

MINISTERIO DE INDUSTRIA
REGISTRO DE LA PROPIEDAD INDUSTRIAL



18	ES	11	NUMERO	462033	10	A1
		21				
		22	FECHA DE PRESENTACION	- 1 SET. 1977		

PATENTE DE INVENCION

30	PRIORIDADES:	32	FECHA	33	PAIS
31	NUMERO				
	P 26 39 433.2		2 de septiembre de 1.976		Rep. Federal Alemana

47	FECHA DE PUBLICIDAD	51	CLASIFICACION INTERNACIONAL	62	PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA
			COFF/AOIN		

54	TITULO DE LA INVENCION
	PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE ESTERES PIRIMIDINILICOS DE LOS ACIDOS <u>[TIONO-(TIOL)]</u> -FOSFO-RICO(NICO).

71	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. Wolfgang Behrenz, Dr. Ingeborg Hammann, Dr. Bernhard Homeyer, Dr. Wilhelm Stendel.

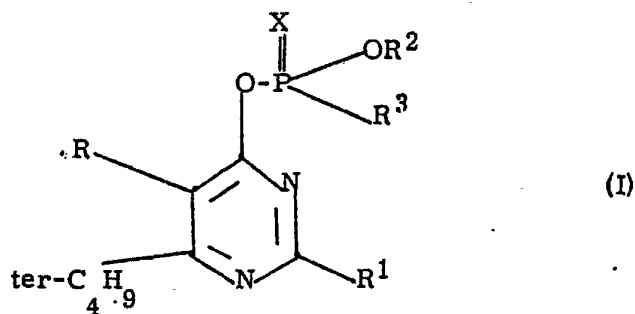
73	TITULAR (ES)

74	REPRESENTANTE
	GOMEZ-ACEBO.

La presente invención se refiere a nuevos ésteres pirimidínicos de los ácidos fosfórico, tionofosfórico, tioletfosfórico, tionotiol-fosfórico, fosfónicos y tiono-fosfónicos, a un procedimiento para su producción y a su empleo como insecticidas y acaricidas.

Ya es conocido que ésteres pirimidínicos del ácido tionofosfórico y de ácidos tionofosfónicos metil-sustituidos, por ejemplo los ésteres O-metil- y O-etil-O-(2,6-dimetilpirimidin(4)ílico) de los ácidos etano- y metanotionofosfónicos, y el éster O,O-dietil-O-(2,5-dimetil-6-metil-pirimidin(4)ílico) del ácido tionofosfórico, tienen propiedades insecticidas y acaricidas (compárese con las patentes estadounidenses Nos. 3.216.894 y 3.886.156).

Ahora se ha encontrado que los nuevos ésteres pirimidínicos de los ácidos fosfórico, tionofosfórico, tioletfosfórico, tionotiol-fosfórico, fosfónicos y tiono-fosfónicos de fórmula



en la cual representan

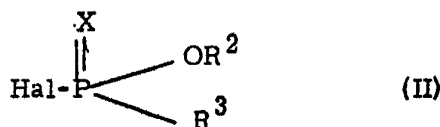
- R hidrógeno, halógeno o alquilo,
R¹ hidrógeno o alquilo,
R² alquilo,

R³ alquilo, alcoxi, alquiltio o fenilo y

X oxígeno o azufre,

tienen un efecto insecticida y acaricida excelente.

5. Además fué encontrado que los ésteres pirimidínicos de los ácidos fosfórico, tionofosfórico, tiolfosfórico, tiono~~ti~~-fosfórico, fosfónicos y tiono-fosfónicos de fórmula (I) son obtenidos, si halogenuros ésteres de los ácidos fósforico tiono-, tiol- y tiono~~ti~~fosfórico, fosfónicos y tionofosfónicos de fórmula



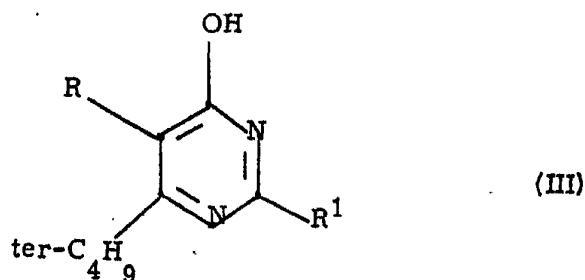
en la cual

R², R³ y X tienen los significados arriba indicados y

Hal representa halógeno, preferiblemente cloro,

se hacen reaccionar con 4-hidroxi-6-ter-butil-pirimidinas de fór-

15 mula



en la cual

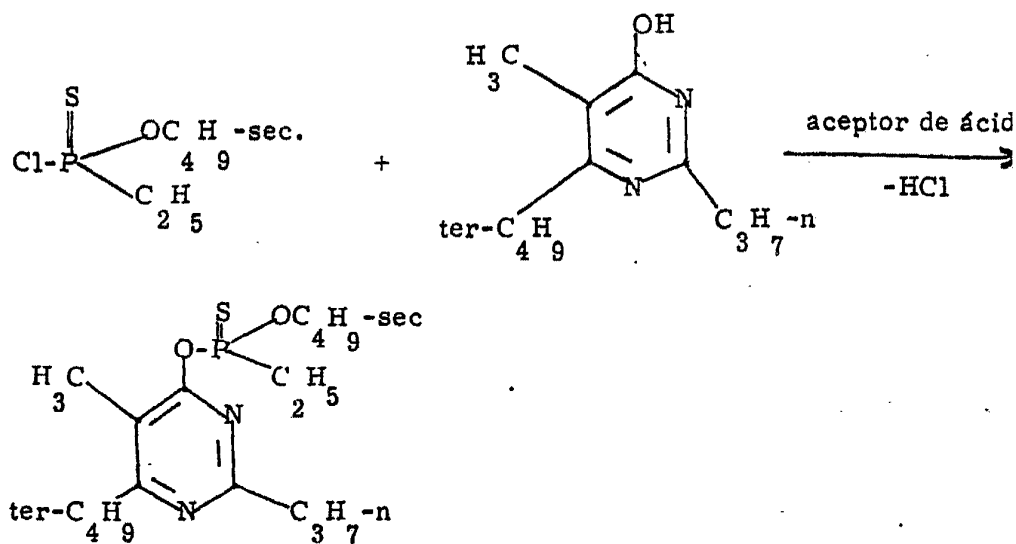
R y R¹ tienen los significados arriba indicados,

eventualmente en presencia de un agente aceptor de ácidos o even-

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

5 Sorprendentemente los ésteres pirimidínicos de los ácidos fosfórico, tionofosfórico, tiolfosfórico, tionotiofosfórico, fosfónicos y tionofosfónicos según la invención muestran un efecto insecticida y acaricida mejor que los ésteres pirimidínicos conocidos de los ácidos fosfórico y fosfónicos metil-
10 substituidos de constitución análoga y de igual orientación de actividad. Por consiguiente los compuestos de acuerdo con la presente invención representan un enriquecimiento verdadero de la técnica.

Si se emplean como sustancias de partida, a título de ejemplo el cloruro éster O-sec-butílico del ácido etano-
15 tionofosfónico y la 2-n-propil-4-hidroxi-5-metil-6-ter-butil-pirimidina, el desarrollo de la reacción puede ser representado por el siguiente esquema de fórmulas:



Las sustancias de partida 3. emplear
están definidas en forma genérica por las fórmulas (II) y (III).

En las mismas, sin embargo, representan con preferencia:

- R hidrógeno o cloro,
- 5 R¹ hidrógeno o alquilo lineal o ramificado con 1 a 6,
 particularmente 1 a 4 átomos de carbono;
- R² alquilo lineal o ramificado con 1 a 6, particularmente
 1 a 4 átomos de carbono,
- R³ alcoxi o alquiltio lineales o ramificados, cada uno con
10 1 a 6 particularmente 1 a 4 átomos de carbono; alquilo li-
 neal o ramificado con 1 a 8, particularmente 1 a 5 átomos
 de carbono, o fenilo, y
- X azufre.

Los ésteres pirimidínicos de los ácidos
15 fosfóricos, tionofosfórico, tiolfosfórico, tionotiol-fosfórico, fos-
 fónicos y tionofosfónicos (II) son conocidos y también son técnica-
 mente bien preparables según procedimientos conocidos de la lite-
 ratura.

Como ejemplos de los mismos pueden men-
20 cionarse en detalle:

los cloruros diésteres O,O-dimetílico, O,O-dietílico,
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, O-metil-O-iso-propílico,
25 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

- los cloruros diésteres O, S-dimetílico, O, S-dietílico,
- 5 O, S-di-n-propílico, O, S-di-iso-propílico, O, S-di-n-butílico, O, S-di-iso-butílico, 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-butílico-S-etílico del ácido tionotiofosfórico, y
- 10 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-, etano-, n-propano-, iso-propano-, n-butano-, iso-butano-, ter-butano-, sec-butano-, n-pentano- y feniltionofosfónicos.

- 15 Las 4-hidroxi-6-ter-butil-pirimidinas(III) a emplear además como sustancias de partida, pueden ser preparadas también según procedimientos conocidos de la literatura, condensando por ejemplo hidroccloruros de acilamidina con derivados de ésteres alquílicos del ácido pivaloilacético, eventualmente en
- 20 presencia de un alcoholato. Como ejemplos de las mismas sean mencionadas en detalle:

- 6-ter-butil y 5-cloro-6-ter-butil-4-hidroxi-pirimidina, además
- 2-metil-, 2-etil-, 3-n-propil-, 2-iso-propil-, 2-n-butil-, 2-sec-butil-, 2-iso-butil-, 2-ter-butil-, 2-metil-5-cloro-,
- 25 2-etil-5-cloro-, 2-n-propil-5-cloro-, 2-iso-propil-5-cloro-, 2-n-

butil-5-cloro-, 2-iso-butil-5-cloro-, y 2-sec-butil-5-cloro-
4-hidroxi-6-ter-butil-pirimidina.

El procedimiento para la producción de los compuestos según la invención es realizado preferiblemente con el empleo concomitante de disolventes y diluyentes apropiados. Como tales entran en consideración prácticamente todos los disolventes orgánicos inertes. A éstos pertenecen particularmente los hidrocarburos alifáticos y aromáticos eventualmente clorados, tales como benceno, tolueno, xileno, nafta, cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono, clorobenceno, los éteres, por ejemplo eter dietílico y éter dibutílico, dioxano; las cetonas, por ejemplo acetona, metiletilcetona, metilisopropilcetona y metilisobutilcetona; además los nitrilos, tales como acetonitrilo y propionitrilo.

Como aceptores de ácido pueden encontrarse 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 el ter-butilato de potasio; además, aminas alifáticas, aromáticas o heterocíclicas, por ejemplo trietilamina, trimetilamina, dimetilaminina, dimetilbencilamina y piridina.

La temperatura de reacción puede ser variada entre márgenes amplios. Por lo general se trabaja a temperaturas entre 0 y 120°C, preferiblemente de 20 a 60°C.

Generalmente se lleva a cabo la reacción

a la presión normal.

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

En la mayoría de los casos los nuevos compuestos se presentan en forma de aceites que no pueden ser destilados sin descomposición, pero 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. Algunos compuestos se presentan en forma cristalina y se caracterizan por su punto de fusión.

Como ya se ha mencionado varias veces los ésteres pirimidínicos de los ácidos fosfórico, tionofosfórico, tioletfosfórico, tionotiofosfórico, fosfónicos y tiono-fosfónicos según la invención se distinguen por una sobresaliente eficacia insecticida

y acaricida. Son eficaces contra parásitos de plantas, anti-higiénicos y de provisiones, así como en el sector de la medicina veterinaria contra parásitos, particularmente ectoparásitos. A una baja fitotoxicidad tienen un buen efecto contra insectos tanto chupadores como también mordedores y contra ácaros.

Por esta razón los compuestos según la invención pueden ser aplicados con buen resultado como parasiticidas en la protección de las 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, arácnidos 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 estados o contra estados individuales de desarrollo. A los parásitos arriba mencionados pertenecen: del orden de los isópodos, por ejemplo *Oniscus asellus*, *Armadillidium vulgare*, *Porcellio scaber*.

Del orden de diplópodos, por ejemplo *Blaniulus guttulatus*.

Del orden de quilópodos, por ejemplo *Geophilus carpophagus*,

Scutigera spéc.

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

Del orden de los tisanuros, por ejemplo *Lepisma saccharina*.

- Del orden de Collembola, por ejemplo *Onychiuros armatus*.
- Del orden de ortópteros, por ejemplo *Blatta orientalis*, *Peripanneta americana*, *Leucophaea maderae*, *Blattella germanica*,
5 *Acheta domesticus*, *Gryllotalpa* spp., *Locusta migratoria migratorioides*, *Melanoplus differentialis*, *Schistocerca gregaria*.
- 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*,
10 *Pemphigus* spp., *Pediculus humanus corporis*, *Haematopinus* spp.,
Linognathus spp.
- Del orden de Mallophaga, por ejemplo *Trichodectes* spp., *Damalinaea* spp.
- Del orden de los tisanópteros, por ejemplo *Hercinothrips femoralis*,
Thrips tabaci.
- 15 Del orden de los heterópteros, por ejemplo *Eurygaster* spp.,
Dysdercus intermedius, *Piesma quadrata*, *Cimex lectularius*,
Rhodnius prolixus, *Triatoma* spp.
- Del orden de los homópteros, por ejemplo *Aleurodes brassicae*,
Bemisia tabaci, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aphis gossypii*,
20 *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus ribis*, *Doralis fabae*,
Doralis pomi, *Eriosoma lanigerum*, *Hyalopterus arundinis*,
Macrosiphum avenae, *Myzus* spp., *Phorodon humuli*, *Rhopalosiphum padi*,
Empoasca spp., *Euscelis bilobatus*, *Nephotettix cincticeps*,
Lecanium corni, *Saissetia oleae*, *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*,
25 *Annidiella aurantii*, *Aspidiotus hederae*, *Pseudococcus*

spp., *Psylla* spp.

Del orden de los lepidópteros, por ejemplo *Pectinophora*

gossypiella, *Bupalus piniarius*, *Cheimatobia brumata*,

Lithocolletis blancardella, *Hyponomeuta padella*, *Plutella macu-*

5 *lipennis*, *Malacosoma neustria*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Lymantria*

spp., *Bucculatrix thurberiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Agrotis* spp.,

Euxoa spp., *Feltia* spp., *Earias insulana*, *Heliothis* spp.,

Laphygma exigua, *Mamestra brassicae*, *Panolis flammea*, *Prodenia*

litura, *Spodoptera* spp., *Trichoplusia ni*, *Carpocapsa pomonella*,

10 *Pieris* spp., *Chilo* spp., *Pyrausta nubilalis*, *Epeestia kuehnniella*,

Galleria mellonella, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Choristoneura*

fumiferana, *Clysia ambiguella*, *Homona magnanima*, *Tortrix viridana*.

Del orden de los coleópteros, por ejemplo *Anobium punctatum*,

Rhizopertha dominica, *Bruchidius obtectus*, *Acanthoscelides*

15 *obtectus*, *Hylotrupes bajulus*, *Agelastica alni*, *Leptinotarsa decem-*

lineata, *Phaedon cochleariae*, *Diabrotica* spp., *Psylliodes chryso-*

cephala, *Epilachna varivestis*, *Atomaria* spp., *Orysaephilus suri-*

namensis, *Anthonomus* spp., *Sitophilus* spp., *Otiorrhynchus sulcatus*,

Cosmopolites sordidus, *Ceuthorryncus assimilis*, *Hypero postica*,

20 *Dermestes* spp., *Trogoderma* spp., *Anthrenus* spp., *Attagenus*

spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Ptinus* spp., *Niptus holo-*

leucus, *Gibbium psylloides*, *Tribolium* spp., *Tenebrio molitor*,

Agriotes spp., *Conoderus* spp., *Melolontha melolontha*, *Amphimallon*

solstitialis, *Costelytra zealandica*.

25 Del orden de los himenópteros, por ejemplo *Diprion* spp., *Hoplocam-*

- pa 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., *Calliphora erythrocephala*, *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp.,
5 *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*.
Del orden de los sifonápteros, por ejemplo *Xenopsylla cheopis*,
10 *Ceratophyllus* spp.,
Del orden de los arácnidos, por ejemplo *Scorpio maurus*, *Latro-*
dectus mactans.
Del orden de los ácaros, por ejemplo *Acarus siro*, *Argas* spp.,
Ornithodoros spp., *Dermapyssus gallinae*, *Eriophyes ribis*,
15 *Phyllocoptura 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.

A los nematodos parasitarios de plantas

- 20 pertenecen:
Pratylenchus spp., *Radopholus similis*, *Ditylenchus dipsaci*,
Tylenchulus semipenetrans, *Heterodera* spp., *Meloidogyne* spp.,
Aphelenchoides spp., *Longidorus* spp., *Xiphinema* spp., *Tricho-*
dorus spp.

25

La aplicación de las sustancias activas

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

El contenido de substancia activa de las formas de aplicación preparadas de las formulaciones corrientes en el comercio puede variar dentro de límites amplios. La concentración de la substancia activa de las formas de aplicación pueden estar entre 0,0000001 y 100% en peso de substancia 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 substancias activas se distinguen por un sobresaliente efecto residual sobre madera y arcilla, así como por una buena resistencia a álcalis sobre bases encaladas.

Las substancias 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, micro capsulaciones 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 nebu-

lización en frío y en caliente de volumen ultrabajo.

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, 15 tales como ciclohexano, 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 20 como agua; como diluyentes o vehículos gaseosos licuados entendiéndose como tales aquellos líquidos que a la temperatura 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 25 naturales molidos, tales como caolines, arcillas, talco, creta,

cuarzo, atapulguita, montmorillonita o tierra de diatomeas,
y minerales sintéticos molidos, tales como ácido silícico alta-
mente disperso, óxido de aluminio y silicatos; como vehículos
sólidos para granulados: piedras naturales quebradas y fraccio-
5 nadas, tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolo-
mita, así como granulados sintéticos de harinas inorgánicas y
orgánicas, así como granulados de material orgánico, tales como
aserrines, cáscaras de nueces, de coco, marzocas y tallos de
tabaco; como agentes emulsionantes y/o espumantes: emulsivos
10 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, sul-
fatos de alquilo, sulfonatos de arilo, así como hidrolizados de pro-
teínas como agentes dispersantes: por ejemplo lignina, leñas de
15 desecho de sulfito y metilcelulosa.

En las formulaciones pueden emplearse
agentes adherentes tales como carboximetilcelulosa, polímeros
polverulentos, granulares o en forma de látices naturales y, sinté-
ticos, tales como goma arábiga, alcohol polivinílico, acetato de
20 polivinilo.

Pueden emplearse colorantes, tales como
pigmentos inorgánicos, por ejemplo óxido de hierro, óxido de tita-
nio, azul de ferrocianuro y colorantes orgánicos, tales como aliza-
rina, colorantes azoicos de ftalocianina metálica, y micronutrientes
25 tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, mo-
libdeno 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

5 Ensayo de tiempo letal TL_{100} para dípteros

Animales de ensayo: *Aedes aegypti*

Disolvente: acetona

2 partes en peso de la sustancia activa son recogidas en 1000 partes en volumen del disolvente. La solución así obtenida es diluida con disolvente ulterior hasta las concentraciones menores deseadas.

Mediante una pipeta, se colocan 2,5 ml de la solución de sustancia activa en un platillo de Petri. Sobre el fondo del platillo de Petri se encuentra un papel para filtrar de un diámetro de aproximadamente 9,5 cm. El platillo de Petri permanece abierto, hasta que se haya evaporado totalmente el disolvente. Según la concentración de la solución de sustancia activa, resulta distinta la cantidad de sustancia activa por m^2 de papel para filtrar. Subsiguientemente se introducen unos 25 animales de ensayo en el platillo de Petri y se cubre este con una tapa de vidrio.

El estado de los animales de ensayo se observado continuamente. Se determina aquél tiempo que es necesario para una destrucción al 100%.

25 Los animales de ensayo, las sustancias

activas, sus concentraciones y los tiempos, dentro de los cuales se observa una destrucción al 100 %, constan en la siguiente tabla 1:

TABLA 1

5 (Ensayo de tiempo letal TL₁₀₀ para dípteros / *Aedes aegypti*)

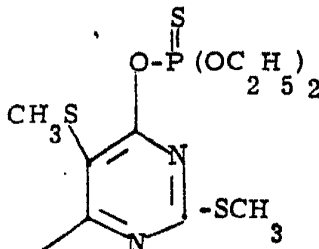
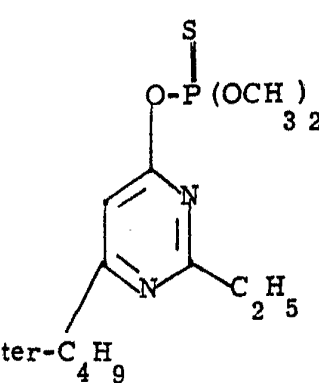
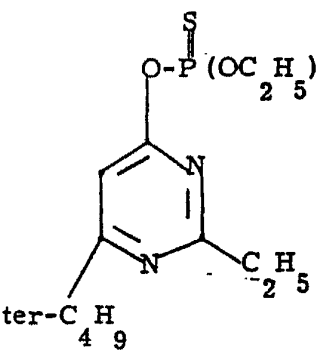
Substancia activa	concentración de la substancia activa en la solución en %	TL ₁₀₀ en minutos (') o en horas (h)
 <p>(conocida)</p>	0,02	3 ^h = 0
	0,02	180'
	0,02	120'

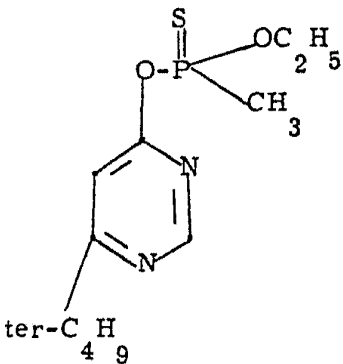
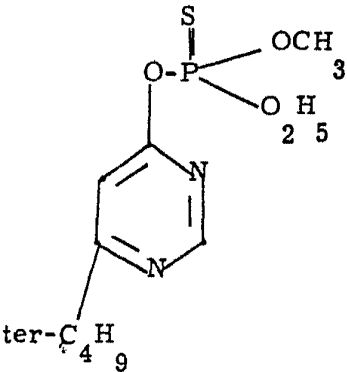
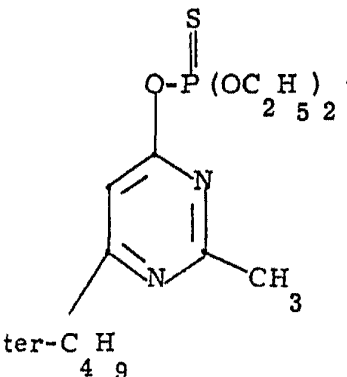
TABLA 1 (continuación)

(Ensayo de tiempo letal TL₁₀₀ para dípteros/*Aedes aegypti*)

Substancia activa	concentración de la substancia activa en la solución en %	TL ₁₀₀ en minutos (') o en horas (h)
	0,02	120'
	0,02	120'
	0,02	60'

TABLA 1 (continuación)

(Ensayo de tiempo letal TL₁₀₀ para dípteros/
Aedes aegypti)

Substancia activa	concentración de la substancia activa en la solución en %	TL ₁₀₀ en minutos (') o en horas (h)
	0,02	60'
	0,02	120'
	0,02	60'

Ejemplo B

Ensayo con larvas de mosquitos

Animales de ensayo: Larvas de *Aedes aegypti*

Disolvente: 99 partes en peso de acetona

5 Emulgente: 1 parte en peso de éter bencilhidroxidifenilpoliglicólico

Para obtener una preparación adecuada de sustancia activa, se disuelven 2 partes en peso de la sustancia activa en 1000 partes en volumen del disolvente que contiene el emulsivo en la cantidad arriba indicada. La solución así obtenida es diluida con agua hasta las concentraciones menores deseadas.

10

Se introducen las preparaciones líquidas de sustancia activa en unos vasos y subsiguientemente en cada vaso se colocan unas 25 larvas de mosquitos.

Al cabo de 24 horas, se determina la destrucción en %, significando 100% que fueron matadas todas las larvas, mientras que 0% significa que no fué matada ninguna larva.

15

Las sustancias activas, sus concentraciones, los animales de ensayo y los resultados constan en la siguiente tabla 2:

TABLA 2

(Ensayo con larvas de mosquitos / *Aedes aegypti*)

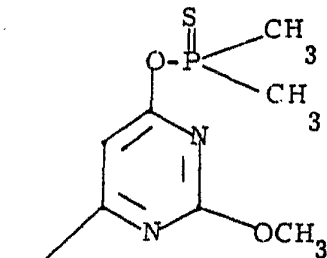
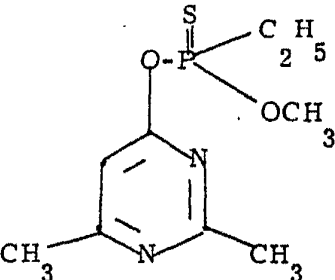
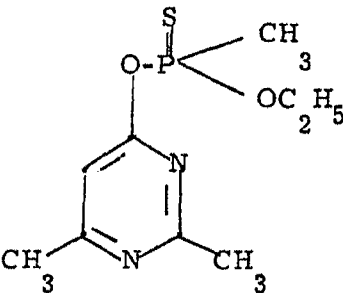
Substancia activa	concentración de la substancia activa en la solución en ppm.	grado de destrucción en %
 <p>(conocida)</p>	1	0
 <p>(conocida)</p>	1	0
 <p>(conocida)</p>	1	0

TABLA 2 (continuación)

(Ensayo con larvas de mosquitos / *Aedes aegypti*)

Substancia activa	concentración de la substancia activa en la solución en ppm.	grado de destrucción en %
	1	95
	1	100
	1	100
	1	90

TABLA 2 (continuación)

(Ensayo con larvas de mosquitos / *Aedes aegypti*)

Substancia activa	concentración de la substancia activa en la solución en ppm.	grado de destrucción en %
	1	100
	1	100
	1	100

11/11/71

TABLA 2 (continuación)
(Ensayo con larvas de mosquitos / *Aedes aegypti*)

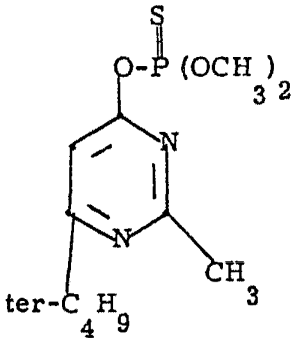
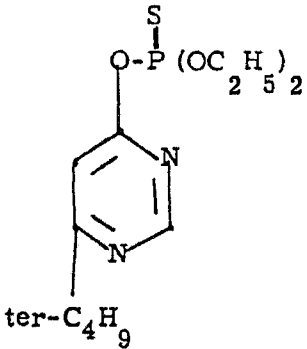
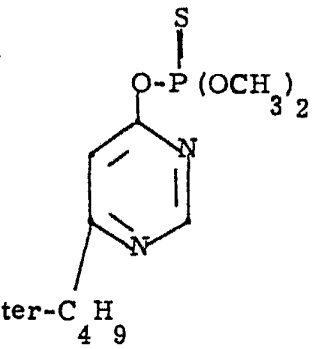
Substancia activa	concentración de la substancia activa en la solución en ppm.	grado de destrucción en %
 <p>Chemical structure: A pyridine ring with a dimethyl phosphorothioate group (-P(=S)(OCH₃)₂) at position 2, a methyl group (-CH₃) at position 3, and a tert-butyl group (-C(CH₃)₃) at position 4.</p>	1	90
 <p>Chemical structure: A pyridine ring with a diethyl phosphorothioate group (-P(=S)(OCH₂CH₃)₂) at position 2 and a tert-butyl group (-C(CH₃)₃) at position 4.</p>	1	100
 <p>Chemical structure: A pyridine ring with a dimethyl phosphorothioate group (-P(=S)(OCH₃)₂) at position 2 and a tert-butyl group (-C(CH₃)₃) at position 4.</p>	1	100

TABLA 2 (continuación)

(Ensayo con larvas de mosquitos / *Aedes aegypti*)

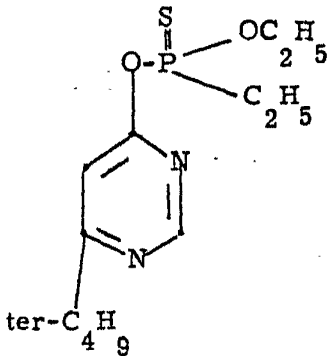
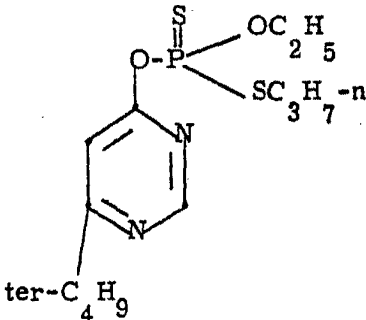
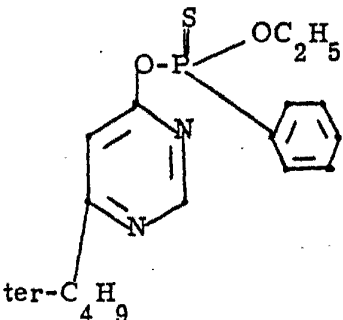
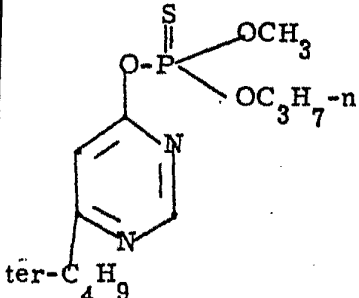
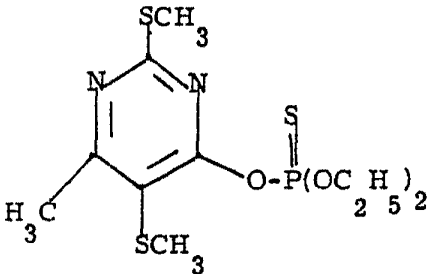
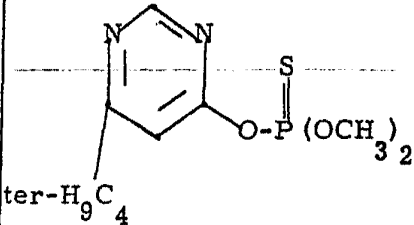
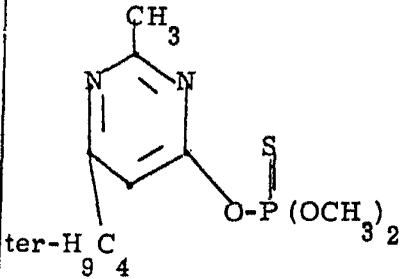
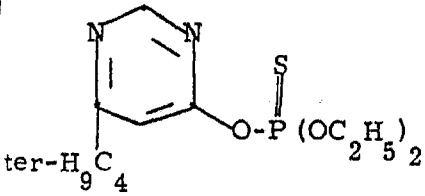
Substancia activa	concentración de la substancia activa en la solución en ppm.	grado de destrucción en %
	1	100
	1	100
	1	100
	1	100

TABLA 3

(Ensayo con Plutella)

Substancia activa	concentración de la substancia activa en %	grado de destrucción en % al cabo de 3 días
	0,1 0,01	80 0
(conocida)		
	0,1 0,01	100 100
	0,1 0,01	100 100
	0,1 0,01	100 100

TA BLA 3 (continuación)

(Ensayo con *Plutella*)

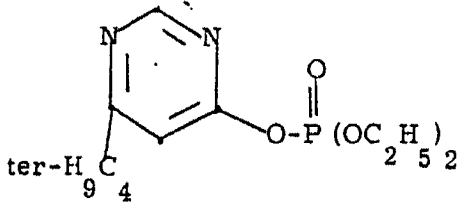
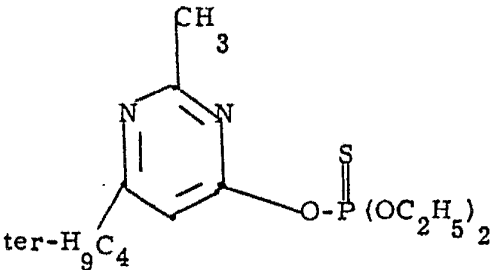
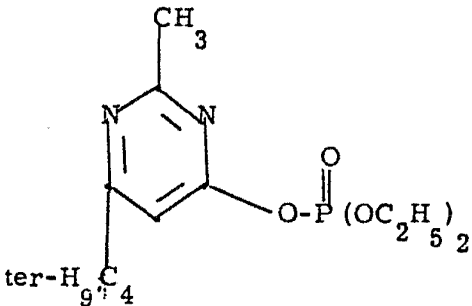
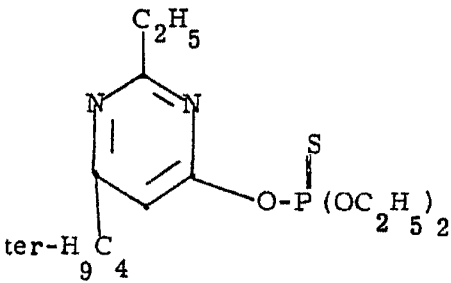
Substancia activa	concentración de la substancia activa en %	grado de destrucción en % al cabo de 3 días
	0,1 0,01	100 100
	0,1 0,01	100 100
	0,1 0,01	100 100
	0,1 0,01	100 100

TABLA 3 (continuación)

(Ensayo con Plutella)

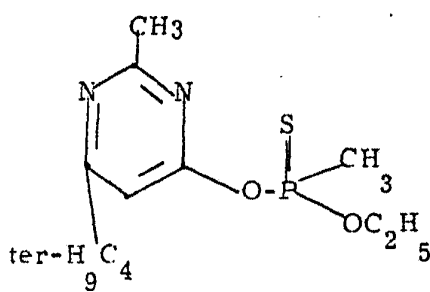
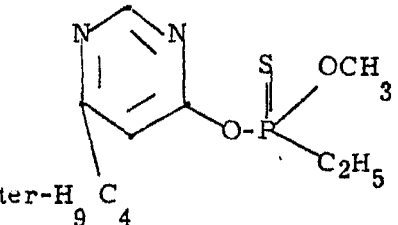
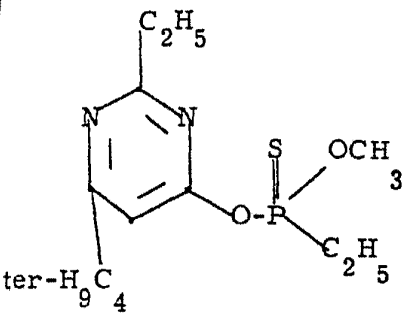
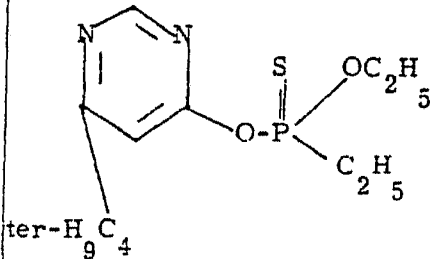
Substancia activa	concentración de la substancia activa en %	grado de destrucción en % al cabo de 3 días
	<p>0,1</p> <p>0,01</p>	<p>100</p> <p>100</p>
	<p>0,1</p> <p>0,01</p>	<p>100</p> <p>100</p>
	<p>0,1</p> <p>0,01</p>	<p>100</p> <p>100</p>
	<p>0,1</p> <p>0,01</p>	<p>100</p> <p>100</p>

TABLA 3 (continuación)

(Ensayo con Plutella)

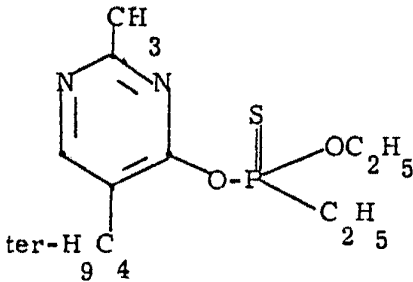
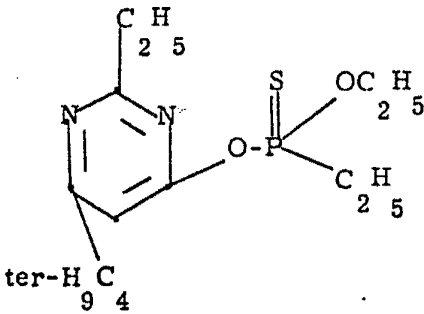
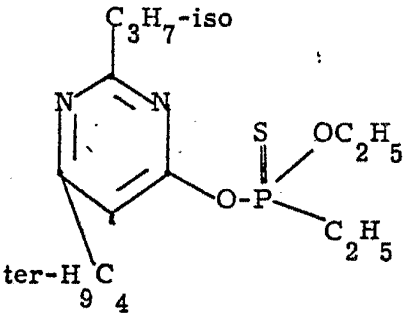
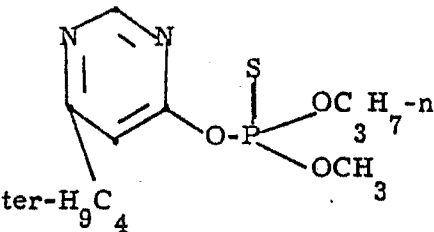
Substancia activa	concentración de la substancia activa en %	grado de destrucción en % al cabo de 3 días
	<p>0,1 0,01</p>	<p>100 100</p>
	<p>0,1 0,01</p>	<p>100 100</p>
	<p>0,1 0,01</p>	<p>100 100</p>
	<p>0,1 0,01</p>	<p>100 100</p>

TABLA 3 (continuación)

(Ensayo con *Plutella*)

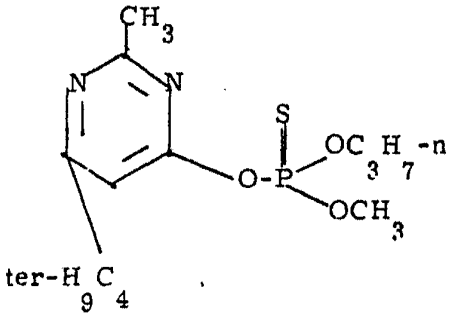
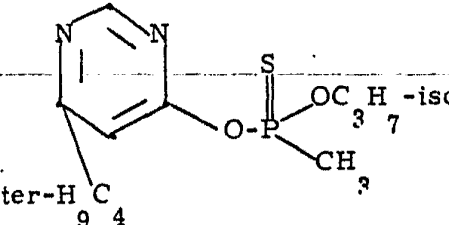
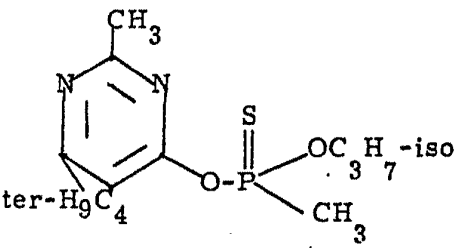
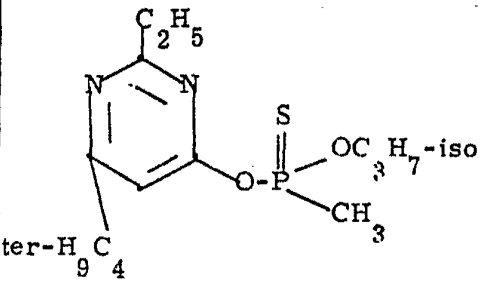
Substancia activa	concentración de la substancia activa en %	grado de destrucción en % al cabo de 3 días
 <p>ter-H C 9 4</p>	<p>0,1 0,01</p>	<p>100 100</p>
 <p>ter-H C 9 4</p>	<p>0,1 0,01</p>	<p>100 100</p>
 <p>ter-H₉ C 4</p>	<p>0,1 0,01</p>	<p>100 100</p>
 <p>ter-H C 9 4</p>	<p>0,1 0,01</p>	<p>100 100</p>

TABLA 3 (continuación)

(Ensayo con Plutella)

Substancia activa	concentración de la substancia activa en %	grado de destrucción en % al cabo de 3 días
<p> $\text{C}_3\text{H}_7\text{-iso}$ $\text{ter-H C}_9\text{C}_4$ </p>	<p>0,1 0,01</p>	<p>100 100</p>
<p> $\text{SC}_3\text{H}_7\text{-n}$ OC_2H_5 $\text{ter-H C}_9\text{C}_4$ </p>	<p>0,1 0,01</p>	<p>100 100</p>
<p> C_2H_5 $\text{SC}_3\text{H}_7\text{-n}$ OC_2H_5 $\text{ter-H C}_9\text{C}_4$ </p>	<p>0,1 0,01</p>	<p>100 100</p>
<p> $\text{C}_3\text{H}_7\text{-iso}$ $\text{SC}_3\text{H}_7\text{-n}$ OC_2H_5 $\text{ter-H C}_9\text{C}_4$ </p>	<p>0,1 0,01</p>	<p>100 100</p>

TABLA 3 (continuación)

(Ensayo con *Plutella*)

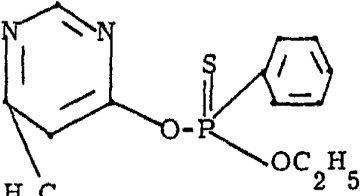
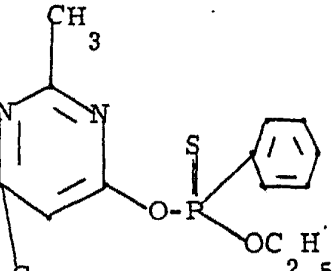
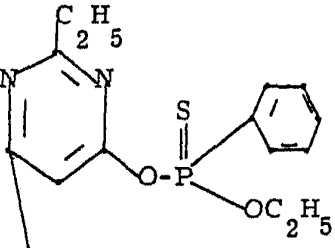
Substancia activa	concentración de la substancia activa en %	grado de destrucción en % al cabo de 3 días
 <p>ter-H C₉ C₄</p>	0,1 0,01	100 100
 <p>ter-H C₉ C₄</p>	0,1 0,01	100 100
 <p>ter-H C₉ C₄</p>	0,1 0,01	100 100

TABLA 4

(Ensayo con Tetranychus / resistente)

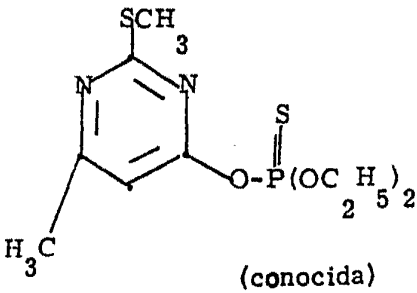
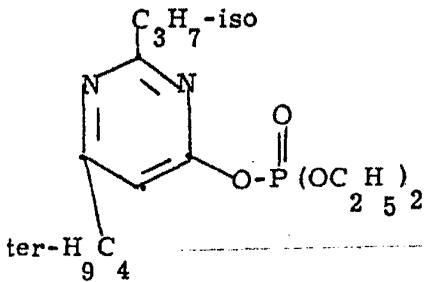
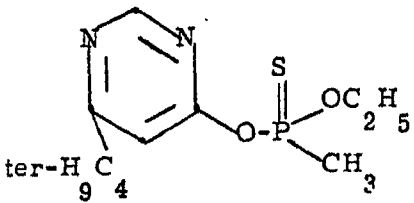
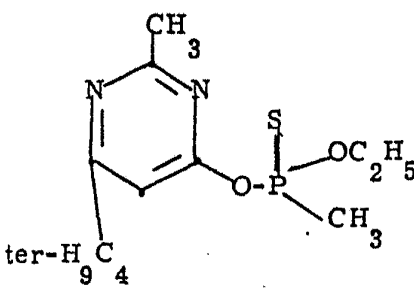
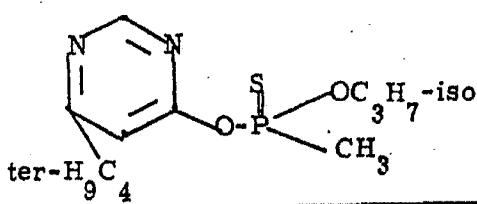
Substancia activa	concentración de la substancia activa en %	grado de destrucción en % al cabo de 2 días
 <p>(conocida)</p>	0,1	100
	0,1	99
	0,1	100
	0,1	100
	0,1	100

TABLA 4 (continuación)

(Ensayo con Tetranychus / resistente)

Substancia activa	concentración de la substancia activa en %	grado de destrucción en % al cabo de 9 días
<p>Chemical structure of the active substance: A pyridine ring substituted with an isopropyl group (C₃H₇-iso) at the 2-position, a tert-butyl group (ter-H C₉ 4) at the 3-position, and a phosphorothioate group (-O-P(=S)(SC₂H₅)OC₂H₅) at the 4-position.</p>	0,1	100

Ejemplo E

Ensayo de concentración límite / insectos habitantes en el suelo

Insecto de ensayo : Cresas de *Phorbia antiqua* en el suelo

Disolvente: 3 partes en peso de acetona

5 Emulgente: 1 parte en peso de éter alquilaril-poliglicólico

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

Se mezcla la preparación de sustancia activa íntimamente con tierra. En esto, la concentración de la sustancia activa en la preparación no tiene prácticamente ninguna importancia, decisiva es tan solo la cantidad en peso de la sustancia activa por unidad de volumen de la tierra, cuya cantidad se
15 indica en ppm (=mg/litro). Se introduce la tierra en macetas y se dejan éstas en reposo a la temperatura ambiente.

Al cabo de 24 horas, se introducen los animales de ensayo en la tierra tratada, y al cabo de otros 2 a
20 7 días, se determina en % el grado de efecto de la sustancia activa, contándose los insectos de ensayo muertos y vivos. El grado de efecto es de un 100%, si todos los insectos de ensayo fueron matados, y es de un 0%, si sigue viviendo todavía un número de insectos de ensayo exactamente igual que en la tierra testigo no tratada.

25 Las sustancias activas, sus cantidades de aplicación y los resultados constan en la siguiente tabla-5:

TABLA 5

(Ensayo de concentración límite / insectos habitantes en el suelo I)

(Cresas de Phorbia antiqua en el suelo)

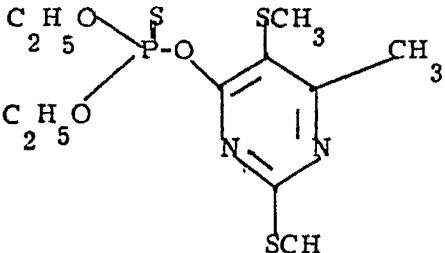
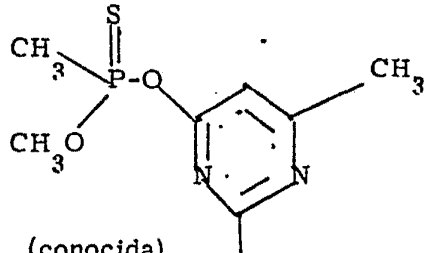
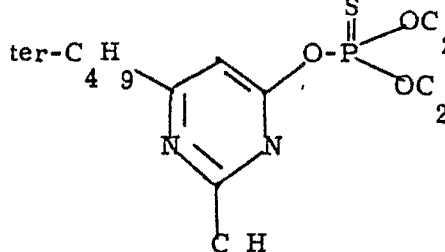
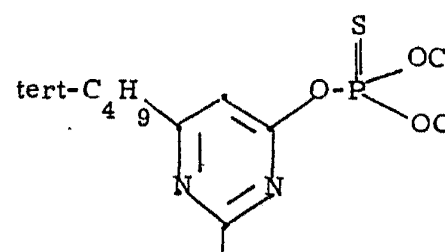
Substancias activas	grado de destrucción en % a una concentración de la sustancia activa de 10 ppm.
 <p>(conocida)</p>	0
 <p>(conocida)</p>	0
	100
	100

TABLA 5 (continuación)

(Ensayo de concentración límite / insectos habitantes en
el suelo I)
(Cresas de Phorbia antiqua en el suelo)

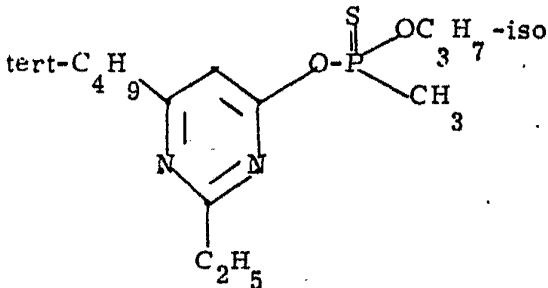
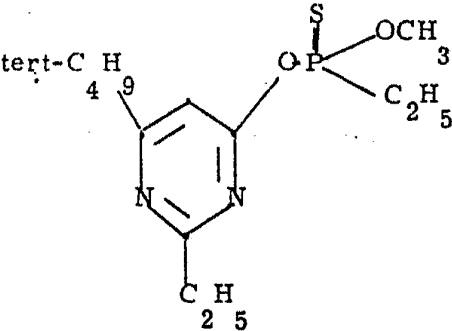
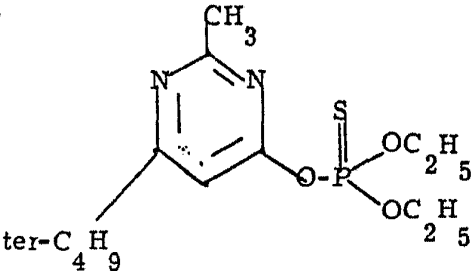
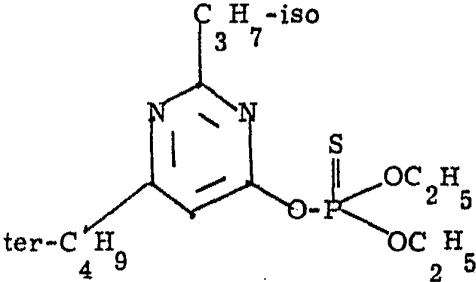
Substancias activas	grado de destrucción en % a una concentración de la sustancia activa de 10 ppm.
	100
	100
	100
	100

TABLA 5 (continuación)

(Ensayo de concentración límite / insectos habitantes en el el suelo I)

(Cresas de Phorbia antiqua en el suelo)

Substancias activas	grado de destrucción en % a una concentración de la sustancia activa de 10 ppm.
	100
	100
	100
	100

TABLA 5 (continuación)

(Ensayo de concentración límite / insectos habitantes en el suelo I)

(Cresas de *Phorbia antiqua* en el suelo)

Substancias activas	grado de destrucción en % a una concentración de la sustancia activa de 10 ppm.
	100
	100
	100

Ejemplo F

Ensayo de concentración límite / insectos habitantes en el suelo II

Insecto de ensayo: Larvas de *Tenebrio molitor* en el suelo

Disolvente: 3 partes en peso de acetona

5 Emulgente: 1 parte en peso de éter alquilaril-poliglicólico

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

10 concentración deseada.

Se mezcla la preparación de sustancia activa íntimamente con tierra. En esto, la concentración de la sustancia activa en la preparación no tiene prácticamente ninguna importancia, decisiva es tan solo la cantidad en peso de la sustancia activa por unidad de volumen de la tierra, cuya cantidad se indica en

15 ppm (=mg/litro). Se introduce la tierra en macetas y se dejan éstas en reposo a la temperatura ambiente.

Al cabo de 24 horas, se introducen los animales de ensayo en la tierra tratada y, al cabo de otros 2 a 7 días, se determina en % el grado de efecto de la sustancia activa, contando los insectos de ensayo muertos y vivos. El grado de efecto es de un 100%, si todos los insectos de ensayo fueron matados, y es de un 0%, si sigue viviendo todavía un número de insectos de ensayo exactamente igual que en la tierra testigo no tratada.

20

Las sustancias activas, sus cantidades de aplicación y los resultados constan en la siguiente tabla 6:

TABLA 6

Ensayo de concentración límite / insectos habitantes en el suelo II

(Larvas de Tenebrio molitor en el suelo)

5.

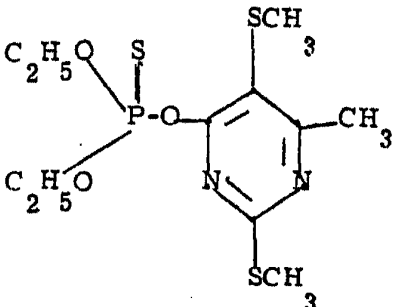
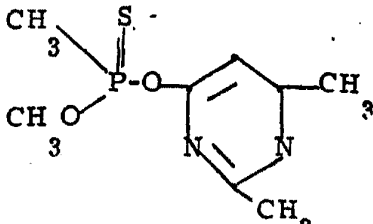
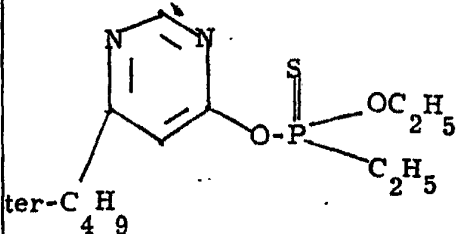
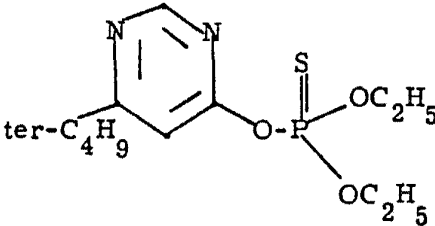
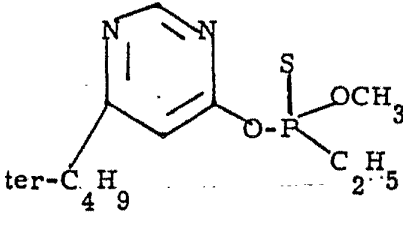
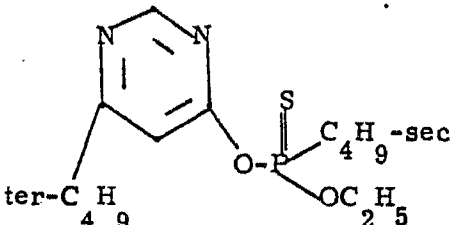
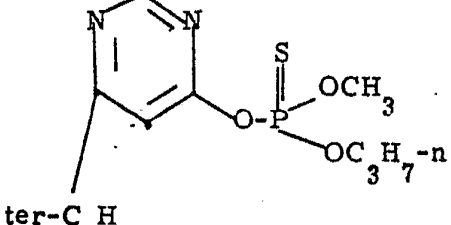
Sustancia activa	grado de destrucción en % a una concentración de la sustancia activa de 5 ppm.
 <p>(conocida)</p>	0
 <p>(conocida)</p>	0
	100

TABLA 6

Ensayo de concentración límite / insectos habitantes en el suelo II

(Larvas de Tenebrio molitor en el suelo)

Substancia activa	grado de destrucción en % a una concentración de la substancia activa de 5 ppm
 <chem>CC(C)(C)c1cc(COP(=S)(OCC)OCC)cn1</chem>	100
 <chem>CC(C)(C)c1cc(COP(=S)(OC)OCC)cn1</chem>	100
 <chem>CC(C)C(c1cc(COP(=S)(OCC)OCC)cn1)C(C)C</chem>	100
 <chem>CC(C)(C)c1cc(COP(=S)(OCC)OC)cn1</chem>	100

Ejemplo G

Ensayo con larvas de moscarda

Ensayo en serie (Screening) con *Lucilia cuprina* / ensayo in vitro en tubitos

5. Objeto de ensayo: Larvas de moscarda sensibles recién salidas de los huevos, de aproximadamente 12^h a 24 horas de edad.
- Procedimiento de ensayo: Introducción de unas 20 a 30 larvas por concentración en series de concentración (100, 10, 1 ppm).
- A este propósito las larvas son colocadas sobre tapones de algodón
- 10 (diámetro 1,7 cm, altura 1 cm, firma Rescheisen y Co, Ulm) previamente humedecidos con 2,5 ml de una suspensión al 25% de harina de huesos en agua y dispuestos en tubitos de vidrio (vasos de esparcido, blancos 43/44 x 23/24 mm de vidrio de Bänder, Art. No. 7301009).
- 15 Subsiguientemente, mediante una pipeta son aplicados a estos tapones de algodón humedecidos, 0,5 ml de la concentración a ensayar. Entonces se traspasan los tubitos a un ambiente climatizado y se los guardan en éste ($27^{\circ}\text{C} \pm 1^{\circ}$, humedad $\pm 5\%$). Verificación del efecto al cabo de 24 horas.
- 20 Criterios de evaluación: Como criterio para el efecto vale la muerte de las larvas tratadas.
- Calificación: 3=efecto del 100% = todas las larvas están muertas
2=efecto del >50% más del 50% de las larvas están muertas
1= efecto del <50% = menos del 50% de las larvas
- 25

están muertas

0=ningún efecto = todas las larvas están vivas.

Las substanciaa activas, sus concen-
traciones y los resultados constan en la siguiente tabla 7:

5

TABLA 7

Ensayo con larvas de moscarda (*Lucilia cuprina*)

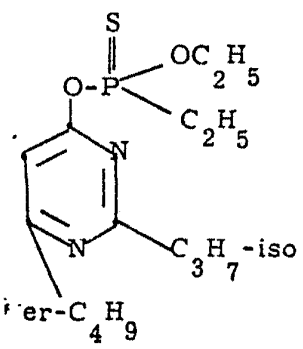
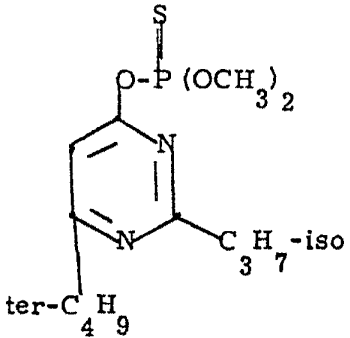
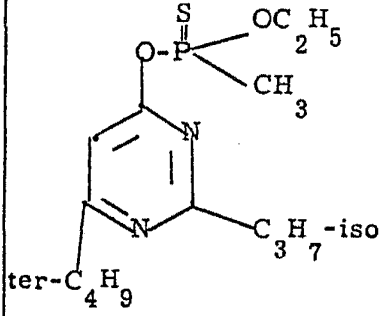
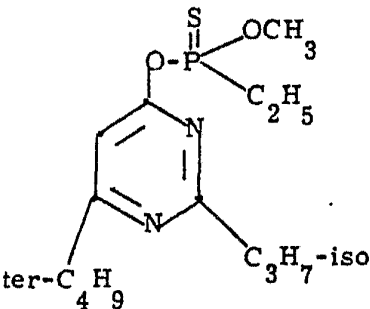
Substancia activa	concentración de la substancia activa en ppm.	grado de destrucción en %
	100	100
	30	100
	10	100
	100	100
	30	100
	10	100
	3	100
	100	100
	10	100

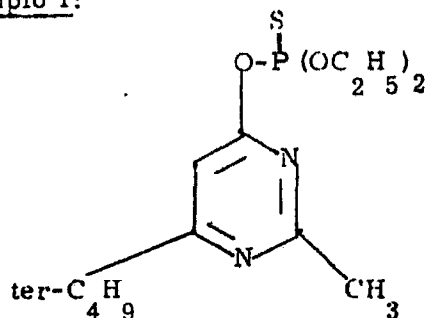
TABLA 7 (continuación)

Ensayo con larvas de moscarda (*Lucilia cuprina*)

Substancia activa	concentración de la substancia activa en ppm.	grado de destrucción en %
	100	100
	30	100
	10	100
	3	>50
	1	>50

Ejemplos de Preparación

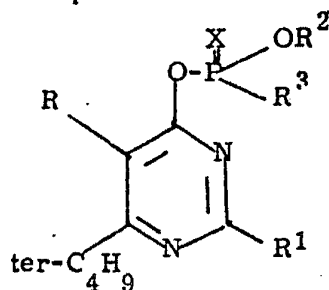
Ejemplo 1:




En una mezcla de 16,6 g (0,1 mol) de 2-
 5 metil-4-hidroxi-6-ter-butil-pirimidina, 14,5 g (0,105 moles) de
 carbonato de potasio y 200 ml de acetonitrilo, se instilan 18,8 g (0,1
 mol) de cloruro diéster O,O-diético del ácido tionofosfórico. Se
 calienta la mezcla durante 3 horas a 40°C, luego se enfría y se vier-
 te la mezcla de la reacción en 300 ml de tolueno. La solución tolué-
 10 nica es lavada con una solución saturada de bicarbonato de sodio y
 con agua, deshidratada con sulfato de sodio y concentrada. Después
 de la destilación incipiente se obtienen 22 g (69% de la teoría) del
 éster O,O-diético-O-(2-metil-6-ter-butil-pirimidin (4)ílico) del
 ácido tionofosfórico en forma de aceite amarillo con índice de re-
 15 fracción $n_D^{23} : 1,4930$.



D


En forma análoga pueden sintetizarse
 los siguientes compuestos




(I)

Ejemplo No.	R	R ¹	R ²	R ³	X	rendimiento (% de la teoría)	índice de refracción
2	H	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	S	70	n _D ²³ : 1,5060
3	H	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	S	74	n _D ²³ : 1,5090
4	H	CH ₃	C ₃ H ₇ -iso	CH ₃	S	70	n _D ²³ : 1,5035
5	H	CH ₃	C ₃ H ₇ -n	OCH ₃	S	54	n _D ²³ : 1,4968
6	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	S	40	n _D ²³ : 1,5048
7	H	CH ₃	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	O	51	n _D ²³ : 1,4679
8	H	CH ₃	C ₂ H ₅		S	81	n _D ²² : 1,5540
9	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	S	64	n _D ²³ : 1,4873
10	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	S	76	n _D ²³ : 1,4977
11	H	C ₂ H ₅	CH ₃	OCH ₃	S	39	n _D ²³ : 1,4909
12	H	C ₂ H ₅	C ₃ H ₇ -iso	CH ₃	S	76	n _D ²³ : 1,4948
13	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	SC ₃ H ₇ -n	S	66	n _D ²³ : 1,5186

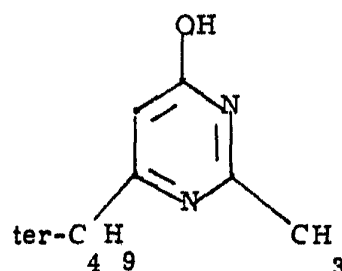
Ejemplo						rendimiento (% de la teoría)	índice de refracción
No.	R	R ¹	R ²	R ³	X		
14	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	- 	S	73	n _D ²³ : 1,5404
15	H	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	S	71	n _D ²³ : 1,5048
16	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	O	72	n _D ²³ : 1,4538
17	H	H	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	O	78	n _D ²³ : 1,4709
18	H	H	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	S	74	n _D ²³ : 1,4950
19	H	H	CH ₃	OCH ₃	S	54	n _D ²³ : 1,5072
20	H	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	S	87	n _D ²³ : 1,5123
21	H	H	C ₂ H ₅	SC ₃ H ₇ -n	S	71	n _D ²³ : 1,5268
22	H	H	C ₃ H ₇ -iso	CH ₃	S	78	n _D ²³ : 1,5110
23	H	H	C ₂ H ₅	CH ₃	S	73	n _D ²³ : 1,5150
24	H	H	C ₂ H ₅	- 	S	70	n _D ²³ : 1,5581
25	H	H	CH ₃	C ₂ H ₅	S	82	n _D ²³ : 1,5199

Ejemplo No.	R	R ¹	R ²	R ³	X	rendimiento (% de la teoría)	índice de refracción
26	H	H	C ₂ H ₅	C ₄ H ₉ -sec	S	90	n _D ²³ : 1,5102
27	H	H	CH ₃	OC ₃ H ₇ -n	S	59	n _D ²³ : 1,5321
28	Cl	H	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	S	89	n _D ²³ : 1,5061
29	Cl	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	S	84	n _D ²³ : 1,5169
30	Cl	H	C ₂ H ₅		S	76	n _D ²³ : 1,5611
31	Cl	H	CH ₃	OC ₃ H ₇ -n	S	80	n _D ²³ : 1,5080
32	Cl	H	C ₂ H ₅	OC ₃ H ₇ -n	S	81	103°C (p. fus.)
33	H	C ₃ H ₇ -iso	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	S	95	n _D ²³ : 1,4880
34	H	C ₃ H ₇ -iso	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	S	85	n _D ²³ : 1,4967
35	H	C ₃ H ₇ -iso	C ₂ H ₅	SC ₃ H ₇ -n	S	90	n _D ²³ : 1,5130
36	H	C ₃ H ₇ -iso	CH ₃	OCH ₃	S	78	n _D ²³ : 1,4960

Ejemplo No.	R	R ¹	R ²	R ³	X	rendimiento (% de la teoría)	índice de refracción
37	H	C ₃ H ₇ -iso	C ₃ H ₇ -iso	CH ₃	S	82	n _D ²³ : 1,4940
38	H	C ₃ H ₇ -iso	C ₂ H ₅		S	74	n _D ²³ : 1,5380
39	H	C ₃ H ₇ -iso	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	O	76	n _D ²³ : 1,4660
40	H	C ₃ H ₇ -iso	C ₂ H ₅	CH ₃	S	79	n _D ²³ : 1,4983
41	H	C ₃ H ₇ -iso	CH ₃	C ₂ H ₅	S	88	n _D ²³ : 1,5024
42	H	C ₃ H ₇ -iso	C ₂ H ₅	C ₄ H ₉ -sec	S	89	n _D ²³ : 1,4984
43	H	C ₃ H ₇ -iso	C ₂ H ₅	OC ₃ H ₇ -n	S	95	n _D ²³ : 1,4865

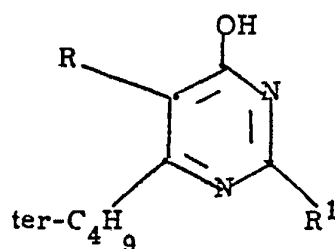
Las 4-hidroxi-6-ter-butil-pirimidinas

(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, 19,4 g (0,2 moles) de hidrocloreuro de acetamida, 34,4 g (0,2 moles) de éster etílico del ácido pivaloil-acético y 100 ml de metanol es calentada durante 10 horas con reflujo; luego la misma es concentrada por evaporación y el residuo recogido en 350 ml de agua.
- 10 La solución acuosa es mezclada bajo refrigeración con hielo, con ácido clorhídrico concentrado hasta un pH de ≈ 6 y subsiguientemente extraída dos veces con 200 ml de cloruro de metileno cada vez. Los extractos de cloruro de metileno reunidos son secados con sulfato de sodio y luego concentrados. Se obtienen 21 g (63% de la teoría) de
- 15 2-metil-4-hidroxi-6-ter-butil-pirimidina en forma de cristales incoloros, de punto de fusión 131-132°C.

En forma análoga pueden ser preparados los siguientes compuestos de fórmula



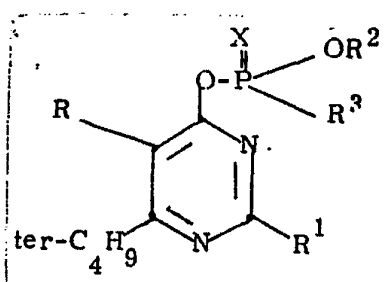
(III)

R	R ¹	rendimiento (% de la teoría)	punto de fusión °C
H	C ₂ H ₅	79	46
H	H	45	218
H	C ₃ H ₇ -iso	62	113

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 pirimidinílicos de los ácidos [tiono-(tiol)]fosfo-rico(nico) de fórmula



en la cual representan:

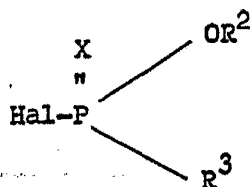
R hidrógeno, halógeno o alquilo;

R¹ hidrógeno o alquilo;

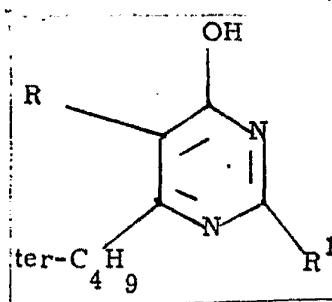
R² alquilo;

10 R³ alquilo, alcoxi, alquiltio o fenilo y

X oxígeno o azufre; caracterizado porque halogenuros ésteres de los ácidos fosfórico, tionotiol- y tionotiofosfórico, fosfónicos y tionofosfónicos de fórmula



15 en la cual R², R³ y X tienen los significados indicados anteriormente y Hal representa halógeno, preferiblemente cloro, se hacen reaccionar con 4-hidroxi-6-terc-butil-pirimidinas de fórmula



5 en la cual R y R¹ tienen los significados indicados anteriormente eventualmente en presencia de un agente aceptor de ácidos o eventualmente en forma de las correspondientes sales alcalinas, alcalinoterreas o de amonio, y eventualmente en presencia de un disolvente o diluyente.

10 2.- Procedimiento para la obtención de ésteres pirimidínicos de los ácidos [tiono-(tiol)]-fosforico(nico), tal y como queda sustancialmente descrito en la presente Memoria.

Esta Memoria consta de 55 hojas escritas a máquina por una sola cara.

- 1 SET. 1977

Madrid,

BAYER AKTIENGESELLSCHAFT.

I. M. GOMEZ ACEBO Y POMBO
p. p. Firmado: Alejandro Calle López

~~X~~