



AMT FÜR ERFINDUNGS- UND PATENTWESEN

(21) WP A 01 N / 292 543 7

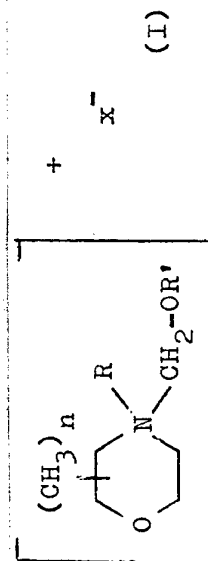
(22) 16.07.86

(44) 04.11.87

(71) VEB Fahlberg-List, Chemische und pharmazeutische Fabriken, Alt-Salbke 60/63, Magdeburg, 3013, DD
(72) Witek, Stanislaw, Prof. Dr., PL; Oswiecimska, Malgorzata, Dr., PL; Bakuniak, Edmund, Prof. Nauk Rolniczych, PL; Bakuniak, Irena, Dr. Nauk Rolniczych, PL; Lang, Sieghard, Dr. agr. Dipl.-Landw., DD; Michel, Hans-Jürgen, Dr. rer. nat. Dipl.-Chem., DD; Wozniak, Hartmut, Dr.-agr., DD; Klepel, Manfred, Dr. rer. nat. Dipl.-Chem., DD; Kühne, Sabine, Dipl.-Chem., DD

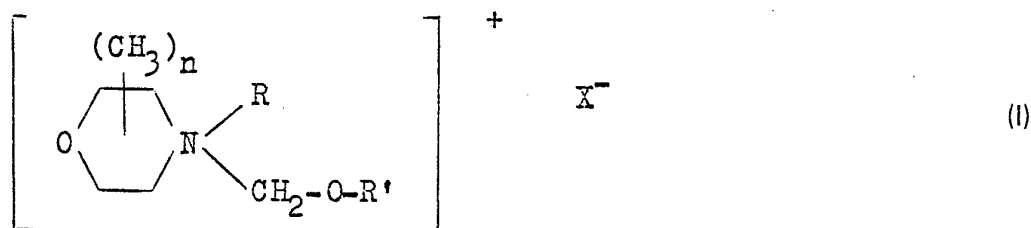
(54) Mittel zur Beeinflussung des Pflanzenwachstums und der Pflanzenentwicklung

(57) Die Erfindung betrifft neue Mittel zur Beeinflussung des Pflanzenwachstums bzw. der Pflanzenentwicklung von Kulturpflanzen, die als Wirkstoffe Morpholiniumsalze der allgemeinen Formel (I) enthalten, in der R und R' Alkylreste mit 1–18 C-Atomen sein können, n = 0 ist und X = Cl, Br oder J bedeuten. Je nach Substituentenmuster verfügen diese Verbindungen über Eigenschaften, wodurch sie sich zur Defoliation und Siccation, zur Geiztriebhemmung, zur Retardanz bei mono- und dikotylen Pflanzen, zur Ertragsbeeinflussung usw. eignen. Die Anwendung der erfindungsgemäßen Mittel erfolgt in den für Wachstumsregulatoren üblichen Zubereitungs- bzw. Ausbringungsformen. Formel I



Patentanspruch:

Mittel zur Beeinflussung der Pflanzenentwicklung, **dadurch gekennzeichnet**, daß sie eine oder mehrere Verbindungen der allgemeinen Formel I



in der R und R' Alkylreste mit 1–18 C-Atomen, die auch verzweigt sein können, n = 0 oder 2 sind und X: Cl, Br oder J bedeuten, neben üblichen Formulierungshilfsstoffen enthalten.

Anwendungsgebiet der Erfindung

Die Erfindung betrifft neue Mittel zur Beeinflussung des Pflanzenwachstums bzw. der Pflanzenentwicklung von Kulturpflanzen.

Charakteristik der bekannten technischen Lösungen

Wachstumsregulatoren üben vielfältige Wirkungen auf das Pflanzenwachstum aus. Sie können an den verschiedensten Rezeptoren angreifen und in Abhängigkeit vom Entwicklungsstadium der Pflanzen, der Applikationsart, dem Applikationszeitpunkt sowie von der Konzentration und Formulierung des Wirkstoffes sehr unterschiedliche Reaktionen im Stoffwechsel der Pflanzen auslösen.

Daraus ergeben sich vielfältige praktische Anwendungsmöglichkeiten, wie beispielsweise die Sproßstauchung bei mono- und dikotylen Pflanzen, die Beeinflussung des Blütenansatzes und des Blühzeitpunktes, die Beschleunigung der Fruchtreife, das Auslösen von Blatt- und/oder Fruchtfall, aber auch die Förderung oder Hemmung der Seitentriebbildung.

Die genannten Anwendungsbeispiele stellen nur einen Ausschnitt der bekannten Wirkungen dar.

Aus dem derzeitigen Stand der Technik sind eine Reihe artifiziereller Stoffe, wie Chlormequat, Ethepon, Thidiazuron, Paclobutrazol, Maleinsäurehydrazid, bekannt, die derartige Reaktionen in der Pflanze auslösen.

In der landwirtschaftlichen Praxis werden z. B. zur Hemmung der Seitentriebbildung, vorzugsweise bei Tabak, synthetische Mittel, wie C₆–C₁₈-Carbonsäurealkylester (US-PS 3340040) oder Carbonsäureester (US-PS 319165, GB-PS 1236969, SU-PS 322866), eingesetzt.

Des weiteren finden langkettige Fettalkohole und deren Kombinationen mit Carbamaten (US-PS 3824094) zu diesem Zweck Verwendung. Die genannten Präparate bewirken vorwiegend durch Verätzen (Kontaktmittel) ein Abtöten der freiliegenden Meristeme.

Synthetische Auxine, wie 2,4-D (SCHILTZ, R.; COSSIRAT, J.-C.: Annales de la Pirection des Etudes et de l'Equipement, SEITAZ, Paris 10 [1973], S. 75–84) und NAA (MIKHAILOVA, T. P.; BAKAY, E. P.: Chemie in der Landwirtschaft [russ.] Moskau 10 [1972], S. 41–43), aber auch Auxinanaloga (JA 6092202) oder Stoffe wie Maleinsäurehydrazid und PRIME (N-Ethyl-N-(2-chlor-6-fluorbenzyl)-2,6-dinitro-4-trifluormethyl-anilin) verfügen hingegen über einen systematischen Wirkmechanismus und sind von praktischer Bedeutsamkeit.

Ebenfalls für die Praxis vorgesehen, jedoch hauptsächlich unter dem Aspekt der Sproßstauchung bei Getreide angewendet, befinden sich die DMC (VRP 83116) sowie einige Morphiniumderivate (WAGENBRETH u. a., Fortschrittsberichte für die Land- und Nahrungsgüterwirtschaft, Bd. 19 [1981], Heft 5, S. 24–25).

In der PL-PS 106181 werden Alkoxymethylammoniumverbindungen als fungizide Mittel beansprucht.

Die genannten Mittel bzw. Kombinationen weisen in unterschiedlichem Maße durch z. T. ungenügende biologische Wirksamkeit bzw. Anwendungssicherheit Nachteile oder aber, aufgrund hoher Wirkstoffaufwendungen, begrenzt verfügbarer Ausgangsprodukte bzw. aufwendiger Synthesen, ökonomische Mängel auf. Außerdem erfüllen sie nicht in jedem Fall die Anforderungen in toxikologischer Hinsicht.

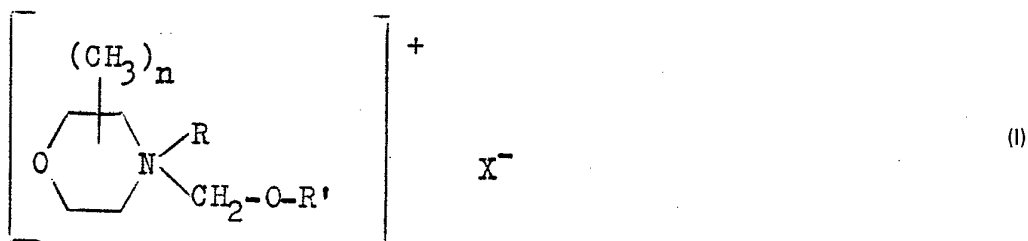
Ziel der Erfindung

Ziel der Erfindung ist es, das Wachstum oder die Entwicklung von landwirtschaftlichen und gärtnerischen Kulturen hinsichtlich der Verbesserung der Quantität und Qualität des Erntegutes sowie zur Ernteerleichterung bzw. -mechanisierung vorteilhaft zu beeinflussen.

Mit den erfindungsgemäßen Mitteln gelingt es, nachteilige Eigenschaften der bekannten Präparate, insbesondere hinsichtlich Anwendungssicherheit und biologischer Wirksamkeit, Ökonomie und Toxikologie, auszuschalten.

Darlegung des Wesens der Erfindung

Überraschender Weise wurde festgestellt, daß Verbindungen der allgemeinen Formel I



wobei R und R' Alkylreste mit 1–18 C-Atomen sind, die auch verzweigt sein können, n = 0 oder 2 ist und X: Cl, Br oder J bedeuten, über pflanzenwachstumsregulierende Eigenschaften verfügen, wobei sie sich je nach Substitutionsmuster zur Defoliation und Sikkation, zur Geiztriebhemmung, zur Retardanz bei mono- und dikotylen Pflanzen, zur Ertragsbeeinflussung usw. eignen. Dabei haben die genannten erfindungsgemäßen Mittel den Vorteil gegenüber bekannten Präparaten, daß sie neben ihrer verlässlichen Wirkung leicht und ökonomisch herstellbar sind, wobei die zur Erzielung des gewünschten biologischen Effekts erforderlichen Anwendungskonzentrationen nur gering sind und darüber hinaus toxikologische Unbedenklichkeit besteht. Die in Tabelle 1 zusammengestellten erfindungsgemäßen Verbindungen lassen sich nach bekannten Verfahren z. B. durch Quarternisierung von 4-Alkylmorpholininen bzw. 4-Alkyldimethylmorpholininen mit den jeweiligen Alkyl-chlormethylethern herstellen. Die erfindungsgemäßen Mittel können ggf. mit anderen Agrochemikalien kombiniert bzw. zusammen ausgebracht werden, wobei zweckmäßigerweise Aufwandmengen von 0,5... 10 kg/ha, vorzugsweise jedoch von 1... 6 kg/ha, angewandt werden.

Die Anwendung der erfindungsgemäßen Mittel erfolgt in den für Wachstumsregulatoren üblichen Zubereitungs- bzw.

Ausbringungsformen wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen und Konzentraten.

Diese Formulierungen werden unter Verwendung der geeigneten Hilfs- und Trägerstoffe wie Lösungsmittel, Emulgier- und Dispergiermittel sowie Trägerstoffe appliziert.

Die nachfolgenden Beispiele sollen die Erfindung erläutern ohne sie einzuschränken.

Beispiel 1: Defoliation und Sikkation

50 Masseteile der zu prüfenden Verbindung werden mit 15 Masseteilen Kieselgel und 25 Masseteilen Kaolin (als Trägerstoffe), 5 Masseteilen Alkylsulfonat (als Benetzungsmittel) und 5 Masseteilen Sulfitaublauge (als Dispergator) vermischt und vermahlen. Dieses Spritzpulver wird bei der Anwendung in Wasser suspendiert.

Die in den Beispielen genannten Anwendungskonzentrationen beziehen sich auf die Wirkstoffmenge. Für die weiteren Untersuchungen der biologischen Aktivität (Beispiele 3–5) wurden entsprechend diesem Beispiel die Zubereitungen hergestellt und angewendet.

3 Wochen alte Bohnensämlinge (*Phaseolus vulgaris*) werden zu Stecklingen mit jeweils 2 Primärblättern verarbeitet. Die Applikation erfolgt durch Eintauchen der Blätter in die Testlösung. Als Kriterium der Wirkung gilt die Anzahl der abgefallenen bzw. vertrockneten Blätter im Vergleich zur unbehandelten Kontrolle nach 6 Tagen. In Tabelle 2 sind diese Resultate zusammengefaßt.

Beispiel 2: Stauchung monokotyler Pflanzen

10 Masseteile der zu prüfenden Verbindung werden mit 0,3 Masseteilen Alkylarylpolglykolether und 89,7 Masseteilen dest. Wasser vermischt. Diese wäßrigen Zubereitungen werden auf die in Tabelle 2 angeführten Anwendungskonzentrationen verdünnt.

Die im Beispiel genannten Anwendungskonzentrationen beziehen sich auf den Wirkstoffgehalt.

Weizen- und Haferpflanzen werden nach 8tägiger Anzucht in Hydrokultur mit den erfindungsgemäßen Mitteln behandelt, indem die Blätter kurzzeitig in die Lösung derselben getaucht werden und die Wurzeln für 2 Tage in dieser Lösung verbleiben.

Die Auswertung erfolgt nach 14 Tagen. Als Kriterium der Wirkung dient die Länge des Scheinstengels zwischen dem 1. und 2. Blatt in Relation zur Kontrolle.

Die Ergebnisse des Versuches sind in Tabelle 3 dargestellt. Aus diesen Werten ist eine gute retardierende Wirkung der erfindungsgemäßen Mittel bei Getreide zu ersehen.

Beispiel 3: Geiztriebhemmung

Drei Wochen alte Bohnenpflanzen (*Phaseolus vulgaris*) mit voll entwickelten Primärblättern und noch nicht ausgetriebenen Achselknospen werden 7 cm unter dem Blattansatz abgeschnitten. Die Blattachseln von 5 Explantaten werden in die Testlösung mit einer Wirkstoffkonzentration von 10^{-1} Gew.-% eingetaucht. Anschließend werden die Explantate in Bechergläsern mit Wasser weiter kultiviert. Nach 12 Tagen werden die verätzten bzw. nicht ausgetriebenen Achseltriebe ausgezählt bzw. wird die Stauchung der Achseltriebe im Vergleich zur Kontrolle bestimmt.

Die Ergebnisse der Testung beinhaltet Tabelle 4.

Beispiel 4: Seitentriebhemmung bei Tabak (Gewächshaus)

Tabakpflanzen der Sorte „Canella“ werden im Gewächshaus kultiviert. Zu Beginn der Blüte erfolgt das Köpfen der Pflanzen mit anschließender Spritzapplikation des erfindungsgemäßen Mittels. Die Auswertung wird nach 14 Tagen durch Auszählen und Ermittlung der Frischmasse der Seitentriebe (0,5 cm) durchgeführt. Zur Feststellung der Ertragsbeeinflussung wird das Gewicht der oberen 3 Blätter bestimmt.

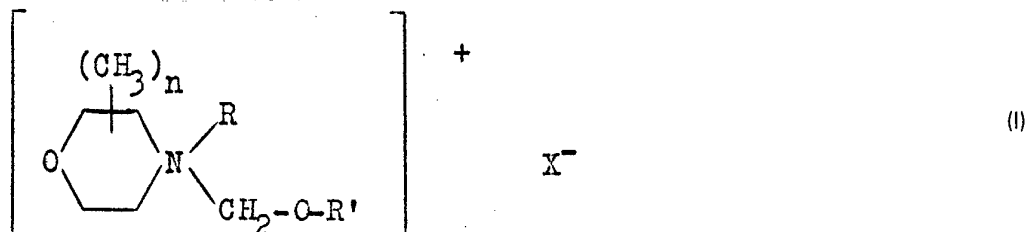
Das Ergebnis ist in Tabelle 5 dargestellt.

Beispiel 5: Seitentriebhemmung bei Tabak (Freiland)

In einem Freilandparzellenversuch werden Tabakpflanzen der Sorte „Korso“ zu Blühbeginn geköpft und unmittelbar danach mit dem erfindungsgemäßen Mittel bei einer Brüheaufwandmenge von 600 l pro Hektar (30 000 Pflanzen/ha) mittels Rückenspritze behandelt.

Die Auswertung erfolgt durch Bestimmung der Frischmasse der Seitentriebe sowie der 8 oberen Blätter zum Abschluß der Ernte.

Das Ergebnis zeigt Tabelle 6.

Tabelle 1:

Verbindung	R	R'	X	Fp. °C
1	2	3	4	5
1.	C ₃ H ₇	C ₄ H ₉	Cl	56–58 ⁺
2.	C ₃ H ₇	C ₅ H ₁₁	Cl	75–77 ⁺
3.	C ₃ H ₇	C ₆ H ₁₃	Cl	56–57 ⁺
4.	C ₃ H ₇	C ₁₄ H ₂₉	Cl	180–182,5
5.	C ₄ H ₉	C ₉ H ₁₉	Cl	213–215,5
6.	C ₅ H ₁₁	C ₆ H ₁₃	Cl	187–189
7.	C ₅ H ₁₁	C ₈ H ₁₇	Cl	194–195
8.	C ₅ H ₁₁	C ₉ H ₁₉	Cl	194–195,5
9.	C ₅ H ₁₁	C ₁₄ H ₂₉	Cl	195–196
10.	C ₇ H ₁₅	C ₂ H ₅	Cl	50,5–53,5 ⁺
11.	C ₇ H ₁₅	C ₄ H ₉	Cl	54–56 ⁺
12.	C ₇ H ₁₅	C ₅ H ₁₁	Cl	90–91 ⁺
13.	C ₇ H ₁₅	C ₆ H ₁₃	Cl	102,5–104,5
14.	C ₇ H ₁₅	C ₈ H ₁₇	Cl	94–95,5 ⁺
15.	C ₇ H ₁₅	C ₉ H ₁₉	Cl	167,5–169
16.	C ₇ H ₁₅	C ₁₀ H ₂₁	Cl	169–170,5
17.	C ₇ H ₁₅	C ₁₄ H ₂₉	Cl	169,5–171
18.	C ₈ H ₁₇	C ₂ H ₅	Cl	69–71,5 ⁺
19.	C ₈ H ₁₇	C ₃ H ₇	Cl	168,5–170
20.	C ₈ H ₁₇	C ₁₀ H ₂₁	Cl	167–169
21.	C ₈ H ₁₇	C ₁₂ H ₂₅	Cl	170–172
22.	C ₈ H ₁₇	C ₁₄ H ₂₉	Cl	168,5–170
23.	C ₈ H ₁₇	C ₁₆ H ₃₃	Cl	171–172
24.	C ₉ H ₁₉	C ₂ H ₅	Cl	60–63,5 ⁺
25.	C ₉ H ₁₉	C ₃ H ₇	Cl	73–75 ⁺
26.	C ₉ H ₁₉	C ₅ H ₁₁	Cl	88–90 ⁺
27.	C ₉ H ₁₉	C ₆ H ₁₃	Cl	62,5–65 ⁺
28.	C ₉ H ₁₉	C ₇ H ₁₅	Cl	108–111,5
29.	C ₉ H ₁₉	C ₁₂ H ₂₅	Cl	122–123
30.	C ₉ H ₁₉	C ₁₄ H ₂₉	Cl	153–155,5
31.	C ₁₂ H ₂₅	C ₂ H ₅	Cl	175–176,5
32.	C ₁₂ H ₂₅	C ₃ H ₇	Cl	176–178
33.	C ₁₂ H ₂₅	C ₄ H ₉	Cl	177,5–178,5
34.	C ₁₂ H ₂₅	C ₈ H ₁₇	Cl	174–175,5
35.	C ₁₆ H ₃₃	C ₅ H ₁₁	Cl	175–176
36.	C ₁₆ H ₃₃	C ₈ H ₁₇	Cl	183,5–185
37.	C ₃ H ₇	C ₈ H ₁₇	Cl	179–181
38.	C ₁₆ H ₃₃	C ₇ H ₁₅	Cl	180–181,5
39.	C ₁₂ H ₂₅ C ₁₄ H ₂₉ ⁺ (1:1)	C ₂ H ₅	Cl	—
40.	C ₁₀ H ₂₁ C ₁₈ H ₃₇ (techn. Gemisch)	C ₂ H ₅	Cl	—

⁺ Verbindung ist stark hygroskopisch

Tabelle 2: Defoliation und Sikkation unter Laborbedingungen

Verb. lfd. Nr. gem. Tabelle 1	Anwendungskonzentration in %	Anzahl der abgefallenen Keimblätter	Sikkative Blattfläche
Camposan	10^0	10	100
	10^{-1}	10	0
Endothal	10^{-1}	10	100
31	10^{-1}	6	75
4	10^0	8	100
	10^{-1}	3	0
25	10^0	10	100
	10^{-1}	—	—

Tabelle 3: Stauchung monokotyler Pflanzen

Getreideart	Verbindung (lfd. Nr. gem. Tab. 1)	Anwendungs-konzentration in %	Stauchung in % zur Kontrolle	Frischgewicht prozentual z. Kontrolle
Weizen	CCC	10^{-2}	45	-8
	31	10^{-2}	68	-46
	32	10^{-2}	68	-42
	33	10^{-2}	64	-33
	34	10^{-2}	64	-20
	25	10^{-2}	41	-25
	5 ×	10^{-3}	33	-15
Hafer	Camposan	10^{-2}	66	-17
	31	10^{-2}	73	-11
	33	10^{-2}	80	-11
	34	10^{-2}	71	-11
	25	10^{-2}	60	+87

Tabelle 4: Seitentriebhemmung bei *Phaseolus vulgaris* unter Laborbedingungen (Wirkstoffkonzentration $10^{-1}\%$)

Verbindung (lfd. Nr. gem. Tab. 1)	verätzt	nicht ausgetrieben	vorhanden	Stauchung (%)
Atrinal	—	2	8	50
31	—	8	2	+12
32	10	—	—	—
33	10	—	—	—
34	6	2	2	38
4	—	4	6	75
37	1	4	5	60
38	—	10	—	—

Tabelle 5: Seitentriebhemmung bei Tabak im Gewächshaus (relativ zur geköpften, unbehandelten Kontrolle, Kontrolle = 100)

Verbindung (lfd. Nr. gem. Tab. 1)	Aufwandmenge kg/ha	Anzahl lebender Seitentriebe	Frischmasse d. Seitentriebe	Frischmasse der oberen 3 Blätter
Maleinsäurehydrazid	1	100	7	102
Alkanole (C_6-C_9)	3,0 + 0,8	78	2	108
+ Maleinsäurehydrazid				
31	1,0	47	5	101
	1,5	14	2	109
	3,0	0	0	114
39	1,5	0	0	102
	3,0	2	1	103
40	1,5	30	5	105
	3,0	11	2	105

Tabelle 6: Seitentriebhemmung bei Tabak im Freiland (relativ zur geköpften, unbehandelten Kontrolle, Kontrolle = 100)

Verbindung (lfd. Nr. gem. Tab. 1)	Aufwandmenge kg/ha	Masse d. Seitentriebe	Masse der oberen 8 Blätter
Maleinsäurehydrazid	6,0	444	124
Alkanole (C ₆ -C ₉)			
+ Maleinsäurehydrazid	7,2 + 1,8	34	118
31	1,8	54	129
	4,0	28	142
	6,0	1,0	127
39	4,0	0	133
	6,0	0	123