

文章编号: 0454-6296 (2000) 03-0264-07

# 光活化多炔类化合物对蚊幼虫的毒力

万树青<sup>1</sup>, 徐汉虹<sup>1</sup>, 赵善欢<sup>1</sup>, 尚稚珍<sup>2</sup>, 刘 准<sup>2</sup>

(1. 华南农业大学昆虫毒理研究室, 广州 510642;

2. 南开大学元素有机化学国家重点实验室, 天津 300071)

**摘要:** 采用自制的光活化实验装置, 测定了 11 个合成的多炔类化合物对致倦库蚊 *Culex quinquefasciatus* 4 龄幼虫的光活化毒力, 发现部分化合物在近紫外光照射条件下, 能明显地提高光活化毒杀效应, 测得化合物 5 (1-苯基-4-(3,4-亚甲基二氧) 苯基-丁二炔) 光照与未光照处理 LC<sub>50</sub> 分别是 0.35  $\mu\text{g}/\text{mL}$  和 8.89  $\mu\text{g}/\text{mL}$ 。实验中发现蚊虫先接触药后, 再进行光照处理, 才能较好地发挥毒效, 而且毒杀效应与光照时间呈正相关。模拟田间试验表明, 太阳光能显著提高化合物 5 毒杀蚊幼虫的药效。利用抗氧化剂进行猝灭作用试验, 间接地证明化合物 5 的光活毒杀机理是与过氧化作用有关。分析结构与活性关系, 发现二苯基-丁二炔衍生物比二烷基取代丁二炔活性高, 苯基上不同取代基也影响光活毒杀效果, 它们的活性顺序是: 亚甲基二氧基 > 甲氧基 > 邻硝基 > 间硝基 > 甲基酯。

**关键词:** 多炔类化合物; 致倦库蚊; 光活毒杀作用

**中图分类号:** Q965.9      **文献标识码:** A

多炔类 (Polyacetylenes) 化合物及其它的衍生物是一类非常重要的植物次生代谢产物, 这类化合物在化学结构上含有一个或多个乙炔基团。据 Otto<sup>[1]</sup>报道双子叶植物中 14 个科中含有 1 257 种多炔类化合物, 其中菊科植物含有 1 022 种, 从菊科植物鬼针草 *Bidens pilosal* 中分离的 7-苯基 2, 4, 6-庚三炔 (Phenylheptatriyne, PHT) 和从万寿菊 *Tagetes erecta* 中分离的由炔类化合物转化而来的  $\alpha$ -三噻吩 ( $\alpha$ -Terthienyl,  $\alpha$ -T) 是这类化合物的二个典型代表。研究表明: PHT 和  $\alpha$ -T 对许多昆虫具有拒食、忌避和抑制生长发育作用, 特别是对多种传病蚊虫、蝇类等具有显著的光活毒杀效应, 光活比为 18~555.6<sup>[2~5]</sup>。徐汉虹、赵善欢<sup>[6]</sup>从菊科植物猪毛蒿 *Artemisia scoparia* 中分离出茵陈二炔 (Capillene), 发现它对几种主要的贮粮害虫具有熏杀、忌避和抑制繁殖作用, 对斜纹夜蛾具有光活化毒杀作用。为了进一步研究多炔类化合物对害虫的光活化毒杀作用及其构效关系, 本研究以茵陈二炔为先导化合物, 人工合成了 9 个共轭二炔和 2 个单炔化合物, 选择我国重要的传病蚊虫致倦库蚊 *Culex quinquefasciatus* 作为研究试虫, 采用自制的光活化实验装置, 测定 11 个化合物对 4 龄蚊幼虫的光活毒力, 并在光活毒杀实验基础上加入几种具有猝灭作用的抗氧化剂, 初步研究光活毒杀机理和田间药效。

基金项目: 国家自然科学基金项目 (39870437) 和南开大学元素有机化学所国家重点实验室资助课题

收稿日期: 1999-04-25; 修订日期: 2000-01-15

# 1 材料和方法

## 1.1 试虫

致倦库蚊,广州市郊塘池采集,室内饲养在盛有1 000 mL水的搪瓷盆中,饲料为酵母粉和面粉(面粉经高温100℃烘2h)各半。培养温度(20±2)℃。每天光照16h。实验时选择4龄幼虫作为试虫。

## 1.2 供试化合物

9个共轭二炔和2个单炔化合物(表1),由南开大学元素所刘淮等合成。每种化合物含量≥95%。生测参比化合物为α-三噻吩(α-terthienyl, α-T),Sigma产品。

表1 化合物的代号、结构式、化学名称和熔点

Table 1 Tested compound number, structural formula, name and melting point

编号 Compound No.	结构式 Structural formula	名称 Name	熔点(℃) Melting point
1	$(\text{CH}_3)_3\text{C}-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-\text{C}(\text{CH}_3)_3$	1,4-二叔丁基-丁二炔 (1,4-di-t-butyl-diacetylene)	129~130
2	$(\text{CH}_3)_3\text{C}-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-\text{CH}_2\text{OH}$	1-叔丁基-4-羟甲基-丁二炔 (1-t-butyl-4-hydroxymethyl-diacetylene)	液体*
3	$\text{HOCH}_2-\text{C}=\text{C}-\text{C}=\text{C}-\text{CH}_2\text{OH}$	1,4-二羟甲基-丁二炔 (1,4-dihydroxymethyl-diacetylene)	112
4		1-苯基-4-对-甲氧基苯基-丁二炔 (1-phenyl-4-p-methoxyphenyl-diacetylene)	94~95
5		1-苯基-4-(3,4-亚甲基二氧)苯基-丁二炔 (1-phenyl-4-(3,4-methylenedioxy)-phenyl-diacetylene)	105~106
6		1-苯基-4-间硝基苯基-丁二炔 (1-phenyl-4-m-nitrophenyl-diacetylene)	147~148
7		1-苯基-4-邻硝基苯基-丁二炔 (1-phenyl-4-o-nitrophenyl-diacetylene)	152~153
8		1-苯基-4-苯甲酰氧甲基-丁二炔 (1-phenyl-4-phenylformyloxymethyl-diacetylene)	液体*
9		1-苯甲基-4-甲基-丁二炔 (1-benzyl-4-methyl-diacetylene)	液体*
10	$(\text{C}_2\text{H}_5\text{O})_2\text{P}(=\text{S})-\text{OCH}_2-\text{C}=\text{CH}$	O-炔丙基-硫代磷酸二乙酯 (di-ethyl-2-propynyl-phosphorothioate)	液体*
11	$\text{Br}-\text{C}=\text{C}-\text{CH}_2\text{OH}$	3-溴-2-丙炔-醇-1 (3-bromo-2-propyn-1-ol)	液体*

\* Liquid form

### 1.3 实验方法

**1.3.1 光活毒杀实验:** 光活化装置参考乐海洋方法<sup>[5]</sup>, 光源采用国产 YHG-20 荧光灯, 近紫外光波长 310~400 nm, 光强 1.3~1.5 W/m<sup>2</sup>。选择 4 龄蚊幼虫, 放入盛有受试药样的不同浓度药液 10 mL 培养皿 (直径 9 cm) 内, 每皿接 30 头幼虫, 每种处理重复 3 次, 置黑暗处 (25±2)°C 处理 12 h 后, 试验材料的一半, 经荧光灯下照 3 h, 再放入黑暗处, 24 h 后, 分别调查照射处理和未照射处理死亡情况, 计算死亡率, 用最小二乘法, 求出回归方程式, 求得 LC<sub>50</sub> 值。光活化毒力比 = 未经光照射处理的 LC<sub>50</sub> 值 / 光照射处理的 LC<sub>50</sub> 值。

在毒力测定的基础上, 选择活性高的化合物, 测定光照时间长短与光照不同处理方式对毒效的影响。设计光照时间分别是 50、100、150 min, 处理方式有: ①将药液先照射 3 h 后, 接入蚊幼虫置黑暗处, 24 h 后调查结果; ②将药液先照射 3 h 后, 接入蚊幼虫放入黑暗处 12 h, 然后照射 3 h, 24 h 后调查结果; ③将蚊幼虫置入药液中黑暗处 12 h, 然后再照射 3 h, 24 h 后调查结果。

**1.3.2 几种抗氧化剂对光活毒杀蚊幼虫影响的测定:** 参照 1.3.1 方法, 在配制好的药液中分别加入维生素 C、色氨酸和谷胱甘肽, 浓度为 200 μg/mL, 接入蚊虫后置黑暗中处理 12 h 后, 照射 3 h, 然后放入黑暗处, 24 h 后调查结果, 每种处理重复 3 次。

**1.3.3 太阳光对光活毒杀作用的影响测定:** 配成不同浓度的药液 200 mL, 放入玻璃杯内, 以不加药剂为对照, 每杯接 3~4 龄幼虫约 100 头, 每种处理重复 3 次, 光照组放在太阳光下照射 3 h, 然后放入室内; 未光照组放入室内 (室温 20°C ± 3°C), 24 h 后调查试验结果。

## 2 结果与分析

### 2.1 对致倦库蚊幼虫光活毒杀的毒力

光活毒力测定表明, 多数炔类化合物对致倦库蚊幼虫具有不同程度的光活毒杀作用 (表 1)。化合物 4 和 5 是受试的化合物中活性较高的化合物, 它们的光照与黑暗处理 LC<sub>50</sub> (μg/mL) 分别是 7.45、86.9 和 0.35、8.89, 光活化毒力比分别是 11.66 和 25.6。参比化合物 α-T 在相同的实验条件下, 光照与黑暗的 LC<sub>50</sub> (μg/mL) 分别是 0.47 和 3.19, 光活化毒力比是 6.82。比较毒力测定结果, 化合物 5 是一种较优良的光敏剂。

### 2.2 不同光照处理方式下化合物 5 与 α-T 毒杀蚊幼虫的效应

化合物 5 和 α-T 配成浓度为 1 μg/mL 药液, 采取 3 种处理方式, 发现仅有第 1 种处理方式即蚊幼虫接触药液后, 再进行光照处理, 才能达到光活毒杀效果, 采用这种处理, 化合物 5 和 α-T 的死亡率分别为 76.14% 和 92.50% (表 2)。而将药液先进行光照处理 3 h, 再接入蚊幼虫和药液光照后接蚊幼虫, 再进行光照处理 3 h, 后者二种处理毒杀效果显著低于第 1 种 (表 3)。实验结果表明, 光活毒素分子发挥毒效作用的条件是, 虫体吸收未经紫外光照射的药剂后再进行照射处理, 才能发挥毒杀作用。而经紫外光照射后, 毒素分子的结构可能发生某种程度的变化, 这种变化的分子破坏了它的光敏性, 因而降低了它的光活毒杀效应。

### 2.3 光照时间长短对化合物 5 和 α-T 光活毒杀效应的影响

化合物 5 和 α-T 配成浓度为 1 μg/mL, 接入 4 龄蚊幼虫后, 分别光照 50、100、150 min, 24 h 后调查。实验结果表明, 在一定时间范围内, 光活毒杀的效应与光照时间呈直线关系

表2 多炔类化合物对致倦库蚊4龄幼虫的光活毒力

Table 2 Phototoxicity of polyacetylene compounds against the 4th instar larvae of *C. quinquefasciatus*

化合物 Compound	紫外光 UV-A	回归方程 Regression equation	LC <sub>50</sub> (μg/mL) (X   SE)	光活化毒力比 Ratio of photoactivity
1	有	0.6444 + 2.7209x	39.8836   1.1324	1.6630
	无	3.1308 + 4.4633x	66.3280   1.0468	
2	有	-2.1328 + 4.3297x	42.1033   1.0525	1.1689
	无	-2.8080 + 4.6442x	48.7865   1.0495	
3	有	-3.3062 + 0.8959x	77.7342   1.3278	1.1256
	无	-2.6807 + 3.9550x	87.5000   1.0584	
4	有	-2.7434 + 2.5871x	7.4516   1.0808	11.6632
	无	5.7864 + 5.5627x	86.9092   1.0445	
5	有	5.8402 + 1.8027x	0.3469   0.0579	25.6241
	无	3.0356 + 2.0703x	8.8889   1.1154	
6	有	-0.8878 + 2.7758x	30.3003   1.0682	1.0861
	无	0.0111 + 3.3026x	32.9094   1.0597	
7	有	3.4456 + 1.8744x	7.6318   1.1141	2.2922
	无	2.1092 + 2.3259x	17.4934   1.0932	
8	有	0.9938 + 2.1548x	72.3099   1.0973	1.3164
	无	1.1034 + 1.9694x	95.1857   1.1451	
9	有	4.2269 + 1.3620x	3.6900   1.1392	2.5600
	无	0.7862 + 4.3206x	9.4467   1.0569	
10	有	0.4419 + 4.8218x	13.4463   1.0488	1.2070
	无	-0.2024 + 4.2248x	17.0371   1.0661	
11	有	-2.0639 + 4.7175x	31.4327   1.0444	1.1934
	无	-3.1304 + 5.1649x	37.5119   1.0430	
α-T	有	5.9400 + 2.8542x	0.4684   0.1438	6.8189
	无	3.4662 + 3.0412x	3.1940   1.2051	

(图1), 随着光照时间的延长, 二种化合物毒杀蚊幼虫的死亡率也提高。

#### 2.4 几种抗氧化剂对化合物5和α-T光活毒杀蚊幼虫的影响

化合物5和α-T分别配成浓度为1 μg/mL, 然后分别加入200 μg/mL的色氨酸、维生素C和谷胱甘肽, 接入试虫后, 光照3 h, 24 h后检测几种抗氧化剂对化合物5和α-T毒杀效果的影响。从表4可以看出谷胱甘肽能明显地降低化合物5的毒杀效应, 而色氨酸能明显降低α-T的毒杀效应, 同时谷胱甘肽和维生素C也不同程度地降低α-T的毒杀效应。分析实验结果表明, 二种光活毒素分子毒杀蚊幼虫的机制存在一定

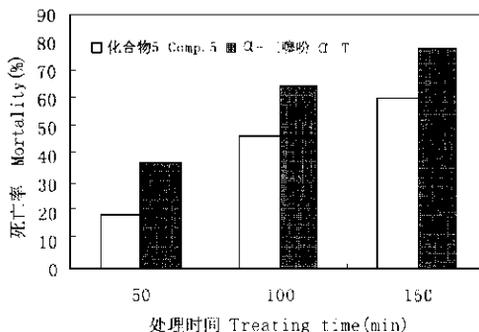


图1 不同光照时间, 化合物5 (1 μg/mL) 和α-T (1 μg/mL) 对致倦库蚊4龄幼虫的光活毒杀作用  
Fig.1 The phototoxicity of compound 5 (1 μg/mL) and α-T (1 μg/mL) to the 4th instar larvae of *C. quinquefasciatus* after different time of irradiation

表 3 不同光活处理, 化合物 5 和  $\alpha$ -T 对 4 龄蚊幼虫光活毒杀作用的比较

Table 3 The comparison of phototoxicities against 4th instar larvae of *C. quinquefasciatus* with compound 5 and  $\alpha$ -T in different tested methods

化合物 Compounds (1 $\mu$ g/mL)	处理方式 Treatment	死亡率 (%) Mortality (X   SE)
5	先接虫, 后进行光照处理	76.14   3.12
$\alpha$ -T	先接虫, 后进行光照处理	92.50   1.14
5	先光照, 后接虫	3.64   1.46
$\alpha$ -T	先光照, 后接虫	4.12   0.57
5	光照后接虫, 再光照	32.71   1.15
$\alpha$ -T	光照后接虫, 再光照	13.29   2.15

表 4 几种抗氧化剂对化合物 5 和  $\alpha$ -T 光活毒杀蚊幼虫效果的影响

Table 4 The effect of three antioxidants on phototoxicity of compound 5 and  $\alpha$ -T against 4th instar larvae of *C. quinquefasciatus*

抗氧化剂 Antioxidants (1 $\mu$ g/mL)	死亡率 Mortality (%)	
	化合物 5 (200 $\mu$ g/mL) (X   SE)	$\alpha$ -T (200 $\mu$ g/mL) (X   SE)
维生素 C vitamin C	100.00   0.00	72.08   2.54
色氨酸 tryptophane	92.00   4.12	34.13   3.15
谷胱甘肽 glutathione	64.80   1.21	60.22   2.13

差异。色氨酸是单线态氧 ( $^1O_2$ ) 的猝灭剂, 而谷胱甘肽是过氧化猝灭剂, 实验中加入色氨酸能降低  $\alpha$ -T 的毒杀效果, 说明  $\alpha$ -T 光活毒杀蚊幼虫的机理是与光诱导产生  $^1O_2$  有关, 这与许多文献报道结果一致<sup>[7,9,10]</sup>, 谷胱甘肽能降低化合物 5 的毒杀效果, 间接地表明化合物的作用

表 5 太阳光对化合物 5 和  $\alpha$ -T 光活毒杀蚊幼虫的影响

Table 5 The effect of sunlight on phototoxicity of compound 5 and  $\alpha$ -T against 4th instar larvae of *C. quinquefasciatus*

化合物 Compounds	浓度 Dosage ( $\mu$ g/mL)	死亡率 Mortality (%)	
		光照 Light (X   SE)	未光照 Dark (X   SE)
5	0.1	30.88   3.58	0.52   0.27
	0.5	81.03   2.22	11.40   1.16
	1	91.08   0.92	15.07   1.20
$\alpha$ -T	0.1	30.70   3.05	9.66   0.58
	0.5	97.51   1.27	33.89   0.89
	1	99.47   0.27	53.59   3.00
清水 Control	0	0.79   0.03	0.79   0.60

机理是与光诱导产生过氧化作用有关。  
2.5 太阳光对化合物 5 和  $\alpha$ -T 光活毒杀的影响

化合物 5 和  $\alpha$ -T 配成浓度为 0.1、0.5、1  $\mu$ g/mL 的药液, 分别接入试虫后, 一半置于室外直射的太阳光下照射 3 h 后放入室内, 另一半放入室内, 24 h 调查结果。实验结果表明, 太阳光能显著提高化合物 5 和  $\alpha$ -T 毒杀蚊幼虫的作用。随着药液浓度的提高, 毒杀效果也显著地提高 (表 5)。在 0.5  $\mu$ g/mL 浓度处理的情况下, 化合物 5 光照组的死亡率是 81.03%, 未光照处理组死亡率为 11.4%, 光照能提高活性 7.11 倍。

### 3 讨论

#### 3.1 多炔类化合物光活毒杀蚊幼虫的作用及其可能的作用机理

光活化毒杀作用是多炔类及其衍生物抗虫的主要特征之一。通过光活化毒杀致倦库蚊幼虫的毒力测定表明, 合成的多炔类化合物具有天然炔类化合物相似的杀虫性质, 特别是化合物 5, 它的光活毒杀效应与  $\alpha$ -T 的效果相当。化合物 5 的光活毒杀效应是与光因子紧密相关,

光是激活它的毒杀效应的重要因子，在近紫外光和太阳下能极大地提高化合物毒杀蚊幼虫的效应。在一定范围内，光照时间与毒杀效应呈正相关。但化合物 5 经光照后，可改变它的光敏性，降低或失去它的光活毒杀性质。

关于多炔类及其衍生物的光活毒杀机制已有许多文献报道<sup>[7]</sup>，已知  $\alpha$ -T 为 II 型光氧化剂，受光激发后，分子能量转移给处于基态的三线态氧 ( $^3\text{O}_2$ )， $^3\text{O}_2$  被激发形成具氧化能力的单线态氧 ( $^1\text{O}_2$ )， $^1\text{O}_2$  能作用于生物膜，引起膜的不饱和脂肪酸、甾醇、蛋白质 (酶) 等生物分子的氧化，继而破坏细胞结构，扰乱细胞的正常代谢，最终机体死亡。Arnasori<sup>[8]</sup> 提出多炔类化合物 PHT 的光活毒杀作用的游离自由基的模型。即：



当 PHT (P) 吸收光子后，形成激发态  $\text{P}^*$ ，随后形成游离自由基  $\text{P}^\bullet$ ，在生物体内产生毒性效应与多聚化反应。当光活毒杀试验中加入抗氧化剂时，发现化合物 5 与  $\alpha$ -T 的毒杀效应分别受不同的抗氧化剂所降低， $\alpha$ -T 主要受色氨酸的影响，而化合物 5 受谷胱甘肽的影响，间接地表明它们的作用机理存在差异。分析结果表明， $\alpha$ -T 在水溶液中光活毒杀机理主要是产生  $^1\text{O}_2$ ，但还存在过氧化作用，而化合物 5 主要为过氧化作用，但存在产生  $^1\text{O}_2$  的可能，而且，实验中发现两种化合物经光照处理后，接虫，再光照，发现化合物 5 的毒杀效果绝对值高于  $\alpha$ -T (表 3)。分析这种结果是否与它们光照后诱导产生的毒素分子的不同或半衰期差异有关。因此，化合物 5 光活化毒杀的光化学机理的直接证明还需进一步的研究。

### 3.2 多炔类化合物的化学结构与光活毒杀活性的关系

多炔类及其衍生物的光活毒杀效应的构效关系研究较多<sup>[9~10]</sup>，结论是噻吩类比乙炔类更具光敏性，提高分子中的噻吩环和炔键数目可提高光敏性，光活毒杀活性与化合物的辛醇-水分配系数的对数值和单线态氧产率呈正相关。比较分析光活毒杀实验的结果，发现二苯基-丁二炔衍生物 (化合物 4、5、6、7、8) 的活性一般比二烷基取代丁二炔高 (化合物 1、2、3) (表 1)，苯基上不同取代基也影响光活毒杀效果，它们的活性顺序为：亚甲基二氧基 > 甲氧基 > 邻硝基 > 间硝基 > 甲基酯。共轭二炔两侧取代基不同，改变化合物的理化性质，对于渗透昆虫体内与靶标位点结合起着重要作用。文献中大多数报道噻吩类比多炔类化合物光活毒杀效应好，而该研究结果发现化合物 5 的光活化毒力比却比  $\alpha$ -T 高，寻找其原因，从加抗氧化剂试验结果分析，这种化合物的光活机制是存在差异的，关于化合物 5 光活化毒杀蚊虫的生物学机理还有待进一步研究。

**致谢** 感谢中山医科大学钟作良教授鉴定蚊虫种名和蒋志胜博士参加部分实验。

### 参 考 文 献 (References)

- [1] Otto R Q. Evolution of polyacetylenes in sympetalae in micromolecular evolution systematics and ecology. An essay into a novel botanical discipline. New York: Springer-Verlay Berlin Heidelberg, 1982. 62~70
- [2] Wat C K, Prasad S K, Graham E A *et al.* Photosensitization of invertebrates by natural polyacetylenes. Biochem. System. Ecol., 1981, 9 (1): 59~62

- [3] Arnason T, Swain T, Wat C K *et al.* Mosquito larvicidal activity of polyacetylenes from species in the Asteraceae. *Biochem. System. Ecol.*, 1981, 9 (1): 63~68
- [4] Arnason J T, Philogene B J R, Berg C *et al.* Phototoxicity of naturally occurring and synthetic thiophene and acetylene analogues to mosquito larvae. *Phytochemistry*, 1986, 25 (7): 1 609~1 611
- [5] 乐海洋. 菊科物质对蚊虫和菜粉蝶光活化活性研究. 华南农业大学博士学位论文, 1995
- [6] 徐汉虹. 猪毛蒿精油的杀虫活性研究. 华南农业大学学报, 1993, 14 (1): 97~102
- [7] Hasspieler B M, Arnason J T, Downe A E R. Modes of action of the plant derived phototoxin  $\alpha$ -terthienyl in mosquito larvae. *Pesti. Biochem. Physiol.*, 1990, 38: 41~47
- [8] Arnason T, Wat C K, Downum K *et al.* Photosensitization of *Scherichiacolic* and *Saccharomyces cerevisiae* by phenylheptatriene from *Biden pilosa*. *Can. J. Microbiol.*, 1980, 26: 215~220
- [9] Marles R J. Thiophenes as mosquito larvicidal structure-toxicity relationship analysis. *Pesti. Biochem. Physiol.*, 1991, 41: 89~100
- [10] Marles R J. Quantitative structure-activity relationship analysis of natural products: phototoxic thiophenes. In: Fisher N H, Isman M B, Stafford H A eds. *Modern Phytochemical Methods. Recent Advance in Phytochemistry*, 1991, 25: 371~395

## Phototoxicity of synthetic polyacetylenes against mosquito larvae (*Culex quinquefasciatus*)

WAN Shu-qing<sup>1</sup>, XU Han-hong<sup>1</sup>, ZHAO Shan-huan<sup>1</sup>, SHANG Zhi-zhen<sup>2</sup>, LIU Zhun<sup>2</sup>

(1. Laboratory of Insect Toxicology, South China Agricultural University, Guangzhou 510642, China;

2. Institute of Elemento-Organic Chemistry, Nankai University, Tianjin 300071, China)

**Abstract:** Eleven new synthetic polyacetylenes were screened for their biological activity to the 4th instar larvae of the mosquito *Culex quinquefasciatus*. The toxicities of some compounds to the tested insects were found to be enhanced greatly by irradiation with near-UV. Compound 5 (1-phenyl-4-(3,4-methylenedioxy)-phenyl-diacetylene) is an effective photosensitizer, of which  $LC_{50} + UV-A$  (in the presence of UV-A) and  $LC_{50} - UV-A$  (in the absence of UV-A) to the larvae were  $0.35 \mu\text{g/mL}$  and  $8.89 \mu\text{g/mL}$  respectively. The ratio of photoactivity [ $(LC_{50} - UV-A) / (LC_{50} + UV-A)$ ] was 25.65. The results in simulated field experiment showed the phototoxicity of compound 5 also was enhanced greatly to the tested larvae by sunlight. The mortality of presence and absence of sunlight were 81.63 and 11.40 percent respectively. The result of preliminary experiment by adding different kinds of antioxidants showed the compound 5 belongs to the type of yielding superoxygen radical in organism and it differs from  $\alpha$ -terthienyl ( $\alpha$ -T) in the mechanism of photodynamic action. The analysis of structure-bioactivity shows that diacetylene of biphenyl-containing derivatives has higher activity in phototoxicity than diacetylene of bialkyl substitute. Different substitutes on phenyl also affect its effect, the order in activity is methylene dioxy > methoxy > o-nitro > m-nitro > methyl ester.

**Key words:** polyacethlenes; *Culex quinquefasciatus*; phototoxicity