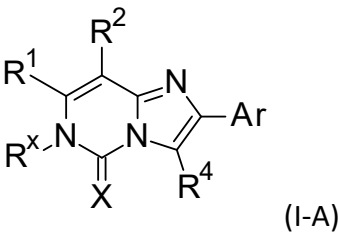


ANEXO I

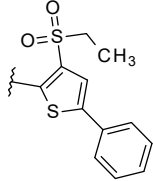
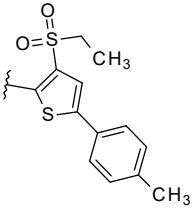
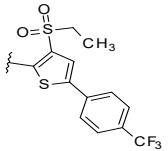
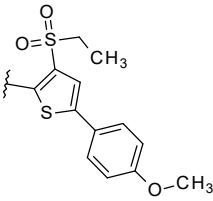
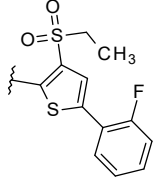
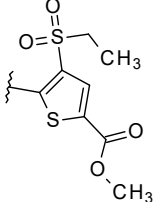
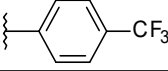
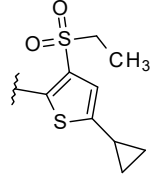
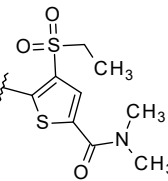
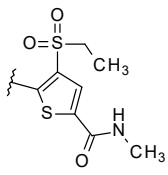
Datos experimentales de respaldo adicionales PF160053

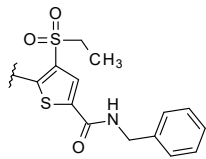
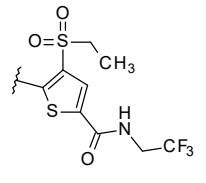
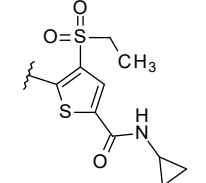
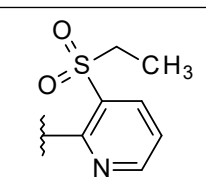
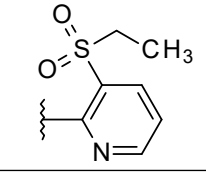
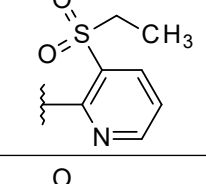
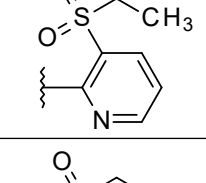
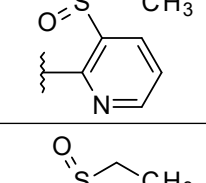
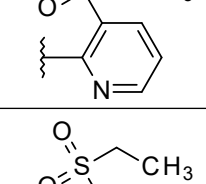
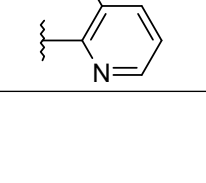
1) Preparación y caracterización de compuestos

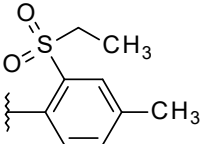
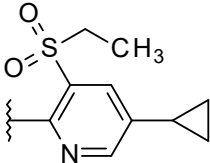
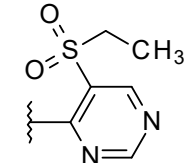
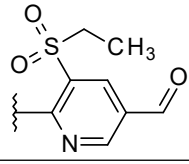
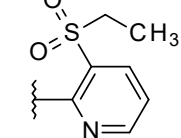
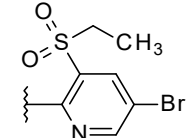
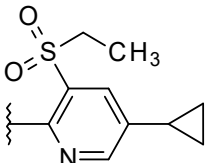
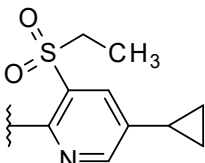
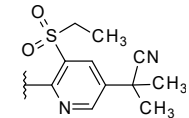
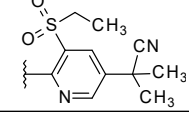
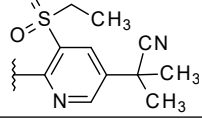
Mediante procedimientos análogos al procedimiento descrito en la página 67 ss. de la presente solicitud, se prepararon los siguientes ejemplos de la Fórmula I-A, en donde los sustituyentes Ar, R¹, R², R^x, R⁴ y X son como se describen en la Tabla Z.



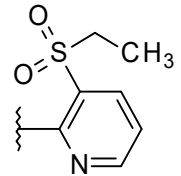
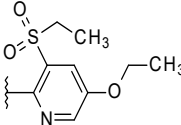
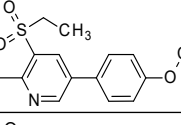
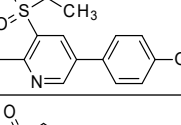
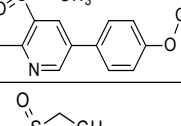
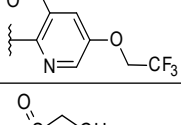
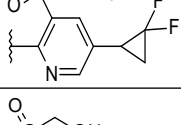
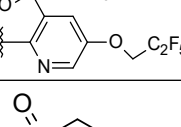
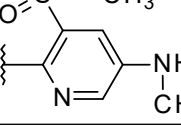
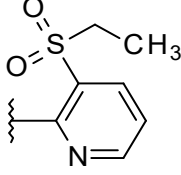
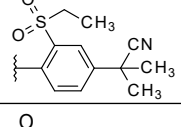
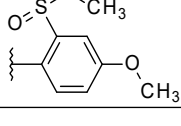
Ejemplo No.	Ar	R ¹	R ²	R ^x	R ⁴	X	Datos fisicoquímicos: Retención de HPLC [min] ¹		
							M+1	t _R (min)	Método HPLC
C-39		CF ₃	H	CH ₃	H	O	514,9	1,292	A
C-40		CF ₃	H	CH ₃	H	O	531,1	1,284	A
C-41		CF ₃	H	CH ₃	H	O	463	1,246	A
C-42		CF ₃	H	CH ₃	H	O	493	1,256	A
C-43		CF ₃	H	CH ₃	H	O	488	1,19	A
C-44		CF ₃	H	CH ₂ CH ₃	H	O	441	1,159	A

Ejemplo No.	Ar	R ¹	R ²	R ^x	R ⁴	X	Datos fisicoquímicos: Retención de HPLC [min] ¹		
							M+1	t _R (min)	Método HPLC
C-45		CF ₃	H	CH ₃	H	O	467,9	1,317	A
C-46		CF ₃	H	CH ₃	H	O	481,9	1,385	A
C-47		CF ₃	H	CH ₃	H	O	535,9	1,411	A
C-48		CF ₃	H	CH ₃	H	O	497,9	1,315	A
C-49		CF ₃	H	CH ₃	H	O	485,9	1,332	A
C-50		CF ₃	H	CH ₃	H	O	449,9	1,146	A
C-51		CF ₃	H	ciclopropilo	H	O	388	2,1	B
C-52		CF ₃	H	CH ₃	H	O	431,8	1,26	A
C-53		CF ₃	H	CH ₃	H	O	463	1,026	A
C-54		CF ₃	H	CH ₃	H	O	449	0,944	A

Ejemplo No.	Ar	R ¹	R ²	R ^x	R ⁴	X	Datos fisicoquímicos: Retención de HPLC [min] ¹		
							M+1	t _R (min)	Método HPLC
C-55		CF ₃	H	CH ₃	H	O	524,8	1,17	A
C-56		CF ₃	H	CH ₃	H	O	512	1,054	A
C-57		CF ₃	H	CH ₃	H	O	470,1	1,006	A
C-58		CF ₃	H	bencilo	H	O	462,9 5	1,856	B
C-59		CF ₃	H	ciclopropil metilo	H	O	428	1,803	B
C-60		CF ₃	H	isopropilo	H	O	429,1	1,931	B
C-61		CF ₃	H	Ciclohexil metilo	H	O	468,8	2,188	B
C-62		CF ₃	H	prop-2-inilo	H	O	411	1,653	B
C-63		CF ₃	H	CH ₂ CF ₃	H	O	454	1,771	B
C-64		CF ₃	H	C ₂ H ₄ OCH ₃	H	O	431	1,653	B

Ejemplo No.	Ar	R ¹	R ²	R ^x	R ⁴	X	Datos fisicoquímicos: Retención de HPLC [min] ¹		
							M+1	t _R (min)	Método HPLC
C-65		CF ₃	H	CH ₃	H	O	399,8	1,117	A
C-66		CF ₃	H	ciclobutilo	H	O	480	2,155	B
C-67		CF ₃	H	ciclopropil metilo	H	O	428	1,803	B
C-68		CF ₃	H	CH ₃	H	O	415	0,979	A
C-69		CF ₃	CH ₃	CH ₃	H	O	401	1,754	B
C-70		CF ₃	H	ciclopropilo	H	O	n.d.	n.d.	n.d.
C-71		CF ₃	H	CH ₂ CF ₃	H	O	n.d.	n.d.	n.d.
C-72		CF ₃	H	ciclopropilo	H	O	n.d.	n.d.	n.d.
C-73		CF ₃	H	ciclopropilo	H	O	481	n.d.	n.d.
C-74		CF ₃	H	CH ₃	H	O	454	n.d.	n.d.
C-75		CF ₃	H	ciclopropil- metilo	H	O	494	n.d.	n.d.

Ejemplo No.	Ar	R ¹	R ²	R ^x	R ⁴	X	Datos fisicoquímicos: Retención de HPLC [min] ¹		
							M+1	t _R (min)	Método HPLC
C-76		CF ₃	H	ciclopropilo	H	O	3,635	M-H 464	C
C-77		CF ₃	H	ciclopropilo	H	O	1,807	463	C
C-78		CF ₃	H	2-propenilo	H	O	1,775	413,20	C
C-79		CF ₃	H	ciclopropilo	H	O	1,830	438	C
C-80		CF ₃	H	ciclopropilo	H	O	1,848	428	C
C-81		CF ₃	H	ciclopropilo	H	O	2,260	493	C
C-82		CF ₃	H	ciclopropilo	H	O	1,914	439	C
C-83		CF ₃	H	ciclopropilo	H	O	1,504	429	C
C-84		CF ₃	H	-CH ₂ CH ₂ F	H	O	1,653	(M+) 418	C
C-85		CF ₃	H	-CH ₃	CH ₃	O	1,176	480,9	C
C-86		CF ₃	H	Ciclohexil metilo	H	O	2,162	548,2	C

Ejemplo No.	Ar	R ¹	R ²	R ^x	R ⁴	X	Datos fisicoquímicos: Retención de HPLC [min] ¹		
							M+1	t _R (min)	Método HPLC
C-87		CF ₃	H	Ciclobutil metilo	H	O	2,005	441	C
C-88		CF ₃	H	-CH ₃	H	O	1,121	430,9	C
C-89		CF ₃	H	ciclopropilo	H	O	2,517	573	C
C-90		CF ₃	H	-CH ₃	H	O	1,201	493	C
C-91		CF ₃	H	ciclopropilo	H	O	2,51	555	C
C-92		CF ₃	H	ciclopropilo	H	O	1,90	511	C
C-93		CF ₃	H	ciclopropilo	H	O	1,86	489	C
C-94		CF ₃	H	ciclopropilo	H	O	1,96	561	C
C-95		CF ₃	H	ciclopropilo	H	O	1,90	442	C
C-96		C ₂ F ₅	H	ciclopropilo	H	O	1,87	463	C
C-97		CF ₃	H	ciclopropilo	H	O	1,94	479	C
C-98		CF ₃	H	-CH ₃	H	O	1,109	416	C

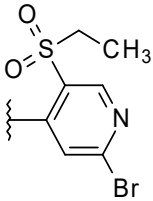
Ejemplo No.	Ar	R ¹	R ²	R ^x	R ⁴	X	Datos fisicoquímicos: Retención de HPLC [min] ¹		
							M+1	t _R (min)	Método HPLC
C-99		CF ₃	H	-CH ₃	H	O	1,155	466,8	C

Tabla Z: identidad de los compuestos C-39 a C99 y caracterización física mediante HPLC-MS; n.d. significa que no está disponible fácilmente en este punto temporal pero que se puede producir de ser necesario.
Método de HPLC A: Columna: Phenomenex Kinetex 1,7 µm XB-C18 100A; 50 x 2,1 mm. Elución: acetonitrilo / agua + 0,1 % de ácido trifluoroacético (TFA) en una relación de 5:95 (flujo 0,8 ml/min) a 100:0 (flujo 1 ml/min) en 1,5 minutos a 60 °C. Método de HPLC B: Columna: Eclipse Plus C-18, 5 µm, 50 mm x 4,6 mm. Elución: el amortiguador A es acetonitrilo / agua + 10 % de formiato de amonio y 0,1 % de ácido fórmico; el amortiguador B es acetonitrilo más 0,1 % de ácido fórmico en una relación A:B de 10:90 a 100:0 (flujo 1,2 ml/min) en 1,5 minutos, que luego se mantiene a 100:0 durante 1 min, todo a 30 °C. Método C de HPLC: Fase móvil: A: agua + 0,1 % de TFA; B: acetonitrilo Gradiente: 5 % de B a 100 % de B en 1,5 min Flujo: 0,8 ml/min a 1,0 ml/min en 1,5 min Temperatura: 60 °C columna: Kinetex XB C18 1,7 µ 50 x 2,1 mm Método MS: ESI Positivo Dispositivo: Shimadzu Nexera LC-30 LCMS-2020.

Además, los siguientes ejemplos de la Fórmula I-A se prepararon en consecuencia, en donde los sustituyentes Ar, R¹, R², R^x, R⁴ y X son como se muestran en la Tabla Y.

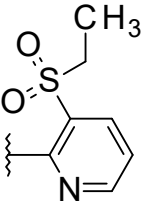
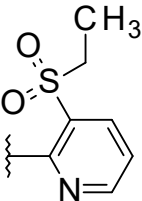
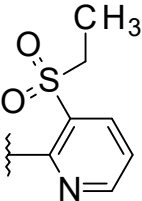
Ejemplo No.	Ar	R ¹	R ²	R ^x	R ⁴	X	¹ H NMR
C-100		OCH ₂ CF ₃	H	CH ₃	H	O	¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃): δ 8,92 (br d, J=3,75 Hz, 1 H) 8,53 (d, J=6,84 Hz, 1 H) 8,36 (s, 1 H) 7,55 (dd, J=8,05, 4,74 Hz, 1 H) 6,28 (s, 1 H) 4,55 (q, J=7,35 Hz, 2 H) 3,64 (s, 3 H) 3,58 (q, J=7,28 Hz, 2 H) 1,28 (t, J=7,39 Hz, 3 H).
C-101		SCF ₃	H	CH ₃	H	O	¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃): δ 8,90 (dd, J=4,77, 1,63 Hz, 1 H) 8,53 (dd, J=8,16, 1,63 Hz, 1 H) 8,43 (s, 1 H) 7,53 (dd, J=8,03, 4,77 Hz, 1 H) 7,32 (s, 1 H) 3,79 - 3,94 (m, 5 H) 1,34 (t, J=7,47 Hz, 3 H).
C-102		S(O)CF ₃	H	CH ₃	H	O	¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃): δ 8,59 (s, 1 H) 8,53 (d, J=6,62 Hz, 1 H) 8,03 (d, J=7,94 Hz, 1 H) 7,47 (dd, J=7,94, 6,62 Hz, 1 H) 7,28 (s, 1 H) 3,84 (s, 3 H) 3,77 (q, J=7,42 Hz, 2 H) 1,37 (t, J=7,50 Hz, 3 H)

Tabla Y: identidad de compuestos C-100 a C-102 y caracterización física mediante ¹H-RMN.

2) Pruebas biológicas

Los compuestos C-39 a C-99 se probaron para determinar la actividad contra *Aedes aegypti*; ("AEDES"), *Aculopus pelekassi* ("ACULPS"), *Anthonomus grandis* ("ANTHGR"), ***Aphis craccivora*** ("APHICR"), *Heliothis virescens* ("HELIVI"), *Megoura viciae* ("MEGHVI"), *Myzus persicae* ("MYZUPE"), ***Nephotettix virescens*** ("NEPHIM"), *Nezara viridula* ("NEVI"), ***Nilaparvata lugens*** ("NILALU"), ***Plutella xylostella*** ("PLUTMA"), *Rhipicephalus sanguineus* ("RHIS"), ***Spodoptera eridania*** ("PRODER") y *Trialeurodes vaporariorum* ("TRIAVA"). Todas las pruebas se realizaron con una concentración de ingrediente activo (a.i.) de 2500 ppm, a menos que se especifique de otro modo. Las pruebas contra ANTHGR, HELIVI, MEGHVI, MYZUPE y NEPHIM se llevaron a cabo como se describe en las páginas 73-77 de la publicación internacional. Las pruebas contra AEDES, ACULPS, APHICR, NEPHIM, NEVI, NILALU, PLUTMA, PRODER, TRIAVA y RHIS se llevaron a cabo de la siguiente manera:

Mosquito de la fiebre amarilla (*Aedes aegypti*; AEDES)

Para la evaluación del control de mosquitos de la fiebre amarilla (*Aedes aegypti*), la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación con 96 cavidades que contenían 200 µl de agua corriente por cavidad y 5-15 larvas de *A. aegypti* recién nacidas. Los compuestos activos se formularon con una solución que contenía 75 % (v/v) de agua y 25 % (v/v) de DMSO. Sobre la dieta para insectos, se pulverizaron diferentes concentraciones de los compuestos formulados o las mezclas a 2,5 µl, usando un microatomizador hecho a medida, con dos réplicas. Después de la aplicación, se incubaron placas de microtitulación a 28 + 1 °C, 80 + 5 % de HR durante 2 días. Luego, se evaluó visualmente la mortalidad de las larvas.

Chinche verde hedionda (*Nezara viridula*; NEVI)

El compuesto activo se disolvió en la concentración deseada en una mezcla 1:1 (vol:vol) de agua destilada:acetona. Se agregó tensioactivo (Kinetic) en una proporción de 0,01 % (vol/vol). La solución de prueba se preparó el día de uso. Las vainas de soja se colocaron en placas de Petri de vidrio de 90 x 50 mm recubiertas con papel de filtro húmedo y se inocularon con 10 *N. viridula* tardías de 3.a etapa. Con un atomizador manual, se pulverizó en cada placa de Petri una solución de aproximadamente 2 ml. El conjunto tratado se mantuvo a alrededor de 25-26 °C y con una humedad relativa de alrededor de 65-70 %. El porcentaje de mortalidad se registró luego de 5 días.

Mosca blanca de invernadero (*Trialeurodes vaporariorum*; TRIAVA)

Para evaluar el control de la mosca blanca de invernadero (*Trialeurodes vaporariorum*), la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación de 96 cavidades que contenían un disco de hoja de berenjena con huevos de mosca blanca. Los compuestos o las mezclas se formularon

con una solución que contenía 75 % de agua y 25 % de DMSO. Sobre la dieta para insectos, se pulverizaron diferentes concentraciones de los formulados a 2,5 µl, usando un microatomizador hecho a medida, con dos réplicas. Después de la aplicación, se incubaron placas de microtitulación a 23 + 1 °C, 65 + 5 % de HR durante 6 días. Luego se evaluó visualmente la mortalidad de los gusanos nacidos.

Garrapata marrón del perro (*Rhipicephalus sanguineus*; RHIS)

Se evaluó la eficacia de contacto de los compuestos inventivos C-71 y C-72 para las garrapatas marrones del perro después de un ensayo de contacto de vial de vidrio con exposiciones continuas. En resumen, los viales de vidrio (20 ml de centelleo) se trataron con 445 µl de distintas concentraciones del compuesto disuelto en acetona. Los viales se giraron de costado y se colocaron sobre una mesa de rodillos automatizada. Los viales se hicieron rodar (6 rpm) sin tapa para permitir un recubrimiento parejo del tratamiento. Después de hacerlos rodar, se dejó que los viales se secaran por completo durante al menos una hora. Cada tratamiento se replicó cinco veces. Aproximadamente seis garrapatas marrones se colocaron en cada vial y se expusieron a tratamientos a temperatura ambiente durante la duración del estudio.

Ácaros de la roya de los cítricos (*Aculopus pelekassi*; ACULPS)

Los compuestos se diluyeron en acetona pura hasta una concentración de 2000 ppm para solución de reserva. Para preparar soluciones diluidas de 1000 y 100 ppm, respectivamente, se mezclaron la solución de reserva y 0,05 % de Tween-20 en agua. Se vertieron 30 ml de 1 % de agar con violeta cristal en una taza de plástico de 60 ml. Las hojas de una planta de cítrico infestada en la etapa de hoja verdadera 3-5 se prepararon de la siguiente manera: Se cortaron 5 centímetros cuadrados de hoja con un cúter. Luego se vertieron 2 ml de 1 % de agar a una temperatura por debajo de 45 °C sobre el agar solidificado e inmediatamente el disco de hoja tratada se colocó boca abajo en la capa de agar líquido (cara adaxial hacia abajo). Las tazas se pulverizaron mediante un aerógrafo con 100 µl de soluciones diluidas y se sellaron con tapas. Se contaron los adultos y las ninfas. Las configuraciones contenían 20-100 ácaros, y se hicieron dos réplicas. Las tazas que contenían ácaros de la roya de los cítricos se colocaron en vertical en una bandeja y se mantuvieron en una cámara a 25 °C y un ciclo a la luz del día-noche de 16 horas/8 horas.

Áfido de caupí (*Aphis craccivora*; APHICR)

El compuesto activo se disolvió en la concentración deseada en una mezcla 1:1 (vol:vol) de agua destilada:acetona. Se agregó tensioactivo (Kinetic) en una proporción de 0,01 % (v/v). La solución de prueba se preparó el día de uso.

Las plantas de caupí en macetas se colonizaron con aproximadamente 30 - 50 áfidos de diversas etapas transfiriendo manualmente cortes de hojas infestadas por áfidos 24 horas antes de la aplicación. Las plantas se rociaron con las soluciones de prueba usando un atomizador manual DeVilbiss® a 20- 30 psi ($\approx$ 1,38 a 2,07 bar) después de que se revisó la población de las plagas. Las plantas tratadas se mantuvieron en carros transportadores a alrededor de 25-26 °C. El porcentaje de mortalidad estimado se determinó después de 72 horas.

Cigarra verde del arroz (*Nephotettix virescens*; NEPHIM)

Las plántulas de arroz de cuatro a cinco semanas de vida con la porción de hoja superior cortada se limpiaron y se lavaron 24 horas antes de la pulverización. Los compuestos activos se formularon en 1:1 de acetona:agua (vol:vol), y se agregó 0,01 % v/v de tensioactivo (Kinetic). Las plántulas de arroz en macetas se pulverizaron con 5-6 ml de solución de prueba, se secaron al aire, se cubrieron con cajas Mylar y se inocularon con 10 adultos. Las plantas de arroz tratadas se mantuvieron a alrededor de 28-29 °C y con una humedad relativa de alrededor de 50-60 %. El porcentaje de mortalidad se registra luego de 72 horas.

Saltamontes marrón del arroz (*Nilaparvata lugens*, NILALU)

Las plántulas de arroz de cuatro a cinco semanas de vida se limpiaron y se lavaron 24 horas antes de la pulverización. Los compuestos activos se formularon en 1:1 de acetona:agua (vol:vol), y se agregó 0,01 % v/v de tensioactivo (Kinetic). Las plántulas de arroz en macetas se pulverizaron con 5-6 ml de solución de prueba, se secaron al aire, se cubrieron con cajas Mylar y se inocularon con 10 adultos. Las plantas de arroz tratadas se mantuvieron a alrededor de 28-29 °C y con una humedad relativa de alrededor de 50-60 %. El porcentaje de mortalidad se registra luego de 72 horas.

Polilla de la col (*Plutella xylostella*; PLUTMA)

El compuesto activo se disolvió en la concentración deseada en una mezcla 1:1 (vol:vol) de agua destilada:acetona. Se agregó tensioactivo (Kinetic) en una proporción de 0,01 % (vol/vol). La solución de prueba se preparó el día de uso. Los discos de hojas de col (60 mm de diámetro) se sumergieron en solución de prueba y se secaron al aire. Las hojas tratadas se colocaron en placas de Petri recubiertas con papel de filtro húmedo y se inocularon con diez larvas de 3.a etapa. La mortalidad se registró 72 horas después del tratamiento. Los daños por la alimentación también se registraron usando una escala de 0-100 %.

Gusano cogollero del sur (*Spodoptera eridania*, larva de 2da etapa; PRODER)

Los compuestos activos se formularon mediante un distribuidor de líquidos Tecan en ciclohexanona al 100 % como una solución de 10.000 ppm suministrada en tubos. La solución de 10.000 ppm se diluyó en serie en ciclohexanona al 100 % para obtener soluciones provisionales. Estas sirvieron como soluciones de reserva para las cuales se obtuvieron diluciones finales mediante el Tecan en 50 % de acetona:50 % de agua (v/v) en viales de vidrio de 10 o 20 ml. Se incluyó un tensioactivo no iónico (Kinetic[®]) en la solución a un volumen de 0,01 % (v/v). Los viales se insertaron en un pulverizador electroestático equipado con una boquilla atomizadora para la aplicación en plantas/insectos.

Se cultivaron 2 plantas de frijoles de lima (variedad Sieva) en una maceta y se seleccionaron para el tratamiento en la etapa de la primera hoja verdadera. Las soluciones de prueba se pulverizaron sobre el follaje con un pulverizador electrostático automatizado para plantas, equipado con una boquilla de pulverización atomizadora. Las plantas se secaron en la campana de humos del pulverizador y luego se retiraron de este. Cada maceta se colocó en bolsas de plástico perforadas con un cierre zip. De 10 a 11 larvas de gusanos cogolleros se colocaron en las bolsas y estas se cerraron. Las plantas de prueba se mantuvieron en una cámara de crecimiento a alrededor de 25 °C y con alrededor de 20-40 % de humedad relativa durante 4 días, para así evitar la exposición directa a la luz fluorescente (fotoperíodo de 14:10 luz:oscuridad) para impedir la acumulación de calor en las bolsas. La mortalidad y la reducción en la alimentación se evaluaron 4 días después del tratamiento, en comparación con plantas de control sin tratar.

Barrenador del arroz (*Chilo suppressalis*; “CHILSU”)

El compuesto activo se disolvió en la concentración deseada en una mezcla 1:1 (vol:vol) de agua destilada:acetona. Se agregó tensioactivo (Kinetic) en una proporción de 0,01 % (v/v). La solución de prueba se preparó el día de uso. 10 larvas de primera etapa se introdujeron en un lado de la placa de Petri pulverizada y se desplazaron hasta alcanzar finalmente paja de arroz recién cortada en otro lado de la placa. Cuando todas las larvas estaban dentro de la paja, se tapó con la tapa de placa de Petri. El porcentaje de mortalidad se registró 72 horas después del tratamiento.

Se observaron los siguientes efectos:

ANTHGR:

Los compuestos C-39, C-40, C-41, C-42, C-43, C-44, C-49, C-50, C-52, C-53, C-56, C-57, C-58, C-59, C-60, C-62, C-63, C-64, C-65, C-66, C-68, C-73, C-74 y C-101 mostraron más de 75 % de

mortalidad en comparación con controles sin tratar frente a ANTHGR. Los Compuestos C-75, C-76, C-77, C-81, C-89, C-90, C-91, C-92, C-93, C-94, C-95 y C-97 a 800 ppm mostraron más de 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar. El Compuesto C-55 a 800 ppm mostró al menos 50 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar frente a ANTHGR. Los Compuestos C-79, C-80, C-84, C-88, C-96 y C-98 a 2500 ppm mostraron más de 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar.

HELIVI:

Los compuestos C-39, C-40, C-41, C-43, C-44, C-47, C-49, C-50, C-51, C-52, C-56, C-58, C-59, C-60, C-62, C-63, C-65, C-66, C-73, C-74 y C-101 mostraron más de 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar frente a HELIVI. Los Compuestos C-75, C-76, C-77, C-78, C-81, C-89, C-90, C-91, C-92, C-93, C-94, C-95 y C-97 a 800 ppm mostraron más de 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar. Los compuestos C-42, C-45, C-53, C-68 a 800 ppm mostraron al menos 50 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar frente a HELIVI. Los Compuestos C-79, C-80, C-88, C-96, C-98 a 2500 ppm mostraron más de 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar.

MEGHVI:

Los compuestos C-39, C-40, C-41, C-43, C-50, C-53, C-56, C-57, C-58, C-59, C-60, C-61, C-62, C-63, C-64, C-66, C-68, C-73, C-101 y C-102 mostraron más de 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar frente a MEGHVI. Los compuestos C-48 y C-49 mostraron al menos 50 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar frente a MEGHVI. El Compuesto C-78 a 800 ppm mostró más de 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar frente a MEGHVI. Los compuestos C-84, C-96 y C-98 a 2500 ppm mostraron más de 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar frente a MEGHVI.

MYZUPE:

Los compuestos C-40, C-41, C-43, C-44, C-45, C-50, C-52, C-53, C-54, C-56, C-57, C-58, C-59, C-61, C-62, C-63, C-64, C-65, C-66, C-68, C-73, C-74 mostraron más de 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar frente a MYZUPE. Los Compuestos C-73 y C-75 a 800 ppm mostraron más de 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar. Los compuestos C-39 y C-60 mostraron al menos 50 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar frente a MYZUPE.

TRIAVA:

Los compuestos C-40, C-44, C-56, C-59, C-63, C-64, C-68, C-73, C-74 mostraron más de 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar frente a TRIAVA. Los compuestos C-57, C-62 y C-66 mostraron al menos 50 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar frente a TRIAVA.

RHIS:

Tres días después del tratamiento, los compuestos C-71 y C-72 mostraron al menos 70 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar frente a *Rhipicephalus sanguineus* a una concentración de 500 ppm.

ACULPS:

Los compuestos C-2, C-70 y C-71 mostraron al menos 70 % de mortalidad a 100 ppm de concentración 8 días después del tratamiento.

AEDES:

En esta prueba, los Compuestos C-73, C-74 a 800 ppm mostraron más de 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar.

NEVI:

En esta prueba, los Compuestos C-73, C-74, C-75 a 800 ppm mostraron más de 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar. En esta prueba, los compuestos C-77, C-79, C-84, C-89, C-91, C-92, C-93, C-96 a 300 ppm mostraron más de 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar. En esta prueba, el compuesto C-97 a 1000 ppm muestra más de 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar.

APHICR:

En esta prueba, los Compuestos C-76, C-77, C-78, C-79, C-81, C-82, C-84, C-88, C-96, C-91, C-92, C-94, C-97 y C-98 a 300 ppm mostraron más de 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar. En esta prueba, los compuestos C-100, C-101 y C-102, resp., a 500 ppm mostraron más de 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar.

NEPHIM:

En esta prueba, los Compuestos C-77, C-84, C-91, C-92, C-93, C-96 a 300 ppm mostraron más de 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar.

NILALU:

En esta prueba, los Compuestos C-91, C-93 a 300 ppm mostraron más de 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar.

PLUTMA:

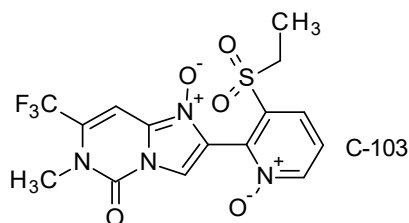
En esta prueba, los Compuestos C-84, C-86, C-89, C-92, C-94, C-101 a 300 ppm mostraron más de 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar. En esta prueba, el compuesto C-97 a 1000 ppm muestra más de 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar.

PRODER:

En esta prueba, los compuestos C-76, C-77, C-82, C-89, C-91, C-92, C-93, C-94 y C-97 a 300 ppm mostraron más de 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar.

III) N-óxidos, estereoisómeros y sales aceptables en la agricultura o veterinaria

Se ha preparado el siguiente N-óxido de C-103 de manera análoga a los ejemplos sintéticos de la publicación internacional:



Se probó el compuesto C-100 para determinar la actividad biológica a una concentración de 2500 ppm como se describe en el ítem 3) más arriba. El Compuesto C-76 muestra más de 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar frente a ANTHGR, HELIVI, MEGHVI, MYZUPE, y más de 50 % mortalidad en comparación con controles sin tratar frente a TRIAVA.