

编 号: 0135

内 部

科学技术成果报告

植物蜕皮激素的筛选——露水草的发现



科学技术文献出版社

目 录

前言.....	(1)
一、露水草的生态.....	(1)
二、露水草的化学研究.....	(2)
三、露水草植物蜕皮激素的生物活性.....	(6)
四、露水草生产蜕皮激素的工艺流程.....	(7)
五、露水草蜕皮激素的产品剂型.....	(10)
六、露水草蜕皮激素在蚕业上的应用和推广.....	(10)
七、展望.....	(15)
后记.....	(15)
参考文献.....	(15)

植物蜕皮激素的筛选——露水草的发现

聂 瑞 麟

前 言

昆虫保幼激素和蜕皮激素在蚕业上的应用,自一九七三年八月在镇江召开全国协作会议以来,发展很快、成绩显著,已在全国近二十个省市自治区推广。目前我国已能生产多种保幼激素,但从筋骨草提取蜕皮激素由于含量低、资源少、成本高、远远不能满足需要。因此一九七六年四月上海昆虫激素鉴定会建议有关植物研究单位继续进行蜕皮激素植物资源的普查,希望能筛选出高含量、高活性的植物品种以满足蚕业生产的迫切需要。

一九七三年作者在上海有机化学研究所,受到当时赴美考察过昆虫激素研究的周维善教授以及陈毓群等同志的影响和启发,于是决心开展此项研究。但当时没有昆虫活性追踪试验的条件,因此只能完全靠化学的提取、分离、鉴定,这样做的效果是十分可靠的,不致因为植物体内含抗蜕皮激素一类化学物质的干扰,而在昆虫活性追踪时遗漏或误筛,但是这样做速度较慢。开始时完全是重复前人的工作。一九七四年初我们在云南西畴、富宁、麻栗坡等地国境线上人迹罕到的森林里采集百日晴(又名紫柏)等植物样品。虽然从中分离出蜕皮激素,但含量不像文献记载那样高,而且它是大乔木,资源甚少,不能解决生产的实际问题^[1]。因此在第二阶段的工作中,我们完全抛弃文献,选择云南资源丰富的草本植物进行筛选,草本极易生长,即使含量低些在生产上也比乔木合算。经分析云南遍地皆是飞机草以及油料植物小葵子的茎秆等多种植物,都没有发现蜕皮激素的存在。但是云南两万多种植物,逐个进行分析确有困难,于是我们想在前人报导过含蜕皮激素的同属植物中去找,植物亲缘关系近些,可能化学物质的积累会很相似。例如我们找到的野牛膝和南方红豆杉中就含蜕皮激素,但含量都很少。南方红豆杉含蜕皮激素按干量计仅十万分之三点七^[2]。一九七六年又从文献中看到露水草同属植物中的一种含蜕皮激素、该属植物云南有四种,经请教吴征镒教授,得知露水草是滇中高原十分丰富的一种野生植物。于是我们在实验室周围挖了几十克样品进行分析。其结果几乎使我们惊呆了。它含蜕皮激素竟高达全草干重的百分之一二。根部达百分之二点九。而且活性很强。经反复实验,又创造了一条简易、经济、可行的生产工艺程序。在一九七七年八月露水草昆虫蜕皮激素鉴定会上,来自全国四大蚕区及有关省市的代表一致认为:“这一发现为我国激素养蚕走在世界前列创造了优越条件”。的确它含蜕皮激素之丰富是世界上最前所未有的。在一九七八年中国农学会召开的全国农业学术讨论会上,被评选为突出的支农科研成果之一^[3]。由于云南露水草资源非常丰富,中部高原每年就可收购几十吨,这样不仅使我国蚕业每年需二百四十至三百公斤的蜕皮激素,可迅速得到解决,而且有可能使我国成为世界上实现蜕皮激素大规模工业生产的第一个国家。

一 露水草的生态

露水草 *Cyanotis arachnoidea* C. B. Clarke 又名珍珠露水草(云南曲靖)、鸡冠参

(云南昆明)、知母(云南蒙自)、蛛丝毛蓝耳草(见云南植物名录)。

系鸭跖草科蓝耳草属多年生草本植物。高15—30(—90)厘米。有成丛的基生叶,从中发出数支披散的紫绿色的长茎,全体被蛛丝状白色绵毛,总苞片及苞片上尤多,萼上也被这种毛或顶端有细长刚毛。根数条,细长,稍肉质。基生叶带状,长7—20厘米,宽0.8—1.1厘米,茎生叶互生、较短、长卵状披针形,基部有明显的膜质叶鞘。聚伞花序顶生和腋生,复出或有时单生,无柄或有时有短柄,为佛焰状总苞所托,有数朵花;苞片镰刀状弯曲,排成覆瓦状,两列;花无梗;萼片3枚,长约5毫米,基部连合;花瓣蓝紫色,长约7毫米,中部连合成筒,两端分离,上部有了裂片;雄蕊6枚,全育,花丝被念珠状长绒毛;子房3室,顶端簇生刚毛,蒴果倒卵状三棱



珍珠露水草 *Cyanoti arachnoidea* C. B. Clarke

形,长、宽约2毫米,顶端被毛,3片裂,每室2种子。种子小,圆锥状卵形,稍有皱纹。

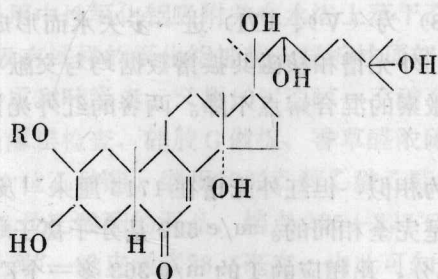
本种在云南分布于东部、中部、南部至西部,生长于海拔1100—2700米的干燥山坡、路旁或潮湿处。我国贵州、广西、广东、福建、台湾等省也有。分布印度、斯里兰卡至中南半岛。

我省资源比较丰富。露水草还易于栽培,是我省荒山坡地综合利用的一种有发展前途的经济植物。目前我所植物园已在进行引种驯化试验。(插图:露水草植物图)

二 露水草的化学研究^[4]

露水草的化学研究未见前人报导,该属植物的化学研究报导也很少,前人曾从该属的另一种植物中分离得 β -蜕皮激素。我们用的植物样品是从昆明黑龙潭山上采集来的,它主要含两个具有蜕皮激素活性的化合物I和II,经证明, I是 β -蜕皮激素(β -ecdysone); II是它

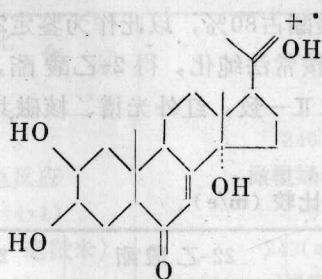
的 2 位乙酸酯。后者迄今未见从自然界分到过。



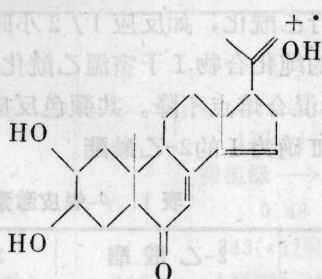
I R=H

II R=Ac

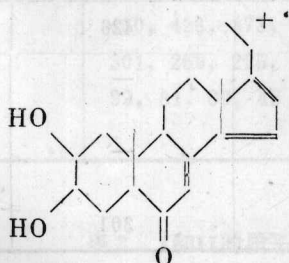
由于样品含蜕皮激素丰富,故改进了提取分离方法。所得化合物 I 在薄层层析上与香草醛硫酸作用显示出多羟基甾体的典型颜色(橄榄绿至草黄)。紫外光谱在 242 毫微米($\epsilon 12000$)处出现最强的吸收,表明有共轭烯酮存在。红外光谱在 1650 厘米^{-1} 处的强峰进一步证实为 α, β -烯酮;在 3400 厘米^{-1} 处显示多羟基的宽峰。核磁共振谱具有甾体化合物的典型特征:从积分线计算含 44 个氢质子,在高场范围有 5 个甲基的 15 个质子。 $\delta 3 \sim 4$ 的范围经重水交换,有 6 个羟基质子消失,表明分子内存在 6 个羟基。 $\delta 5.75$ 处的双峰应是双键的质子。这些都与 β -蜕皮激素分子内质子数目和特征相吻合。质谱虽未测得分子离子峰,但 $m/e 363, 345, 327, 301, 99, 81$ 等碎片可表明 I 的结构与 β -蜕皮激素是完全一致的。



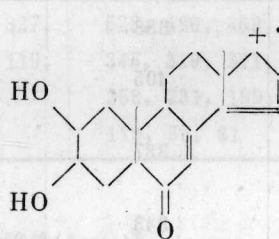
[I] $m/e 363$



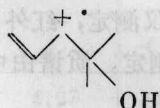
[II] $m/e 345$



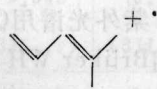
[III] $m/e 327$



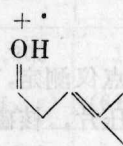
[IV] $m/e 301$



[V] $m/e 99$



[VI] $m/e 81$



[VII] $m/e 99$

$m/e 363$ (M-117) 是 $C_{20}:C_{22}$ 之间断开的母核部分 [I]; $m/e 345$ (M-117-18); $m/e 327$ (M-117-2 $\times$ 18) 分别为母核进一步失水所形成 [II]、[III]。 $m/e 301$ 是 C_{17} :

C₂₀断开并失去 1 分子水的母核部分〔Ⅳ〕。m/e 99(117-18)为边链失 1 分子水形成〔Ⅴ〕、〔Ⅶ〕。m/e 81(111-2×18)为〔Ⅴ〕、〔Ⅶ〕进一步失水而形成〔Ⅵ〕。按常法制备三乙酰化物，熔点146~147℃，红外光谱和核磁共振谱数据均与文献相符。

化合物 I 与已知β-蜕皮激素的混合熔点不降。两者的红外光谱吻合。由此确证 I 是β-蜕皮激素。

化合物 II 的性质与 I 极为相似，但红外光谱在 1715 厘米⁻¹及 1260 厘米⁻¹处还出现酯基峰。质谱表明它和 I 的骨架是完全相同的。m/e 522 是分子离子峰；m/e 405(522-117) 是 C₂₀与 C₂₂之间断开的母核部分，比相应的 I 的 m/e 363 多一个乙酰基，表明乙酰基在母核上，而不是在边链上；m/e 81(117-2×18)为边链进一步失水碎片。根据一系列β-蜕皮激素乙酰化物的质谱比较，充分说明m/e 522, 388是母核 2 位乙酸酯所固有的特征(表 1)。这个情况在核磁共振谱中获得完全证实：δ1.422是由 3 个质子构成的单峰，表明乙酰基上甲基的存在；在高场有 5 个甲基；重水交换后δ3.221~δ4.042处的 5 个羟基峰消失，进一步表明分子内确有一个羟基被乙酰化。比较 I 的核磁共振谱发现，C₁₉甲基往低场移动0.069ppm，这是 2 位乙酰基的诱导效应的结果。同时在 δ4.91 处有相应于 1 个质子的一组复峰，它是 A 环 C₂的α-H受乙酰基的影响而往低场位移并与相邻 C₁及 C₃质子偶合所形成。对应于 C₃上的α-H位于δ4.07处。这一情况表明 C₂上的β-OH被乙酰化了。烯键质子为一双峰，在δ5.73处。上述数据与文献报导相吻合。由于β-蜕皮激素的2, 3, 22位羟基乙酰化的速率有很大差异，可选择性地进行乙酰化，如反应 1/2 小时，2-乙酸酯占80%，以此作为鉴定2-乙酸酯的手段。取分离得的纯化合物 I 于室温乙酰化 30 分钟，按常法纯化，得 2-乙酸酯，熔点 130~132℃，与 II 的混合熔点不降。其颜色反应和 R_f 值与 II 一致，红外光谱、核磁共振谱与 II 重叠，由此可信 II 确为 I 的 2-乙酸酯。

表 1 β-蜕皮激素乙酸酯质谱比较 (m/e)

化 合 物	2-乙 酸 酯	3-乙 酸 酯	22-乙 酸 酯	25-乙 酸 酯
分子离子峰	522	—	—	—
基 峰	388	388	426	504(M-H ₂ O)
相应结构碎片	405	405	—	462(M-60)
				363
	387	387	—	345
				300
	343	343	301	99, 81

实 验

熔点用显微熔点仪测定，未校正。紫外光谱用 QR-50 型仪测定，红外光谱用 IR-450 型仪测定，用溴化钾压片，核磁共振谱用 Brüker WH-90 型仪测定。质谱由中国科学院有机化学研究所协助测定。

样品 1976 年 6 月 21 日采集。

初试：全株植物经烘干磨碎。干样 36 克用甲醇 300 毫升以索氏提取器提取。提取液过滤弃渣再浓缩至 30 毫升，加入蒸馏水 70 毫升。放置析出许多叶绿素等胶状沉淀物，再滤。用水

饱和的正丁醇350毫升，分三次提取滤液。减压回收正丁醇得白色固体和大量棕色胶状物质。用无水乙醇溶解，以少量层析用中性氧化铝吸附并在水浴上蒸干乙醇，用10克层析用中性氧化铝装柱（活性Ⅱ级）。少量吸有试样的氧化铝被装于层析柱顶部，用100毫升（试剂Ⅱ级）乙酸乙酯冲洗，得微量结晶物质和叶绿素。又用10%乙醇—乙酸乙酯混合溶剂100毫升冲洗，洗脱液浓缩后得少量结晶，经薄层检查，硅胶G做板，香草醛浓硫酸显色呈橄榄绿至草黄色斑点。证明是 β -蜕皮激素的2位乙酸酯。继用20%乙醇乙酸乙酯混合溶液100毫升冲洗，经浓缩后得 β -蜕皮激素和少量2位乙酸酯的混晶，熔点235—237℃，重284.2毫克。最后用50%乙醇乙酸乙酯液冲洗还得到 β -蜕皮激素28.5毫克。由此可知该植物含蜕皮激素物质1%左右。改进的分离程序：粉碎干样两公斤，用工业乙醇加热回流提取3次。每次约4小时，合并乙醇提取液，减压回收乙醇至小体积，放置冷却过夜，析出叶绿素及胶状物质，过滤除去之。滤液吸附于100克层析用中性氧化铝上（活性Ⅱ级），用水浴或烘箱（不超过90℃）干燥之，氧化铝干成块状，粉碎过筛。用500克层析用中性氧化铝装于柱下，吸附样品的氧化铝装于柱顶，用化学纯乙酸乙酯约1000毫升洗脱，洗脱液呈绿色。浓缩后得叶绿素和微量Ⅰ及Ⅱ的混合物，进一步层析纯化得化合物Ⅱ，用乙酸乙酯-环己烷重结晶，熔点130~132℃。其它性质见表2，3。

表2 从露水草提得的蜕皮激素的物理化学性质

性 质 \ 化 合 物	I	II
熔点(℃)	240~241	130~132
香草醛硫酸颜色反应	橄榄绿→草黄	橄榄绿→草黄
R_f (氯仿:乙醇=4:1)	0.18	0.48
紫外光谱(乙醇, 毫微米)	242(ϵ 12000)	243(ϵ 11037)
红外光谱(厘米 ⁻¹)	1650(α, β 烯酮), 3400(羟基)	1658(α, β 烯酮), 3410(羟基) 1715; 1260(酯基)
质谱(m/e)	430, 426, 373, 363, 345, 327, 301, 269, 225, 185, 149, 119, 99, 81, 69, 43	522, 486, 468, 405, 388, 373, 345, 329, 311, 291, 285, 269, 258, 231, 199, 183, 161, 143, 119, 99, 81

表3 I和II的质子信号化学位移值(δ ppm)*

化合物	C ₂	C ₃	C ₇	C ₁₈	C ₁₉	C ₂₁	C _{26,27}	2位乙酰 上甲基
I	—	—	5.75 (H, d)	0.943 (3H, s)	0.913 (3H, s)	1.202 (3H, s)	1.178 (6H, s)	—
II	4.91 (H, m)	4.07 (H, m)	5.73 (H, d)	0.919 (3H, s)	0.982 (3H, s)	1.210 (3H, s)	1.178 (6H, s)	1.422 (3H, s)

* 四甲基硅为内标准，氘代丙酮做溶剂。s—单峰；d—双峰；m—复峰。

〔分析〕 $C_{29}H_{46}O_8 \cdot \frac{1}{2}H_2O$ 计算值: C, 65.51; H, 8.91。实测值: C, 65.78; H, 9.37。

层析柱继续用1:4的乙醇:乙酸乙酯溶液洗脱, 浓缩洗脱液, 得主要为 I 但还含少量 II 的粗品, 约重24克。经甲醇-乙酸乙酯多次重结晶, 得无色针状结晶。薄层层析上显示一点。熔点 $240 \sim 241^\circ C$ 。 $[\alpha]_D^{25} + 62.5^\circ (c, 1.0, \text{甲醇})$ 。其它性质见表 2, 3。

〔分析〕 $C_{27}H_{44}O_7$ 计算值: C, 67.47; H, 9.23。实测值: C, 67.62; H, 9.45。

I 的三乙酰化物的制备

取样品50毫克加吡啶、醋酐各0.5毫升, 摇匀后室温放置 24 小时。按常法处理, 用乙酸乙酯-环己烷重结晶, 得无色针状结晶。熔点 $146 \sim 147^\circ C$, 硅胶 G 薄层层析 (以 1:4 的乙醇:氯仿为展开剂), 对香草醛浓硫酸呈暗绿色斑点的 R_f 值为 0.77。

〔分析〕 $C_{33}H_{50}O_{10} \cdot 1/2H_2O$ 计算值: C, 64.36; H, 8.34。实测值: C, 64.13; H, 8.28。

红外光谱: 3450(羟基), 1660(α, β -烯酮), 1742, 1250(酯基)厘米⁻¹。

核磁共振谱 (氘代氯仿为溶剂) δ 值: 0.854(3H, s); 1.037(3H, s); 1.212(3H, s); 1.239(3H, s); 1.265(3H, s); 2.015(3H, s); 2.119(6H, s)。

上述数据均与文献报导的 β -蜕皮激素 2,3,22-三乙酸酯数据一致。

I 的 2-乙酸酯的制备

纯 1500 毫克, 加吡啶、醋酐各 5 毫升, 摇匀后室温放置 30 分钟, 加水 35 毫升分解, 立即减压蒸去溶剂, 得乳白色胶状物。用 10 毫升乙酸乙酯溶解, 不溶物经薄层层析检查系未反应的原料, 过滤除去。滤液通过 3 克层析用中性氧化铝, 再用分析纯乙酸乙酯洗脱, 薄层层析检查并收集 R_f 值为 0.48 的单一斑点的洗脱液, 浓缩并加适量环己烷重结晶, 得无色针状结晶。熔点 $130 \sim 132^\circ C$ 。

〔分析〕 $C_{29}H_{46}O_8 \cdot 1/2H_2O$ 计算值: C, 65.51; H, 8.91。实测值: C, 65.44; H, 9.17。

红外光谱: 1658(α, β -烯酮), 3410(羟基), 1715, 1260(酯基)厘米⁻¹。

核磁共振谱 (氘代丙酮为溶剂) δ 值: 0.919(3H, s, C_{18}), 0.985(3H, s, C_{19}), 1.20(3H, s, C_{21}), 1.18(6H, s, $C_{26,27}$), 1.428(3H, s, 2-乙酰基上的甲基), 4.95(1H, m, C_2), 4.056(1H, m, C_3), 5.758(1H, d, C_7)。

上述数据与分得的化合物 II 一致, 两者的混合熔点不降。

三 露水草植物蜕皮激素的生物活性

上述露水草所分离得的蜕皮激素, 经云南省蚕桑研究所、江苏省蚕业研究所、浙江农科院蚕桑研究所、广东农业科学院蚕业研究所、及四川农科院蚕桑研究所测定活性, 使五龄蚕提早上簇 12~21 小时。

(1) 云南省蚕桑研究所测定结果: (一九七六年在秋蚕上)

从 (表 4)、(表 5) 两次都是见熟 5% 喷药, 喷药后不论品种不同对促进老熟齐~和促进吐丝结茧均比对照的提早, 这表明露水草中提取的蜕皮激素具有活性。应用后死笼茧没有增加, 表明对蚕体健康没有影响, 配合保幼激素及在缺桑情况下有应用价值。

(2) 江苏省蚕业研究所测定结果: 七六年十一月, 五天半添食露水草的蜕皮激素。

表 4 第一次不同浓度的蜕皮激素的活性调查 供试品种：苏₁₃×南₆

五龄 喷药 饲食后 (小时)	浓度 (微克/头)	收 蚁 日 期	供 试 头 数	五龄饲食后上簇 时间 (小时)			公 斤 茧 颗 数 (个)	死 笼 茧 (%)	茧质调查 (雌雄各25颗平均)		
				始熟	盛熟	终熟			全茧量 (克)	茧层量 (克)	茧层率
180	6	7月20日	600	180	192	199	534	0	1.988	0.392	19.70
180	4	7月20日	600	180	192	204	526	0	2.092	0.412	19.52
180	2	7月20日	600	180	192	201	538	0	2.044	0.404	19.85
对照		7月20日	600	180	199	211	532	0	1.96	0.396	19.17

表 5 第二次不同浓度蜕皮激素的活性调查 供试品种：东肥×华合

五龄 喷药 饲食后 (小时)	浓度 (微克/头)	收 蚁 日 期	供 试 头 数	喷药后经 12小时		喷药后经 20小时		公 斤 茧 颗 数 (个)	死 笼 茧 (%)	茧质调查 (雌雄各 25颗平均)		
				熟蚕 (头)	比例 (%)	熟蚕 (头)	比例 (%)			全茧量 (克)	茧层量 (克)	茧层率 (%)
199	8	9月8日	600	159	26.5	331	55.1	520	0	1.984	0.416	20.96
199	6	9月8日	600	154	25.6	323	53.9	514	4	1.966	0.422	21.43
199	4	9月8日	600	193	32.1	272	45.4	508	4	2.024	0.428	21.29
199	2	9月8日	600	198	33.0	268	44.7	504	6	1.988	0.423	21.72
对照		9月8日	600	106	17.6	138	28.0	490	4	1.998	0.436	21.75

2 × 1.25微克 = 2.5微克/头—21 (小时)

(即1.25微克/头连添食两次)

对照沪产精品 (筋骨草内提取)

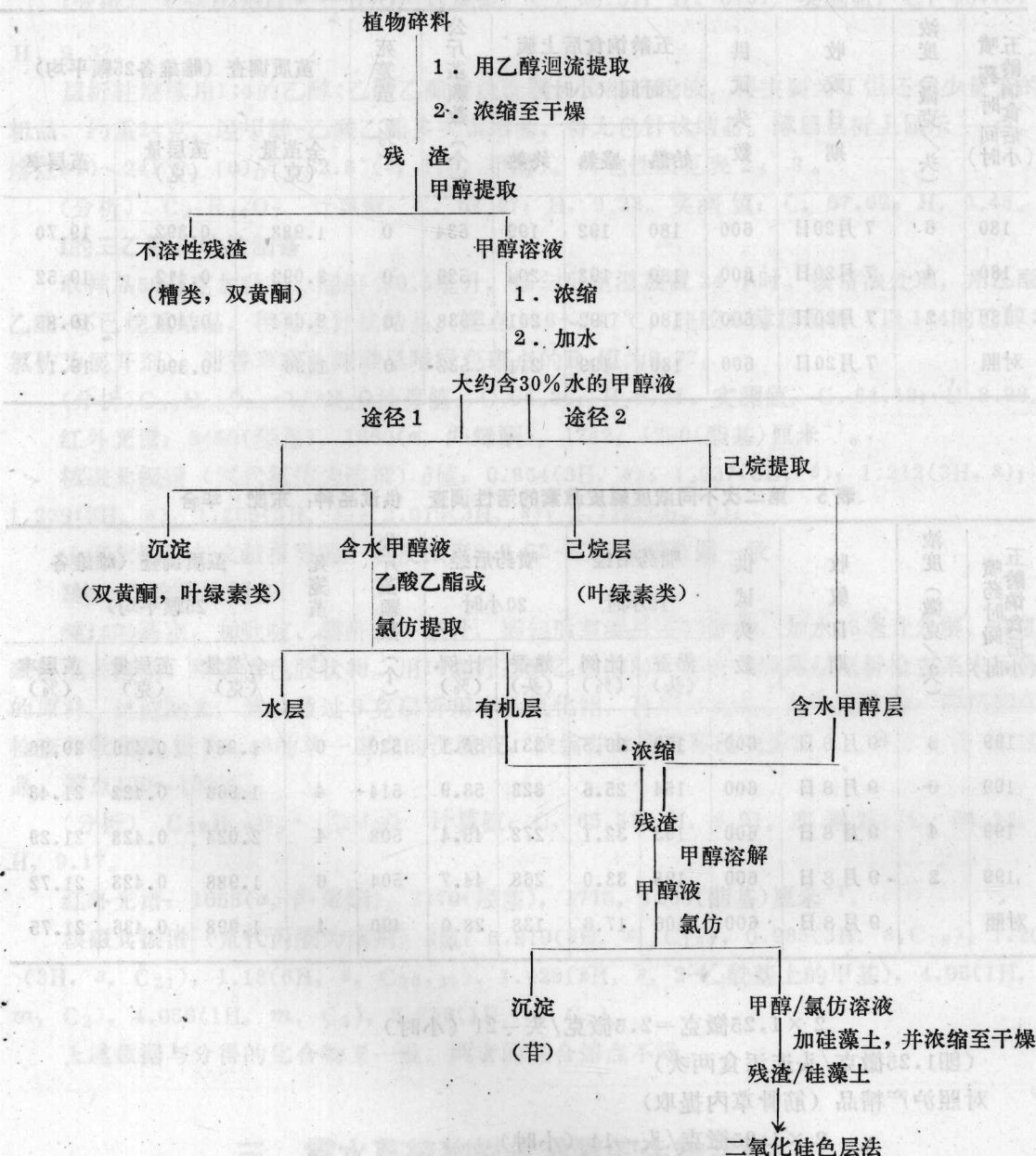
2 × 1.25微克/头—14 (小时)

江苏省蚕研所自一九七六年起至七七年五月份先后共进行了六个批次的活性鉴定和效果试验。七七年春又在本省农村示范推广 2 万余张，室内外试验均取得了良好的效果，受到广大贫下中农的欢迎。

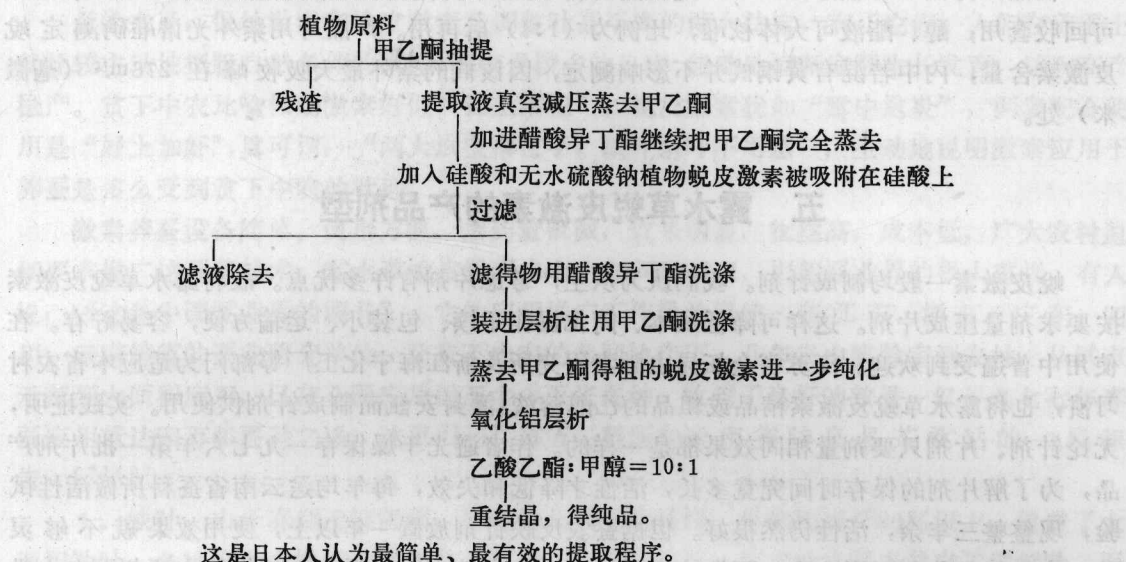
四 露水草生产蜕皮激素的工艺流程

经反复试验，创造了工业生产蜕皮激素工艺流程，较国内外一般提取分离植物蜕皮激素的方法都优越，比日本专利〔CA，70—13339〕也省三分之二以上的程序，同时不用任何昂贵的化学试剂，现将提取蜕皮激素的程序简述如下：

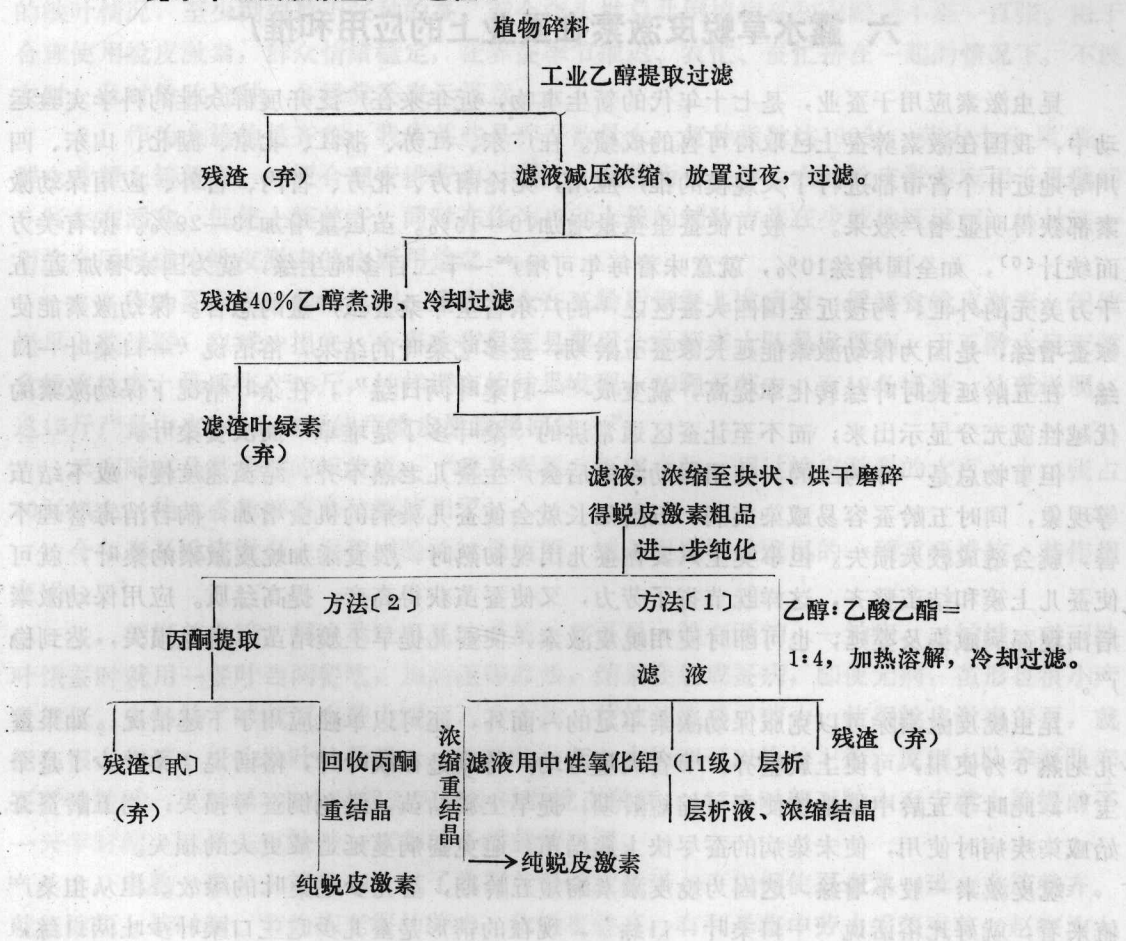
(1) 国外植物蜕皮激素一般提取程序⁽⁵⁾



(2) 日本植物蜕皮激素提取专利(CA, 70—13339)



(3) 露水草蜕皮激素生产工艺程序



粗品：方法〔2〕较方法〔1〕纯化更为省事，成本降低，得率提高，周期缩短。氧化铝可回收套用；醇、酯液可大体校准，比例为（1:4）后再用。产品可用紫外光谱准确测定蜕皮激素含量，内中若混有黄铜甙并不影响测定，因该甙的紫外最大吸收峰在 278m μ （毫微米）处。

五 露水草蜕皮激素的产品剂型

蜕皮激素一般均制成针剂。我们认为从生产考虑片剂有许多优点。故将露水草蜕皮激素按要求剂量压成片剂。这样可降低成本、简化操作手续、包装小、运输方便，容易贮存。在使用中普遍受到欢迎。江苏省金坛昆虫激素研究所及浙江海宁化工厂等部门为适应本省农村习惯，也将露水草蜕皮激素精品或粗品的乙醇溶液，灌封安瓿而制成针剂供使用。实践证明，无论针剂、片剂只要剂量相同效果都是一样的。作者避光干燥保存一九七六年第一批片剂产品，为了解片剂的保存时间究竟多长，活性才降低和失效，每年均送云南省蚕科所做活性试验，现整整三年余，活性仍然很好。但据蚕农反映针剂放置一年以上，使用效果就不够灵敏。而且粗品片剂蚕喜欢吃，不像纯品那样产生拒食性。因此看来片剂作为主要剂型之一供生产应用是很有价值的。

六 露水草蜕皮激素在蚕业上的应用和推广

昆虫激素应用于蚕业，是七十年代的新生事物，近年来在广泛开展群众性的科学实验运动中，我国在激素养蚕上已取得可喜的成绩。在广东、江苏、浙江、北京、湖北、山东、四川等地近廿个省市都进行了大规模的推广应用，无论南方、北方、省内、省外、应用保幼激素都获得明显增产效果。一般可使蚕全茧量增加10—15%。茧层量增加13—29%。据有关方面统计〔6〕，如全国增茧10%，就意味着每年可增产一千二百多吨生丝，就为国家增加近五千万美元的外汇，约接近全国四大蚕区之一的广东省全年桑蚕茧产量的总合。保幼激素能使家蚕增茧，是因为保幼激素能延长家蚕五龄期，蚕多吃桑叶的结果，俗话说“一口桑叶一口丝”在五龄延长时叶丝转化率提高，就变成“一口桑叶两口丝”，在余叶情况下保幼激素的优越性就充分显示出来，而不至让蚕区通常讲的“桑叶多了是堆草”而浪费桑叶。

但事物总是一分为二的。使用保幼激素后会产生蚕儿老熟不齐，结茧速度慢，或不结茧等现象，同时五龄蚕容易感染疾病，五龄延长就会使蚕儿染病的机会增加，倘若消毒管理不善，就会造成较大损失。但事实上只要在蚕儿出现初熟时，喂食添加蜕皮激素的桑叶，就可使蚕儿上簇和结茧整齐，这样既节省了劳力，又使蚕茧获得高产，提高丝质。应用保幼激素后出现蚕病感染及蔓延，也可即时使用蜕皮激素，使蚕儿提早上簇结茧，避免损失，达到稳产。

昆虫蜕皮激素除可以克服保幼激素不足的一面外，还可以单独应用于下述情况；如果蚕儿见熟5%使用，可使上簇整齐，节省大量劳动；特别是在缺叶时，俗话说“桑叶少了是个宝”，此时于五龄中期酌情使用可缩短龄期，提早上簇结茧，避免倒蚕等损失；当五龄蚕开始感染疾病时使用，使未染病的蚕尽快上簇结茧，避免蚕病蔓延造成更大的损失。

蜕皮激素一般不增茧，这因为蜕皮激素缩短五龄期，蚕儿少吃桑叶的缘故。但从担桑产值来看，就好比俗话说“一口桑叶一口丝”，现在的情形是蚕儿少吃三口桑叶少吐两口丝，

在经济上也还是合算的。

总的来说：保幼激素和蜕皮激素是调整叶蚕平衡的两大法宝，有了它们，人们在养蚕上就比较主动地摆脱自然条件的束缚，而获得较多的自由，能动地控制家蚕生长发育，达到高产稳产。贫下中农比喻保幼激素好似“锦上添花”，蜕皮激素犹如“雪中送炭”，两者配合使用是“好上加好”，真可谓：“两大法宝拿在手，缺叶余叶不用愁”，生动地说明激素应用于养蚕是多么受到贫下中农的欢迎。

激素养蚕设备简单、使用方便，用药量极微，效果明显，收益高，成本低，广大农村迫切要求推广这项新技术。露水草蜕皮激素自七六年问世以来，引起蚕业界的极大重视，有人说：“这是中国蚕业界的福音”。它的应用推广工作极为迅速，在江苏、浙江、广东、四川、云南等省的蚕业研究单位、及贫下中农的协作下，几年来由实验室到农村，从试点示范到大面积应用，已在全国应用近五十多万张蚕种，收到了良好的效果。仅一九七七年春蚕应用就达四万张蚕种之多，这里引用江苏省蚕科所和云南省陆良县茶桑站的一段报告：〔7〕〔8〕

1. 缺叶：由于春期连续阴雨，桑叶生长和成熟缓慢，平均约减产20%以上，造成了大面积缺叶，各地除大力推广合理用桑、节约用桑等措施外，使用蜕皮激素就成了调剂叶、蚕平衡的主要措施之一。如吴江县原估计缺叶2—3万担，由于统一调度和合理安排使用露水草蜕皮激素，基本上未出现盲目外出买叶和盲目倒蚕等现象，据吴江县反应，以往如遇今春的缺叶情况，至少倒掉数千张种的蚕，而今年头批总共倒掉病蚕和迟眠蚕不满一百张。由于合理使用蜕皮激素，群众情绪稳定，在养蚕季节推迟、农忙、蚕忙挤在一起的情况下，不误农时，及时抢收抢种，各级党委表示满意。

2. 作为上簇的整齐剂：我省某些县养蚕数量大，复种指数达100%，劳力十分紧张，群众希望上簇整齐。以便合理安排劳力。因此，我省约有一半左右的蜕皮激素应用于见熟后5%左右添食，促使上簇整齐。同时亦作为自动上簇的辅助方法在少数地区试用，估计这一用途今后将成为蜕皮激素的主要用途之一。

3. 作为蚕发病时的催熟剂：我省群众在五龄后期蚕儿发病时，便添食蜕皮激素，促使提早上簇结茧，以减少损失。今春我省吴江县黎里公社新丰大队暴发僵病，于五龄六足天添食蜕皮激素，最后张产15斤，抽样调查的结果发现，30颗蚕茧中，有19条僵蚕，这就说明，这15斤产量中有2/3是由于使用蜕皮激素挽回的。”

云南陆良县茶桑站的报告说：“我县春蚕八百四十张，用过蜕皮激素的六百一十二张占70%以上，绝大多数养蚕单位都使用了。

今年春蚕蜕皮激素大面积试验的结果证明，这是促进蚕桑发展的一项重要措施。其作用在于：

1. 能提前上簇，解决桑叶不足的矛盾。养蚕员一般有两怕，一怕病、二怕饿。碰到缺叶饿蚕时就用一餐叶当两餐吃，加高温等办法，结果会造成蚕病，即使无病，茧形也很小产量很低。自己缺了叶就派出劳力四面八方去找，往往是浪费了劳力。使用蜕皮激素养蚕，就能在很大程度上缓和缺叶的矛盾，一般缺叶一天左右的都可以提前上簇。真理大队养蚕队春蚕严重缺叶，五龄第111小时即四天15小时喂蜕皮激素。157小时即五龄六天半就上簇提前了一天半时间。这就是说缺叶一天半的矛盾就解决了。

2. 老熟一致，上簇整齐。见了熟蚕就喂蜕皮激素，可以促使蚕老熟一致，上簇整齐。就能缩短上簇时间，节约拣老蚕的劳力。化蛹也整齐，有利于集中劳力采茧卖茧。赵家沟大

队第七队试验的结果，见熟蚕喂蜕皮激素的16个小时就上完了簇，对照的10簇，41小时才上完，相差两倍的时间。同时由于上簇一致，簇中的死蚕和不结茧蚕也大大减少。庄上大队下村专业队反映，喂了蜕皮激素采茧时未见死蚕和不结茧蚕，真理大队养蚕专业队调查24簇，试验组的死蚕和不结茧蚕比对照组减少40%。

3. 减少蚕病造成的损失。这一条我们没有实践经验。但从以上两个作用可以说明这个科学道理。五龄蚕发病一般是五、六、七天，特别是空头病，很难控制，容易造成大损失。这时若使用蜕皮激素，没有发病的蚕，就可以提前上簇，避免病毒病菌传染，这就减少了损失。

4. 蜕皮激素与保幼激素同时使用可以促使蚕茧稳产高产。保幼激素是在桑叶有剩余时使用，能延长蚕的龄期，多吃叶，多产茧。但其弱点是上簇不整齐，有不结茧蚕。在使用保幼激素见熟推后同时使用蜕皮激素，这就克服了保幼激素不足的一面，促进了蚕茧稳产高产。

我们协助云南省蚕桑研究所在用保幼激素515及512后配合露水草蜕皮激素使用均收到良好的效果。

由表6可见515确有效果，蚕全茧量增加了6.7—7.5%，茧层量增加11.3%，在见熟1%时配合蜕皮激素使用，比对照增产8.9%，并且上簇整齐，仅6小时就全部上完，五龄期比对照延长24小时，但单独用515则延长47—60小时之久，上簇也不整齐。

表6 515配合蜕皮激素试验调查
77年5月春蚕第一批；地点：草坝蚕科所；品种：滇13×滇14

激素种类	供试头数	用药时间 五龄饲食	浓度 微克/头	五龄经过	全茧 量克	指 数	茧层 量克	指 数	公斤颗 粒 数	茧层率	见熟至终 熟时间
515	400	96	2	8天18 小时	272	107.5	67.5	108.8	356	24.9	6小时
昆精蜕		见熟1%	2								
515	400	96	1.5	8天18 小时	275	108.7	67.5	108.8	354	24.4	6小时
昆精蜕		见熟1%	2								
515	400	96	1	8天23 小时	270	106.7	69	111.3	354	25.56	11小时
515	400	96	1.5	9天12 小时	272.1	107.5	69	111.3	362	25.46	24小时
对 照	400			7天18 小时	253	100	62	100	384	24.5	24小时

注：茧质调查以100粒计，蜕皮激素配合保幼激素使用的两组使用蜕皮激素后6小时全部上簇完。

表 7 激素试验龄中经过调查

地点：真理专业队 蚕品种华合×东肥671

区号	激素种类	五龄饲食用药时间 (小时)	剂 量 微克/头	使用昆片剂 盛 熟 期	五龄经过时间	龄期延长时 时间 (小时)
1	昆蛻皮激素片剂	192(见熟前半天)	3	17 小 时	8 日17时	- 21
2	512与昆片剂	90	1	17 小 时	9 日12时	- 2
		211(见熟前半天)	3			
3	512	90	1		10日14时	+ 24
4	对 照 区				9 日14时	

注：2区使用512后，出现蚕病，提前使用蛻皮激素。

表 8 簇 中 及 茧 质 调 查

区号	激素种类	簇 中			公斤颗 粒数	全茧量 (克)	指 数	茧层量 (克)	指 数	茧层率	死笼茧 (%)
		不结茧 蚕%	死蚕%	薄皮茧 %							
1	昆蛻皮激素片剂	0.33	0.9	0.7	600	167.4	96.1	35.8	91.33	24.4	△
2	512与昆片剂	0.38	1.55	0.57	564	186.3	107	39.35	100.4	21.3	2
3	512	0.7	1.33	1.5	557	183.7	105.5	44.2	112.8	23.5	2
4	对 照	0.5	1.91	1.75	582	174.1	100	39.2	100	22.5	2

注：蚕茧以100粒调查

表 7、表 8 表明：露水草蛻皮激素与512两者效果都很灵。前者五龄比对照缩短24小时，后者延长24小时，茧层量增加12.8%。

在使用512后，于五龄饲食211小时，发现较多空头病，虽未见老熟蚕，即添食蛻皮激素，比对照提前两小时上簇。全茧量、茧层量略有增加、茧层率略低。这说明，使用保幼激素后，如果万一发生蚕病，只要有蛻皮激素，是可挽回损失达到稳产的。还说明：只有适当延长龄期，蚕多吃桑叶方能增丝，两种激素配合使用，才能充分发挥保幼激素的作用。在见熟5~10%时使用蛻皮激素，可以克服保幼激素的缺点，达到增丝、上簇整齐、节省劳力、龄期又延长不多的目的。

蛻皮激素于五龄192小时（见熟蚕前半天）使用，仅17小时盛熟率就达92.5%，22小时全部熟完，但公斤茧颗数、茧层量略低于对照。它告诉我们：蛻皮激素作为上簇齐一剂，一定要在见熟5~10%时，过早影响产量，过迟效果不明显。在缺叶情况下或蚕病感染不得已也要在五龄饲食7天后使用。

此次示范试验还表明：上簇环境的干湿影响簇中死蚕及薄皮茧，如对照区的簇较蛻皮激素与保幼激素两区的簇偏低、湿度大，采茧时死蚕、薄皮茧较两区多。两种激素配合使用区的通风较差，死蚕也较多。由此可见加强簇中管理也是十分重要的。

表9 丝质成绩调查

曲靖丝绸厂进行

区 号	激素种类	新有茧绪 %	类 节 (个)	均 匀 (分数)	净 度 (分数)	小糙	展结	环裂及丝	成 绩
1	昆片剂	55	△	88.33	96.04	1			99.64
2	512及昆片剂	55	1	87.5	95			1	99.38
3	512	47	2.5	87.83	97.16	2			99.34
4	对照区	57.7	2	86.25	96.56		1		99.38

表10 解 舒 调 查

区 号	激素种类	茧 丝 长 (米)	解 舒 率 %	长 吐 率 %	蛹 市 寸 %	丝 量 (克)
1	昆片剂	992.1	85.47	6.81	7.72	29.92
3	512	1079.8	88.43	4.99	6.58	34.48

注：茧丝长以米计。

* 昆精、昆粗，昆片剂系指露水草蛻皮激素精品、粗品及片剂。515、512由江苏金坛激素研究室、金坛激素化工厂出品。

通过茧质调查（表9、10）可见激素对茧质（净度、解舒率等）并无不良影响。而影响茧质的因素是复杂的，有的是加工工艺造成的。如此次实验丝质调查样品，烤茧时对照区与蛻皮激素区的样品，由于操作上的原因部份被烤黄，因此蛻皮激素区的解舒调查只供参考。

综上所述露水草蛻皮激素具有较强的生物活性，使用效果良好，很有实用价值。它的主要效用是：

1. 缩短家蚕五龄期、促进上簇整齐。
2. 某些保幼激素品种产生不结茧蚕、上簇不齐等缺点，可配合使用蛻皮激素得到克服，达到既增丝，又可控制食桑量、龄期又延长不多的目的。
3. 缺叶使用可提早老熟结茧，避免倒蚕等损失。
4. 五龄后期发现蚕病时使用，未发病蚕提早上簇结茧，可挽回蚕病蔓延造成的损失。
5. 使用蛻皮激素后，熟蚕齐一时，可把簇器放在蚕座上，用登簇剂，熟蚕会自动登簇，节省大量劳力。

现将露水草蛻皮激素的使用方法介绍如下：

1. 使用剂量：每片含蛻皮激素40毫克，每张种用1—1.5片，在蚕儿发病或缺叶时可用2片，分两次添食。
2. 药液配制方法：每张种1—1.5片，配时，先用少量热水捣碎溶解。有可能可加少量酒，最后放入所需水量4市斤充分拌匀即可使用。
3. 使用时每张种以桑叶12—15公斤用喷雾器将药液全部均匀喷洒在桑叶上添食。

注意事项：

1. 一般情况下在发现老蚕 5 % 左右时才能使用, 过早会影响产茧量, 若发生蚕病或缺叶时也应五龄龄期中期 7 天左右酌情使用。

2. 配合保幼激素使用, 既增产, 老熟又整齐。

3. 喷药液的桑叶要偏少, 喷洒桑叶要均匀, 效果才明显。

4. 待添食桑叶食完后, 随即再喂一次桑叶, 使吐丝前充分饱食

5. 用不完的片剂, 避光干燥保存下次再用。

七 展 望

昆虫蜕皮激素是昆虫前胸腺所分泌的一类具生理活性特征的极微量甾体化合物, 它结构复杂、不易大量人工合成。自一九六六年日本学者 Nakanishi 等从我国台湾产的罗汉松科植物百日睛中分得蜕皮激素类似物以来, 引起各国学者的注意, 植物中这类化合物的化学结构和生物活性均与昆虫蜕皮激素相同。由于植物中含这类物质高出昆虫千万倍, 人们都企图从植物中大量获得它。这样为植物资源的利用, 开辟了崭新的途径。近十多年来为在植物中寻找这类微量生理活性物质, 在生物实验的基础上, 对大量植物进行了筛选。植物品种近千种以上。已从植物中分离及确定结构的蜕皮激素有近 40 种。这些化合物存在于 80 余种植物的各个不同器官中, 通常蜕皮激素在植物中含量还是很少的, 一般只是占干物重的万分之几甚至更微, 少数达干重的千分之几。在个别的情况下, 蜕皮激素的总含量可达干重的 1 %, 最为突出的是麻花头 (*Serratula inermis* Gilib.) 的花序中, 含 β -蜕皮激素竟高达 2 %⁽⁹⁾, 该属植物云南也有分布, 但较稀少, 并且仅是花序中含量丰富, 而花序也是很难获得的。

露水草生长较易, 蜕皮激素含量甚高, 资源十分丰富, 经几年来的实践证明: 露水草是一种很有价值的, 应该引种栽培的特种经济植物, 在蜕皮激素及其类似物, 无法人工合成进行工业生产的情况下, 它就是一座合成蜕皮激素最好的绿色工厂, 建议有分布露水草的省区, 充分发掘利用野生资源, 保护野生植物资源, 做到采育结合, 长期利用。建议有关省区植物园进行引种栽培、不断总结经验, 推广到公社生产队, 充分利用荒山坡地, 建立原料生产基地。此外由于蜕皮激素可以大量获得, 期望加强蜕皮激素综合利用的研究, 预想它在医药、农药以及其它方面的应用将会有新的发现。对于自然资源丰富的我国, 进一步研究蜕皮激素的特性, 摸清它在植物界的分布规律, 充分发掘利用我国植物界中新的高含量、高活性植物品种, 仍然是植物化学工作者一项极其重要的任务。

后 记

在植物蜕皮激素筛选研究的过程中, 曾得到中国科学院上海有机化学研究所周维善教授、陈毓群同志的协助。所内得到吴征镒教授、周俊副教授的大力支持。方瑞徵同志鉴定植物标本, 吴锡林同志绘图, 许祥誉、何敏、岳远征等同志先后参加了部分实验工作。李朝汉、杨崇仁、诸远章等同志协助采集植物样品。在露水草蜕皮激素活性试验和推广应用中得到江苏省蚕业研究所高一陵教授、载祝英同志, 广东省蚕业研究所方定坚同志、云南省蚕桑所杨秀华同志以及浙江蚕科所、四川蚕桑所等单位的许多同志大力支持和帮助, 均在此表示衷心感谢。

参 考 文 献

- (1) 裴瑞麟等《紫柏的植物蜕皮激素》, 云南植物研究 2, 9 (1975),