

植物保护用抗菌素的研究与应用

II. 防治植物细菌病、病毒病、农业害虫及杂草的抗菌素

陈 玉 梅

(中国科学院微生物研究所, 北京)

本文分别介绍除防治植物真菌病害之外的其它植物保护用抗菌素的研究进展。

防治植物细菌病害的抗菌素

一、链霉素

这是第一个成功应用于植物细菌病害防治的抗菌素。据报道, 它可防治 40 种以上的病害, 主要病原菌是假单胞杆菌属(*Pseudomonas*)、黄杆菌属(*Xanthomonas*)及欧文氏菌属(*Erwinia*)。

美国自 1954 年起用于防治梨和苹果火疫病(病原菌是 *Erwinia amylovora*); 日本于 1957 年起用于防治烟草野火病(病原菌是 *Pseudomonas tabaci*)以及桃和柑桔的流胶病和蔬菜软腐病等; 印度曾用于防治稻白叶枯病和棉角斑病^[1]。链霉素可单独使用, 也可和其它抗菌素或化学农药混用。使用浓度一般在 50—100ppm^[2]。防治稻白叶枯病用 200—500ppm, 再高会有药害, 而且效果也不如甲基砷酸铁或酰基砷酸盐好^[3],

在近抽穗期使用，常因药害造成减产^[4]。印度在1964和1965年间曾用链霉素和土霉素混合物或链霉素和金霉素防治稻白叶枯病，取得了增产效果^[3]。链霉素和铜离子有协同作用，用链霉素-硫酸铜螯合物防治番茄晚疫病可增效6倍^[5]。

链霉素既可用于消毒种子，亦可在田间喷雾，田间喷雾效果受环境条件及用法影响^[2]。硫酸链霉素同氯化铁或柠檬酸铁混用，可降低其对植物的毒性^[4]。用100—400ppm链霉素水溶液浸渍感病稻苗3小时，可以治疗疫霉病^[2,4]。荷兰用硫酸链霉素水溶液加甘油制成商品“Fytostrep”，用于防治温室蔷薇白粉病。捷克的“Fytostrep”则是链霉素和土霉素的混合制剂^[2]。“Agristrep”以及“Phytomycin”也是含硫酸链霉素的农药制剂^[6]。

链霉素是蛋白质合成抑制剂。Vörös认为：真菌细胞壁中的几丁质可阻止链霉素渗入细胞，所以链霉素对一般真菌不起作用^[7]。

植物病原细菌容易对链霉素产生抗药性。据报道，在番茄上连喷10次后，辣椒斑点病黄杆菌(*Xanthomonas vesicatrix*)的抗药性菌株就会占优势^[6]。链霉素抗药菌还对氯霉素和灭胞素有交叉抗药性。为防止出现抗药，应当将链霉素和作用机制不同的农药(包括其它抗菌素)混用。据说链霉素和土霉素混合配成的“Agri-mycin 100”有助于抑制抗药菌出现^[6]。

二、氯霉素

日本从1964年起用氯霉素防治水稻白叶枯病及某些果树、蔬菜的细菌病。可单独使用，也可和碱性氯化铜混用。现在都用化学合成法生产，作为农药，可用外消旋制品。用于防治稻白叶枯病的使用浓度为100—200ppm^[4]。

氯霉素也是一种蛋白质合成抑制剂。

三、灭胞素

灭胞素是千叶链霉菌(*Streptomyces chibaensis*)产生的抗菌素。用100—200ppm喷雾，对稻白叶枯病有很好的防治效果。但浓度超过200ppm时有药害。日本自1964年起批准用它作防治稻白叶枯病的农药，但近年来用量显著

下降^[2,4]。

灭胞素现用化学合成法生产。它的作用受半胱氨酸或谷胱甘肽拮抗。它强烈抑制α-氧化戊二酸经琥珀酰-辅酶A变成琥珀酸的反应^[4]。

四、野尻霉素

野尻霉素是碱性水溶抗菌素。产生菌有链霉菌属中的几个种。它在pH 7—9的水溶液中加热30分钟仍稳定，但在酸性条件下易分解。用55ppm水溶液防治稻白叶枯病的效果达91%^[8-10]。该抗菌素的动物毒性很低。

防治植物病毒病害的抗菌素

已经发现有许多抗菌素能抑制植物病毒的增殖、感染或局部病斑形成，但还没有一种被实际应用。

一、抗病毒物质 AV

这种抗菌素能被植物内吸，并能在植物体内转移，对烟草、黄瓜和番茄花叶病等四种植物病毒的感染有抑制作用^[11]。

二、杀稻瘟菌素 S

杀稻瘟菌素S除已大规模用于防治稻瘟病外，还发现它对烟草花叶病毒的增殖和水稻条纹病毒的感染有抑制作用。如0.05ppm的浓度可抑制烟叶内50%的烟草花叶病毒增殖，并能完全抑制心叶烟或斑豆上烟草花叶病毒病斑的形成，但浓度超过2ppm即有药害^[4]；对水稻条纹病毒，该抗菌素可以降低它的感染力，抑制它在稻叶内增殖，但其活性只能在植株体内或传毒昆虫体内维持2天^[12]。

三、月桂菌素

月桂菌素又名间型霉素B或大谷霉素，是淡紫灰链霉菌(*Streptomyces lavendulace*) No.6600 G-1产生的抗稻白叶枯病抗菌素，它在烟叶内可抑制烟草花叶病毒的增殖，对斑豆叶中该病毒形成局部病斑也有明显抑制作用^[4,13]。但是它的毒性较大，浓度高时有药害。据称在抗菌素液内混入Mn²⁺可降低其植物毒性^[14]。

四、三原霉素 A

三原霉素A除有抗稻瘟病菌活性外，还能抑制烟草花叶病毒、马铃薯X病毒、黄瓜花叶病

毒和水稻条纹病毒的增殖和局部病斑形成。试验证明，2.5ppm 浓度的三原霉素 A 盐酸盐能抑制心叶烟中烟草花叶病毒局部病斑的 90%，1ppm 时可抑制 81%。用浮叶法测定，5ppm 抗菌素几乎完全抑制病毒增殖。在植株上喷洒浓度为 20ppm 的液体，可抑制症状出现，但在 10 ppm 时就有药害^[15-18]。

五、比奥罗霉素

由菲律宾链霉菌比奥罗变种 (*Streptomyces filipinensis* var. *bihoroensis*) 产生的脂溶性抗菌素。用离叶法测定，浓度为 1ppm 的该抗菌素可抑制烟草花叶病毒在斑豆中的 90% 局部病斑；在植株上 5ppm 抑制病斑 90%，10ppm 抑制 100%。但它对动植物的毒性都比较大^[4,19]。

六、杀葡萄孢菌素

由金霉素链霉菌 (*Streptomyces aureofaciens*) 产生的抗菌素，后来还由芽孢杆菌 (*Bacillus*) No. 9116-2 中分离到。它对烟草花叶病毒和灰霉病菌 (*Botrytis* sp.) 有强活性。离叶试验证明：10ppm 抗菌素抑制心叶烟烟草花叶病毒的病斑 97%，100ppm 叶面喷雾后接种，抑制病斑 93%，但叶背喷药叶面接种时，只能抑制病斑 40%。均未见药害^[20]。

七、阿博霉素

阿博霉�除对稻瘟病菌有作用外，也抑制植物病毒。用浸叶法测定，1ppm 抗菌素抑制烟叶内烟草花叶病毒增殖的 80%，但在植株上要将浓度提高到 10ppm 以上才能达到此效果。田间实际应用还要高于 10ppm^[4,13]。盆栽试验中对黄瓜花叶病毒等数种病毒的感染、增殖和发病有抑制作用。此抗菌素毒性很低，在植株上喷洒浓度高达 2000ppm 时亦无药害，被认为是一种有希望的抗病毒抗菌素^[4,13]。

八、桔霉素

桔霉素是一种霉菌毒素。可由黄绿青霉 (*Penicillium citro-viridis*) 的培养滤液中分离到。它对心叶烟烟草花叶病毒局部病斑形成有明显抑制作用，但不影响病毒增殖^[4]。这种抗菌素是一种螯合剂，能使心叶烟的多酚氧化酶或过氧化物酶活性受到抑制^[13]。它在低浓度时抑制

28S rRNA，高浓度时还抑制 TMV-RNA 的生物合成^[21]。

九、抗菌素 NA-699

温室盆栽防病试验结果表明，12.5—100 ppm 的这种抗菌素对芫菁花叶病毒有良好效果；对黄瓜花叶病毒，100ppm 时的效果为 86%，200ppm 时为 100%。均未见药害^[22]。

防治农业害虫的抗菌素

利用微生物代谢产物防治农业害虫的研究，主要有两个方面的工作：一是从昆虫病原菌分离毒素；一是分离抗菌素。现已分离到若干种对害虫（包括螨类）有杀伤作用的抗菌素。如由绿僵菌 (*Metarrhizium anisopliae*) 分离的腐败菌素等就是昆虫病原菌产生的毒素。放线菌产生的抗霉素、金链菌素、放线菌素、放线酮、硫藤黄菌素、杀粉蝶菌素及四抗菌素等等，都有一定的杀虫或杀螨作用^[23]。其中四抗菌素已在 1974 年由日本政府批准作为农业杀螨剂。下面介绍几种新近发现有杀虫和杀螨作用的抗菌素。

一、密比霉素 (milbemycin)

这是链霉菌 B-41-146 产生的大环内酯类抗菌素。它对二点叶螨、柑桔红蜘蛛、稻叶跳岬和天幕毛虫有明显的杀伤作用。该抗菌素在有效剂量内对多种植物安全。这是一个多成分抗菌素，已分离到 13 种成分。

二、莫能菌素

由肉桂地链霉菌 (*Streptomyces cinnamomensis*) ATCC 15413 产生的抗菌素，有 A、B、C 三个组分。对防治叶螨、绿豆象及黑尾叶蝉都有效。使用浓度为 0.05—0.01%，无药害^[24]。这一抗菌素在国外已大量生产，主要用作饲料添加剂，防治球虫病^[25]。盆栽防虫试验表明，杀灭红蜘蛛的效果良好；对黑尾叶蝉成虫，0.01% 浓度的 A、B、C 三组分的杀虫效果分别达 85%，93% 及 76%，浓度为 0.05% 时效果可达 100%；对绿豆象成虫，用滤纸浸药法试验，当每平方厘米含 2 微克时，各组分的杀虫率分别达 91%、99% 及 91%。在菜豆和水稻植株上喷洒浓度为 1500ppm 的药液无药害^[24]。

三、杀粉蝶菌素

由茂原链霉菌(*Streptomyces mobaraensis*)菌体内分离出的抗菌素混合物,现已分离到16种组分。它对家蝇、叶蝉及桃蚜等有强烈的杀虫活性,但对二化螟和蟑螂较差^[23,26]。各组分的活性有很大差别。因为它的结构与辅酶Q很相似,所以能作为辅酶Q的拮抗体起作用,抑制线粒体的呼吸代谢^[23,26,27]。Horgan等认为它的作用部位与鱼藤酮和异戊基巴比妥酸相同^[23,26]。

四、四抗菌素(tetranactin)

由金色链霉菌(*Streptomyces aureus*)菌体内分离到的大四环内酯类抗菌素。已分离出三个组分。它不溶于水,对日光和热都稳定,有强烈的杀螨活性,1974年日本政府批准作农药^[4]。

由于该抗菌素的分子较大,不易掺入螨体内,所以作粉剂使用无效。喷雾悬液干燥后也不能杀螨,但向干燥后形成的药膜喷水,对螨有杀伤作用,这是由于抗菌素重新悬浮在水中便易于渗入或溶于螨体细胞膜,并同细胞膜中的钾离子形成复合物,破坏了细胞维持内部恒定钾离子浓度的能力所致^[28]。

四抗菌素对数种红蜘蛛有强烈的杀伤作用,用喷雾法试验,半致死剂量是4.8ppm^[29]。田间试验证明,在苹果叶上喷抗菌素悬液,对红蜘蛛的杀伤效果优于杀螨醇(Dicofol,即Kelthane),在32天内完全停止了繁殖,但杀卵力微弱^[4]。

应用四抗菌素杀螨,药害小,毒性低,并且它在pH2—13.5小时的环境下,在60℃15天或在紫外光下数天,活性都不变。但它没有内吸杀螨性,必须与螨体接触才能起作用。

抗菌素除草剂

据报道,一些放线菌产生的抗菌素及某些植物病原菌毒素都有一定的杀草活性^[30]。但或者由于选择性不高,或者由于活性低,还没有一种可实际应用。近数年来日本报道的两种具有杀草活性的抗菌素,值得注意,现简介如下。

一、NK-049^[31]

它是茴香霉素的衍生物。稻田试验证明,每公顷用4公斤抗菌素,防除稗草效果良好。

它的作用是使杂草完全失绿,但用量过大时会偶见稻茎轻微失绿。

NK-049性质稳定,毒性很低,且易被微生物或日光作用而分解。是一种安全的除草剂。

二、杀草素(herbicidin)^[32,33]

自*Streptomyces saganonensis*分离得到的腺嘌呤核苷类抗菌素,有A、B二个组分。它对稻白叶枯病有体内活性。选择杀草性好,对双子叶植物的杀草活性最大,而对单子叶植物中的水稻最少杀伤作用。它对动物的毒性很低,也许有希望成为稻田除草剂。

结语

植物保护决不能单纯依赖化学保护。但对化学保护的作用应充分认识。抗菌素作为植物化学保护剂的一类,近20年来有了很大发展,特别在某些真菌病害的防治方面,已有若干种抗菌素被大规模应用,并充分显示了独特的优越性。对于细菌病害,虽然也有一些抗菌素有防治效果,但主要还是医用抗茵素的扩大应用,且用量有限,效果也不甚令人满意。至于作用于病毒和除草的抗菌素,基本上还处于研究探索阶段。在杀虫方面,四抗菌素可用于杀螨,似乎还不能说有大的突破。

如果说Fleming发现青霉素使对人类疾病的化疗发生了一次革命的话,杀稻瘟菌素S和春日霉素等几种重要农用抗菌素的发现及大规模应用,至少可以说是为植物保护提供了一种新的锐利武器。

到目前为止,全世界已发现的由微生物产生的抗菌素已超过了4300种,每年报道的新抗菌素种类,正在稳步增加,如1972年为180种,1977年为340种^[34]。虽然大多数还没有实用价值,但却说明大自然的资源是无穷的。有人认为:现在凡能被发现的抗菌素已被发现了,因而怀疑从微生物中筛选新抗菌素的前途,强调抗菌素的化学改造或半合成。我们认为这种看法不全面,新抗菌素的筛选仍有广阔前途。

关键在于研究方法需要革命。已有常规方法主要地只能发现常见的微生物类型和已知的

抗菌素。近年来，各国学者更多注意到从链霉菌属以外的，以及土壤微生物以外的微生物中筛选抗菌素，并且已取得了可喜的进步^[35]。另一方面，抗菌素的结构改造也是重要的，它不仅可以帮助我们克服某些抗菌素的缺点，而且有可能创造新的抗菌素，这在医用抗菌素的研究中已取得了很大成功，在农用抗菌素方面，也愈来愈受到了重视。可以预料，随着筛选方法的不断改进和分离鉴别技术的提高、抗菌素结构—活性关系和作用机制的进一步阐明、化学的进步，新抗菌素的研究无疑将会加速其进程。

用抗菌素作农药，效果好、用量少、分解快，残效短，一般不须担心污染环境。但是，抗药性问题，特别是某些抗菌素可能会遇到与人类病原菌发生交叉抗药性问题，还有价格较高，这些问题都是必须进一步研究解决的。有的国家已明文禁止一些重要医用抗菌素在农业上应用。至于植物病原菌本身的抗药性问题，只要不是长期单纯连续使用，或者将作用机制不同的农药混用，就可能解决。毫无疑问，抗菌素在农药中的地位，将随着更多更有效的新农抗的发现而愈来愈显得重要。

参考文献

- [1] Vezina, C.: *Pure Appl. Chem.*, 28: 681—698, 1971.
- [2] Dekker, J.: *World Rev. Pest Control*, 10: 9—23, 1971.
- [3] Thirumalachar, M. J.: *Adv. Appl. Microbiol.*, 10: 313—337, 1968.
- [4] Misato, T. et al.: *Adv. Appl. Microbiol.*, 21: 53—88, 1977.
- [5] Cross, J. E.: *Antibiotics in Agriculture* (ed. by Woodrobine, M.), Butterworths, London, 1962, pp. 86—100.
- [6] Dekker, J.: *Adv. Appl. Microbiol.*, 17: 243—262, 1963.
- [7] Voros, J.: *Phytopathol. Z.* 54: 249—257, 1965.
- [8] 莊村喬ら: 明治制菓研究所年報, 8: 7—16, 1966.
- [9] Ishida, N. et al.: *J. Ant.* 20A: 62—65, 1967.
- [10] Ishida, N. et al.: *ibid.* 20A: 66—71, 1967.
- [11] Hadaka, Z. et al.: *Proc. 1st Intersect. Congr. IAMS (Sci. Coun. Jap.)* pp. 1975, pp. 610—619.
- [12] Hirai, T. et al.: *Phytopathol.*, 58: 602—604, 1968.
- [13] 黄耿堂: 植物防疫, 28: 175—183, 1974.
- [14] 尹泰吉ら: 日本植物病理学会报, 34: 109, 1968.
- [15] 鶴岡崇士ら: 明治制菓研究所年報, 9: 1—4, 1967.
- [16] 莊村喬ら: 同上, 9: 5—10, 1967.
- [17] 野口昭久ら: 同上, 9: 11—16, 1967.
- [18] 野口昭久ら: 日本植物病理学会报, 34: 323—327, 1968.
- [19] 小疋吉久ら: 特許公報, 昭 47—18636, 1972.
- [20] 米原 弘ら: 同上, 昭 46—11049, 1972.
- [21] 安田 康ら: 日本植物病理学会报, 37: 1—10, 1971.
- [22] 宗像桂ら: 特許公報, 昭 49—45599, 1974.
- [23] 高橋信孝: 植物防疫, 28: 206—210, 1974.
- [24] 大石秀夫ら: 特許公報, 昭 49—11048, 1974.
- [25] Perlman, D.: *Amer. Soc. Microbiol. News*, 43: 82—89, 1977.
- [26] Takahashi, N.: *Proc. 1st Intersect. Congr. IAMS (Sci. Coun. Jap.)* 1975, pp. 472—481.
- [27] 深見順一: 第8回农药科学シンポジウム讲演要旨集, 1975, pp. 1—9。
- [28] Ando, K. et al.: *Proc. 1st Intersect. Congr. IAMS (Sci. Coun. Jap.)* 1975, pp. 630—640.
- [29] Sagawa, T. et al.: *J. Econ. Entomol.*, 66: 349—351, 1972.
- [30] 岩田秀式: 植物防疫, 28: 211—215, 1974.
- [31] Ishida, S. et al.: *Proc. 1st Intersect. Congr. IAMS (Sci. Coun. Jap.)* 1975, pp. 641—650.
- [32] Arai, M. et al.: *J. Ant.*, 29: 863—869, 1976.
- [33] Heneish, T. et al.: *J. Ant.*, 29: 870—875, 1976.
- [34] Perlman, D.: *Jap. J. Ant.*, 30(Suppl): S133—137, 1977.
- [35] Nora, T. et al.: *Jap. J. Ant.*, 30(Suppl): S174—189, 1977.