

◆ 综述与进展 ◆

氟氯氨草酯的应用与开发进展

李绍晨^{1,2}, 马淑晴^{1,2}, 李亚辉^{1,2*}

(1. 贵州大学 精细化工研究开发中心, 贵阳 550025; 2. 安徽农业大学资源与环境学院, 农产品质量安全危害因子与风险控制安徽省重点实验室, 合肥 230036)

摘要: 氟氯氨草酯是清原农冠于2019年自主研发的新型吡啶氧羧酸类非选择性除草剂, 属于合成激素类除草剂。其除草谱广, 在低温下也能保持稳定的防效, 对禾本科杂草、阔叶杂草、莎草科杂草均有效。本文综述了氟氯氨草酯的作用机理、环境归趋、合成化学、登记情况, 以及专利概况。

关键词: 氟氯氨草酯; 作用机理; 环境归趋; 登记; 合成化学; 专利; 开发进展

中图分类号: TQ 457.2 文献标志码: A doi: 10.3969/j.issn.1671-5284.2026.01.002

Application and development progress of fluchloraminopyr-tefuryl

LI Shaochen^{1,2}, MA Shuqing^{1,2}, LI Yahui^{1,2*}

(1. Center for Research and Development of Fine Chemicals of Guizhou University, Guiyang 550025, China; 2. Anhui Provincial Key Laboratory of Hazardous Factors and Risk Control of Agri-Food Quality Safety, School of Resources and Environment, Anhui Agricultural University, Hefei 230036, China)

Abstract: Fluchloraminopyr-tefuryl is a novel pyridineoxy carboxylic acid-type non-selective herbicide independently developed by Qingyuan Agro (KingAgroot) in 2019. It has a broad spectrum of weed control, maintains stable efficacy even at low temperatures, and is effective against gramineous weed, broadleaf weeds, and sedge weeds. This article reviewed the mechanism of action, environmental fate, synthetic chemistry, registration, and patent status of fluchloraminopyr-tefuryl.

Key words: fluchloraminopyr-tefuryl; mechanism of action; environmental fate; registration; synthetic chemistry; patent; development progress

氟氯氨草酯(fluchloraminopyr-tefuryl)是清原农冠自主研发的吡啶氧羧酸类新型非选择性除草剂, 属内吸传导型合成生长素类(激素类)除草剂, 具有长效灭生和广谱除草特性。该药剂可用于荒山、坡地、路旁、沟边等非耕地除草, 也可用于部分果园行间除草, 能有效防除对草甘膦产生抗性的多种杂草, 如牛筋草、稻李氏禾、鸭跖草、田旋花、加拿大飞蓬和芦苇等。同时, 其对林地和非耕地中顽固灌木及藤蔓植物也具有良好的防除效果。

1 作用机理及应用

从结构上看, 氟氯氨草酯类似于2,4-滴。其是在

氯氟吡氧乙酸(fluroxypyr)的 β -羰基位引入甲基得到氟氯氨草酸(fluchloraminopyr)后, 再与四氢糠醇发生酯化反应得到(见图1)。氟氯氨草酯是一种新型合成激素类除草剂。施药后, 其被植物快速吸收, 模拟过量的生长素, 导致基因表达失控, 引起细胞异常分裂与伸长, 最终导致植株畸形并缓慢死亡^[1-2]。

生长激素类除草剂的作用机制较为复杂。在植物体内, 部分基因的转录由生长素反应因子(ARFs)激活。当ARFs被2个密切相关的Aux/IAA抑制蛋白家族阻断时, 其活性受到抑制。生长素的存在可通过泛素-蛋白酶体系统介导Aux/IAA抑制因子的靶向降解。该过程涉及由Skp1、Cullin 1和F-box蛋白组

收稿日期: 2025-06-10

基金项目: 国家重点研发计划项目(2021YFD1700100)

作者简介: 李绍晨, 博士, 研究方向 新农药创制。E-mail: lishaochen@ahau.edu.cn

通信作者: 李亚辉, 博士, 教授/博导, 研究方向 新农药创制。E-mail: Yahui.Li@ahau.edu.cn

成的E3泛素连接酶,其中TIR1蛋白及其同源物AFB1~5作为F-box底物受体,共同构成SCFTIR1/AFB1~5复合物。生长素分子占据该连接酶F-box腔的底部,作为“分子胶”固定Aux/IAA抑制因子。随后,SCFTIR1/AFB-5复合物催化抑制因子与小蛋白泛素的共价结合,进而被26S蛋白酶体降解。抑制因子的缺失会激活一系列基因的过度表达,包括参与乙烯生物合成的基因(如1-氨基环丙烷羧酸合成酶)、脱落酸合成相关基因(如9-顺式环氧类胡萝卜素双加氧酶)以及其他生长素响应基因,最终导致植物死亡^[3]。

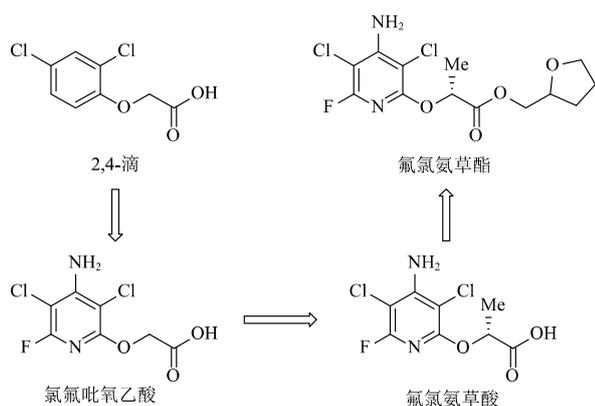


图1 2,4-滴、氯氟吡氧乙酸、氟氯氨草酸和氟氯氨草酯的结构式

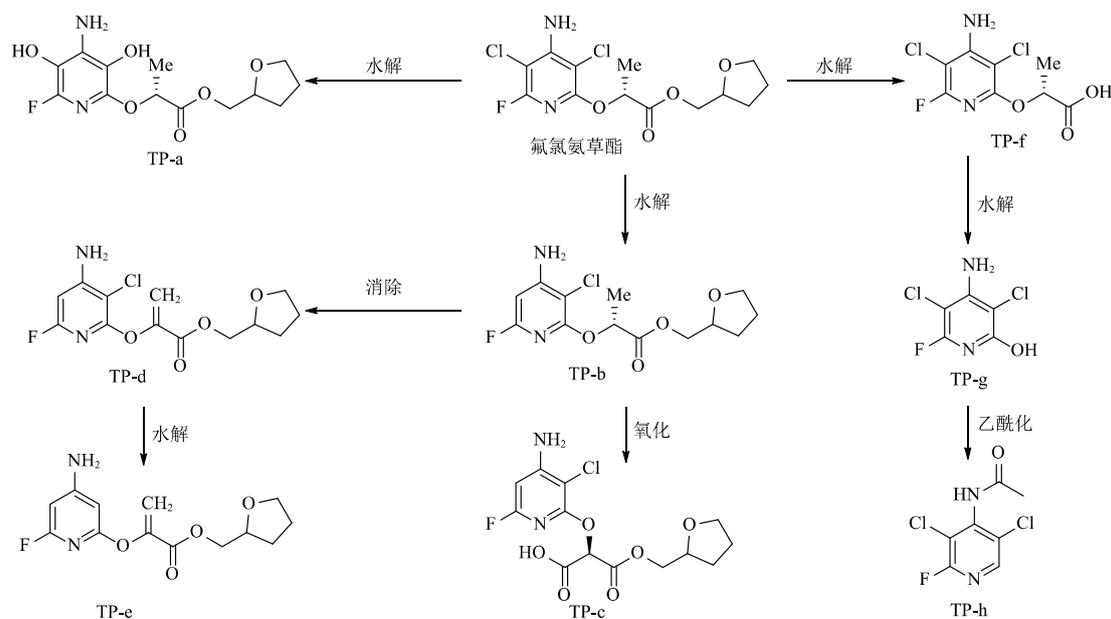


图2 氟氯氨草酯在土壤中降解产物(TP-a~TP-h)和可能降解途径

氟氯氨草酯在田间应用中表现出良好的适应性,其活性受温度影响较小,即使在低温条件下也能保持稳定高效的除草效果。相较于其他合成激素类除草剂,其不仅对阔叶杂草和莎草科杂草具有广谱防效,更显著提升了对禾本科杂草的防控能力,能有效防除牛筋草、马唐、稗草、千金子、狗尾草、稻李氏禾、看麦娘、日本看麦娘及狗牙根等多种难防禾本科杂草。这一特性使得其能够弥补草甘膦、百草枯、草铵膦等主流灭生性除草剂在除草谱上的局限性,尤其在禾本科杂草多发区域展现出重要的应用价值^[3]。

2 环境归趋

2024年,中国农业科学院植物保护研究所首次评估了氟氯氨草酯于好氧/厌氧条件下在4种代表性土壤(黑土、潮土、褐土和红壤)中的消解动态。结果显示,其消解半衰期(DT_{50})为0.107~4.760 d。如图2所示,通过超高效液相色谱-四极杆飞行时间质谱联用(UPLC-QTOF/MS)和密度泛函理论(DFT)计算,鉴定出氟氯氨草酯在土壤降解过程中产生的8种转化产物(TP-a~TP-h)及可能的降解路径。此外,基于ADMETlab 2.0预测了母体化合物及其转化产物的毒性。结果表明,其具有相对较低的致癌性和呼吸毒性风险^[4]。

3 合成路线

氟氯氨草酯的合成主要经历3步反应(见图3)。

首先,在相转移催化剂四丁基溴化铵(TBAB)存在下,4-氨基-3,5-二氯-6-氟吡啶-2-醇钾盐与(S)-2-溴丙酸甲酯发生亲核取代反应,生成关键中间体氟氯氨

草酸甲酯。随后,该中间体在氢氧化锂(LiOH)的甲醇溶液中进行水解反应,得到相应的羧酸衍生物氟氯氨草酸。最后,此羧酸与四氢糠醇在脱水缩合剂

二环己基碳二亚胺(DCC)作用下发生酯化反应,制得目标产物氟氯氨草酯^[4-5]。该路线操作简便,反应条件温和,是制备该除草剂的有效方法之一。

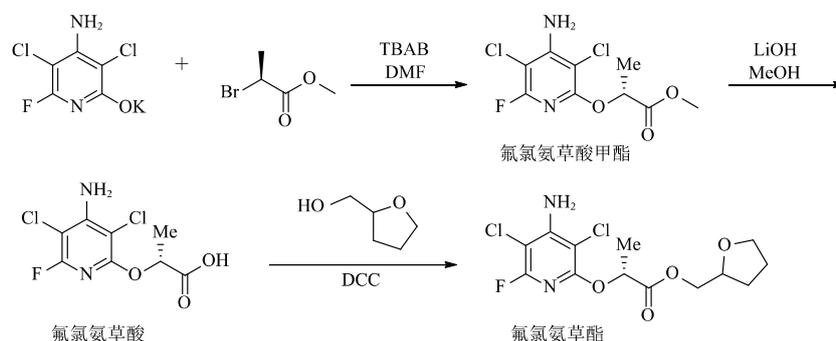


图 3 氟氯氨草酯的合成路线

分析其合成路线可知,氟氯氨草酸甲酯是制备氟氯氨草酯的关键中间体。鉴于原路线所使用的(S)-2-溴丙酸甲酯价格较高,安徽农业大学对其合成工艺进行了改进(图4)。以2,6-二氟-3,5-二氯吡啶-4-

胺为起始原料,选用价格更低的(R)-乳酸甲酯替代(S)-2-溴丙酸甲酯,以98%的收率和91%的对映体过量值(ee值)成功制备出该关键中间体^[6]。这一改进显著降低了前期原料成本。

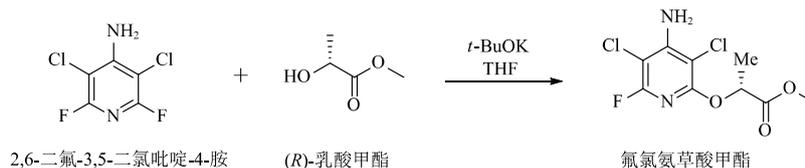


图 4 氟氯氨草酸甲酯的改进制备路线

4 登记情况

2022年4月,氟氯氨草酯在柬埔寨获得全球首次登记。2024年6月,98%氟氯氨草酯原药(仅限出口

至柬埔寨)在中国完成登记。截至2025年12月,氟氯氨草酯在中国登记的产品共有5个,均为仅供境外使用农药,登记证持有人均为山东清原农冠作物科学有限公司。其登记详情见表1^[7]。

表 1 氟氯氨草酯在中国的登记情况

农药名称	农药类别	各有效成分含量	剂型
氟氯氨草酯	除草剂	98%	原药
氟氯氨草酯·精草铵膦	除草剂	氟氯氨草酯50 g/L+精草铵膦100 g/L	微乳剂
草甘膦·氟氯氨草酯	除草剂	草甘膦60 g/L+氟氯氨草酯300 g/L	微乳剂
氟氯氨草酯	除草剂	300 g/L	乳油
氟草啶·氟氯氨草酯	除草剂	氟草啶40 g/L+氟氯氨草酯200 g/L	乳油

5 专利概况

2019年,青岛清原化合物有限公司申请了专利CN 111377856B,发明名称为“R型吡啶氧基羧酸及其盐、酯衍生物、制备方法、除草组合物和应用”。该专利权利要求书涵盖了氟氯氨草酯的化学结构通式、合成路径等^[8]。

2020年,青岛清原化合物有限公司进一步申请

了专利CN 112273395A,发明名称为“包含R型吡啶氧基羧酸衍生物的除草组合物及其应用”。其保护范围涵盖了氟氯氨草酯及其衍生物与其他除草剂的组合,以及其应用^[5]。

2020年,江苏清原农冠杂草防治有限公司申请了专利CN 112741097B,发明名称为“包含N-(1,3,4-噁二唑-2-基)芳基甲酰胺类化合物的除草组合物及其应用”。以除草有效量的氟氯氨草酯,与HPPD抑

制剂、DOXP抑制剂、PPO抑制剂等其中一种组合,能有效防除异型莎草等莎草科杂草、稻稗等禾本科杂草,以及鸭舌草等阔叶杂草。组合使用具有扩大除草谱,减少施用量,产生增效作用并解决抗药性杂草等特点^[9]。

2022年,江苏清原农冠杂草防治有限公司申请了专利CN 118056496A,发明名称为“包含氟氯氨草酯的三元除草组合物及其应用”。该专利涉及包含氟氯氨草酯的三元除草剂组合物及其应用,配伍成分分别选自苯唑氟草酮、硝磺草酮、苯唑草酮、异噁唑草酮、氟吡草酮、tolpyralate中的1种和莠去津、特丁津中的1种^[10]。

2023年,巴斯夫欧洲公司申请涉及氟氯氨草酯的除草组合物专利CN 119451575A,发明名称为“包含L-草铵膦或其盐和第二种除草剂的除草混合物”。其中第二种除草剂包括氟氯氨草酯^[11]。

2025年,安徽农业大学申请了专利CN 120349278A,发明名称为“一种氟氯氨草酯中间体的制备方法”。该专利优化了氟氯氨草酯关键中间体的合成工艺^[6]。

6 总结

氟氯氨草酯是我国自主研发、包含吡啶结构的合成激素类除草剂,具有强内吸传导性和长效灭生性。其除草谱广,能有效防除对草甘膦、草铵膦等灭生性除草剂产生抗性的杂草,以及小飞蓬等多种顽固性杂草;同时,对林地、非耕地中难防除的小灌木及藤本植物也表现出良好的防效。此外,氟氯氨草酯在土壤中降解迅速,其降解产物具有较低的毒性

风险,展现出广阔的应用前景。

参考文献

- [1] 吕庆浩,陈姿,董立尧,等. 激素类除草剂氟吡啶酯的毒理与抗性研究进展[J]. 植物保护学报, 2025, 52(2): 274-283.
- [2] 叶萱. 杂草对合成生长素类除草剂的抗性[J]. 世界农药, 2018, 40(6): 1-9.
- [3] ZAKHARYCHEV V V, MARTSYNKEVICH A M. Development of novel pyridine-based agrochemicals: a review[J]. Advanced Agrochem, 2025, 4: 30-48.
- [4] ZHOU W T, ZHANG W B, HAN H L, et al. Degradation of a novel herbicide fluchloraminopyr in soil: dissipation kinetics, degradation pathways, transformation products identification and ecotoxicity assessment[J]. Environment International, 2024, 193: 109135.
- [5] 彭学岗,赵德,崔琦,等. 包含R型吡啶氧基羧酸衍生物的除草组合物及其应用: ZL, 202010228317.6[P]. 2021-01-29.
- [6] 李亚辉,田青强,李赵,等. 一种氟氯氨草酯中间体的制备方法: ZL, 202510771347.4[P]. 2025-07-22.
- [7] 农业农村部农药检定所. 农药登记数据[DB/OL]. [2025-12-12]. <http://www.chinapesticide.org.cn/zwb/dataCenter>.
- [8] 连磊,彭学岗,华荣保,等. R型吡啶氧基羧酸及其盐、酯衍生物、制备方法、除草组合物和应用: ZL, 201911321469.4[P]. 2020-07-07.
- [9] 彭学岗,张景远,赵德,等. 包含N-(1,3,4-噁二唑-2-基)芳基甲酰胺类化合物的除草组合物及其应用: ZL, 202010953693.1[P]. 2022-11-29.
- [10] 李平生,姜若赬,赵德,等. 包含氟氯氨草酯的三元除草组合物及其应用: ZL, 202211445680.9[P]. 2024-05-21.
- [11] 扎加尔 C. 包含L-草铵膦或其盐和第二种除草剂的除草混合物: ZL, 202380049710.0[P]. 2025-02-14.

(上接第13页)

- [102] LIU Y, YANG H H, WEN F, et al. Chitooligosaccharide-induced plant stress resistance[J]. Carbohydrate Polymers, 2023, 302: 120344.
- [103] 周欣欣,吴声敢,王倬,等. 植物免疫诱导剂酰氨基寡糖素对环境非靶标生物的毒性研究[J]. 现代农药, 2022, 21(3): 50-53.
- [104] LIAQAT F, ELTEM R. Chitooligosaccharides and their biological activities: a comprehensive review[J]. Carbohydrate Polymers, 2018, 184: 243-259.
- [105] 陈谊,张彩菊,蒋洪. 胆钙化醇灭鼠剂的研究[J]. 中华卫生杀虫药械, 2014, 20(3): 282-286.
- [106] GROSU C, JIJIE A R, MANEA H C, et al. New insights concerning phytophotodermatitis induced by phototoxic plants[J]. Life, 2024, 14(8): 1019.
- [107] SHAO X H, ZHANG Z H, QIAN X H, et al. Potential biochemical pesticide—synthesis of neofuranocoumarin and inhibition the proliferation of *Spodoptera frugiperda* cells through activating the mitochondrial pathway[J]. Toxins, 2022, 14(10): 677.
- [108] CHEN C Y, TANG Z B, LIU Z C. Recent advances in the synthesis and applications of furocoumarin derivatives[J]. Chinese Chemical Letters, 2023, 34(9): 108396.
- [109] WU J C, WANG L Y, ZHANG Y F, et al. Synthesis and photoactivated toxicity of 2-thiophenylfuranocoumarin induce midgut damage and apoptosis in *Aedes aegypti* larvae[J]. Journal of Agricultural and Food Chemistry, 2021, 69(3): 1091-1106.
- [110] QBAL Z, IQBAL M S, HASHEM A, et al. Plant defense responses to biotic stress and its interplay with fluctuating dark/light conditions[J]. Frontiers in Plant Science, 2021, 12: 631810.
- [111] 李琳红,王海宝,梁沛. RNA杀虫剂研究进展[J]. 现代农药, 2024, 23(4): 13-21.
- [112] 路子琪,王静,张震,等. 基于RNAi的生物农药研究进展[J]. 浙江农业学报, 2024, 36(4): 968-977.