

327603



1967

327603

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

a favor de:

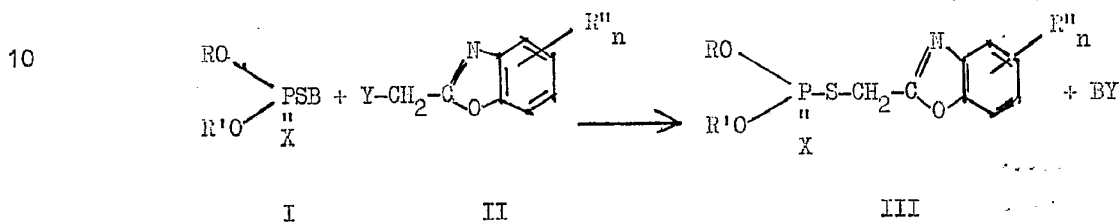
FABRIK FÜR CHEMISCHE ERZEUGNISSE, vormals Meister Lucius & Brüning,
de nacionalidad alemana, residente en Frankfurt (M) - Hoechst (República
Federal Alemana), por:

"PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE NUEVOS ESTERES DE LOS ACIDOS MONO
Y DITIOFOSFORICOS".

Memoria descriptiva

Objeto del presente invento son nuevos ésteres de ácidos fosfóri-
cos, así como su obtención y aplicación como agentes contra organismos
nocivos.

Han sido descubiertos procedimientos para la obtención de nuevos
ésteres de ácidos fosfóricos de la fórmula general III, mediante la
reacción de sales de los correspondientes ácidos O,O-dialcohol(di)tiofos-
fóricos de la fórmula I, con benzoxazoles sustituidos en el anillo ben-
zólico de la fórmula II, de acuerdo con el siguiente esquema general:



15 en el que X significa en cada caso O o S, representando B un catión de metal alcalino, alcalinotérreo o amónico, o bien un catión de una base orgánica, R y R' radicales alcohilo inferiores iguales o distintos, Y un átomo de halógeno o un radical ácido reactivo, por ejemplo, un radical ácido sulfónico, mientras que R'' significa sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por halógenos, radicales de hidrocarburos con 1 - 4 átomos de carbono, el radical fenilo, el grupo trifluorometilo, NO₂, CN, carbalcoxi, carbamido, acilamino, sulfalcoxi, sulfamido, alcohilsulfenilo, alcohilsulfinito, alcohilsulfonilo o radicales acilo, pudiendo dos sustituyentes formar conjuntamente un anillo, y representando n un número entero de 1 a 4.

25 Objeto del invento es asimismo la utilización de los nuevos compuestos en calidad de pesticidas.

30 los 2-halógeno-metilbenzoxazoles sustituidos en el anillo benzólico conforme a la fórmula II y los ésteres de ácidos sulfónicos de los correspondientes 2-oximetilbenzoxazoles, no son conocidos hasta ahora. El invento, por consiguiente, se refiere también a estos compuestos nuevos, tal como serán descritos a continuación con más detalle.

Los 2-clorometilbenzoxazoles de la fórmula general II, que sirven como compuestos de partida, se obtienen, por ejemplo, de la manera siguiente:

35 66 g de 2-cloracetamino-4-clorofenol, junto con 0,5 g de cloruro de cinc, son calentados durante 1/2 hora en 300 ml de o-diclorobenzol, destilándose lentamente el o-diclorobenzol, hasta que ya no se destila agua junto con dicho o-diclorobenzol. Después de enfriar a temperatura ambiente, se agita la solución con agua y se separa. De la solución se extrae el o-diclorobenzol mediante destilación en el vacío. El residuo, que solidifica a aproximadamente 47°C., se recristaliza desde metanol. De este modo

40

327603



1967

se obtienen 56 g de 2-clorometilo-5-clorobenzoxazol con un punto de fusión de 54 - 55°C.

45 Los restantes 2-clorometilbenzoxazoles indicados en los ejemplos, pueden ser obtenidos de manera análoga, eventualmente mediante la introducción ulterior de sustituyentes.

50 Las sustancias activas de la fórmula III de más arriba, se mezclan con sustancias inertes, de la manera usual para pesticidas, siendo empleados como polvos espolvoreables a mano o a pistola, como emulsiones o en forma de soluciones o también de granulados. Se suelen emplear fórmulas que permitan combatir los organismos nocivos, sin que afecten demasiado a los animales huéspedes, por ejemplo, en la lucha contra los ectoparásitos, o a la planta huésped, por ejemplo, en la lucha contra hongos fitopatógenos.

55 Estos agentes presentan con relación al 2-O,O-dietilditiofosforilmetilbenzoxazol conocido, no sustituido en el anillo benzólico, la ventaja de una mayor eficacia frente a los parásitos y de una menor toxicidad para los animales de sangre caliente, tal como queda demostrado a base de la LD₅₀ para ratas. Estas propiedades permiten su empleo para la lucha contra los parásitos domésticos y de las despensas, así como
60 contra otros organismos molestos y ectoparásitos.

Ante la natural sorpresa, presentan algunos de los nuevos compuestos además de su acción insecticida y acaricida, también una buena acción fungicida, especialmente contra el oidio del trigo.

65 La tabla siguiente muestra la menor toxicidad para los animales de sangre caliente de algunos de los compuestos reivindicados, en relación con el compuesto conocido, citado al principio.

327603



1967

	Sustancia activa	LD ₅₀	(rata)
70	2-O,0-dietilditiofosforilmetil-benzoxazol (compuesto conocido)	30 mg/kg	de rata
	2-O,0-dietilditiofosforilmetil-5,7-dicloro- benzoxazol (conforme al invento)	105	" "
	2-O,0-dietilditiofosforilmetil-5-metil- benzoxazol (conforme al invento)	120	" "
75	2-O,0-dietilditiofosforilmetil-5-trifluoro- metil-benzoxazol (conforme al invento)	120	" "
	2-O,0-dietilditiofosforilmetil-6-cloro- benzoxazol (conforme al invento)	110	" "

80 Los ejemplos siguientes muestran la forma de obtención de los nuevos compuestos, así como su aplicación en calidad de pesticidas.

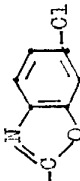

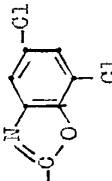
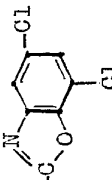
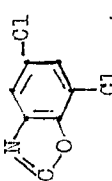
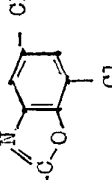
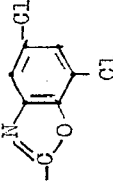
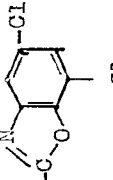
Ejemplo 1

85 45 g de la sal potásica del ácido 0,0-dietilditiofosfórico y 41 g de 2-clorometil-5-clorobenzoxazol (P. 54 - 55°C.), se calientan a reflujo durante 15 minutos en 150 ml de etanol. Después de dejar enfriar a temperatura ambiente, se extrae el cloruro potásico sedimentado mediante absorción. Después de destilado el etanol contenido en el producto filtrado, restan 64 g de 2-O,0-dietilditiofosforilmetil-5-clorobenzoxazol en forma de aceite pardo.

Análisis:	Hallado:	Calculado
90	4,1/4,2 % de N	4,0 % de N
	8,7/8,8 % de P	8,8 % de P

Ejemplos 2 - 39

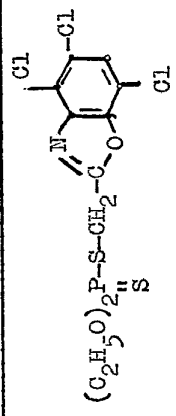
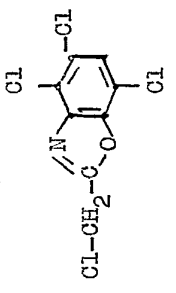
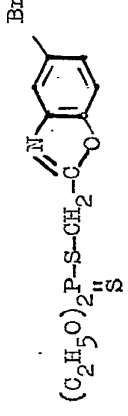
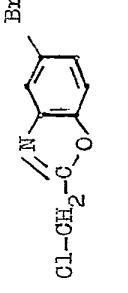
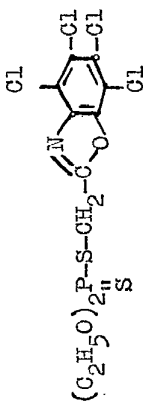
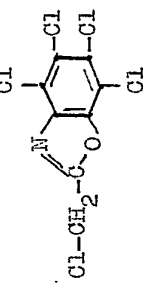
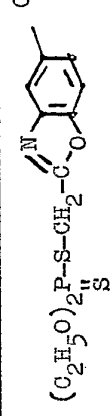
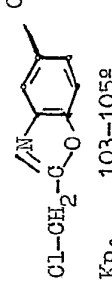
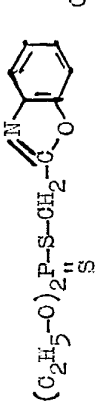
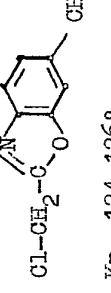
95 Del mismo modo se obtuvieron los siguientes ésteres del ácido fosfórico, a partir de sales de ácidos 0,0-dialcohol(di)tiofosfóricos y de 2-clorometilbenzoxazoles sustituidos correspondientemente en el anillo benzólico:

Nº	Fórmula del producto conforme al procedimiento	Propiedades físicas	Análisis	Características físicas de los 2-clorometilbenzoxazoles (producto de partida)
			Hallado	Calculado
100	2 $(C_2H_5O)_2P-S-CH_2-C$ S	aceite pardo	4,2/4,0 % N 8,7/8,8 % P	4,0 % N 8,8 % P
				
				F. 58 - 59°C.
105	3 $(C_2H_5O)_2P-S-CH_2-C$ S	"	7,8/7,9 % P 18,4/18,6 % Cl	8,2 % P 18,9 % Cl
				
				F. 60 - 61°C.
110	4 $(OH_3O)_2P-S-CH_2-C$ S	"	3,9/4,0 % N 8,6/8,9 % P	3,9 % N 8,7 % P
				
				F. 60 - 61°C.
115	5 $(C_2H_5O)_2P-S-CH_2-C$ O	"	4,1/3,8 % N	3,8 % N
				
				F. 60 - 61°C.



1967

327603

Nº	Fórmula del producto conforme al procedimiento	Propiedades físicas	Análisis		Características físicas de los 2-clorometilbenzoxazoles (producto de partida)
			Hallado	Calculado	
6	$(C_2H_5O)_2P(S)CH_2-C$  $(C_2H_5O)_2P(S)CH_2-C$ 	F. 98 - 99 ^a	3,6/3,6 % N 7,3/7,4 % P	3,3 % N 7,4 % P	F. 102 - 103 ^a C.
7	$(C_2H_5O)_2P(S)CH_2-C$  $(C_2H_5O)_2P(S)CH_2-C$ 	aceite pardo	3,7/3,8 % N 7,9/7,9 % P	3,6 % N 7,8 % P	
8	$(C_2H_5O)_2P(S)CH_2-C$  $(C_2H_5O)_2P(S)CH_2-C$ 	F. 133 - 134 ^a	2,8/2,9 % N 7,0/7,1 % P	3,1 % N 6,8 % P	
9	$(C_2H_5O)_2P(S)CH_2-C$  $(C_2H_5O)_2P(S)CH_2-C$ 	aceite pardo	4,5/4,6 % N 9,0/9,1 % P	4,2 % N 9,3 % P	F. 114 - 115 ^a
10	$(C_2H_5O)_2P(S)CH_2-C$  $(C_2H_5O)_2P(S)CH_2-C$ 	aceite amarillento	3,7/3,8 % N 8,5/8,6 % P	3,9 % N 8,6 % P	Kp. 3 124-126 ^a F. 39 - 40 ^a



967

327603

120

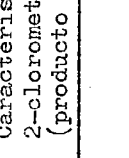
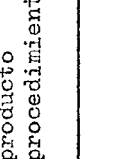
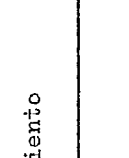

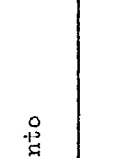
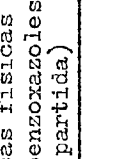
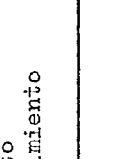
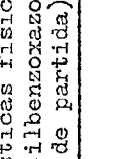
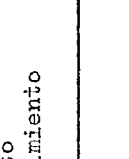
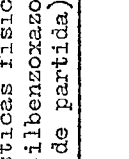
125

130

135

140

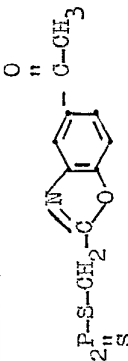
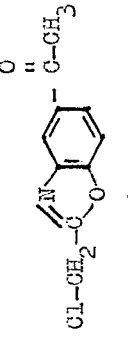
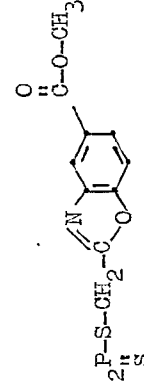
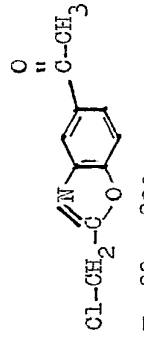
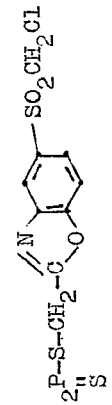
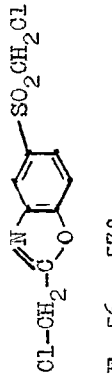
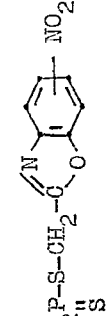
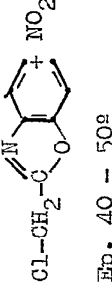
145

Nº	Fórmula del producto conforme al procedimiento	Propiedades físicas	Análisis	Características físicas de los 2-clorometilbenzoxazoles (producto de partida)
			hallado	calculado
11	$(C_2H_5O)_2P-S-CH_2-C$ 	F. 37 - 38°	4,0/4,0 % N 8,0/7,9 % P	$Cl-CH_2-C$  F. 82 - 83°
12	$(C_2H_5O)_2P-S-CH_2-C$ 	aceite pardo	4,0/4,0 % N 7,7/7,8 % P	$Cl-CH_2-C$  F. 46 - 47°
13	$(C_2H_5O)_2P-S-CH_2-C$ 	aceite pardo	3,5/3,5 % N 7,5/7,6 % P	$Cl-CH_2-C$  F. 90 - 91°
14	$(C_2H_5O)_2P-S-CH_2-C$ 	F. 51 - 52°	3,5/3,6 % N 8,2/8,3 % P	$Cl-CH_2-C$  F. 114 - 115°
15	$(C_2H_5O)_2P-S-CH_2-C$ 	Ep. 25 - 26°	4,2/4,1 % N 8,3/8,4 % P	$Cl-CH_2-C$  F. 114 - 115°



957

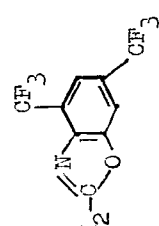
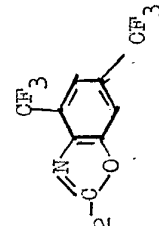
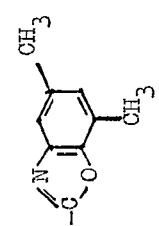
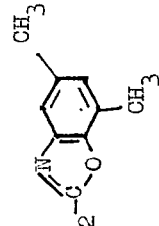
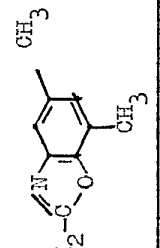
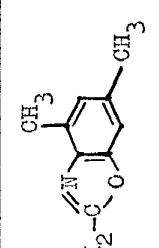
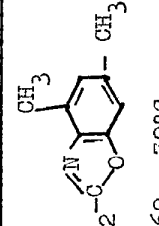
327603

Nº	Fórmula del producto conforme al procedimiento	Propiedades físicas	Análisis hallado	Análisis calculado	Características físicas de los 2-clorometilbenzoxazoles (producto de partida)
175					
180	$(C_2H_5O)_2P-S-CH_2-C \begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{C-CH}_3 \end{array}$ 	aceite pardo	3,8/4,0 % N 8,9/9,1 % P	$Cl-CH_2-C \begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{C-CH}_3 \end{array}$  F. 52 - 53 ^a	
185	$(C_2H_5O)_2P-S-CH_2-C \begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{C-O-CH}_3 \end{array}$ 	aceite pardo	3,6/3,6 % N 8,2/8,2 % P	3,7 % N 8,3 % P	$Cl-CH_2-C \begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{C-CH}_3 \end{array}$  F. 88 - 89 ^a
190	$(C_2H_5O)_2P-S-CH_2-C \begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{SO}_2CH_2Cl \end{array}$ 	aceite pardo	3,0/2,9 % N 7,0/7,0 % P	3,2 % N 7,3 % P	$Cl-CH_2-C \begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{SO}_2CH_2Cl \end{array}$  F. 56 - 57 ^a
195	$(CH_3O)_2P-S-CH_2-C \begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{NO}_2 \end{array}$  mezcla de isómeros	aceite pardo	7,5/7,8 % N 8,2/8,3 % P	7,7 % N 8,5 % P	$Cl-CH_2-C \begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{NO}_2 \end{array}$  Ep. 40 - 50 ^a mezcla de isómeros



1861



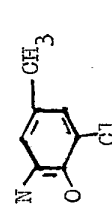
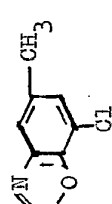
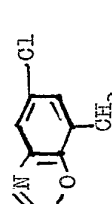
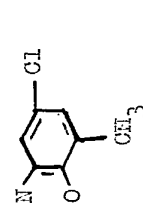
327603

Nº	Fórmula del producto conforme al procedimiento	Propiedades físicas	Análisis hallado	Análisis calculado	Características físicas de los 2-clorometilbenzoxazoles (producto de partida)
200					
205	$(C_2H_5O)_2P-S-CH_2-CH_2-$ 	aceite amarillento	14,1/14,3 % S 24,6 % F	14,2 % S 25,2 % F	 $Cl-CH_2-$ K_{p1} 92-95°C F = 56-57°C.
210	$(CH_3O)_2P-S-CH_2-CH_2-$ 	aceite	4,3/4,1 % N 19,3/19,3 % S	4,4 % N 20,0 % S	 $Cl-CH_2-$ $K_{p0,6}$ 120-122°C F = 61-62°C.
215	$(C_2H_5O)_2P-S-CH_2-CH_2-$ 	aceite	3,7/3,7 % N 17,9/17,9 % S	4,0 % N 18,5 % S	"
220	$(C_2H_5O)_2P-S-CH_2-CH_2-$ 	aceite	3,8/3,9 % N 17,9/18,3 % S	4,0 % N 18,5 % S	 $Cl-CH_2-$ F = 69 - 70°C.



327603

Características físicas de los
2-clorometilbenzoxazoles
(producto de partida)

Nº	Fórmula del producto conforme al procedimiento	Propiedades físicas	Análisis hallado	calculado
230	$(C_2H_5O)_2P(S)CH_2$ 	aceite	10,2/10,4 % Cl 17,5/17,8 % S	9,7 % Cl 17,5 % S
235	$(CH_3O)_2P(S)CH_2$ 	aceite	10,9/11,0 % Cl 19,2/18,9 % S	10,5 % Cl 19,0 % S
240	$(CH_3O)_2P(S)CH_2$ 	aceite	18,2/18,5 % S 11,1/11,3 % Cl	19,0 % S 10,6 % Cl
245	$(C_2H_5O)_2P(S)CH_2$ 	aceite	9,6/9,7 % Cl 16,9/17,0 % S	9,7 % Cl 17,5 % S
250	$(C_2H_5O)_2P(S)CH_2$ 	aceite	17,7/17,9 % S 9,3/9,3 % Cl	17,5 % S 9,7 % Cl
255	$(CH_3O)_2P(S)CH_2$ 	aceite	19,6/19,6 % S 10,6/10,6 % Cl	19,0 % S 10,5 % Cl

F = 63-64° C.

"

F = 48 - 49° C

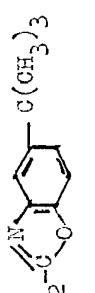
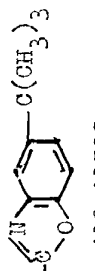
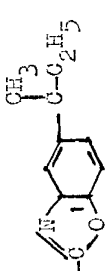
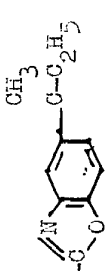
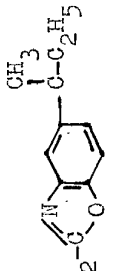
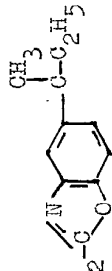
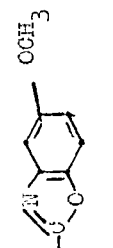
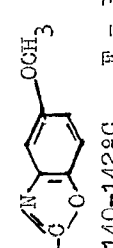
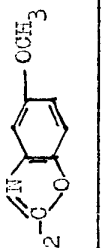
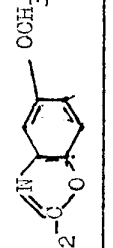
"

F = 48-50° C.



1961


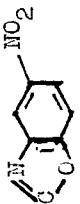
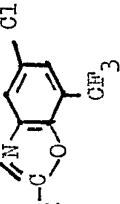
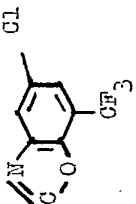
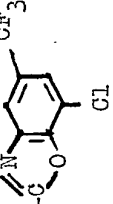
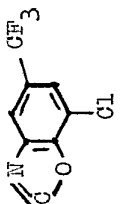
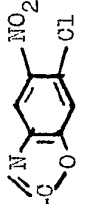

327603

255	Nº	Fórmula del producto conforme al procedimiento	Propiedades físicas	hallado	Analisis calculado	Características físicas de los 2-clorometilbenzoxazoles (producto de partida)
260	30	$(C_2H_5O)_2P-S-CH_2-C(CH_3)_3$ 	aceite	17,3/17,5 % S 7,9/7,9 % P	17,2 % S 8,3 % P	$Cl-CH_2-C(CH_3)_3$  $K_{P1,5} = 130-135^{\circ}C.$
265	31	$(CH_3O)_2P-S-CH_2-C(CH_3)H_5$ 	aceite	18,8/18,7 % S 4,1/3,9 % N	18,6 % S 4,1 % N	$Cl-CH_2-C(CH_3)H_5$  $K_{P1} = 130-140^{\circ}C \quad F = 46-47^{\circ}C$
270	32	$(C_2H_5O)_2P-S-CH_2-C(CH_3)H_5$ 	aceite	17,5/17,5 % S 3,4/3,4 % N	17,2 % S 3,7 % N	"
275	33	$(C_2H_5O)_2P-S-CH_2-C(CH_3)H_5$ 	aceite	9,5/9,8 % S 3,8/3,8 % N	9,0 % S 3,9 % N	"
280	34	$(CH_3O)_2P-S-CH_2-OCH_3$ 	aceite.	19,8/19,8 % S 4,2/4,1 % N	20,0 % S 4,4 % N	$Cl-CH_2-OCH_3$  $K_{P3} = 140-142^{\circ}C \quad F = 35-36^{\circ}C$
285	35	$(C_2H_5O)_2P-S-CH_2-OCH_3$ 	aceite	18,3/18,3 % S 3,9/3,8 % N	18,5 % S 4,0 % N	"
290	36	$(C_2H_5O)_2P-S-CH_2-OCH_3$ 	aceite	10,4/10,1 % S 4,2/4,1 % N	9,7 % S 4,2 % N	"

327603



1967

No	Fórmula del producto conforme al procedimiento	Propiedades físicas	Análisis hallado	Análisis calculado	Características físicas de los 2-clorometilbenzoxazoles (producto de partida)
295	$(\text{CH}_3\text{O})_2\text{P-S-CH}_2\text{-C}$  NO_2	aceite	7,8/7,9 % N 20,1/20,3 % S	8,5 % N 19,6 % S	$\text{Cl-CH}_2\text{-C}$  NO_2
					F = 113 - 114°C.
300	$(\text{C}_2\text{H}_5\text{O})_2\text{P-S-CH}_2\text{-C}$  Cl CF_3	aceite	14,5/14,7 % S 13,6 % F	15,2 % S 13,6 % F	$\text{Cl-CH}_2\text{-C}$  Cl CF_3
					K _{P1} = 140-145° C F = 65-66°C
305	$(\text{C}_2\text{H}_5\text{O})_2\text{P-S-CH}_2\text{-C}$  CF_3 Cl	aceite	14,7/14,8 % S 13,4 % F	15,2 % S 13,6 % F	$\text{Cl-CH}_2\text{-C}$  CF_3 Cl
310	$(\text{C}_2\text{H}_5\text{O})_2\text{P-S-CH}_2\text{-C}$  NO_2 Cl	aceite	15,8/16,0 % S 7,1/7,3 % N	16,2 % S 7,1 % N	$\text{Cl-CH}_2\text{-C}$  NO_2 Cl
					F = 104 - 105°

327603



567



327603

Ejemplo 41

315 Cerdos de engorde parasitados por el piojo porcino "haematopinus suis", fueron rociados en cada caso con 0,8 a 1 litro de una emulsión acuosa de sustancia activa al 0,05 - 0,075%, de la fórmula siguiente:

- 10% de sustancia activa
- 78% de etanol como disolvente
- 10% de un éter alcoholifenolpoliglicólico como emulgente
- 320 2% de epiclorhidrina como estabilizador

sirviendo como sustancia activa:

- a) 2-0,0-dietilditiofosforilmetil-5,7-dicloro-benzoxazol;
- b) 2-0,0-dietilditiofosforilmetil-5-metil-benzoxazol;
- c) 2-0,0-dietilditiofosforilmetil-5-trifluorometil-benzoxazol.

325 Los piojos porcinos fueron destruidos en su totalidad.

Ejemplo 42

330 Una placa recubierta con polillas de los tipos "phylodromia germanica" y "periplaneta americana", fué tratada con 2 - 3 g de un polvo que, en calidad de sustancia activa, contiene 2% de 2-0,0-dietilditiofosforilmetil-6-cloro-benzoxazol y, en calidad de excipiente, talco y tierra de Fuller. Las polillas más arriba citadas murieron en el transcurso de 2 horas.

Ejemplo 43

335 Larvas de langosta migratoria ("pachitylus migratorius migratoroides") en su cuarto período de desarrollo, fueron rociadas con una emulsión acuosa de sustancia activa al 0,01% análoga a la del ejemplo 40, con 2-0,0-dietilditiofosforilmetil-5-nitro-benzoxazol en calidad de sustancia activa. Las larvas de langosta fueron destruidas en un 100%.

340 Para un efecto igual se precisa una emulsión de sustancia activa al 0,05% de una fórmula análoga, con el conocido 1-0,0-dietilditiofosforilmetil-benzoxazol.

Ejemplo 44

345 Algunas ventajas de las sustancias activas reivindicadas, formando parte de una fórmula análoga a la del ejemplo anterior, con relación a agentes conocidos y en cuanto a su eficacia frente a larvas del escarabajo mejicano de la judía ("epilachna varivertus") pueden apreciarse en la tabla comparativa siguiente:

327603



1967

Sustancia activa	Concentración	Destrucción
350 $(C_2H_5O)_2P-S-CH_2-C \begin{matrix} \diagup N \\ \diagdown O \end{matrix} \text{C}_6H_4NO_2$ (conforme al invento)	0,001 %	100 %
355 $(C_2H_5O)_2P-S-CH_2-C \begin{matrix} \diagup N \\ \diagdown O \end{matrix} \text{C}_6H_3(NO_2)Cl$ (conforme al invento)	0,001 % 0,002 %	90 % 100 %
360 $(C_2H_5O)_2P-S-CH_2-C \begin{matrix} \diagup N \\ \diagdown O \end{matrix} \text{C}_6H_3Cl_2$ (conforme al invento)	0,001 % 0,002 %	90 % 100 %
365 $(C_2H_5O)_2P-S-CH_2-C \begin{matrix} \diagup N \\ \diagdown O \end{matrix} \text{C}_6H_4$ (conocido)	0,002 %	40 %
370 $(C_2H_5O)_2P-S-O-C_6H_4NO_2$ (corriente en el comercio)	0,002 %	60 %
375 $(C_2H_3O)_2P-S-CH_2-N \begin{matrix} O \\ \\ C \end{matrix} \text{C}_6H_4$ (corriente en el mercado)	0,002	70 %
385 $(C_2H_5O)_2P-S-O-C \begin{matrix} HC \\ \\ N \end{matrix} \begin{matrix} CH_3 \\ \\ N \end{matrix} - CH \begin{matrix} CH_3 \\ \\ CH_3 \end{matrix}$ (corriente en el mercado)	0,002 %	20 %

327603



Ejemplo 45

Un cereal almacenado, atacado por el gorgojo del trigo, fué mez-
clado en la proporción de 1000 : 1 con un polvo espolvoreable de la com-
posición siguiente:

390

1 % de 2-O,0-dietilditiofosforilmetil-6-cloro-benzoxazol

3 % de tierra de Fuller

96 % de talco

Los gorgojos del trigo existentes, fueron destruidos totalmente.

395

La misma concentración de 0,0-dietilditiofosforilmetil-benzoxazol,
únicamente origina la destrucción de 40% de los parásitos.

Ejemplo 46

Manzanas infectadas con larvas de la polilla de la manzana ("carpocapsa
pomonella"), fueron tratadas con un caldo aplicable a pistola al 0,2%,
que estaba fabricado con un polvo de aspersión de la composición siguiente:

400

10 % de 2-O,0-dimetilditiofosforilmetil-5-nitro-benzoxazol

20 % de un preparado amorfo de ácido silícico

56,5 % de Na₂SO₄

10 % de ligninsulfonato de calcio

405

2 % de éter alcoholifenilpoliglicólico

1,5 % de alcohol estearílico

Todas las larvas existentes fueron destruidas.

Si en esta fórmula se sustituye la sustancia activa a emplear con-
forme al invento por el conocido 2-O,0-dietilditiofosforilmetil-benzo-
razol, entonces se precisa un caldo de una concentración cinco veces ma-
yor, para conseguir el mismo efecto.

410

Ejemplos 47 - 49

Para comprobar el efecto fungicida de los compuestos a emplear con-
forme al invento, se trataron plantas útiles, 5 días después de una in-
fección por hongos, con una suspensión acuosa, que se preparó con un
denominado polvo humectable de la composición siguiente:

415

10 % de sustancia activa (compárese la tabla)

20 % de un preparado amorfo de ácido silícico

56,6 % de sulfato sódico

420

10 % de ligninsulfonato de calcio

327603



1967

2 % de éter alcoholifenilpoliglicólico

1,5 % de alcohol estearílico

La tabla siguiente muestra la superioridad de los compuestos reinvindicados frente al conocido 2-O,O-dietilditiofosforilmetil-benzoxazol y al 5-amino-1-bis(dimetil-amidofosforil-3-fenil-1.2.4-triazol).

425



Concentración del caldo rociabile	Remisión del ataque aprox. 2 semanas después del tratamiento, frente a sin tratar	Toxicidad para animales de sangre caliente, lb ₅₀ en mg/kg de rata
<p>430</p> <chem>Clc1ccc2nc3c(c1)oc4c3ncc4</chem> <p>(C₂H₅O)₂P-S-CH₂-C₂S</p> <p>(conforme al invento)</p>	<p>0,03 %</p> <p>95 %</p> <p>0,06 %</p> <p>100 %</p>	<p>110</p>
<p>435</p> <chem>Clc1ccc2nc3c(c1)oc4c3ncc4</chem> <p>(C₂H₅O)₂P-S-CH₂-C₂S</p> <p>(conforme al invento)</p>	<p>0,012 %</p> <p>100 %</p>	<p>105</p>
<p>440</p> <chem>OC(=O)c1ccc2nc3c(c1)oc4c3ncc4</chem> <p>(C₂H₅O)₂P-S-CH₂-C₂S</p> <p>(conforme al invento)</p>	<p>0,05 %</p> <p>100 %</p>	<p>120</p>
<p>445</p> <chem>Cc1ccc2nc3c(c1)oc4c3ncc4</chem> <p>(C₂H₅O)₂P-S-CH₂-C₂S</p> <p>(compuesto conocido)</p>	<p>0,012 %</p> <p>0,025 %</p> <p>0,03 %</p> <p>0,05 %</p> <p>0,06 %</p> <p>50 %</p> <p>90 %</p> <p>60 %</p> <p>95 %</p>	<p>30</p> <p>90 %</p>
<p>450</p> <chem>Nc1ccc2nc3c(c1)oc4c3ncc4</chem> <p>(conforme en el mercado)</p>	<p>0,025 %</p> <p>0,05 %</p> <p>80 %</p> <p>40 %</p>	<p>10 - 20</p>

327603

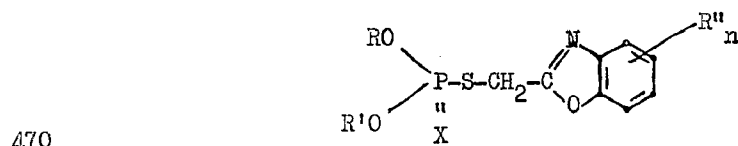


1967

460 Esta solicitud corresponde a las presentadas en Alemania el 9 de Junio de 1.965 bajo los números F 46 283 IVd/12p y F 46 284 IVA/451, 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

465 1). Un procedimiento para la obtención de ésteres de los ácidos mono o ditiofosfórico de la fórmula general



caracterizado por ser hechos reaccionar entre sí sales de los correspondientes ácidos O,C-dialcohol-monotiofosfóricos o de los ácidos O,C-dialcohol-ditiofosfóricos de la fórmula general



con benzoxazoles sustituidos en el anillo benzólico, de la fórmula general



485 preferentemente en un disolvente orgánico, inerte con relación a los participantes de la reacción, y a temperaturas de entre 20 y 100°C., representando X oxígeno o azufre, B un catión de metal alcalino, alcalinotérreo o amónico o un catión de una base orgánica, R y R' radicales alcohol inferiores, Y un átomo de halógeno o un radical ácido reactivo, R'' substituyentes

327603

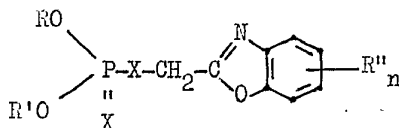


iguales o distintos, tales como halógenos, radicales de hidrocarburos con 1 - 4 átomos de carbono, radicales fenilo, trifluorometilo, NO₂, carbalcoxi, alcoholisulfenilo, alcoholisulfonilo o acilo, y pudiendo dos sustituyentes formar conjuntamente un anillo, mientras que n es un número entero de 1 - 4.

490

2). Un procedimiento para la obtención de agentes para la lucha contra los parásitos, caracterizados por contener compuestos de la fórmula general

495



en la que X representa O ó S, R y R' radicales alcoholo inferiores iguales o distintos, R'' sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por halógenos, radicales de hidrocarburos con 1 - 4 átomos de carbono, el radical fenilo, los grupos de trifluorometilo, NO₂, carbalcoxi, alcoholisulfenilo, alcoholisulfonilo o radicales acilo, pudiendo 2 sustituyentes formar conjuntamente un anillo, y siendo n un número entero de 1 - 4.

500

505

3). Procedimiento de obtención de fórmulas para pesticidas que contienen una sustancia conforme a la reivindicación anterior en calidad de componente activo, y un material portador sólido o líquido, así como disolventes, agentes adhesivos, humectantes, dispersores o auxiliares de la molturación.

510

4). Procedimiento para la obtención de fórmulas de acuerdo con la reivindicación 3), en forma de polvos humectables ("wetttable powder").

5). Procedimiento para la obtención de fórmulas de acuerdo con la reivindicación 3), en forma de soluciones o de emulsiones concentradas.

6). Procedimiento para la obtención de fórmulas de acuerdo con la reivindicación 3), en forma de granulados.

515

7). Procedimiento de lucha contra insectos, arácnidos y hongos dañinos mediante el empleo de concentraciones tóxicas para el parásito de un agente que contiene una sustancia conforme a la reivindicación 2), en calidad de sustancia activa.

327603



1967

520

8). "PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE NUEVOS ESTERES DE LOS ACIDOS MONO Y DITIOFOSFORICOS".

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

Madrid, 6 de Junio de 1.966

Handwritten signature or initials, possibly "Leo", written in dark ink.