

(12) Wirtschaftspatent

Erteilt gemäß § 17 Absatz 1 Patentgesetz

PATENTSCHRIFT

(19) DD (11) 280 031 A1

4(51) A 01 N 41/04
A 01 N 53/06
A 01 N 33/18

PATENTAMT der DDR

In der vom Anmelder eingereichten Fassung veröffentlicht

(21) WPA 01 N / 326 010 8 (22) 24.02.89 (44) 27.06.90

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

(72) Hofferek, Horst, Dr. rer. nat. Dipl.-Chem.; Lyr, Horst, Prof. Dr. sc.; Noll, Bernd, Dr. rer. nat. Dipl.-Chem.; Keil, Siegfried, Dr. rer. nat. Dipl.-Chem.; Kochmann, Werner, Prof. Dr. rer. nat. Dipl.-Chem., DD

(54) Mittel zum Schutz von Kultur- und Nutzpflanzen gegen pilzliche Pathogene

(55) Mittel zum Schutz von Kultur- und Nutzpflanzen gegen pilzliche Pathogene; Gelbrost; Zwergrost;

4,4'-Diamino-stilben-2,2'-disulfonsäure;

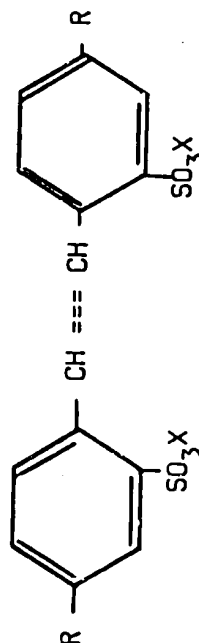
4,4'-Dinitro-stilben-2,2'-disulfonsäure

(57) Die Erfindung betrifft Mittel zum Schutz von Kultur- und Nutzpflanzen gegen pilzliche Pathogene.

Erfindungsgemäß sind sie gekennzeichnet durch einen Gehalt an einer oder mehreren Verbindungen der allgemeinen Formel, in der

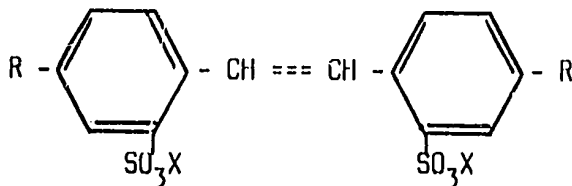
R = NH₂ oder NO₂ undX = Na, K, NH₄ oder aliphatisches Amin

bedeuten. Formel



Patentanspruch:

Mittel zum Schutz von Kultur- und Nutzpflanzen gegen pilzliche Pathogene, gekennzeichnet dadurch, daß sie sich neben üblichen Hilfs- und Zusatzstoffen durch einen Gehalt an einer oder mehreren Verbindungen der allgemeinen Formel



in der

R = NH₂ oder NO₂ und

X = Na, K, NH₄ oder aliphatisches Amin bedeuten, auszeichnen.

Anwendungsgebiet der Erfindung

Die Erfindung betrifft Mittel zur Erhöhung der Widerstandsfähigkeit von Kultur- und Nutzpflanzen gegen pilzliche Pathogene. Die Mittel im Labor- und Gewächshausbereich sowie im Feld – unter praktischen Anbaubedingungen – Anwendung gegen verschiedene Infektionskrankheiten, wie zum Beispiel

- | | |
|----------------------|---|
| a) Gelbrost | (<i>Puccinia striiformis</i> West.) |
| – Gerste | (<i>Hordeum vulgare</i> L.) |
| – Weizen | (<i>Triticum aestivum</i> L.) |
| b) Zwergrost | (<i>Puccinia hordei</i> Otth.) |
| – Gerste | (<i>Hordeum vulgare</i> L.) |
| c) Mehltau | (<i>Erysiphe graminis</i> DC.) |
| – Gerste | (<i>Hordeum vulgare</i> L.) |
| – Weizen | (<i>Triticum aestivum</i> L.) |
| – Roggen | (<i>Secale cereale</i> L.) |
| – Hafer | (<i>Avena sativa</i> L.) |
| d) Braunrost | (<i>Puccinia triticina</i> Erikss.) |
| – Weizen | (<i>Triticum aestivum</i>) |
| e) Braunrost | (<i>Puccinia dispersa</i> Erikss.) |
| – Roggen | (<i>Secale cereale</i> L.) |
| f) Bohnenrost | (<i>Uromyces phaseoli</i> [Pers.] Wint.) |
| – Bohne | (<i>Phaseolus vulgaris</i> L.) |
| g) Erbsenrost | (<i>Uromyces pisi</i> [Pers.] de By.) |
| – Erbse | (<i>Pisum sativum</i> L.) |
| h) Mehltau | (<i>Erysiphe cichoracearum</i> DC.) |
| – Gurke | (<i>Cucumis sativus</i> L.) |
| i) Grauschimmelfäule | (<i>Betrytis cinerea</i> Pers.) |
| – Tomate | (<i>Lycopersicon esculentum</i> L.) |
| – Erdbeere | (<i>Fragaria grandiflora</i> L.) |
| – Gurke | (<i>Cucumis sativus</i> L.) |
| j) Mehltau | (<i>Erysiphe betae</i> [Vanha] Weltzien) |
| – Rübe | (<i>Beta vulgaris</i> L.) |
| k) Nelkenrost | (<i>Uromyces caryophyllinus</i> Wint.) |
| – Nelke | (<i>Dianthus caryophyllus</i> L.) |
| l) Chrysanthemenrost | (<i>Puccinia horiana</i> P. Henn.) |
| – Chrysantheme | (<i>Chrysanthemum indicum</i> L.) |

Charakteristik des bekannten Standes der Technik

1. Direkte Schaderregerbekämpfung

Mit den herkömmlichen Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmitteln (PSM – vgl. KEMPTER, G.; JUMAR, A.: Chemie organischer Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, 2. Aufl., Berlin 1983) und Verfahren zur direkten Schaderregerbekämpfung können längst nicht alle Infektionskrankheiten befriedigend bekämpft werden. Der Einsatz von Pflanzenschutzmitteln wird besonders durch das Auftreten von Resistenz im Pathogenbestand beschränkt; mit den Erfolgen der Resistenzzüchtung geht auch eine zunehmende Selektion von Erregerstämmen (Pathotypen) einher, die gegenüber Pflanzenschutzmitteln resistent geworden sind. – Der Anwendung von PSM zur direkten Schaderregerbekämpfung stehen zunehmend ökologische und toxikologische, zum Teil auch ökonomische Probleme entgegen.

Eine Erhöhung der PSM-Produktion gewährleistet noch keine Verbesserung im Pflanzenschutz. Die letzten Jahre haben eindringlich gezeigt, welche, ökologischen Probleme ein unbedachter und unkontrollierter Einsatz von Pestiziden (z. B. Insektizide, Herbizide) ergeben kann; auch die Entwicklung neuer Pestizide dieser Art kann nicht als echter Ausweg angesehen werden. Die konventionellen PSM dürften aber noch auf lange Sicht ihre hohe wirtschaftliche Bedeutung im wesentlichen behalten.

Die angeführten Nachteile der direkten Schaderregerbekämpfung zwingen zur Erforschung prinzipiell neuer Methoden des Pflanzenschutzes und der Schädlingsbekämpfung bzw. zur Ausschau nach weiteren Rationalisierungsmöglichkeiten. Alternativen bieten die Verfahren zur Erhöhung der Widerstandsfähigkeit der Pflanzen. Zu diesen Verfahren zählt vor allem die Züchtung resistenter Sorten. Der Einsatz solcher Sorten ist mit dem Problem der Resistenzüberwindung durch virulente Pathotypen, deren Selektion unter modernen Anbaubedingungen begünstigt sein kann, belastet.

2. Erhöhung der Widerstandsfähigkeit der Pflanzen

Die ökonomisch wichtigen Infektionskrankheiten der Kultur- und Nutzpflanzen lassen sich heute mit chemischen Mitteln praktisch noch nicht umfassend bekämpfen.

Alternativen bieten die Verfahren zur Erhöhung der Widerstandsfähigkeit der Pflanzen; hierzu zählen die Züchtung resistenter Sorten und die Induktion von Krankheitsresistenz (Resistenzaktivierung).

2.1. Züchtung resistenter Sorten:

Mit den großen Erfolgen der Resistenzzüchtung geht auch eine zunehmende Selektion von Erregerassen (Pathotypen) einher; durch natürliche Auslese – Gegenauslese von Pathogenen – wird die Resistenz neuer Pflanzenformen durchbrochen. Ferner wird es auf einigen Gebieten der Pflanzenzüchtung immer schwerer, die Forderungen nach hohen Erträgen und guter Qualität züchterisch gleichzeitig mit hohen Resistenzeigenschaften zu koppeln.

2.2. Induktion von Krankheitsresistenz:

Im Prinzip bietet der Aspekt der Aktivierung natürlicher Abwehrsysteme (durch ein ökonomisch sinnvolles und ökologisch vertretbares Verfahren) völlig neue Möglichkeiten der Kontrolle von Pflanzenkrankheiten. Für den heutigen Pflanzenschutz stellt sich somit die Frage, ob praktikable Mittel und Verfahren zur Erhöhung der Widerstandsfähigkeit von Kultur- und Nutzpflanzen – ohne genetische Eingriffe – entwickelt werden können. Ein Schlüsselproblem ist die Art und Weise, in der eine dauerhafte Einführung eines Resistenz induzierenden Prinzips in einen Pflanzenbestand gelingt.

Bisher haben sich Resistenzinduktoren – Stoffe, die geeignet sind, Resistenzmechanismen in Pflanzen zu aktivieren – mikrobieller Herkunft als besonders wirksam erwiesen, doch es ist über deren chemischen Natur kaum berichtet worden; man verwendet z. B. als Induktorkulturen nicht aufbereitete Kulturfiltrate von Kulturen bestimmter Bakterien (*Bacillus subtilis*, *Pseudomonas aeruginosa*), die als Produzenten des Resistenzinduktors erfaßt worden waren (SCHÖNBECK, F.; DEHNE, H.-W.; BALDER, H.: Zur Wirksamkeit induzierter Resistenz unter praktischen Anbaubedingungen. I. Echter Mehltau an Reben, Gurken und Weizen. Z. Pflanzenkrankheiten und Pflanzenschutz [1982] 89, 177–184). Es zeigte sich, daß Pflanzenbestände auch unter praktischen Anbaubedingungen vor Infektionen mit Hilfe des Phänomens der Resistenzinduktion geschützt werden können.

Felderproben dieser Art wurden vor allem von F. SCHÖNBECK und Mitarb. (Universität Hannover/BRD) durchgeführt. Allerdings steht die Entwicklung, die solche Modelle für den Pflanzenschutz anwendbar macht, noch am Anfang; vgl. BEICHT, W.: Wie „immunisiert“ man Pflanzen? Naturwiss. Rundschau (1984) 37, H. 8, 309–312. – Der Nachteil dieser Lösungen ergibt sich aus der Forderung nach definierten Wirkstoffen bzw. standardisierten Substanzgemischen; aufwendige Reinigungsoperationen dürften hier mit erheblichen Kosten verbunden sein.

In vielen Modellen gelang auch die Resistenzinduktion durch eine leichte Erstinfektion mit dem Erreger; durch Kontakt der Pflanze mit anderen Pathogenen oder schwach virulenter Erregerassen. Die Ausbringung eines Erregers in einen Pflanzenbestand erscheint jedoch für die Praxis kaum brauchbar, was unter anderem wohl die geringe Bedeutung des Verfahrens in der Vergangenheit erklärt (SEQUEIRA, L.: the acquisition of systemic resistance by prior inoculation. In: J. M. DALY; J. URITANT: Recognition and specificity in plant host-parasite interactions. Japan Scient. Soc. Press. Tokyo 1979).

Neben diesen Darstellungen gibt es weitere, jedoch weniger praxisorientierte Studien über das Phänomen der induzierten Resistenz; zahlreiche Fälle von induzierter Resistenz gegen pilzliche, bakterielle und virale Krankheiten sind in der Literatur dokumentiert. Um Resistenz zu induzieren, wurden nichtpathogene Rassen von Pathogenen, Nichtpathogene des Wirtes, Pathogene sowie Stoffwechselprodukte von Wirten oder von infektiösen Agenzien verwendet (zusammenfassende Darstellungen u. a. bei BEICHT, W.: Untersuchungen zur Induktion von Resistenzmechanismen in Pflanzen durch mikrobielle Stoffwechselprodukte., Diss. Univ. Hannover 1981).

KUC, J.: Multiple mechanisms, reaction rates and induced resistance in plants. In: R. C. STAPLES; G. H. TOENIENSEN (Eds.): Plant disease control – resistance and susceptibility. John Wiley & Sons, New York, Chichester, Brisbane, Toronto 1981. S. 259–272.

WOOD, R. K. S.: Active defense mechanisms in plants, New York: Plenum, 1982, 1–381).

In den letzten Jahren sind Fortschritte bei der Erfassung bzw. Isolierung und Identifizierung (Strukturaufklärung) von pflanzlichen Resistenzinduktoren erzielt worden (cf. HOFFEREK, H.: Neue Zugänge zur Biochemie und Physiologie der Krankheitsresistenz der Pflanzen. Schriftenreihe „Vorträge aus dem Bereich der AdL“, 1983, H. 1, 35–60); solche Metabolite liegen aber in sehr geringen Konzentrationen in der Pflanze vor, so daß im günstigsten Fall nur Konzeptionen für die Synthese von Strukturanaloga praxisrelevant sein dürften (s. auch JENNS, A.; KUC, J.: Graft transmission of systemic resistance of cucumber against *Colletotrichum lagenarium*. *Physiol. Plant Pathol.* [1979] 69, 753–756).

Die Wirkstoffforschung in der PSM-Industrie führte zu der Entdeckung, daß ein an sich bekanntes Fungizid – die Verbindung 2,2-Dichlor-3,3-dimethyl-cyclopropan-carbonsäure (WL 28325) – gegenüber dem Erreger der Reisbräune, *Piricularia oryzae*, Resistenz zu induzieren vermag (LANGCAKE, P.; CARTWRIGHT, D.; RIDE, J. P.: The dichlorocyclopropanes and other fungicides with indirect mode of action. In: Systemic Fungicides and Antifungal Compounds, proceedings of a symposium, Reinhardtbrunn, DDR, ed. H. Lyr; C. POTTER. Akademie Verlag Berlin 1981); es wurden weitere Dichlorocyclopropan-Derivate mit einer entsprechenden indirekten Wirkung aufgefunden. Es zeigte sich, daß antifungale Agenzien durch Beeinflussung des pflanzlichen Stoffwechsels wirken können. Andere Beispiele für einen indirekten Wirkungsmodus von Fungiziden sind beschrieben worden (WADE, M.: Antifungal agents with an indirect mode of action. In: A. P. J. TRINCI; J. F. Ryley (Eds.): Made of action of antifungal agents. Cambridge University Press. Cambridge, London, New York 1984, S. 283–298); es sind u. a. die Mittel Aliette, Phenylthioharnstoff, Probenazol. Solche „Fungizide“ (wozu auch die o. g. Substanz WL 28325 zählt) induzieren in der

Pflanze die Synthese von bestimmten Abwehrstoffen (Phytoalexine). Die gleiche Reaktion kann jedoch auch durch andere, sogenannte Streßfaktoren – wie Kälte, UV-Strahlung, Quecksilbersalze, diverse anorganische bzw. organische Substanzen – ausgelöst werden; der Effekt – im Prinzip seit langem bekannt – ist unspezifisch und für die Pflanze in physiologischer Hinsicht stark belastend. Weitere Nachteile sind: Störung des Entwicklungsprozesses der Pflanze (Ertragsverluste, Qualitätsverlust), ökologische und toxikologische Probleme.

Für den praktischen Pflanzenschutz haben die indirekten Wirkungsmechanismen von Fungiziden bislang keinerlei besondere Bedeutung; solche Mittel genügen nicht den hohen Forderungen, die mit Recht an moderne Pflanzenschutzmittel gestellt werden.

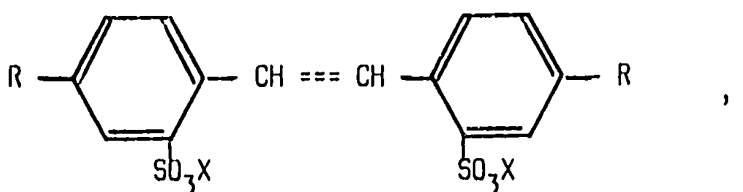
Ziel der Erfindung

Das Ziel der Erfindung sind neue Mittel zum Schutz gegen pathogene Pilze bei Kultur- und Nutzpflanzen, wodurch der Entwicklung bzw. Ausbreitung von Schaderregern – der Verbreitung pilzlich bedingter Pflanzenkrankheiten bei landwirtschaftlichen und gärtnerischen Kulturen – wirksam begegnet werden soll.

Darlegung des Wesens der Erfindung

Es bestand somit die Aufgabe, durch physiologisch unbedenklich verwendbare, synthetisch erzeugte, chemische Mittel eine wirksame Bekämpfung von pilzlichen Infektionskrankheiten bei Kultur- und Nutzpflanzen, insbesondere bei Getreidearten zu ermöglichen mit ökologischen Vorteilen und hohem Nutzen bei der Erhöhung und Stabilisierung von Erträgen ohne genetische Eingriffe und ohne Anwendung toxischer Pflanzenschutzmittel.

Diese Aufgabe wird erfindungsgemäß dadurch gelöst, daß sich die Mittel zum Schutz von Kultur- und Nutzpflanzen gegen pilzliche Pathogene neben üblichen Hilfs- und Zusatzstoffen durch einen Gehalt an einer oder mehreren Verbindungen der allgemeinen Formel



in der

R = NH₂ oder NO₂ und

X = Na, K, NH₄ oder aliphatisches Amin bedeuten, auszeichnen.

Die aktiven Verbindungen der erfindungsgemäßen Mittel sind durch chemische Synthese leicht zugänglich; die industrielle Herstellung der Mittel ist sehr wirtschaftlich, ebenso sehr wie in der landwirtschaftlichen und gärtnerischen Praxis ihre Anwendung (Aufwandmenge) außerordentlich ökonomisch ist.

Die Anwendung der vorliegenden Erfindung beseitigt die angeführten Mängel der bisher bekannten technischen Lösungen. Die erfindungsgemäßen Mittel erzeugen – werden sie appliziert – Resistenz gegen pilzliche Schaderreger durch Aktivierung pflanzeigener Abwehrsysteme (indirekte Schaderregerbekämpfung). Pflanzen besitzen bekanntlich ein natürliches Resistenzpotential, das sich durch ein hohes Maß an Elastizität auszeichnet und durch Eingriffe nichtgenetischer Art aktivieren läßt. Die erfindungsgemäßen Mittel sind in allen Applikationsvariationen physiologisch unbedenklich anwendbar.

Phytotoxische Wirkungen sind in keinem Fall festgestellt worden. Spezialuntersuchungen zeigten auch keine toxischen Wirkungen bei Mensch und Tier. Gegenüber den herkömmlichen Verfahren zur Schaderregerbekämpfung ergeben sich bei Anwendung der Mittel keine toxikologischen und ökologischen Probleme. Die Ökonomie bei Produktion und Anwendung der erfindungsgemäßen Mittel ist in hohem Maße günstiger als vergleichsweise etwa bei konventionellen Fungiziden.

Ausführungsbeispiel

Das Beispiel soll die vorteilhafte Wirkung der erfindungsgemäßen Mittel näher erläutern.

Gerstepflanzen (*Hordeum* sp.) werden im Drei- bis Vierblattstadium mit einer wäßrigen Lösung von 0,1 % der aktiven Verbindung (oberflächenaktive Komponente: 0,01 % Polyoxyethylen-sorbitan-monolaurat oder 0,1 % Alkylphenolpolyglykolether-Netzmittel) gespritzt. Die so behandelten Pflanzen werden auf ihre Anfälligkeit gegen pilzliche Erkrankungen (Gelbrost, Zwergrost) geprüft. Für die Untersuchung dienen die Gerstesorten 'Abed Binder 12', 'Xeniy' und 'Haisa'.

Gegenüber der unbehandelten Kontrolle wird der Befall bei Gelbrost durch das Na-salz der 4,4'-Diamino-stilben-2,2'-disulfonsäure auf 57 % und bei Zwergrost durch das Na-salz der 4,4'-Dinitro-stilben-2,2'-disulfonsäure auf 41 % gesenkt.