



323191

323191



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

a favor de:

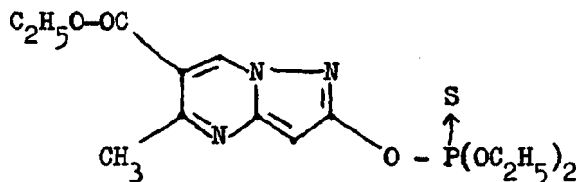
FARBWERKE HOECHST AKTIENGESELLSCHAFT, vormals Meister Lucius & Brüning, de nacionalidad alemana, residente en Frankfurt (M) - Hoechst (República Federal Alemana), por:

"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

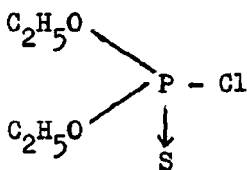
5



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



323191



10

con 2-hidroxi-5-metil-7-carbetoxi-pirazolo-pirimidin-sodio 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 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 CH_2Cl_2 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, 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.

25

El producto del procedimiento posee una excelente actividad contra los hongos patógenos de las plantas.

Unos pepinos de una variedad atacable por el mildiú fueron infectados fuertemente, de manera artificial, con una suspensión de conidios del mildiú de los pepinos (*Erysiphe cichoracearum*). A los cinco días de la infección, los pepinos fueron tratados con una emulsión acuosa de un preparado de la siguiente composición:

30

10 % de 2-[0,0-dietiltionofosforil]-5-metil-6-carbetoxi-pirazolo-pirimidina,

35

80 % de alcohol etílico,

10 % de emulgador (nonilfenol con un 10% de óxido de etileno)

La concentración de empleo era de 500, 250, 120, 60, 30, 15 y 7,5 mg de sustancia activa por litro de caldo de rociado. Todas las plantas fueron rociadas hasta gotear.

40

Como medio de comparación se empleó un preparado de óxido de fosfina (sustancia activa : óxido de bis-(dimetilamino)-(3-amino-5-fenil-



323191

45. triazolil)-fosfina) corriente del comercio, activo contra el mildiú, que se roció en la misma concentración y en iguales condiciones de empleo, y un control no sometido a tratamiento.

50. El resultado del ensayo, a las tres semanas del tratamiento, reproducido en la Tabla adjunta, muestra muy claramente la excelente eficacia contra el mildiú de la substancia activa reivindicada. Mientras que el éster de ácido fosfórico reivindicado impidió por completo el ataque por el mildiú hasta una concentración de empleo de 30 mg de substancia activa por litro de caldo de rociado, el medio de comparación no consiguió impedir, en la misma concentración de empleo, el ataque completo. Incluso en la concentración máxima de empleo de 500 mg de substancia activa por litro de caldo de rociado, el medio de comparación siguió revelando todavía un 20% atacado por el mildiú.

55.

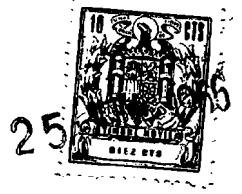
323191

T a b l a

Preparado	% de ataque por el mildiú con los mg siguientes de substancia activa por litro de caldo de rociado					
	500	250	120	60	30	15
A +)	0	0	0	0	3,1	5,0
Preparado del comercio, como medio de comparación	10	20	38	60	70	100
Sin tratar	100	100	100	100	100	100

+) A = 2-[O,O-dietiltionofosforil]-5-metil-6-carbetoxi-pirazolo-pirimidina.

323191





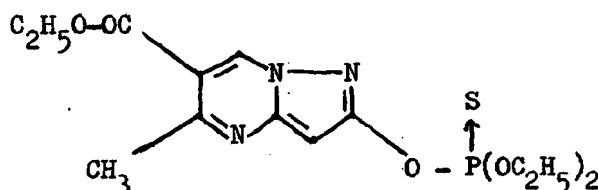
323191

65

Se explicará la invención con referencia al Ejemplo siguiente.

Ejemplo

70
75
80



Análisis : M (373)
 calculado : P 8,3 S 8,6
 hallado : P 8,0 S 8,5

Se agita durante 8 - 10 horas a 50° C. aproximadamente una mezcla de 24,3 g (0,1 mol) de la sal sódica de 2-hidroxi-5-metil-7-carbetoxi-pirazolo-pirimidina, 18,9 g (0,1 mol) de cloruro O,O-dietiltiofosforílico y 200 ml de acetona. Del filtrado purificado de NaCl se obtienen 37 g de 2-(O,O-dietil-tionofosforil)-5-metil-6-carbetoxi-pirazolo-pirimidina en forma de aceite amarillo que se solidifica lentamente (p.f. 38-40° C.).

80

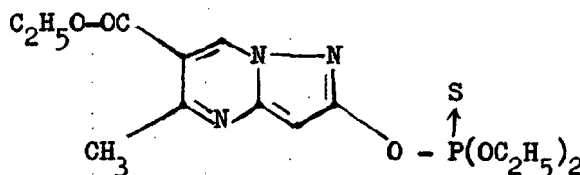
Esta solicitud corresponde a la presentada en Alemania el 20 de Febrero de 1.965 bajo el número F 45 304 IVd/12p, se acoge a los beneficios del artículo 51 del vigente Estatuto de la Propiedad Industrial y del artículo 4° del Convenio de la Unión.

REIVINDICACIONES

85

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

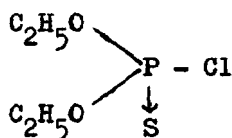
90



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



323191



95

con 2-hidroxi-5-metil-7-carbetoxi-pirazolo-pirimidin-sodio y obtenerse el producto del procedimiento de la mezcla de reacción.

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 molienda 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".

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

Madrid, 17 de Febrero de 1966