**附件：2018-2019年度神农中华农业科技奖公示内容**

**一、成果名称**

新型杀菌剂丁香菌酯的创制与应用

**二、成果简介**

苹果树腐烂病和水稻纹枯病是影响苹果与水稻安全生产的重大病害，流行年份导致死树毁园或大幅减产，甚至绝收。该项目针对生产中缺乏安全高效防治药剂的重大需求和绿色农药原始创新投入大、成功率低等难题，创建了中间体衍生化法，以天然产物香豆素为模板和中间体,创制了获多国发明专利、高效、低毒、环境友好的新型仿生杀菌剂丁香菌酯。探明了作用机制，解决了上述病害防治难题，获得大面积推广应用，实现了绿色农药原始创新的重大突破。

1、针对绿色农药品种原始创新重大科技难题，创建了绿色农药分子设计和品种创制的新方法中间体衍生化法，大幅提高了新农药创制成功率、降低了研发成本。化学农药属有机小分子，通过逆合成分析可知，其化学结构是由一个或几个原料（中间体）经过化学反应得到。就市场而言，新农药必须具有专利权与高性价比优势，而农药的专利、性能都与化学结构有关，成本则取决于原料（中间体）及其价格和化学反应。基于此，创建了中间体衍生化法：在分子设计之时，同步考虑未来产品的开发，选用便宜易得、安全环保的原料（中间体）和易于工业化的化学反应，发明性价比高、专利权稳定的新农药品种。1999−2013年，该项目团队采用中间体衍生化法，在研究投入仅为国外公司8%的情况下，使新农药创制成功率提高了90%。

2、针对重大病害苹果树腐烂病、水稻纹枯病防治药剂缺乏的难题，采用中间体衍生化法，发明了丁香菌酯。天然产物是创制绿色农药的重要源泉，以香豆素为模板和中间体，经多轮“设计-合成-测试-分析”研究，3次先导化合物的优化升级，历时11年发明了含两个天然产物片段结构新颖、高效、低毒、环境友好的仿生杀菌剂丁香菌酯，获多国发明专利；对两类重大病害具有很好的防治效果，显著优于多种常用药剂。2010年获新农药登记，并实现了产业化。

3、探明了丁香菌酯的作用机制和抗性机制，研发了增效减量用药新混剂，获农药登记。探明了丁香菌酯为线粒体呼吸抑制剂，其对线粒体复合物III(泛醌-细胞色素c还原酶)具有明显的抑制活性，IC50值为0.052µM；采用分子对接和定点突变方法推定复合物III上细胞色素bc1复合体的Cyt b上L129−G143为丁香菌酯的主要结合腔；明确了病原菌对丁香菌酯的抗性位点主要为Cyt b上A86V和G143A的连锁性突变，且抗性风险低于嘧菌酯。基于此，发明了增效减量组合物，研发了绿色农药剂型，获准登记，并实现了大面积推广应用。

该项目实现了“方法创新-产品创新-应用创新”，获国内外发明专利40件，其中美、欧、日等5件；发表论文98篇，其中SCI论文34篇（单篇最高影响因子45.66、他引58次）；出版专著1部；获农药登记证4个。近两年实现销售7858万元，应用面积1007.55万亩次，农业增收或挽回损失48.88亿元。获中国石化联合会技术发明奖一等奖、中国发明专利奖优秀奖、中国农业农村十大新产品、中国植保市场最具爆发力品牌产品等10项科技奖励与荣誉。该成果达到国际领先水平，为提升我国农药原始创新及重大作物病害防治的科技水平做出了重要贡献。

**三、主要完成人情况**

|  |  |  |  |  |  |
| --- | --- | --- | --- | --- | --- |
| **序号** | **姓名** | **排名** | **技术****职称** | **工作单位** | **对本项目贡献** |
| 1 | 刘长令 | 1/8 | 教授级高级工程师 | 沈阳中化农药化工研发有限公司 | 主持负责总体设计、方案制订与指导实施。技术发明点1、2、3主要贡献者。提出了中间体衍生化法；作为核心发明专利的第一发明人，发明了杀菌剂丁香菌酯，并主持该品种研究开发至产业化；授权发明专利10件，发表SCI论文30篇，主编专著1部《新农药创制与合成》；获丁香菌酯相关奖励4项。 |
| 2 | 关爱莹 | 2/8 | 高级工程师 | 沈阳中化农药化工研发有限公司 | 项目主要执行人。技术发明点1、2主要贡献者。与第一完成人共同探索创建了中间体衍生化法，并以第一作者将该方法发表于Chemical Reviews；丁香菌酯第二发明人，并参与其研究开发至产业化；授权发明专利10件，发表第一作者SCI论文11篇，副主编专著1部；丁香菌酯相关奖励4项。 |
| 3 | 刘西莉 | 3/8 | 教授 | 中国农业大学 | 项目主要执行人。技术发明点3主要贡献者。探明了丁香菌酯的作用位点和抗性风险，为丁香菌酯的田间应用及组合物研究提供了科学依据。 |
| 4 | 李志念 | 4/8 | 高级工程师 | 沈阳中化农药化工研发有限公司 | 项目主要执行人。技术发明点2主要贡献者。进行新化合物的生物活性筛选，以及丁香菌酯的室内作用特性、生物活性测试和田间防病效果应用技术研究；授权发明专利5件，发表SCI论文14篇；获丁香菌酯相关奖励4项。 |
| 5 | 孙永吉 | 5/8 | 研究员 | 吉林省八达农药有限公司 | 项目主要执行人。技术发明点3主要贡献者。发现丁香菌酯与戊唑醇等三唑类杀菌剂具有显著的增效作用。并指导丁香菌酯系列新产品的开发、推广、登记及销售策划，相关产品也因此获得了多项荣誉。授权发明专利1件，农药登记证4个，获丁香菌酯相关奖励与荣誉8项。 |
| 6 | 郑敬敏 | 6/8 | 高级农艺师 | 陕西上格之路生物科学有限公司 | 项目主要执行人。技术发明点3主要贡献者。对丁香菌酯与苯噻菌胺、苯菌酮、壬菌铜、乙嘧酚、嘧菌环胺、咯菌腈、氟吡菌胺、烯酰吗啉、百菌清、咪鲜胺等多种杀菌剂进行了室内配方筛选试验和田间药效试验研究，发现含丁香菌酯的组合物对多种植物真菌病害具有显著防效，增效作用明显，授权发明专利26件，获丁香菌酯相关奖励1项。 |
| 7 | 陈亮 | 7/8 | 其它 | 吉林省八达农药有限公司 | 项目主要执行人。对技术发明点2、3做出了重要贡献。丁香菌酯的示范试验和市场推广，发现丁香菌酯对苹果树腐烂病、水稻纹枯病、稻瘟病有优异的防治效果，明确了丁香菌酯的产品定位；完成20%丁香菌酯悬浮剂、40%丁香戊唑醇悬浮剂和0.15%丁香菌酯悬浮剂市场产品策划，技术支持，整体销售方案落地，检查，监督，最终完成每年销售目标。获丁香菌酯相关奖励2项。 |
| 8 | 费千武 | 8/8 | 其它 | 吉林省八达农药有限公司 | 项目主要执行人。对技术发明点2、3做出了重要贡献。作为丁香菌酯事业部总经理，审核丁香菌酯系列产品全国试验、销售推广方案的可操作性以及实施落地；组建和管理专业的推广销售丁香菌酯系列产品的技术团队；管理和维护销售丁香菌酯系列产品的大客户，制定和考核大客户销售政策及奖励政策；审核和提报丁香菌酯系列产品开发立项建议。获丁香菌酯相关奖励1项。 |

**四、主要完成单位情况**

|  |  |
| --- | --- |
| 单位名称 | 沈阳中化农药化工研发有限公司 |
| 排 名 | 1 | 法定代表人 | 朱建军 | 组织机构代码 | 912101003408664411 |
| 所在地 | 辽宁 | 单位性质 | 企业 |
| 联系人 | 张孟迪 | 电子邮箱 | zhangmengdi@sinochem.com |
| 移动电话 | 18640569628 | 单位电话 | 024-85869137 | 传 真 | 024-85869137 |
| 通讯地址及邮政编码 | 辽宁省沈阳市铁西区沈辽东路8-1号,110021 |
| 对本成果科技创新和推广应用情况的贡献：1、采用“中间体衍生化方法”创制了丁香菌酯，发表论文30余篇，其中SCI收录7篇。申请专利17件，其中化合物专利6件，组合物专利1件，用途专利10件，获中、美、日、欧授权专利10件。 2、室内、田间生物活性研究，包括杀虫、杀菌、抗病毒活性等研究。 3、完成了20%丁香菌酯悬浮剂小试配方研究。 4、进行了丁香菌酯的中试研究，产品总收率达75%，含量达96%。 |

|  |  |
| --- | --- |
| 单位名称 | 吉林省八达农药有限公司 |
| 排 名 | 2 | 法定代表人 | 孙永吉 | 组织机构代码 | 91220381X05191395L |
| 所在地 | 吉林 | 单位性质 | 企业 |
| 联系人 | 陈亮 | 电子邮箱 | 343144151@qq.com |
| 移动电话 | 15844425863 | 单位电话 | 0434-6351319 | 传 真 | 0434-6351319 |
| 通讯地址及邮政编码 | 吉林省公主岭市工业大街179号 ,136100 |
| 对本成果科技创新和推广应用情况的贡献：1、通过对丁香菌酯小试报告的学习，组织实施了中试研究，并在此基础上进行了放大生产。 2、20%丁香菌酯悬浮剂的配方研究。经过大量的乳化剂、分散剂、助悬剂等助剂的筛选实验，最终研发成功稳定的剂型。热贮、冷贮及产品各项指标符相关标准要求。 3、研究了丁香菌酯与众多杀菌剂的组合物。发现丁香菌酯与戊唑醇、烯酰吗啉等多种杀菌剂混用，增效显著。 4、丁香菌酯的示范试验和市场推广。 在防治苹果树腐烂病、水稻稻瘟病、水稻纹枯病等方面做大量田间示范试验及推广工作，市场上产品的宣传、销售。 服务果农使用丁香菌酯防治相关病害，跟踪试验效果，开农民会，现场会，观摩会等，2012年在陕西省铜川市联合全国农技推广中心及陕西省农技推广中心共同组织大型现场观摩会，丁香菌酯的效果得到了各级植保部门及经销商、果农的高度认可，为农民有效解决苹果树腐烂病。 从2010年至今，丁香菌酯在防治苹果树腐烂病、水稻稻瘟病、水稻纹枯病等上，田间示范试验累计超过2000个，召开专题会累计1200余场。 |

|  |  |
| --- | --- |
| 单位名称 | 陕西上格之路生物科学有限公司 |
| 排 名 | 3 | 法定代表人 | 袁江 | 组织机构代码 | 916101247669689556 |
| 所在地 | 陕西 | 单位性质 | 企业 |
| 联系人 | 任亚强 | 电子邮箱 | renyaqiang@norsyn.com |
| 移动电话 | 18602979110 | 单位电话 | 029-82209660 | 传 真 | 029-88745698 |
| 通讯地址及邮政编码 | 陕西省西安市高新区沣惠南路36号橡树街区B座,710065 |
| 对本成果科技创新和推广应用情况的贡献：1、研究了丁香菌酯与众多杀菌剂的组合物。发现丁香菌酯与苯噻菌胺、苯菌酮、壬菌铜、乙嘧酚、嘧菌环胺、咯菌腈、百菌清、咪鲜胺等多种杀菌剂混用，增效显著。 2、申请组合物专利32件，授权29件，转让给吉林八达8件。 |

|  |  |
| --- | --- |
| 单位名称 | 中国农业大学 |
| 排 名 | 4 | 法定代表人 | 孙其信 | 组织机构代码 | 40001816-2 |
| 所在地 | 北京 | 单位性质 | 大专院校 |
| 联系人 | 杜玲 | 电子邮箱 | duling@cau.edu.cn |
| 移动电话 | 13811470554 | 单位电话 | 010-62732906 | 传 真 | 010-6231013 |
| 通讯地址及邮政编码 | 中国农业大学西区科学研究院,100193 |
| 对本成果科技创新和推广应用情况的贡献：探明了丁香菌酯的作用位点和抗性风险，为丁香菌酯的田间应用及组合物研究提供了科学依据。 |