

Ενώσεις που επιταχύνουν την έκδυση (molting accelerating compounds, MACs) ή αγωνιστές εκδυσόνης

Οι ενώσεις MAC ενεργούν ως εντομοκτόνα προκαλώντας μια πρόωρη, θανατηφόρο έκδυση στα έντομα-στόχους. Επειδή οι ενώσεις MAC μπορούν να επάγουν την έκδυση σε πολύ χαμηλότερες συγκεντρώσεις σε σύγκριση με τη φυσική ορμόνη, την 20-υδροξυ-εκδυσόνη (20E), και δεν αποβάλλονται αποτελεσματικά από το σώμα του εντόμου, το έντομο παραμένει εγκλωβισμένο στη διαδικασία της έκδυσης και πεθαίνει λόγω αφυδάτωσης και στέρησης τροφής.

Για την ανίχνευση των ενώσεων MAC αναπτύχθηκε ένα σύστημα που βασίζεται στην ενεργοποίηση ενός ευαίσθητου στην εκδυσόνη γονιδίου αναφοράς σε κυτταρικές σειρές εντόμων (1) και χρησιμοποιήθηκε για τον έλεγχο μιας συλλογής από περισσότερες των 200 ενώσεων διβενζοϋλυδραζίνης (2). Η δραστηριότητα των ενώσεων που αποδείχθηκαν πιο δραστικές κατά τη σάρωση αυτή επιβεβαιώθηκε σε δοκιμές τοξικότητας σε προνύμφες της φυτοφάγου κάμπιας της Μεσογείου,

Spodoptera

littoralis

(

3

).

Συστήματα ανίχνευσης αγωνιστών εκδυσόνης ή ενώσεων MAC αναπτύχθηκαν για είδη που ανήκουν στα λεπιδόπτερα (3), τα δίπτερα (4), τα κολεόπτερα (5,6) και τα οστρακόδερμα (7,8

). Πρόσφατα παρατηρήθηκε ισχυρή δραστηριότητα των ενώσεων διβενζοϋλυδραζίνης σε δοκιμές τοξικότητας έναντι προνυμφών του κουνουπιού που προκαλεί ελονοσία (*Anopheles gambiae*) (

9

).

1. Swevers, L., Kravariti, L., Ciolfi, S., Xenou-Kokoletsi, M., Ragoussis, N., Smagghe, G., Nakagawa, Y., Mazomenos, B., and Iatrou., K. (2004). A cell-based high-throughput screening system for detecting ecdysteroid agonists and antagonists in plant extracts and libraries of synthetic compounds. *FASEB J.* **18**, 134-136. [FASEB J. 10.1096/fj.03-0627fje](https://doi.org/10.1096/fj.03-0627fje).

2. Wheelock, C.E., Nakagawa, Y., Harada, T., Oikawa, N., Akamatsu, M., Smagghe, G., Stefanou, D., Iatrou, K., and Swevers, L. (2006). High-throughput screening of ecdysone agonists using a reporter gene assay followed by 3-D QSAR analysis of the molting hormonal activity. *Bioorganic & Medicinal Chemistry* **14**, 1143-1159.
3. Soin, T., De Geyter, E., Mosallanejad, H., Iga, M., Martín, D., Ozaki, S., Kitsuda, S., Harada, T., Miyagawa, H., Stefanou, D., Kotzia, G., Efrose, R., Labropoulou, V., Geelen, D., Iatrou, K., Nakagawa, Y., Janssen, C.R., Smagghe, G., and Swevers, L. (2010a). Assessment of species specificity of molting accelerating compounds in Lepidoptera: comparison of activity between *Boobyx mori* and *Spodoptera littoralis* by *in vitro* reporter and *in vivo* toxicity assays. *Pest Management Science* **66**, 526–535.
4. Soin, T., Swevers, L., Kotzia, G., Iatrou, K., Janssen, C.R., Rougé, P., Harada, T., Nakagawa, Y., and Smagghe G (2010b). Comparison of the activity of non-steroidal ecdysone agonists between dipteran and lepidopteran insects, using cell-based EcR reporter assays. *Pest Manag. Sci.* **66**, 1215-1229.
5. Soin, T., Masatoshi, I., Swevers, L., Rougé, P., Janssen, C.R., and Smagghe, G. (2009). Towards Coleoptera-specific high-throughput screening systems for compounds with ecdysone activity: development of EcR reporter assays using weevil (*Anthonomus grandis*)-derived cell lines and *in silico* analysis of ligand binding to *A. grandis* ligand-binding pocket. *Insect Biochem. Mol. Biol.* **39**, 523-534.

6. Ogura, T., Nakagawa, Y., Swevers, L., Smagghe, G., and Miyagawa, H. (2012). Quantitative evaluation of the molting hormone activity in coleopteran cells established from the Colorado potato beetle, *Leptinotarsa decemlineata*. *Pesticide Biochemistry and Physiology* **104**, 1–8.

7. Verhaegen, Y., Parmentier, K., Swevers, L., Rougé, P., Soin, T., De Coen, W., Cooreman, K., and Smagghe, G. (2010). The brown shrimp (*Crangon crangon* L.) ecdysteroid receptor complex: Cloning, structural modeling of the ligand-binding domain and functional expression in an EcR-deficient *Drosophila* cell line. *Gen. Comp. Endocr.* **168**, 415-423.

8. De Wilde, R., Swevers, L., Soin, T., Christiaens, O., Rougé, P., Cooreman, K., Janssen, C.R., and Smagghe, G. (2013). Cloning and functional analysis of the ecdysteroid receptor complex in the opossum shrimp *Neomysis integer* (Leach, 1814). *Aquat. Toxicol.* **130-131**, 31-40.