



热点聚焦：领涨市场的HPPD抑制剂类除草剂

发布日期：2021-06-17 信息来源：《世界农药》2021年第4期 作者：江苏省农药协会 农药资讯网 柏亚罗



原标题：HPPD抑制剂类除草剂的产品研发及市场概况

杂草已对约占全球除草剂市场3/4 份额的6类除草剂（EPSPS、ALS、ACCase、PS II、VLCFA、激素类）中的4类产品（EPSPS、ALS、ACCase、PS II）产生了较为严重的抗药性。截止2021年1月，报道的516种除草剂抗性杂草生物型涉及263种杂草，其中，双子叶杂草152种、单子叶杂草111种。这些抗性杂草分布在71个国家，覆盖94种作物，对目前已知的26种作用机理除草剂中的23种产生了抗性，涉及167种除草剂。

抗性杂草成为制约农业生产的世界性难题，但同时也为除草剂的发展提供了机遇，持续创制新型超高效除草剂是当前农业生产的迫切需要。对羟基苯基丙酮酸双氧化酶（HPPD：4-hydroxyphenylpyruvate dioxygenase）是目前最重要的除草剂作用靶标之一，HPPD抑制剂类除草剂也成为了全球研发的热点。

自吡唑特1979年上市以来，HPPD抑制剂类除草剂已历经40余年发展，该类除草剂涉及异噁唑酮类、三酮类、吡唑酮类等化学结构类型，其中以三酮类和吡唑酮类化合物居多。

除异噁唑草酮外，该类除草剂中的重磅产品大多在2000年之后上市，并很快发展成为超亿美元的产品。尤其是2001年上市的硝磺草酮，其2019年的销售额达8.00亿美元，占该类除草剂市场的44.6%，在全球除草剂市场排名第三，是第一大选择性除草剂。异噁唑草酮、环磺酮的销售额也已突破2.00亿美元，其中的环磺酮于2019年9月8日在中国的化合物专利到期，引发市场高度关注，或将于2021年在我国取得首次登记。

目前年销售额在1,000万美元以上的HPPD抑制剂类除草剂有10余个，包括硝磺草酮、异噁唑草酮、环磺酮、苯唑草酮、磺酰草吡唑、磺草酮、氟吡草酮、双环磺草酮、tolpyralate、呋喃磺草酮、吡唑特、吡草酮等。

在作用机理独特、生物活性高、杀草谱广、产品丰富多样、对作物安全性好、抗性发展缓慢、耐除草剂作物上市等多重因素的积极推动下，HPPD抑制剂类除草剂的未來市场仍有望取得较好增长，是一类值得重点关注的除草剂。

1 作用机理及应用

HPPD抑制剂类除草剂虽已发展40余年，但直至20世纪90年代，HPPD才被确定为除草剂作用靶标。在此理论的指导下，诞生了一批重磅产品。

HPPD抑制剂类除草剂通过抑制HPPD的活性，阻止HPPA（对羟基苯基丙酮酸）转化为HGA（尿黑酸），阻碍生育酚、质体醌的正常合成，影响类胡萝卜素的生物合成，促使植物分生、新生组织白化，导致植株死亡。HRAC（国际除草剂抗性行动委员会）将该类除草剂归为F2组，WSSA（美国杂草科学会）将其归类为第27组。



HPPD抑制剂类除草剂可以选择性地高效防除许多阔叶杂草和禾本科杂草，主要用于玉米田，也用于谷物、水稻、甘蔗、高粱等作物田。随着耐HPPD抑制剂大豆的商业化种植，该类除草剂亦已进入大豆市场。

研究发现，HPPD抑制剂类除草剂具有高效、低毒、对作物安全性高、不易产生抗药性、对环境友好等特点。目前，全球报道的抗性案件只有4例，非常适用于抗性杂草综合治理。

2 市场概况

在全球18个主要除草剂产品类型中，氨基酸类（+6.5%）、其他PPO类（+7.5%）、HPPD抑制剂类（+11.1%）、三嗪类（+8.3%）、苯氧羧酸类（+8.8%）、环己二酮类（+6.2%）、其他类（+6.7%）除草剂2018年销售额同比增长均超5.0%。尤其是，HPPD抑制剂类除草剂增幅高达11.1%，领涨除草剂市场。2019年，该类产品的销售额同比再增5.2%，为17.94亿美元；2009—2019年的复合年增长率为9.3%。

表1 2009—2019年HPPD抑制剂类除草剂的销售额及所占份额

时间(年)	销售额(亿美元)	占除草剂市场份额(%)
2009	7.37	3.7
2010	8.64	4.2
2011	10.20	4.6
2013	13.42	5.2
2014	13.92	5.3
2015	12.87	5.4
2016	13.36	5.8
2017	15.36	5.9
2018	17.06	6.2
2019	17.94	6.2

2019年，HPPD抑制剂类除草剂中销售额超亿美元的产品有4个：硝磺草酮、异噁唑草酮、环磺酮、苯唑草酮；其销售总额占该类除草剂市场的78.9%。

表2 2019年主要HPPD抑制剂类除草剂销售额及其所占份额

中文通用名	英文通用名	销售额(亿美元)	所占份额(%)
硝磺草酮	mesotrione	8.00	44.6
异噁唑草酮	isoxaflutole	2.65	14.8
环磺酮	tembotrione	2.45	13.7
苯唑草酮	topramezone	1.04	5.8
磺酰草吡唑	pyrasulfotole	0.91	5.1
磺草酮	sulcotrione	0.76	4.2
氟吡草酮	bicyclopyrone	0.70	3.9
双环磺草酮	benzobicyclon	0.45	2.5
其他		0.98	5.5
总计		17.94	100.0



3 重点上市产品

HPPD抑制剂类除草剂中的前几大产品均来自跨国公司。其中，拜耳上市了5个产品（异噁唑草酮、环磺酮、磺酰草吡唑、磺草酮、呋喃磺草酮）；先正达上市了2个产品（硝磺草酮、氟吡草酮）；巴斯夫上市了1个产品（苯唑草酮）；史迪士、石原、北兴、三共、大冢等日本公司也有此类产品上市。

3.1 硝磺草酮



图1 硝磺草酮的结构式

继磺草酮之后，先正达成功开发了第2个三酮类除草剂——硝磺草酮（通用名：mesotrione；商品名：Callisto等），这是HPPD抑制剂类除草剂中的领军产品。

硝磺草酮是磺草酮的升级版，其活性数倍于磺草酮，安全性显著提升，尤其是其混配性强，形成了包括单剂和许多复配产品在内的独特的产品系列，成为最成功的选择性除草剂。

硝磺草酮广谱、高效，具有内吸性，提供触杀作用，持效期长。通过植物的种子、根、芽、叶快速吸收，并经木质部及韧皮部向顶、向基传导。防除玉米、甘蔗、水稻、谷物、高粱等作物田一年生阔叶杂草及部分禾本科杂草；并用于抗性杂草的防除。苗前、苗后施药，有效成分用药量为70~225 g/hm²。

2019年1月，中国批准进口先正达和巴斯夫的耐草铵膦及硝磺草酮大豆SYHT0H2，这将提升硝磺草酮在大豆田的应用。

硝磺草酮是一个拥有20年市龄的成熟产品，除先正达等跨国公司外，其他许多公司也参与其市场开发。2001年，硝磺草酮在美国率先上市，上市第2年的全球销售额即超1.00亿美元，2019年的销售额达8.00亿美元，创历史最高水平；2002—2019年的复合年增长率高达12.8%。硝磺草酮的市场增长主要得益于：产品性能优秀，新产品持续上市，抗性杂草防除，耐除草剂作物推广等。

表3 硝磺草酮上市以来的全球销售额

时间(年)	销售额(亿美元)	时间(年)	销售额(亿美元)
2002	1.03	2011	5.35
2003	1.80	2012	6.20
2004	2.70	2013	6.60
2005	3.35	2014	6.70
2006	3.55	2015	6.10
2007	4.20	2016	6.50
2008	4.85	2018	7.80
2009	4.45	2019	8.00
2010	4.65		



硝磺草酮的主要市场在美国，约占其全球市场的1/3；其他市场主要包括：欧盟26个成员国、巴西、中国、加拿大、墨西哥、日本、南非、印度尼西亚、俄罗斯、塞尔维亚、厄瓜多尔、韩国、阿根廷、土耳其、肯尼亚、澳大利亚等。

2012年8月2日，硝磺草酮在中国的行政保护（授权号：NB-US2005020229）届满。在期满前的2012年7月19日，安徽中山化工有限公司基于硝磺草酮的2个水分散粒剂在我国首获登记；目前，浙江中山集团旗下位于安徽、响水、浙江3个基地的公司共登记了11个硝磺草酮产品，其中包括2个原药、4个单剂、5个复配产品。我国登记的硝磺草酮产品共有489个，其中原药37个。

硝磺草酮开启了玉米田苗后安全、快速除草的新时代。目前，硝磺草酮约70%的市场来自于玉米，在甘蔗上的使用约占其市场的5%，另外，在水稻、谷物、高粱、草坪、小宗作物上也有少量使用。

在先正达的带领下，基于硝磺草酮的产品不断上市。除单剂产品外，复配产品丰富多样，配伍产品涵盖磺酰胺类、三嗪类、酰胺类等除草剂，如烟嘧磺隆、砒嘧磺隆、异丙甲草胺、丙草胺、特丁津、莠去津、草甘膦、麦草畏、精异丙甲草胺+莠去津、异丙草胺+莠去津、烟嘧磺隆+莠去津、草甘膦+精异丙甲草胺、特丁津+精异丙甲草胺、特丁津+异噁草松、氟吡草酮+精异丙甲草胺、氟吡草酮+精异丙甲草胺+莠去津等。

随着开发产品的不断上市以及耐硝磺草酮转基因作物的大面积推广，硝磺草酮的未来市场仍具备增长潜能。

3.2 异噁唑草酮

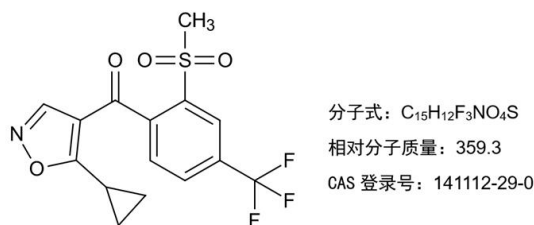


图2 异噁唑草酮的结构式

异噁唑草酮（通用名：isoxaflutole；商品名：Balance）为HPPD抑制剂类除草剂中的第二大产品，是由罗纳-普朗克（现拜耳）1992年发现的异噁唑酮类除草剂。

异噁唑草酮高效、广谱，具有内吸性，持效期长，经植物的根、叶吸收后，在韧皮部、木质部传导至整个植株。主要防除玉米、甘蔗、果蔬、棉花、谷物、甜菜等作物田许多一年生杂草。种植前、苗前、苗后早期施药，有效成分用药量为75~140 g/hm²。

异噁唑草酮在潮湿的条件下用药，可以获得最佳效果。研究表明，滞留在土壤表层的异噁唑草酮，一旦遇到降雨或灌溉，可以再次“激发”其除草活性。

随着转基因耐HPPD抑制剂类除草剂大豆的开发和上市，异噁唑草酮也已用于大豆田。2011年起，拜耳即与先正达、MS Technologies等公司合作，开发耐异噁唑草酮等HPPD抑制剂类除草剂大豆。如Balance GT（Event FG72）性状对草甘膦、异噁唑草酮具有耐受性；LibertyLink GT27（FG72×LL55）大豆对草铵膦、草甘膦、异噁唑草酮具有耐受性；FG072大豆对草铵膦、异噁唑草酮具有耐受性……

异噁唑草酮已上市20余年。1996年，异噁唑草酮率先在牙买加上市；2001年，其全球销售额达1.00亿美元；2019年的销售额为2.65亿美元；2001 - 2019年的复合年增长率为5.6%。



表4 异噁唑草酮近年来的全球销售额

时间(年)	销售额(亿美元)	时间(年)	销售额(亿美元)
2001	1.00	2014	2.40
2003	1.20	2015	2.05
2008	1.10	2016	2.20
2009	1.05	2018	2.58
2010	1.75	2019	2.65
2011	1.65		

异噁唑草酮的全球布局有所侧重，美洲和欧洲的市场地位更加凸显。目前最重要的市场在美国和巴西，各占该产品约25%的市场份额；罗马尼亚约占10%的市场份额；另外，该产品还在法国、意大利、澳大利亚、阿根廷、哥伦比亚、巴拉圭、加拿大、西班牙、俄罗斯、德国、英国、斯洛伐克、中国、印度尼西亚、泰国、越南等许多国家销售。

时至2021年1月，异噁唑草酮在中国的登记产品有19个，其中包括拜耳股份公司97.2%异噁唑草酮原药及26%噁唑·异噁唑悬浮剂（7%噁唑磺隆+19%异噁唑草酮）。江苏中旗、上虞颖泰、江苏省激素所也登记了异噁唑草酮原药；其中，江苏中旗拟建年产1,000吨异噁唑草酮原药项目。



异噁唑草酮的市场渐趋成熟，尤其在玉米领域，约占其全球市场65%的份额；在甘蔗上的使用也较多，约占其全球市场的20%；另外，还在果蔬、棉花、谷物田少量使用。

在异噁唑草酮的市场开发中，拜耳发挥了重要作用；随着该产品专利到期，其他公司也参与其市场开发。这些公司不仅开发了异噁唑草酮的单剂产品，还开发了许多复配产品。尤其是安全剂环丙磺酰胺（cyprosulfamide）的加入不仅提高了产品对作物的安全性，而且拓宽了用药适期；而其他有效成分的加入，一方面降低了异噁唑草酮的用量，同时也扩大了产品的防治谱。与异噁唑草酮复配的有效成分主要有：环丙磺酰胺、苯草醚、三嗪苄草胺、氟噻草胺、莠去津、特丁津、噻酮磺隆+环丙磺酰胺、2,4-滴异辛酯+乙草胺、硝磺草酮+莠去津等。

3.3 环磺酮

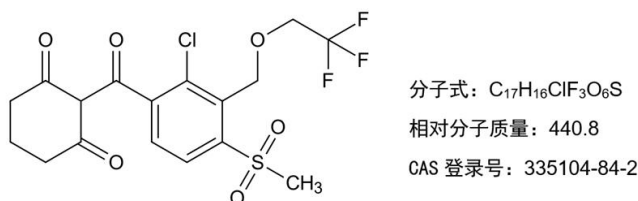


图3 环磺酮的结构式

环磺酮（通用名：tembotrione；商品名：Laudis；开发代号：AE 0172747）是拜耳通过对磺草酮结构优化后得到的三酮类化合物。主要用于玉米，也用于向日葵、非作物领域等。其杀草谱广，具有内吸性和选择性。苗后防除玉米田阔叶杂草与禾本科杂草，如莠、田旋花、婆婆纳、辣子草、鼬瓣花、猪殃殃等，且对草甘膦、ALS抑制剂类除草剂、麦草畏等产生抗性的杂草有效。苗后施药，有效成分用药量为92 g/hm²。

为提高产品的安全性，环磺酮通常与安全剂双苯噁唑酸（isoxadifen）复配使用。

2007年，环磺酮上市，受到市场的普遍欢迎，销售额几乎逐年提升。2019年的全球销售额为2.45亿美元；2009—2019年的复合年增长率为23.4%。

表5 环磺酮近年来的全球销售额

时间(年)	销售额(亿美元)	时间(年)	销售额(亿美元)
2009	0.30	2014	2.40
2010	0.95	2015	2.30
2011	1.20	2016	2.10
2012	1.85	2018	2.31
2013	2.10	2019	2.45



玉米是环磺酮最大的应用作物，约占该产品全球市场的80%；在向日葵及其他作物/非作物领域也有销售，约占其总市场的20%。

拉丁美洲是环磺酮的第一大地区市场，约占其全球市场的45%；欧洲、北美自由贸易区分别约占20%、10%的份额。

巴西对环磺酮的市场贡献最大，约占该产品全球市场45%的份额；美国也占了约10%的份额。环磺酮在欧盟19个成员国（法国、德国、奥地利、意大利、罗马尼亚、克罗地亚、荷兰、保加利亚、斯洛伐克、比利时、西班牙、捷克等）、加拿大、墨西哥、塞尔维亚、南非、厄瓜多尔、智利、肯尼亚等地区和国家也有销售和使用。

2019年9月8日，环磺酮在中国的化合物专利（CN1269800C）到期。作为玉米田重磅专利过期产品，环磺酮正吸引许多国内企业加紧研发，预计2021年或将在我国首获登记。

环磺酮上市产品既有单剂，也有复配产品。复配产品的主要配伍有：双苯噁唑酸、双苯噁唑酸乙酯、噻酮磺隆、麦草畏二甘醇胺盐、双苯噁唑酸+特丁津、噻酮磺隆+双苯噁唑酸乙酯等。

3.4 苯唑草酮

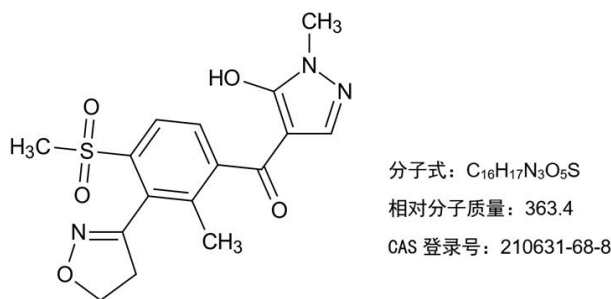


图4 苯唑草酮的结构式

苯唑草酮（通用名: topramezone; 商品名: Clio、Impact等）是由巴斯夫研发的吡唑酮类除草剂，具有安全性高、选择性强、杀草谱广、持效期长、兼容性好等特点。主要用于玉米田，防除一年生杂草，如马唐、稗草、野稷、狗尾草、牛筋草、异型莎草等一年生禾本科杂草，苋、藜、田旋花、苘麻、蓼、龙葵、野芥、鸭跖草等阔叶杂草。苗后使用，有效成分用药量为12.5~25 g/hm²。

2006年，苯唑草酮上市；2019年的全球销售额为1.04亿美元，2011—2019年的复合年增长率为8.3%。

表6 苯唑草酮近年来的全球销售额

时间(年)	销售额(亿美元)	时间(年)	销售额(亿美元)
2011	0.55	2016	0.90
2013	0.95	2018	1.02
2014	0.85	2019	1.04
2015	0.80		

苯唑草酮主要用于玉米，也用于谷物、水稻、非作物领域等。其中，玉米用苯唑草酮约占该产品全球市场的65%。

苯唑草酮主要销往美国、中国、阿根廷等国，分别约占其全球市场的20%、15%、8%；也在匈牙利、墨西哥、印度尼西亚、比利时、日本、德国、加拿大、奥地利、乌克兰、智利、斯洛伐克、荷兰等国销售。

2011年，巴斯夫苯唑草酮产品在中国登记和上市，商品名“苞卫”。随着苯唑草酮2018年1月7日在中国的化合物专利到期，国内不少企业登记了苯唑草酮产品。目前，在我国登记的苯唑草酮产品有15个，其中包括巴斯夫欧洲公司的3个产品，国内企业登记的都是苯唑草酮制剂，尚未登记原药。基于苯唑草酮优秀的产品性能，国内多家公司拟建苯唑草酮原药项目，如中旗股份等。

2020年7月1日，巴斯夫的Frequency（苯唑草酮+安全剂解草酯；悬乳剂）在澳大利亚取得登记，苗后防除小麦（包括硬质小麦）和大麦田杂草。通过安全剂的加入，苯唑草酮的应用范围扩大到谷物。

3.5 磺酰草吡唑

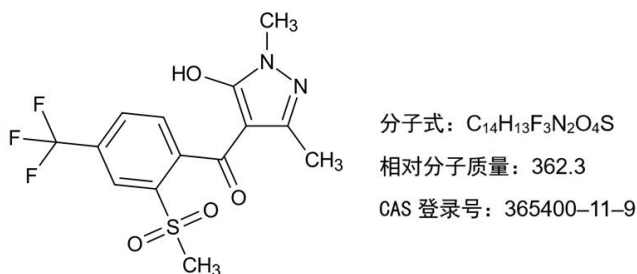


图5 磺酰草吡唑的结构式

磺酰草吡唑（通用名: pyrasulfotole; 商品名: Huskie等；开发代号: AE 0317309）是由安万特（现拜耳）研发的吡唑酮类除草剂，2000年首次报道，现已成为HPPD抑制剂中的第五大产品。

磺酰草吡唑是第1个用于谷物田的HPPD抑制剂类除草剂，为谷物田抗性和多抗性杂草防除提供了新的解决方案。主要防除阔叶杂草，如繁缕、藜属、茄属植物、苋属、苘麻属，对部分一年生禾本科杂草（如狗尾草）的防效并不理想；苗后施药，有效成分用药量为25~50 g/hm²。

通过与安全剂吡唑解草酯混配，作物对磺酰草吡唑的抗药性显著提高，使其几乎可用于所有品种的小麦、大麦、黑小麦等。

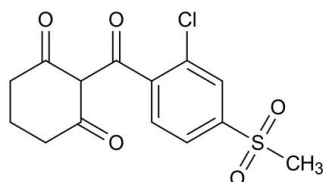
磺酰草吡唑于2007年上市。近年来，其销售额稳步增长。2014—2015年，磺酰草吡唑的全球销售额分别为0.50亿、0.55亿美元；2016年为0.65亿美元；2019年的销售额为0.91亿美元，2011—2019年的复合年增长率为14.9%。

磺酰草吡唑用于谷物田的销售额约占其全球市场的90%。加拿大、美国、澳大利亚分别约占该产品市场的40%、35%、15%。

目前，磺酰草吡唑尚未在欧洲登记，也未在中国登记。

磺酰草吡唑的上市丰富了拜耳谷物田除草剂产品组合，其与溴苯腈和苯氧类产品等具有协同作用。公司推出了磺酰草吡唑的多个复配产品，配伍产品有：2甲4氯、噻酮磺隆、溴苯腈+吡唑解草酯、溴苯腈+噁唑禾草灵、溴苯腈+氯氟吡氧乙酸等。

3.6 磺草酮



分子式：C₁₄H₁₃ClO₅S

相对分子质量：328.8

CAS 登录号：99105-77-8

图6 磺草酮的结构式

在目前上市的13个主要HPPD抑制剂类除草剂中，有6个三酮类化合物，几乎占据了半壁江山。率先上市的磺草酮为后续产品的结构优化奠定了坚实的基础，诞生了多个重磅产品和重磅潜力产品。像硝磺草酮，其与磺草酮仅差一个取代基，两者的销售额却呈现9倍之差。

磺草酮（通用名：sulcotrione）是由捷利康（现先正达）研发并上市，主要用于玉米田，防除禾本科杂草和阔叶杂草，苗后施药，有效成分用药量为300~450 g/hm²。

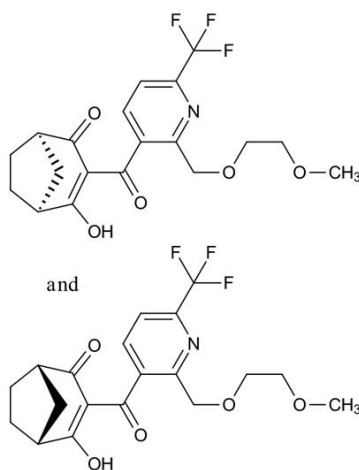
1990年，磺草酮在欧洲上市，用于玉米田。2000年，磺草酮剥离给拜耳，继而在美国获准登记。不过，磺草酮在美国的市场有限，在欧洲的市场优势也已被硝磺草酮所取代。

2019年，磺草酮的全球销售额为0.76亿美元，2014—2019年的复合年增长率为-9.5%。

磺草酮用于玉米田的销售额约占其全球市场的50%以上；该产品主要销往法国、匈牙利、德国、意大利等国。

目前，我国登记的磺草酮产品有24个，其中包括8个原药。

3.7 氟吡草酮



分子式：C₁₉H₂₀F₃NO₅

相对分子质量：399.4

CAS 登录号：352010-68-5

图7 氟吡草酮的结构式

继磺草酮、硝磺草酮之后，先正达成功上市了第3个三酮类除草剂——氟吡草酮（通用名：bicyclopyrone；商品名：Acuron等；开发代号：NOA449280），这是近年来该类除草剂中增长最快的产品。主要防除玉米、甘蔗、谷物（如小麦、大麦）等作物田阔叶杂草和部分禾本科杂草，对三裂叶豚草和苍耳等大型种子阔叶杂草的防效较高，对草甘膦抗性杂草防效较好。种植前、苗前、苗后施药，有效成分用药量为50~300 g/hm²。

通过与安全剂解草啉（benoxacor）或解草酯（cloquintocet）等混配，可以提高氟吡草酮对作物的安全性。

2015年，氟吡草酮上市，现已在美国、加拿大、阿根廷、乌拉圭、澳大利亚等多个国家登记和上市。



2015年，美国环保署批准登记了氟吡草酮原药及其四元复配产品Acuron（氟吡草酮+硝磺草酮+精异丙甲草胺+莠去津）等，用于玉米和甘蔗田；同年，Acuron上市。

Acuron拥有3种不同的作用机理，可防除玉米田70多种一年生杂草，包括巨型豚草、豚草、问荆、地肤、长芒苋及抗性杂草等。上市首年，Acuron即实现销售额1.00亿美元；预计其年峰值销售额将突破5.00亿美元。

2016年，先正达在美国上市了Acuron Flexi（氟吡草酮+硝磺草酮+精异丙甲草胺+解草啉）、Talinor（氟吡草酮+辛酰溴苯腈）；2017年，在澳大利亚、美国上市了Talinor（氟吡草酮+辛酰溴苯腈+解草啉），用于小麦和大麦。

Talinor可防除麦田50多种阔叶杂草，并可与其他防除禾本科杂草的除草剂混用，禾阔双除。Talinor对合成激素类、ALS抑制剂类除草剂及草甘膦等抗性杂草防效高。

2019年，先正达在加拿大上市了Acuron Flexi（氟吡草酮+硝磺草酮+精异丙甲草胺），防除玉米田许多一年生杂草，如藜、反枝苋等。

氟吡草酮上市以来，其市场增长较快。2015年实现销售额0.15亿美元；2016年为0.20亿美元；2018年为0.50亿美元；2019年的销售额为0.70亿美元，2015—2019年的复合年增长率为47.0%。

玉米是氟吡草酮最重要的应用作物，约占其全球市场的60%；氟吡草酮在美国、阿根廷应用最多，分别约占其全球市场的35%、25%。

虽然氟吡草酮上市不久，但其专利申请较早；其在中国的化合物专利（CN1231476C）将于2021年6月6日期满。目前，氟吡草酮尚未在我国登记。

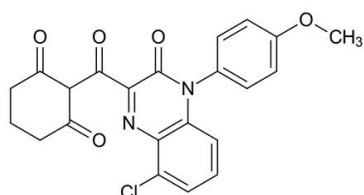
4 最新研发上市产品

HPPD抑制剂类除草剂虽然产品类型较老，但人们对该类产品的研发热情不减，并持续推出新产品。如2015年先正达上市了氟吡草酮，2017年石原产业上市了tolpyralate，2018年组合化学上市了fenquinotrione，2019年石原产业上市了lancotrione-sodium等；2018年以来，清源农冠更是连续上市4个该类除草剂。另外，富美实的F9960也在研发中。

4.1 F9960

F9960是由组合化学研发的HPPD抑制剂类除草剂，后被富美实收购。该产品具有触杀作用，主要防除玉米、大豆、棉花等作物田阔叶杂草，如豚草、问荆、田蓟、蒲公英、苋属杂草等；苗前、苗后施药。预计2024年上市。

4.2 fenquinotrione



分子式：C₂₂H₁₇ClN₂O₅

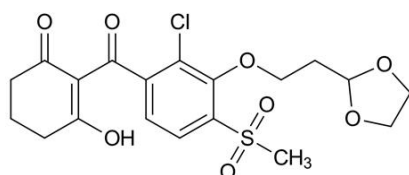
相对分子质量：424.1

CAS 登录号：1342891-70-6

图8 Fenquinotrione的结构式

Fenquinotrione（开发代号：KIH 3653）是组合化学研发的三酮结构的HPPD抑制剂类除草剂，2018年在日本上市，主要用于水稻田，防除阔叶杂草、禾本科杂草、莎草等；也可用于谷物田。苗前或苗后早期使用，有效成分用药量为125~250 g/hm²。

4.3 Lancotrione、SL-1201



分子式：C₁₉H₂₁ClO₈S

相对分子质量：444.9

CAS 登录号：1486617-21-3

图9 Lancotrione的结构式

Lancotrione（开发代号：SL-261）是由石原产业株式会社研发，以钠盐的形式（lancotrione-sodium）商品化，2019年上市。主要防除水稻田禾本科杂草、阔叶杂草、莎草，对野稗、蔗草、慈姑防效较好；苗前、苗后施药；对水稻安全。

SL-1201是石原产业株式会社研发的又一个HPPD抑制剂类除草剂，防除谷物、大豆、马铃薯等作物田禾本科杂草和阔叶杂草，如稗草、马唐、狗尾草、反枝苋、刺黄花稔、苘麻等。该产品将部分聚焦日本国内市场，有望于2022年上市。

4.4 清原农冠最新上市的4个HPPD抑制剂类除草剂

近年来，清原农冠连续推出4个HPPD抑制剂类除草剂，包括用于小麦田的环吡氟草酮、双唑草酮，用于水稻田的三唑磺草酮，以及用于玉米田的苯唑氟草酮。这4个有效成分均为苯甲酰吡唑类（或吡唑酮类）化合物，皆由青岛清原化合物有限公司自主研发、江苏清原农冠杂草防治有限公司独家登记。这些新产品的上市将为小麦、水稻、玉米田抗性杂草防控提供有效工具。

4.4.1 环吡氟草酮

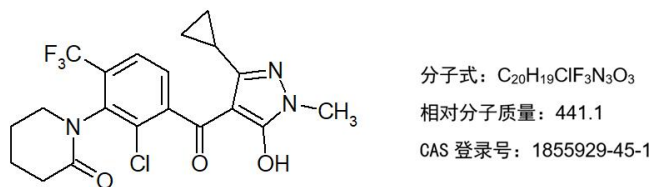


图10 环吡氟草酮的结构式

环吡氟草酮（通用名：cypirafluone；商品名：普草克[®]、虎贲[®]等）的创制和应用开启了HPPD抑制剂类除草剂应用于小麦田防除禾本科杂草的先河。该产品提供内吸传导作用，苗后茎叶处理，防除小麦田一年生禾本科杂草及部分阔叶杂草；具有杀草谱广、杀草彻底、不易反弹、安全性好等特点。

环吡氟草酮与目前小麦田主流药剂甲基二磺隆、啶磺草胺、氟唑磺隆等ALS抑制剂，炔草酯、唑啉草酯、精噁唑禾草灵等ACCase抑制剂，异丙隆等PS II电子传递抑制剂不存在交互抗性，可用于抗性和多抗性杂草的防除。

2018年，江苏清原农冠杂草防治有限公司在我国登记了95%环吡氟草酮原药、6%环吡氟草酮可分散油悬浮剂、25%环吡·异丙隆可分散油悬浮剂（3%环吡氟草酮+22%异丙隆）；3个产品均为低毒。其中，6%环吡氟草酮可分散油悬浮剂、25%环吡·异丙隆可分散油悬浮剂制剂量分别为：150~200、160~250 mL/667 m²；通过茎叶喷雾，防除冬小麦田一年生禾本科杂草及部分阔叶杂草。

2018年底，基于环吡氟草酮的产品在我国上市，受到市场的普遍欢迎。预计未来仅在中国的推广面积即可达4,000万~5,000万亩，全球峰值销售额将达5.00亿~7.00亿美元。

4.4.2 双唑草酮

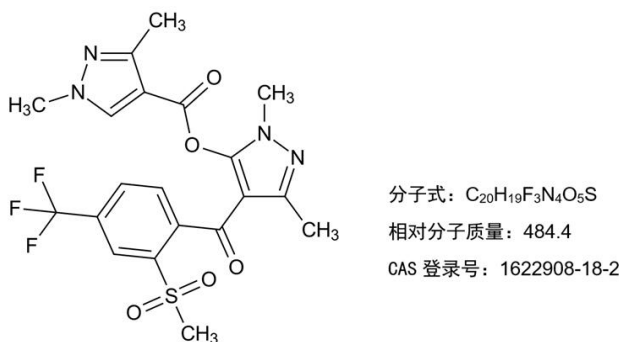


图11 双唑草酮的结构式

双唑草酮（通用名：bipyrzone；商品名：雪虎[®]、麦欢[®]、雪鹰[®]、麦豹[®]、满达[®]、锐宝[®]等）提供内吸传导作用，高效防除冬小麦田一年生阔叶杂草；具有杀草谱广、杀草彻底、不易反弹、安全性好（无需加入安全剂）、复配灵活性高等特点；苗后茎叶处理。

双唑草酮通过切断光合作用能量转换、抑制维生素合成、破坏对叶绿素的保护等3个途径导致杂草死亡，杂草很难产生靶标抗性；与麦田常用的苯磺隆、苄嘧磺隆、双氟磺草胺等ALS抑制剂类除草剂，2,4-滴、2甲4氯钠等激素类除草剂，乙唑氟草醚、唑草酮等PPO抑制剂类除草剂无交互抗性；对抗性和多抗性的繁缕、牛繁缕、播娘蒿、芥菜、麦家公、野油菜等防效优异。

2018年，江苏清原农冠杂草防治有限公司在我国登记了96%双唑草酮原药、10%双唑草酮可分散油悬浮剂、22%氟吡·双唑草酮可分散油悬浮剂；3个产品皆为低毒。其中，22%氟吡·双唑草酮可分散油悬浮剂为氟吡氧乙酸异辛酯（16.5%）与双唑草酮（5.5%）两种不同作用机理有效成分的复配产品，从而进一步扩大杀草谱、提升防治效果（如猪殃殃等）、减少用药量、提高作物安全性。10%双唑草酮可分散油悬浮剂、22%氟吡·双唑草酮可分散油悬浮剂的制剂量分别为：20~25、30~50 mL/667 m²。

2018年底，基于双唑草酮的产品在我国上市，在麦田除草剂市场引起了较大反响。



4.4.3 苯唑氟草酮

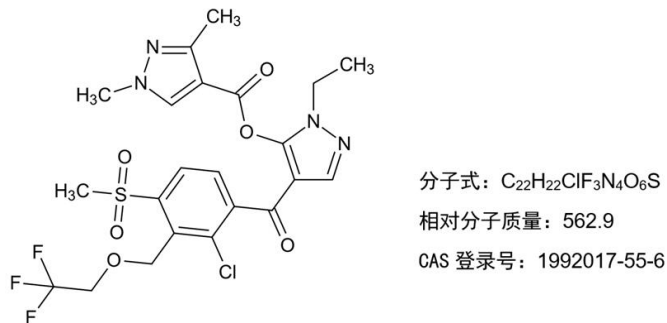


图12 苯唑氟草酮的结构式

苯唑氟草酮（通用名：fenpyrazone；商品名：清原金玉盈[®]、金稳玉[®]）是玉米田第三代HPPD抑制剂类除草剂，具有内吸传导作用，杀草活性高，苗后茎叶处理，防除阔叶杂草及禾本科杂草。对马唐、稗草、牛筋草、狗尾草、虎尾草、野糜子、野稷、止血马唐等常见禾本科杂草高效，对藜、苘麻、反枝苋、马齿苋、苍耳、龙葵等一年生阔叶杂草也有优异的防除效果，对抗烟嘧磺隆杂草具有很高的活性，与烟嘧磺隆（ALS抑制剂）无交互抗性。得益于其含氟的化学结构，苯唑氟草酮除草更快更彻底，不易返青；对玉米安全，并具有良好的后茬作物安全性。

2020年，江苏清原农冠杂草防治有限公司在我国登记了95%苯唑氟草酮原药、6%苯唑氟草酮可分散油悬浮剂、25%苯唑氟草酮·莠去津可分散油悬浮剂（3%苯唑氟草酮+22%莠去津）；3个产品均为低毒；制剂产品仅限于谷物类作物使用。

其中，6%苯唑氟草酮可分散油悬浮剂防除夏玉米田一年生杂草，制剂用量为75~100 mL/667 m²。25%苯唑氟草酮·莠去津可分散油悬浮剂防除春玉米田、夏玉米田一年生杂草，制剂用量分别为：200~300、150~200 mL/667 m²。

2020年，基于苯唑氟草酮的系列产品清原金玉盈[®]、金稳玉[®]在我国上市。该有效成分产品将代表下一代玉米苗后除草剂的发展方向。

4.4.4 三唑磺草酮

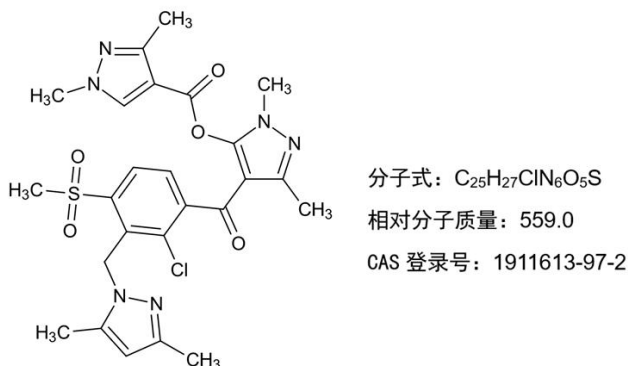


图13 三唑磺草酮的结构式

三唑磺草酮（通用名：tripyrasulfone；商品名：稻裕[®]、稻谷盈[®]、稷杰[®]；开发代号：QYR301）是清原农冠重磅推出的第4个HPPD抑制剂类化合物，是全球首例安全用于水稻田苗后茎叶处理防除禾本科杂草的HPPD抑制剂类除草剂。与公司之前推出的3款该类除草剂相比，三唑磺草酮结构更加复杂，分子中同时含有3个吡唑环。

三唑磺草酮定位于水稻田，杀草谱广，苗后茎叶处理，防除禾本科杂草和部分阔叶杂草，对稗草、千金子、鸭舌草、鳢肠、碎米莎草、稻稗等活性较高；并能高效防除抗性千金子和多抗性稗草、稻稗等。对水稻安全，适用于水稻移栽田和直播田。研究发现，三唑磺草酮对未出苗（0叶期）的稗草也表现出一定的防效，说明其还具有土壤处理活性。

三唑磺草酮可以通过3个途径（切断光合作用能量转换、抑制维生素合成、破坏对叶绿素的保护）导致杂草死亡，作用机理复杂，杂草很难产生抗药性。三唑磺草酮与稻田常用除草剂五氟磺草胺、氰氟草酯、二氯喹啉酸等无交互抗性；可有效防除水稻田对ALS抑制剂、ACCase抑制剂产生抗性的稗属杂草，以及对ACCase抑制剂产生抗性的千金子。

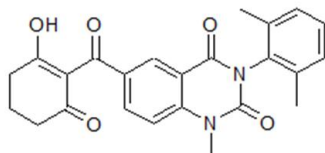
清原农冠将采集到的上万份疑似多抗性稗草进行了检测，结果表明，三唑磺草酮对这些多抗性稗草表现出较高的防效。

2020年，江苏清原农冠杂草防治有限公司基于三唑磺草酮的3个产品在我国取得登记，分别为：95%三唑磺草酮原药、6%三唑磺草酮可分散油悬浮剂（防除直播、移栽水稻田稗草）、28%敌稗·三唑磺草酮可分散油悬浮剂（防除直播水稻田稗草）；3个产品均为低毒。

三唑磺草酮可与2甲·灭草松混用，以提高对阔叶杂草和莎草科杂草的防效，实现禾阔莎一次防除，提高除草效率。

2020年，基于三唑磺草酮的3个系列品牌产品稻裕[®]、稻谷盈[®]、梗杰[®]在我国全新上市，高效防除水稻田抗性千金子、多抗性稗草等，具有广阔的应用和市场前景。

4.5 喹草酮



分子式：C₂₃H₂₂N₂O₅

相对分子质量：406.4

图14 喹草酮的结构式

华中师范大学化学学院杨光富团队通过研究，创制了基于喹唑啉二酮类全新骨架的HPPD抑制剂类除草剂喹草酮，在全球首次实现将该类除草剂应用于高粱田防除单双子叶杂草，解决野麻子、虎尾草等恶性杂草的防控问题。

喹草酮对高粱表现出高度的安全性，对玉米、小麦、甘蔗也安全。具有内吸性，速效性好；可被植物茎叶吸收，防除或抑制高粱田一年生杂草，如野麻子、马唐、稗草、牛筋草、狗尾草、野黍、藜、苘麻、反枝苋、鸭跖草、马齿苋、苍耳等，尤其对狗尾草、野麻子防效优异。具有优异的毒理学性质和环境相容性。

2016年，喹草酮转让给山东先达，正式启动了该产品的登记工作。2020年，辽宁先达农业科学有限公司在我国登记了98%喹草酮原药、10%喹草酮悬浮剂；两产品均为低毒。其中，10%喹草酮悬浮剂通过茎叶喷雾，防除高粱田一年生杂草，制剂量为60~100 mL/667 m²。

喹草酮的推出将可以解决高粱田全生育期杂草防控技术难题，减少施用除草剂1次，减少除草剂有效成分用药量50%以上。

5 最新研发的主要竞争产品

近年来，研究人员还不断研发出其他作用机理的新型除草剂，其中，有些产品或将在玉米、谷物、水稻等作物市场对HPPD抑制剂类除草剂形成竞争之势。如可能在玉米田除草剂市场形成竞争的三氟草嗪、F4050、epyrifenacil等；可能在谷物田除草剂市场形成竞争的cyclopyrimorate、cinmethylin、bixlozone、F4050、SL-1201、epyrifenacil等；可能在水稻田除草剂市场形成竞争的cyclopyrimorate、bixlozone、F4050、cyclopyranil、tetflupyrolimet、dimesulfazet、epyrifenacil等。

三氟草嗪（通用名：trifludimoxazin；商品名：Tirexor；开发代号：BAS 850 H）是巴斯夫研发的原卟啉原氧化酶（PPO）抑制剂，为三嗪酮类除草剂，主要用于玉米、大豆、小粒谷物、果树等，防除黑麦草、阔叶杂草、抗性杂草等，如苋属、豚草属杂草等，播后苗前、苗后使用。2020年在澳大利亚首获登记，将于2021年上市。

F4050由富美实研发，主要防除玉米、水稻、谷物、大豆、向日葵等作物田阔叶杂草，苗前、苗后施药。预计2025年上市。

Cyclopyrimorate（开发代号：SW-065）是由三井化学AGRO株式会社研发的拥有新颖作用机理的除草剂，为尿黑酸茄尼基转移酶抑制剂（homogentisate solanesyltransferase inhibitor），主要防除谷物、水稻田阔叶杂草、莎草。2019在日本首先上市。

环庚草醚（通用名：cinmethylin；商品名：Luximo；开发代号：BAS 684 H）是由巴斯夫研发的拥有独特作用机理的除草剂，为酰基载体蛋白（ACP）脂肪酸硫酯酶（FAT）抑制剂。苗前除草，具有持效作用，主要防除谷物田禾本科杂草，如大穗看麦娘、黑麦草等。2020年在澳大利亚率先上市，2021年将在英国上市。

Bixlozone（开发代号：F9600）是由富美实研发的异噁唑啉酮类除草剂，为脱氧-D-木酮糖磷酸合酶抑制剂，是异噁草松的类似物。主要用于谷物、水稻、甘蔗、棉花、油菜、果树、蔬菜等作物田，防除阔叶杂草、禾本科杂草、莎草等。2020年，bixlozone在澳大利亚首获登记，将于2021年上市。

Tetflupyrolimet是由杜邦（现科迪华）研制，后转让给富美实，为二氢磷酸脱氢酶（DHO dehydrogenase）抑制剂，主要用于玉米、水稻、大豆、小麦等作物田，防除一年生杂草及抗性杂草，如稗草、地肤、沼生异蕊花、大狗尾草等，苗前使用效果更好。预计2023年上市，年峰值销售额有望达3.00亿美元。

Dimesulfazet（开发代号：NC-653）是由日产化学株式会社研发的磺酰苯胺类除草剂，为极长侧链脂肪酸生物合成抑制剂，防除水稻田莎草和抗性杂草等。预计2024年在日本率先上市，年峰值销售额有望达0.25亿美元。

氯氟吡啶酯（通用名：florpyrauxifen-benzyl；商品名：Rinskor、Lovant）是由陶氏益农（现科迪华）研发的芳基吡啶甲酸酯类除草剂，2018年上市，主要用于水稻、玉米田，防除一年生杂草。预计其年峰值销售额约达4.00亿美元。

氟噁硫草酯（通用名：tiafenacil；商品名：Terrad'or；开发代号：DCC-3825）是由福阿母韩农株式会社研发的新型咪唑啉类非选择性除草剂，为新型PPO抑制剂类除草剂。主要用于大豆、油菜、水稻、玉米、小麦等作物田，也用于果园和非耕地，种植前、苗前、苗后防除阔叶杂草和禾本科杂草，如苘麻、苋属、稗草等，并能防除对草甘膦产生抗性的杂草。还可作为脱叶剂，用于棉花等作物。

Epyrifenacil（开发代号：S-3100）是由住友化学研发的PPO抑制剂类除草剂，主要用于玉米、水稻、小麦、大麦、大豆、高粱、花生、棉花、甜菜、向日葵、油菜、花卉、观赏植物等，防除阔叶杂草和禾本科杂草。预计2025年上市。

Cyclopyranil（KY-1211）是由Kyoyu Agri研发的PPO抑制剂类除草剂，主要防除水稻田禾本科杂草和阔叶杂草，对旱地作物田的蔷薇科杂草、藜麦、苋属杂草等防效较好。其作用方式与结构相似的双唑草腈相同。预计cyclopyranil的年峰值销售额约达0.50亿美元。

6 市场前景

研究认为，作用于HPPD靶标酶的除草剂具有非常好的市场潜能。该类产品可选择性防除许多阔叶杂草、禾本科杂草及抗性杂草，特别适用于玉米，近年来还用于水稻、谷物、转基因大豆、高粱等作物田。该类除草剂现已成为全球研发的热门领域，持续上市新产品。

在HPPD抑制剂类除草剂中，硝磺草酮、异噁唑草酮领军市场，环磺酮、氟吡草酮等成为重要的增长品种。异噁唑草酮在上市之初，曾受到耐农达玉米上市的不利影响，但近几年其市场快速增长，这主要得益于其与新上市产品的复配以及在甘蔗上的使用增加。

HPPD抑制剂类除草剂亦已进入水稻市场，呋喃磺草酮上市之初，市场增长强劲，但近年来的增速放缓，主要因为日本和韩国水稻种植面积下降。

随着磺酰草吡唑的上市，HPPD抑制剂类除草剂在谷物市场的销售额增加。目前进入谷物市场的该类除草剂还有清原农冠的环吡氟草酮、双唑草酮等，它们在防除难治杂草、抗性杂草方面担纲了重要角色。

HPPD抑制剂类除草剂抗性水平很低，目前报道的抗性案例仅有4个。

综合考虑多重影响因素后，Phillips McDougall公司认为，HPPD抑制剂类除草剂仍具备增长的潜力，预计2024年的销售额将增至22.75亿美元，2019—2024年的复合年增长率为4.9%（基于2019年的汇率）。

关键字

农药资讯网

HPPD抑制剂

硝磺草酮

异噁唑草酮

环磺酮

苯唑草酮

氟吡草酮

环吡氟草酮

双唑草酮

三唑磺草酮

苯唑氟草酮



0



热门文章

联苯吡菌胺：拜耳富美实联袂打造的重磅杀菌剂

联苯吡菌胺是由拜耳作物科学公司研发的联苯基吡唑酰胺结构的杀菌剂，是目前增长最快的琥珀酸脱氢酶抑制剂（SDHI）类杀菌剂中的重要成员。2003年发现，2006年公开，2010年登记和上市，拜耳公司生产。联苯吡菌胺是拜耳、富美实联袂打造的重磅杀菌剂，现已跻身SDHI类杀菌剂四强之列。拜耳预计，联苯吡菌胺的年峰值销售额将突破

优秀抗性杂草治理新工具——氯氟吡啶酯

激素类除草剂通常具有传导性好，除草谱广，成本低，且不易产生抗性等优点，在世界范围内广泛使用。近年来，2种具有新型芳基吡啶甲酸酯结构的激素类除草剂——氯氟吡啶酯和氯氟吡啶酯开发上市，为激素类除草剂市场发展注入了新的活力。与其他激素类除草剂相比，氯氟吡啶酯和氯氟吡啶酯用量更低，除草谱更广，对环境友好，是抗性杂草治理的新工具。

巴斯夫农药研发及近年来上市的新产品

巴斯夫始创于1865年，为全球第一大化学品公司、第三大农药公司，旗下拥有表面处理技术、材料、化学品、工业解决方案、农业解决方案、营养与护理等六大业务领域。巴斯夫现代植保业务起源于20世纪40年代，最初推出苯氧类除草剂，继而陆续上市了多个杀菌剂，如代森联、氟环唑、醚菌酯、吡唑醚菌酯、氟唑菌酰胺等，为杀菌剂发展打下坚实基础

稻飞虱防治新标杆——三氟苯嘧啶

三氟苯嘧啶是杜邦公司（现科迪华）历时多年打造的一款新型介离子嘧啶酮类杀虫剂，为烟碱乙酰胆碱受体抑制剂，能有效防治鳞翅目和同翅目害虫。三氟苯嘧啶现已在亚太地区广泛登记和上市，高效防控稻飞虱等害虫及预防稻飞虱传播的病毒病，已成为稻飞虱防治的新标杆。1 理化性质及毒性三氟苯嘧啶英文通用名triflumezop

水稻田除草剂迭代升级，新型HPPD抑制剂重磅切入

水稻是我国的四大主粮之一，也是世界重要的粮食作物，全球种植面积约1.6亿公顷，成为植保产品重大的用武之地。目前，水稻用农药市场约占全球作物用农药市场的10%，除草剂占据首位。其中，氰氟草酯、五氟磺草胺在全球广泛使用。水稻田杂草种类繁多，加之除草剂的长期、大量使用，杂

30家农药上市公司年报盘点

目前，农药上市公司2021年年报基本发布完毕。本文统计了30家营业收入8亿元以上的农药上市公司（快达农化并入利尔化学统计）年报。其中，28家上市公司实现盈利，21家上市公司实现营业收入和净利润双增长。根据年报，营业收入最高的是安道麦A，为310.39亿元；其次为兴发集团，营业收入236.07亿元；列第三位的是新安股份，

创新发展，久易股份业绩飙升

安徽久易农业股份有限公司（简称“久易股份”）一直专注于农药原药、制剂的研发、生产及销售，尤其在新产品研发及市场推广领域，公司积累了丰富的经验，并从中获益良多。公司在烟嘧磺隆原药及制剂产品上精耕细作，同时不断创新产品；杀菌剂丙硫菌唑原药及其制剂产品进一步推广，并得到市场广泛认可；除草剂环磺酮原药及

重磅杀菌剂氯氟醚菌唑的市场开发进展

作为全球第三大农药公司，巴斯夫在农药研发领域持续高投入，每年的研发费用约占公司销售额的10%，并从研发之初就植入可持续发展基因，从而源源不断地向市场推出具有持久生命力的新产品。在杀菌剂领域，巴斯夫亦已打造多款爆品，如甲氧基丙烯酸酯类杀菌剂中的吡唑醚菌酯、三唑类杀菌剂中的氟环唑、琥珀酸脱氢酶抑制剂（SDHI）类杀菌剂中的

最近登记及上市的16个农药新品种

作物在生产过程中不可避免会遭受病虫害的侵扰，使用农药不仅能有效防治病虫害，而且能大幅度提高作物品相和产量。近年来多个农药品种因环境及安全等问题，先后退出市场，市场呼唤更多对人类安全，对环境友好的新农药。本文归纳总结了全球16个新近登记、上市的农药品种，包括除草剂5个，杀虫剂4个，杀菌剂5个，杀线虫剂2个。针对16个

氟吡菌酰胺：优秀的杀菌/杀线虫剂，2023年专利到期

近年来，琥珀酸脱氢酶抑制剂（SDHI）类杀菌剂一直保持较快的增长速度，尤其是2010年之后上市的多个产品，强劲提升了该类杀菌剂的市场地位。目前上市的SDHI类杀菌剂有20多个，其中拜耳贡献了4个产品，包括2010年上市的联苯吡菌胺，2012年上市的氟唑菌苯胺、氟吡菌酰胺，以及2020年上市的isoflucypram。2

网站声明

- (1) 本网旨在传播信息，促进交流，多方面了解农药发展动态，但不构成任何投资建议。
- (2) 所有文章仅代表作者观点，不代表本网立场。
- (3) “信息来源：江苏省农药协会 农药资讯网”为原创文章，转载时请注明来源和作者。
- (4) 本网转载文章的版权属于原作者，若有侵权，请联系删除。

友情链接 | 农业农村部 | 生态环境部 | 中国农药信息网 | 种植业管理司 | 全国农技推广网 | 江苏植保网 | 江苏省应急管理厅 | 江苏省生态环境厅 |



首页 / 新闻综合 / 政策法规 / 企业动态 / 研发生产 / 安全环保 / 质量管理 / 价格行情 / 植保资讯 / 经济运行 / 下载中心 / 关于我们

联系电话：025-86631831 传真：025-86638816 E-mail: jsppa126@126.com
邮政编码：210024 地址：南京市北京西路17号（化工大厦）主办单位：江苏省农药协会
版权所有 Copyright © 2019 农药资讯网 备案号：苏ICP备19029622-1号