

(19) DEUTSCHE DEMOKRATISCHE REPUBLIK



Wirtschaftspatent

Erteilt gemäß § 29 Absatz 1 des Patentgesetzes

PATENTSCHRIFT

ISSN 0433-6461

(11)

154 933

Int.Cl.<sup>3</sup>

3(51) A 01 N 43/54

AMT FUER ERFINDUNGS- UND PATENTWESEN

(21) WP A 01 N/ 221 622

(22) 06.06.80

(45) 05.05.82

- (71) AKADEMIE DER WISSENSCHAFTEN DER DDR BERLIN;DD;  
(72) SUESSE, MANFRED,DR. DIPL.-CHEM.;BERGNER, CHRISTOPH,DR.;  
JOHNE, SIEGFRIED,PROF. DR.SC. DIPL.-CHEM.;DD;  
(73) siehe (72)  
(74) ADW DER DDR, INSTITUT FUER BIOCHEMIE DER PFLANZEN, BFS, 4020 HALLE/SAALE,  
WEINBERG 3

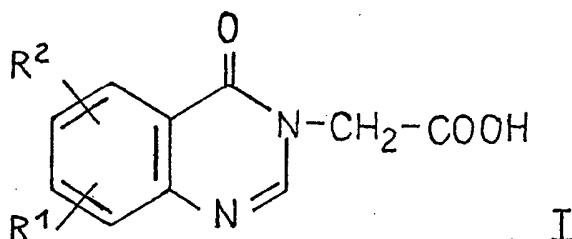
(54) MITTEL ZUR BEEINFLUSSUNG DES HABITUS VON KULTURPFLANZEN

(57)Ziel der Erfindung ist es, durch Veraenderung des Pflanzenhabitus eine Ertragssteigerung oder Qualitätsverbesserung bei Kulturpflanzen sowie technologische Erleichterungen bei Anbau, Vermehrung oder Ernte zu erreichen. Die Aufgabe wird geloest, indem Mittel eingesetzt werden, die Chinazolin-4-on-carbonsaeuren der allgemeinen Formel I und/oder ihre Ester oder Salze enthalten. Beispielsweise sind diese Mittel fuer die Beeinflussung des Laengenwachstums von Getreide oder dikotylen Kulturpflanzen,des Blatt-Wurzel-Verhaeltnisses bei Zuckerrueben oder zur Seitentriebfoerderung gaertnerischer Kulturen geeignet. - Formel I -

22 16 22 -1-

Mittel zur Beeinflussung des  
Habitus von Kulturpflanzen

Die Erfindung betrifft Mittel zur Beeinflussung des Habitus von Kulturpflanzen auf der Grundlage von Chinazolincarbonsäuren der allgemeinen Formel I und/oder ihren Estern oder Salzen.



Dabei sollen unter Kulturpflanzen alle landwirtschaftlichen Nutzpflanzen einschließlich Sonderkulturen, alle gärtnerischen Kulturen einschließlich Zierpflanzen und Obstkulturen sowie Forstgehölze verstanden werden.

Anwendungsgebiet der Erfindung

Die Beeinflussung des Habitus von Kulturpflanzen umfaßt verschiedene Effekte. So wird z.B. das Wachstum des Haupttriebes zugunsten des Nebentriebwachstums oder das Sproßwachstum zugunsten des Wurzelwachstums gehemmt. Derartige Wirkungen sind von vielfältigem praktischen Interesse. Unter anderem

können entsprechende Mittel zur Beeinflussung des Blatt-Wurzel-Verhältnisses bei Zuckerrüben oder zur Seitentriebförderung gärtnerischer Kulturen verwendet werden.

Die Erfindung ist für die Land-, Garten- und Forstwirtschaft von Bedeutung.

#### Charakteristik der bekannten technischen Lösungen

Es ist bekannt, daß eine Anzahl von Chinazolinderivaten biologisch wirksam ist. Darunter besitzen eine Reihe von 2,4-Dioxo-tetrahydrochinazolin- und 2,4-Dioxo-decahydrochinazolin-herbizide Wirkung, z.B. Decazolin (R. WEGLER "Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel", Bd. 5 Herbizide, Springer-Verlag Berlin-Heidelberg-New York 1977, S. 324). Auch 3-Alkylenimino-chinazoline zeigen herbizide Potenzen (GB-Patent 1 139 627).

Bestimmte Chinazolin-4-on-3-essigsäuren wurden von W. LEHR-SPLAWINSKI (Zeszyty Nauk Uniw. Jagiel., Ser. Nauk Mat.-Przyrod., Mat., Fiz., Chem. (6), 53 (1959)) auf ihre keimungshemmende Aktivität im Lepidium-Test untersucht. Es wurde gefunden, daß nur die 2-Methyl-6,8-dichlor-chinazolin-4-on-3-essigsäure in ihrer Aktivität dem 2,4-D vergleichbar ist.

Mittel zur Beeinflussung des Habitus von Kulturpflanzen auf der Grundlage von Chinazolinderivaten der allgemeinen Formel I und/oder von ihren Estern oder Salzen sind jedoch noch nicht bekannt.

Einige der Verbindungen der allgemeinen Formel I wurden bereits von verschiedenen Autoren synthetisiert (B.R. BAKER, M.V. QUERRY, A.F. KADISH, J.H. WILLIAMS, J. org. Chem. 17, 35 (1952); W. LEHR-SPLAWINSKI (Zeszyty Nauk Uniw. Jagiel., Ser. Nauk Mat.-Przyrod., Mat., Fiz., Chem. (6), 53 (1959)); S. JOHNE, B. JUNG, Pharmazie 33, 299 (1978)). Beispielsweise

werden Chinazolin-4-on-3-essigsäureester durch Reaktion eines Isatosäureanhydrids mit Glycinmethylester zum entsprechenden 2-Aminobenzoylglycinmethylester und dessen anschließende Cyclisierung mit Orthoameisensäuretriäthylester hergestellt. Durch saure Hydrolyse erhält man die entsprechenden freien Carbonsäuren.

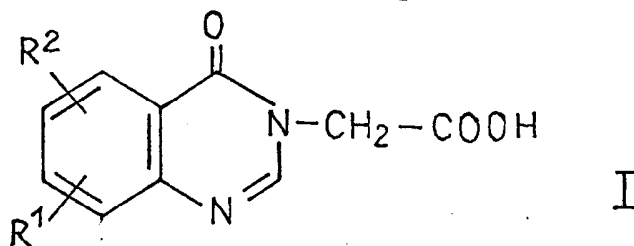
#### Ziel der Erfindung.

Es ist das Ziel der Erfindung, durch eine Veränderung des Pflanzenhabitus eine Ertragssteigerung oder Qualitätsverbesserung bei Kulturpflanzen sowie technologische Erleichterungen bei Anbau, Vermehrung oder Ernte zu erreichen.

#### Darlegung des Wesens der Erfindung

Die Aufgabe der Erfindung besteht darin, Mittel zu entwickeln, die eine Beeinflussung des Habitus von Kulturpflanzen hervorrufen.

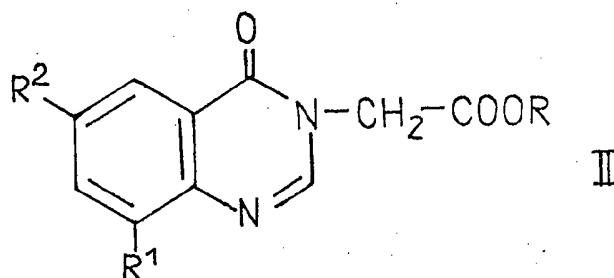
Überraschend wurde gefunden, daß Mittel, die als Wirkstoffe Chinazolin-4-on-carbonsäuren der allgemeinen Formel I



und/oder ihre Ester oder Salze enthalten, zur Beeinflussung des Habitus von Kulturpflanzen geeignet sind. In der Formel stehen  $R^1$  und  $R^2$  unabhängig voneinander für H, Halogen, niederes Alkyl ( $C_1 - C_4$ ), COOH oder COOR (R = z.B. niederes Alkyl). Bevorzugte Substitutionsorte für  $R^1$  und  $R^2$  sind die Positionen 6 und/oder 8 (vgl. Formel II).

Beispiele für erfindungsgemäß verwendbare Verbindungen der allgemeinen Formel II wurden in Tabelle 1 zusammengestellt.

Tabelle 1



|      | R               | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Schmp. (°C) |
|------|-----------------|----------------|----------------|-------------|
| (1)  | CH <sub>3</sub> | H              | H              | 152-54      |
| (2)  | H               | H              | H              | 247-49      |
| (3)  | CH <sub>3</sub> | H              | Br             | 173-74      |
| (4)  | H               | H              | Br             | 280-83      |
| (5)  | CH <sub>3</sub> | H              | Cl             | 162-64      |
| (6)  | H               | H              | Cl             | 277-79      |
| (7)  | CH <sub>3</sub> | Br             | Br             | 215-18      |
| (8)  | H               | Br             | Br             | 283-85      |
| (9)  | CH <sub>3</sub> | Cl             | Cl             | 224-27      |
| (10) | H               | Cl             | Cl             | 285-87      |

Die erfindungsgemäßen Mittel enthalten die üblichen Hilfs- und Zusatzstoffe, insbesondere flüssige oder feste Streck- oder Verdünnungsmittel und/oder oberflächenaktive Stoffe. Entscheidend für eine optimale Wirksamkeit der erfindungsgemäßen Mittel ist, daß die zugrunde liegenden Wirkstoffe mit geeigneten Dispergier- oder Trägerstoffen kombiniert werden, um ein maximales Eindringen in den Pflanzenkörper zu gewährleisten.

Außerdem können die erfindungsgemäßen Mittel mit bekannten Wachstumsregulatoren wie CCC, Dimethylmorpholiniumchlorid (DMC), Chloräthynphosphonsäuren, Pflanzenhormonen, Herbiziden, aber auch mit Dünge-, Pflanzenschutz- oder Bodenverbesserungsmitteln kombiniert werden. Durch additive oder synergistische Wirkung der Einzelkomponenten ergeben sich Vorteile hinsichtlich Anwendungs- und/oder Wirkungsbreite.

Die erfindungsgemäßen Mittel besitzen als Effektoren von Pflanzenwachstum und -entwicklung für verschiedene Gebiete der Pflanzenproduktion potentielle Bedeutung. So wird beispielsweise das Längenwachstum von Getreidepflanzen, aber auch von dikotylen Kulturpflanzen, beeinflusst. Appliziert man die erfindungsgemäßen Mittel in einem geeigneten Entwicklungsstadium auf die Pflanzen, so kommt es zur Veränderung des Pflanzenhabitus zugunsten der ertragsbildenden Organe. Dabei ist in Abhängigkeit von Dosierung, Anwendungszeitpunkt und Applikationsart eine praktisch bedeutungsvolle Beeinflussung nicht nur des Längenwachstums, sondern auch anderer Wachstums- und Entwicklungsprozesse möglich, wie z.B. Seitentriebhemmung bzw. -förderung, u.a. durch Beeinflussung der Apikaldominanz, Verminderung des Sproßwachstums zugunsten des Wurzelwachstums, Beeinflussung des Dickenwachstums sowie Regulierung von Blüten- bzw. Fruchtbildung. Unter anderem können die erfindungsgemäßen Mittel zur Beeinflussung des Blatt-Wurzel-Verhältnisses bei Zuckerrüben oder zur Seitentriefförderung gärtnerischer Kulturen verwendet werden.

Je nach ihrem Verwendungszweck können die erfindungsgemäßen Mittel als Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Pasten oder Granulate vorliegen. Diese Formulierungen werden durch Vermischen mit den Zusätzen hergestellt.

Die Wirkstoffe können in Form ihrer Formulierungen bzw. der daraus bereiteten Applikationsform oder ihrer Mischungen mit weiteren Komponenten in üblicher Weise angewendet werden, z.B. durch Gießen, Verspritzen, Versprühen oder Verstäuben auf die Pflanzen, auf Pflanzenteile oder in den Lebensraum der Pflanzen. Geeignete Applikationsformen sind beispielsweise wäßrige Lösungen, die durch übliche Dispergiermittel stabilisiert sind, Suspensionen, Emulsionen, Spritz- oder Stäubemittel oder Granulate. Die Wirkstoffkonzentrationen können in einem größeren Bereich in den für Phytoeffektoren üblichen Grenzen variiert werden.

Die erforderlichen optimalen Wirkstoffaufwandmengen sind je nach Pflanzenart und -sorte, Wirkstoffkomponente bzw. -kombination sowie in Abhängigkeit von Anwendungsart und -zeitpunkt unterschiedlich und differieren im Bereich von 0,1 bis 20 kg/ha, liegen aber im allgemeinen zwischen 0,5 und 10 kg/ha.

Die nachfolgenden Beispiele sollen die Erfindung erläutern, ohne sie einzuschränken.

Beispiel 1: Wachstumshemmung bei Gerstenpflanzen

Die Testpflanzen wurden in Plasteschalen mit einem Volumen von ca. 350 cm<sup>3</sup> angezogen. Als Substrat diente Quarzsand, dem Wasser und Nährstoffe zugemischt worden waren (je Schale 350 g Quarzsand, 40 ml H<sub>2</sub>O, 113 mg NH<sub>4</sub>NO<sub>3</sub>, 118 mg KCl, 51 mg MgSO<sub>4</sub> x 7 H<sub>2</sub>O, 111 mg CaHPO<sub>4</sub> x 2 H<sub>2</sub>O). Je Gefäß kamen 30 Getreidekörner (Sommergerste, cv. "Nadja") zur Aussaat. Die Anzucht erfolgte im Phytotron bei 18 °C und 12 Stunden Licht. Nach Entfalten des ersten Blattes wurden die Pflanzen mit einer Wirkstofflösung (50 % wäßriges Aceton) besprüht. Etwa 10 Tage nach der Applikation erfolgte die Auswertung. Durch Messung der Blattscheiden des ersten und zweiten Blattes ("Pseudostengel") wurde die Wuchshöhe der Pflanzen ermittelt (unbehandelte Kontrolle = 100 %).

Beispiele für die Wirksamkeit der Substanzen der allgemeinen Formel II enthält die Tabelle 2.

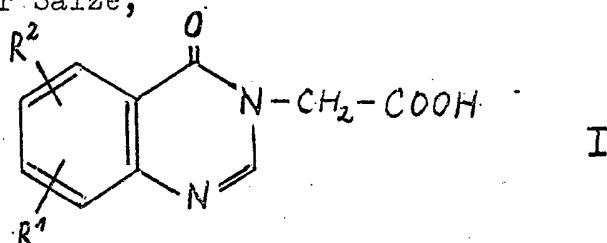
Tabelle 2

| Verbindung                     | Rel. Längenwachstum (%) |             |             |
|--------------------------------|-------------------------|-------------|-------------|
|                                | bei Konz.               |             |             |
|                                | $10^{-2}_m$             | $10^{-3}_m$ | $10^{-4}_m$ |
| (4)                            | 63,3                    | 79,6        | 93,9        |
| (3)                            | 73,5                    | 93,9        | 104,1       |
| (8)                            | 51,0                    | 71,4        | 87,8        |
| (6)                            | 65,3                    | 87,8        | 102,0       |
| (10)                           | 73,5                    | 89,8        | n.b.        |
| Ethephon (bekannter Wirkstoff) | 81,6                    | n.b.        | n.b.        |

n.b. = nicht bestimmt

Erfindungsanspruch

1. Mittel zur Beeinflussung des Habitus von Kulturpflanzen, dadurch gekennzeichnet, daß sie als Wirkstoffe Chinazolin-4-on-carbonsäuren der allgemeinen Formel I und/oder ihre Ester oder Salze,



- wobei  $R^1$  und  $R^2$  unabhängig voneinander für H, Halogen, niederes Alkyl ( $C_1-C_4$ ), COOH oder COOR stehen, neben üblichen Hilfs- und Zusatzstoffen enthalten.
2. Mittel nach Punkt 1, dadurch gekennzeichnet, daß sie Chinazolin-4-on-carbonsäuren der Formel I, in denen sich die Substituenten  $R^1$  und  $R^2$  in 6- und/oder 8-Stellung befinden, und/oder ihre Ester oder Salze enthalten.
  3. Mittel nach Punkt 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß sie flüssige oder feste Streck- oder Verdünnungsmittel und/oder oberflächenaktive Stoffe sowie gegebenenfalls weitere Dispergier- oder Trägerstoffe enthalten.
  4. Mittel nach Punkt 1, 2 oder 3, dadurch gekennzeichnet, daß sie andere Wirkstoffe, wie Wachstumsregulatoren, Phytohormone, Herbizide, Pflanzenschutzmittel, Düngemittel und/oder Bodenverbesserungsmittel enthalten oder gemeinsam mit ihnen angewandt werden.
  5. Verwendung der Mittel nach Punkt 1, 2, 3 oder 4, dadurch gekennzeichnet, daß man sie zur Beeinflussung des Habitus von Kulturpflanzen einsetzt.
  6. Verwendung der Mittel nach Punkt 1, 2, 3 oder 4, dadurch gekennzeichnet, daß man sie zur Beeinflussung des Blatt-Wurzel-Verhältnisses bei Zuckerrüben einsetzt.

7. Verwendung der Mittel nach Punkt 1, 2, 3 oder 4, dadurch gekennzeichnet, daß man sie zur Seitentriebsförderung in gärtnerischen Kulturen einsetzt.
8. Verwendung der Mittel nach Punkt 1, 2, 3 oder 4, dadurch gekennzeichnet, daß man sie zur Regulierung des Längenwachstums von Kulturpflanzen einsetzt.
9. Verfahren zur Herstellung der Mittel nach Punkt 1, 2, 3 oder 4, dadurch gekennzeichnet, daß die Verbindungen der allgemeinen Formel I und/oder ihre Ester oder Salze mit den Zusätzen vermischt werden.
10. Verfahren nach Punkt 9, dadurch gekennzeichnet, daß die Mittel gemäß Punkt 1, 2, 3 oder 4 als Lösungen, Suspensionen, Emulsionen, Pulver, Pasten oder Granulate formuliert werden.
11. Verwendung der Mittel nach Punkt 5 bis 8, dadurch gekennzeichnet, daß man die Mittel nach Punkt 1, 2, 3 oder 4 als wäßrige Lösungen, die durch übliche Dispergiermittel stabilisiert sind, Suspensionen, Emulsionen, Spritz- oder Stäubemittel oder Granulate appliziert.
12. Verwendung der Mittel nach Punkt 5 bis 8, dadurch gekennzeichnet, daß man als Aufwandmenge der Verbindungen der allgemeinen Formel I und/oder ihrer Ester oder Salze 0,1 bis 20 kg/ha, vorzugsweise 0,5 bis 10 kg/ha, einsetzt.