



1966

323190

323190

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

a favor de:

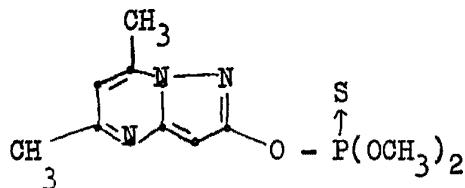
FARBWERKE HOECHST AKTIENGESELLSCHAFT, vormalis Meister Lucius & Brüning, de nacionalidad alemana, residente en Frankfurt (M) - Hoechst (República Federal Alemana), por:

"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



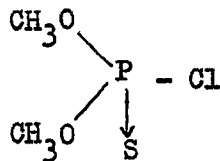
323190



1966

caracterizado por hacerse reaccionar cloruro O,O-dimetiltiofosforílico de la fórmula

10



con 2-hidroxi-5,7-dimetil-pirazolopirimidina en presencia de un agente antiácido y obtenerse el producto del procedimiento de la mezcla de reacción.

15

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 metilacetona, 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 CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> o el tetracloruro de carbono, y los aromáticos, como el benzol, el xilol y sus derivados sencillos, como el clorobenzol, el diclorobenzol o el nitrobenzol.

20

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

25

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

30

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

10,0 % de O,O-dimetil-O-(5,7-dimetil-pirazolo-pirimidil-(2)-tiofosfato,

323190



1966

- 35
- 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 rocío do que es empleado al 0,05%, es decir con una concentración de materia activa del 0,005%.

45

En ensayos de laboratorio, se rociaron unas manzanas pequeñas y no maduras y se pusieron en su proximidad huevos de la mariposa de la manzana (*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

55

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 consiguió, 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 83%.

60

Los insectos chupadores de plantas, es decir los pulgones, las cochinillas y las chinches, fueron aniquilados con preparados de O,O-dimetil-O-(5,7-dimetil-pirazolo-pirimidil-(2))-tiofosfato de análoga formulación.

323190



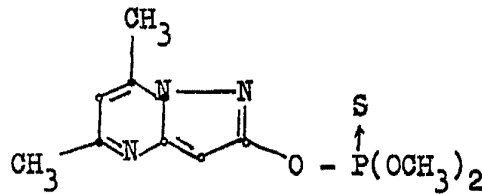
1966

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 de solamente el 0,00075%.

65 Se explicará la invención con referencia al Ejemplo siguiente:

Ejemplo

70



75

Se suspenden en 100 ml de acetona 48,9 g (0,3 mol de 2-hidroxi-5,7-dimetilpirazolo-pirimidina y 40 g de  $K_2CO_3$ . Se añaden agitando, a gotas, 48 g (0,3 mol) de cloruro de 0,0-dimetiltiofosforilo y se calienta la mezcla de reacción, durante 2 horas, a 40-50° C. Por filtración del exceso de  $K_2CO_3$  y del KCl, se obtienen de la solución acetónica 84 g de 2-(0,0-dimetiltiofosforilo)-5,7-dimetilpirazolo-pirimidina, de un p. f. 72 - 74° C.

80

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.

REIVINDICACIONES

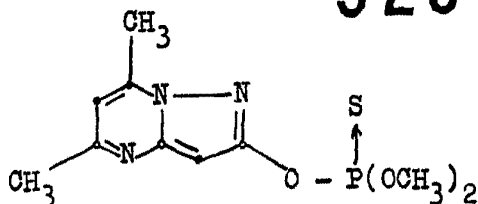
85

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

323190

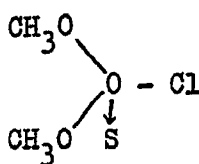


UN. 1966



90

caracterizado por hacerse reaccionar cloruro 0,0-dimetiltiofosfo  
rílico de la fórmula



95

con 2-hidroxi-5,7-dimetil-pirazolopirimidina en presencia de un  
medio antiácido 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 materia activa definida en  
la reivindicación 1) con los materiales de soporte y los agentes  
de adherencia, humedecimiento, dispersión o auxiliares de molien-  
da inertes, sólidos o líquidos, corrientes en la protección de las  
plantas.

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

105

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

Madrid, 17 de Febrero de 1966