

生物科学参考资料

第八集

科学出版社

内 容 提 要

本书共收集了八篇论文。介绍了昆虫激素在害虫防治和益虫繁育上的应用、微粒体多功能氧化酶和昆虫抗性的关系、RNA 噬菌体的结构和功能、tRNA 的结构和功能、肝细胞质膜的制备、脉冲离解技术在放射生物学中的应用以及癌细胞的表面结构、荧光技术在生物物理学中的应用等问题，可供农业、医学、生物学工作者参考。

生 物 科 学 参 考 资 料

第 八 集

*

科 学 出 版 社 出 版

北京朝阳门内大街 137 号

中 国 科 学 院 印 刷 厂 印 刷

新华书店北京发行所发行 各地新华书店经售

*

1977 年 2 月第 一 版 开本: 787×1092 1/18

1977 年 2 月第一次印刷 印张: 8

印数: 0001—4,990 字数: 184,000

统一书号: 13031·554

本社书号: 815·13—6

定价: 0.85 元

限 国 内 发 行

目 录

昆虫激素在害虫防治和益虫繁育上的应用·····	(1)
微粒体多功能氧化酶和昆虫抗性的关系·····	(22)
RNA 噬菌体的结构和功能 ·····	(37)
肝细胞质膜的制备·····	(46)
癌细胞的表面结构	
——尤以肝癌细胞的细胞外套为中心 ·····	(61)
转移核糖核酸的结构和功能·····	(76)
脉冲辐射离解技术及其在放射生物学研究中的应用·····	(103)
荧光技术在生物物理学中的应用	
——一些近期发展·····	(125)

昆虫激素在害虫防治和 益虫繁育上的应用

一、昆虫激素的种类

一般讲,昆虫激素分为两大类:(1)内激素,(2)外激素。内激素包括脑激素、蜕皮激素、保幼激素、滞育激素等,是由昆虫体内特有的腺体所分泌,经血液传导到全身,在不同发育时期内,对昆虫的生长、发育、变态、滞育(休眠)、生殖等生理功能起着调节控制的作用。外激素又称为信息激素,由雄性或雌性昆虫的特有腺体分泌到昆虫体外,对它同种伙伴发出的化学信号,影响他们的行为,从而帮助获得昆虫生活中的种种基本需要,例如生殖、觅食、群聚活动、自卫等。现已发现的昆虫外激素有性外激素、结集外激素、追踪外激素及告警外激素等。目前有许多种害虫的外激素,特别是性外激素已被分离,测定了结构,并且由人工合成,已开始用于害虫防治。

内激素和外激素的研究在近年来发展十分迅速。已发表的论文有数千篇,并出版了许多综述论文和专著^[1-8]。

在资本主义国家,除去一些研究单位,大专院校外,还有一些大的化学企业公司从事这项研究。如美国,专业进行昆虫激素研究和生产的公司已有两个:佐伊康公司(Zoecon Corp.)目前已提供昆虫性引诱剂商品和保幼激素样品;法庆公司(Far-
chan Corp.)已开始提供30余种合成的性引诱剂。

近年来国内有关单位业已开展昆虫激素的研究和应用。广东、上海、北京等有关单位合成了一系列保幼激素类似物,提供蚕丝增产和防治害虫试验^[9],从植物中分离昆虫蜕皮激素类似物的工作也取得了结果。蜕皮激素用于蚕业能使蚕上簇整齐,减少养蚕作业劳动力消耗,增加蚕丝产量。

关于外激素方面,国内已开始棉红铃虫^[10]、松毛虫^[11]、玉米螟、梨小食心虫等害虫的性引诱剂粗提物应用,有效成分的分离、测定结构和人工合成的研究,在有些省区已开展了群众性科学试验,显示了昆虫外激素在综合防治害虫方面的潜力。

本文仅就昆虫保幼激素和蜕皮激素研究动态作简要介绍。

二、昆虫生长发育的激素调节控制

昆虫在生物中种类最多。它们能适应严酷的自然条件,具有很强的生殖能力,一生中有各种变态。其中,经过卵、幼虫、蛹、成虫等几个阶段的叫做完全变态昆虫,如

蝶、蛾、蜉蝣等；只经过卵、若虫，不经过蛹而到成虫阶段的叫做不完全变态昆虫，如，蟋蟀、蝗虫等。昆虫的这些变态，一方面受到外界环境条件(湿度、温度、光照)的影响，但主要是有其内在的机理。现已证明：昆虫的生长发育至少受到体内三种具有强烈的生理活性物质，即所谓昆虫内激素的控制。这就是脑激素、蜕皮激素和保幼激素。它们分别由脑神经球、前胸腺、咽侧体所分泌，通过体液的传递，相互巧妙地协作，起着调节昆虫生长发育的作用。

昆虫生长发育的激素调节关系，可从图 1 得到一个概念。

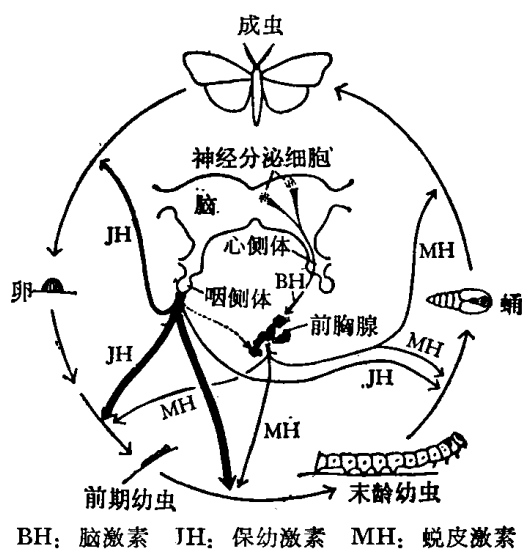


图 1 昆虫生长发育的激素调节控制^[92]

脑激素又叫促前胸腺激素，它刺激前胸腺分泌蜕皮激素。当脑激素不存在时，昆虫不能分泌蜕皮激素，就不能生长发育和变态。保幼激素起到保持幼虫机体的结构，抑制昆虫变态的作用。在幼虫时期保幼激素与蜕皮激素同时存在，共同起作用时，幼虫蜕皮仍然为幼虫而生长；在昆虫末龄幼虫蜕皮前和羽化蜕皮前，保幼激素停止分泌，只有蜕皮激素起作用时才引起昆虫变态，幼虫蜕皮化为蛹，蛹蜕皮变为成虫。也就是说，变态是由蜕皮激素和保幼激素量的平衡决定的。在成虫时期保幼激素又行分泌，对卵的成熟和胚胎发育起作用。

当人们认识了昆虫生长发育的调节控制规律，又掌握了一系列激素药物，就可以以这些药物为手段调节昆虫的生长发育，人为地控制益虫的繁殖，也可以用过量激素干扰昆虫的正常生理活动，达到消灭害虫的目的。也就是人们常说的所谓“第三代杀虫剂”。

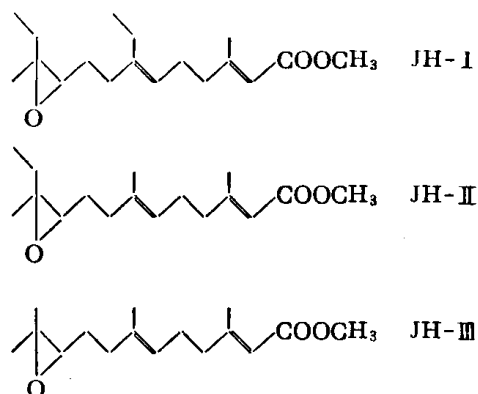
三、昆虫保幼激素

(一) 天然保幼激素

保幼激素是由昆虫咽侧体分泌的，是控制昆虫发育、变态、滞育的三种内激素之一。

早在1934年 V. B. Wigglesworth 首先发现昆虫体内存在有保幼激素物质^[12], 1956年 Williams 从天蚕蛾的腹部第一次成功地获得了具有很高活性的保幼激素^[13]。此后, 许多生物化学工作者为了分离天然保幼激素和确定其化学结构进行了许多研究工作^[14,15]。

随着分离提纯技术和仪器的发展, 保幼激素的结构于1967年由美国威士康星大学 Roller 等人采用先进的气相色谱, 质谱, 核磁共振谱技术进行一系列的生物的和化学的研究, 确定从天蚕蛾分离出来的保幼激素结构式为3,11-二甲基-7-乙基-顺-10,11-环氧-反,反-2,6-十三烃二烯酸甲酯(JH-I)^[14,15,16]。不久, Meyer 等人^[17,18]从同一种蛾分离出来第二种保幼激素并确定其结构式为3,7,11-三甲基-顺-10,11-环氧-反,反-2,6-十三烃二烯酸甲酯(JH-II)。而保幼激素(I)和(II)无论从其分子结构和生物、化学方面的性质看, 都十分相似, 同属于倍半萜烯酯类化合物。1973年, Judy 等^[19]采用烟草天蛾(*Manduca sexta*)咽侧体在体外培养方法分离保幼激素, 这个改进了的方法使产物更易于分离提纯, 提纯产物经高压液体色谱仪分离, 获得了一个已知的 JH-II 和另一个新的 JH-III。到目前为止, 从昆虫体内分离出来的天然保幼激素只有这三种, 即 JH-I, JH-II, JH-III, 它们的结构如下:

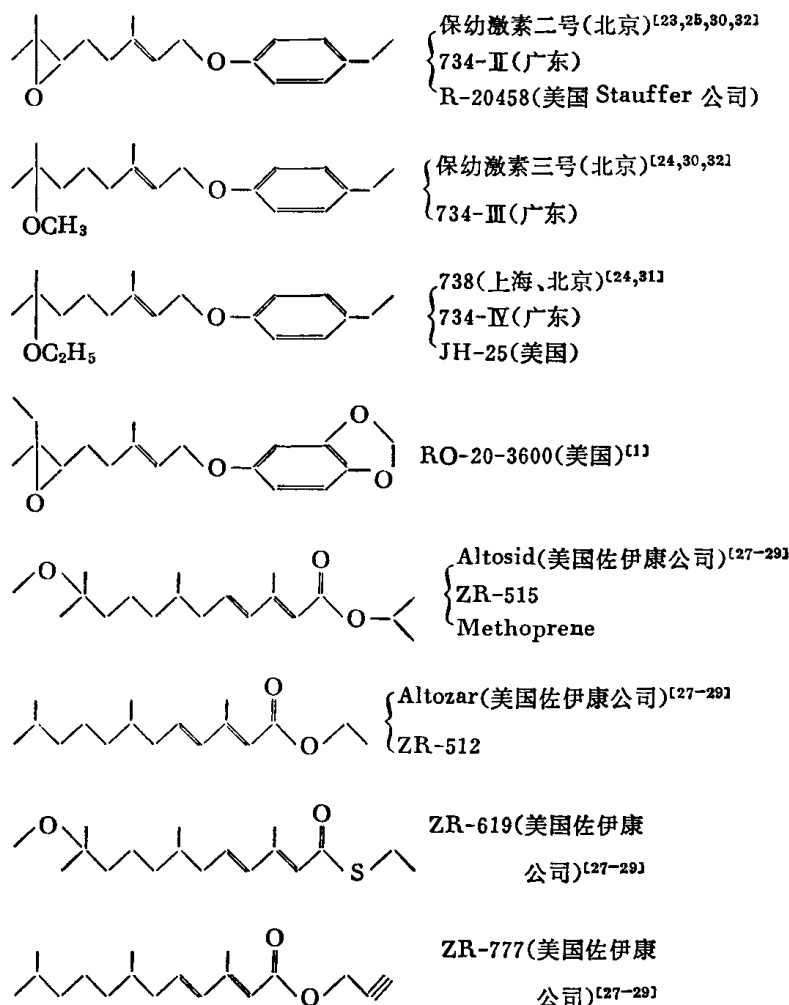


为了证实从昆虫体内分离出来的保幼激素的立体化学结构, 各国有机化学工作者通过各种合成路线, 相继合成了这些天然保幼激素, 并与天然的产物进行物理、化学、生物活性的比较^[20,21,22], 从而证实了它们的立体化学结构, 因篇幅限制本文不予详述。

(二) 保幼激素的类似物

天然来源的昆虫保幼激素具有一定的立体化学结构, 人工合成它们的步骤也较多, 成本也高, 大量供应是有困难的。所以目前许多单位集中力量搞保幼激素类似物的研究, 以期获得化学结构简单, 容易合成, 活性高, 稳定性高的药物。这方面的工作进展很快。到目前为止, 已经筛选了数千种化合物, 从中发现了一些性能优越的品种。

目前国内外已发现比较好的保幼激素品种有下列几种:



保幼激素 734-II, 738 等化学结构比较简单, 原料易得, 容易合成^[24-26,30-32]。所需原料如香叶醇, 乙基苯酚等均可立足于国内。

ZR-515, ZR-512 类型是美国佐伊康公司发展的品种, 已经建立了小型试验车间。并经美国环境保护局批准, 可用于防治蚊虫试验。国内已购进这类激素的样品, 在蚕业上应用, 收到很好的增产效果。有关单位正在进行试制。

(三) 保幼激素的生理作用

保幼激素及其类似物对昆虫的生理作用有以下几方面:

1. 阻止正常变态和导致异常变态^[1]

正如前面所说, 在昆虫生活史中有两个时期(幼虫末龄、蛹)不存在保幼激素, 这时如果从外面施加保幼激素, 则引起幼虫期延长, 或成为超龄期的幼虫, 或变为半幼虫-半蛹中间型。这些虫态都没有生命力, 不久即死亡。在蛹期施用保幼激素则可能产生第二次蛹或半蛹-半成虫中间型, 也没有生命力, 从而达到被消灭的目的。如果使用的剂量较小, 可能延长末龄幼虫的龄期, 不会导致死亡。例如用适量的保幼激素类似物处理 5 龄家蚕幼虫, 可使龄期延长一天到二天, 个体长大, 正常结茧, 提高蚕丝

产量,这就为保幼激素的利用开辟了更广泛的可能性。

2. 打破滞育^[33,35,37]

昆虫的滞育是对抗外界不利条件(如高温、严寒、干旱)的一种自卫生理状态。这种状态也是受激素调节控制的。近来研究表明,保幼激素能使已滞育的昆虫中止滞育。如果用化学药品打破滞育状态,在不利的自然界条件下,昆虫会失去自卫能力而死亡。同时也可利用激素调节滞育,以便有利于益虫(如蚕、寄生蜂)的繁殖。

3. 不育和杀卵^[36]

已发现有些保幼激素类似物对卵巢的发育、性的成熟有影响,高剂量时能引起昆虫不育、卵不孵化,低剂量有良好的作用,增加产卵量和卵的孵化率,这方面已有一些初步成果。

由此可见,保幼激素及其类似物可阻碍昆虫正常的生理功能,最终达到消灭和控制昆虫的目的。因此亦被称为“昆虫变态抑制剂”或“昆虫生长调节剂”。

(四) 保幼激素的代谢

由于保幼激素的特殊功能以及它以极微的数量控制了昆虫的发育,因而它在昆虫体内的代谢途径,较早已被人们注意^[38,41,43,45,46]。试验结果表明^[38],天然保幼激素在四种昆虫(烟草天蛾,天蚕蛾,一种沙漠蝗(*Schistocerca vaga*)和一种麻蝇)中的代谢途径各有不同,但基本上可认为主要代谢途径有两条:一是将激素(I)分子中的环氧部分水解,生成二醇类似物(II);另一是先水解分子中的酯生成环氧酸(III),再水解环氧部分成二醇酸类似物(IV),解除活性,缀合后排出体外,如图2^[47]所示。

用标记的保幼激素对8个目的昆虫所进行的代谢研究^[42],也说明主要代谢途径是以上两个,另外从代谢产品中,也还发现有四醇酸类似物和双环氧酸类似物和其他产物,可以看出,保幼激素在虫体内的代谢途径是复杂多样的。

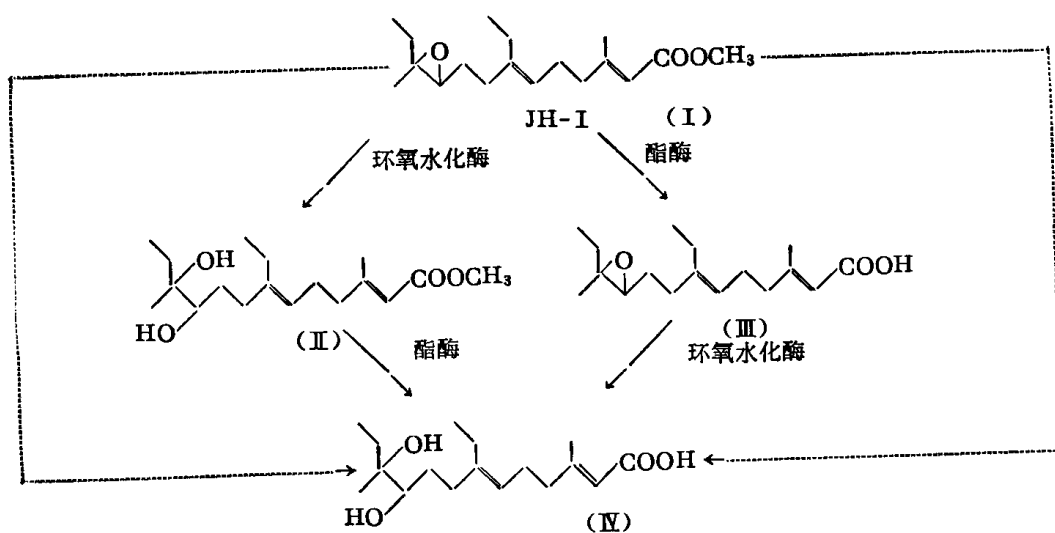
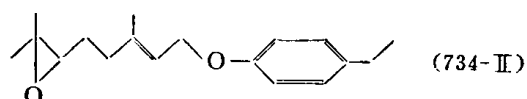


图2 保幼激素的代谢途径

从以上主要代谢途径看,以及用数种昆虫在体外的试验表明,保幼激素的代谢是由于虫体内酶系统起的作用^[41,43],因此虫体内解除保幼激素活性的器官也不只一个。从试验也可看出保幼激素在虫体内存在的时间也相当短^[38,45]。这说明昆虫本身具有极有效而快速地代谢它自己的激素的办法。

天然保幼激素,对动物毫不显毒性^[39],因此保幼激素在动物体内的代谢也同样引起人们的兴趣。用标记的保幼激素处理小白鼠所得结果表明^[38,44],动物对保幼激素的代谢基本上和昆虫相同,但有相当多的部分转化贮存在动物体内^[38],看来动物对保幼激素的代谢似乎比昆虫更复杂。例如保幼激素类似物 1-(对-乙苯氧基)-3,7-二甲基-6,7-环氧-反-2-庚烯(下式):

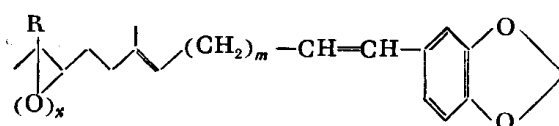


在小白鼠的代谢产物中^[40],除发现水解环氧部分的二醇类似物醚键断裂后的相应生成物和苯环支链上的氧化产物外,还发现有不同取代的四氢呋喃和四氢吡喃衍生物。看来有更多的酶系(氧化酶,环化酶)参加到保幼激素的代谢途径中来了。

(五) 保幼激素对家蚕的增丝作用^[48-51,68]

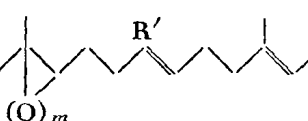
1971年 Akai 等^[48]报道了家蚕幼虫因注射保幼激素而使龄期延长,增加了丝蛋白的积累量。试用药是合成的 C_{18} 保幼激素。以花生油稀释,注射乙醚麻醉的五龄蚕儿。用药时间是进入五龄后的第24小时。用药剂量10微克/头。五龄延长大约一天。全茧量和茧层量增加大约30%。

1972年张清芬等^[49]报道了用次甲二氧基苯的衍生物点滴家蚕形成大茧。这些类似物的结构式如下:

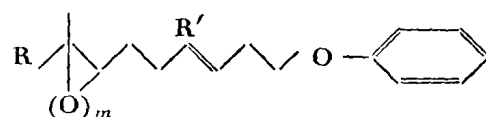


以 $R=CH_3$, $m=1$, $x=1$ 为例: 用药剂量10微克/头,蚕儿不再蜕皮继续生长,而后变畸形,死亡,得不到绢丝。用药剂量为1微克/头时,(五龄的第二、三天各施药0.5微克/头),五龄延长二天(对照八天),结果茧层量和全茧量增加大约20%;第四、五天处理,五龄延长六天,茧层量和全茧量增加约50%;第七、八天处理,蚕儿变畸形而后死亡。

同年他们还报道了用次甲二氧基苯的衍生物口服处理家蚕增加蚕丝的产量。将药物混入人工饲料进行喂饲。用药剂量为0.5, 1.0, 2.0 ppm(百万分之一单位),五龄开始到第48小时之间喂食含药的饲料几乎是无效。五龄第48—96小时喂食含药饲料,结果增加了茧层量和全茧量。4.0 ppm,五龄第48小时与第96小时之间口服给药效果最好,龄期延长66.4小时,茧层量为对照的1.41倍。8.0 ppm则形成较重的茧,但是茧层率低于对照。这就证明了家蚕五龄幼虫通过经口喂饲保幼激素,可以提高丝产量^[50]。

K. Kiguchi 等^[51] 1974 年报道了用不同烷基取代的萜烯酯类和苯基香叶基醚类对家蚕的保幼激素活性。萜烯酯类用某些烷基取代而得活性更高的化合物。萜烯酯类的类似变化也是如此。萜烯酯类:  共试验了

13 个化合物。其中以 R 为 $-(CH_2)_2CH_3-n$, R' 为 CH_3 活性最高。萜烯醚类:

 共试验了 24 个化合物。其中以 R 为

$-(CH_2)_2CH_3-n$, R' 为 CH_2CH_3 活性最高。一般说来, 带有环氧的化合物比相应的三个双键的酯类化合物的活性高。生物试验的方法是蚕儿第三次蜕皮后的 24 小时切除咽侧体, 立刻注射保幼激素。活性最高的则进行正常的幼虫蜕皮, 进入五龄, 没有一个化蛹。活性较小的则蜕皮形成幼虫一蛹的中间形。没有活性的则很快完全化蛹。

我国保幼激素在蚕业上应用的研究是从 1973 年春开始的^[30,52,53]。在很短的时间内合成了 JH 类似物二号(734-II)、三号、“738”等化合物, 用喷射蚕体的方法达到增丝的目的。二号和“738”已在广东、江苏、湖北、山东等地进行了比较大规模的推广使用。收到了可喜的效果。

国内试用的效果见表 1。

表 1 保幼激素类似物对二化性家蚕的增产效果 (湖北罗田, 1974)

试 用 药 物	药 液 浓 度 (ppm)	万头收 茧 量 增 加 (%)	万头 茧 层 量 增 加 (%)
三 号	12.5	4.4	5.9
738	10	10.2	15.0
二 号*	4		12.3
515	6.5	12	13.1
619	5	10	13.8

* 据山东蚕业研究所资料。

保幼激素类似物在蚕业上的应用是提高蚕丝产量的一项新的措施。鉴于这一研究工作的时间较短, 无论是合成方面还是使用方面都需要进一步的探讨, 以便找出更理想的保幼激素类似物以及更合理的使用方法, 从而为进一步提高蚕丝的产量作出贡献。

(六) 保幼激素对害虫的防治作用

应用昆虫保幼激素及其类似物防治害虫的研究工作, 受到国内外各方面的重视, 把它们作为“第三代杀虫剂”来对待。但是到目前为止还没有大规模实际应用, 仍处于试验阶段。

一般认为保幼激素作为杀虫剂有以下几个优点：(1) 活性高。在室内对每个虫体的作用剂量在微克和毫微克(10^{-6} — 10^{-9} 克)以下,田间使用浓度也较低；(2) 无公害。由于保幼激素在自然界易被分解,不会污染环境；(3) 无毒。保幼激素及其类似物对高等动物毒性极低。但也要看到在实际应用方面也还存在一些问题：(1) 稳定性差。易被光照、空气、水分等因素作用而分解,在田间防治害虫实际应用时,需要多次重复施药才能收到效果；(2) 作用时间要求严格。只有在昆虫发育周期的敏感时期(末龄幼虫、蛹、成虫和卵)才起作用,而在对幼虫期为主要危害阶段的害虫进行防治时,难以立刻压低虫口,在某些情况下,幼虫可能延长了危害期；(3) 成本较高。最近的一些研究表明,保幼激素的这些缺点正在逐步被克服,一些活性较高的品种,其稳定性还可以用剂型改进来增强。

关于保幼激素对害虫的防治作用的文献很多,可以参考一些专著和综述性的文章^[1,5,6]。下面就近年的部分资料举例来说明。

1. 仓库害虫

美国加州大学 R. G. Strong 与佐伊康公司的 J. Diekman^[54]等详细地研究了 15 种保幼激素类似物对杏仁蛾、印度谷蛾、赤拟谷盗等 12 种害虫的防治作用。采用粮食拌药的办法,试验浓度为 5, 10, 50 ppm。其中以 ZR-515 及 ZR-512 效果较好,有效浓度为 5—10 ppm,效果与马拉硫磷相近。激素杀虫剂的特点是对亲代成虫无杀伤作用,而对于 1 代及其后代有阻止发生的作用,借以阻止大量虫口的出现。由于 ZR-515, ZR-512 对高等动物的毒性极低,用于添加于粮食产品具有明显的优点,可以作为粮食害虫综合防治的一个环节来考虑。但由于保幼激素类似物成本较高,目前还无法取代现有杀虫剂。

2. 蚊幼虫^[55,56,57,58]

保幼激素及其类似物主要对末龄幼虫起作用(阻止变态)。蚊幼虫生活在水中,到成虫时期才对人畜造成危害。如能阻止蚊成虫的出现也就达到了防治的作用。保幼激素在这方面有其优点。有些品种对蚊幼虫的杀伤力非常高。例如 ZR-515 对伊蚊幼虫的 LC_{50} (致死百分之五十的浓度)为 0.0001 ppm (双硫磷对伊蚊幼虫的 LC_{50} 为 0.0005 ppm),超过了目前最好的杀蚊幼虫药双硫磷。加以 ZR-515 对高等动物毒性低,对水生生物安全,所以重点进行了研究。但由于 ZR-515 在日光作用下在水中极易分解,效果不能维持。最近国外发展了一种缓释剂型(Slow releasing formulation),以增加其稳定性。例如 Altosid SR-10 (ZR-515)是含有有效成分 10%的一种微型胶囊剂型,可用于暂时积水的牧场及田地内的伊蚊幼虫防治,每英亩用纯 ZR-515 量为 0.025—0.1 磅。暂时积水的田地中蚊幼虫发育期整齐,掌握在幼虫三、四龄大发生时期施药,效果很好。如是长期积水的稻田、池塘,蚊虫发育期不整齐,防治效果不明显。ZR-515 对于有机磷杀虫剂抗性的伊蚊幼虫也有好的防治效果。

北京动物研究所^[60]1973 年曾经用进口 ZR-515 乳油及其 SR-10 剂型在北京、广西南宁初步进行对蚊幼虫的防治试验。ZR-515(SR-10 剂型)用 0.015 ppm 浓度处理水体,当天取水样测定效果,死亡率可达 100%,但残效太短,24 小时后活性显著下降。

保幼激素类似物成本高,残效短,限制了在防治蚊幼虫方面的实际应用。
几种保幼激素对伊蚊幼虫的活性比较及其防治费用可参阅表 2 及表 3:

表 2 几种保幼激素类似物对伊蚊幼虫的活性比较

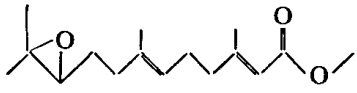
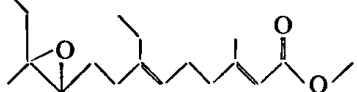
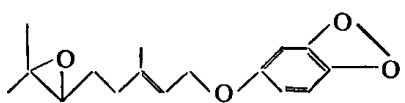
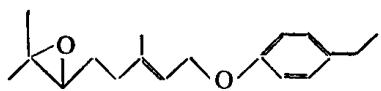
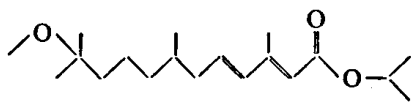
代 号	结 构	相 对 活 性	LC ₅₀ (ppm)
JH-III		1.0	0.21
JH-I		1.4	0.15
RO-20-3600		70	0.0030
R-20458		450	0.0047
ZR-515		1900	0.00011

表 3 几种杀蚊幼虫药剂的毒性及防治费用比较^[59]

药 剂	对高等动物的毒性 (LD ₅₀)* (毫克/公斤)	每英亩用药量 (磅)	防治一次费用 (美元/英亩)
对 硫 磷	19	—	0.15
倍 硫 磷	214	0.1	0.3—0.5
马 拉 硫 磷	1,187	0.4	0.5
双 硫 磷	2,000	0.05—0.1	0.3—0.5
矿 物 油	>10,000	2—5 (加仑)	0.6—2.5
ZR-515 (SR-10)	>34,600	0.25—0.5	2—4

* LD₅₀ 为致死百分之五十的剂量。

3. 蝇类^[61,62]

保幼激素类似物对蝇类的作用是阻止蛹变为成虫,而达到防治的目的。例如在美国南部牧区有一种吸血厩蝇在海边、湖边、河滩杂草及土中繁殖,用 R-20458 (0.05%浓度), Methoprene (0.025%浓度) 喷于草上,能阻止成虫出现,有效率达 99%。保幼激素类似物亦可采用家畜、家禽口服的办法,阻止蝇类在粪便中繁殖。例如牛每天口服 0.7 毫克 ZR-515 能阻止角蝇在其粪便中繁殖,对厩蝇的有效剂量为每天 100 毫克。ZR-515 家畜口服后对家蝇幼虫无效。

4. 蚜虫

蚜虫的世代较短,使用保幼激素类似物,可以阻止其繁殖。S. G. Nasser^[63]等研究了保幼激素类似物对于春麦蚜虫的防治作用。发现 ZR-619, ZR-777 等对于这种蚜虫有抑制变态的作用,对四龄若虫及成虫有不育作用。将 0.01—0.1% 浓度的药液喷到有蚜虫的小麦植株上可以直接杀死蚜虫,阻止其大量繁殖,并能减轻这种蚜虫分泌物对小麦所造成的毒害。

R.J.Kuhr等^[64]研究了 9 种保幼激素类似物对豌豆蚜虫,草莓蚜虫的防治效果。0.1%浓度的药液浸渍蚜虫寄主植物,ZR-512 对两种蚜虫有同等的毒性,接近 0.1% 西维因的效果。能使有翅蚜虫的翅膀变皱,影响迁移,而且影响生殖力。R-20458 (0.1%浓度)对豌豆蚜虫能致死 95%。一般是接触作用,但口服也有效。小规模田间试验,对草莓实生苗用 0.12% ZR-512 及 RO-20-3600 作喷布处理,10 天后蚜虫虫口分别降低 50%和 80%。显然这样的浓度是不经济的,还需要研究极低浓度下长期防治效果。

菜蚜经保幼激素处理后,在幼虫末期翼表皮细胞不能正常发育^[65]。

一种豆蚜施用保幼激素后,阻止虫口发展^[66]。

5. 介壳虫^[67]

保幼激素类似物对桔粉蚧有明显的防治效果。主要表现在成虫致死及生殖力下降。例如 ZR-777(0.1—0.01% 浓度)喷洒造成各龄期若虫大量死亡,使孤雌生殖的雌虫生殖力下降。0.1%浓度,10 天后使虫口降低 99—100%。

ZR-619, ZR-699, ZR-777 对于盾蚧也有高的防治效果。ZR-619(0.001%浓度)能使所有若虫完全受到抑制^[68]。

6. 蚜虫

W. F. Walker^[69] 试验了保幼激素对墨西哥瓢蚧的作用。用保幼激素处理豆科植物,能使正在产卵中的瓢蚧成虫所产的卵不能孵化,末龄幼虫取食激素处理过的植物,得到幼虫-蛹-蛹-成虫中间型。田间小区试验得到 90%卵不孵化的效果。

W. F. Walker 等人^[70]还试验了 20, 25-去氧蜕皮素与保幼激素相配合使用,对墨西哥瓢蚧的毒杀作用。蜕皮激素类似物主要引起四龄幼虫致死性非正常蜕皮,对正在产卵中的成虫造成不育。保幼激素对蜕皮激素类似物的活性起到增强作用。

Nilles 等^[33] 合成了 20 余种保幼激素类似物,并以麦负泥虫(一种蚜虫)为对象,研究了这些类似物对于这种蚜虫成虫滞育的影响。试验结果表明,有些保幼激素类似物能阻止即将滞育的蚜虫进入滞育,中止已经滞育的蚜虫的滞育。所试样品中以 JH-III(烟草天蛾保幼激素)效果最高。有些类似物能引起这些蚜虫致死,但所用剂量较高,没有实用价值。

7. 玉米螟虫^[71]

Lewis 等试验了 9 种保幼激素类似物对玉米螟虫的毒杀作用。将激素施用于人工饲料,末龄幼虫后期较为敏感。颗粒剂施于玉米植株对第一代玉米螟没有明显的保幼激素活性。

8. 烟青虫

Benskin 等^[72]研究了保幼激素 JH-Ⅱ(十七碳天蛾保幼激素)对于烟青虫幼虫及卵的作用,发现蜕皮后第二天的末龄幼虫最敏感,产生异常变态,导致死亡。同一个剂量分次给药(三天内)比一次给药效果高,有的高 10 倍以上,温度对活性也有影响,27℃时的活性比 17℃ 时高 9 倍。保幼激素对卵有抑制孵化的作用。卵的前期比后期敏感(卵产下后 12 小时内最敏感)。

Gurrera 等^[73]研究了 16 种保幼激素对烟青虫幼虫、蛹、成虫的作用。成虫接触到药后能产卵,但不能孵化。喷到棉株上幼虫吃下后,幼虫长成成虫后,此成虫产下的卵也不能孵化。

(七) 保幼激素的生物测定方法

昆虫保幼激素作为杀虫剂的一个基本概念,就是选择昆虫在正常情况下不存在激素或者只存在少量激素的发育阶段中使用过量激素,以便抑制昆虫的变态,如使半变态的昆虫为半若虫-半成虫的中间体,全变态的昆虫为半蛹-半成虫的中间体,甚至造成昆虫各阶段的死亡。基于这个概念,在对昆虫保幼激素类似物进行生物活性测定和比较时,多数情况下,常用实验室内饲养的昆虫和在室内作试验。因为室内饲养的试验昆虫,由于它们的饲养条件(温湿度、食物、水分等)比较一致,因而生理状态(生长发育、年龄、体重、生活力等)也相近,那么它的活性测定结果也会准确,差异也小。另外,在实验室内测定可以减少由于不同环境条件和试验机体的降解率不同所造成的量的差异。一般不是计算这些保幼激素类似物对昆虫的直接杀死,而是考虑更复杂的现象。测定对象和测定条件的标准是不太可能完全一致的,但是操作技术和统计处理还是可以一致的,这样,实验室间的结果可以进行比较^[1]。

一般常用的试验对象有:

黄粉蚧	<i>Tenebrio molitor</i> L.
蚊虫	(主要为埃及伊蚊 <i>Aedes aegypti</i> , 尖音库蚊 <i>Culex pipiens</i> L.,其他种类也可以用)
德国蜚蠊	<i>Blattella germanica</i>
杂拟谷盗	<i>Tribolium confusum</i> Jacaquin
吸血蝽象	<i>Phodnius prolixus</i>
体虱	<i>Pediculus</i> [<i>humanus</i> var.] <i>corporis</i> DeGeer

一般常用的昆虫保幼激素生物活性的测定方法:

1. 点滴法

这是个较实际的方法,它不仅操作容易控制,而且能准确地计算出每个或每克昆虫体所受的药量。昆虫保幼激素的稀释溶剂一般用丙酮或甲醇等。黄粉蚧的点滴测定法,不论在昆虫保幼激素对正常昆虫的发育和变态的影响以及它作为杀虫剂的发展和评价方面,都是目前国际上最广泛地用作活性测定和比较的标准方法。

我们曾在实验室内进行了昆虫保幼激素对黄粉蚧的点滴测定。具体方法如下:

每种昆虫保幼激素的每个剂量用十个 2—8 小时内或 24 小时内的黄粉蚜蛹进行活性测定。用微量注射器点滴 1 微升保幼激素的丙酮溶液于蛹的腹部腹面。对照组用丙酮处理。在温度 $26 \pm 1^{\circ}\text{C}$, 相对湿度 60—70% 下培养 7—8 天。非正常发育的标志为: 保留着蛹腹部的胫 (gin-traps)、尾突成半蛹-半成虫中间体, 甚至于蛹的死亡。试验结果, 可以计算出保幼激素阻止 50% 黄粉蚜蛹非正常发育的剂量 (ED_{50}), 或者将非正常发育的程度分为五级: 0, 正常成虫, 无保幼激素活性。1, 保留胫或尾突。2, 保留胫和尾突。3, 保留胫和尾突, 并在处理部位周围有蛹皮。4, 保留蛹的全部特征。可以记录各组变态级别的范围或者计算各组变态级别的平均数, 以区别各保幼激素的生物效应^[24,75]

2. 浸液法

对于水生昆虫幼虫, 常用埃及伊蚊及淡色库蚊等蚊种。我们根据世界卫生组织 1960^[76] 年公布推广的蚊虫测定方法结合前人用昆虫保幼激素对蚊虫测定的方法确定如下:

使用 20 条四龄的蚊幼虫, 放入盛有 25 毫升蒸馏水的小烧杯内。另在盛有 225 毫升水的磁碗内, 分别滴入 1 毫升不同浓度的昆虫保幼激素的丙酮溶液, 搅拌均匀后, 将杯中的幼虫及 25 毫升水一起倒入碗内, 使成 10 ppm, 1 ppm, 0.1 ppm, 0.01 ppm 和 0.001 ppm 浓度。每个浓度至少重复 3 次, 对照组只加入 1 毫升丙酮代替药液, 其他处理相同。一般蚊幼虫在药液内浸泡半小时, 或者处理的蚊幼虫可根据试验的需要确定浸泡时间, 浸泡后将蚊幼虫移入装有清水的烧杯内饲养, 2 小时后加入饲料, 以后每日加一次。每天移出死的幼虫和蛹并作记录。待有活蛹出现时, 将烧杯上放一纱罩, 以便观察和记录蛹的羽化和非正常变态数。在对照组的非正常发育数超过 20% 时, 试验全部作废, 非正常发育率经校正后计算其 LG_{50} ^[77,78]。

3. 药粉法

一般用于杂拟谷盗的测定。在 100 克面粉内加入从 0.01 到 1,000 ppm 的药量, 放入杂拟谷盗成虫 100 头, 没有处理的面粉喂对照昆虫, 观察 120 天看其繁殖和生存情况^[23]。

4. 喷雾法

这个方法接近于实际使用的情况。一般均用昆虫保幼激素的水溶液喷洒。Gerardus(1973)^[74] 认为对昆虫保幼激素喷雾的实用剂型以 1% 吐温 20 和 1% 丙酮为适宜。但在家蚕增丝试验的喷洒使用上, 不宜使用丙酮溶液, 因为它对蚕有不利的影 响, 同时可使喂养家蚕的桑叶腐烂, 可用吐温 20 或 80 把保幼激素溶于水中使用。

5. 注射法

这是一个真正测定外加的保幼激素活性的方法, 它消除了药剂的穿透因素, 但不 够实际。此法一般都用体形较大的昆虫为试验对象, 如黄粉蚜、蜉蝣等。一般地是在 昆虫腹部表皮下面, 用微量注射器注射入一定药量, 在 0.001 毫升至 0.1 毫升之间, 大都用植物油为溶剂^[79]。

6. 蛹蜡法

此法有较高的灵敏度,但操作不容易和不适合大量的保幼激素测定。一般是将保幼激素溶于矿物油内,配成不同浓度,每浓度用5—10头蜡螟嫩蛹。首先在蛹身上去掉一小块蛹的表皮,伤口处用配好的保幼激素溶液与石蜡构成混合物封住伤口以进行观察效果。如果有活性效应,则羽化的成虫在伤口部位就会局部再生出一块蛹的补丁,并且不同于成虫的表皮。根据结果,计算引起50%反应的活性浓度或者抑制剂量(ID₅₀)^[80,81,82]。

最近又报道了几种超微量的保幼激素活性测定方法。Wigglesworth(1973)^[83]介绍了将JH药液点滴在5龄的蜡象(Rhodnius)幼虫腹部,天然JH可测到15毫微克(ng),合成的JH可测到45毫微克。Truman(1973)^[84]将烟草天蛾颈部结扎后,点滴JH于腹部背面,观察表皮变色情况。此法的灵敏度在0.01毫微克,并且两天即可得出结果。Kunkel^[85]利用JH对德国蜉蝣促性腺的反应,介绍了一种快速、简易而定量的生物测定方法。测定实验可以在两天内完成。方法是将德国蜉蝣用CO₂麻醉,结扎颈部后,在腹部节间膜处注射入2—8微升的JH溶液,测量卵原细胞的长度和面积。

(八) 保幼激素对高等动物的毒性

保幼激素及其类似物对高等动物毒性极低,这是它们最显著的优点。毒性数据可参阅表4。

表 4 保幼激素对高等动物的毒性

保幼激素名称	口服毒性 LD ₅₀ (毫克/公斤)		经皮毒性 LD ₅₀ (毫克/公斤)	鱼 毒 TL ₅₀ (ppm)
	小 白 鼠	大 白 鼠	(动 物)	
JH- I (人工合成)	>4,000	> 4,000	>4,000 (小白鼠)	
RO-20-3600	3,900	> 4,000	>4,000 (小白鼠)	
R-20458 (734- II)	>3,690	> 4,640		>10
ZR-515		>50,000	>2,000 (兔)	>80
ZR-512		>34,600	4,500 (兔)	>100
ZR-619		>10,000		
ZR-777		> 2,330	9,000 (兔)	

(九) 保幼激素分析方法

保幼激素 R-20458(734- II)可用薄层^[86,87]、气相色谱^[87,88]法分析。ZR-515在水中的稳定可用生物测定法及气相色谱法分析^[89]。ZR-515乳状液在水中的半衰期为2小时;R-20458(734- II)在水中在日光照射下4小时后余下81%^[90]。还报道有关蚕蛾保幼激素的定量测定^[91]方法。

(十) 害虫对保幼激素的抗性^[92-95]

关于害虫能否对保幼激素类似物产生抗性问题曾经有过争论。最初有人提出昆虫不会对自己的激素产生抗性,但最近的研究表明,某些害虫不但能对保幼激素类似物有天然抗性,而且某些昆虫品系对杀虫剂有了抗性,对保幼激素类似物也有交互抗性。可能是因为抗性品系含有较高活性的氧化酶,而加速保幼激素类似物在昆虫体内的降解。估计将来应用保幼激素类似物也会有抗性问题。抗性品系家蝇对 ZR-515 有 5—30 倍抗性^[95]。

四、昆虫蜕皮激素

昆虫的一生要经过多次蜕皮和变态。这些蜕皮和变态的发生是由蜕皮激素和保幼激素协调控制的。

(一) 蜕皮激素的来源和种类

1. 昆虫蜕皮激素

第一个昆虫蜕皮激素蜕皮素(α -ecdysone)是 Butenand 和 Karlson 等于 1954 年从家蚕(*Bombyx mori*)蛹中分离出来的^[96]。1965 年用非重元素 X-射线分析法确定了化学结构^[97]。迄今,已从家蚕、烟草天蛾、摩洛哥蝗虫(*Doclostaurus maroccanus*)等昆虫中分离出四种昆虫蜕皮激素,即蜕皮素,蜕皮甾酮(β -ecdysone), 26-羟基蜕皮素(20, 26-hydroxyecdysone)和(20, 26-二羟基蜕皮素(20, 26-dihydroxyecdysone)(图 3)。

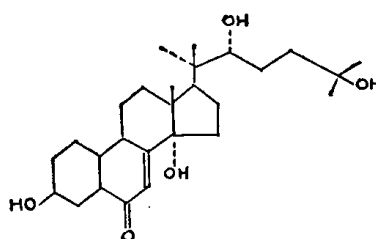
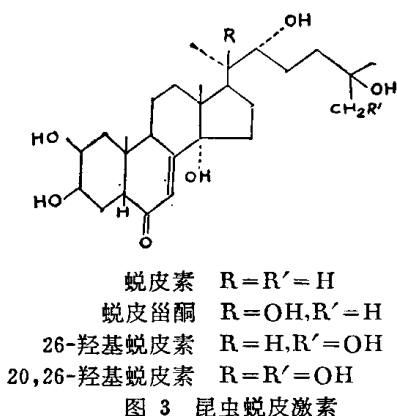


图 4 去氧蜕皮甾酮

2. 甲壳类蜕皮激素

从甲壳类动物中已分离出四种蜕皮激素:从海水螯虾(*Jasus lalandei*)中获得蜕皮甾酮(crystecdysone 即 β -ecdysone)和去氧蜕皮甾酮(deoxycrystecdysone)(图 4),从蟹(*Callinectes sapidus*)中分离出蟹蜕皮素(callinecdysone A 和 B)(即植物蜕皮激素 inokosterone 和 makisterone A)。