菌株出现的频率增高,遗传性稳定。出现多菌灵抗性病株 $EC_{50}$ 值与秸秆还田年限增加呈现出正相关性的现象,建议秸秆还田历史较长的地区应该尽量少用多菌灵。相关研究表明,多菌灵的使用会引起小麦籽粒DON毒素增加,主要原因是多菌灵可以促进禾谷镰刀菌体内乙酰辅酶A产生,上调DON毒素合成<sup>[34]</sup>。

(2) 甲基硫菌灵。甲基硫菌灵英文通用名: Thiophanate-methyl, 分子式:  $C_{12}H_{14}N_4O_4S_2$ 。其内吸性和持效性比多菌灵好,防效也高于多菌灵<sup>[21]</sup>,常与戊唑醇、己唑醇、福美双等药剂复配。2015年,黄世广等<sup>[35]</sup>研究发现高剂量的甲基硫菌灵对小麦赤霉病防效优异,防效达90%以上,优于多菌灵。其与多菌灵存在交互抗性,一般在生产上不要混配使用。

### 1.3 咪唑类

目前,登记用于小麦赤霉病的咪唑类农药主要为咪鲜胺及其盐类。截至2021年12月,共有60个产品登记,其中混剂49个,主要与戊唑醇、噻霉酮、吡唑醚菌酯、啞菌酯、丙环唑、福美双、甲硫灵等复配。

(1) 咪鲜胺英文通用名: Prochloraz, 分子式:  $C_{15}H_{16}Cl_3N_3O_2$ 。其为麦角甾醇脱甲基化抑制剂,通过抑制14 $\alpha$ -脱甲基酶的活性而阻止麦角甾醇的生物合成,导致细胞膜功能异常,达到抑菌杀菌目的。目前小麦赤霉病原菌对咪鲜胺的敏感性依然较高,鲜有关于产生抗药性的报道。马雪莉等<sup>[36]</sup>研究表明禾谷镰刀菌对咪鲜胺非常敏感,其 $EC_{50}$ 值为0.058 mg/L,比多菌灵和己唑醇的杀菌活性更好,当其与啞菌酯按4:2混配时,具有增效作用,杀菌活性比咪鲜胺单剂更高,可以用于防治对多菌灵产生抗性的禾谷镰刀菌。张春梅等<sup>[37]</sup>利用戊唑·咪鲜胺防治小麦赤霉病,发现其防效较好,在江苏睢宁试验点防效达87.62%~91.36%,江苏里下河地区试验点达87.4%~91.4%。尹军良等<sup>[38]</sup>利用咪鲜胺与氰烯菌酯复配防治小麦赤霉病原菌,发现其抑菌水平远远大于单剂,两者增效系数也大于7, $EC_{50}$ 值为0.018 46  $\mu$ g/L。

(2) 咪鲜胺锰盐、咪鲜胺铜盐不仅具有优异的杀菌功能,而且对小麦安全,对环境影响小。2018年,亢晓丽<sup>[39]</sup>报道了40%咪鲜胺铜盐·氟环唑悬浮剂对小麦赤霉病的防效达90.95%,优于45%戊唑·咪鲜胺水乳剂。蒋志新等<sup>[40]</sup>63.5%咪鲜胺锰盐·多菌灵WP对小麦赤霉病有较好的防效,一次用药即有较好的效果,可达84%左右,且对小麦安全。

### 1.4 丙烯酸酯类

丙烯酸酯类杀菌剂分为两类,一类为甲氧基丙烯酸酯类杀菌剂,是目前全球销售额较大的杀菌剂,其通过抑制电子在细胞色素间传递,进而阻止了ATP的形成,抑制细胞线粒体呼吸,达到杀菌的目的。目前登记用于防治小麦赤霉病的甲氧基丙烯酸酯类杀菌剂有烯炀菌酯、吡唑醚菌酯、啞菌酯、醚菌酯、肟菌酯。登记有效期内共有49个农药产品,主要为混剂,占比85.7%。登记条数最多的为吡唑醚菌酯,其次为肟菌酯,烯炀菌酯登记最少,仅有1个产品,为烯炀·多菌灵。另一类为氟基丙烯酸酯类,仅有氰烯菌酯,登记产品共4个,混剂主要与戊唑醇剂己唑醇复配。

(1) 吡唑醚菌酯。吡唑醚菌酯的通用名: Pyraclostrobin, 分子式:  $C_{19}H_{18}N_3O_4Cl$ 。由巴斯夫公司于1993年研发成功,2002年上市。吡唑醚菌酯具有广阔的

杀菌谱,保护作物及提高产量等作用,对小麦赤霉病也有较好的防效。刘同金等<sup>[41]</sup>于2019年报道了吡唑醚菌酯在安徽和山东地区小麦上的防效,发现两地防效均在78.33%以上,但在山东地区吡唑醚菌酯的防效低于多菌灵,而安徽则高于多菌灵。由于其抗性是非可逆性,且复配药剂对小麦赤霉病的防效比单剂更高,复配药剂还可以延缓抗药性,因此推荐其与戊唑醇、氟环唑、咪鲜胺、多菌灵等复配防治小麦赤霉病。有研究表明,吡唑醚菌酯单剂与戊唑醇等复配对小麦赤霉病有一定防效,但其不能有效控制小麦籽粒DON毒素,远差于氰烯菌酯和戊唑醇等<sup>[22]</sup>。

(2) 氰烯菌酯。氰烯菌酯英文通用名: Phenamacril, 分子式:  $C_{12}H_{12}N_2O_2$ ,是由江苏省农药研究所于1998年发现的高效、低毒、对环境友好的肌球蛋白抑制剂。与甲氧基丙烯酸酯类杀菌剂能刺激赤霉病菌产生毒素不同,氰烯菌酯则通过抑制DON毒素小体的形成,显著降低毒素的合成<sup>[42]</sup>。相关研究表明,其对小麦赤霉病的防效比目前生产上广泛应用的多菌灵和戊唑醇更好,并且即使麦粒受到禾谷镰刀菌侵染,依然能够有效地控制DON毒素积累<sup>[43-44]</sup>。2020年,丰越<sup>[45]</sup>研究发现,氰烯菌酯与丙硫菌唑和戊唑醇复配对小麦赤霉病的防效分别达91.43%和83.39%,其处理小区的小麦籽粒中真菌毒素含量均在0.02 mg/kg以下。2019年,张春云等<sup>[44]</sup>报道了氰烯·戊唑醇·氰烯菌酯对小麦赤霉病的防效分别达98.47%、97.45%,优于戊唑·咪鲜胺等药剂防效,同时能较好地控制真菌毒素。由于其独特的作用机理,氰烯菌酯已成为各省植保站及政府防治赤霉病的首推药剂。值得注意的是,氰烯菌酯与目前现有的杀菌剂无交互抗性,建议生产上不要单用,可以选择复配药剂,增强效果,延缓抗药性。

### 1.5 酰胺类

酰胺类杀菌剂已经有50多年的应用历史,主要通过干扰病原菌的呼吸链电子传递从而达到杀菌的效果。目前登记防治小麦赤霉病的酰胺类杀菌剂仅有3个产品,为萎锈灵与戊唑醇复配及氟唑菌酰胺单剂。

氟唑菌酰胺英文通用名: Pydiflumetofen, 分子式:  $C_{16}H_{16}Cl_3F_2N_3O_2$ ,是先正达开发的新型琥珀酸脱氢酶抑制剂(SDHD)类杀菌剂,于2017年上市,2019年在我国获得登记。它对小麦赤霉病原菌抑制效果及DON毒素防效均非常优异。2021年,陈宏州等<sup>[46]</sup>发现其对禾谷镰刀菌菌丝生长抑制活性要高于

咪鲜胺、戊唑醇、丙硫菌唑、多菌灵等药剂。然而,氟唑菌酰胺作用位点比较单一,其抗性发展水平较高,建议与不同作用机理的药剂复配使用或者轮换使用,如丙环唑、戊唑醇等。2021年,杨健等<sup>[47]</sup>发现氟唑菌酰胺与丙环唑防效优异,1次防效达90.6%。

### 1.6 其他

除上述农药类别外,登记用于防治小麦赤霉病的还有生物农药和多靶标位点类农药等。登记期内的生物农药共有38个产品,主要涉及低聚糖素、氨基寡糖素、多抗霉素、申嗪霉素、四霉素、枯草芽孢杆菌、蜡质芽孢杆菌、多粘类芽孢杆菌KN-03及井冈霉素及其复配等。多靶标位点类有福美双、百菌清,在登记有效期内共有39个产品,由于此类杀菌剂对小麦赤霉病的毒力不强<sup>[21]</sup>,一般与戊唑醇、咪鲜胺、多菌灵等复配使用。

## 2 文献报道的部分活性化合物结构

### 2.1 国外报道

2021年4月先正达在专利WO2021074309、

WO2021074311分别公布了1-(3-喹啉基)-3,4-二氢异喹啉衍生物和1-(3-喹啉基)-1,2,3,4-四氢异喹啉衍生物。专利WO2021074309包含187个化合物,结构通式见图1。当衍生物处理浓度为20 mg/L,24℃下处理3~4 d后,其中的131个化合物对黄色镰刀菌(*Fusarium culmorum*)的抑制率超过80%;当浓度为200 mg/kg时,温度为20℃,相对湿度为60%条件下处理6~8 d,其中的20个化合物同时对*Fusarium culmorum*、禾谷镰刀菌(*Fusarium graminearum*)的抑制率超过80%<sup>[48]</sup>。专利WO2021074311中,化合物1和化合物2(图2)对*Fusarium graminearum*的抑制率超过80%,并且化合物1同时对*Fusarium culmorum*有优异的抑制率<sup>[49]</sup>。

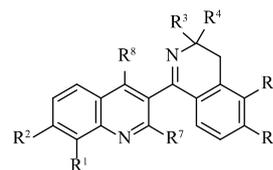


图1 1-(3-喹啉基)-3,4-二氢异喹啉衍生物结构通式

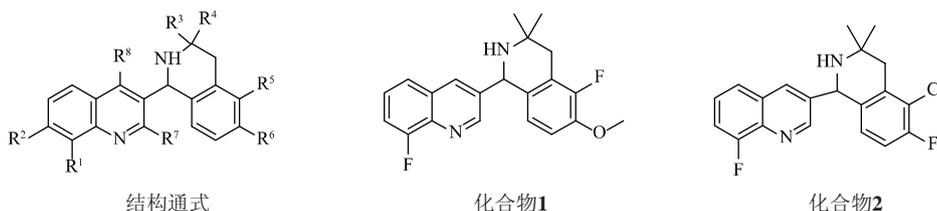


图2 1-(3-喹啉基)-1,2,3,4-四氢异喹啉衍生物结构式

### 2.2 国内报道

华中师范大学专利CN107372496A公布了苯胍基酮类化合物3和4,当浓度为20 mg/L时,对小麦赤霉病的抑制率分别达85.4%和93.9%<sup>[50]</sup>。兰州大学专利CN109717198B和CN110447651B分别公布了新白叶藤碱衍生物和喹唑啉酮类化合物<sup>[51-52]</sup>。专利CN109717198B中的化合物5、化合物6、化合物7、化合物8和化合物9对小麦赤霉病有优异的抑制率,显著优于噻菌酯,当浓度为50 mg/L时,对小麦赤霉病菌的抑制率分别为95.98%、100.66%、99.98%、91.27%和90.46%;当浓度为25 mg/L时,对小麦赤霉病的抑制率分别为87.74%、99.98%、95.75%、84.68%和88.06%。专利CN110447651B中的化合物10和11在浓度为50 mg/L时,对小麦赤霉病抑制率超过85%。江苏省农药股份有限公司报道了(Z)-3-亚氨基-1-丙烯醇类化合物12对小麦赤霉病菌的抑制率达100%,田间病指防效达89.62%,显著优于常规药剂多·酮

可湿性粉剂,而且显著降低小麦籽粒中DON毒素<sup>[53]</sup>。

李安邦等<sup>[54]</sup>将噻吩环引入吡唑酰胺类杀菌剂的骨架中,设计并合成了24个吡唑联噻吩甲酰胺类衍生物(图4),并对其抑菌活性进行研究。生物活性测试结果表明化合物13对小麦赤霉病菌的EC<sub>50</sub>为28.9 μmol/L,对小麦赤霉病菌抑制率为88.7%,并且对草莓灰霉病、水稻纹枯病和马铃薯早疫病病菌有较好的抑制率。王维等<sup>[55]</sup>基于活性亚结构拼接原理,将1,3,4-噻二唑与2,2-二氟-1,3-苯并二噁茂结合,合成了9个结构新颖的2,2-二氟-1,3-苯并二噁茂类衍生物,其中化合物14在100 mg/L下对小麦赤霉病菌、苹果树腐烂病菌和番茄灰霉病菌的抑制活性为100%。左怀龙等<sup>[56]</sup>将二苯醚结构单元引入3,4-二氢异喹啉母核中,设计合成了15个新型的异喹啉衍生物,其中化合物15对小麦赤霉病菌的抑菌率为83.3%,远优于血根碱(64.2%)和百菌清(57.7%)。同时对油菜菌核病菌、水稻纹枯病菌等有较好的抑制作用。

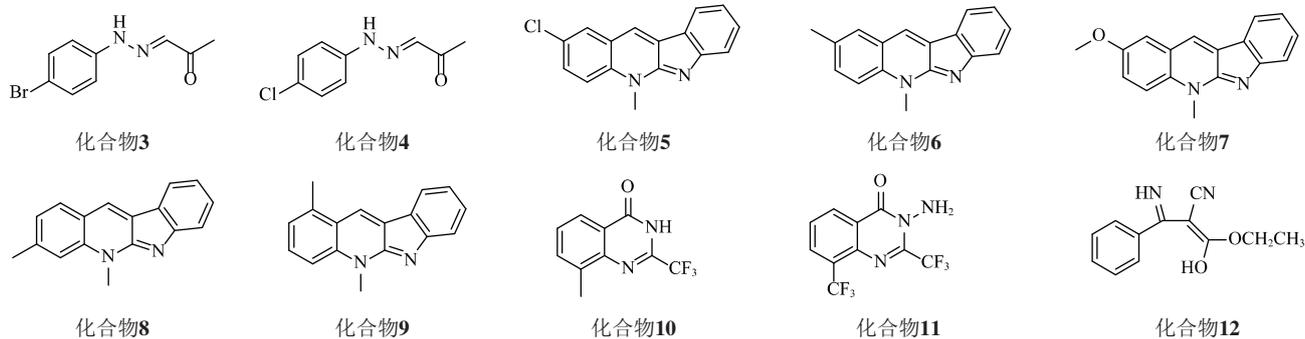


图3 国内专利公布的化合物结构式

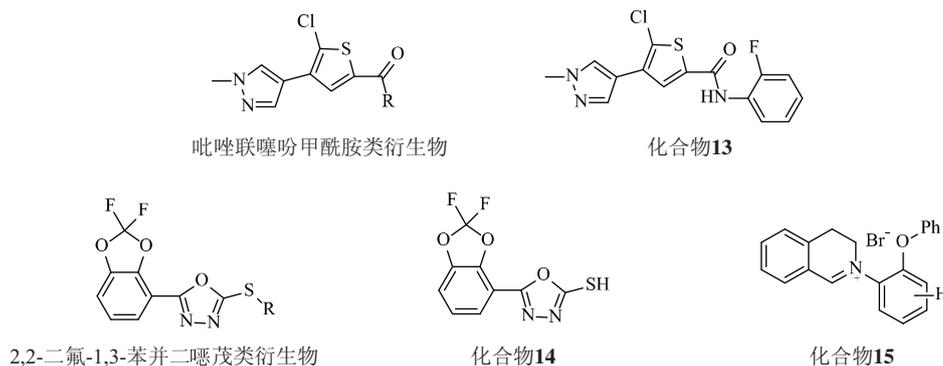


图4 国内文献中的部分化合物结构式

### 3 小结与展望

小麦赤霉病是世界性病害,主要高发于我国长江中下游和黄淮小麦产区,年发病面积超过1亿亩,对小麦的产量和品质产生严重影响的同时还造成籽粒积累DON毒素,危害人类健康。化学防治依然是赤霉病防治的主要措施,目前登记在小麦赤霉病上的农药产品共有368种,其中混剂占比58.4%,主要包括三唑类、苯并咪唑类、甲氧基丙烯酸酯类和氰基丙烯酸酯类等。在登记农药中,老品种农药登记占比较高,如多菌灵,共有118个产品在登记有效期;甲基硫菌灵,共有82个产品,而近年来登记的新有效成分氟唑菌酰胺、叶菌唑、丙硫菌唑占比少,分别登记了2、1、3个产品。部分地区已经出现小麦赤霉病对多菌灵、丙硫菌唑等药剂产生抗药性,并且对小麦赤霉病产生抗性的菌株会导致菌株DON毒素含量上升,严重影响小麦产量和品质。

小麦赤霉病的防治要遵循“主动出击,科学用药”。这不仅要注意不同作用机制的药剂混用和轮换使用来延长农药产品的使用寿命,同时要选择对降低毒素作用较强的农药。在对多菌灵和丙硫菌唑等产生抗性的地区,建议选择氰烯菌酯、戊唑醇、咪唑啉、氟唑菌酰胺等及其复配进行防治。此外,不

断开发高效、低残留、新型作用机制的产品是解决小麦赤霉病抗性问题的有效途径,也是未来防治小麦赤霉病的一个重要研究方向。

#### 参考文献

- [1] 赵广才,常旭虹,王德梅,等. 小麦生产概况及其发展[J]. 作物杂志, 2018(4): 1-7.
- [2] 刘慧. 全球小麦供需形势趋紧[N]. 经济日报, 2021-08-24(1).
- [3] ZHENG T, HUA C, LI L, et al. Integration of meta-QTL discovery with omics: Towards a molecular breeding platform for improving wheat resistance to *Fusarium* head blight[J]. The Crop Journal, 2020, 9(4): 739-749.
- [4] 姚金保,陆维忠. 中国小麦抗赤霉病育种研究进展[J]. 江苏农业学报, 2000, 16(4): 242-248.
- [5] 李兵,梁晋刚,朱育攀,等. 我国小麦赤霉病成灾原因分析及防控策略探讨[J]. 生物技术进展, 2021, 11(5): 647-652.
- [6] 于平平. 小麦市场新型药剂更迭加速[J]. 营销界, 2021(14): 48-53.
- [7] CHEN Y, CORBY K H, MA Z H, et al. *Fusarium graminearum* trichothecene mycotoxins: biosynthesis, regulation, and management [J]. Annual Review of Physiology, 2019, 57: 15-39.
- [8] GALE L R, HARRISON S A, WARD T J, et al. Nivalenol-type populations of *Fusarium graminearum* and *F. asiaticum* are prevalent on wheat in southern Louisiana[J]. Phytopathology, 2011, 101(1): 124-134.
- [9] SHAH L, ALI A, YAHYA M, et al. Intergrated control of *fusarium* head blight and deoxynivalenol mycotoxin in wheat[J]. Plant

- Pathology, 2018, 67: 532-548.
- [10] 廖森, 方正武, 胡文静, 等. 59份江苏小麦品种(系)的抗赤霉病评价与农艺性状分析[J]. 麦类作物学报, 2021, 41(11): 1-9.
- [11] GALE L R, HARRISON S A, WARD T J, et al. Nivalenol-type populations of *Fusarium graminearum* and *F. asiaticum* are prevalent on wheat in southern Louisiana[J]. Phytopathology, 2011, 101(1): 124-134.
- [12] 汪永安, 杨林, 陈劲松, 等. 舒城县小麦赤霉病防治药剂筛选试验结果[J]. 中国农技推广, 2021, 37(9): 80-82.
- [13] 李雷雷, 蔡智勇, 范志业, 等. 防治小麦赤霉病的药剂选择[J/OL]. 河南农业大学学报: 1-8 [2021-12-14]. <https://doi.org/10.16445/j.cnki.1000-2340.20210910.002>.
- [14] 王志超, 王国群, 张明理, 等. 河南省小麦赤霉病菌对多菌灵抗药性研究及处理方法[J]. 化学工程与装备, 2021(8): 23-25.
- [15] 李梦婷. 小麦赤霉病菌对丙硫菌唑的抗药性评价[D]. 合肥: 安徽农业大学, 2021.
- [16] 周子燕, 李昌春, 高同春, 等. 三唑类杀菌剂的研究进展[J]. 安徽农业科学, 2008, 36(27): 11842-11844.
- [17] YIN Y, LIU X, LI B, et al. Characterization of sterol demethylation inhibitor-resistant isolates of *Fusarium asiaticum* and *F. graminearum* collected from wheat in China[J]. Phytopathology, 2009, 99: 487-497.
- [18] 叶滔. 禾谷镰孢菌对戊唑醇抗药性风险评估及抗药性机制初探[D]. 保定: 河北农业大学, 2012.
- [19] 朱保平, 孙俊铭. 几种药剂防治小麦赤霉病田间药效试验研究[J]. 安徽农学通报, 2021, 27(17): 118-119.
- [20] 王平山, 成谊新, 朱崇敬. 几种三唑类杀菌剂混用对小麦赤霉病的防效[J]. 大麦与谷类科学, 2020, 37(1): 43-45.
- [21] 王苹, 吴佳文, 张海波, 等. 我国防治小麦赤霉病的药剂种类评析[J]. 中国植保导刊, 2021, 41(1): 71-76; 56.
- [22] 张海艳, 段云辉, 韩敏, 等. 几种杀菌剂防控小麦赤霉病穗腐及籽粒脱氧雪腐镰刀菌烯醇(DON)毒素的评价[J]. 植物保护, 2021, 47(1): 259-264; 272.
- [23] 陈莉, 袁谦, 范志业, 等. 两株禾谷镰刀菌对六种杀菌剂的敏感性测定[J]. 湖北农业科学, 2021, 60(20): 84-86.
- [24] 宋阳阳, 林杨, 罗汉钢, 等. 湖北省小麦赤霉病菌对多菌灵、戊唑醇和咪鲜胺的敏感性[J]. 农药学报, 2016, 18(6): 724-728.
- [25] 周华飞, 吴佳文, 杨红福, 等. 江苏地区小麦赤霉病菌种群检测与抗药性分析[J]. 农学报, 2020, 10(5): 31-35.
- [26] 徐建强, 张勇, 平忠良, 等. 河南省小麦赤霉病菌对戊唑醇的敏感性[J]. 麦类作物学报, 2018, 38(10): 1255-1261.
- [27] 王栓, 陈金鹏, 付刘元, 等. 4种杀菌剂及其复配剂对禾谷镰孢菌的毒力影响[J]. 现代农药, 2021, 20(5): 51-55.
- [28] 殷毅凡, 吴向辉, 沈雨, 等. 丙硫菌唑纳米水性化制剂对小麦赤霉病的防治效果[J]. 安徽农业科学, 2021, 49(5): 143-146.
- [29] 李永平, 石磊, 闵红, 等. 叶菌唑对小麦三种重要病害的防治效果[J]. 现代农药, 2020, 19(5): 52-56.
- [30] 刘程程, 孙海燕, 张雯婷, 等. 叶菌唑与4种杀菌剂复配对小麦赤霉病的毒力及防效[J]. 植物保护, 2020, 46(4): 248-252.
- [31] 王长青, 韩玉江, 曾泉, 等. 克菌丹·叶菌唑防治小麦赤霉病效果试验[J]. 湖北植保, 2018(3): 10-11.
- [32] 王晋丽. 赤霉病菌抗药性监测及天然活性化合物FM-A的作用机制初探[D]. 杭州: 浙江大学, 2021.
- [33] 张穗, 陈伟, 王东, 等. 上海郊区小麦赤霉病菌多菌灵抗性群体动态的研究[J]. 上海农业学报, 2020, 36(2): 120-124.
- [34] 殷茹娟, 孙莹, 朱凯, 等. 河南省假禾镰刀菌对多菌灵的敏感性[J/OL]. 农药学报: 1-12 [2021-12-14]. <https://doi.org/10.16801/j.issn.1008-7303.2021.0145>.
- [35] 黄世广, 吴锦霞, 乔德丰, 等. 5种杀菌剂防治小麦赤霉病的田间药效评价[J]. 世界农药, 2015, 37(4): 59-60; 62.
- [36] 马雪莉, 耿忠义, 高龙银, 等. 咪鲜胺与嘧菌酯及其不同配比对禾谷镰孢菌的毒力测定[J]. 山东农业大学学报(自然科学版), 2020, 51(6): 1044-1048.
- [37] 张春梅, 邵统响, 卫甜, 等. 45%戊唑·咪鲜胺WP防治小麦赤霉病试验[J]. 天津农业科学, 2018, 24(9): 70-72; 84.
- [38] 尹军良, 张兴, 马东方, 等. 小麦赤霉病菌对咪鲜胺和氟烯菌酯敏感性及其混配增益效果研究[J]. 江西农业大学学报, 2018, 40(5): 920-924.
- [39] 亢晓丽. 40%咪鲜胺铜盐·氟环唑悬浮剂对小麦赤霉病的防效研究[J]. 现代农业科技, 2018(23): 133.
- [40] 蒋志新, 周建平, 汤露萍. 63.5%咪鲜胺锰盐·多菌灵WP防治小麦赤霉病试验初报[J]. 上海农业科技, 2010(3): 126.
- [41] 刘同金, 李瑞娟, 宋国春, 等. 吡唑醚菌酯对小麦赤霉病的防效及在小麦籽粒中的残留[J]. 中国农学通报, 2019, 35(21): 159-164.
- [42] TANG G F, CHEN Y, XU J R, et al. The fungal myosin I is essential for *Fusarium* toxosome formation[J]. PLoS Pathogens, 2018, 14(1): e1006827.
- [43] 张承启. 新型杀菌剂氟烯菌酯对禾谷镰刀菌的作用机制研究[D]. 杭州: 浙江大学, 2016.
- [44] 张春云, 张桥, 吴庭友, 等. 几种杀菌剂对小麦赤霉病及真菌毒素的控制效果[J]. 安徽农业科学, 2019, 47(20): 155-158.
- [45] 丰越. 安徽省沿淮淮北小麦赤霉病发生规律及综合防治技术研究[D]. 合肥: 安徽农业大学, 2020.
- [46] 陈宏州, 吴佳文, 庄义庆, 等. 不同杀菌剂对小麦赤霉病及籽粒DON毒素的控制效果[J]. 植物保护, 2021, 47(6): 307-317.
- [47] 杨健, 宁国云, 柏超, 等. 氟唑菌酰胺等药剂对小麦赤霉病的防效[J]. 浙江农业科学, 2021, 62(2): 370-371.
- [48] MATTHIAS W, LAURA Q, FARHAN B H, et al. 1-(3-quinolyl)-3, 4-dihydroisoquinoline derivatives as fungicides for combating specific phytopathogens: WO, 2021074309[P]. 2021-04-22.
- [49] MATTHIAS W, LAURA Q, FARHAN B H, et al. 1-(3-quinolyl)-1, 2,3,4-tetrahydroisoquinoline derivatives as fungicides for combating specific phytopathogens: WO, 2021074311[P]. 2021-04-22.
- [50] 万坚, 任彦亮, 万芬, 等. 苯胍基酮类化合物在作为农用杀菌剂的用途: CN, 107372496B[P]. 2021-01-15.
- [51] 刘映前, 朱佳凯, 李俊采, 等. 一种A环修饰的新白叶藤碱衍生物在防治农业植物病害中的应用: CN, 109717198B[P]. 2021-01-08.
- [52] 刘映前, 彭静文, 杨程杰, 等. 一种唑啉酰胺类化合物及在制备或防治农业植物病害中的应用: CN, 110447651B[P]. 2021-09-21.
- [53] 谭波, 曹杨, 王洪雷, 等. (Z)-3-亚氨基-1-丙烯醇类化合物、制备方法及其用途: CN, 109879841B[P]. 2021-05-18.
- [54] 李安邦, 李中珊, 赵洋, 等. 新型吡唑啉嗪吩甲酰胺类衍生物的设计、合成及其抑菌活性研究[J]. 有机化学, 2020, 40(9): 2836-2844.
- [55] 王威, 黄晓瑛, 王列平, 等. 新型2,2-二氟-1,3-苯并二茂衍生物的合成与杀菌活性[J]. 农药, 2021, 60(8): 563-566; 590.
- [56] 左怀龙, 雷思敏, 张锐, 等. 新型异噻唑衍生物的设计合成及抑菌活性[J]. 高等学校化学学报, 2021, 42(9): 2766-2771.

(责任编辑:徐娟)