



32318

323189

P A T E N T E D E I N V E N C I O N

a favor de:

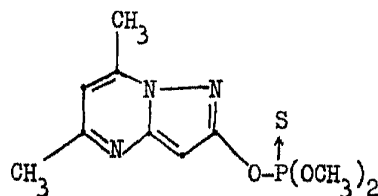
FARBWERKE HOECHST AKTIENGESELLSCHAFT, vormalis Meister Lucius & Brüning, de nacionalidad alemana, residente en Frankfurt (M) - Hoechst (República Federal Alemana), por:

"PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE UN NUEVO DERIVADO DE ESTER DE ACIDO FOSFORICO".

-----

Memoria descriptiva

Se ha hallado un procedimiento para la obtención de un nuevo derivado de éster de ácido fosfórico de la fórmula

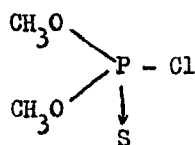


caracterizado por hacerse reaccionar cloruro 0,0-dimetil-tiofosforílico de la fórmula



323189

10



15

con 2-hidroxi-5,7-dimetil-pirazolopirimidin-sodio y obtenerse el producto del procedimiento de la mezcla de reacción.

20

La reacción puede ejecutarse con o sin disolvente. Como disolventes son particularmente adecuadas las cetonas alifáticas de bajo peso molecular, por ejemplo la acetona o la metiletilcetona, y además los nitrilos, como el acetonitrilo, los ésteres, como el éster metílico de ácido acético, los éteres, como el tetrahidrofurano o el dioxano, los hidrocarburos clorados, como el  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$  o el tetracloruro de carbono, y los aromáticos, como el benzol, el xilol y sus derivados sencillos, como el cloro benzol, el diclorobenzol o el nitrobenzol.

25

En general, la transformación se verifica ya a una temperatura de aprox. 15-25°C. con suficiente velocidad, pudiendo ser aumentada ésta mediante elevación de temperatura, por ejemplo a 50-70°C., o a temperatura de reflujo y/o mediante adición de un poco de cobre en polvo.

30

El producto del procedimiento posee una excelente actividad contra los insectos que se alimentan chupando o mordiendo.

Mezclando los componentes, se obtiene el polvo rociable y mojable (wetttable powder) siguiente:

35

- 10,0 % de 0,0-dimetil-O-(5,7-dimetil-pirazolo-pirimidil-(2)-tiofosfato,
- 10,0 % de ácido silícico activo,
- 10,0 % de silicato de aluminio,
- 3,5 % de alquil-arilsulfonato como agente humectante,
- 56,5 % de sulfato sódico,
- 10,0 % de pez celulósica.

40

Mediante suspensión en agua, se obtiene un caldo de rociado que es empleado al 0,05%, es decir con una concentración de materia activa del 0,005%.

En ensayos de laboratorio se rociaron unas manzanas pequeñas y no maduras y se pusieron en su proximidad huevos de la mariposa de la man-

323189



45 zana (*Carpocapsa pomonella*), de modo que las oruguitas pudieran visitar  
 espontáneamente las manzanas o un punto de penetración, como ocurre en  
 la naturaleza. Las manzanas tratadas quedaron protegidas de su ataque  
 y las oruguitas murieron en un 100%, lo más tarde al penetrar en las  
 manzanas, incluso cuando se habían puesto 15 huevos por manzana y todas  
 las oruguitas habían nacido.

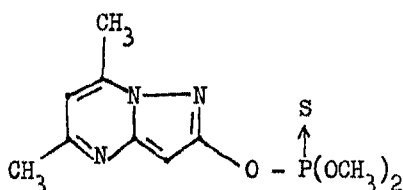
50 O,O-dietil-O-(2-isopropil-4-metil-pirimidil-6)-tionofosfato (véase  
 Schrader : Die Entwicklung neuer insektizider Phosphorsäureester, 1963,  
 Verlag Chemie, pág. 149), empleado con fines de comparación, no consi-  
 guió, con la misma concentración de materia activa del 0,005%, sino un  
 68% de mortandad, e incluso con una concentración doble (0,01%) sólo un  
 55 83%.

Los insectos chupadores de plantas, es decir los pulgones, las co-  
 chinillas y las chinches, fueron aniquilados con preparados de O,O-dime-  
 til-O-(5,7-dimetil-pirazolo-pirimidil-(2))-tiofosfato de análoga formu-  
 lación.

60 La *Doralis fabae* y el *Pyrethromyzus sanborni*, en plantas como la  
*Vicia faba* y respectivamente especies de *Chrysanthemum*, estaban todos  
 muertos a las pocas horas de un único rociado de un contenido de materia  
 activa del 0,00075% solamente.

Se explicará la invención con referencia al Ejemplo siguiente:

65 Ejemplo



Análisis : M (287)  
 calculado : P 10,8 N 14,6  
 hallado : P 10,7 N 14,6

75 A una suspensión de 185 g (1 mol) de la sal sódica de 2-hidroxi-  
 5,7-dimetil-pirazolo-pirimidina en 800 ml de metiletilcetona se añaden  
 a gotas 160,4 g (1 mol) de cloruro O,O-dimetiltiofosforílico. Se agita  
 la mezcla obtenida, durante 1 hora, a una temperatura ambiente de 20° C.  
 y luego se filtra. Al destilar el disolvente, se separa por cristaliza-  
 ción en el filtrado la 2-(O,O-dimetiltionofosforil)-5,7-dimetilpirazolo-

323189

25



pirimidina.

80 Se obtiene un polvo de color débilmente amarillo de un p.f. 72 - 74° C. El rendimiento es de 282 g.

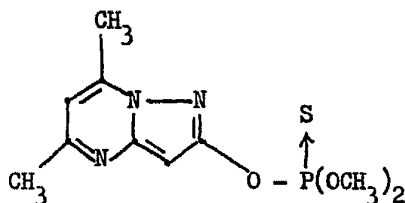
Esta solicitud corresponde a la presentada en Alemania el 20 de Febrero de 1.965, bajo el número F 45 304 IVd/12p, se acoge a los beneficios del artículo 51 del vigente Estatuto de la Propiedad Industrial y del artículo 4º del Convenio de la Unión.

85

REIVINDICACIONES

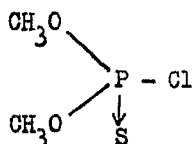
1). Procedimiento para la obtención de un nuevo derivado de éster de ácido fosfórico de la fórmula

90



caracterizado por el hecho de hacerse reaccionar cloruro O,O-dimetiltio fosforílico de la fórmula

95



con 2-hidroxi-5,7-dimetil-pirazolopirimidin-sodio y obtenerse el producto del procedimiento de la mezcla de reacción.

100

2). Procedimiento para la obtención de un agente protector de las plantas caracterizado por mezclarse la sustancia activa definida en la reivindicación 1) con los materiales de soporte y los agentes de adherencia, humedecimiento, dispersión o auxiliares de molienda inertes, sólidos o líquidos corrientes en la protección de las plantas.

323189



20 1906

105 3). "PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE UN NUEVO DERIVADO DE ESTER DE ACIDO FOSFORICO".

Esta Memoria consta de cinco hojas foliadas y mecanografiadas por un sólo lado de sus caras.

Madrid, 17 de Febrero de 1966

Handwritten signature or initials.