

植物源杀虫农药的研究开发现状及展望

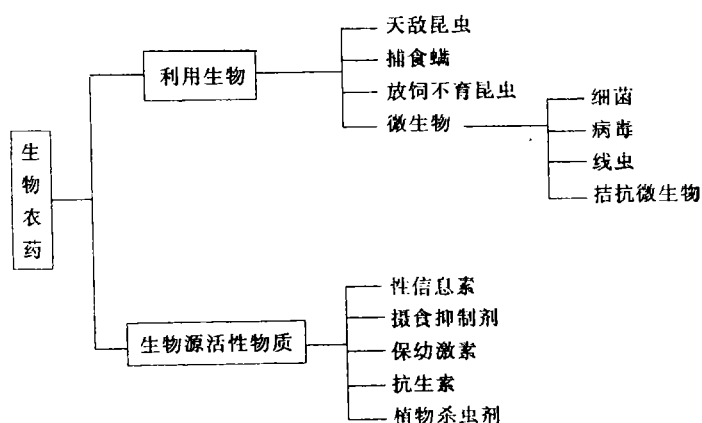
Prospects and R & D Progress on Phyto-Insecticides

邱明华

(中国科学院昆明植物研究所, 副研究员 昆明 650204)

千百年以前,人们为使农作物免遭害虫、病菌、病毒的侵害,就学会利用植物中杀虫活性物质来保护作物,这就是最早的农药。如公元前 1500~1000 年左右,中国就开始用燃烧艾菊、烟草等方法来阻止害虫蔓延。随着农业的发展,象除虫菊这样高效低毒的植物杀虫剂被许多国家开发成支柱产业。但 40 年代后,化学合成农药的迅猛发展,使植物源农药的研究开发落入低潮。近十年来,人类日益关注全球生态环境及自身生存条件,一方面努力减轻化学农药的毒性及对环境的影响,另一方面则努力开发无污染、安全性高的生物农药。

所谓生物农药,指的是来源于生物并可对特定的害虫具有特效而安全性又高的天然农药,一般可分为直接利用生物和利用生物体中活性物质两大类(见下图)。



一、植物源杀虫农药的研究开发现状

在化学农药之前,许多国家即以除虫菊、鱼藤酮、尼古丁、沙巴草和苦木素作为杀虫剂,且曾广泛使用。鱼藤酮由于毒性高,目前仅用于有限的几种农作物。尼古丁、沙巴草、苦木素现今也很少使用。而出自除虫菊花的天然菊酯在对付有害昆虫时,主要是作快速击倒素用,目前仍为开发的热点之一。

从现在的研究结果看,最有使用前途的植物杀虫剂是楝科、芸香科、番荔枝科和唇形科植物的一些种类。

1、除虫菊

除虫菊已是众所周知的杀虫植物,早在 19 世纪中叶即由西亚引入欧洲、美洲及日本。在很长的一段时间内,日本是世界上产量最大的除虫菊及菊酯生产国。第二次世界大战后,东非取代日本,成为世界上产量最高的地区。除虫菊至今仍为肯尼亚、厄瓜多尔等一些国家的支柱产业。我国云南省等地在 40 年代中期开始从国外引种栽培。人工合成杀虫剂对环境污染及对人体健康的影响,日趋严重,而除虫菊酯虽然应用多年,但昆虫产生抗性仍较小,因而除虫菊的开发又一次成为天然农药开发的一个热点。因肯尼亚、厄瓜多尔等主产国的除虫菊产量、质量不能满足市场需要,除虫菊的种植正向其他地区转移。澳大利亚 BOC 燃气公司在政府的支持下,成立了 CIG 除虫菊公司。1986 年在塔斯马尼亚州的北部推广种植除虫菊,干花总产量 1989 年只有 300 吨左右,1993 年就增加到了 2 500 吨,占领了世界除虫菊市场的 10~20%,目前国际市场上除虫菊酯仍供不应求,促使产品开发不断翻新。最近,英国的阿格罗阿姆公司利用液体 CO₂ 以超临界萃取方法从干花中提取除虫菊酯。

我国 40~60 年代在浙江、云南等省均种植有除虫菊,但一直没有发展。80 年代初,在贵州北部和云南楚雄等地又开始种植除虫菊。许多单位研究表明,云南生态环境和自然条件与世界除虫菊的主产区肯尼亚、厄瓜多尔等地相似,适宜于除虫菊的生长及开花,完全有可能发展成为世界上另一个除虫菊主产区。

2、印楝

印楝树 (*Azadirachta indica*) 是一种亚洲干旱地区土生的亚热带树种。现在也被中南美洲一些国家栽培。树的各部分提取物,特别是其种子,对多种不同龄期的昆虫显示出抑制取食、驱避、毒性和干扰内分泌的作用。印楝子油作为天然植物杀虫剂已

在发展中国家使用多年。印楝油中主要杀虫活性成分为印楝素,四去甲降三萜类化合物。在印楝素剂量低到 0.1ppm 时就表现出比较好的活性,且对人畜无害。由于印楝素对环境和人畜的安全性,美国、印度及其他一些国家都在进行开发。如美国生产的 Margosan O 已作为商业专利登记,产品由种子抽取成分配制而成,环保部门已批准用于非食用性作物和苗圃;改良后的制剂在美国市场上也有销路。印度生产了“Neemmark”,加拿大已开始考虑开发这类杀虫剂。缅甸则抽提印楝子油大量出口。印楝要求高温、气候干燥而又无台风侵害,我国海南、云南的不少地区很适宜种植。华南农大已于 1986 年在海南引种成功,并进行了少量栽培。云南省也在干热河谷及干热区引种成功,并有可能引进缅甸大量的印楝植物资源进行杀虫剂的提炼开发。

3、其他杀虫植物资源

一些番荔枝科(Annoaceae)植物中番荔枝内酯素类化合物,也是近年来较引人注目的植物杀虫剂。番荔枝(*Annona squamosa*)是热带亚热带著名的水果之一,从其种子中可分离出大量的番荔枝素类(Acetogenins)化合物,番荔枝素 I 是具有较强杀虫活性的化合物之一。杀虫活性实验表明,这类化合物对根猿叶甲虫、菜蛾、桃蚜、烟蚜和地中海蜡头蝇均有较好的活性,与除虫菊酯很接近,对某些类别的害虫如菜蛾、桃蚜等,杀虫活性比除虫菊酯更高,故而番荔枝素 I 被认为是很有前途的植物杀虫剂。近来又发现了一些具有杀虫活性的这类化合物。我国的华南植物所、昆明植物所的研究人员也发现了杀虫活性较好,而还未被国外专利覆盖的一些番荔枝素。如海南哥纳香素 D,E,F,G 在 50 毫克/毫升浓度下时,对菜青虫、小菜蛾的拒食率可达 96%以上,24 小时内 100%死亡,无触杀作用。从圆滑番荔枝中则发现番荔枝素 I 的含量高达 0.15%。番荔枝作为热带水果,便于开发利用,是很有前景的一类新植物杀虫剂。目前国外正纷纷加紧研究开发,我国也应迎头赶上。

除此之外,芸香科(Rutaceae)柑桔属植物中分离出的柠檬烯类化合物,也显示出对棉铃虫可产生拒食作用。柠檬苦素(Limonin)对马铃薯甲虫也是一种有效的拒食剂。紫菀科(Asteraceae)植物土木香(*Inula helenium* L.)中分离出来的倍半萜烯内酯,墨西哥万寿菊(*Tagetes mimufa*)叶子中得到的 5-罗勒烯酮等等都是具有较好杀虫、驱避活性的物质。昆明植物所等单位对卫矛科植物中的倍半萜多酯类化合物进行了深入的研究,发现一些具有杀虫活性的新化合物。

二、仿生合成农药的先导物

植物杀虫剂除直接用来杀死害虫作为农药之

外,还常作为仿生合成农药的先导物,在高效低毒的仿生农药商品化中起极为重要的作用,最具代表性的例子就是除虫菊酯。天然除虫菊酯由六个化学结构非常相近的化合物组成。尽管有许多国家将除虫菊酯生产作为支柱产业,但由于干花产量及菊酯含量的限制,成本仍然较高。由迈克尔·埃利奥特领导的 Rothamsted 集团公司首先研究了菊酯的杀虫活性部位,合成了拟除虫菊酯杀虫剂——氯氰菊酯,其光稳定性优于天然菊酯,杀虫活性提高了近 34 倍。目前已有 30 来个酯类合成农药投放市场,溴氰菊酯(Decis)就是较为典型的农药之一。虽然过分使用,害虫会表现出明显的抗性,但因其高效低毒易分解,仍引起重视。有大量学者正在研制这类新农药,我国中西集团发现的新的低活性拟菊酯类农药正在注册中。这说明植物杀虫剂作为合成农药的先导物比直接作为商品更有希望。但是由于拟菊酯类农药在合成过程中,仍会造成较大的化学污染,因而德国、法国政府已明文规定自 1995 年起,这类合成农药不准再在其国内进行生产。

另一类重要的杀虫农药——氨基甲酸酯类,也是以毒扁豆所含毒扁豆碱为模板仿生出来的,这类农药占杀虫剂市场约 20%,而作为除草剂也占其市场约 6%。

三、植物源杀虫农药的开发途径

植物是杀虫活性物质的丰富来源。从植物中得到适当提取物后,可以按部就班地进行活性筛选。一般先进行离体和活体试验,再不断分离、筛选活性,直到筛选出活性部位、活性分子。一旦证实化合物的杀虫活性后,就可以考虑开发。其方式有:以此作为先导物,筛选出活性更高,安全性更好,更加容易得到,而无环境污染的目标分子,再进行新农药开发;以此活性分子为目标分子,进行植物的引种驯化、推广栽培,再大规模开发。随着人们对生态环境的重视,各国政府对农药的使用、生产和开发作了明确规定,并实行农药注册登记制度,要求在完成急性毒性、亚急性毒性、长期毒性、残留以及致癌、致畸、致突变等实验的基础上注册,确保其安全性后再批准使用,使农药的危害减小到最小程度。

四、创制新天然农药面临的机遇与挑战

人类正面临着环境和粮食危机,我国也正面临着类似的挑战。为此,我国政府提出到 2000 年时争取提高粮食年增产量达 500 亿公斤。同时,也顺应世界潮流的发展,颁布了人口、环境和发展白皮书《中国 21 世纪议程》。要同时解决环境和粮食危机这两大世界性难题,在耕地面积日益缩小的情况

(下转第 20 页)

下蓄水池。如果在此基础上再使用符合中国国情的燕山滴灌等节水灌溉技术,把这种集水工程扩展到大田,应用于粮、棉等作物,形成“拦截径流补充灌溉模式”,变浇“救命水”为浇丰产水,则西北地区农业就可望进入全新的主动抗旱阶段;进而就可能在很大程度上扭转贫困面貌。正如河南省卫辉市一个过去人喝的水都要到 5 里以外去挑的山村,自采用了现代水窖加燕山滴灌成套技术后,不仅创造出前所未有的 302 亩“水浇地”,小麦亩产因此增加了一倍半;而且信心十足地提出,要靠这套组合技术不但解决温饱,而且实现“小康”。

对“土壤水库”作用的再认识

以上讨论的是用特殊材料蓄积地表微径流。在另一方面,如何充分利用土体蓄积有限的降水,在半干旱半湿润地区也有着可观的潜力。北方地区,尤其是黄土高原一个得天独厚的优势便是土体深厚,大多有 100 多米,且土质(壤土,垆土)相对轻、松,非常有利于蓄纳较为集中的降雨。从作物根系能够积极吸纳水分的 2 米土层看,每亩耕地按容重 1.35 及饱和含水量 24% 计,可蓄纳的水量总计可达 440 立方米,其中约 60~70% 是可以被作物吸收利用的。科技人员已从选育根系强大,水分利用率高的品种,以及促进根系发育等方面进行了卓有成效的研究。如近年来北京农业大学和山东莱阳农学院的科技人员,已分别成功地通过发挥“土壤水库”的作用,创造出冬麦春季返青后只浇一次水(全生育期共两次,而常规栽培要六次左右)亩产千斤,以及在完全无水浇灌条件的旱地上,冬麦亩产达 300~350 公斤的记录,成为节水栽培的重要科技成果。

(上接第 25 页)

下,创制新天然农药、推广应用现有天然农药,是必要的途径之一。

为解决人类面临的环境安全大问题,开发高效低毒、易分解、选择性高,对人类无危害无污染的农药,成了时代的潮流。世界上大量农药研究机构及政府都在积极投资,尽力研制新农药。研制一种新农药,需要进行一系列的研究,涉及的学科门类繁多,是一项极为复杂的系统工程。而杀虫活性先导物的发现及目标分子的选择,工作量都极大,筛选命中率目前大概仅接近 1/80 000,大公司开发成功一种项目亦需 8~10 年,投入的财力、物力是一个

薄膜覆盖栽培的巨大潜力

塑料薄膜自 80 年代初从日本引进以后,从保护地栽培(农膜)发展到大棚和畜舍(棚膜),进而又发展到覆盖(地膜)栽培粮、棉、油和水果等,应用范围越来越广。前些年采用塑料薄膜覆盖栽培玉米的技术推广到山区,被高寒缺水的贫困山区农民盛赞为“温饱工程”。农业科技人员也早已开始研究采用薄膜覆盖来解决作物生长温度不足和冻害,以及超高产的可能性。然而人们对薄膜覆盖栽培在干旱、半干旱地区的巨大潜力尚未有充分估计。而在经历了去、今两年连旱和特大干旱之后的西北地区的科技人员、干部和农民,亲身体会到薄膜栽培的巨大优越性,迸发出空前的推广热情。如甘肃省白银市属三县二区,有耕地 450 余万亩,今年冬小麦几乎全部绝收,而 4 万亩地膜覆盖玉米在几经挑水保种后保住了苗,终于接上了 7 月初第一场透雨,目前长势非常好。在甘肃和宁夏不少试种地膜小麦和地膜玉米的地方,都已有亩产(一季)分别超 400 公斤和 800 公斤(乃至“吨粮”)的记录,比常规种植的小麦和玉米亩产分别高出 100 公斤和 2~5 倍。薄膜栽培技术不仅能有效地抑制土壤水分和氮肥的蒸(挥)发,抑制杂草生长,还能起到用塑料膜表面集纳降雨于植株局部根区的作用。因而受到农民的热烈欢迎,推广之势若星火燎原,几乎每个县都制定了从今秋播种起要扩大数万亩甚至一二十万亩的庞大计划。类似“洛阳纸贵”的“西域膜贵”的前景已是势在必行。这也给科技工作者出了新的课题:如何千方百计地降低农用地膜的造价,以有力地支持节水和旱作农业的发展。(责任编辑 蔡德诚)

难以想象的天文数字。现在正逐步走上计算机依据作用机制等理论模拟预测分子结构、设计活性分子的道路,但刚起步,还有待完善和发展。

利用国外在植物杀虫剂方面的一些研究及开发应用的结果,开发植物源杀虫农药,对解决我国目前环境恶化及粮食危机的大问题,具有相当重大而现实的意义。

可以相信,从我国已有广泛民间利用基础的丰富植物资源入手,进行植物源杀虫农药的研究和开发,是大有希望的。(责任编辑 肖庆山)