

植物性物质川楝素的研究概况

赵善欢 张兴

(昆虫毒理研究室)

提 要

本文对川楝素的来源、发现、提制、生产、应用及药理、毒理、毒性等方面的研究历史、现状及展望作了简单叙述。旨在讨论进一步研究这一天然化合物的重要意义。特别是通过对川楝素在医学上的药理、毒性等方面研究成果的回顾、总结,而为深入研究其在害虫防治方面的作用机制及应用措施提供依据、寻找线索、开创思路。

关键词: 川楝; 苦楝; 川楝素; 植物杀虫剂

目前在研制较能适合于害虫综合治理(IPM)要求的优秀杀虫剂工作中,从植物界寻找较理想的杀虫活性物质已成为一个主要的研究课题。特别是近十多年来对印楝(*Azadirachta indica* A. Juss)、苦楝(*Melia azedarach* L.)等几种楝科植物杀虫特性的研究,非常引人注目。有报道指出,从楝科植物中已分离出了280多种具杀虫活性的柠檬素(limonoid)类物质^[27]。其中来自印楝的物质最为有效。美国的一个印楝产品, Margosan-O, 已作为杀虫剂正式通过注册^[28]。我国在这方面也作了不少工作,关于印楝的研究我们也取得了一定的成绩^{[29][30]}。但这种植物产于非洲、南美洲及东南亚,在我国还没有真正发现有分布。楝科植物在我国均分布有15属,64种,是我国热带、亚热带森林组成中的重要成分和园林绿化树种。特别是楝科楝属植物的代表种——苦楝及其近缘种川楝在我国南部地区广为分布,在我国用于医药及杀虫已早有历史记载。解放后从楝属植物中分离提制出了川楝素,主要用于人医中驱除寄生虫。近几年通过大量研究,在杀虫、医用及生理研究方面又有了不少新发现。本文试图从我国几种楝属植物应用的历史到川楝素的发现,研制应用的过程及其现状、发展前景作一扼要描述,旨在为这一研究起到抛砖引玉的作用。

川楝素的发现、化学、提制及生产概况

川楝素是1955年四川中药研究所根据我国古代文献记载、传统医学及民间流行使用情况,在寻找代替进口药物山道年驱蛔药物时从几种楝属植物中发现的。在临床治疗的配合下,四川省中药研究所第三研究室从1953年起,开始探索川楝的驱蛔有效成份。

1987年2月12日收稿

1955年从韧皮部中分离出一种有效成份晶体,定名为川楝素(Toosendanin)。该品为~白色针状晶体,无色、无臭、味苦。易溶于乙醇、甲醇、乙酸乙酯、丙酮、二氧六环、吡啶等,微溶于热水、氯仿、苯、乙醚,难溶于石油醚。熔点在含一分子结晶水时为178~180℃,乙醇中结晶产物为238~240℃,薄层上分单一的两个色点的熔点为243~245℃。四川省中药研究所顾月翠等用纸层分析光度测定法来定性定量分析川楝素。以乙二醇作固定相,苯-丙酮-乙二醇(9:1:饱和)作移动相,纸层析分离,用对二甲氨基苯甲醛硫酸试剂显色。并发现川楝素层析图谱始终存在有两个点而推测其有互变异构现象。钟焜昌等^[15]通过化学反应及光谱分析,证明川楝素为一呋喃三萜类化合物。初步确定了它的化学结构及立体构型(图1)。

舒国欣等从层析特性上分析川楝素有两个互变异构体,用氘不定位标记而测定其放射纯度时,也证实了川楝素有两个互变异构体。从而认为图1不能完全反映川楝素的真实化学结构。作者从有关sendanin结构(图3)的文献中认为,川楝素可能只比sendanin少一个乙酰基。通过化学分析,红外光谱、核磁共振谱及晶胞参数等分析结果也证明了这一点,从而对川楝素的结构作了修定(图3)^[21]。

川楝素结构中C-28位为游离羟基,因含有半缩醛基团而具有互变异构现象。这一结构特点在衍生物制备及结构活性分析中具有重要意义。

在我国分布的楝属植物有三种,即苦楝(*Melia azedarach* Linn.),又名楝、楝树、紫花树、森树等;川楝(*Melia toosendan* Sieb. et Zucc.),又名金铃子、唐苦楝、大果苦楝等;和南岭楝(*Melia dubia* Cav.),又名大稔树^[20]。其中以苦楝分布最为广泛,广布于黄河以南,以北也有零星分布。而川楝和南岭楝主要分布于西南各省,南部其它省也有分布。这三种楝属植物中均可提取出川楝素,只是含量不同而已。川楝树皮中川楝素含量为苦楝、南岭楝皮的2~3倍,川楝根皮中川楝素含量为杆皮中的2~3倍。12月至3月之间,皮中川楝素含量最高,快速干燥(以真空干燥最好)则不致使川楝素降解。贮藏中微量霉菌感染反而会使川楝素含量增高^[9]。

在川楝素的工业生产过程中,四川省中药研究所及宜宾地区红光制药厂(现名四川宜宾制药厂)等几个工厂以楝树韧皮作原料,用70%乙醇浸渍,用量约为原料的1.4倍,损耗量为原料的0.25倍。川楝素纯品收得率约为原料的0.3%。后来曾用水代替70%乙醇而使胶质少出,然后用氯仿萃取法,川楝素收得率为0.25~0.3%,用湿炭吸附法可得到川楝素0.4%。钟朝杰等^[16]又介绍了一种连续溶剂萃取法从川楝皮水浸液中提取川楝素的方法,为川楝素新型工业生产设计提供了依据。

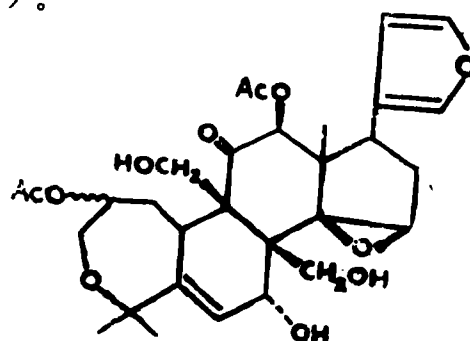


图1 初定川楝素结构式

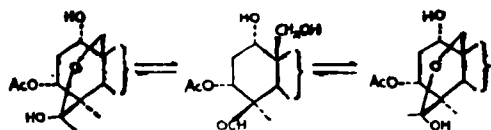


图2 川楝素分子中半缩醛结构的互变异构现象

川楝素的药理及药性

楝属植物本身作为医药使用，在我国据文字记载至少已有二千年的历史。公元前1~2世纪有人托名“神农氏”所著的《神农本草经》中便记有：“楝实、味苦寒。主温疾伤寒，大热烦狂，杀三虫疥疮，利小便水道”。自此以后，也有不少著作如《肘后备急方》(285~341, 葛洪)、《雷公炮灸论》(420~479, 雷学文)、《名医别录》(502, 陶弘景)、《千金方》(581~682, 孙思邈)、《图经本草》(1018, 苏颂)等都不同程度地有所论述。还有不少偏方、单方中也都包括有楝，如“金铃散”、“楝实丸”等。但以明朝李时珍所著的《本草纲目》(1596)对楝记述的最为详细。这些名著中均认为其是一种清热解毒，去肝火，止痛，治疝、疥、驱虫之良药。解放后从楝树中提出的川楝素被加工成川楝素片用于驱蛔。不少医学文献通过对大量病例的调查研究，认为川楝素片驱蛔具有效果高而迅速，服用方便，不用附加泻剂（其本身有催泻作用），价廉，兼驱蛲虫等优点。疗效超过或相仿于进口驱蛔药物山道年。

在驱蛔机理研究中，刘桂德等^[2]通过对猪蛔虫的一系列试验表明，川楝素对猪虫有麻痹作用，药效表现较为缓慢。主要作用部位系猪蛔首部的神经环。但此麻痹作用可自行恢复而为暂时性的。四川省中药研究所吴廷楷等通过电刺激及肌肉磷代谢的试验表明，川楝素可透过蛔虫表皮而使其兴奋，自发活动加强，间歇出现异常的剧烈收缩而破坏了其运动规律。造成能量的供不应求，导致收缩性疲劳而痉挛，使虫体不能附着肠壁而驱出体外。并证明川楝素对猪蛔虫的胆硷脂酶活性以及呼吸和酵解均无明显影响。另外，值得提出的是杨平等^[9]在兽医上用于驱蛔时，发现猪对川楝素很敏感，大剂量可引起猪体中毒死亡。孙步云^[1]也曾报道过川楝素驱蛔引起中毒的两个病例。虽然稽其原因，皆因服用了超过标准2~3倍药量而致，但也曾引起了人们的关注而进行了其毒性的研究。一系列的试验表明，川楝素对试验动物胃膜有刺激作用，易发生水肿、炎症等病变。大剂量主要可损伤胃及肝，且有一定的累积作用。这在以后的研究中值得引起重视。

近些年在川楝素药理、药性等方面的研究中取得了重大突破。施玉樑等^[17]首先通过对大鼠膈肌标本的一系列电生理测定，报道了川楝素的神经肌肉接头前的阻遏作用。李培忠等^[4]报道川楝素对传出神经系统的胆碱能神经系统及肾上腺素能神经系统均无明显影响而主要阻断神经肌肉间的传递功能。与此同时，黄世楷等^[21]报道川楝素在神经肌肉接头可引起亚显微结构变化。后来，熊春生^[24]用大鼠重复了亚显微研究，得到了一致的结果。这又从形态学方面支持了川楝素的接头前作用机理。

这一发现是非常有意义的。因为就目前所知，仅有的几种突触前阻断剂基本都属于高分子的毒蛋白，如肉毒杆菌毒素（肉毒）和 β -银环蛇毒素。而川楝素这一相对而言结构简单、容易提制的四环三萜类化合物的特殊生理活性的发现，无疑将对突触前生理及药理研究有所推动。施玉樑等^[18]用大鼠膈神经膈肌标本作了进一步观察。结果表明，川楝素所引起的各种反应都与接头前阻遏剂——肉毒的特性相似。但对小终板电位发放频率

的影响形式及中毒肌肉标本对间接强直刺激引起的反应型有所不同。这些现象证明它们的作用环节和作用方式又不完全一样。

巧合的是,李培忠等^[6]在筛选肉毒中毒治疗药物时,发现川楝素能治愈致死剂量肉毒中毒的动物。肉毒杆菌毒素是目前所知的最强毒物,一些国家已将它列为标准战剂。肉毒中毒至今在世界各地仍时有发生。治疗的主要手段是使用抗肉毒血清。鉴于抗肉毒血清在生产上的困难和使用上的限制,国内外学者从本世纪初便一直在寻找简单有效的治疗药物。但成效甚微,至今仍未见有明显突破。自李培忠等报道了川楝素对肉毒动物的治疗效果后,立即引起了国外有关学者的重视。我国学者近几年在混用增效、剂型加工、药代动力学等方面又作了不少工作,但能否实际应用,则还有待于进一步进行研究。

从以上概要叙述可看出,川楝素这一源于植物具驱蛔作用的呋喃三萜类化合物,却与专一地作用于神经肌肉接头前的高分子毒蛋白——肉毒和 β ——银环蛇毒素相似,为一不可逆地、选择地作用于突触前的神经肌肉传递阻遏剂。川楝素与肉毒同为神经肌肉传递阻遏剂,它却有明显的抗肉毒效应。这些充分证明川楝素具有独特的生理作用,有望成为一医用及生理研究的活性物质。

川楝素杀虫作用研究情况

关于楝树的杀虫作用,历史上也有不少记载。《神农本草经》中记有“杀三虫”,随后的多种本草医书中也偶有谈论。宋朝大诗人苏东坡所著的《格物粗谈》(1080)中记道:“收苦楝花或叶藏席下可避蚤虱”,“端午取楝子碎投厕中不生虫。”《本草纲目》中记道:“花,铺菇下,杀蚤虱”。《中国土农药志》(1959)中对楝树皮、叶、果实、花防治农业卫生害虫有详细记载。根据这些文献记载及国外对印楝的研究,特别是我国医学科技人员对川楝素应用及机理上的研究进展,启发了华南农业大学昆虫毒理研究室从1980年开始首先对川楝素的杀虫作用作了探讨,并且取得了一定的成果。

在1980~1982年的广泛筛选工作中,首先在三化螟(*Scirpophaga incertulas*)内吸毒杀试验中发现了川楝素具强的内吸拒食及毒杀活性。所以在该试验中一直用川楝素作为标准药剂而代替了原计划标准药剂——杀虫脒^[10]。在其它试验中又发现川楝素对白脉粘虫(*Spodoptera venalba*),小菜蛾(*Plutella xylostella*),亚洲玉米螟(*Ostrinia furnacalis*)均表现出强的拒食活性。但对桔蚜(*Aphis citricididis*),桔二叉蚜(*Toxoptera aurantii*),菜缢管蚜(*Phopalosiphum pseudobrassicae*)和两种六月金龟甲(*Anomala cupripes*, *Holotrichia ovata*)无明显拒食及忌避作用。不足的是,当时未观察其胃毒毒杀效应^{[6][12]}。在对粘虫(*Mythimna separata*)的试验中,发现在人工饲料中混入1ppm的川楝素,7天后幼虫体重减轻率为64.9%,9天后死亡率达44%。另外,在斜纹夜蛾拒食试验中,测定出对5龄幼虫的选择性拒食中浓度(AFC₅₀)为27ppm,而非选择性的AFC₅₀却为914ppm,二者相差30多倍,这个问题值得进行深入研究^[31]。张格成等^[8]报道了防治几种柑桔害虫的效果,用1000ppm川楝素防治桔蚜,5天后虫口减退率达90.8%,但对矢尖蚧的效果不很高。值得注意的是他们利用提制川楝素时的废液

来防治这两种虫，300倍浓度下均有很高的防效。

在川楝素杀虫作用研究中，研究较为深入的是对蔬菜上的一大主要害虫——菜青虫的防治试验。早在1981年我们就曾发现川楝素对菜青虫幼虫有强的拒食活性，100ppm的浓度拒食率可达86%，同时也注意到了川楝素的胃毒毒杀作用。张业光等^[32]报道，1000ppm川楝素对5龄菜青虫幼虫的拒食率达97.5%。对1龄幼虫200ppm可致98%的试虫死亡。盆栽试验防3龄幼虫，400ppm处理中5天后的叶片保护率可达90.6%。赵善欢，曹毅等^[13]曾对川楝素防菜青虫作了深入的研究。从室内生物测定，盆栽防治及残效期测定到田间小区试验，系统地测定了川楝素对菜青虫幼虫的生物活性。最后指出用500~800ppm川楝素，在大田条件下便可达到保护菜苗的目的。但发现川楝素对甘兰菜苗有药害现象。最近我们又发现：未经重结晶的川楝素粗制品（约含川楝素50%）对菜青虫的防效远高于川楝素纯品，同为250ppm浓度，其拒食率分别为89.3%及54.5%。在田间小区试验中，400ppm川楝素的防效接近于1000ppm的常用杀虫剂乙酰甲胺磷，叶片保护率分别为79.3%及95.2%。经试验，选用适当的溶剂及乳化方法所制成的川楝素乳液，不但在田间有效浓度按纯品计算可降到150~200ppm，而且可避免对甘兰发生药害。另外，用生产川楝素时的粘稠废液干燥而成的粉状物在室内生测及田间防治试验中，均对菜青虫表现出一定的防效。同时对甘兰菜苗的生长还有一定的刺激作用，很有必要作进一步深入细致的研究。值得注意的是，不管在盆栽及田间小区试验中，发现对几种主要天敌如食蚜蝇幼虫，瓢虫成虫及幼虫，蚜茧蜂等均很安全，但在整个试验中，发现对菜蚜防效不佳。最近，根据我们研究室的研究结果（详细另文报道），发现川楝素与苏云金杆菌（*B. t.*）混用，具有明显阻止菜青虫4龄或5龄幼虫取食为害的作用。保叶增效高达23%，并影响幼虫的生长发育，化蛹率和蛹重明显下降，对幼虫毒杀力显著提高。川楝素与有机磷杀虫剂乐斯本（Chlorpyrifos）混用，对菜青虫4龄虫亦表现增效。这些混合配方经进一步的试验，可望在生产上推广应用。

在川楝素对昆虫的作用方式及作用机理方面也作了观察。我们早在1980~1981年曾用滤纸爬行法测定了川楝素对三化螟、米象、玉米象的接触杀虫作用；用点滴法测定了对荔枝蜡蛾、玉米螟、菜青虫的接触毒杀作用；用培养皿密闭法测定了对米象、玉米象的熏蒸杀虫作用。发现川楝素对供试昆虫不表现出接触和熏蒸杀虫活性。其它前已述及的试验结果表明，川楝素对粘虫、斜纹夜蛾、玉米螟、菜青虫等试虫表现出强的拒食活性。在较低浓度或在昆虫饥饿情况下而取食少量经川楝素处理的饲料后，又表现出胃毒毒杀活性。在菜青虫试验中，中毒试虫表现为抽搐、麻痹、昏迷，于24~48小时后才逐渐死亡。大多数取食了川楝素的试虫均有拉稀现象，直至使后肠拉出腹部末端。部分高龄幼虫取食少量川楝素后虽然可成预蛹或化蛹，但蛹体畸形或变小。幼虫旧表皮不能蜕出，或在着翅部位形成水泡状突出，但死于畸预蛹阶段的试虫仍为多数。由此可见，川楝素对供试昆虫无接触、熏蒸杀虫活性，而表现出拒食、胃毒及一定的生长发育抑制作用。

廖春燕等^[25]用粘虫为材料所进行的拒食作用研究中曾认为川楝素与杀虫脒的作用有相似之处，不但为一拒食剂，而且具有神经毒性。采用微量点滴的办法将川楝素滴于粘虫口器的几个化学感受器上，观察它对取食反应的影响。发现川楝素主要作用于下颚

须,其次是下颚瘤状体而表现出拒食效应的^[20]。施玉樑等^[19]用电生理的方法证明川楝素的拒食效应与其作用于和取食有关的化学感受器,使之丧失了对食物刺激的正常敏感性,抑制了感觉传入冲动有关。廖春燕、刘秀琼^[20]对粘虫口器上的化感器作了扫描电镜观察,并通过试验而初步推论,川楝素主要作用于粘虫幼虫下颚须丹锥感受器,对下颚瘤状体栓锥感受器也有抑制作用。这种抑制作用导致神经系统内导取食刺激信息的传递受到破坏而中断,使幼虫失去味觉功能而表现出拒食反应。关于川楝素对昆虫生长发育影响方面的机理研究,傅贻玲(私人通信)曾对粘虫作过试验,发现对幼虫前胸腺从组织学方面来看,影响不很明显,但用放射免疫法测定,发现 β -蜕皮激素的含量则显著降低。关于这方面的研究还有待于进一步深入进行。

另外,值得一提的是,如果我们把医学毒理毒性试验结果和昆虫的相比较,则可发现不少相似之处。从以上所述及的有关川楝素药理毒性研究文献中可看到,川楝素可使试验动物肠胃粘膜发生水肿、发炎、及溃疡而致拉稀甚至血便。而我们在菜青虫试验中也观察到试虫取食川楝素后大量拉稀,甚至排出水泡状物。是否也是对肠道组织有破坏作用,则有待于作进一步研究;中毒动物四肢无力,活动减弱,头下垂而表现出肌体无力现象,菜青虫中毒后也表现出麻痹、昏迷,且持续几天后才死亡;动物电生理研究证明其主要阻遏突触前的传导。而在昆虫中从中毒症状上来看也显然不同于DDT,除虫菊类及有机磷、氨基甲酸酯类杀虫剂影响轴突离子穿透及抑制乙酰胆碱脂酶(AchE)的致毒机理。最近,有人在美洲蜚蠊(*Periplaneta americana* L.)神经节上的电生理试验也表明川楝素为一突触前传递阻遏剂^[21],动物试验中证明对供试动物的呼吸中枢有抑制作用。而我们的初步试验中也可看出川楝素对菜青虫的呼吸有明显地抑制。但这还须从酶学、组织学及电生理等方面做进一步的证实。特别是驱蛔机理研究结果证明,川楝素可致蛔虫麻痹,可干扰蛔虫体内磷代谢,造成能量供不应求而影响到其行为等方面,对昆虫毒理研究也很有启发。这些研究结果都为我们探讨川楝素对昆虫致毒机理的研究提供了线索和依据。

结语及展望

从以上对几个问题的简述,可看出我国学者在川楝素的分离、提纯、鉴定及工业化生产方面作了不少工作。特别是在其生物活性方面进行了较深入细致的研究。已证明川楝素的驱蛔及抗肉毒活性,并为一个不可多得的接头前传递阻遏剂。在杀虫方面证明对多种重要农业害虫有拒食及毒杀活性,充分表明这个源于自然界的化合物在应用方面的潜力。但总的来说,我们对这一化合物还研究、认识得不够深入,仍有不少问题有待于解决。如其化疗指数较低,对其杀虫作用机制还知之甚少,在生产加工,残毒和环境毒理等方面的研究还存有困难。但用发展的观点来综合分析则可肯定,川楝素仍为一个极有前途的化合物。

首先,川楝素为一来自于自然界的天然产品,则其本身的特性及可避免大规模化学合成等方面,可使对环境造成污染的程度降到极小。川楝素的生产只是一个抽提和纯化的简单过程,一般的社办工厂都可进行生产。如果选好溶剂并作好回收工作,则基本上

不存在“三废”问题。川楝素本身为一天然产品而容易降解。而且作为一个杀虫剂，其作用方式特殊，对害虫作用较缓慢，有拒食作用或取食后致使害虫拉稀、脱水、昏迷而逐渐死亡，故对害虫天敌及其它有益生物基本安全。所以使用后对环境造成污染的可能性很小，也不会明显影响局部的生态平衡而较适于综合防治的要求。较符合于目前杀虫剂发展的方向。从作用特性上来看，其既不属于速效型，也不属于缓效型，而是属于中间型的过渡性杀虫剂。而这正好与我国科学技术发展水平相适应〔7〕。

通过结构活性分析及分子改造来提高其化疗指数及杀虫活性。舒国欣等〔23〕所制备的衍生物虽没有提高化疗指数，但已在其结构活性方面摸出了一些规律。廖春燕、刘秀琼〔24〕的研究表明，它对粘虫的拒食活性与分子中半缩醛所在基团有关。如加入具巯基的化合物如半胱氨酸或DTT而消去半缩醛羟基，则该物质便失去了拒食活性。另外，我们的试验证明，川楝素衍生物及水解川楝素衍生物对菜青虫的拒食活性都远高于川楝素。这些均可作为改造川楝素结构而提高其生物活性、降低毒性提供一定的依据。

采用现代化的科研手段继续对其生理、毒理、药理及作用机制方面进行研究，有希望发现其在医用、农用方面的新途径。川楝素的抗肉毒作用是我国学者的一项重大发现。这一非蛋白结构的突触前传递阻遏剂肯定在治疗其它疾病及药理学研究方面仍有潜力可挖。在杀虫作用研究中，我们的试验范围还很小，供试虫种也不多，所得的结果还有限。如果通过对其作用机制的深入探讨，并与实际应用相结合，使其成为一个新颖的杀虫剂品种的可能性是很大的。

直接应用川楝素粗制品便可达到经济有效。医学方面有关研究表明，用川楝素粗品驱蛔虫，虽对人的反应稍有加重，但驱虫效果较高。纯品则反应较轻，但驱蛔效果也差。我们最近的研究也证明，如按川楝素纯品折算，同浓度川楝素粗制品对菜青虫的活性远高于川楝素纯品。张格成等〔8〕及我们最近的研究都发现，提制川楝素时的废液也具有一定的杀虫活性。这些都提示我们在制取川楝素粗品，进行剂型加工后便可用于害虫防治。这样可大大降低制剂的成本，是否其粗品中还含有其它杀虫成分，或其它成分川楝素有协同或增效作用，则有待于进一步分析研究。

川楝素来源丰富、药源充足。该物质主要从川楝树皮韧皮部中抽提而得，但不少文献报道从川楝近缘种苦楝及南岭楝中也抽提出川楝素。我们在三化螟内吸致毒作用试验中，从生物测定结果来看，川楝和苦楝除树皮中含有川楝素外，叶子、木质部、根均不同程度的含有川楝素〔10〕。我们所测定的其它十余种具杀虫活性的楝科植物，是否也含有川楝素，则还有待于进一步研究。单就楝属植物在我国分布的广泛性，再结合绿化安排建立楝树生产基地，则川楝素的工业化生产是可得到保障的。

川楝素作为我国所发现、研制的一个天然产品，与受到国际农药界极大重视的另一楝科植物产品——印楝素，在某些方面有相似之处，但又各有所长。详见图3及表1。

此外，楝树产品的综合利用也大有文章可作。楝树木材轻软，纹理粗而美，适为上等傢俱、建筑、箱盒、模型、舟车、乐器等用材。楝果的皮、肉可制白酒和工业酒精，果核硬壳可制糠醛、活性炭。川楝油中含有丰富的不饱和脂肪酸，亚油酸含量竟高达68.87%，有较高的医用价值。川楝油可用于水稻害虫防治也已有报道〔11〕〔14〕。苦楝

油除可以作增塑剂、肥皂、酚醛清漆外，也是一种很有效的杀虫剂。可以用来防治水稻飞虱、叶蝉等害虫。特别是近几年经华南农业大学昆虫毒理研究室试验证明，苦楝油可有效地防治柑桔红蜘蛛而对天敌安全。

从以上这些方面不难看出，川楝素极有可能成为一个在医用、农用及科学研究中有着广阔应用前景的天然化合物。我们衷心希望有关科技人员能联合起来，组成一支“多兵种”的队伍，共同努力对我国这一自然资源加以充分的开发和利用。

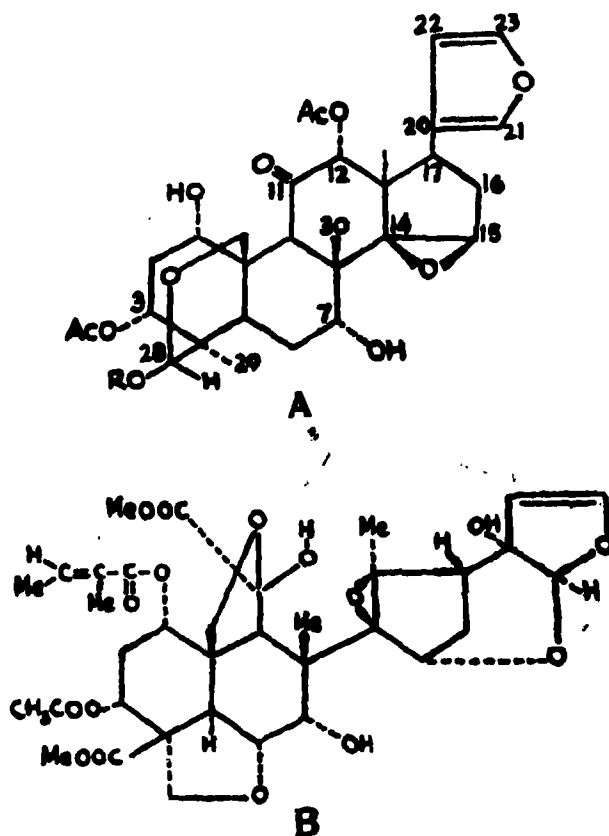


图3 印楝素(B)、川楝素(A, R=H)和Sendanin(A, R=AC)的结构式

表1 川楝素和印楝素的特性比较

	结构特点	对昆虫的作用	对高等动物的毒性
川楝素	四环三萜类化合物，与Sendanin相似，分子中含有一半缩醛羟基基团，可能与昆虫拒食活性有关。	拒食，内吸毒杀，胃毒（麻痹致死）；及一定的生长发育抑制作用（菜青虫取食后化为畸形蛹）。	大剂量可损伤胃及肝脏，在体内有一定的累积作用。
印楝素	四环三萜类化合物，分子中含有一顺-2-甲基丁烯-(2)-酯基团，可能与抑制昆虫生长发育活性有关。	拒食，内吸拒食，接触及取食后抑制昆虫生长发育（作用于神经内分泌系统，并可破坏昆虫表皮）。	可引起雄性不育

引用文献

- [1] 孙步云：苦楝片中毒二例报告，《中医杂志》，(6)1958，401—402。
- [2] 刘桂德、姚丹帆、毛本授：几种驱虫药在试管内对整体猪蛔虫的麻痹作用，《生理学报》，22(1)1958，16—21。
- [3] 杨平、李朝松、等：川楝片驱除猪蛔虫试验引起猪体中毒死亡报告，《中国畜牧兽医》，(7)1962，25。
- [4] 李培忠、石笑春等：川楝素的药理学研究，《中草药》，13(7)1982，29—32。
- [5] 李培忠、邹镜等：川楝素对肉毒中毒动物的治疗效果，《中草药》，13(6)1982，29—30。
- [6] 张兴、赵善欢：楝科植物对几种害虫的拒食和忌避作用，《华南农学院学报》，4(3)1983，1—7。
- [7] 张兴：害虫化学防治概念新进展，《西北农学院学报》，(4)1985，65—77。
- [8] 张格成、李继祥：楝科植物物质防治柑桔害虫效果初报，《中国柑桔》，(2)1985，35—36。
- [9] 周继铭、顾月翠等：川楝皮中川楝素动态的研究，《药学通报》，16(6)1981，10—12。
- [10] 赵善欢、张兴：植物杀虫剂对水稻三化螟的拒食及内吸毒力试验，《中国农业科学》，(2)1982，55—62。
- [11] 赵善欢、黄炳球、胡美英：几种楝科植物种核油对褐稻虱的拒食作用试验，《昆虫学报》26(1)1983，1—9。
- [12] 赵善欢、黄端平、张兴：楝科物质对亚洲玉米螟幼虫取食和生长发育的影响，《昆虫学报》，28(4)1985，450—453。
- [13] 赵善欢、曹毅等：应用天然植物产品川楝素防治菜青虫试验，《植物保护学报》，12(2)1985，125—131。
- [14] 赵善欢、黄炳球、胡美英：楝科植物油及种核粉抽提物对稻瘿蚊产卵忌避作用及防治试验，《昆虫学报》，29(2)1986，221—224。
- [15] 钟炽昌、谢晶曦、陈淑凤、梁晓天：川楝素的化学结构，《化学学报》，33(1)1975，35—47。
- [16] 钟朝杰、陈云彩、顾月翠：连续溶剂萃取法从川楝皮水浸液中提取川楝素，《中草药》，12(2)1981，14—17。
- [17] 施玉梁、甄乃森等：一种作用于突触前的神经肌肉接头传递阻断剂——川楝素，《生理学报》，32(3)1980，293—297。
- [18] 施玉梁、杨亚琴、王文萍、徐科：刺激频率、温度、钙离子对川楝素阻遏接头传递作用的影响，《生理学报》，33(2)1981，141—146。
- [19] 施玉梁、王文萍、廖春燕、赵善欢：川楝素抑制粘虫幼虫化学感受器诱发峰的观察，《昆虫学报》，29(3)1986，233—238。
- [20] 侯宽昭、陈德昭：中国楝科志，《植物分类学报》，4(1)1955，1—49。
- [21] 黄世楷、宋秀娥、施玉梁：川楝素对小白鼠神经肌肉接头的超微结构的影响，《生理学报》，32(4)1980，385—390。
- [22] 舒国欣、梁晓天：关于楝素的化学结构的修正，《化学学报》，38(2)1980，190—196。
- [23] 舒国欣、董瑞武、凌泽红：川楝素衍生物的制备，《中草药》，14(4)1983，10—12。
- [24] 熊春生：川楝素对大白鼠膈神经肌肉接头超微结构的影响，《药学学报》，17(6)1982，407。

- [25] 廖春燕、赵善欢：川楝素对粘虫幼虫拒食作用研究，《华南农业大学学报》，7 (1) 1986, 1—6。
- [26] 廖春燕、刘秀琼：粘虫幼虫感受器扫描电镜观察及川楝素的抑制作用，《华南农业大学学报》，7 (2) 1986, 43—46。
- [27] Taylor, D. A. H. 1983 The chemistry of the limonoids from Meliaceae. In "Progress in the Chemistry of Organic Natural Products". PP. 2—93.
- [28] Miami Deach 1985 Plants' natural defenses may be key to better pesticides. Chemical and Engineering News 63 (21), 46—51.
- [29] Chiu Shin-Foon, Zhang Xing, Liu Siuking, Huang Duanping 1985 Growth-disrupting effects of azadirachtin on the larvae of the Asiatic corn borer (*Ostrinia furnacalis* Guenee)(Lepid., pyralidae). Zeitschrift für angewandte Entomologie(99), 276—284.
- [30] Chiu Shin-Foon 1985 Recent research findings on Meliaceae and other promising botanical insecticides in china. Zeitschrift für Pflanzenkrankheiten und Pflanzenschutz 92 (8), 310—319.
- [31] Chiu Shin-Foon, Zhang Ye-Guang 1984 Effects of some plant materials of Meliaceae on fifth instar larvae of *Spodoptera litura* as feeding inhibitors. Neem Newsletter 1 (3), 23—24.
- [32] Zhang Ye-Guang, Chiu Shin-Foon 1985 Preliminary investigation of some deterrents against the imported cabbage worm (*Pieris rapae* L.). Neem Newsletter 2 (3) 30—32.
- [33] Zhou Pei-Ai, Luo Lin-Er, Bai Dong-Lin, Liao Chun-Yan 1986 Toosendanin, a natural product, as a neurotoxin and antifeedant. 6th International Congr. Pesticide Chemistry, Canada.

A CRITICAL REVIEW OF TOSENDANIN—A NOVEL
INSECTICIDE ISOLATED FROM *MELIA TOSENDAN*

SIEB. ET ZUCC. (MELIACEAE)

Chiu Shin-Foon Zhang Xing

(Laboratory of Insect Toxicology)

ABSTRACT

This paper gives a critical review of toosendanin, including its source, isolation, physical and chemical properties, industrial production, toxicology to vertebrates and insects, with special emphasis on the potential of development as a novel class of botanical insecticides. As far as the authors are aware, the chinaberry tree *Melia toosendan* Sieb. et Zucc. is mainly found in China and toosendanin was first isolated in China. We are the first group working on toosendanin as an insecticide. The unique properties of the toxic principles of toosendanin as an antifeedant, systemic and stomach poison as well as insect growth regulators, local availability, safe to the environment and compatibility with the agroecosystem emphasize its ample potential in insect pest management system.

Key words: *Melia toosendan*; *Melia azedarach*; Toosendanin; Botanical insecticides