

生物药物素 AVERMECTINS 及其 在农业害虫防治中的应用

许再福

(浙江农业大学植保系, 杭州 310029)

Avermectins 是链霉菌 *Streptomyces avermitilis* 产生的, 具有杀线虫、螨类和昆虫活性的一类十六元大环内酯物质。由八种活性物质组成, 分别用 A1a、A2a、B1a、B2a、A1b、A2b、B1b 和 B2b 表示。其中, 组份 A1a、A2a、B1a 或 B2a 的含量 $\geq 80\%$, 组份 A1b、A2b、B1b 或 B2b 的含量 $\leq 20\%$ 。已证明, B 族的生物活性比 A 族的强^[1]。

Avermectin B1, 通称阿巴美丁 (abamectin) 或 MK936, 包括含量 $\geq 80\%$ 的 avermectin B1a 和含量 $\leq 20\%$ 的 avermectin B1b。22, 23-二

氢 avermectin B1, 通称伊维菌素 (ivermectin) 或 MK933, 包括含量 $\geq 80\%$ 的 22, 23-二氢 avermectin B1a 和含量 $\leq 20\%$ 的 22, 23-二氢 avermectin B1b。

1979年, 首次报道 avermectins 对害虫杂拟谷盗 *Tribolium confusum* Duv. 有强的杀虫活性。迄今, 至少发现有 8 目 25 科 75 种农业害虫对这种药物敏感。由于组份 B1a 对害虫和害螨的毒性要比组份 B2a、A1a 或 A2a 高得多 (黄

1993-12-27 收稿

瓜十一星叶甲 *Diabrotica undecimpunctata* 例外,它对组份 B2a 最敏感),所以,阿巴美丁被选用作害虫和害螨的防治剂^[1]。遗憾的是,随后的研究发现 avermectins 对农业中重要的害虫类群鳞翅目昆虫,尤其是夜蛾科昆虫的活性并不理想,不足以进行商业性开发,因而加速了进行化学结构的改造研究工作,并取得了可喜的进展,第二代 avermectins 杀虫剂 4"-表氨基-4"-脱氧 avermectin B1 的诞生就是 avermectins 化学结构改造的结果。1986年5月,阿巴美丁获准在美国环境保护局注册,1991年,在我国登记。目前,国外用于防治害虫的阿巴美丁商品有:AFFIMR, AVID, AGRIMEC, AGRI-MEK, VERTIMEC 和 ZEPHYR^[2],其中在我国登记的是“爱力螨克”(AGRIMEC)。我国已有阿巴美丁的同类商品生产,商品名为“爱福丁”和“虫克星”。

1 杀虫机理

它们的作用机理尚未清楚,致死作用可能与它干扰神经原突触或神经肌肉突触的 γ -氨基丁酸(GABA)的释放或结合有关,从而阻断信息传递^[2,3]。另外,它还可以抑制几丁质的转化和合成,从而干扰脱皮^[4]。阿巴美丁对乙酸胆碱介导的神经传导不起作用。

2 环境毒性

在通气有光条件下,阿巴美丁易降解,在水体表层的半衰期少于12h,在土壤表层的半衰期约为21h。但在土壤深层的阿巴美丁的半衰期可达20至56d,甚至可达267d。在土壤中,至少可以降解成13种产物,其中8a-羟基 avermectin B1a 和对应的开环醛基衍生物是主要的降解物。阿巴美丁的降解物几乎失去了它原有的化学特性,变得无毒^[5]。在土壤中,阿巴美丁的滤过性很差,主要分布于土壤表层,这样有利于它的氧化降解,从而大大地降低了它在环境中的存留和在生物体中的累积。在土壤中的阿巴美丁或其降解物,也只有很少量为植物根系所吸收^[6]。

在果园里,叶面喷施 3×10^{-6} 阿巴美丁至3h后,柠檬叶中的阿巴美丁浓度分别为0.92土

0.23×10^{-6} ; 橙皮和柠檬皮中的浓度分别为 0.066 ± 0.007 和 $0.038 \pm 0.006 \times 10^{-6}$ ^[7]。在菜园中,叶面施药后,叶片中的阿巴美丁要比叶柄中的高;但叶片中的阿巴美丁的降解要比叶柄中的快^[8]。

阿巴美丁对土壤中的固氮菌及其它细菌、酵母菌、原生物和蚯蚓等相对安全,但对真菌有一定的抑制作用^[2,4]。

阿巴美丁对人也是相对安全的。虽然人的中枢神经系统的神经传递也是以 GABA 介导的,但人的中枢神经系统为血脑屏障所保护, avermectins 如果没有被强制地穿透血脑屏障(如注射中枢神经系统),一般对人是没有太大的影响的^[3]。在阿巴美丁和伊维菌素的正常使用中,它对人是安全的;但人体肌肉注射将会导致脸色苍白,恶心,呕吐,肚痛,心速加快,血压过低,体温过低,风疹和眼睛刺痛等反应^[9]。1987年,伊维菌素(商品名:MECTIZAN,片剂)获准用于防治人体内的盘尾丝虫病。到1989年,在非洲国家已有七万余人服用这种片剂来防治盘尾丝虫病,效果很好。世界卫生组织(1989)专设一个委员会对这次大规模试用的安全性进行调查,得出的结论是:“这种药物对人相当安全,未见有已知的药理学副作用^[9]”。到1991年,非洲和拉丁美洲等洲的三十个国家至少有六十万感染盘尾丝虫病的病人接受了这种药物的治疗。这里需要指出的是,尽管阿巴美丁对人相对安全,但它在人体中的应用尚仅限于防治盘尾丝虫病。

在试验的剂量范围内,阿巴美丁对大多数有益动物安全,无三致作用。但是,蜜蜂对这种药物相当敏感,无论是摄食或接触都很容易中毒死亡。不过,施药24h后,由于光降解作用,对蜜蜂已无不良的影响^[2]。

未发现阿巴美丁对菊花、扶郎花和金鱼草等植物产生药害。

3 在农业害虫防治中的应用

应用阿巴美丁防治的农业害虫主要有:

三叶草斑潜蝇 *Liriomyza trifolii* (Burgess): 室内毒力测定结果表明,阿巴美丁

对幼虫的 LC_{50} 和 LC_{90} 分别为 0.377×10^{-6} 和 1.473×10^{-6} , 对雌成虫的 LD_{50} 和 LD_{90} 分别为 0.404×10^{-6} 和 1.56×10^{-6} 。阿巴美丁对幼虫和雌成虫有胃毒和触杀作用, 但对雄成虫似乎只有触杀效果^[10]。田间试验表明, 阿巴美丁每公顷有效成份用量 10—22g, 防治芹菜、胡荽、番茄、菊花、扶郎花和石头花等蔬菜和观赏植物上的三叶草斑潜蝇, 包括已对氯菊酯产生抗性的品系, 效果很好, 建议推广使用^[2,11]。同时, 阿巴美丁也能有效地控制拉美豌豆斑潜蝇 *Liriomyza huidobrensis* (Blanchard) 和美甜瓜斑潜蝇 *Liriomyza sativae* Blanchard 的为害。

小菜蛾 *Plutella maculipennis* (Curtis): 对阿巴美丁很敏感, 但因寄主植物品种的不同, 其敏感性有较大的差异^[12]。在白菜上, LC_{50} 为 0.011×10^{-6} ; 在卷心菜上, LC_{50} 为 2.79×10^{-6} 。未见已对灭幼脲、马拉硫磷、滴滴涕或氯氰菊酯产生抗性的小菜蛾对阿巴美丁存在交叉抗性^[13]。在马来西亚, 每公顷有效成份用量 10.8—16.2g, 能非常有效地控制小菜蛾的为害。在我国广东省, 用 $9—18 \times 10^{-6}$ 的阿巴美丁防治椰菜花上的小菜蛾, 10d 内的效果仍可达 82.07—91.08%^[14]。

烟芽夜蛾 *Heliothis virescens* (Fabricius) 和谷实夜蛾 *H. zea* (Boddie): 前者较后者敏感。中毒昆虫逐渐停止活动; 死亡幼虫的体节伸长, 身体肿大; 部份存活下来的幼虫也常死于蛹期或成虫期。在草莓地里, 每公顷有效成份用量 20g, 防治谷实夜蛾效果显著, 同时兼治了二点叶螨 *Tetranychus urticae*, 使得草莓挂果率明显提高, 单果重明显增加, 与对照区差异显著。在棉花地里, 每公顷有效成份用量 28.3g, 防治烟芽夜蛾, 结果处理地的棉花产量较对照区产量增加 75%。阿巴美丁对已有合成除虫菊酯抗性的烟芽夜蛾效果也很好。

梨黄木虱 *Psylla pyricola* Förster: 夏型的梨黄木虱较冬型的敏感。阿巴美丁对夏型的梨黄木虱幼虫和成虫的 LC_{50} 分别是 0.142×10^{-6} 和 0.210×10^{-6} 。田间防治梨树上的梨黄木虱, 每公顷有效成份用量 14g, 当天效果 99.0%, 第

七天效果尚可达 74.5%; 每公顷有效成份用量 28g, 当天效果达 99.8%, 第七天效果达 96.4%。阿巴美丁防治普通梨黄木虱 *Psylla pyri* (L.) 也很有效。

西花蓟马 *Frankliniella occidentalis* (Pergande): 西花蓟马不仅直接为害作物, 还传播番茄斑萎病毒。在美国、英国、加拿大和芬兰等国家, 阿巴美丁被认为是防治番茄、菊花和大岩桐等植物上的西花蓟马的最有效农药, 推荐使用浓度 12×10^{-6} ^[15]。

阿巴美丁除直接杀死害虫外, 还有致畸、延缓发育、拒食、影响信息素分泌、妨碍交配和降低产卵力, 甚至导致不育的作用^[16,17,18]。

4 对害虫天敌的影响

阿巴美丁对天敌的影响已有一些报道。在正常使用浓度下, 它对三叶草斑潜蝇的天敌: *Diglyphus intermedius*, *Ganaspidium hunteri*, *Chrysonotomia* spp., *Chrysocharis* spp. 和 *Discorygma* spp. 等无明显的影响。在室内, 以田间使用浓度处理 *Aphytis melinus*, *Cryptolomus montrouzieri* 和 *Eusellis stipulatus*, 未见受试的三种天敌昆虫表现出明显的中毒症状。但是, 蜘蛛 *Phidippus audax* 捕食曾喂食过 10×10^{-6} 阿巴美丁的谷实夜蛾幼虫后, 80% 蜘蛛表现出明显的中毒症状; 当阿巴美丁浓度达 40×10^{-6} 时, 蜘蛛全部死亡^[2]。

5 害虫的抗药性

已发现柑橘蓟马 *Scirtothrips citri* (Moulton)、马铃薯叶甲 *Leptinotarsa decemlineata* (Say) 和西花蓟马 *F. occidentalis* (Pergande) 三种害虫对阿巴美丁产生了抗药性。对马铃薯叶甲抗性品系的研究结果表明, 抗性因子是多基因的, 位于常染色体上, 不完全隐性; 抗药性的生理生化机制主要是基于单加氧酶降解代谢的增加, 可能还有基于羧酸酯酶的抗性机制^[19]。

6 第二代 AVERMECTIN 杀虫剂: 4"-表甲氨基-4"-脱氧 avermectin B1 (MK243)

1989年, 美国默沙东 (Merck sharp & Donme) 公司通过对阿巴美丁的基团进行化学

修饰,发现了七种衍生物,其中4"-表甲氨基-4"-脱氧 avermectin B1对鳞翅目害虫的毒性最高^[20]。例如,它对草地夜蛾 *Spodoptera frugiperda* (Smith)、甜菜夜蛾 *S. exigua* (Hübner)、谷实夜蛾、烟芽夜蛾和粉纹夜蛾 *Trichoplusia ni* (Hubner)等幼虫的LC₉₀值分别为0.01、0.005、0.002、0.003和 0.014×10^{-6} 。根据LC₉₀值,MK243对甜菜夜蛾和南方灰翅夜蛾 *Spodoptera eridania* (Cramer)的毒力分别是阿巴美丁的1166倍和1500倍;对烟芽夜蛾的杀虫活性也较常规的化学农药灭多威、灭索双和氰戊菊酯高,分别是它们的3300、1666和500倍^[2]。

田间试验表明,MK243每公顷有效成份用量11.2—22.4g,能非常有效地防治一些蔬菜和玉米上的重要害虫^[2]。

参 考 文 献

- [1] Putter I, MacConnell J G, Preiser F A, *et al.* *Experientia*, 1981, **37**: 963—964.
- [2] Lasota J A, Dybas R A. *Annu Rev Entomol*, 1991, **36**: 91—117.
- [3] Campbell W C, Fisher M H, Stapley E O, *et al.* *Science*, 1983, **221**: 823—828.
- [4] Calcott P H, Fatig R O. *The Journal of Antibiotics*, 1984, **37** (3): 253—259.
- [5] Crouch L S, Gordon L R, *et al.* *J Agri Food Chem*, 1992, **40** (1): 88—92.
- [6] Moye H A, Malagodi M H, Yoh J, *et al.* *J Agri Sci Chem*, 1987, **35**: 859—864.
- [7] Iwata I, MacConnell J G, Flor J E, *et al.* *J Agri Food Chem*, 1985, **33**: 467—471.
- [8] Moye H A, Malagodi M H, Yoh J *et al.* *J Agri Food Chem*, 1990, **38**: 290—297.
- [9] Campbell W C, Fisher M H, Stapley E O, *et al.* *Annu Rev Microbiol*, 1991, **45**: 445—474.
- [10] Schuster D J, Taylor J L. *J Econ Entomol*, 1988, **81**: 106—109.
- [11] Harris M A, Begley J W, *et al.* *J Econ Entomol*, 1990, **83** (6): 2380—2384.
- [12] Abro G H, Wright D J. *Annals of Applied Biology*, 1989, **115** (3): 481—487.
- [13] Ismail F, Wright D J. *Pesticide Science*, 1991, **33** (3): 359—370.
- [14] 刘建峰,王春夏,杨五棋,等. *昆虫天敌*, 1992, **14** (2): 83—88.
- [15] Bournier, J P. *Phytoma*, 1990, **422** (35): 38—39.
- [16] Deecher D C, Brezner J, *et al.* *J Econ Entomol*, 1990, **83** (3): 710—714.
- [17] Strong L, Brown T A. *Bull Entomol Res*, 1987, **77**: 357—389.
- [18] Etienne J C, Ngugen T X, Burts E C. *J Econ Entomol*, 1992, **85** (1): 182—186.
- [19] Argentine J A, Clark J M, Lin H. *Pesticide Biochemistry and Physiology*, 1992, **44** (3): 191—207.
- [20] Mrozik H, Eskola P, Linn B, *et al.* *Experientia*, 1989, **45**: 315—316.