



国家科学技术学术著作出版基金资助

# 杀虫剂作用的分子行为

MOLECULAR BEHAVIOR OF INSECTICIDE ACTION

唐振华 毕强编著

上海遠東出版社

## 杀虫剂作用的分子行为

---

编 著/唐振华 毕 强

特约编审/张一宾

特约编辑/王国琴

责任编辑/马 赛

装帧设计/张晶灵

版式设计/李如琬

责任制作/晏恒全

责任校对/周国信

出 版/上海远东出版社

(200336) 中国上海市仙霞路 357 号

<http://www.ydbook.com>

发 行/上海发行所

上海远东出版社

制 版/南京理工排版校对有限公司

印 刷/上海长阳印刷厂

装 订/上海长阳印刷厂

版 次/2003 年 9 月第 1 版

印 次/2003 年 9 月第 1 次印刷

开 本/850×1168 1/16

字 数/1205 千字

印 张/43.75

印 数/1—1500

---

ISBN 7- 80661- 851-1

T · 69 定价:198.00 元

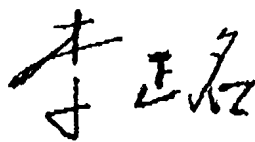
## 序 一

唐振华教授是我国昆虫毒理学的著名学者。长期以来从事杀虫剂的机理研究,成绩斐然。他的近作《杀虫剂作用的分子行为》一书,是一本高水平的学术专著,值得向各位读者推荐。

农药学科,作为一门交叉学科,不断地汲取了化学、生物学、农学、医学、环境保护学、化学工程、计算机技术等精华,面对种种困难和挑战,自强不息,茁壮成长,已成为一门自成体系的农药科学。解放后我国由于农业现代化,保障社会进步及国家安全的需要,我国农药生产有了巨大的发展,已成为世界农药生产大国。入世以后,形势迫使我们创制具有自主知识产权的对环境友好的绿色农药以升级换代。遗憾的是目前我国生产杀虫剂中不少是高毒品种。其原因是与创制投入力度大小有关,基础理论的匮乏,高新技术介入不够,形成我国成为世界农药强国的“瓶颈”,急待有关领导部门协助解决。

本书作者汲取了国外先进技术,对多年的研究体会总结成文,填补了我国在杀虫剂创制基础理论工作的一个空白,将对提高我国农药科技水平起很好的促进作用。我深信此书的出版将推动我国其他农药专家著书之源,为丰富新世纪的农药科学和生命科学继续做出应有的贡献。

中国工程院院士  
南开大学教授  
天津市科协主席



2002. 11.

## 序 二

《杀虫剂作用的分子行为》一书是唐振华教授等专家学者花了近两年的时间终于完成并得以出版。在这本书中灌注了唐振华教授多少心血。

当前,随着我国加入 WTO,创制具有自主知识产权的新农药已十分迫切。人们普遍认识到,要提高创制效率、合理设计新农药,做到“有的放矢”,就必须对有害生物靶标及药剂作用机理有较全面的理解。这样,才能从分子生物学的水平进行合理设计。此外,有不少化学或生物学方面的学者,分别从化学和生物学的角度,对农药的结构与活性进行了阐述,但缺乏两个领域贯通的专著。

唐振华教授毕生从事杀虫剂毒理学的研究,其从生物分子学角度并结合化学结构,对杀虫剂作用机理进行了颇为完全的阐述。该书全面地、深入浅出地对杀虫剂作用的分子行为进行了论述,并从分子、基因、细胞和个体水平阐述了杀虫剂的作用方式与结构特性。该书的出版无疑是对我国农药创制的一大贡献。它将有利于化学工作者更好地了解生物,也能使生物学工作者从化学结构上对农药予以进一步的理解。

在本书中,唐教授收集了国内外最新资料信息,结合他几十年的工作经验,进行了认真的归纳、总结。其不仅为我们提供了大量的知识和信息,同时也使我们感悟到唐教授的严谨学风和很高的学术造诣。《杀虫剂作用的分子行为》无疑是一本具有很高学术水平的参考书、教科书。

中国工程院院士  
浙江工业大学校长  
上海市农药研究所名誉所长

沈寅初

2002. 11.

# 前言

根据现代杀虫剂研究开发的趋势和社会的要求,21 世纪的杀虫剂必须具有高活性、低用量、安全性高、环境相容性好和市场潜力大等特点,只有这些杀虫剂才能在国际市场上具有竞争力。加入 WTO 后,我国农药行业正面临国际知识产权和环境保护等方面的挑战。为了迎接新世纪的挑战,尽快实行我国农药研究开发的战略转移,加速农药的创制工作,我国在 1995 年组建了国家南、北两个农药创制中心。自那年起,我有幸被聘为国家农药南方创制中心上海基地的顾问、学术委员会委员和兼职研究员,使我有更多的机会向农药界的前辈和同仁学习。我国新农药创制工作起点晚,基础薄弱,人才分散,从事农药创制的人员多以化学、化工为主,从事生物筛选的人员仍处于传统的生物测定水平。正如李正名院士所说:“新农药创制作为生命科学的一个重要组成部分,正成为综合性极强的高新技术系统集成”。

自 Jerassi 等人在 1974 年提出了生物合理设计(biorational design)以后,使农药的创制从单纯的随机合成和类同合成的传统途径,进入到通过合理设计进行高起点、高水平研究的快速通道。尤其是生物合理设计,正如英国的 Tadd 爵士所说:“只有了解生命过程中所涉及的酶系及其在不同生物体内易受攻击的部位,才能开发合理的专效性农药”。由此可见,生物合理设计是在以分子水平阐明的靶标酶、生物膜等作用部位的基础上寻找“合乎其理”的理想化合物。而我国在这方面的研究基础很薄弱,况且在国内有关农药的著作虽然出版了不少,但多是以合成、应用和产品介绍为主,有关杀虫剂毒理学的专著主要有由张宗炳先生等将 Wilkinson (1976)主编的《*Insecticide Biochemistry and Physiology*》(《杀虫剂的生物化学和生理学》)译成了中文,并于 1985 年由科学出版社出版。该书确是一本好书,充分反映了当时有关杀虫剂生理生化的研究成果,但限于当时条件,对靶标作用的分子机理阐述较少。在此书的基础上,张宗炳先生又撰写并出版了我国第一本《杀虫药剂的分子毒理学》。在他去世后,反映该领域研究进展的资料几乎处于“真空”期,于是由冷欣夫、唐振华、王荫长主编了“杀虫剂分子毒理学及昆虫抗药性”,并于 1996 年由中国农业出版社出版。近年来,由于分子生物学和基因工程的研究取得了突飞猛进的发展,促进了杀虫剂分子毒理学的发展,已从分子、基因水平阐述杀虫剂的作用机理。而今国内外尚无此类专著,更无将杀虫剂分子毒理学和农药创制相结合的专著。为了集中撰写杀虫剂的表皮穿透、代谢和靶标部位的作用的分子行为,并探讨其与新农药(杀虫剂)的关系,故将此书定名为《杀虫剂作用的分子行为》,且获得了国家科学技术学术著作出版基金的资助。

《杀虫剂作用的分子行为》(*Molecular Behavior of Insecticide Action*)是从分子、基因、细胞和个体水平阐明杀虫剂生物动态相(biodynamic phase)和生物动力相(biokinetic phase)的作用方式和作用机理,而细胞和个体对杀虫剂的反应仅是杀虫剂的微观作用在宏观的表现。此书的出版希望能有助于拓展杀虫剂创制的思路,同时能在从事杀虫剂化学合成和生物筛选

的研究人员之间起一个沟通的桥梁作用,为我国杀虫剂创制,特别是生物合理设计提供理论依据,并谨以此书献给国家南方农药创制中心。

本书共分六篇 25 章。第一篇为基础篇(第 1~4 章),主要涉及杀虫剂的发展简史及其作用,杀虫剂毒力、毒性的测定和评价,杀虫剂在昆虫体内的动态变化和药理动力学,以及从基因到蛋白质的基础分子生物学。第二篇为代谢篇(第 5~9 章),主要内容有杀虫剂代谢概论,各类杀虫剂的代谢,P450 单加氧酶,酯酶和谷胱甘肽 S-转移酶及其在杀虫剂代谢中的作用。第三篇为靶标篇(第 10~17 章),分别是神经膜的分子结构与功能,受体与 G 蛋白,乙酰胆碱酯酶的结构与功能,电压门控离子通——钠、钾、钙离子通道,配体门控离子通道—— $\gamma$ -氨基丁酸和谷氨酸氯离子通道,乙酰胆碱受体的结构与功能,章鱼胺受体作为杀虫剂靶标的分子基础和作用于昆虫呼吸链的杀虫剂及其作用机理。第四篇为昆虫生长调节剂篇(第 18~20 章),含作用于昆虫蜕皮激素和保幼激素受体的杀虫剂及其作用机理,几丁质合成抑制剂及其作用机理和昆虫几丁质酶及其作用机理。第五篇为杀虫农用抗生素篇(第 21~22 章),主要为阿维菌素类和多杀菌素类杀虫剂及其作用机理。第六篇为抗性篇(第 23~25 章),有昆虫抗药性概论,代谢抗性和靶标抗性的分子生物学。在每一章后面都有参考文献,以便进一步查阅。

原来本书由笔者、郭庆铭和毕强共同撰写,后来由于郭庆铭教授任上海高伦现代农化股份有限公司董事长,工作繁忙,实在无时间撰写杀虫剂代谢的有关章节,这部分只能由毕强和笔者来完成。不过郭庆铭教授无论在任上海市农药研究所所长还是在任董事长期间,始终支持和关怀本书的撰写和出版。另外,本书的出版与上海市农药研究所现任所长姚再男先生的支持是分不开的,对此深表感谢!此外,陈万义、钱旭红、金桂玉等教授也极力推荐和建议,促进了本人的写作,在此表示感谢!

在撰写过程中曾得到中国工程院院士李正名教授和沈寅初教授的热情鼓励和支持,并在百忙之中为拙作作序。此书自筹划到出版,自始至终得到了国家科技部高新司张新民先生和国家南方农药创制中心领导小组办公室王龙根先生的支持和帮助。张一宾高级工程师为本书的特邀编审,并给予了真诚的帮助。在此亦表感谢!

在此还要感谢我所庄佩君高级工程师和上海生农生化制品有限公司的张振国总经理、周宝玲主任为我和毕强处理日常事务,让我们腾出时间、集中精力撰写本书。感谢日本名古屋大学 T. Miyata 教授和美国堪萨斯大学的朱坤炎副教授提供了非常有价值的珍贵资料,上海市农药研究所袁莉萍、吴霞等也给予了很多帮助,我所的袁建忠和上海生农生化制品有限公司的杭岩打印了文稿和扫描插图。此外,还得到了不少朋友和同仁的帮忙,限于篇幅,不再一一列名,在此一并感谢!

本书的出版如能实现我们的初衷,对我国杀虫剂创制工作有所裨益,将感欣慰。鉴于我们的水平有限,错误和缺点在所难免,恳请大家给予批评指正,不胜感谢!

唐振华

2002 年 11 月于中国科学院上海昆虫研究所

**图书在版编目(CIP)数据**

杀虫剂作用的分子行为/唐振华,毕强编著. —上海:  
上海远东出版社,2003  
ISBN 7-80661-851-1

I. 杀... II. ①唐... ②毕... III. 杀虫剂-分子作  
用-研究 IV. TQ453

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2003)第 072484 号

谨以此书献给  
**国家南方农药创制中心**

## 内容简介

本书从个体、细胞、分子和基因水平诸方面全面、系统、深入地阐述了杀虫剂从昆虫表皮穿透、体内代谢到靶标部位以及如何产生抗性的分子行为。为了便于未涉及过分子生物学的读者的阅读,本书增加了从基因到蛋白质的基础分子生物学内容。

全书共分六篇25章。第一篇为基础篇(第1~4章),主要涉及杀虫剂发展简史及其作用,杀虫剂毒力、毒性的测定和评价,杀虫剂在昆虫体内的动态变化和药理动力学,以及从基因到蛋白质的基础分子生物学;第二篇为代谢篇(第5~9章),主要内容为杀虫剂代谢概论,各类杀虫剂的代谢,P450单加氧酶,酯酶和谷胱甘肽S-转移酶及其在杀虫剂中的作用;第三篇为靶标篇(第10~17章),包括神经膜的分子结构与功能,受体与G蛋白,乙酰胆碱酯酶的结构与功能,电压门控离子通道——钠、钾、钙离子通道,配体门控—— $\gamma$ -氨基丁酸和谷氨酸氯离子通道,乙酰胆碱受体,章鱼胺受体和昆虫呼吸链系统;第四篇为昆虫生长调节剂篇(第18~20章),包括昆虫几丁质合成和几丁质酶的抑制剂,昆虫蜕皮激素和保幼激素类似物;第五篇为农用抗生素杀虫剂篇(第21~22章),主要为阿维菌素类和多杀菌素类杀虫剂及其作用机理;第六篇为抗性篇(第23~25章),包括昆虫抗药性概论、代谢抗性和靶标抗性的分子生物学。

本书不仅可作为从事农药创制人员的重要参考书,而且也可作为昆虫毒理学、农药学、植物保护学、生物学、生物化学、神经生理学、药理学等学科的本科生、研究生和教师的教学用书。

# 目 录

|    |   |
|----|---|
| 序一 |   |
| 序二 |   |
| 前言 | 1 |

## 第一篇:基础篇

|                      |     |
|----------------------|-----|
| 第1章 杀虫剂发展简史及其作用      | 3   |
| 1. 杀虫剂发展的简史          | /3  |
| 2. 杀虫剂发展的四个黄金时代      | /5  |
| 2.1 杀虫剂发现的黄金时代       | /5  |
| 2.2 健康与环境的黄金时代       | /17 |
| 2.3 抗性和新颖靶标的黄金时代     | /21 |
| 2.4 基因工程的黄金时代        | /27 |
| 3. 杀虫剂研究的复兴          | /28 |
| 参考文献                 | /29 |
| 第2章 杀虫剂毒力、毒性的测定和评价   | 30  |
| 1. 杀虫剂的毒力测定          | /30 |
| 1.1 农药生物测定意义         | /30 |
| 1.2 杀虫剂生物测定及其意义      | /30 |
| 1.3 毒力测定的原理          | /31 |
| 1.4 杀虫剂生物测定中应注意的几个问题 | /33 |
| 2. 杀虫剂毒力和毒性的评价       | /33 |
| 2.1 农药的毒性及其分类        | /33 |
| 2.2 杀虫剂的毒性及其分级       | /34 |
| 2.3 选择毒性             | /34 |
| 3. 杀虫剂选择性机制的概述       | /44 |
| 3.1 生态选择性机制          | /44 |
| 3.2 杀虫剂的生理生化选择性机制    | /44 |
| 4. 生物测定与农药(杀虫剂)筛选    | /49 |
| 5. 杀虫剂混用的毒力测定及其评估    | /51 |
| 参考文献                 | /54 |

**第3章 杀虫剂在昆虫体内的动态变化和药理动力学 ..... 55**

1. 引言 /55
2. 昆虫表皮的结构与功能 /56
  - 2.1 昆虫的表皮结构 /56
  - 2.2 皮细胞层 /56
  - 2.3 原表皮 /56
3. 杀虫剂进入昆虫体内的途径 /57
4. 昆虫的表皮与杀虫剂的穿透 /58
  - 4.1 杀虫剂在表皮穿透过程中的“损失” /58
  - 4.2 质膜的结构与功能 /59
5. 表皮穿透的动力学 /59
6. 影响穿透作用的因子 /60
  - 6.1 杀虫剂的脂溶性 /60
  - 6.2 杀虫剂的解离作用 /61
  - 6.3 杀虫剂的分配系数 /61
  - 6.4 杀虫剂与昆虫表皮及组分的亲和性 /62
  - 6.5 载体和溶剂的影响 /62
7. 杀虫剂的侵入、活化和降解之间的相互关系 /63
- 参考文献 /64

**第4章 从基因到蛋白质的基础分子生物学 ..... 65**

1. 引言 /65
2. 基因 /65
  - 2.1 核酸编码分子信息 /65
  - 2.2 基因的分类 /67
  - 2.3 基因调控元件 /68
  - 2.4 “废物”DNA /69
  - 2.5 突变 /70
3. 遗传信息的传递途径 /72
4. 与杀虫剂毒理学相关的分子生物学方法 /72
  - 4.1 聚合酶链反应 /72
  - 4.2 印迹技术 /75
  - 4.3 DNA 重组技术 /76
  - 4.4 杂交瘤技术 /78
5. 蛋白质的结构层次 /78
  - 5.1 一级结构 /79
  - 5.2 二级结构 /79
  - 5.3 超二级结构和结构模体 /79
  - 5.4 域结构或结构域 /79

- 5.5 三级结构 /80
- 5.6 四级结构 /80
- 参考文献 /80

## 第二篇:代谢篇

### 第5章 杀虫剂代谢概论 ..... 83

- 1. 引言 /83
- 2. 初级代谢 /84
  - 2.1 氧化作用 /84
  - 2.2 还原作用 /86
  - 2.3 水解作用 /87
  - 2.4 谷胱甘肽介导的代谢 /89
  - 2.5 其他转移酶 /95
- 3. 次级代谢:耦合作用 /97
  - 3.1 葡萄糖苷或葡萄糖醛酸的耦合作用 /98
  - 3.2 硫酸盐耦合作用或硫酸酚酯的合成 /99
  - 3.3 甘氨酸耦合作用或马尿酸合成 /100
  - 3.4 半胱氨酸耦合作用或巯基尿酸合成 /102
  - 3.5 组氨酸和谷氨酸耦合作用 /103
  - 3.6 葡萄糖苷的形成 /103
  - 3.7 氰化物-硫氰酸盐的解毒作用 /103
  - 3.8 甲基化作用 /104
  - 3.9 乙酰化作用与辅酶 A(CoA)的耦联 /104
  - 3.10 谷胱甘肽耦合作用或硫醚氨酸的形成 /105
  - 3.11 磷酸的耦合作用 /106
  - 3.12 其他的耦合作用 /106
- 参考文献 /106

### 第6章 各类杀虫剂的代谢 ..... 107

- 1. 引言 /107
- 2. 氯化烃类杀虫剂的代谢 /107
  - 2.1 氯化烃类杀虫剂的代谢反应 /107
  - 2.2 氯化烃杀虫剂的代谢 /110
- 3. 有机磷类杀虫剂的代谢 /117
  - 3.1 对有机磷酸酯类化合物的代谢反应 /117
  - 3.2 一些有机磷杀虫剂的代谢 /119
- 4. 氨基甲酸酯类杀虫剂的代谢 /127
  - 4.1 概述 /127

## 目 录

- 4.2 氨基甲酸酯类杀虫剂的代谢 /128
- 5. 除虫菊酯类杀虫剂的代谢 /134
  - 5.1 除虫菊素和丙烯菊酯的代谢 /134
  - 5.2 合成拟除虫菊酯的代谢 /136
- 6. 其他杀虫剂的代谢 /139
  - 6.1 鱼藤酮的代谢 /139
  - 6.2 烟碱的代谢 /140
  - 6.3 除虫脲的代谢 /140
  - 6.4 保幼激素的代谢 /141
- 参考文献 /142

## 第7章 P450 单加氧酶系及其在杀虫剂代谢中的作用 ..... 144

- 1. 引言 /144
- 2. 微粒体 P450 单加氧酶系的组成 /145
  - 2.1 细胞色素 P450 /145
  - 2.2 NADPH-P450 还原酶 /146
  - 2.3 细胞色素  $b_5$  /146
  - 2.4 NADPH-细胞色素  $b_5$  还原酶 /146
  - 2.5 磷脂 /146
- 3. P450 单加氧酶的分类 /147
  - 3.1 三蛋白系统 /147
  - 3.2 二蛋白系统 /147
  - 3.3 单蛋白系统 /147
- 4. P450 催化循环 /147
- 5. P450s 催化的反应类型 /151
- 6. P450 的分子生物学 /154
  - 6.1 P450 基因的命名 /155
  - 6.2 P450 的晶体结构及其相应的基因序列 /155
  - 6.3 P450 的调控、诱导和抑制 /157
- 7. 昆虫 P450 的分子生物学特性 /161
  - 7.1 概述 /161
  - 7.2 昆虫 P450 基因的主要功能 /165
  - 7.3 昆虫 P450 的调控与诱导作用 /170
- 参考文献 /178

## 第8章 酯酶及其在杀虫剂代谢中的作用 ..... 182

- 1. 引言 /182
- 2. 酯酶及其特性 /182

- 2.1 酯酶催化的化学反应 /182
- 2.2 关于酯酶的分类 /183
- 2.3 酯酶的特性 /185
- 3. 与杀虫剂代谢相关的酯酶 /188
  - 3.1 磷酸酯酶 /188
  - 3.2 羧酸酯酶 /189
  - 3.3 羧基酰胺酶 /191
  - 3.4 氨基甲酸酯水解酶 /192
- 4. 昆虫中的酯酶 /193
- 5. 酯酶的分子生物学 /194
  - 5.1  $\alpha/\beta$  水解酶超家族 /194
  - 5.2 羧酸酯酶/胆碱酯酶多基因家族 /196
  - 5.3 保幼激素酯酶 /197
- 参考文献 /199

## 第9章 谷胱甘肽 S-转移酶及其在杀虫剂代谢中的作用 ..... 200

- 1. 引言 /200
- 2. 具有重要生物学意义的亲电性底物 /200
- 3. 谷胱甘肽 S-转移酶的分类、结构与功能 /202
  - 3.1 谷胱甘肽 S-转移酶的分类 /202
  - 3.2 谷胱甘肽 S-转移酶的基因结构 /202
  - 3.3 谷胱甘肽 S-转移酶的结构与功能 /204
  - 3.4 晶体结构中的不变残基及其功能 /213
- 4. 昆虫中谷胱甘肽 S-转移酶的特性 /219
  - 4.1 谷胱甘肽 S-转移酶的 GST 的多样性 /219
  - 4.2 谷胱甘肽 S-转移酶的诱导性 /222
  - 4.3 宿主植物和他感化合物对谷胱甘肽 S-转移酶的诱导作用 /224
  - 4.4 谷胱甘肽 S-转移酶在昆虫体内的分布及其与生长发育的关系 /224
- 5. 昆虫中的谷胱甘肽 S-转移酶基因及其调控 /225
  - 5.1 双翅目昆虫中的谷胱甘肽 S-转移酶基因 /225
  - 5.2 鳞翅目昆虫中的谷胱甘肽 S-转移酶基因 /235
  - 5.3 蜉、螨类中的谷胱甘肽 S-转移酶基因 /236
  - 5.4 昆虫和蜉、螨类中的谷胱甘肽 S-转移酶基因的进化 /236
- 参考文献 /238

## 第三篇:靶标篇

## 第10章 神经膜的分子结构与功能 ..... 243

- 1. 引言 /243

- 2. 神经元 /244
- 3. 神经膜的结构与功能 /245
  - 3.1 膜的脂质结构 /245
  - 3.2 膜蛋白的结构 /246
  - 3.3 膜的传运 /247
  - 3.4 膜的动力学 /252
- 4. 神经细胞的电兴奋性 /255
  - 4.1 兴奋性细胞的电现象 /255
  - 4.2 离子学说和离子电性的作用 /256
  - 4.3 动作电位及其传导 /258
  - 4.4 离子通道 /262
  - 4.5 突触传递 /263
- 参考文献 /269

## 第 11 章 受体与 G 蛋白 ..... 271

- 1. 引言 /271
- 2. 受体的结构与功能 /271
  - 2.1 受体的结构 /271
  - 2.2 受体的主要特性 /272
  - 2.3 受体的分类 /272
  - 2.4 信号转导分子能激活基因转录 /277
  - 2.5 药剂-受体的互相作用 /279
- 3. G 蛋白的结构与功能 /281
  - 3.1 G 蛋白的构成及其分类 /282
  - 3.2 G 蛋白的功能 /282
  - 3.3 小 G 蛋白及其功能 /287
- 4. 离子通道和 G 蛋白耦联受体作为杀虫剂的靶标 /288
- 参考文献 /289

## 第 12 章 乙酰胆碱酯酶的结构与功能 ..... 290

- 1. 引言 /290
- 2. 乙酰胆碱酯酶的生理功能 /291
  - 2.1 乙酰胆碱酯酶与丁酰胆碱酯酶 /291
  - 2.2 乙酰胆碱酯酶的生理功能 /291
- 3. 乙酰胆碱酯酶的结构与功能 /292
  - 3.1 乙酰胆碱酯酶的活性部位 /292
  - 3.2 乙酰胆碱酯酶基因结构及乙酰胆碱酯酶的分子型 /293
  - 3.3 乙酰胆碱酯酶的晶体结构及功能位点 /302

4. 乙酰胆碱酯酶的动力学及其重要参数 /313
  - 4.1 有机磷和氨基甲酸酯对乙酰胆碱酯酶的抑制作用 /314
  - 4.2 乙酰胆碱酯酶的动力学及一些重要参数 /315
5. 乙酰胆碱酯酶-抑制剂复合体的晶体结构 /317
  - 5.1 乙酰胆碱酯酶的抑制位点 /317
  - 5.2 有机磷-乙酰胆碱酯酶复合体的晶体结构 /318
  - 5.3 氨基甲酸酯-乙酰胆碱酯酶复合体的晶体结构 /319
  - 5.4 四价配体-乙酰胆碱酯酶复合体的晶体结构 /320
  - 5.5 多肽-乙酰胆碱酯酶复合体的晶体结构 /321
6. 有机磷的结构和对乙酰胆碱酯酶的抑制作用之间的关系 /322
  - 6.1 物理化学参数与  $pI_{50}$  的关系 /322
  - 6.2 含  $P=S$  的有机磷类与含  $P=O$  的有机磷类对乙酰胆碱酯酶的抑制作用 /323
  - 6.3 苯基磷酸酯的间位引入取代基后对乙酰胆碱酯酶的抑制作用 /323
  - 6.4 有机磷类的手性对乙酰胆碱酯酶抑制作用的影响 /323
- 参考文献 /324

### 第13章 电压门控离子通道——钠、钾、钙离子通道 ..... 327

1. 电压门控离子通道的特性 /327
2. 钠离子通道的结构与功能 /328
  - 2.1 钠离子通道的模式结构 /328
  - 2.2 作用于钠离子通道的神经毒素及其结合部位 /329
  - 2.3 钠离子通道的结构模型 /332
  - 2.4 钠离子通道的一级结构 /332
  - 2.5 脊椎动物和昆虫的钠离子通道的基因结构及其功能 /333
3. 钙离子通道的结构与功能 /338
4. 钾离子通道的结构与功能 /340
5. 电压门控离子通道的功能机理 /341
  - 5.1 离子转运和门控机理 /341
  - 5.2 S4 的螺旋滑动模型 /342
  - 5.3 钠、钙离子通道的失活机理 /342
6. 作用于电压门控离子通道的杀虫剂 /343
  - 6.1 作用于钠离子通道的杀虫剂 /343
  - 6.2 作用于钾和钙离子通道的杀虫剂 /348
7. 影响电压门控离子通道的神经毒性多肽 /348
  - 7.1 影响钠离子通道的昆虫选择性神经毒素 /348
  - 7.2 影响钙离子通道的昆虫选择性神经毒素 /349
8. 昆虫钠、钙离子通道的高通量测定 /349
- 参考文献 /350

## 第 14 章 配体门控离子通道—— $\gamma$ -氨基丁酸和谷氨酸门控氯离子通道 ..... 352

1. 配体门控离子通道 /352
2.  $\gamma$ -氨基丁酸受体氯离子通道 /352
  - 2.1 GABA 受体的分类及其生理学和药理学特性 /352
  - 2.2 GABA<sub>A</sub> 受体是许多药物的主要分子靶标 /353
  - 2.3 GABA<sub>A</sub> 受体的分子结构 /354
  - 2.4 昆虫 GABA 受体的结构与生理作用 /357
  - 2.5 果蝇 GABA 受体亚基的分子生物学 /357
3. 作用于 GABA 受体的杀虫剂及相关化合物 /361
  - 3.1 昆虫的非竞争性阻断剂部位和激活剂部位 /361
  - 3.2 多氯环烷类及相关化合物对 GABA 受体的作用 /363
  - 3.3 Picrodendrin 和 silphinene 天然产物 /364
  - 3.4 氟虫腈及其类似物 /365
  - 3.5 三噁二环辛烷类及其相关化合物 /366
  - 3.6 非竞争性 GABA 受体拮抗剂的选择性及其机理 /367
  - 3.7 阿维菌素类 /369
4. 谷氨酸门控氯离子通道 /369
  - 4.1 谷氨酸门控氯离子通道的生理学、药理学 /370
  - 4.2 谷氨酸受体的分子生物学 /371

参考文献 /371

## 第 15 章 乙酰胆碱受体的结构与功能 ..... 373

1. 引言 /373
2. 乙酰胆碱受体的分类 /373
  - 2.1 脊椎动物的烟碱型乙酰胆碱受体 /374
  - 2.2 昆虫烟碱型乙酰胆碱受体的结构与功能及其多样性 /381
  - 2.3 作用于烟碱型乙酰胆碱受体的杀虫剂 /394
  - 2.4 毒蕈碱型乙酰胆碱受体 /411
  - 2.5 展望 /419

参考文献 /420

## 第 16 章 章鱼胺受体作为杀虫剂靶标的分子基础 ..... 423

1. 引言 /423
2. 章鱼胺在昆虫中的作用 /423
3. 章鱼胺受体的分类及其药理学特性 /424
  - 3.1 章鱼胺受体的分类 /424
  - 3.2 章鱼胺受体 1 和 2 的激动剂和拮抗剂及其药理学特性 /424
  - 3.3 章鱼胺受体 3 的激动剂和拮抗剂及其药理学特性 /426