

农药的设计与开发指南

(第三册)

农药的选择毒性与抗性

〔日〕 山本 出 主编
深见 顺一

化学工业出版社

0-1

2

农药的设计与 开发指南

(第 三 册)

农药的选择毒性与抗性

折介六 李树正 等译
许泳峰

李 范 校

化学工业出版社

内 容 提 要

本书是“农药—デザインと开发指针—”一书中的第三篇。它介绍了杀虫剂、杀螨剂、杀菌剂、除草剂的抗性及其机制。从生理、生化、形态、遗传的角度揭示抗性发生、发展的特点以及今后的对策。它是迄今该方面有关文献的综述。

可供从事农药研究的人员及高等农业院校教师和高年级学生、研究生参考。

山本 出 主编
深见 顺一

農業—デザインと開発指針

——農薬の選択毒性と耐性

ソフトサイエンス社

昭和54年3月31日，第1版第1次印刷

农药的设计与开发指南

(第 三 册)

农药的选择毒性与抗性

李树正
折介六 等译
许泳峰

李 范 校

责任编辑：杨立新

封面设计：季玉芳

化学工业出版社出版发行

(北京和平里七区十六号楼)

化学工业出版社印刷厂印刷

新华书店北京发行所经销

开本787×1092^{1/32}印张7^{1/2}字数168千字

1988年10月第1版 1988年10月北京第1次印刷

印 数 1—1,200

ISBN 7-5025-0175-4/TQ·137

定 价 2.40 元

出版说明

“农药—デザインと开发指针—”是由日本山本 出和深见顺一主编，由各方面专家四十余人执笔编写的一本综合性农药科学全书。以设计开发农药新品种为主线，从化学、生物学等方面的关系来研究农药，比较系统地介绍了各个领域内当今农药科学的进展，专家们分别在综述文献的基础上提出了本人见解和今后发展方向，从而使这本书具有一定学术水平。我社组织全国有关同志翻译了全书，无疑对我国农药新品种创制，开发新农药途径等方面科研人员有所帮助，对高等农业院校教学，高年级学生、研究生学习均有一定参考价值。

鉴于本书篇幅太大，为了方便读者，我们将该书分四册出版。

- 第一册 农药的生理活性和作用机制
- 第二册 农药的代谢、降解与生态毒理学
- 第三册 农药的选择毒性与抗性
- 第四册 农药的分子设计

目 录

第一章 杀虫剂的选择毒性	1
第一节 防治害虫上选择性杀虫剂的作用	1
1. 对种群数量的影响	1
2. 研究选择毒性的目的	5
第二节 杀虫剂选择毒性的机制	7
1. 药剂向体内的渗透性	7
2. 药剂的解毒分解代谢及活性化代谢	9
3. 药剂向组织内蓄积及向体外排泄	14
4. 药剂向作用点的渗透性	14
5. 药剂作用点的毒性	16
6. 随着向作用点攻击而产生的二次性作用	17
第三节 害虫的生理、生态特征与由此进行的选择性杀虫剂的开发	18
第二章 杀虫剂抗性	22
第一节 什么是杀虫剂抗性	23
1. 引言	23
2. 交互抗性, 复合抗性	25
3. 负相关交互抗性	26
4. 抗性的分类和定义	27
第二节 杀虫剂抗性的遗传学	30
1. 引言	30
2. 单基因, 多基因遗传	31
3. 显性、隐性	82
4. 遗传分析	83

5. 抗性发生的速度	36
6. 抗性的稳定性	37
第三节 杀虫剂抗性的生理, 生物化学	38
1. 引言	38
2. 体壁渗透性, 积蓄, 排泄	38
3. 解毒分解	40
4. 作用点的敏感性降低	46
第四节 杀虫抗性的对策	49
1. 引言	49
2. 用新的杀虫剂取代	49
3. 增效剂、增效作用	52
4. 负相关交互杀虫剂	53
5. 混合剂和轮换用药	56
6. 抗性对策的设想	57
第三章 杀螨剂的抗性	65
第一节 叶螨抗性发展的特异性	65
第二节 影响叶螨敏感性的主要因子	67
第三节 发育阶段和抗性的程度	67
第四节 药剂淘汰和抗性发展	67
第五节 抗性事例和交互抗性	68
1. 选择性的杀螨剂	68
2. 有机磷杀虫剂	74
3. 有机磷和选择性杀螨剂之间的交互抗性	78
4. 复合抗性	79
第六节 抗性的遗传	79
1. 选择性的杀螨剂	79
2. 有机磷杀虫剂	81
第七节 抗性的机制	83
1. 胆碱酯酶活性	83

2. 其它	87
第八节 抗性和敏感性在生态上各种性质的比较	90
1. 产卵数、孵化率、发育速度、繁殖力	90
2. 滞育性	91
第九节 抗性的稳定性	92
1. 选择性的杀螨剂	92
2. 有机磷杀虫剂	94
第十节 抗性对策	96
1. 负相关药剂	96
2. 增效剂	97
3. 物理防治	98
第四章 杀菌剂的选择性	106
第一节 病害防治与杀菌剂的选择性	106
第二节 杀菌剂对病原菌的选择性	107
1. 病原菌对药剂的溶解作用和选择性	107
2. 病原菌对药剂的吸收和选择性	108
3. 病原菌的解毒和选择性	109
第三节 杀菌剂对病害的选择性	110
1. 药剂在发病过程中的选择性	110
2. 湿度和选择性	111
3. 土壤微生物和选择性	112
4. 其它因素和选择性	113
第五章 杀菌剂的抗性	115
第一节 抗性植物病原菌的意义	115
第二节 抗性菌的形成过程	117
第三节 抗性遗传	122
1. 细菌的抗性	122
2. 真菌的抗性	123
第四节 抗性的药理	127

1. 抗药性的药理学机制	127
2. 对苯并咪唑类药剂的抗性	130
3. 对氧硫杂芑类药剂的抗性	132
4. 对甾醇合成抑制剂的抗性	133
5. 对有机磷杀菌剂和稻瘟灵的抗性	135
6. 对取代芳香烃类药剂的抗性	140
7. 对春雷霉素的抗性	141
8. 对多氧霉素的抗性	142
第五节 抗性菌在田间的生态及其对策	143
1. 抗性菌在田间发生的条件	143
2. 抗性菌在田间的消长	147
第六章 除草剂的选择作用	157
第一节 除草剂的选择作用	157
第二节 选择作用的各个方面	158
1. 根据植物生态之差异而产生的选择作用	159
2. 以植物的药剂反应性为基础的选择作用	162
第三节 选择作用的分析 (I)	165
第四节 选择作用的分析 (II)	168
1. 以吸收过程作为衡量分级的选择作用方法	168
2. 以输导及分布过程作为衡量分级的选择作用	170
3. 依赖于化学的形态变化的选择作用	171
第五节 依赖于作用系统的特殊性而产生的选择作用	180
第六节 今后的各种问题	182
第七章 杂草的演替与除草剂抗性	190
第一节 杂草群落的建立与演替	190
1. 杂草群落的形成	190
2. 杂草群落的建立	193
3. 杂草群落的演替	194
第二节 除草剂对杂草群落组成的变化	199

1. 杂草对除草剂敏感性的差别	199
2. 除草剂本身残效期与植被的变化	204
3. 除草剂连用对植被的变化	211
第三节 对除草剂抗性的获得	216
1. 杂草获得抗性的可能性	216
2. 抗性杂草的出现	217
3. 与抗性有关的遗传变异	222
第四节 杂草防除及其对策	224
1. 杂草防除的进展	224
2. 对杂草防除指导思想的转变	226
3. 今后的杂草防治对策	227

第一章 杀虫剂的选择毒性

第一节 防治害虫上选择性杀虫剂的作用

1. 对种群数量的影响

若不拘限于害虫，而对动物、植物、微生物的种群数量进行长时间的调查研究，它的数量有时虽然也发生不规则的变化，但是，大致以一定的平均值为中心而有所上下；有时会不断地无限增殖，一般不容易绝灭。这是由于这种生物的内因以及外在的对这种生物的外因的综合作用加以自然控制的缘故。如果这些控制机制不起作用时， N_0 只的生物在 t 代后，则是：

$$N = R_0^t N_0$$

式中： R_0 是每一世代纯增殖率（每一只雌虫的平均雌性生殖数），二化螟的 $R_0=150$ ， $t=2$ ，因此到了第二年就成为22,500倍；稻褐飞虱的 $R_0=100$ ， $t=4$ ，到这一年末就增殖到 1×10^8 倍，即使二化螟每一世代死亡99.3%，稻褐飞虱每一世代死亡99.0%，仍能维持前一世代的种群数量。

如果以一定数量的饲料和一定的物理条件饲养生物，在种群数量少的时候，就随着纯增殖率成指数的增加，不久增殖曲线即行放缓，从整体来看，表现为S型的增殖曲线（也叫作逻辑斯谛〔logistics〕曲线），最后达到了看不出种群数量有增减的稳定状态。这种由于种群数量的增长本身控制了种群数量的增加，称为对增殖的密度效果（density effect）。

自然界中并不是这样单纯的相互关系，是与围绕着这个生

物种群的物理的、化学的、生物的环境因素之间的复杂关系，不仅由于出生和死亡，并且通过迁移滞育，相互变异等的原因，生物种群数量（密度）随着时间而不断变动。

a. 绿蝽象

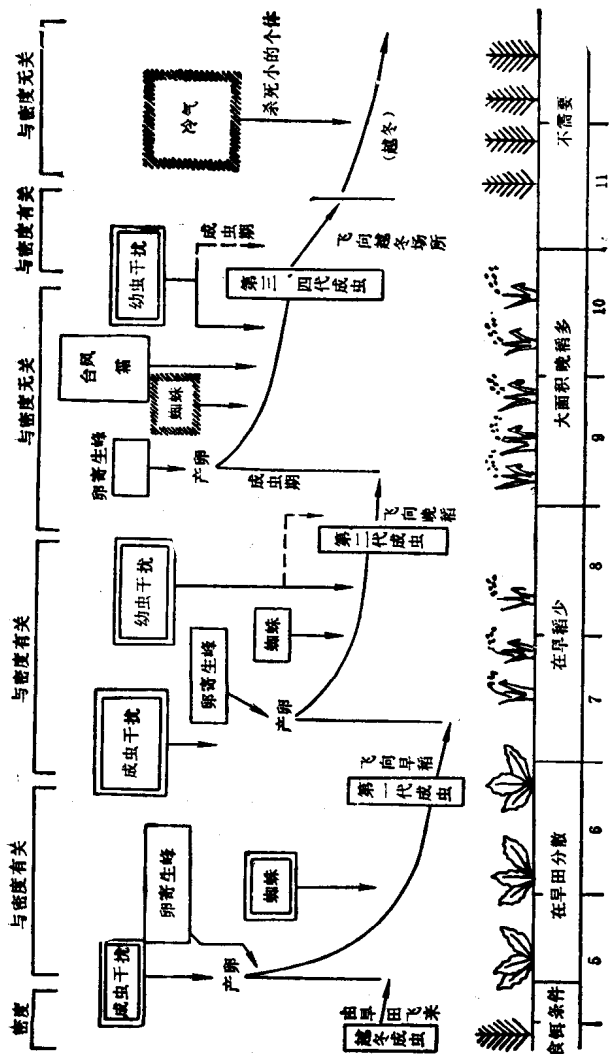
绿蝽象 (*Nezara viridula*) 是象英文叫作 green vegetable bug 那样的杂食性害虫，它有害水稻、玉蜀黍，小麦等禾本科，大豆，菜豆等豆科，番茄、马铃薯等茄科，黄瓜、烟草、棉花或者柑桔、柿、桃等果实。在日本，大部分种群每年经过三个世代，由越冬成虫早期所产之卵的一世代，在这一年内可繁殖四个世代，分别以第三世代或第四世代成虫越冬。

因此，每年经过的世代数是随着该年的气象条件而左右。3~6月间在温暖多雨之年份，越冬成虫的产卵就早，幼虫发育也早，于是很多个体都是经过四个世代。图1.1所示是和歌山县朝来附近绿蝽象种群的控制机制模式。

在越冬前后的移动期中，前一世代的密度高时的生存率比低时为低的这种依存密度过程就起了作用，但是，这个因果关系很低。在越冬期中则可看到与此相反的过程，脱离越冬地的移动，主要根据非密度依存的过程来决定种群数量。结果，自第3，第4世代至春天的越冬飞来成虫之间，也看不出有什么依存密度的关系。

另一方面，在越冬飞来成虫→第4世代，第1世代→第2世代之间，由于因依存密度所引起的成虫间的干扰，从而产卵数降低，通过因依存密度引起幼虫直接死亡，成虫体重减少，引起产卵数减少。随着在第一世代较高的卵寄生率、孵化幼虫数减少，结果增加了捕食性昆虫的抑制效果，从整体上显示依存密度的倾向。

但是，从第2世代到越冬后的第3、第4世代时，水稻的



注: 与密度无关的死亡因素; 与密度有关的死亡因素;

与密度负相关的死亡率 与密度正相关的死亡率

图 1.1 绿蟥象群的控制机制模式^[10](引自伊藤, 桐谷—1971)^[10]

栽培面积增加, 保证有了充分的饲料和空间; 另一方面, 因卵寄生率降低, 卵块大小增加所产生的卵寄生蜂的抑制效果降低, 结果, 种群密度的控制机制就不起作用。

这就可见生物种群的控制机制, 决不是所有各世代都起同样的作用, 是因世代和时期而各异。不仅如此, 并且表示生物种群由于某一世代有效的控制机制起了作用, 就能防止无限制的增加 (引自伊藤, 桐谷一, 1971)⁽¹⁰⁾

b. 马铃薯甲虫

从这样复杂的机制中所展开的生物种群数量的变动, 由于所谓农地化, 都市化这种环境的单纯化, 引起特定生物的种群数量增大, 也就是特定动物的害虫化。

图1.2为马铃薯引入美国大陆前后, 作为马铃薯大害虫的马铃薯甲虫的种群密度变动模式图。1850年在大陆开始大面积种植马铃薯, 随之少数生活在落矶山脉东面的噬食野生茄科植物 (*Solanum rostratum*) 叶子的叶甲就大量增殖起来。它的分布1874年到达东海岸, 有时超过经济受害水平 (economic injure level, EIL, 给经济带来损害的害虫最低密度), 或者超过了经济阈值 (economic threshold, 为预防害虫密度达到EIL而应防治的害虫密度) (引自 stern and smith 等, 1972)⁽²²⁾。同样的, 1850年加利福尼亚州开始种植牧草苜蓿, 以前不是重要害虫的粉蝶的一种, 苜蓿粉蝶 (*Colias philodice euiytheme*) 得到新的适合其胃口的食草, 于是就大发生而成为害虫。

c. 吹绵蚧

图1.3所示是吹绵蚧于1868年侵入加利福尼亚州柑桔园, 由于1888年引进潜叶蝇的一种吹绵蚧隐毛蝇 (*Cryptochaetum iceryae*) 和澳洲瓢虫 (*Rodolia cardinalis*) 两种天敌, 将其

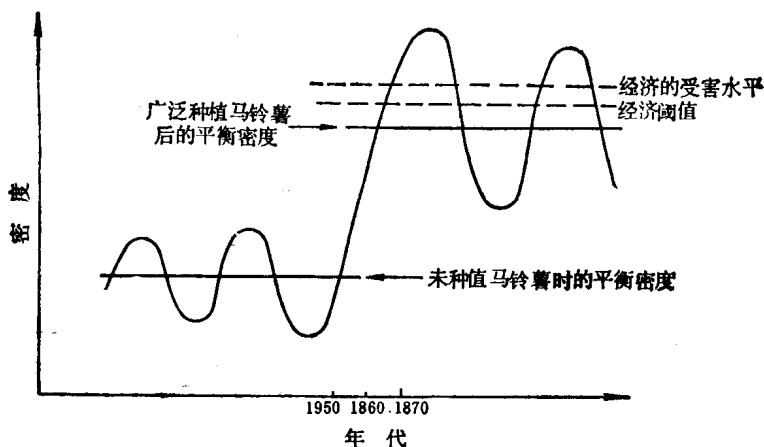


图 1.2 美国随着马铃薯的栽培而产生的马铃薯甲虫平衡密度变化的模式 (引自Stern and Smith1972)⁽²²⁾

完全控制。但是到了1947年，由于使用滴滴涕，使澳洲瓢虫减少了，吹绵蚧便又大生。于是停止使用滴滴涕，再次依靠澳洲瓢虫的力量，使吹绵蚧抑制在EIL以下（引自Stern and Smith等，1972）⁽²²⁾，这种害虫的发生很少有以天敌减少或作物栽培作为原因的例子。又如前述的南绿蝽，一般都是由于复杂的生态系统的结合，才世代相传。所以，粗心大意地喷洒杀虫剂，即使获得暂时的防治害虫效果，但是不久害虫却又再次大发生，或者造成其它害虫的发生，于是就必须使用更强力的杀虫剂，这是因为杀虫剂根本破坏了生态系统，绝对不是有效的防治了害虫。

2. 研究选择毒性的目的

当初研究杀虫剂的选择毒性是以减轻对高等动物或作物的毒性（对作物指药害及残留——译者注）为目的的，其后由于

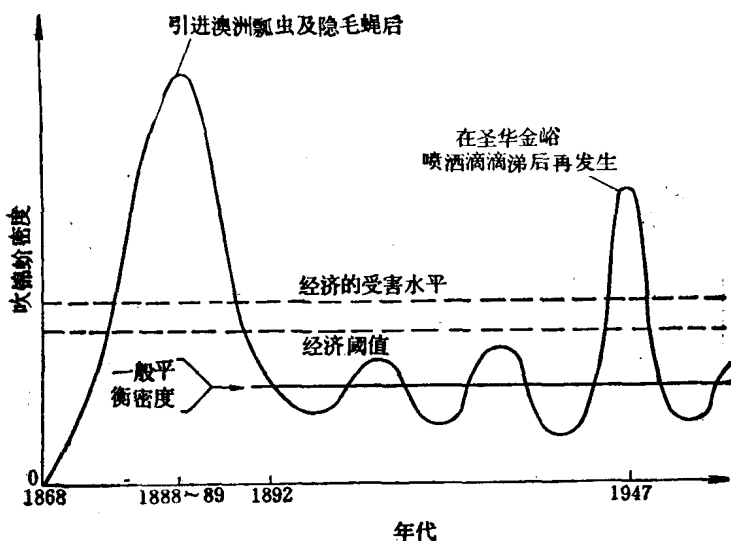


图 1.3 1868年吹绵蚧侵入加利福尼亚州的柑桔园后
的种群密度变动的模式 (引自Stern and Smith等, 1972)^[22]

战后粮食不足和过度发展有机合成杀虫剂的结果，对人畜和作物的毒性也就最成为问题了。但是，现在研究选择毒性的目标，当然也仍是对人畜和作物的毒性，但也以减轻对目标害虫以外的生物的作用，更以对食物和环境不造成残留为其重要的目标。因此就研制了满足这个目标的化合物，不再以杀虫剂防治害虫，而用作害虫的密度调节剂，或使害虫恢复到EIL以下的平衡密度的控制剂。选择性杀虫剂所适用的害虫种类很少，而且过量使用并不可靠，在使用时就必须详尽周密地考虑到适用药剂和适用害虫，所以这往往与商业观点，或现场使用者和指导者的希望相反，有必要对原有害虫进行长期防治。

第二节 杀虫剂选择毒性的机制

据解释：所谓‘选择毒性’是：在相互接近的某种生物中，对一方无害，而对另一方给以损伤（Albert, 1976）^[12]。这个困难问题是医药上最重要的课题，不仅在人类与其他生物（病原菌或寄生物等）的关系上，即使在同一个体内的组织或器官之间，选择毒性也是重要的问题。

例如，在麻醉剂中所见到那样，只对中枢神经有强烈的毒性，而对其他组织，其毒性可以忽视，并且要求所有毒性一经停止投放，就能快速而完全地消除。至于杀虫剂的选择毒性，这种组织间的选择毒性不成为研究课题，而只研究生物之间的问题。

Ripper and Greenslade等(1951)^[18]把杀虫剂选择毒性的要因分为：生态学的选择毒性和生理学的选择毒性。生态学的选择毒性在施用内吸杀虫剂上，使植食性昆虫直接受毒，而非植食性昆虫不直接受毒，它是根据昆虫的行动或习性而有所不同，杀虫剂的局部散布，或者从事散布者穿用防护服也属于这个范畴之内。在这些方面可以说内吸杀虫剂和胃毒剂比触杀剂能够得到更好的效果，具有强烈急性毒性的涕灭威（aldicarb）和克百威（carbofuran）制成粒剂使用而得到应用。

生理学的选择毒性的机制可分为：（1）药剂向体内的渗透性；（2）药剂的解毒分解代谢及活性化代谢；（3）药剂向组织内积蓄和向体外排泄；（4）药剂向作用点的渗透性；（5）药剂对作用点的毒性作用；（6）随着攻击作用点而产生的二次性作用（O'Brien, 1967）^[15]。

1. 药剂向体内的渗透性

一般昆虫的体壁是含有几丁质（chitin）的硬壳，与此相

反，哺乳动物则为含有角朊 (keratin) 的柔软的皮肤。在结构上当然有显著的不同，就是在生理上和物理上也有很多相异之处。滴滴涕为高脂溶性，容易被昆虫表皮存在的蜡质溶化，对皮肤有高度的渗透性；因此，滴滴涕对脊椎动物的为低毒性，而对昆虫却表现有高的经皮毒性。

a. 动物与昆虫的差异

表 1.1 因处理方法不同的滴滴涕毒性的差异

(引自 O'Brien, 1967)⁽¹⁵⁾

	LD ₅₀ (mg/kg)			
	经皮	口服	腹腔内注射	静脉注射
鼠	3,000	400	150	50
兔	300~2,820	300	2,100	50
蟪象的一种	409	301	31	—
蜜蜂	114	1.7	0.2	—
日本金龟子	93	205	162	—
美洲大蠊	10	—	7	—

表1.1是变更滴滴涕的处理方法,来比较对各种动物,昆虫的毒性。哺乳动物的大鼠和兔的经皮毒性是比日本金龟子 (*Popilla japonica*), 美洲大蠊 (*Periplaneta americana*) 低得多, 这就支持了上述的想法。但是, 滴滴涕对皮肤的渗透性经直接测定结果, 大鼠的半量透过时间是26小时, 而美洲大蠊是26.4小时, 两者的渗透性并无多大差异。由此即可认为, 两者经皮毒性的差异是关系到选择毒性的主要因子。滴滴涕在大鼠上或美洲大蠊上的皮肤渗透性并不高, 但在另一方面, 可以看到大鼠能迅速将滴滴涕解毒, 而美洲大蠊不能迅速将滴滴涕解毒; 因此, 经皮毒性才有如此显著的差异。这就可以想象到大鼠的腹腔内注射毒性远比美洲大蠊要大得多了 (O'Brien-