



(12) Wirtschaftspatent

Erteilt gemäß § 17 Absatz 1 Patentgesetz

(19) **DD** (11) **258 168 A1**4(51) **A 01 N 43/78****A 01 N 37/28****A 01 N 35/10****A 01 N 31/14****AMT FÜR ERFINDUNGS- UND PATENTWESEN**

In der vom Anmelder eingereichten Fassung veröffentlicht

(21) WP A 01 N / 300 359 2

(22) 02.03.87

(44) 13.07.88

(71) VEB Chemiekombinat Bitterfeld, Bitterfeld, 4400, DD

(72) Hölzel, Horst, Dr. rer. nat. Dipl.-Chem.; Creuzburg, Dörthe, Dr. rer. nat. Dipl.-Biol.; Stohr, Peter, Dipl.-Chem.;
 Dehne, Heinz, Prof. Dr. sc. nat. Dipl.-Chem.; Teller, Joachim, Dr. rer. nat. Dipl.-Chem.; Kranz, Lisa, Dipl.-
 Chem.; Luthardt, Horst, Dr. rer. nat. Dipl.-Chem.; Röthling, Tilo, Dr. rer. nat. Dipl.-Chem.; Kästner, Antje,
 Dipl.-Biochem., DD

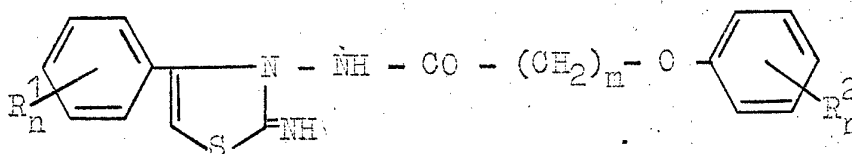
(54) **Mittel zur Regulierung von Stoffwechsel- und Wachstumsvorgängen**

(55) Mittel zur Regulierung des Stoffwechsels und von Wachstumsvorgängen, Seitentriebhemmung, Tabakanbau, substituierte 3-Acylamino-4-aryl-2-imino-thiazole

(57) Die Erfindung betrifft neue Mittel zur Regulierung von Stoffwechsel- und Wachstumsvorgängen, vorzugsweise zur Seitentriebhemmung landwirtschaftlicher Kulturen. So werden z. B. durch die Anwendung der erfindungsgemäßen Mittel im Tabakanbau erhebliche Ertrags- und Qualitätsminderungen durch Geiztriebe verringert. Außerdem tritt eine Ernteerleichterung ein. Als Wirkstoffe enthalten sie substituierte 3-Acylamino-4-aryl-2-imino-thiazole.

Patentanspruch:

Mittel zur Regulierung von Stoffwechsel- und Wachstumsvorgängen, vorzugsweise zur Seitentriebshemmung, **gekennzeichnet dadurch**, daß die Mittel neben üblichen Hilfs- und Trägerstoffen, Wirkstoffe der allgemeinen Formel



in der

m = 1, 2 oder 3

R¹ = H, Alkyl, eine Alkoxygruppe, Halogen oder eine Nitrogruppe

R² = eine Alkylgruppe, Wasserstoff, eine Nitrogruppe, eine OH-Gruppe oder Halogen

n = 1 oder 2 bedeuten,
enthalten.

Anwendungsgebiet der Erfindung

Die Erfindung betrifft Mittel zur Regulierung von Stoffwechsel- und Wachstumsvorgängen in Pflanzen und Pflanzenteilen, vorzugsweise zur Hemmung des Seitentriebwachstums landwirtschaftlicher und gärtnerischer Kulturen.

Charakteristik des bekannten Standes der Technik

Es ist bekannt, daß man aufgrund des derzeitigen Standes der Technik gezielt regulierend in die pflanzlichen Stoffwechsel- und Wachstumsvorgänge eingreifen kann. So können artifizielle Regulatoren an den verschiedensten Rezeptoren angreifen und in Abhängigkeit vom Entwicklungsstand der Pflanze, der Applikationsart, dem Applikationszeitpunkt, der Konzentration und Zubereitungsform des Wirkstoffes unterschiedliche Reaktionen im Stoffwechsel der Pflanzen auflösen. Daraus ergeben sich mannigfaltige praktische Anwendungsmöglichkeiten, wie zum Beispiel Hemmung oder Förderung der Seitentriebabbildung sowie des Austreibens von Knollen und Zwiebeln, Sproßtauchung, Beschleunigung der Keimung und Fruchtreife, Beeinflussung des Blütenansatzes und des Blühzeitpunktes, Auslösung von Blatt- und/oder Fruchtfall und gezielte Beeinflussung der Wasser- und Nährstoffaufnahme, des Transportes sowie der Bildung und Zusammensetzung von Inhalts- und Speicherstoffen in der Pflanze. Bekannt ist, daß eine Reihe artifizieller Stoffe wie zum Beispiel Chlormequat, Ethephon, Maleinsäurehydrazid, Paclobutrazol, Glyphosine, u. a. derartige Reaktionen in der Pflanze auslösen.

Synthetische Mittel, wie beispielsweise C₆-C₁₈-Carbonsäurealkylester (US-PS 3340040) oder Carbonsäureester (US-PS 319165, GB-PS 1236969, SU-PS 322866) werden zur Regulierung des Pflanzwachstums, vorzugsweise zur Hemmung der Seitentriebabbildung bei Tabak, in der Landwirtschaft eingesetzt. Zu diesem Zweck finden auch Kombinationen von langkettigen Fettalkoholen mit Carbamaten (US-PS 3824094) Verwendung. Geiztriebhemmende Wirkung besitzen auch einige synthetische Auxine, wie 2,4-D; NAA; 2,4,5-T.

Die genannten Mittel weisen in unterschiedlichem Maße Nachteile bzw. ökonomische Mängel auf (z. T. ungenügende biologische Wirksamkeit, zu geringe Kulturpflanzenverträglichkeit, hohe Wirkstoffaufwendungen, begrenzt verfügbare Ausgangsprodukte, aufwendige Synthesen). Außerdem erfüllen sie nicht in jedem Fall die Anforderungen in toxikologischer Hinsicht.

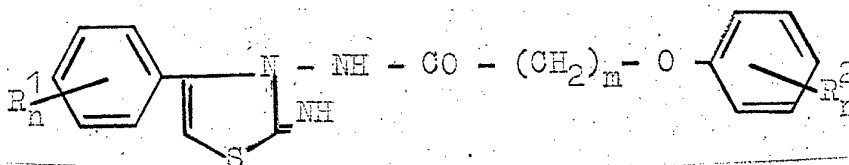
Das Ziel der Erfindung

Das Ziel der Erfindung besteht darin, wachstumsregulierende Mittel zu entwickeln, deren Wirkungen zur Ernteerleichterung beitragen.

Darlegung des Wesens der Erfindung

Die Aufgabe der Erfindung ist das Auffinden von neuen Mitteln zur Regulierung von Stoffwechsel- und Wachstumsvorgängen, die einerseits Auxinwirkung zeigen und andererseits auch zur Seitentriebshemmung geeignet sind.

Erfindungsgemäß wird diese Aufgabe dadurch gelöst, daß die neuen Mittel zur Regulierung von Stoffwechsel- und Wachstumsvorgängen als Wirkstoff Verbindungen der allgemeinen Formel



in der

m = 1, 2 oder 3

R¹ = H, Alkyl, eine Alkoxygruppe, Halogen oder eine Nitrogruppe

R² = eine Alkylgruppe, Wasserstoff, eine Nitrogruppe, eine OH-Gruppe oder Halogen

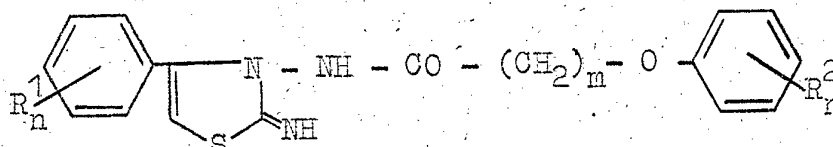
n = 1 bis 2 bedeuten,

enthalten, eine wachstumsregulatorische Wirkung aufweisen und neben üblichen Hilfs- und Trägerstoffen vorzugsweise zur Seitentriebhemmung Verwendung finden. Dabei können die Aufwandmengen 1 bis 5 kg Wirkstoff pro Hektar betragen. Die neuen erfindungsgemäßen Verbindungen zeigen im Rettichkotyledonentest (Standardtest) eine auxinanaloge Wirkung, die aber die Wirkung des Standards (IBS-Indolylbuttersäure) nicht ganz erreicht. Dagegen ist die Wirkung hinsichtlich Seitentriebhemmung ausgezeichnet.

Dabei wird der Standard Atrinal bei sehr guter Pflanzenverträglichkeit weit übertroffen. Die Seitentriebhemmung der neuen erfindungsgemäßen Mittel beträgt bei üblichen Anwendungskonzentrationen 100%, die vom Standard bei Konzentrationsvervielfachung nicht erreicht wird.

Die Herstellung der erfindungsgemäßen 3-Acylamino-4-aryl-2-iminothiazoline erfolgt durch Umsetzung von α -Thiocyanatoacetophenonen mit Carbonsäurehydraziden in organischen Lösungsmitteln in Gegenwart saurer Katalysatoren.

Tabelle 1: Erfindungsgemäße Wirkstoffe der allgemeinen Formel



Lfd. Nr.	R ¹	R ²	m	Schmelzpunkt(°C)
1.	4-CH ₃	4-Cl	1	167-169
2.	3,4-Cl ₂	2,4-Cl ₂	3	148-150
3.	4-Cl	2,4-Cl ₂	1	129-131
4.	4-NO ₂	2,4-Cl ₂	1	137-139
5.	4-OCH ₃	4-Cl	1	149-151

Die angeführten Verbindungen sind neu und in der Literatur noch nicht beschrieben.

Die neuen erfindungsgemäßen Mittel sind mit normalem Synthesaufwand herstellbar und zeigen ausgezeichnete Wirkungen. Sie sind mit geringerer Aufwandmenge einsetzbar bei guter Kulturpflanzenverträglichkeit. Die Seitentriebhemmung der erfindungsgemäßen Mittel beträgt bei üblichen Anwendungskonzentrationen 100%, die z. B. vom Standardpräparat Atrinal bei Vervielfachung der Aufwandmenge nicht erreicht wird.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können je nach ihrem Anwendungsgebiet in Form von Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulvern, Pasten oder Granulaten vorliegen. Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt. Die Applikation kann direkt auf die Pflanze erfolgen.

In den nachfolgenden biologischen Beispielen entsprechen die Wirkstoffbezeichnungen den Angaben aus Tabelle 1.

Ausführungsbeispiele

Die Beispiele sollen die Erfindung erläutern, ohne sie einzuschränken.

Beispiel 1

Cytokininanaloge Wirkung der erfindungsgemäßen Mittel

Von vorgekeimten Rettichsamen wurden Kotyledonen entnommen und das Frischgewicht von jeweils 10 Stück bestimmt.

Anschließend verbleiben die Kotyledonen mehrere Tage in der Testlösung unter Dauerlicht, bevor eine erneute Frischgewichtsbestimmung erfolgte. Es wurden die Differenzen zwischen Ausgangs- und Endgewicht bestimmt. Die erhaltenen Werte wurden denen der Wasserkontrolle und des Kinetins in Beziehung gebracht. Die als Äquivalentwerte ausgedrückten Ergebnisse wurden folgendermaßen berechnet:

$$\ddot{A} = \frac{\text{Kotyledonengew. in Testlsg.} - \text{Kotyledonengew. in aqua dest.}}{\text{Kotyledonengew. in Kinetinlsg.} - \text{Kotyledonengew. in aqua dest.}}$$

Beträgt der Äquivalentwert 1, entspricht die geprüfte Substanz in ihrer Wirkung dem Kinetin, ergibt sich der Wert 0, so ist die Substanz wirkungslos. Negative Werte zeigen eine Auxinwirkung an. In der Tabelle 2 sind die auxinanalogen Wirkungen der erfindungsgemäßen Wirkstoffe angegeben.

Tabelle 2: Rettichkotyledonentest

Wirkstoff	Konz. Gew.-%	Äquivalentwert
1	10^{-2}	-0,50
	10^{-3}	-0,42
	10^{-4}	-0,15
3	10^{-2}	-0,65
	10^{-3}	-0,44
	10^{-4}	-0,39
4	10^{-2}	-0,61
	10^{-3}	-0,53
	10^{-4}	-0,40
5	10^{-2}	-0,58
	10^{-3}	-0,45
	10^{-4}	-0,31
IBS	10^{-2}	-0,70
	10^{-3}	-0,61
	10^{-4}	-0,43

Beispiel 2 Geiztriebhemmung

3 Wochen alte Bohnenpflanzen (*Phaseolus vulgaris*) mit voll entwickelten Primärblättern und noch nicht ausgetriebenen Achselknospen werden 7 cm unter dem Blattansatz abgeschnitten. Die Blattachsen von 5 Explantaten werden in die Testlösung in der Konzentration $10^{-1}\%$ eingetaucht. Anschließend werden die Explantate in Bechergläser mit Nährlösung weiter kultiviert. Nach 12 Tagen werden die nicht ausgetriebenen Achseltriebe ausgezählt.

Tabelle 3:

Wirkstoff	Konz. in Gew.-%	nichtausgetriebene Seitentriebe	Seiten-triebe	Hemmung %
1.	10^{-1}	10	0	100
2.	10^{-1}	10	0	100
3.	10^{-1}	10	0	100
4.	10^{-1}	10	0	100
5.	10^{-1}	10	0	100
Atrinal	10^{-1}	5	5	50
(Dikegulac-Na)	5×10^{-1}	7	3	70

Tabelle 3 zeigt die ausgezeichnete Seitentriebhemmung der neuen erfindungsgemäßen Mittel im Vergleich zum Standard Atrinal. Sogar bei einer Erhöhung der Anwendungskonzentration von Atrinal um den Faktor 5 wird die Hemmungswirkung der erfindungsgemäßen Mittel nicht erreicht.