



19 ES	11 NUMERO	10 A1
	46400073	
	22 FECHA DE PRESENTACION	
	31.09.1977	

PATENTE DE INVENCION

30 PRIORIDADES:	32 FECHA	33 PAIS
31 NUMERO		
P 26 39 256.3	1 de septiembre de 1.976	Rep. Federal Alemana

47 FECHA DE PUBLICIDAD	51 CLASIFICACION INTERNACIONAL	52 PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA
	C07F ADIN	

64 TITULO DE LA INVENCION
Procedimiento para la obtencion de ésteres pirimidínicos alcoxi- y alquiltio- sustituidos, de los ácidos [tiono-(tiol)]-fosfo-rico(nico).

65 SOLICITANTE (S)
BAYER AKTIENGESELLSCHAFT.

DOMICILIO DEL SOLICITANTE
Leverkusen-Bayerwerk, República Federal Alemana.

72 INVENTOR (ES)
Dr. Fritz Maurer., Dr. Hans-Jochem Riebel., Dr. Rolf Schröder., Dr. Ingeborg Hammann., Dr. Wolfgang Behrenz.

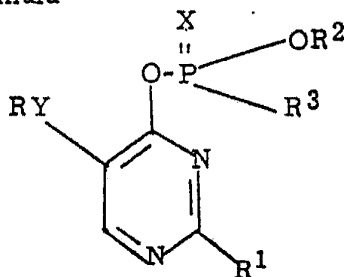
73 TITULAR (ES)

74 REPRESENTANTE
GOMEZ-ACEBO.

La presente invención se refiere a nuevos ésteres pirimidinílicos alcoxi- y alquiltio- sustituidos de los ácidos fosfórico, tionofosfórico, tiolfosfórico, tionotiofosfórico, fosfónicos y tionofosfónicos, a un procedimiento para su producción y a su empleo como insecticidas y acaricidas.

Ya es conocido que ésteres de pirimidina de los ácidos tionofosfórico y tionofosfónicos, por ejemplo el éster O,O-dietil-O-(2-isopropil-6-metil-pirimidin (4) ílico) del ácido tionofosfórico, el éster O,O-dietil-O-(2,5-dimetiltio-6-metil-pirimidin (4) ílico) del ácido tionofosfórico, el éster O-etil-O-(2-isopropoxi-5-acetil-pirimidin (4) ílico) del ácido tionoetanofosfónico y el éster O-metil-O-(2-isopropoxi-5-ciano-pirimidin (4) ílico) del ácido tionoetanofosfónico, tienen propiedades insecticidas y acaricidas (compárese con la patente publicada no examinada de la Rep. Fed. de Alemania No. 2.343.931 y con las patentes estadounidenses Nos. 2.754.243 y 3.886.156).

Ahora se ha encontrado que los nuevos ésteres pirimidinílicos alcoxi- y alquiltio- sustituidos de los ácidos fosfórico, tionofosfórico, tiolfosfórico, tionotiofosfórico, fosfónicos y tionofosfónicos de fórmula



(I)

en la cual

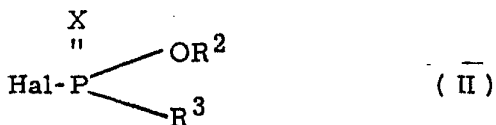
R y R² representan restos alquilo iguales o diferentes;

R¹ representa hidrógeno o alquilo, y

R³ alquilo, alcoxi, alquiltio o fenilo;

5 X e Y representan, independientemente una de otra, oxígeno o azufre, tienen un efecto insecticida y acaricida excelente.

Además fué encontrado que se obtienen los ésteres pirimidínicos alcoxi- y alquiltio- sustituidos de los ácidos fosfórico, tionofosfórico, tiolfosfórico, tionotiofosfórico, fosfónicos y tionofosfónicos de fórmula (I), si halogenuros-ésteres de los ácidos fosfórico, tiono-, tiol- y tionotiol-fosfórico, fosfónicos y tiono-fosfónicos, respectivamente de fórmula

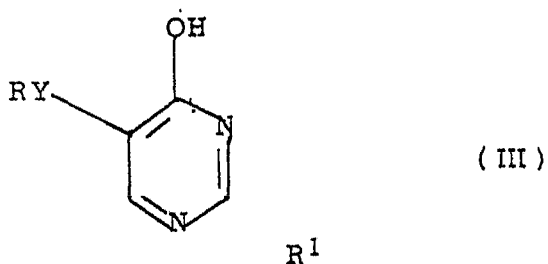


en la cual

15 R², R³ y X tienen los significados arriba indicados y

Hal representa halógeno, preferiblemente cloro,

se hacen reaccionar con 4-hidroxi-pirimidinas alcoxi- o alquiltio-sustituidas de fórmula



en la cual

R y R¹ tienen los significados arriba indicados,

eventualmente en forma de sus sales alcalinas, alcalinotérreas o de amonio, o eventualmente en presencia de un aceptor de ácido, y eventualmente en presencia de un disolvente o de un diluyente.

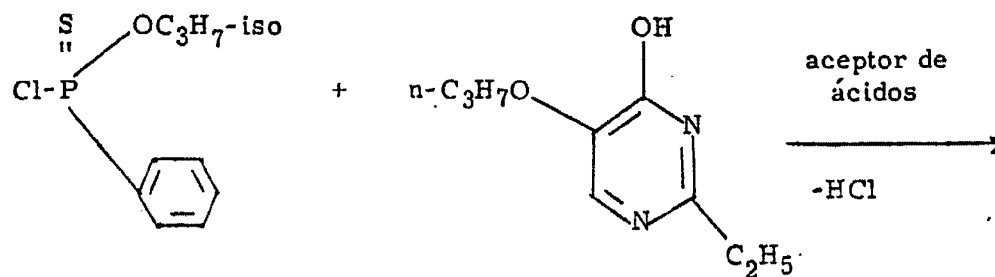
5

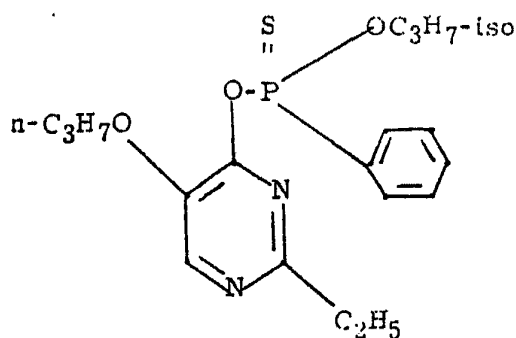
Sorprendentemente, los ésteres pirimidínicos alcoxi- y alquiltio- sustituidos de los ácidos fosfórico, tionofosfórico, tioletfosfórico, tionotioletfosfórico, fosfónicos y tionofosfónicos según la invención muestran un efecto insecticida y acaricida mejor que los ésteres pirimidínicos conocidos de los ácidos tionofosfórico y tionofosfónicos de constitución análoga y de igual orientación de actividad. Por consiguiente, los compuestos según la presente invención representan un enriquecimiento verdadero de la técnica.

10

Si se emplean como sustancias de partida, a título de ejemplo, el cloruro-éster O-iso-propílico del ácido tionofenilfosfónico y la 2-etil-4-hidroxi-5-n-propoxi-pirimidina, el desarrollo de la reacción puede ser representado por el siguiente esquema de fórmulas:

15





Las sustancias de partida a emplear están definidas en forma general por las fórmulas(II) y (III). En las mismas, sin embargo, representan con preferencia

- 5 R y R², restos alquilo, lineales o ramificados, iguales o diferentes, con 1 a 6, particularmente con 1 a 4 átomos de carbono,
- R¹, alquilo lineal o ramificado con 1 a 6, particularmente con 1 a 4 átomos de carbono;
- R³, fenilo ; alquilo lineal o ramificado con 1 a 4, particularmente con 1 a 3 átomos de carbono; alquiltio lineal o ramificado con 1 a 6, particularmente con 1 a 4 átomos de carbono, o alcoxi lineal o ramificado con 1 a 4, particularmente con 1 a 3 átomos de carbono;
- 10
- X, azufre e
- 15 Y, oxígeno.

Los halogenuros-ésteres de los ácidos fosfórico, tiono-, tiol- y tionotiol-fosfórico, fosfónicos y tionofosfónicos (II) son conocidos y preparables sencillamente según procedimientos conocidos de la literatura. Como ejemplos de los mismos sean mencio-

nados en detalle:

- los cloruros-diésteres O, O-dimetílico, O, O-dietílico, O, O-di-n-propílico, O, O-di-iso-propílico, O, O-di-n-butílico, O, O-di-iso-butílico, O, O-di-sec-butílico, O-metil-O-etílico, O-metil-O-n-propílico,
5. O-metil-O-iso-propílico, O-metil-O-n-butílico, O-metil-O-iso-butílico, O-metil-O-sec-butílico, O-etil-O-n-propílico, O-etil-O-iso-propílico, O-etil-O-n-butílico, O-etil-O-sec-butílico, O-etil-O-iso-butílico, O-n-propil-O-butílico y O-iso-propil-O-butílico del ácido tionofosfórico; además,
- 10 los cloruros-diésteres O, S-dimetílico, O, S-dietílico, O, S-di-n-propílico, O, S-di-iso-propílico, O, S-di-n-butílico, O, S-di-iso-butílico, O, S-di-ter-butílico, O, S-di-n-pentílico, O-etil-S-n-propílico, O-etil-S-iso-propílico, O-etil-S-n-butílico, O-etil-S-sec-butílico, O-n-propil-S-etílico, O-n-propil-S-iso-propílico, O-n-butil-S-n-propílico y O-sec-butil-S-etílico del ácido tionotiofosfórico, y los cloruros-ésteres O-metílico, O-etílico, O-n-propílico, O-iso-propílico, O-n-butílico, O-iso-butílico y O-sec-butílico de los ácidos metano-, etanol-, n-propano-, iso-propano- y fenil-tionofosfónicos.
- 15

Las 4-hidroxi-pirimidinas alcoxi- o alquiltio-sustituídas a emplear además como materiales de partida son sintetizadas a partir de amidinas con ésteres alquílicos de ácidos alcoxi- o alquiltio-formilacéticos, eventualmente en presencia de un alcoholato.

20

Como ejemplos de las mismas sean nombradas en detalle:

25

5-metoxi-, 5-etoxi-, 5-n-propoxi-, 5-iso-propoxi-, 5-n-butoxi-
5-iso-butoxi- y 5-sec-butoxi-; 5-metiltio-, 5-etiltio-, 5-n-propiltio-,
5-iso-propiltio-, 5-n-butiltio-, 5-iso-butiltio-; 5-metoxi-2-metil-,
5-etoxi-2-metil-, 5-n-propoxi-2-metil-, 5-iso-propoxi-2-metil-,
5-n-butoxi-2-metil-, 5-iso-butoxi-2-metil- y 5-sec-butoxi-2-metil-;
5-metiltio-2-metil-, 5-etiltio-2-metil-, 5-n-propiltio-2-metil-,
5-iso-propiltio-2-metil-, 5-n-butiltio-2-metil-, 5-iso-butiltio-2-metil-,
5-metoxi-2-etil-, 5-etoxi-2-etil-, 5-n-propoxi-2-etil-, 5-iso-propoxi-
2-etil-, 5-n-butoxi-2-etil-, 5-iso-butoxi-2-etil- y 5-sec-butoxi-2-etil-;
5-metiltio-2-etil-, 5-etiltio-2-etil-, 5-n-propiltio-2-etil-, 5-iso-pro-
piltio-2-etil-, 5-butiltio-2-etil-, 2-iso-butiltio-2-etil-; 5-metoxi-2-n-
propil-, 5-etoxi-2-n-propil-, 5-n-propoxi-2-n-propil-, 5-iso-propoxi-
2-n-propil-, 5-n-butoxi-2-n-propil-, 5-iso-butoxi-2-n-propil- y
5-sec-butoxi-2-n-propil-; 5-metiltio-2-n-propil-, 5-etiltio-2-n-pro-
pil-, 5-n-propiltio-2-n-propil-, 5-iso-propiltio-2-n-propil-,
5-n-butiltio-2-n-propil-, 5-iso-butiltio-2-n-propil-; 5-metoxi-2-iso-
propil-, 5-etoxi-2-iso-propil-, 5-n-propoxi-2-iso-propil-, 5-iso-
propoxi-2-iso-propil-, 5-n-butoxi-2-iso-propil-, 5-iso-butoxi-2-iso-
propil- y 5-sec-butoxi-2-iso-propil-; 5-metiltio-2-iso-propil-,
5-etiltio-2-iso-propil-, 5-n-propiltio-2-iso-propil-, 5-iso-propiltio-
2-iso-propil-, 5-n-butiltio-2-iso-propil-, 5-iso-butiltio-2-iso-propil-;
5-metoxi-2-n-butil-, 5-etoxi-2-n-butil-, 5-n-propoxi-2-n-butil-,
5-iso-propoxi-2-n-butil-, 5-n-butoxi-2-n-butil- y 5-sec-butoxi-2-n-
butil-; 5-metiltio-2-n-butil-, 5-etiltio-2-n-butil-, 5-n-propiltio-2-n-
butil-, 5-iso-propiltio-2-n-butil-, 5-n-butiltio-2-n-butil-,

5-iso-butiltio-2-n-butil-, 5-metoxi-2-iso-butil-, 5-etoxi-2-iso-butil-,
5-n-propoxi-2-iso-butil-, 5-iso-propoxi-2-iso-butil-, 5-n-butoxi-2-
iso-butil-, 5-iso-butoxi-2-iso-butil- y 5-sec-butoxi-2-iso-butil-;
5-metiltio-2-iso-butil-, 5-etiltio-2-isobutil-, 5-n-propiltio-2-iso-bu-
5 til-, 5-iso-propiltio-2-iso-butil-, 5-n-butiltio-2-iso-butil-,
5-iso-butiltio-2-iso-butil-; 5-metoxi-2-sec-butil-, 5-etoxi-2-sec-
butil-, 5-n-propoxi-2-sec-butil-, 5-iso-propoxi-2-sec-butil-, 5-n-
butoxi-2-sec-butil-, 5-iso-butoxi-2-sec-butil- y 5-sec-butoxi-2-sec-
butil-; 5-metiltio-2-sec-butil-, 5-etiltio-2-sec-butil-, 5-n-propiltio-
10 2-sec-butil-, 5-iso-propiltio-2-sec-butil-, 5-n-butiltio-2-sec-butil-,
5-iso-butiltio-2-sec-butil-; 5-metoxi-2-ter-butil-, 5-etoxi-2-ter-bu-
til-, 5-iso-propoxi-2-ter-butil-, 5-N-butoxi-2-ter-butil-, 5-iso-bu-
toxi-2-ter-butil- y 5-sec-butoxi-2-ter-butil-; 5-metiltio-2-ter-butil-,
5-etiltio-2-ter-butil-, 5-n-propiltio-2-ter-butil-, 5-iso-propiltio-2-
15 ter-butil-, 5-n-butiltio-2-ter-butil- y 5-iso-butil-2-ter-butil-4-hidro-
xi-pirimidina.

El procedimiento para la producción de
los compuestos según la invención es realizado preferiblemente con
el empleo concomitante de disolventes y diluyentes apropiados. Co-
20 mo tales entran en consideración prácticamente todos los disolventes
orgánicos inertes. A éstos pertenecen particularmente los hidrocar-
buros alifáticos y aromáticos eventualmente clorados, tales como
benceno, tolueno, xileno, nafta, cloruro de metileno, cloroformo,
tetracloruro de carbono, clorobenceno; los éteres, por ejemplo éter
diétilico y éter dibutílico, dioxano; las cetonas, por ejemplo acetona,
25

metiletilcetona, metilisopropilcetona y metilisobutilcetona; además los nitrilos, tales como acetonitrilo y propionitrilo.

5 Como aceptores de ácido pueden encontrar empleo todos los usuales agentes ligadores de ácidos. Comprobaron ser particularmente eficaces los carbonatos y alcoholatos de metales alcalinos, tales como los carbonatos, metilatos y etilatos de sodio y de potasio y ter-butilato de potasio; además las aminas alifáticas, aromáticas o heterocíclicas, por ejemplo trietilamina, trimetilamina, dimetilanilina, dimetilbencilamina y piridina.

10 La temperatura de reacción puede ser variada entre márgenes amplios. Por lo general se trabaja a temperaturas entre 0 y 120°C, preferiblemente de 10 a 55°C.

La reacción es llevada a cabo generalmente a la presión normal.

15 Para la realización del procedimiento se aplican las sustancias de partida preferiblemente en proporciones equivalentes. Un exceso de uno u otro de los componentes no aporta ninguna ventaja esencial. Los componentes de reacción generalmente son reunidos en uno de los disolventes arriba indicados y, en la mayoría de
20 los casos, son agitados durante una o varias horas a una temperatura más elevada para completar la reacción. Después del enfriamiento, se agrega a la mezcla un disolvente orgánico, por ejemplo tolueno, y se elabora la fase orgánica en forma usual por lavado, secado y eliminación del disolvente por destilación.

25 Los nuevos compuestos se presentan a me-

nudo en forma de aceites que en la mayoría de los casos no pueden ser destilados sin descomposición, pero que pueden ser liberados de los últimos componentes volátiles y así purificados por la llamada "destilación incipiente", vale decir, por un calentamiento prolongado bajo presión reducida a temperaturas moderadamente elevadas. Para su caracterización sirve el índice de refracción.

Como ya se ha mencionado varias veces los ésteres pirimidinílicos alcoxi- y alquiltio- sustituidos de los ácidos fosfórico, tionofosfórico, tiolfosfórico, tionotiofosfórico, fosfónicos y tionofosfónicos se distinguen por una eficacia insecticida y acaricida sobresaliente. Son eficaces contra parásitos de plantas, antihigiénicos y de las provisiones y contra parásitos (ectoparásitos) en el sector de la medicina veterinaria. Teniendo baja fitotoxicidad son efectivos contra insectos tanto chupadores como mordedores y contra ácaros.

Por esta razón los compuestos según la invención pueden ser aplicados con buen resultado como parasiticidas en la protección de plantas, así como en los sectores de la higiene, de la protección de provisiones y de la veterinaria.

A una buena tolerabilidad por las plantas y a una favorable toxicidad para animales de sangre caliente, las sustancias activas se prestan para combatir parásitos animales, particularmente insectos, ácaros y nematodos que ocurren en la agricultura, en la silvicultura, en el sector de la protección de provisiones y materiales, así como en el sector de la higiene. Son eficaces contra especies normalmente sensibles y resistentes, así como contra todos los es-

tados o contra estados individuales de desarrollo.

A los parásitos arriba mencionados pertenecen:

Del orden de los isópodos, por ejemplo *Oniscus asellus*, *Armadillidium vulgare*, *Porcelio scaber*,

5 del orden de los diplópodos, por ejemplo *Blaniulus guttulatus*,

del orden de quilópodos, por ejemplo *Geophilus carpophagus*, *Scutigera spec.*,

del orden de Symphyla, por ejemplo *Scutigera immaculata*,

del orden de los tisanuros, por ejemplo *Lepisma saccharina*,

10 del orden de Collembola, por ejemplo *Onychiurus armatus*,

del orden de ortópteros, por ejemplo *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Leucophaea maderae*, *Blattella germanica*, *Acheta domesticus*, *Grylotalpa spp.*, *Locusta migratoria migratorioides*, *Melanoplus differentialis*, *Schistocerca gregaria*;

15 del orden de dermápteros, por ejemplo *Forficula auricularia*,

del orden de los isópteros, por ejemplo *Reticulitermes spp.*,

del orden de Anoplura, por ejemplo *Phylloxera vastatrix*, *Pemphigus spp.*, *Pediculus humanus corporis*, *Haematopinus spp.*, *Linognathus spp.*,

del orden de Mallophaga, por ejemplo *Trichodectes spp.*, *Damalinea*

20 *spp.*,

del orden de los tisanópteros, por ejemplo *Hercinothrips femoralis*,

Thrips tabaci,

del orden de los heterópteros, por ejemplo *Eurygaster spp.*, *Dysdercus intermedius*, *Piesma quadrata*, *Cimex lectularius*, *Rhodnius prolixus*,

25 *Triatoma spp.*,

- Del orden de los homópteros, por ejemplo *Aleurodes brassicae*,
Bemisia tabaci, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aphis gossypii*,
Brevicoryne brassicae, *Cryptomyzus ribis*, *Doralis fabae*, *Doralis*
pomi, *Eriosoma lanigerum*, *Hyalopterus arundinis*, *Macrosiphum ave-*
5 *nae*, *Myzus* spp., *Phorodon humuli*, *Rhopalosiphum padi*, *Empoasca*
spp., *Euscelis bilobatus*, *Nephotettix cincticeps*, *Lecanium corni*,
Saissetia oleae, *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, *Aonidiella*
aurantii, *Aspidiotus hederae*, *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp.,
del orden de los lepidópteros, por ejemplo *Pectinophora gossypiella*,
10 *Bupalus piniarius*, *Cheimatobia brumata*, *Lithocolletis blancardella*,
Hyponomeuta padella, *Plutella maculipennis*, *Malacosoma neustria*.
Euproctis chrysorrhoea, *Lymantria* spp., *Bucculatrix thurberiella*,
Phyllocnistis citrella, *Agrotis* spp., *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Earias*
insulana, *Heliothis* spp., *Laphygma exigua*, *Mamestra brassicae*, *Pa-*
15 *nolis flammea*, *Prodenia litura*, *Spodoptera* spp., *Trichoplusia ni*,
Carpocapsa pomonella, *Pieris* spp., *Chilo* spp., *Pyrausta nubilalis*,
Ephestia kuehniella, *Galleria mellonella*, *Cacoecia podana*, *Capua*
reticulana, *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Homona mag-*
nanima, *Tortrix viridana*.,
20 del orden de los coleópteros, por ejemplo *Anobium punctatum*, *Rhizo-*
pertha dominica, *Bruchidius obtectus*, *Acanthoscelides obtectus*,
Hylotrupes bajulus, *Agelastica alni*, *Leptinotarsa decemlineata*,
Phaedon cochleariae, *Diabrotica* spp., *Psylliodes chrysocephala*,
Epilachna varivestis, *Atomaria* spp., *Oryzaephilus surinamensis*,
25 *Anthonomus* spp., *Sitophilus* spp., *Otiorrhynchus sulcatus*, *Cosmo'po-*

- lites sordidus, Ceuthorrhynchus assimilis, Hypero postica, Dermestes spp., Trogoderma spp., Anthrenus spp., Attagenus spp., Lyctus spp., Meligethes aeneus, Ptinus spp., Niptus hololeucus, Gibbium psyllodes, Tribolium spp., Tenebrio molitor, Agriotes spp., Conoderus spp.,
- 5 Melolontha melolontha, Amphimallon solstitialis, Costelytra zealandica, del orden de los himenópteros, por ejemplo Diprion spp., Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa spp., del orden de los dípteros, por ejemplo Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Drosophila melanogaster, Musca spp., Fannia spp.,
- 10 Calliphora erythrocephala, Lucilia spp., Chrysomyia spp, Cuterebra spp., Gastrophilus spp., Hyppobosca spp., Stomoxys spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Tabanus spp., Tannia spp., Bibio hortulanus, Oscinella frit, Phorbia spp., Pegomyia hyoscyami, Ceratitis capitata, Dacus oleae, Tipula paludosa,
- 15 del orden de los sifonápteros, por ejemplo Xenopsylla cheopis, Ceratophyllus spp., del orden de los arácnidos, por ejemplo Scorpio maurus, Latrodectus mactans, del orden de los ácaros, por ejemplo Acarus ~~siro~~, Argas spp.,
- 20 Ornithodoros spp., Dermanyssus gallinae, Eriophyes ribis, Phyllocoptruta oleivora, Boophilus spp., Rhipicephalus spp., Amblyomma spp., Hyalomma spp., Ixodes spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Sarcoptes spp., Tarsonemus spp., Bryobia praetiosa, Panonychus spp., Tetranychus spp.

el invento es efectuado en forma de sus formulaciones corrientes en el comercio y/o de las formas de aplicación preparadas de estas formulaciones.

El contenido de sustancia activa de las formas de aplicación preparadas de las formulaciones corrientes en el comercio, puede variar dentro de límites amplios. La concentración de la sustancia activa de las formas de aplicación puede estar entre 0,0000001 y 100 % en peso de sustancia activa, preferiblemente entre 0,01 y 10 % en peso.

La aplicación procede en una forma usual adaptada a las formas de aplicación.

En la aplicación contra parásitos anti-higiénicos y de provisiones, las sustancias activas se distinguen por un sobresaliente efecto residual sobre madera y arcilla, así como por una buena resistencia a álcalis sobre bases encaladas.

Las sustancias activas pueden ser elaboradas en las formulaciones usuales, tales como soluciones, emulsiones, polvos para rociar, suspensiones, polvos, preparados de espolvorear, espumas, pastas, polvos solubles, granulados, aerosoles, concentrados de suspensión y de emulsión, polvos desinfectantes de semilla, sustancias naturales y sintéticas impregnadas con sustancias activas, encapsulaciones finísimas en sustancias polímeras y en envolturas para semillas; además, en formulaciones para dispositivos de fumigación, tales como cartuchos, latas, espirales y similares de fumigación, así como formulaciones de nebulización en frío y en caliente de volumen ul-

trabajo.

Estas formulaciones son producidas en forma conocida, por ejemplo por mezclamiento de las sustancias activas con diluyentes, vale decir, disolventes líquidos, gases licuados bajo presión y/o vehículos sólidos, eventualmente con el empleo de agentes tensioactivos, vale decir, emulgentes y/o agentes dispersantes y/o agentes espumantes. En el caso de la utilización del agua como diluyente pueden emplearse por ejemplo también disolventes orgánicos como disolventes auxiliares.

10 Entran en consideración esencialmente como disolventes líquidos; los hidrocarburos aromáticos, tales como xileno, tolueno, benceno o alquilnaftalenos; los hidrocarburos aromáticos o alifáticos clorados, tales como clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno; los hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano, 15 o parafinas por ejemplo fracciones de petróleo, los alcoholes, tales como butanol o glicol, así como sus éteres y ésteres; cetonas, tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona; disolventes fuertemente polares, tales como dimetilformamida y sulfóxido de dimetilo, así como agua; como diluyentes o vehículos gaseosos licuados, entendiéndose como tales aquellos líquidos que a la temperatura 20 normal y a la presión normal son gaseosos: gases impelentes de aerosoles, tales como hidrocarburos halogenados, así como butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono; como vehículos sólidos: minerales naturales molidos, tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, 25 attapulguita, montmorillonita o tierra de diatomeas, y minerales sintéti-

cos molidos, tales como ácido silícico altamente disperso, óxido de aluminio y silicatos; como vehículos sólidos para granulados: piedras naturales quebradas y fraccionadas, tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, así como granulados sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas, así como granulados de material orgánico, tales como aserrines, cáscaras de nueces de coco, mazorcas y tallos de tabaco; como agentes emulsionantes y/o espumantes: emulsivos no ionógenos y aniónicos, tales como ésteres de polioxietileno y ácidos grasos, éteres de polioxietileno y alcoholes grasos, por ejemplo éteres alquilarilpoliglicólicos, sulfonatos de alquilo, sulfatos de alquilo, sulfonatos de arilo, así como hidrolizados de proteínas como agentes dispersantes: por ejemplo lignina, lejías de desecho de sulfito y metilcelulosa.

En las formulaciones pueden emplearse agentes adherentes, tales como carboximetilcelulosa, polímeros pulverulentos, granulares o en forma de látices naturales y sintéticos, tales como goma arábiga, alcohol polivinílico, acetato de polivinilo.

Pueden emplearse colorantes, tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo óxido de hierro, óxido de titanio, azul de ferrocianuro, y colorantes orgánicos, tales como alizarina, colorantes azóicos de ftalocianina metálica, y micronutrientes, tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y zinc.

Por lo general, las formulaciones contienen entre 0, 1 y 95 % en peso de sustancia activa, preferiblemente entre 0, 5 y 90 %.

Ejemplo A.

Ensayo con *Plutella*

Disolvente: 3 partes en peso de acetona

Emulgente: 1 parte en peso de éter alquilaril-poliglicólico

5

Para obtener una preparación adecuada de sustancia activa, se mezcla 1 parte en peso de la sustancia activa con la cantidad indicada del disolvente y con la cantidad indicada de emulgente y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

10

La preparación de sustancia activa es rociada sobre hojas de col (*Brassica oleracea*) hasta su mojadura al grado de formación de rocío, y sobre las mismas se colocan orugas de arañuelo de las coles (*Plutella maculipennis*).

15

Al cabo de los tiempos indicados, se determina la destrucción en %, significando 100 % que fueron matadas todas las orugas, mientras que 0 % significa que no fué matada ninguna oruga.

Las sustancias activas, sus concentraciones, los tiempos de evaluación y los resultados constan en la siguiente tabla 1:

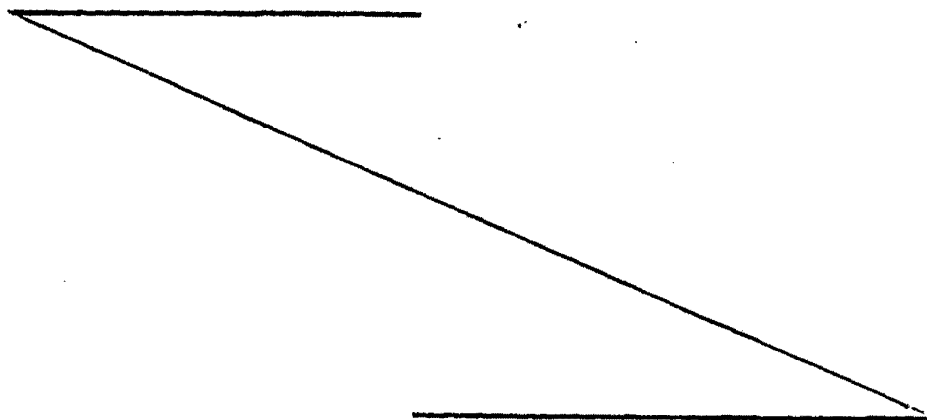


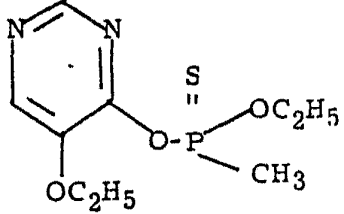
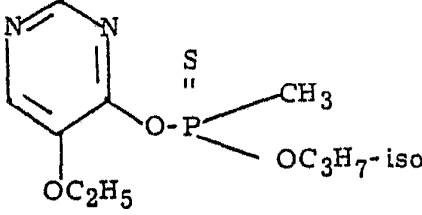
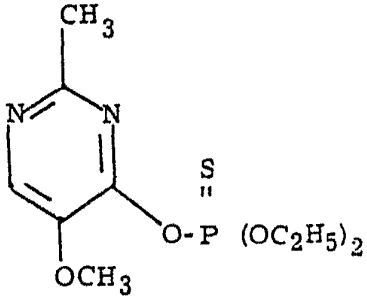
Tabla 1.

(Ensayo con Plutella)

Sustancia activa	concentración de la sustancia activa en %	grado de destrucción en % al cabo de 3 días
<p>(conocida)</p>	<p>0,1</p> <p>0,01</p>	<p>80</p> <p>0</p>
<p>(conocida)</p>	<p>0,1</p> <p>0,01</p>	<p>100</p> <p>0</p>
	<p>0,1</p> <p>0,01</p>	<p>100</p> <p>100</p>

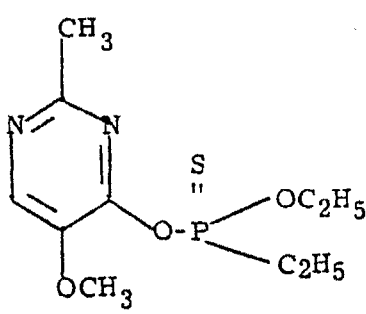
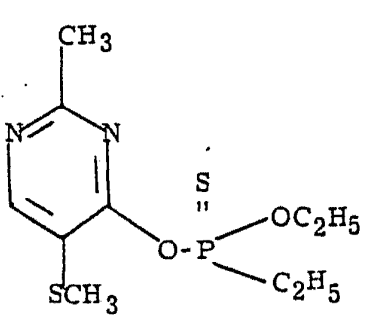
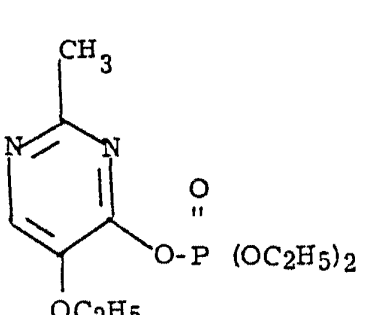
T a b l a 1. (continuación)

(Ensayo con Plutella)

Sustancia activa	concentración de la sustancia activa en %	grado de destrucción en % al cabo de 3 días
	0,1	100
	0,01	100
	0,1	100
	0,01	100
	0,1	100
	0,01	100

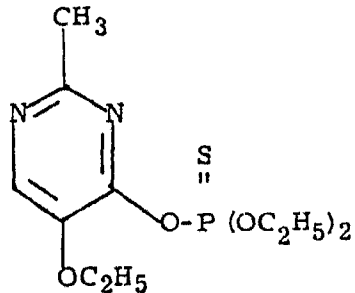
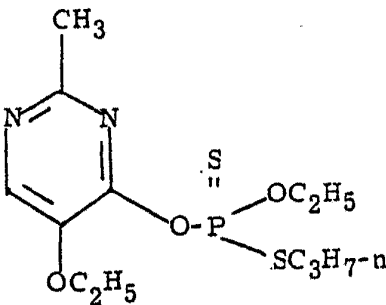
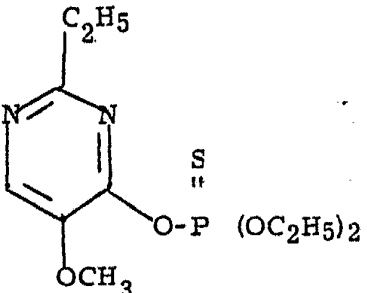
T a b l a 1. (continuación)

(Ensayo con Plutella)

Sustancia activa	concentración de la sustancia activa en %	grado de destrucción en % al cabo de 3 días
	0,1	100
	0,01	100
	0,1	100
	0,01	100
	0,1	100
	0,01	100

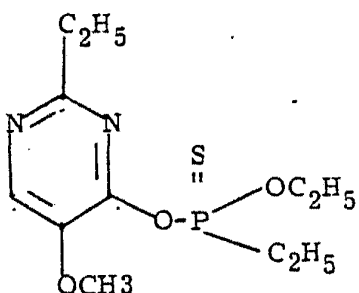
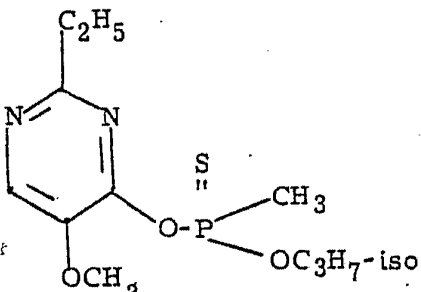
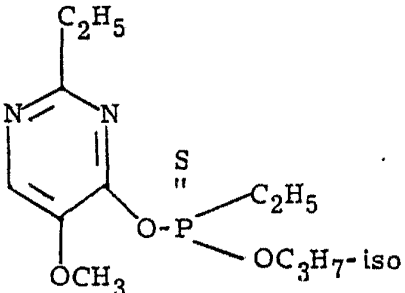
T a b l a 1. (continuación)

(Ensayo con Plutella)

Sustancia activa	concentración de la sustancia activa en %	grado de destrucción en % al cabo de 3 días
	0, 1	100
	0, 01	100
	0, 1	100
	0, 01	100
	0, 1	100
	0, 01	100

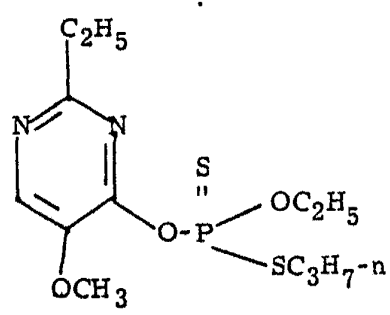
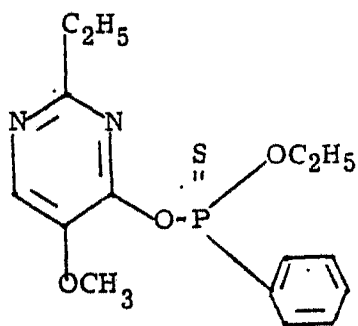
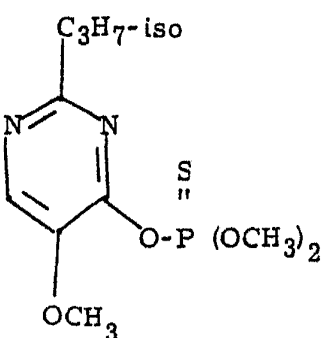
T a b l a 1. (continuación)

(Ensayo con *Plutella*)

Sustancia activa	concentración de la sustancia activa en %	grado de destrucción en % al cabo de 3 días
	0, 1	100
	0, 01	100
	0, 1	100
	0, 01	100
	0, 1	100
	0, 01	100

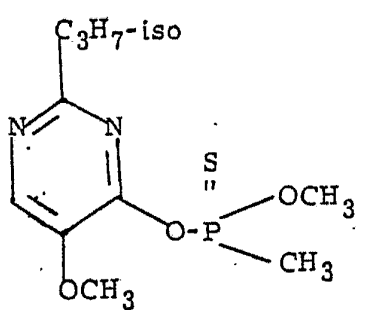
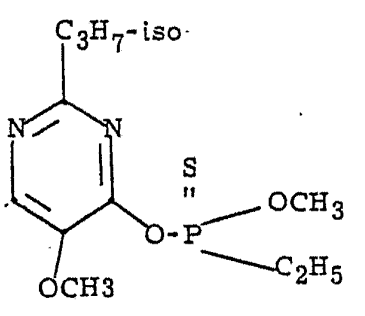
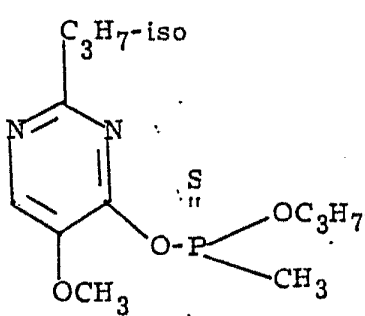
T a b l a 1. (continuación)

(Ensayo con *Plutella*)

Sustancia activa	concentración de la sustancia activa en %	grado de destrucción en % al cabo de 3 días
	0,1	100
	0,01	100
	0,1	100
	0,01	100
	0,1	100
	0,01	100

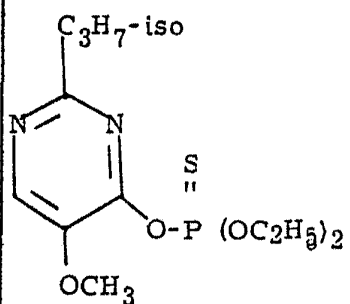
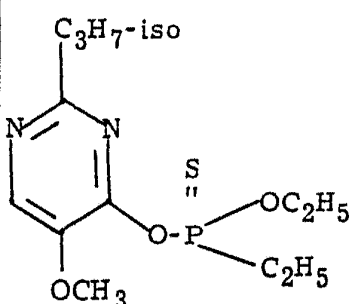
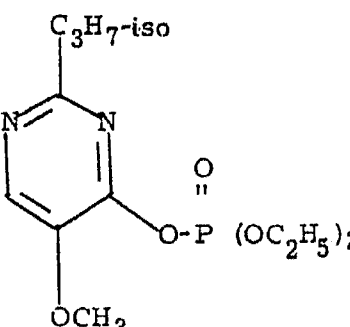
T a b l a 1. (continuación)

(Ensayo con Plutella)

Sustancia activa	concentración de la sustancia activa en %	grado de destrucción en % al cabo de 3 días
 <p>Chemical structure: A pyridine ring with an isopropyl group (C₃H₇-iso) at position 3, a methoxy group (OCH₃) at position 5, and a phosphorus atom at position 2. The phosphorus atom is bonded to a sulfur atom (S), a methoxy group (OCH₃), and a methyl group (CH₃).</p>	0,1	100
	0,01	100
 <p>Chemical structure: A pyridine ring with an isopropyl group (C₃H₇-iso) at position 3, a methoxy group (OCH₃) at position 5, and a phosphorus atom at position 2. The phosphorus atom is bonded to a sulfur atom (S), a methoxy group (OCH₃), and an ethyl group (C₂H₅).</p>	0,1	100
	0,01	100
 <p>Chemical structure: A pyridine ring with an isopropyl group (C₃H₇-iso) at position 3, a methoxy group (OCH₃) at position 5, and a phosphorus atom at position 2. The phosphorus atom is bonded to a sulfur atom (S), a methoxy group (OCH₃), and an isopropyl group (OC₃H₇-iso).</p>	0,1	100
	0,01	100

T a b l a 1. (continuación)

(Ensayo con *Plutella*)

Sustancia activa	concentración de la sustancia activa en %	grado de destrucción en % al cabo de 3 días
	0,1	100
	0,01	100
	0,1	100
	0,01	100
	0,1	100
	0,01	100

T a b l a 1. (continuación)

(Ensayo con *Plutella*)

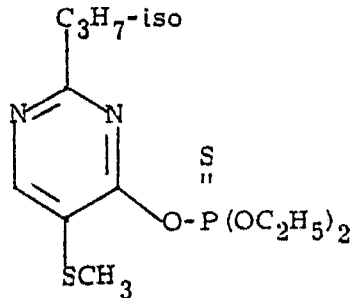
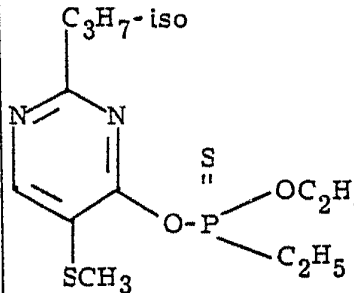
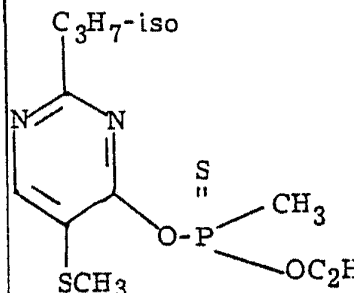
Sustancia activa	concentración de la sustancia activa en %	grado de destrucción en % al cabo de 3 días
	0,1	100
	0,01	100
	0,1	100
	0,01	100
	0,1	100
	0,01	100

Tabla 1. (continuación)

(Ensayo con Plutella)

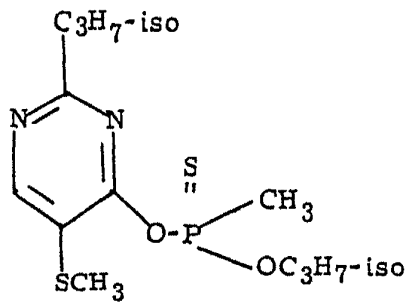
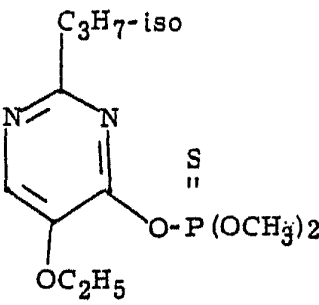
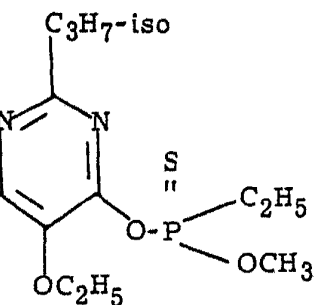
Sustancia activa	concentración de la sustancia activa en %	grado de destrucción en % al cabo de 3 días
	0, 1	100
	0, 01	100
	0, 1	100
	0, 01	100
	0, 1	100
	0, 01	100

Tabla 1. (continuación)

(Ensayo con *Plutella*)

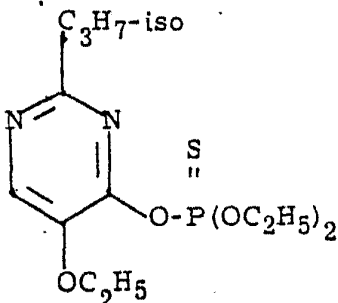
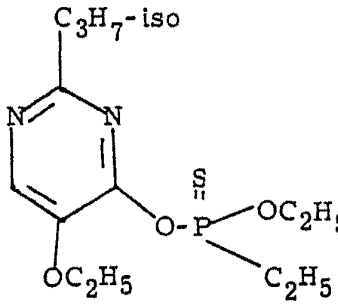
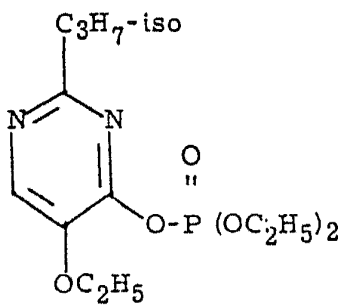
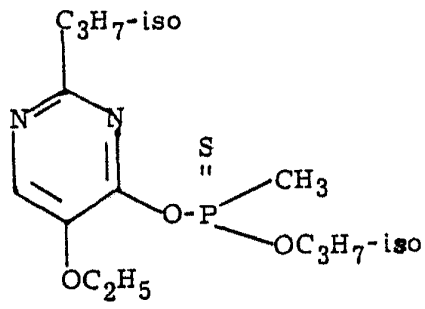
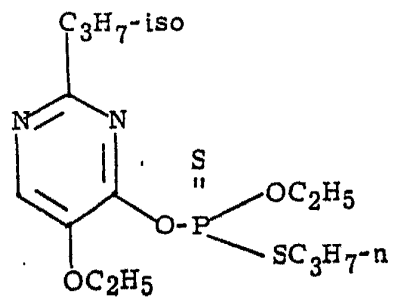
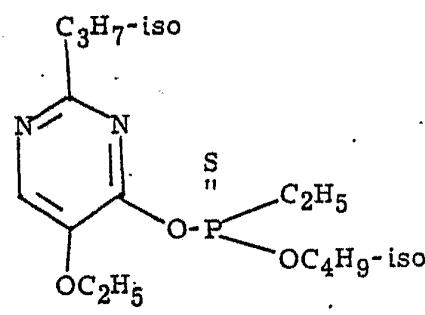
Sustancia activa	concentración de la sustancia activa en %	grado de destrucción en % al cabo de 3 días
	0,1	100
	0,01	100
	0,1	100
	0,01	100
	0,1	100
	0,01	100

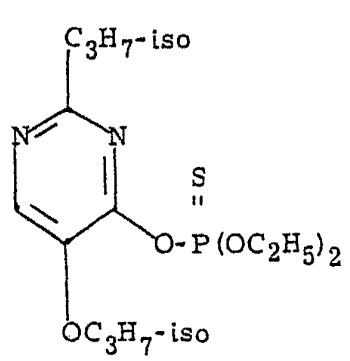
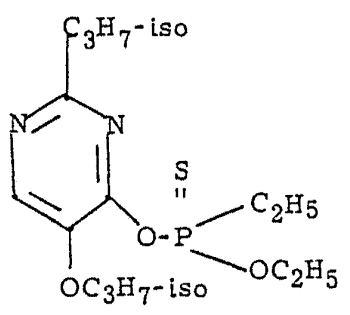
Tabla 1. (continuación)

(Ensayo con Plutella)

Sustancia activa	concentración de la sustancia activa en %	grado de destrucción en % al cabo de 3 días
	0,1	100
	0,01	100
	0,1	100
	0,01	100
	0,1	100
	0,01	100

T a b l a 1. (continuación)

(Ensayo con Plutella)

Sustancia activa	concentración de la sustancia activa en %	grado de destrucción en % al cabo de 3 días
	0,1	100
	0,01	100
	0,1	100
	0,01	100

Ejemplo B.

Ensayo con *Tetranychus* (resistente)

Disolvente: 3 partes en peso de acetona

Emulgente: 1 parte en peso de éter alquilaril-poliglicólico

5

Para la producción de una preparación adecuada de sustancia activa, se mezcla 1 parte en peso de la sustancia activa con la cantidad indicada del disolvente y la cantidad indicada del emulgente, y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

10

Con la preparación de sustancia activa, unas plantas de habichuelas (*Phaseolus vulgaris*) fuertemente atacadas por todos los estados de desarrollo del ácaro hilador común o ácaro hilador de habichuelas (*Tetranychus urticae*), son rociadas hasta su grado de mojadura de formación de gotas.

15

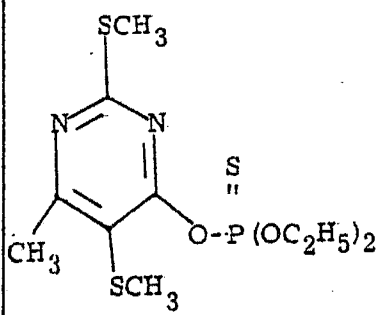
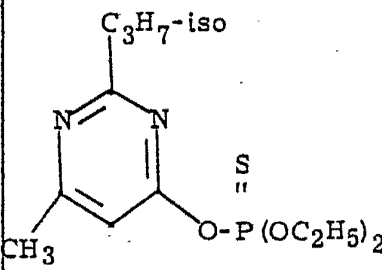
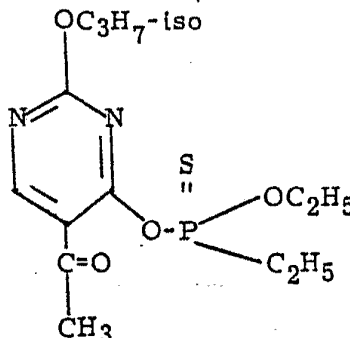
Al cabo de los tiempos indicados, la destrucción es determinada en %, significando 100 % que fueron matados todos los ácaros hiladores; 0 % significa que no fueron matados ningunos ácaros.

20

Las sustancias activas, las concentraciones de las sustancias activas, los tiempos de evaluación y los resultados constan en la siguiente tabla 2:

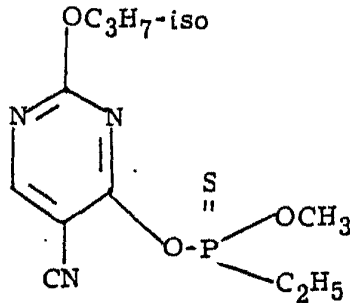
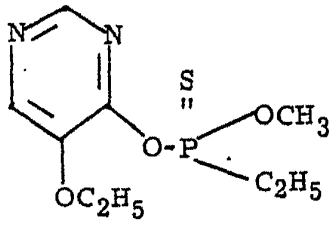
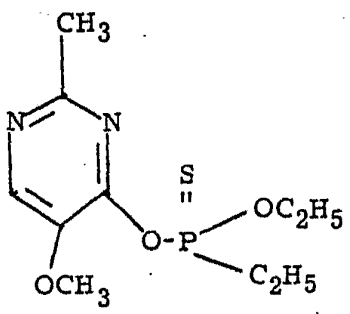
Tabla 2.

(Ensayo con Tetranychus)

Sustancia activa	concentración de la sustancia activa en %	grado de destrucción en % al cabo de 2 días
 <p>(conocida)</p>	0,1	0;
 <p>(conocida)</p>	0,1 0,01	— 95 0
 <p>(conocida)</p>	0,1 0,01	20 0

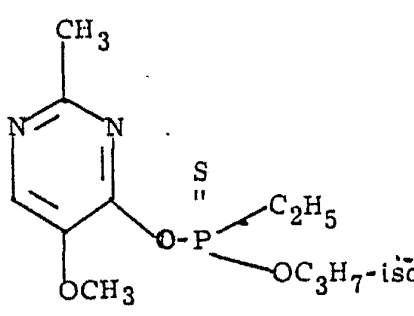
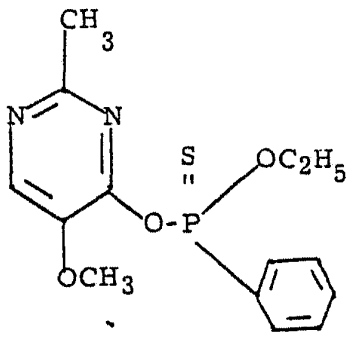
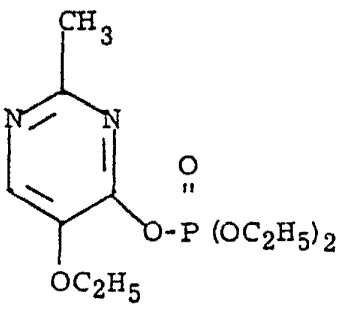
T a b l a 2. (continuación)

(Ensayo con Tetranychus)

Sustancia activa	concentración de la sustancia activa en %	grado de destrucción en % al cabo de 2 días
	0, 1	50
	0, 01	0
(conocida)		
	0, 1	100
	0, 01	100
	0, 1	100
	0, 01	98

T a b l a 2. (continuación)

(Ensayo con Tetra nychus)

Sustancia activa	concentración de la sustancia activa en %	grado de destrucción en % al cabo de 2 días
	0,1	100
	0,01	80
	0,1	99
	0,01	95
	0,1	99
	0,01	80

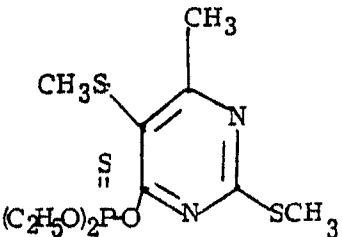
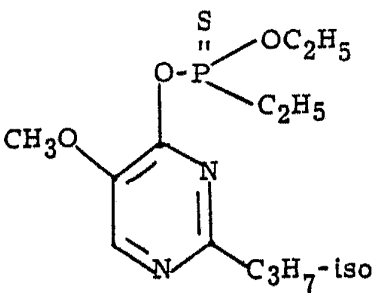
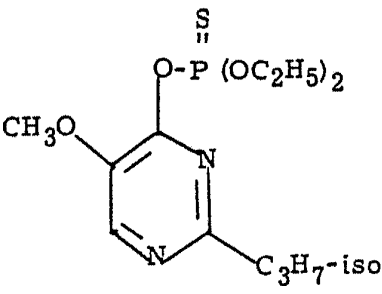
T a b l a 2. (continuación)

(Ensayo con Tetranychus)

Sustancia activa	concentración de la sustancia activa en %	grado de destrucción en % al cabo de 2 días
	0,1 0,01	100 100
	0,1 0,01	100 90

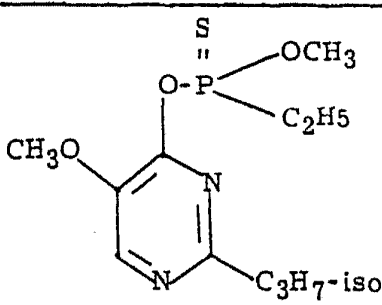
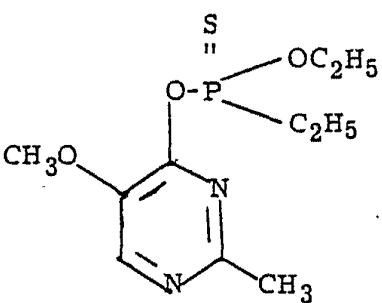
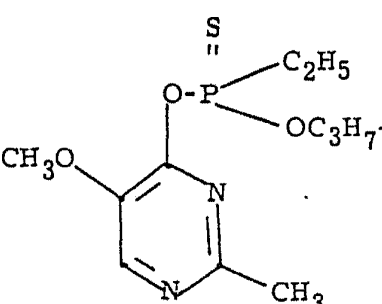
Tabla 3.

(Ensayo de tiempo letal LT_{100} para dípteros / *Aedes aegypti*)

Sustancia activa	concentración de la sustancia activa en la solución en %	TL_{100} en minutos (') u horas (h)
 <p>(conocida)</p>	0,02	3 h = 0 %
	0,02	120 '
	0,02	120 '

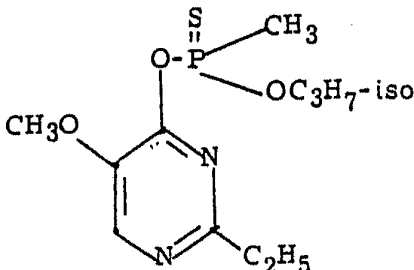
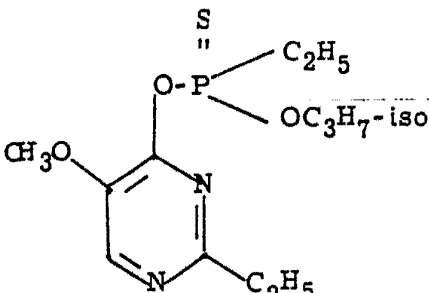
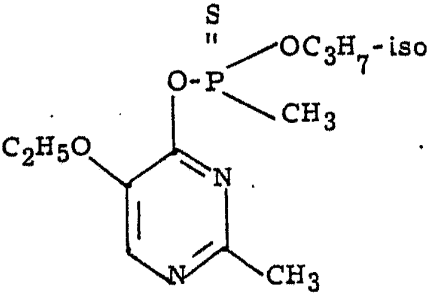
T a b l a 3. (continuación)

(Ensayo de tiempo letal LT_{100} para dípteros / *Aedes aegypti*)

Sustancia: activa	concentración de la sustancia activa en la solución en %	TL_{100} en minutos (') u horas (h)
	0,02	120 '
	0,02	60 '
	0,02	60 '

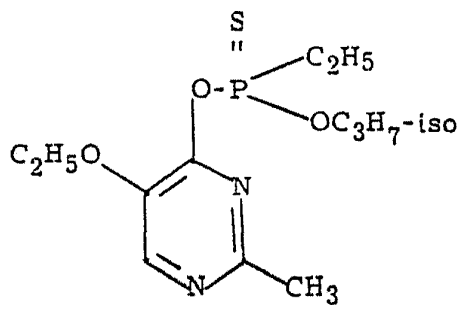
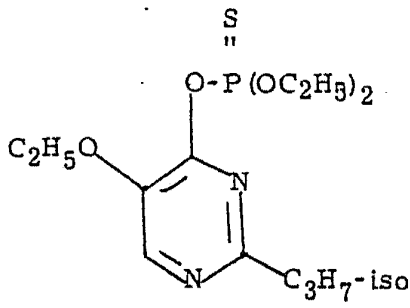
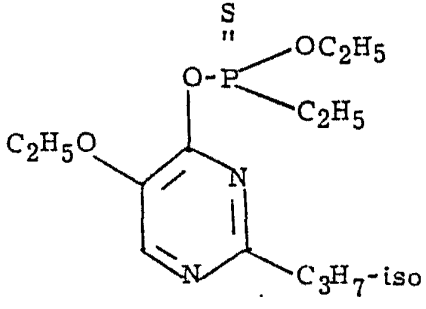
T a b l a 3. (continuación)

(Ensayo de tiempo letal LT_{100} para dípteros / *Aedes aegypti*)

Sustancia activa	concentración de la sustancia activa en la solución en %	TL_{100} en minutos (') u horas (h)
	0,02	60 '
	0,02	60 '
	0,02	120 '

T a b l a 3. (continuación)

(Ensayo de tiempo letal LT_{100} para dípteros / *Aedes aegypti*)

Sustancia activa :	concentración de la sustancia activa en la solución en %	TL_{100} en minutos (') u horas (h)
	0,02	120 '
	0,02	120 '
	0,02	60 '

T a b l a 3. (continuación)

(Ensayo de tiempo letal LT_{100} para dípteros / *Aedes aegypti*)

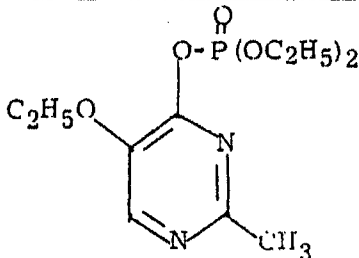
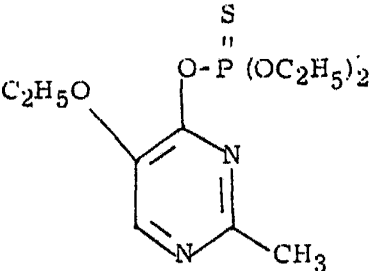
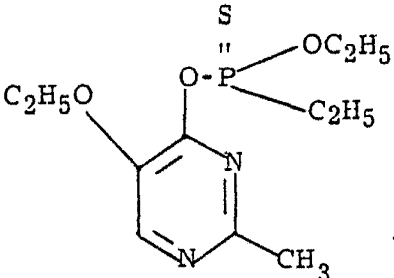
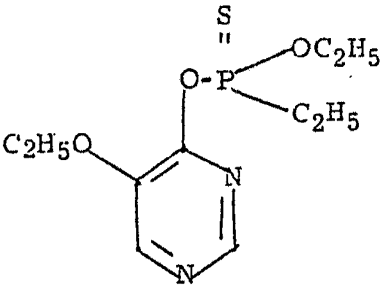
Sustancia activa	concentración de la sustancia activa en la solución en %	TL_{100} en minutos (') u horas (h)
	0,02	120 '
	0,02	120 '
	0,02	120 '
	0,02	60 '

Tabla 4.

(Ensayo de dosis letal DL_{100} / *Sitophilus granarius*) .

Sustancia activa	concentración de la sustancia activa en la solución en %	grado de destrucción en %
<p>(conocida)</p>	0,02	0
	0,02	100
	0,02	100

T a b l a 4-(continuación)

(Ensayo de dosis letal DL₁₀₀ / *Sitophilus granarius*)

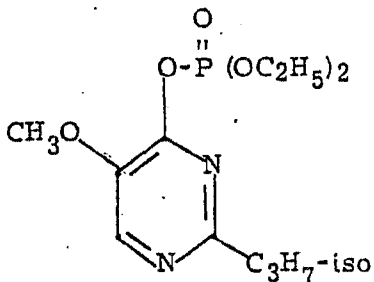
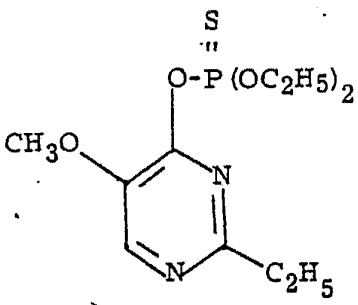
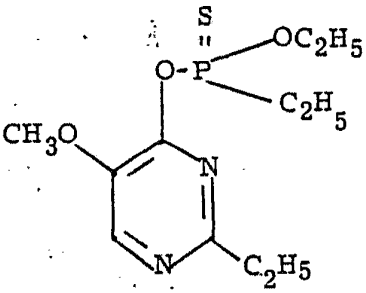
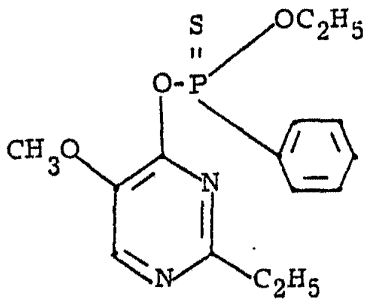
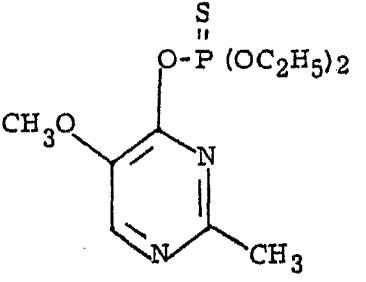
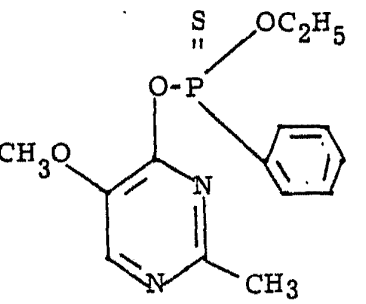
Sustancia activa	concentración de la sustancia activa en la solución en %	grado de destrucción en %
	0,02	100
	0,02	100
	0,02	100

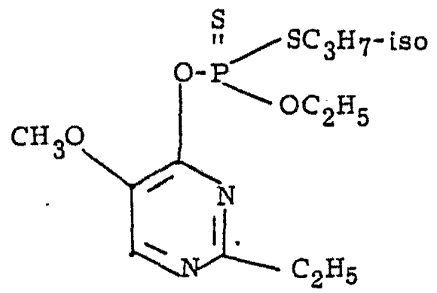
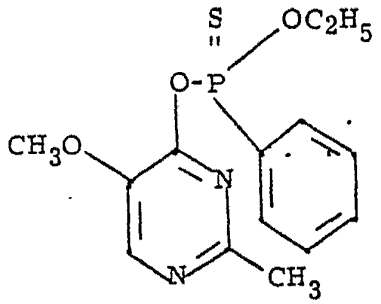
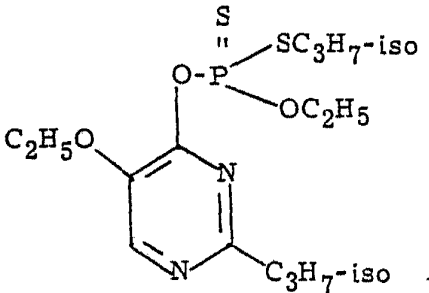
Tabla 4. (continuación)

(Ensayo de dosis letal DL₁₀₀. / Sitophilus granarius)

Sustancia activa	concentración de la sustancia activa en la solución en ‰	grado de destrucción en ‰
	0,02	100
	0,02	100
	0,02	100

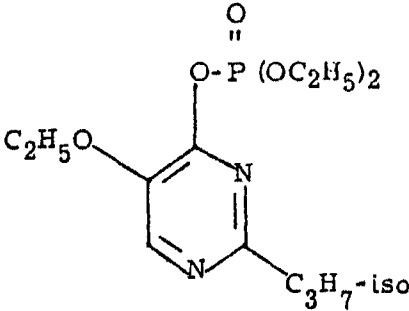
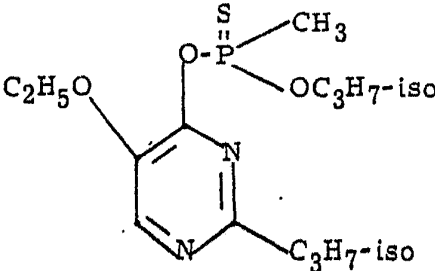
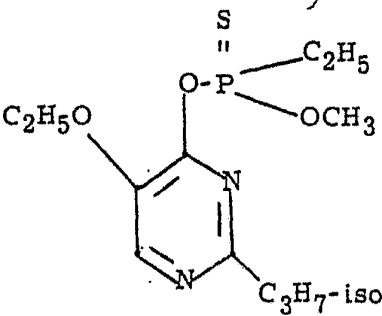
T-a b-l a 4-(continuación)

(Ensayo de dosis letal DL_{100} / *Sitophilus granarius*)

Sustancia activa	concentración de la sustancia activa en la solución en %	grado de destrucción en %
	0,02	100
	0,02	100
	0,02	90

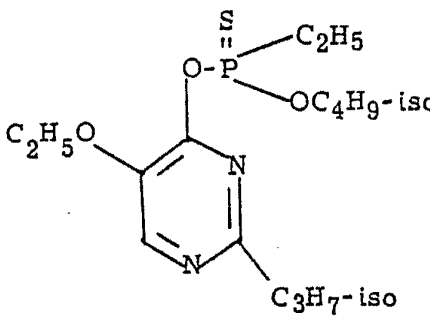
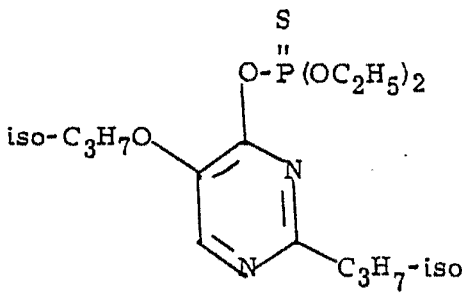
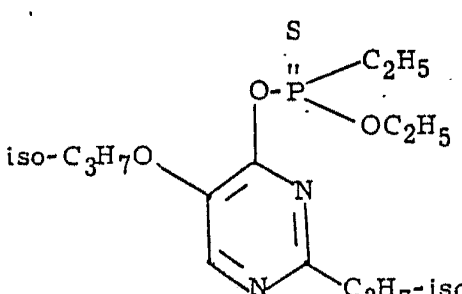
T a b l a 4-(continuación)

(Ensayo de dosis letal DL₁₀₀ / Sitophilus granarius)

Sustancia activa	concentración de la sustancia activa en la solución en %	grado de destrucción en %
	0,02	100
	0,02	100
	0,02	100

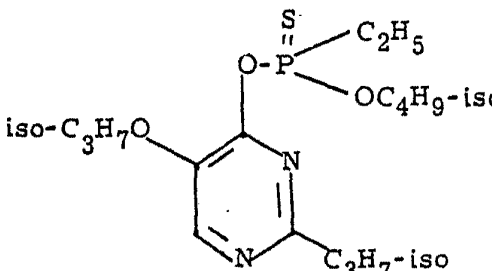
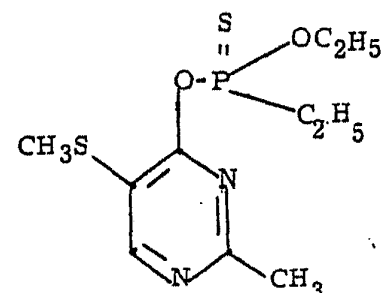
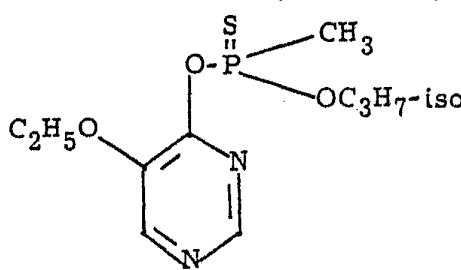
T a b l a 4. (continuación)

(Ensayo de dosis letal DL₁₀₀ / *Sitophilus granarius*)

Sustancia activa	concentración de la sustancia activa en la solución en %	grado de destrucción en %
	0,02	100
	0,02	100
	0,02	100

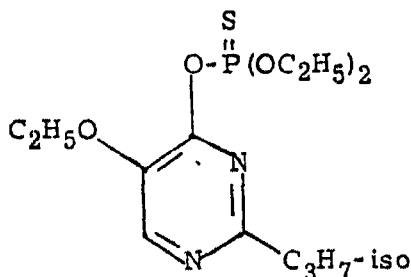
T a b l a 4. (continuación)

(Ensayo de dosis letal DL₁₀₀ / *Sitophilus granarius*)

Sustancia activa	concentración de la sustancia activa en la solución en %	grado de destrucción en %
	0,02	100
	0,02	90
	0,02	100

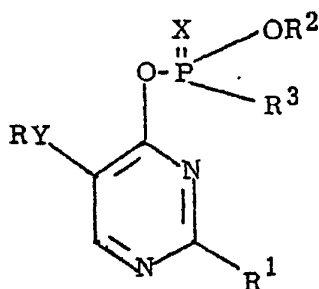
Ejemplos de preparación

Ejemplo 1.






En una suspensión de 18,2 g (0,1 mol) de
 5 2-iso-propil-4-hidroxi-5-etoxi-pirimidina, 14,5 g (0,105 moles) de
 carbonato de potasio y 200 ml de acetonitrilo, se instilan a 20°C 18,8g
 (0,1 mol) de cloruro-diéster O, O-dietílico del ácido tionofosfórico. Se
 calienta la mezcla de reacción durante 3 horas a 40°C, se la enfría y
 se la vierte en 300 ml de tolueno. La solución toluénica es lavada con
 10 una solución saturada de bicarbonato de sodio y con agua, y deshidrata-
 da con sulfato de sodio y luego concentrada. Después de la destilación
 incipiente se obtienen 13 g (39 % de la teoría) del éster O, O-dietil-O-
 (2-iso-propil-5-etoxi-pirimidin (4) ílico) del ácido tionofosfórico en
 forma de aceite amarillo con índice de refracción $n_D^{23} : 1,4960$;



15 En forma análoga pueden sintetizarse los
 siguientes compuestos de fórmula:



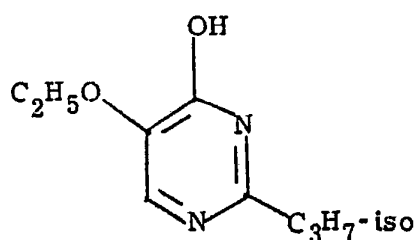
(I)

Ejemplo No.	R	R ¹	R ²	R ³	X	Y	rendimiento (% de la teoría)	índice de refracción
2	C ₂ H ₅	C ₃ H ₇ -iso	C ₂ H ₅	C ₃ H ₇ S	O	S	26	n _D ²³ : 1, 5269
3	C ₂ H ₅	C ₃ H ₇ -iso	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	S	O	41	n _D ²³ : 1, 5071
4	C ₂ H ₅	C ₃ H ₇ -iso	CH ₃	OCH ₃	S	O	30	n _D ²⁰ : 1, 5160
5	C ₂ H ₅	C ₃ H ₇ -iso	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	O	O	54	n _D ²⁰ : 1, 4746
6	C ₂ H ₅	C ₃ H ₇ -iso	C ₃ H ₇ -iso	CH ₃	S	O	88	n _D ²⁰ : 1, 5030
7	C ₂ H ₅	C ₃ H ₇ -iso	CH ₃	C ₂ H ₅	S	O	99	n _D ²⁰ : 1, 5170
8	C ₂ H ₅	C ₃ H ₇ -iso	C ₄ H ₉ -iso	C ₂ H ₅	S	O	69	n _D ²⁰ : 1, 4983
9	C ₃ H ₇ -iso	C ₃ H ₇ -iso	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	S	O	54	n _D ²⁴ : 1, 4928
10	C ₃ H ₇ -iso	C ₃ H ₇ -iso	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	S	O	68	n _D ²⁴ : 1, 5019
11	C ₃ H ₇ -iso	C ₃ H ₇ -iso	C ₄ H ₉ -iso	C ₂ H ₅	S	O	70	n _D ²⁴ : 1, 4925
12	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	S	S	38	n _D ²² : 1, 5358
13	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	S	S	47	n _D ²² : 1, 5480
14	CH ₃	C ₃ H ₇ -iso	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	S	S	45	n _D ²² : 1, 5258
15	CH ₃	C ₃ H ₇ -iso	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	S	S	66	n _D ²² : 1, 5380
16	CH ₃	C ₃ H ₇ -iso	C ₃ H ₇ -iso	CH ₃	S	S	63	n _D ²² : 1, 5342
17	CH ₃	C ₃ H ₇ -iso	C ₂ H ₅	CH ₃	S	S	77	n _D ²² : 1, 5443
18	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	O	O	17	n _D ²² : 1, 4682
19	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	S	O	21	n _D ²² : 1, 4981
20	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	S	O	76	n _D ²² : 1, 5152
21	CH ₃	C ₃ H ₇ -iso	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	S	O	83	n _D ²² : 1, 5122
22	CH ₃	C ₃ H ₇ -iso	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	S	O	76	n _D ²² : 1, 5011
23	CH ₃	C ₃ H ₇ -iso	CH ₃	C ₂ H ₅	S	O	87	n _D ²¹ : 1, 5196
24	CH ₃	C ₃ H ₇ -iso	CH ₃	OCH ₃	S	O	34	n _D ²¹ : 1, 5268

Ejemplo No.	R	R ¹	R ²	R ³	X	Y	rendimiento (% de la teoría)	índice de refracción
25	CH ₃	C ₃ H ₇ -iso	C ₃ H ₇ -iso	CH ₃	S	O	92	n _D ²¹ : 1,5099
26	CH ₃	C ₃ H ₇ -iso	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	O	O	50	n _D ²² : 1,4673
27	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	S	O	70	n _D ²² : 1,5027
28	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	SC ₃ H ₇ -n	S	O	65	n _D ²⁰ : 1,5282
29	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	S	O	81	n _D ²⁰ : 1,4990
30	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	S	O	85	n _D ²² : 1,5157
31	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅		S	O	73	n _D ²² : 1,5623
32	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	S	O	80	n _D ²² : 1,5244
33	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	S	O	59	n _D ²² : 1,5075
34	CH ₃	CH ₃	C ₃ H ₇ -iso	C ₂ H ₅	S	O	85	n _D ²² : 1,5138
35	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅		S	O	57	n _D ²² : 1,5732
36	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₃ H ₇ -iso	CH ₃	S	O	90	n _D ²² : 1,5140
37	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₃ H ₇ -iso	C ₂ H ₅	S	O	88	n _D ²² : 1,5095
38	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	SC ₃ H ₇ -n	S	O	60	n _D ²² : 1,5319
39	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₃ H ₇ -iso	CH ₃	S	O	80	P.f. = 57°C
40	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₃ H ₇ -iso	C ₂ H ₅	S	O	88	n _D ²² : 1,5067
41	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅		S	O	79	n _D ²² : 1,5641

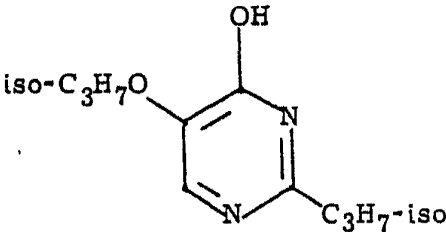
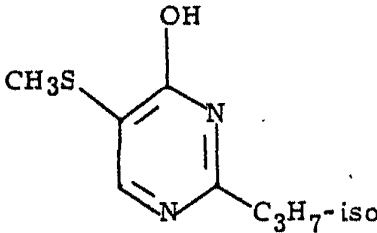
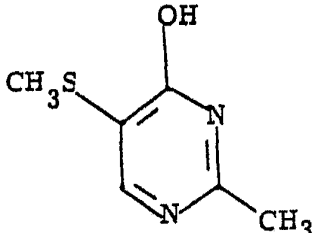
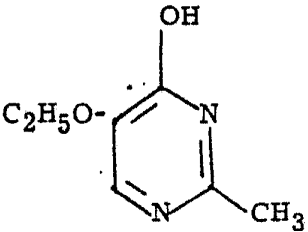
Ejemplo No.	R	R ¹	R ²	R ³	X	Y	rendimiento (% de la teoría)	índice de refracción
42	CH ₃	C ₃ H ₇ -iso	CH ₃	CH ₃	S	O	35	n _D ²⁵ : 1,5191
43	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	O	O	47	n _D ²⁶ : 1,4778
44	CH ₃	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	S	O	69	P.f. = 41°C
45	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	S	O	69	n _D ²³ : 1,5262
46	CH ₃	CH ₃	C ₃ H ₇ -iso	CH ₃	S	O	69	n _D ²³ : 1,5160
47	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	S	O		
48	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	O	O	55	n _D ²⁷ : 1,4775
49	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	S	O		
50	C ₂ H ₅	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	S	O	80	n _D ²³ : 1,5197
51	C ₂ H ₅	H	C ₂ H ₅	CH ₃	S	O	84	n _D ²³ : 1,5264
52	C ₂ H ₅	H	C ₃ H ₇ -iso	CH ₃	S	O	87	n _D ²³ : 1,5159
53	C ₂ H ₅	H	CH ₃	C ₂ H ₅	S	O	69	n _D ²³ : 1,5320
54	C ₂ H ₅	C ₃ H ₇ -iso	C ₂ H ₅		S	O	52	n _D ²⁴ : 1,5590
55	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅		S	S	38	n _D ²⁴ : 1,6120

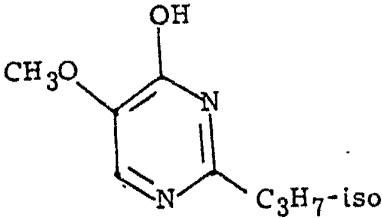
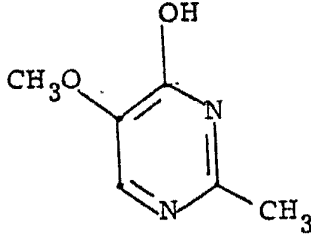
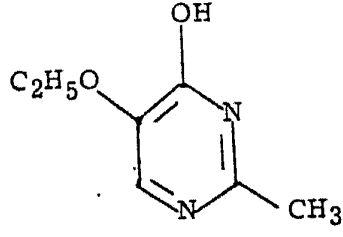
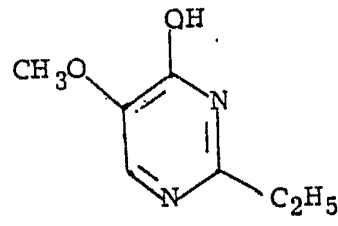
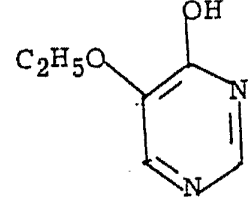
Las 4-hidroxi-pirimidinas (III) requeridas como materiales de partida pueden ser preparadas, por ejemplo, como se describe a continuación:



- 5 Una suspensión de 21,6 g (0,4 moles) de metilato de sodio, 24,5 g (0,2 moles) de hidrocloreuro de iso-butilamidina y 32 g (0,2 moles) de éster etílico del ácido formiletoxiacético, es calentada durante 6 horas con reflujo. Entonces la mezcla es concentrada por evaporación y el residuo es recogido en 200 ml de
- 10 agua. La fase acuosa es mezclada, bajo refrigeración con hielo, con ácido clorhídrico concentrado hasta $\text{pH} \approx 6$ y subsiguientemente extraída dos veces con 200 ml de cloruro de metileno cada vez. Los extractos reunidos de cloruro de metileno son deshidratados con sulfato de sodio y luego concentrados. Se obtienen 22 g (60,5 % de la teoría)
- 15 de 2-iso-propil-5-etoxi-4-hidroxi-pirimidina en forma de cristales incoloros de punto de fusión 154°C .

En forma análoga pueden sintetizarse los siguientes materiales de partida:

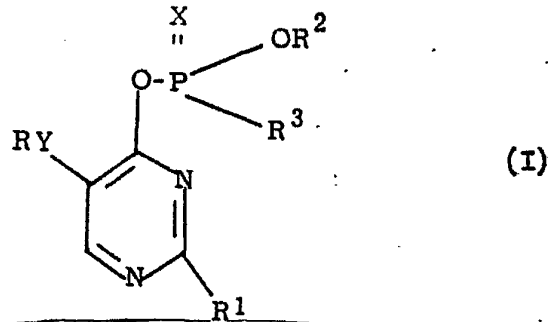
Constitución	rendimiento (% de la teoría)	punto de fusión (°C)
 <p>Chemical structure: A pyridine ring with a hydroxyl group (OH) at position 2, an isopropoxy group (iso-C₃H₇O) at position 4, and an isopropyl group (C₃H₇-iso) at position 6.</p>	56	108-109
 <p>Chemical structure: A pyridine ring with a hydroxyl group (OH) at position 2, a methylsulfanyl group (CH₃S) at position 4, and an isopropyl group (C₃H₇-iso) at position 6.</p>	49	175
 <p>Chemical structure: A pyridine ring with a hydroxyl group (OH) at position 2, a methylsulfanyl group (CH₃S) at position 4, and a methyl group (CH₃) at position 6.</p>	99	>220
 <p>Chemical structure: A pyridine ring with a hydroxyl group (OH) at position 2, an ethoxy group (C₂H₅O-) at position 4, and a methyl group (CH₃) at position 6.</p>	61	160

Constitución	rendimiento (% de la teoría)	punto de fusión (°C)
 <chem>CC(C)C1=CN(C(=O)O)C(OC)=CN1</chem>	65	167
 <chem>CC1=CN(C(=O)O)C(OC)=CN1</chem>	51	206
 <chem>CC1=CN(C(=O)O)C(OCC)=CN1</chem>	37	-
 <chem>CC1=CN(C(=O)O)C(OC)=CN1CC</chem>	65	-
 <chem>OCC1=CN(C(=O)O)C=CN1</chem>	45	137

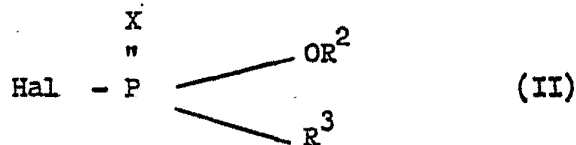
5 Descrita suficientemente la naturaleza del invento, así como la manera de realizarse en la práctica, debe hacerse constar que las disposiciones anteriormente indicadas son susceptibles de modificaciones de detalle en cuanto no alteren su principio fundamental.

REIVINDICACIONES

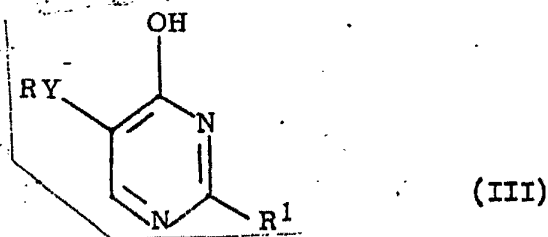
1.- Procedimiento para la obtención de ésteres pirimidínicos alcoxi- y alquiltio- sustituidos, de los ácidos [tiono-(tiol)]-fosfo-rizo(nico) de fórmula



en la cual R y R² representan restos alquilo iguales o diferentes; R¹ representa hidrógeno o alquilo, y R³, alquilo, alcoxi, alquiltio o fenilo; X e Y representan, independientemente una de otra, oxígeno o azufre; caracterizado por-
10 que halogenuros-ésteres de los ácidos fosfórico, tiono-, tiol- y tionotiol-fosfórico, fosfónicos y tiono-fosfónicos, respectivamente de fórmula



15 en la cual R², R³ y X tienen los significados indicados anteriormente y Hal representa halógeno, preferentemente cloro, se hacen reaccionar con 4-hidroxi-pirimidinas alcoxi- o alquiltio-sustituidas de fórmula



20 en la cual R y R¹ tienen los significados indicados ante-

