

WO 2021/000865 A1

一种异噁唑啉类化合物及其制备方法和应用

交叉引用

本发明要求在中国专利局提交的、申请号为 201910583893.X、发明名称为“一种异噁唑啉类化合物及其应用”的中国专利申请的优先权，该申请的全部内容通过引用结合在本发明中。

技术领域

本发明涉及一种异噁唑啉类化合物，具体涉及一种新型的异噁唑啉类化合物及其制备方法和应用。

背景技术

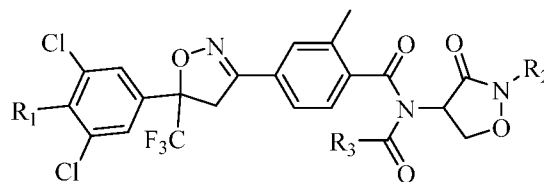
专利 CN102639529A 涉及某些具有杀虫活性的异噁唑啉衍生物。但由于杀虫杀螨剂在使用一段时间后，害虫害螨会对其产生抗性，因此需要不断研发新型的和改进的具有杀虫杀螨活性的新化合物；同时，随着人们对农畜产品等日益增长的需要和对环境保护的日益重视，也一直需要使用高效、广谱且对环境友好的新的杀虫杀螨剂。

发明内容

本发明的目的在于提供一种杀虫杀螨活性好的异噁唑啉类化合物及其制备方法和应用。该异噁唑啉类化合物可用于制备农业和其它领域中防治害虫害螨的药物以及在兽药领域用于制备控制动物寄生虫的药物。

为实现本发明的发明目的，本发明提供了如下技术方案：

一种异噁唑啉类化合物，如通式 I 所示：



通式 I

式中：

R₁ 选自氢、氯或氟；

R₂ 选自乙基或 2, 2, 2-三氟乙基；

R₃ 选自 C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 卤代烷基、C₃-C₈ 环烷基或 C₁-C₆ 烷氧基 C₁-C₆ 烷基；

或为通式 I 化合物的立体异构体；

或为通式 I 化合物的盐；

或为通式 I 化合物的立体异构体的盐。

在一种可能的实现方式中，通式 I 中，

R_1 选自氢、氯或氟；

R_2 选自乙基或 2, 2, 2-三氟乙基；

R_3 选自 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_3 - C_4 环烷基或 C_1 - C_4 烷氧基 C_1 - C_3 烷基。

在一种可能的实现方式中，通式 I 中，

R_1 选自氢、氯或氟；

R_2 选自乙基或 2, 2, 2-三氟乙基；

R_3 选自 C_1 - C_4 烷基、环丙基或 C_1 - C_4 烷氧基 C_1 - C_2 烷基。

在一种可能的实现方式中，通式 I 化合物的盐包括：通式 I 化合物与盐酸、氢溴酸、硫酸、磷酸、甲酸、乙酸、丙酸、丁酸、戊酸、三氟乙酸、草酸、丙二酸、甲磺酸、4-甲苯磺酸、苹果酸、富马酸、乳酸、马来酸、水杨酸、酒石酸或柠檬酸形成的盐。

在一种可能的实现方式中，通式 I 化合物的立体异构体的盐包括：通式 I 化合物的立体异构体与盐酸、氢溴酸、硫酸、磷酸、甲酸、乙酸、丙酸、丁酸、戊酸、三氟乙酸、草酸、丙二酸、甲磺酸、4-甲苯磺酸、苹果酸、富马酸、乳酸、马来酸、水杨酸、酒石酸或柠檬酸形成的盐。

在一种可能的实现方式中，异噁唑啉类化合物选自表 1 化合物，所述表 1 化合物具有如通式 I 的结构且 R_1 、 R_2 和 R_3 如表 1 中所示：

表 1

化合物编号	R_1	R_2	R_3
1	H	乙基	甲基
2	H	乙基	乙基
3	H	乙基	正丙基
4	H	乙基	异丙基
5	H	乙基	正丁基
6	H	乙基	异丁基
7	H	乙基	叔丁基
8	H	乙基	环丙基
9	H	乙基	CH_3OCH_2-
10	H	乙基	$CH_3CH_2OCH_2-$
11	H	乙基	$CH_3CH_2CH_2OCH_2-$
12	H	乙基	$(CH_3)_2CHOCH_2-$
13	H	乙基	$CH_3CH_2CH_2CH_2OCH_2-$

14	H	乙基	$(\text{CH}_3)_3\text{COCH}_2-$
15	H	乙基	$\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
16	H	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
17	H	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
18	H	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
19	F	乙基	甲基
20	F	乙基	乙基
21	F	乙基	正丙基
22	F	乙基	异丙基
23	F	乙基	正丁基
24	F	乙基	异丁基
25	F	乙基	叔丁基
26	F	乙基	环丙基
27	F	乙基	CH_3OCH_2-
28	F	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
29	F	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
30	F	乙基	$(\text{CH}_3)_2\text{CHOCH}_2-$
31	F	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
32	F	乙基	$(\text{CH}_3)_3\text{COCH}_2-$
33	F	乙基	$\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
34	F	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
35	F	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
36	F	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
37	H	2, 2, 2-三氟乙基	甲基
38	H	2, 2, 2-三氟乙基	乙基
39	H	2, 2, 2-三氟乙基	正丙基
40	H	2, 2, 2-三氟乙基	异丙基
41	H	2, 2, 2-三氟乙基	正丁基
42	H	2, 2, 2-三氟乙基	异丁基
43	H	2, 2, 2-三氟乙基	叔丁基
44	H	2, 2, 2-三氟乙基	环丙基
45	H	2, 2, 2-三氟乙基	CH_3OCH_2-
46	H	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
47	H	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$

48	H	2, 2, 2-三氟乙基	$(\text{CH}_3)_2\text{CHOCH}_2-$
49	H	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
50	H	2, 2, 2-三氟乙基	$(\text{CH}_3)_3\text{COCH}_2-$
51	H	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
52	H	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
53	H	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
54	H	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
55	F	2, 2, 2-三氟乙基	甲基
56	F	2, 2, 2-三氟乙基	乙基
57	F	2, 2, 2-三氟乙基	正丙基
58	F	2, 2, 2-三氟乙基	异丙基
59	F	2, 2, 2-三氟乙基	正丁基
60	F	2, 2, 2-三氟乙基	异丁基
61	F	2, 2, 2-三氟乙基	叔丁基
62	F	2, 2, 2-三氟乙基	环丙基
63	F	2, 2, 2-三氟乙基	CH_3OCH_2-
64	F	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
65	F	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
66	F	2, 2, 2-三氟乙基	$(\text{CH}_3)_2\text{CHOCH}_2-$
67	F	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
68	F	2, 2, 2-三氟乙基	$(\text{CH}_3)_3\text{COCH}_2-$
69	F	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
70	F	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
71	F	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
72	F	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
73	Cl	乙基	甲基
74	Cl	乙基	乙基
75	Cl	乙基	正丙基
76	Cl	乙基	异丙基
77	Cl	乙基	正丁基
78	Cl	乙基	异丁基
79	Cl	乙基	叔丁基
80	Cl	乙基	环丙基
81	Cl	乙基	CH_3OCH_2-

82	Cl	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
83	Cl	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
84	Cl	乙基	$(\text{CH}_3)_2\text{CHOCH}_2-$
85	Cl	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
86	Cl	乙基	$(\text{CH}_3)_3\text{COCH}_2-$
87	Cl	乙基	$\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
88	Cl	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
89	Cl	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
90	Cl	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
91	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	甲基
92	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	乙基
93	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	正丙基
94	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	异丙基
95	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	正丁基
96	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	异丁基
97	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	叔丁基
98	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	环丙基
99	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	CH_3OCH_2-
100	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
101	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
102	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	$(\text{CH}_3)_2\text{CHOCH}_2-$
103	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
104	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	$(\text{CH}_3)_3\text{COCH}_2-$
105	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
106	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
107	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
108	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$

或，选自任意一个表 1 化合物的立体异构体；

或，选自任意一个表 1 化合物与盐酸、氢溴酸、硫酸、磷酸、甲酸、乙酸、丙酸、丁酸、戊酸、三氟乙酸、草酸、丙二酸、甲磺酸、4-甲苯磺酸、苹果酸、富马酸、乳酸、马来酸、水杨酸、酒石酸或柠檬酸形成的盐；

或，选自任意一个表 1 化合物的立体异构体与盐酸、氢溴酸、硫酸、磷酸、甲酸、乙酸、丙酸、丁酸、戊酸、三氟乙酸、草酸、丙二酸、甲磺酸、4-甲苯磺酸、苹果酸、富马酸、乳酸、马来酸、水杨酸、酒石酸或柠檬酸形成的盐。

在一种可能的实现方式中，异噁唑啉类化合物选自表 2 化合物，所述表 2 化合物具

有如通式 I 的结构且 R_1 、 R_2 和 R_3 如表 2 中所示：

表 2

化合物编号	R_1	R_2	R_3
1	H	乙基	甲基
2	H	乙基	乙基
3	H	乙基	正丙基
4	H	乙基	异丙基
5	H	乙基	正丁基
6	H	乙基	异丁基
7	H	乙基	叔丁基
8	H	乙基	环丙基
9	H	乙基	CH_3OCH_2-
10	H	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
11	H	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
12	H	乙基	$(\text{CH}_3)_2\text{CHOCH}_2-$
19	F	乙基	甲基
20	F	乙基	乙基
21	F	乙基	正丙基
22	F	乙基	异丙基
23	F	乙基	正丁基
24	F	乙基	异丁基
25	F	乙基	叔丁基
26	F	乙基	环丙基
27	F	乙基	CH_3OCH_2-
28	F	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
29	F	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
30	F	乙基	$(\text{CH}_3)_2\text{CHOCH}_2-$
37	H	2, 2, 2-三氟乙基	甲基
38	H	2, 2, 2-三氟乙基	乙基
39	H	2, 2, 2-三氟乙基	正丙基
40	H	2, 2, 2-三氟乙基	异丙基
41	H	2, 2, 2-三氟乙基	正丁基
42	H	2, 2, 2-三氟乙基	异丁基
43	H	2, 2, 2-三氟乙基	叔丁基

44	H	2, 2, 2-三氟乙基	环丙基
45	H	2, 2, 2-三氟乙基	CH ₃ OCH ₂ -
46	H	2, 2, 2-三氟乙基	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ -
47	H	2, 2, 2-三氟乙基	CH ₃ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -
48	H	2, 2, 2-三氟乙基	(CH ₃) ₂ CHOCH ₂ -
55	F	2, 2, 2-三氟乙基	甲基
56	F	2, 2, 2-三氟乙基	乙基
57	F	2, 2, 2-三氟乙基	正丙基
58	F	2, 2, 2-三氟乙基	异丙基
59	F	2, 2, 2-三氟乙基	正丁基
60	F	2, 2, 2-三氟乙基	异丁基
61	F	2, 2, 2-三氟乙基	叔丁基
62	F	2, 2, 2-三氟乙基	环丙基
63	F	2, 2, 2-三氟乙基	CH ₃ OCH ₂ -
64	F	2, 2, 2-三氟乙基	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ -
65	F	2, 2, 2-三氟乙基	CH ₃ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -
66	F	2, 2, 2-三氟乙基	(CH ₃) ₂ CHOCH ₂ -
73	Cl	乙基	甲基
74	Cl	乙基	乙基
75	Cl	乙基	正丙基
76	Cl	乙基	异丙基
77	Cl	乙基	正丁基
78	Cl	乙基	异丁基
79	Cl	乙基	叔丁基
80	Cl	乙基	环丙基
81	Cl	乙基	CH ₃ OCH ₂ -
82	Cl	乙基	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ -
83	Cl	乙基	CH ₃ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -
84	Cl	乙基	(CH ₃) ₂ CHOCH ₂ -
91	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	甲基
92	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	乙基
93	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	正丙基
94	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	异丙基
95	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	正丁基

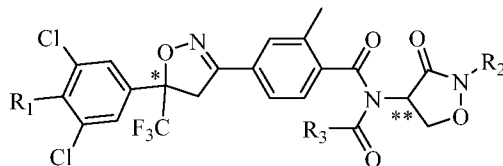
96	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	异丁基
97	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	叔丁基
98	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	环丙基
99	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	CH ₃ OCH ₂ -
100	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ -
101	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	CH ₃ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -
102	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	(CH ₃) ₂ CHOCH ₂ -

或，选自任意一个表 2 化合物的立体异构体；

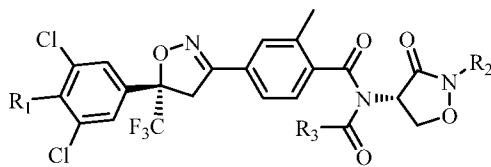
或，选自任意一个表 2 化合物与盐酸、氢溴酸、硫酸、磷酸、甲酸、乙酸、丙酸、丁酸、戊酸、三氟乙酸、草酸、丙二酸、甲磺酸、4-甲苯磺酸、苹果酸、富马酸、乳酸、马来酸、水杨酸、酒石酸或柠檬酸形成的盐；

或，选自任意一个表 2 化合物的立体异构体与盐酸、氢溴酸、硫酸、磷酸、甲酸、乙酸、丙酸、丁酸、戊酸、三氟乙酸、草酸、丙二酸、甲磺酸、4-甲苯磺酸、苹果酸、富马酸、乳酸、马来酸、水杨酸、酒石酸或柠檬酸形成的盐。

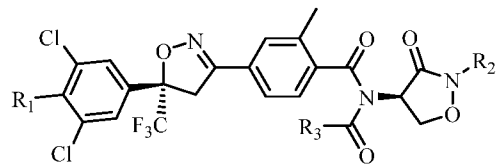
在本发明的通式 I 化合物中，通式 I 化合物具有两个手性碳原子（如下通式 I 中标注*和**的碳原子），因此，通式 I 化合物中，由*碳原子和**碳原子所表示的手性中心产生了以下四种立体异构体：通式 I-1 化合物（*碳和**碳均为 S 构型）、通式 I-2 化合物（*碳为 S 构型，**碳为 R 构型）、通式 I-3 化合物（*碳为 R 构型，**碳为 S 构型）及通式 I-4 化合物（*碳和**碳均为 R 构型）。



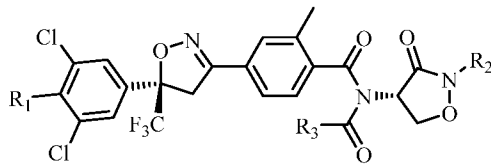
通式 I



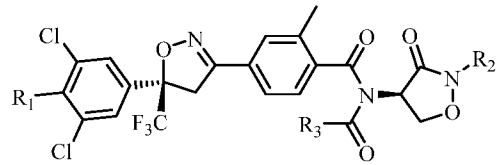
I-1



I-2



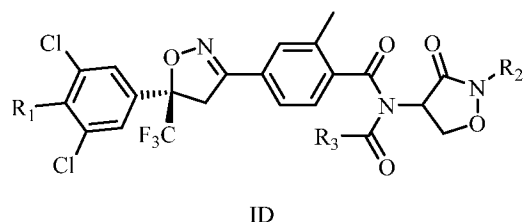
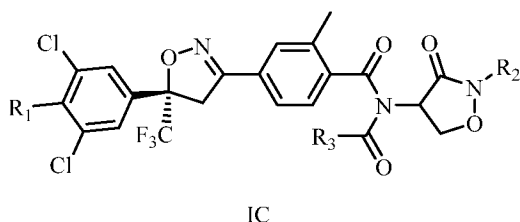
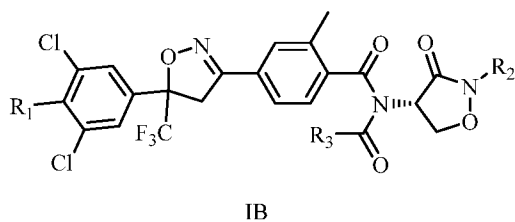
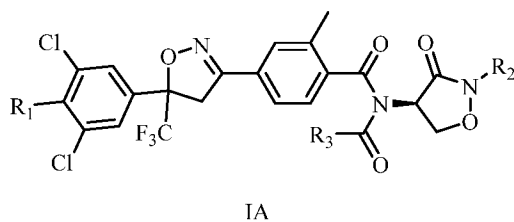
I-3



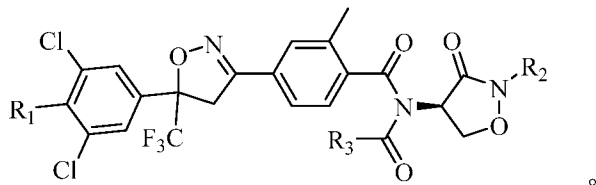
I-4

本发明还包括通式 I-1 化合物、通式 I-2 化合物、通式 I-3 化合物、通式 I-4 化合物中的任意一种，以及它们所有可能形式的混合物。

当通式 I-2 化合物和通式 I-4 化合物以大体上 1:1 的摩尔比例混合时,则可用通式 IA (*碳为外消旋体, **碳原子为 R 构型)表示;当通式 I-1 化合物和通式 I-3 化合物以大体上 1:1 的摩尔比例混合时,则可用通式 IB (*碳为外消旋体, **碳原子为 S 构型)表示;当通式 I-1 化合物和通式 I-2 化合物以大体上 1:1 的摩尔比例混合时,则可用通式 IC (*碳为 S 构型, **碳原子为外消旋体)表示;当通式 I-3 化合物和通式 I-4 化合物以大体上 1:1 的摩尔比例混合时,则可用通式 ID 表示 (*碳为 R 构型, **碳原子为外消旋体)。



另外,本发明通式 I 化合物的其中一种立体异构体能够与另一种立体异构体以任意摩尔比例混合,例如按摩尔比为 1:99 至 99:1 混合,又例如按摩尔比为 10:1 至 1:10 混合。在一种可能的实现方式中,通式 I 化合物的立体异构体为通式 IA 所示化合物:



通式 IA

在一种可能的实现方式中,通式 IA 所示化合物选自表 3 中的化合物,所述表 3 中的化合物具有如通式 IA 的结构且 R_1 、 R_2 和 R_3 如表 3 中所示:

表 3

化合物编号	R_1	R_2	R_3
109	H	乙基	甲基
110	H	乙基	乙基
111	H	乙基	异丙基
112	H	乙基	环丙基
113	H	乙基	CH_3OCH_2-
114	H	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
115	H	乙基	$\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2-$

116	H	乙基	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -
117	F	乙基	甲基
118	F	乙基	乙基
119	F	乙基	异丙基
120	F	乙基	环丙基
121	F	乙基	CH ₃ OCH ₂ -
122	F	乙基	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ -
123	F	乙基	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ -
124	F	乙基	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -

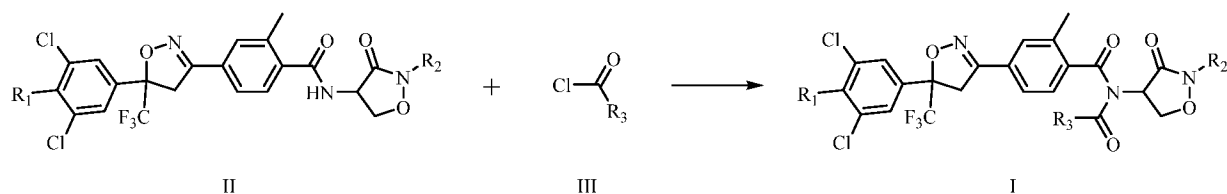
在一种可能的实现方式中，通式 IA 所示化合物选自表 4 中的化合物，所述表 4 中的化合物具有如通式 IA 的结构且 R₁、R₂ 和 R₃ 如表 4 中所示：

表 4

化合物编号	R ₁	R ₂	R ₃
109	H	乙基	甲基
110	H	乙基	乙基
111	H	乙基	异丙基
112	H	乙基	环丙基
113	H	乙基	CH ₃ OCH ₂ -
114	H	乙基	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ -
117	F	乙基	甲基
118	F	乙基	乙基
119	F	乙基	异丙基
120	F	乙基	环丙基
121	F	乙基	CH ₃ OCH ₂ -
122	F	乙基	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ -

本发明实施例还提供了上述异噁唑啉类化合物的制备方法，如下：

(1) 当异噁唑啉类化合物为通式 I 化合物时，其制备方法如下（式中各基团除另有说明外定义同前）：



通式 II 化合物与通式 III 化合物在溶剂中，在温度从-10°C 到溶剂沸点下反应 0.5~48 小时可制得通式 I 化合物；反应可在碱的存在下进行。

(2) 当异噁唑啉类化合物为通式 I 化合物的立体异构体时，可通过常规的方法得到，如：以具有旋光性的反应原料出发获得具有相应旋光性的反应产物，对外消旋或内消旋的反应产物进行手性拆分等。

(3) 当异噁唑啉类化合物为通式 I 化合物的盐或通式 I 化合物的立体异构体的盐时，其制备方法如下：通过常规方法以通式 I 化合物或通式 I 化合物的立体异构体为反应原料，与相应酸形成酸加成盐，例如，可以制成盐酸、氢溴酸、硫酸、磷酸、甲酸、乙酸、丙酸、丁酸、戊酸、三氟乙酸、草酸、丙二酸、甲磺酸、4-甲苯磺酸、苹果酸、富马酸、乳酸、马来酸、水杨酸、酒石酸或柠檬酸的盐。

在一种可能的实现方式中，溶剂包括：苯、甲苯、二甲苯等芳烃类，丙酮、甲乙酮、甲基异丁基酮等酮类，氯仿、二氯甲烷等卤代烃类，乙酸甲酯、乙酸乙酯等酯类，四氢呋喃、二噁烷、二乙醚、1, 2-二甲氧基乙烷等醚类，水、乙腈、N, N-二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮、二甲基亚砜等极性溶剂类中的一种或几种；碱包括：三乙胺、吡啶、DBU、4-二甲氨基吡啶等有机碱，氢化钠、氢化钾等碱金属氢化物，氢氧化钠、氢氧化钾等碱金属氢氧化物，氢氧化钙等碱土类金属氢氧化物，碳酸钠、碳酸钾等碱金属碳酸盐，碳酸氢钠等碱金属碳酸氢盐，甲醇钠、乙醇钾等金属醇盐中的一种或几种。

中间体通式 II 化合物或其立体异构体可以按公知方法制备，例如参照 WO20110672 72、WO2013050302、WO2014019950、WO2014029640、WO2014029709 或 WO2014029 639 等报道的方法制得。通式 III 化合物通常有市售，也可按常规方法自制。

本发明实施例还提供了上述异噁唑啉类化合物在制备杀虫剂和/或杀螨剂中的用途。

在一种可能的实现方式中，所述杀虫剂用于防治以下昆虫的一种或多种：

甲虫(鞘翅目昆虫(Coleopteran))，例如绿豆象(*Callosobruchus Chinensis*)、玉米象(*Sitophilus zeamais*)、赤拟谷盗(*Tribolium Castaneum*)、马铃薯瓢虫(*Epilachna vigintioctomaculata*)、细胸叩甲(*Agriotes ogurae fuscicollis*)、多色异丽金龟(*Anomala rufocuprea*)、马铃薯叶甲(*Leptinotarsa decemlineata*)、叶甲属(*Diabrotica spp.*)、松墨天牛(*Monochamus alternatus endai*)、稻根象(*Lissorhoptrus oryzophilus*)、褐粉蠹(*Lyctus bruneus*)；

鳞翅目(lepidopteran)害虫，例如，舞毒蛾(*Lymantria dispar*)、黄褐天幕毛虫(*Malacosoma neustria*)、菜粉蝶日本亚种(*Pieris rapae crucivora*)、斜纹夜蛾(*Spodoptera litura*)、甘蓝夜蛾(*Mamestra brassicae*)、二化螟(*Chilo suppressalis*)、欧洲玉米螟(*Ostrinia nubilalis*)、干果斑螟(*Cadra cautella*)、chyanokokakumonhamaki(*Adoxophyes honmai*)、苹果小卷蛾(*Cydia pomonella*)、黄地老虎(*Agrotis segetum*)、大蜡螟(*Galleria mellonella*)、菜蛾(*Plutella xylostella*)、烟芽夜蛾(*Heliothis virescens*)、桔潜蛾(*Phyllocnistis citrella*)；

半翅目(Hemipterous)害虫，例如，黑尾叶蝉(*Nephotettix cincticeps*)、褐飞虱(*Nilaparvata lugens*)、康氏粉蚧(*Pseudococcus comstocki*)、矢尖盾蚧(*Unaspis yanonensis*)、桃蚜(*Myzus*

persicas)、苹果蚜(*Aphis pomi*)、棉蚜(*Aphis gossypii*)、萝卜蚜(*Lipaphis erysimi*)、梨冠网蝽(*Stephanitis nashi*)、绿椿属(*Nezara spp.*)、温室粉虱(*Trialeurodes vaporariorum*)、*Pshylla spp.*;

缨翅目(*Thysanoptera*)害虫, 例如棕榈蓟马(*Thrips palmi*)、西方花蓟马(*Franklinella occidentalis*);

直翅目(*orthopteran*)害虫, 例如非洲蝼蛄(*Gryllotalpa Africana*)、非洲飞蝗(*Locusta migratoria*);

蜚蠊目(*blattarian*)害虫, 例如德国蠊(*Blattella germanica*)、美洲大蠊(*Periplaneta americana*)、黄胸散白蚁(*Reticulitermes speratus*)、家白蚁(*Coptotermes formosanus*);

双翅目(*Dipterous*)害虫, 例如家蝇(*Musca domestica*)、埃及伊蚊(*Aedes aegypti*)、灰地种蝇(*Delia platura*)、淡色库蚊(*Culex pipiens pallens*)、中华按蚊(*Anopheles sinensis*)、三带喙库蚊(*Culex tritaeniorhynchus*)、三叶草斑潜蝇(*Liriomyza trifolii*)等。

在一种可能的实现方式中, 所述杀螨剂用于防治以下螨中的一种或多种: 朱砂叶螨(*Tetranychus cinnabarinus*)、棉叶螨(*Tetranychus urticae*)、桔全爪螨(*Panonychus citri*)、桔刺皮瘿螨(*Aculops pelekassi*)、跗线螨属(*Tarsonemus spp.*)等。

在一种可能的实现方式中, 所述杀虫剂和/或杀螨剂用于防治粘虫、小菜蛾、二化螟、朱砂叶螨中的一种或几种。

本发明实施例还提供了一种杀虫剂制剂或杀螨剂制剂, 该杀虫剂制剂或杀螨剂制剂中含有上述异噁唑啉类化合物作为活性组分, 还含有一种或多种辅料。

在一种可能的实现方式中, 杀虫剂制剂或杀螨剂制剂选自以下剂型: 溶液剂、乳剂、可湿性粉剂、颗粒状可湿性粉剂、悬浮剂、粉剂(*powder*)、泡沫剂、膏剂、片剂、颗粒剂、气雾剂、经活性化合物浸渍的天然试剂、经活性化合物浸渍的合成试剂、微胶囊剂、种子包衣剂、装备有燃烧装置的制剂(所述燃烧装置可为烟筒和雾筒、罐和盘管等)以及ULV(冷雾剂、热雾剂)等。这些虫剂制剂或杀螨剂制剂或动物寄生虫防治剂可用已知的方法制备, 例如可通过将活性组分与填充剂(如: 液体稀释剂或载体、液化气稀释剂或载体、固体稀释剂或载体)混合, 以及可选地与表面活性剂(即乳化剂和/或分散剂和/或发泡剂)等混合而制备。

在一种可能的实现方式中, 所述辅料包括以下的一种或多种: 填充剂(如: 液体稀释剂或载体、液化气稀释剂或载体、固体稀释剂或载体)、表面活性剂(如: 乳化剂和/或分散剂和/或发泡剂)、粘合剂、着色剂;

液体稀释剂或载体可包括, 例如, 芳香烃(二甲苯、甲苯、烷基萘等)、氯代芳烃或氯代脂族烃(例如氯苯、氯乙烯、二氯甲烷等)、脂族烃(例如环己烷或石蜡(例如矿物油馏分))、醇(例如丁醇、乙二醇, 及其醚或酯等)、酮(例如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮、环己酮等)、强极性溶剂(例如二甲基甲酰胺、二甲亚砷)、水等。当使用水作为填充剂时, 例如, 可使用有机溶剂作为助溶剂;

液化气稀释剂或载体可包括在大气压力和温度下以气体形式存在的那些，例如，丙烷、氮气、二氧化碳，以及气溶胶喷射剂例如卤代烃；

固体稀释剂可包括粉碎的天然矿物(例如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、绿坡缕石、蒙脱石或硅藻土等)以及粉碎的合成矿物(例如细分散的硅酸、氧化铝和硅酸盐等)等；

乳化剂和/或发泡剂可包括非离子及阴离子乳化剂[例如，聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪酸醇醚(如烷基芳基聚乙二醇醚)、烷基磺酸盐、烷基硫酸盐和芳基磺酸盐]以及白蛋白水解产物等；

分散剂可包括木质素亚硫酸盐废液和甲基纤维素；

粘合剂可包括羧甲基纤维素、天然或合成的聚合物(例如阿拉伯树胶、聚乙烯醇和聚乙酸乙烯酯等)。

着色剂可包括无机颜料(例如氧化铁、氧化钛和普鲁士蓝等)、有机染料例如茜素染料、偶氮染料或金属酞菁染料；及微量元素，例如铁盐、锰盐、硼盐、铜盐、钴盐、钼盐或锌盐。

此外，本发明的异噁唑啉类化合物可作为与一种增效剂的混合物存在，增效剂自身不必具有活性。更确切地，它是增强活性化合物活性的化合物。

在一种可能的实现方式中，杀虫剂制剂或杀螨剂制剂中含有的上述异噁唑啉类化合物的量为 0.1 至 99 重量%，可选地为 0.5 至 90 重量%。

本发明实施例还提供了一种杀虫剂组合物或杀螨剂组合物，其包括上述异噁唑啉类化合物和其他活性化合物(例如杀虫剂、毒饵剂、消毒剂、杀螨剂、杀线虫剂、杀真菌剂、生长调节剂、除草剂等)的混合物。该混合物可以以原料药的形式提供，也可以以市售有用制剂的形式或者由其制剂制得的使用形式提供。

本发明实施例还提供了一种控制农业或林业害虫和/或害螨的方法，其包括以下步骤：将有效剂量的材料施用于需要控制的害虫害螨或其生长介质上，所述材料选自下组中的一种或多种：上述异噁唑啉类化合物、上述杀虫剂制剂或杀螨剂制剂、上述杀虫剂组合物或杀螨剂组合物。

本发明实施例还提供了上述异噁唑啉类化合物在制备动物寄生虫防治剂中的用途。在兽医领域内，即，兽医科学中，本发明异噁唑啉类化合物可以有效地用于对抗多种有害的动物类寄生虫，特别是体内寄生虫和体外寄生虫。

在一种可能的实现方式中，动物寄生虫包括以下的一种或多种：

虱目(Anoplurida)，例如血虱属(*Haematopinus* spp.)、毛虱属(*Linognathus* spp.)、虱属(*Pediculus* spp.)、Phtirus spp 和管虱属(*Solenopotes* spp.)；特别地，代表性实例有，棘颚虱(*Linognathus setosus*)、牛管虱(*Solenopotes capillatus*)；

食毛目(Mallopha、牛颚虱(*Linognathus vituli*)、绵羊颚虱(*Linognathus ovillus*)、*Linognathus oviformis*、足颚虱(*Linognathus pedalis*)、山羊颚虱(*Linognathus stenopsis*)、驴血虱(*Haematopinus asini macrocephalus*)、牛血虱(*Haematopinus eurysternus*)、猪血虱

(*Haematopinus suis*)、头虱(*Pediculus humanus capitis*)、体虱(*Pediculus humanus corporis*)、葡萄根瘤蚜(*Phylloxera vastatrix*)、阴虱(*Phthirus pubis*)和钝角亚目(*Amblycerina*)和细角亚目(*Ischnocera*)，例如，毛羽虱属(*Trimenopon* spp.)、禽虱属(*Menopon* spp.)、巨羽虱属(*Trinoton* spp.)、牛羽虱属(*Bovicola* spp.)、*Werneckiella* spp.、*Lepikentron* spp.、畜虱属(*Damalina* spp.)、嚼虱属(*Trichodectes* spp.)和猫羽虱属(*Felicola* spp.)；特别地，代表性实例有，牛毛虱(*Bovicola bovis*)、羊毛虱(*Bovicola ovis*)、安哥拉山羊羽虱(*Bovicola limbata*)、牛畜虱(*Damalina bovis*)、犬毛虱(*Trichodectes canis*)、猫羽虱(*Felicola subrostratus*)、山羊毛虱(*Bovicola caprae*)、*Lepikentron ovis*、咬虱(*Werneckiella equi*)；

双翅目(*Diptera*)及其长角亚目(*Nematocera*)和短角亚目(*Brachycera*)，例如，伊蚊属(*Aedes* spp.)、按蚊属(*Anopheles* spp.)、库蚊属(*Culex* spp.)、蚋属(*Simulium* spp.)、真蚋属(*Eusimulium* spp.)、白蛉属(*Phlebotomus* spp.)、罗蛉属(*Lutzomyia* spp.)、库蠅属(*Culicoides* spp.)、斑虻属(*Chrysops* spp.)、短蚋属(*Odagmia* spp.)、维蚋属(*Wilhelmia* spp.)、瘤虻属(*Hybomitra* spp.)、黄虻属(*Atylotus* spp.)、虻属(*Tabanus* spp.)、麻虻属(*Haematopota* spp.)、*Philipomyia* spp.、蜂虻属(*Braula* spp.)、家蝇属(*Musca* spp.)、齿股蝇属(*Hydrotaea* spp.)、螫蝇属(*Stomoxys* spp.)、黑角蝇属(*Haematobia* spp.)、莫蝇属(*Morellia* spp.)、厕蝇属(*Fannia* spp.)、舌蝇属(*Glossina* spp.)、丽蝇属(*Calliphora* spp.)、绿蝇属(*Lucilia* spp.)、金蝇属(*Chrysomya* spp.)、污蝇属(*Wohlfahrtia* spp.)、麻蝇属(*Sarcophaga* spp.)、狂蝇属(*Oestrus* spp.)、皮蝇属(*Hypoderma* spp.)、胃蝇属(*Gasterophilus* spp.)、虱蝇属(*Hippobosca* spp.)、羊虱蝇属(*Lipoptena* spp.)、蜚蝇属(*Melophagus* spp.)、鼻狂蝇属(*Rhinoestrus* spp.)、大蚊属(*Tipula* spp.)；特别地，代表性实例有，埃及伊蚊(*Aedes aegypti*)、白纹伊蚊(*Aedes albopictus*)、带喙伊蚊(*Aedes taeniorhynchus*)、冈比亚按蚊(*Anopheles gambiae*)、五斑按蚊(*Anopheles maculipennis*)、红头丽蝇(*Calliphora erythrocephala*)、高额麻虻(*Chrysosona pluvialis*)、五带淡色库蚊(*Culex quinquefasciatus*)、尖音库蚊(*Culex pipiens*)、环喙库蚊(*Culex tarsalis*)、夏厕蝇(*Fannia canicularis*)、肉蝇(*Sarcophaga carnaria*)、厩螫蝇(*Stomoxys calcitrans*)、欧洲大蚊(*Tipula paludosa*)、铜绿蝇(*Lucilia cuprina*)、丝光绿蝇(*Lucilia sericata*)、爬蚋(*Simulium reptans*)、静食白蛉(*Phlebotomus papatasi*)、长须白蛉(*Phlebotomus longipalpis*)、华丽短蚋(*Odagmia ornata*)、马维蚋(*Wilhelmia equina*)、红头灰蚋(*Boophthora erythrocephala*)、多声虻(*Tabanus bromius*)、夜蛾虻(*Tabanus spodopterus*)、北美黑虻(*Tabanus atratus*)、猪虻(*Tabanus sudeticus*)、古氏瘤虻(*Hybomitra ciurea*)、盲斑虻(*Chrysops caecutiens*)、黄缘斑虻(*Chrysops relictus*)、高额麻虻(*Haematopota pluvialis*)、*Haematopota italica*、秋家蝇(*Musca autumnalis*)、家蝇(*Musca domestica*)、西方角蝇(*Haematobia irritans irritans*)、西方角蝇(*Haematobia irritans exigua*)、刺扰血蝇(*Haematobia stimulans*)、*Hydrotaea irritans*、白斑齿股蝇(*Hydrotaea albipuncta*)、*Chrysomya chloropyga*、蛆症金蝇(*Chrysomya bezziana*)、羊狂蝇(*Oestrus ovis*)、牛皮蝇(*Hypoderma bovis*)、纹皮蝇(*Hypoderma lineatum*)、*Przhevalskiana silenus*、人肤蝇(*Dermatobia hominis*)、羊蜚蝇(*Melophagus ovinus*)、*Lipoptena*

capreoli、鹿羊虱蝇(*Lipoptena cervi*)、*Hippobosca variegata*、马虱蝇(*Hippobosca equina*)、肠胃蝇(*Gasterophilus intestinalis*)、赤尾胃蝇(*Gasterophilus haemorroidalis*)、裸节胃蝇(*Gasterophilus internis*)、鼻胃蝇(*Gasterophilus nasalis*)、黑角胃蝇(*Gasterophilus nigricornis*)、黑腹胃蝇(*Gasterophilus pecorum*)、蜂虱蝇(*Braula coeca*);

蚤目(*Siphonapterida*), 例如, 蚤属(*Pulex spp.*)、栉首蚤属(*Ctenocephalides spp.*)、潜蚤属(*Tunga spp.*)、客蚤属(*Xenopsylla spp.*)、角叶蚤属(*Ceratophyllus spp.*); 特别地, 代表性实例有, 犬栉首蚤(*Ctenocephalides canis*)、猫栉首蚤(*Ctenocephalides felis*)、人蚤(*Pulex irritans*)、穿皮潜蚤(*Tunga penetrans*)、印鼠客蚤(*Xenopsylla cheopis*);

异翅目(*Heteropterida*), 例如, 臭虫属(*Cimex spp.*)、锥猎椿属(*Triatoma spp.*)、红猎椿属(*Rhodnius spp.*)、锥蝱属(*Panstrongylus spp.*);

蜚蠊目(*Blattarida*), 例如, 东方蜚蠊(*Blatta orientalis*)、美洲大蠊、德国蠊、夏柏拉蟑螂属(*Supella spp.*)(例如, *Supella longipalpa*);

蜱螨目(*Acari*)(或 *Acarina*), 后气门目(*Metastigmata*)和中气门目(*Mesostigmata*), 例如, 锐缘蜱属(*Argas spp.*)、钝缘蜱属(*Ornithodoros spp.*)、残喙蜱属(*Otobius spp.*)、硬蜱属(*Ixodes spp.*)、花蜱属(*Amblyomma spp.*)、牛蜱属(*Rhipicephalus(Boophilus)spp.*)、革蜱属(*Dermacentor spp.*)、*Haemophysalis spp.*、璃眼蜱属(*Hyalomma spp.*)、皮刺螨属(*Dermanyssus spp.*)、扇头蜱属(*Rhipicephalus spp.*)(异主寄生型螨的原属)、禽刺螨属(*Ornithonyssus spp.*)、肺刺螨属(*Pneumonyssus spp.*)、*Pneumonyssus spp.*、刺利螨属(*Raillietia spp.*)、肺刺螨属(*Pneumonyssus spp.*)、胸刺螨属(*Sternostoma spp.*)、蜂螨属(*Varroa spp.*)、蜂盾螨属(*Acarapis spp.*); 特别地, 代表性实例有, 波斯锐缘蜱(*Argas persicus*)、鸽锐缘蜱(*Argas reflexus*)、非洲钝缘蜱(*Ornithodoros moubata*)、耳残喙蜱(*Otobius megnini*)、微小扇头蜱(微小牛蜱)(*Rhipicephalus(Boophilus)microplus*)、消色扇头蜱(消色牛蜱)(*Rhipicephalus(Boophilus)decoloratus*)、具环扇头蜱(具环牛蜱)(*Rhipicephalus(Boophilus)annulatus*)、有矩扇头蜱(有矩牛蜱)(*Rhipicephalus(Boophilus)calceratus*)、*Hyalomma anatolicum*、埃及璃眼蜱(*Hyalomma aegypticum*)、*Hyalomma marginatum*、*Hyalomma transiens*、外翻扇头蜱(*Rhipicephalus evertsi*)、蓖子硬蜱(*Ixodes ricinus*)、六角硬蜱(*Ixodes hexagonus*)、原野硬蜱(*Ixodes canisuga*)、多毛硬蜱(*Ixodes pilosus*)、浅红硬蜱(*Ixodes rubicundus*)、肩突硬蜱(*Ixodes scapularis*)、全环硬蜱(*Ixodes holocyclus*)、嗜群血蜱(*Haemaphysalis concinna*)、刻点血蜱(*Haemaphysalis punctata*)、*Haemaphysalis cinnabarina*、*Haemaphysalis otophila*、犬血蜱(*Haemaphysalis leachi*)、长角血蜱(*Haemaphysalis longicorni*)、边缘革蜱(*Dermacentor marginatus*)、网纹革蜱(*Dermacentor reticulatus*)、*Dermacentor pictus*、白纹革蜱(*Dermacentor albipictus*)、安氏革蜱(*Dermacentor andersoni*)、变异革蜱(*Dermacentor variabilis*)、毛里求斯璃眼蜱(*Hyalomma mauritanicum*)、血红扇头蜱(*Rhipicephalus sanguineus*)、囊形扇头蜱(*Rhipicephalus bursa*)、非洲扇头蜱(*Rhipicephalus appendiculatus*)、好望角扇头蜱

(*Rhipicephalus capensis*)、图兰扇头蜱(*Rhipicephalus turanicus*)、*Rhipicephalus zambeziensis*、美洲花蜱(*Amblyomma americanum*)、彩饰花蜱(*Amblyomma variegatum*)、有斑花蜱(*Amblyomma maculatum*)、希伯来花蜱(*Amblyomma hebraeum*)、卡延花蜱(*Amblyomma cajennense*)、鸡皮刺螨(*Dermanyssus gallinae*)、囊禽刺螨(*Ornithonyssus bursa*)、林禽刺螨(*Ornithonyssus sylviarum*)、大蜂螨(*Varroa jacobsoni*)；

轴螨目(*Actiniedida*)(前气门亚目(*Prostigmata*))和粉螨目(*Acaridida*)(无气门亚目(*Astigmata*))，例如，蜂盾螨属(*Acarapis* spp.)、姬螯螨属(*Cheyletiella* spp.)、禽螯螨属(*Ornithocheyletiella* spp.)、肉螨属(*Myobia* spp.)、疮螨属(*Psorergates* spp.)、蠕形螨属(*Demodex* spp.)、恙螨属(*Trombicula* spp.)、*Listrophorus* spp.、粉螨属(*Acarus* spp.)、食酪螨属(*Tyrophagus* spp.)、嗜木螨属(*Caloglyphus* spp.)、颈下螨属(*Hypodectes* spp.)、翅螨属(*Pterolichus* spp.)、痒螨属(*Psoroptes* spp.)、皮螨属(*Chorioptes* spp.)、耳疥螨属(*Otodectes* spp.)、疥螨属(*Sarcoptes* spp.)、耳螨属(*Notoedres* spp.)、疥螨属(*Knemidocoptes* spp.)、气囊螨属(*Cytodites* spp.)和鸡雏螨属(*Laminosioptes* spp.)；特别是，雅氏姬螯螨(*Cheyletiella yasguri*)、布氏姬螯螨(*Cheyletiella blakei*)、犬蠕形螨(*Demodex canis*)、牛蠕形螨(*Demodex bovis*)、绵羊蠕形螨(*Demodex ovis*)、山羊蠕形螨(*Demodex caprae*)、马蠕形螨(*Demodex equi*)、*Demodex caballi*、猪蠕形螨(*Demodex suis*)、*Neotrombicula autumnalis*、*Neotrombicula desaleli*、*Neoschonegastia xerothermobia*、秋收恙螨(*Trombicula akamushi*)、狗耳螨(*Otodectes cynotis*)、猫疥螨(*Notoedres cati*)、狗疥螨(*Sarcoptes canis*)、牛疥螨(*Sarcoptes bovis*)、绵羊疥螨(*Sarcoptes ovis*)、山羊疥螨(*Sarcoptes rupicaprae*(=*S. caprae*))、马疥螨(*Sarcoptes equi*)、猪疥螨(*Sarcoptes suis*)、绵羊瘙螨(*Psoroptes ovis*)、兔瘙螨(*Psoroptes cuniculi*)、马瘙螨(*Psoroptes equi*)、牛痒螨(*Chorioptes bovis*)、*Psoergates ovis*、*Pneumonyssoides mange*、犬鼻疥虫(*Pneumonyssoides caninum*)、伍氏蜂跗线螨(*Acarapis woodi*)；

线虫，例如南方根结线虫(*Meloidogyne incognita*)、松材线虫(*Bursaphelenchus xylophilus*)、水稻干尖线虫(*Aphelenchoides besseyi*)、大豆异皮线虫(*Heterodera glycines*)、短体线虫属(*Pratylenchus* spp.)等；

侵袭动物的节肢动物、蠕虫和疟原虫。防治节肢动物、蠕虫和/或疟原虫，可减少家养动物的死亡率，并且可改善动物的生产率(肉、奶、毛、皮、蛋和蜜)和健康。

在一种可能的实现方式中，所述动物寄生虫防治剂用于防治猫蚤、美洲犬蜱中的一种或几种。

在一种可能的实现方式中，动物包括以下的一种或多种：农业动物，例如牛、绵羊、山羊、马、猪、驴、骆驼、水牛、兔、家鸡、火鸡、鸭、鹅、养殖鱼、蜜蜂等；也包括被称为伴侣动物的宠物，例如，狗、猫、笼鸟、观赏鱼；还包括用于实验的动物，例如仓鼠、豚鼠、大鼠和小鼠等。

本发明实施例还提供了一种动物寄生虫防治剂，该动物寄生虫防治剂中含有上述异噁唑啉类化合物作为活性组分，还含有一种或多种辅料。

在一种可能的实现方式中，动物寄生虫防治剂选自以下剂型：片剂、胶囊剂、饮剂、可饮用药、颗粒剂、膏剂和丸剂、栓剂、注射剂(肌肉、皮下、静脉内、腹膜内等)、涂抹剂、气雾剂、无压喷雾剂(例如泵喷雾剂和雾化喷雾剂)。

在一种可能的实现方式中，动物寄生虫防治剂中含有的上述活性组分的量为 1 至 80 重量%的量。

本发明实施例还提供了一种动物寄生虫防治组合物，其包括上述异噁唑啉类化合物和其他动物寄生虫防治活性化合物(例如杀螨剂、杀昆虫剂、杀寄生虫剂、抗疟原虫剂等)的混合物。该混合物可以以原料药的形式提供，也可以以市售有用制剂的形式或者由其制剂制得的使用形式提供。

本发明实施例还提供了一种控制动物寄生虫的方法，其包括以下步骤：将有效剂量的材料施于需要控制的动物寄生虫或其生长介质上，所述材料选自下组中的一种或多种：上述异噁唑啉类化合物；上述动物寄生虫防治剂；上述动物寄生虫防治组合物。例如：采用片剂、胶囊剂、饮剂、可饮用药、颗粒剂、膏剂、丸剂、栓剂进行肠内给药；基于皮肤施用的非肠内给药，例如注射(肌肉、皮下、静脉内、腹膜内等)、植入、鼻部给药，包括洗浴或浸泡、喷雾、泼浇、点滴、清洗和撒粉，和通过使用含有活性化合物的模型制品，例如项圈、耳标、标签、腿部缚带(leg brace)、网、标识器等施用。本发明的活性化合物具有低毒性，可以安全地用于温血动物。

有益效果

本发明的异噁唑啉类化合物具有意想不到的优异的杀虫杀螨效果，其也对有毒的害虫展现出合适的防治效果，且对栽培的作物植物没有植物毒性。此外，本发明的化合物可用于防治多种害虫，例如有害的刺吸式昆虫、咀嚼式昆虫以及其他植物寄生害虫、储存谷物害虫、卫生害虫等，并且可用于消毒和杀灭它们。

具体实施方式

为使本发明实施例的目的、技术方案和优点更加清楚，下面将对本发明实施例中的技术方案进行清楚、完整地描述，显然，所描述的实施例是本发明一部分实施例，而不是全部的实施例。基于本发明中的实施例，本领域普通技术人员在没有作出创造性劳动前提下所获得的所有其他实施例，都属于本发明保护的范围。。

另外，为了更好的说明本发明，在下文的具体实施方式中给出了众多的具体细节。本领域技术人员应当理解，没有某些具体细节，本发明同样可以实施。在一些实施例中，对于本领域技术人员熟知的原料、元件、方法、手段等未作详细描述，以便于凸显本发明的主旨。

除非另有其它明确表示，否则在整个说明书和权利要求书中，术语“包括”或其变换如“包含”或“包括有”等等将被理解为包括所陈述的元件或组成部分，而并未排除其它元件或其它组成部分

除另有注明外，所用原料均有市售。

本发明中，所用术语具有如下含义：

上面给出的通式化合物的定义中，汇集所用术语一般代表如下取代基：

烷基：直链或支链烷基，例如甲基、乙基、正丙基、异丙基或不同的丁基、戊基或己基异构体。

卤代烷基：直链或支链烷基，在这些烷基上的氢原子可部分或全部被卤素所取代，例如氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、2, 2, 2-三氟乙基、七氟异丙基、1, 1, 2, 2, 2-五氟乙基等。

环烷基：取代或未取代的环状烷基，例如环丙基、环戊基或环己基；取代基如甲基、卤素、氰基等。

烷氧基烷基：烷基-O-烷基-，例如 CH_3OCH_2- 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHOCH}_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $(\text{CH}_3)_3\text{COCH}_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ 或 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ 等。

动物寄生虫防治剂：是指能有效地将被寄生虫感染的动物中的各种寄生虫的发病率减少的活性化合物。防治意味着活性化合物能有效地杀灭寄生虫、抑制其生长或繁殖。

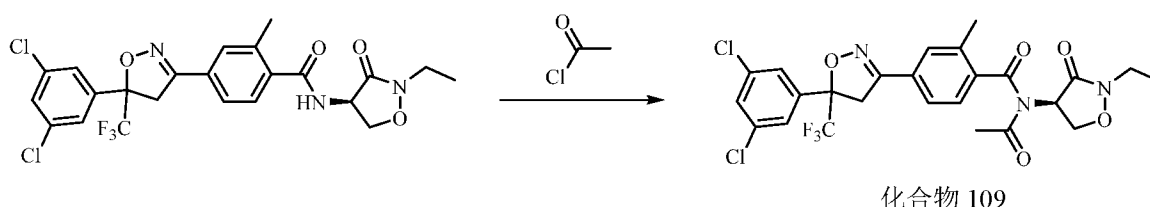
杀虫剂：对害虫具有杀虫效果的物质。

杀螨剂：用于防治植食性害螨的药剂。

合成实施例

按照上述记载的合成路线，采用不同的原料化合物，即可分别制备获得本发明通式 I 所示化合物，进一步具体描述如下：

实施例 1：化合物 109 的制备

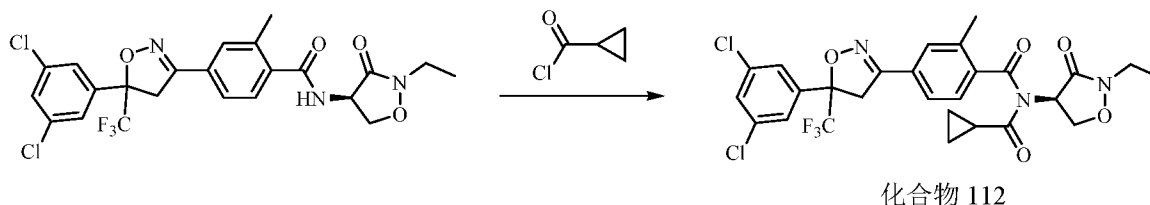


向反应瓶中加入 0.30 g (0.57 mmol) 4-(5-(3, 5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4, 5-二氢异噁唑-3-基)-N-((R)-2-乙基-3-氧代恶唑烷-4-基)-2-甲基苯甲酰胺、20 ml 甲苯及 0.11 g (1.09 mmol) 三乙胺，再加入 66.35 mg (0.85 mmol) 乙酰氯，升温至回流反应。TLC 监测反应结束后，向反应液中加入水，并用乙酸乙酯萃取，有机相用无水硫酸镁干燥，过滤、浓缩，柱层析纯化得 0.13 g 油状物。

化合物 109 的核磁及质谱数据如下：

^1H NMR (600 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 7.83 (t, 1H), 7.71 (s, 1H), 7.67 (dt, 1H), 7.64 (d, 2H), 7.55 (d, 1H), 5.21 (t, 1H), 4.52 – 4.29 (m, 4H), 3.56 – 3.40 (m, 2H), 2.40 (s, 3H), 2.15 (s, 3H), 1.13 (t, 3H). ESI-MS, m/z : 594.23 $[\text{M}+\text{H}+\text{Na}]^+$.

实施例 2：化合物 112 的制备

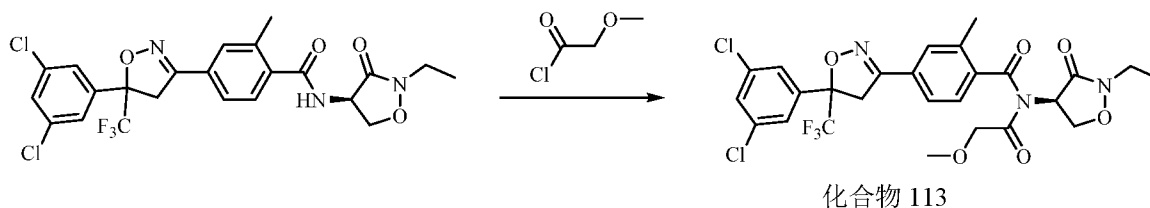


向反应瓶中加入 0.50 g (0.95 mmol) 4-(5-(3, 5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4, 5-二氢异噁唑-3-基)-N-((R)-2-乙基-3-氧代恶唑烷-4-基)-2-甲基苯甲酰胺、25 ml 甲苯及 0.19 g (1.88 mmol) 三乙胺，再加入 0.15 g (1.44 mmol) 环丙基甲酰氯，升温至回流反应。TLC 监测反应结束后，向反应液中加入水，并用乙酸乙酯萃取，有机相用无水硫酸镁干燥，过滤、浓缩，柱层析纯化得 0.29 g 黄色固体。

化合物 112 的核磁及质谱数据如下：

^1H NMR (600 MHz, Chloroform-*d*) δ 7.63 (d, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.56 – 7.49 (m, 3H), 7.44 (t, 1H), 5.56 (t, 1H), 4.56 – 4.42 (m, 2H), 4.08 (d, 1H), 3.75 – 3.56 (m, 3H), 2.52 (s, 3H), 1.40 – 1.15 (m, 4H), 1.11 – 0.94 (m, 2H), 0.60 (br s, 2H). ESI-MS, m/z : 530.2 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

实施例 3：化合物 113 的制备

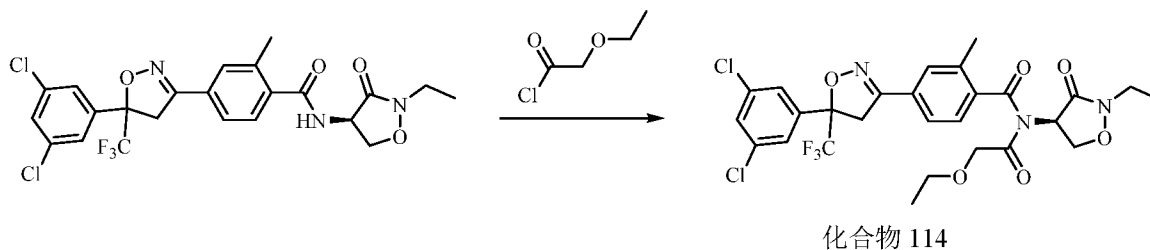


向反应瓶中加入 1.00 g (1.89 mmol) 4-(5-(3, 5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4, 5-二氢异噁唑-3-基)-N-((R)-2-乙基-3-氧代恶唑烷-4-基)-2-甲基苯甲酰胺、30 ml 甲苯及 0.38 g (3.76 mmol) 三乙胺，再加入 0.31 g (2.87 mmol) 甲氧基乙酰氯，升温至回流反应。TLC 监测反应结束后，向反应液中加入水，并用乙酸乙酯萃取，有机相用无水硫酸镁干燥，过滤、浓缩，柱层析纯化得 0.53 g 油状物。

化合物 113 的核磁及质谱数据如下：

^1H NMR (600 MHz, DMSO-*d*₆) δ 7.82 (t, 1H), 7.72 (t, 1H), 7.68 – 7.65 (m, 1H), 7.63 (d, 2H), 7.57 (dd, 1H), 5.08 (t, 1H), 4.49 – 4.28 (m, 4H), 4.15 (s, 2H), 3.57 – 3.36 (m, 2H), 3.22 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 1.12 (t, 3H). ESI-MS, m/z : 624.25 $[\text{M}+\text{H}+\text{Na}]^+$.

实施例 4：化合物 114 的制备

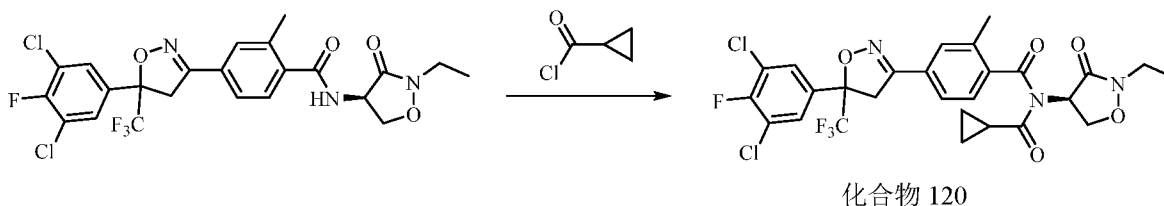


参照实施例 3 的合成方法制得化合物 114（油状物）。

化合物 114 的核磁及质谱数据如下：

^1H NMR (600 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 7.83 (t, 1H), 7.72 (t, 1H), 7.69 – 7.66 (m, 1H), 7.64 (d, 2H), 7.57 (dd, 1H), 5.08 (t, 1H), 4.48 – 4.30 (m, 4H), 4.20 (s, 2H), 3.54 – 3.39 (m, 4H), 2.40 (s, 3H), 1.13 (t, 3H), 1.09 (t, 3H). ESI-MS, m/z : 638.37 $[\text{M}+\text{H}+\text{Na}]^+$.

实施例 5: 化合物 120 的制备

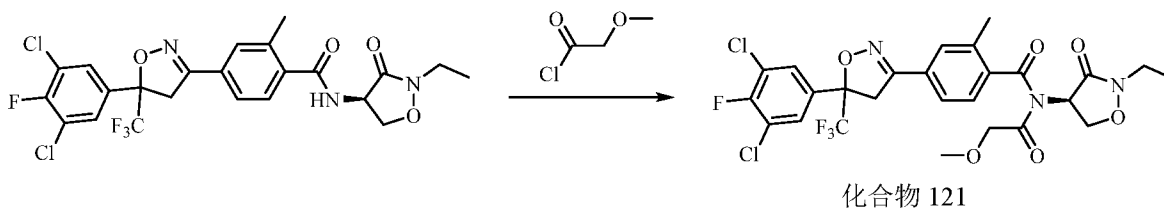


参照实施例 2 的合成方法制得化合物 120 (黄色固体)。

化合物 120 的核磁及质谱数据如下:

^1H NMR (600 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 7.82 (d, 2H), 7.69 (s, 1H), 7.66 (d, 1H), 7.56 (d, 1H), 5.54 (td, 1H), 4.58 (t, 1H), 4.46 – 4.30 (m, 3H), 3.57 – 3.44 (m, 2H), 2.43 (s, 3H), 1.42 – 1.35 (m, 1H), 1.15 (t, 3H), 0.87 – 0.78 (m, 2H), 0.77 – 0.58 (m, 2H). ESI-MS, m/z : 616.30 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

实施例 6: 化合物 121 的制备

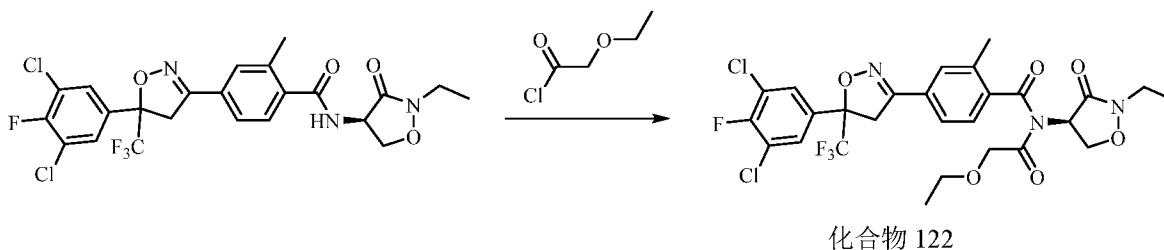


参照实施例 3 的合成方法制得化合物 121 (油状物)。

化合物 121 的核磁及质谱数据如下:

^1H NMR (600 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 7.81 (d, 2H), 7.71 (t, 1H), 7.68 – 7.64 (m, 1H), 7.57 (dd, 1H), 5.08 (t, 1H), 4.48 – 4.29 (m, 4H), 4.15 (s, 2H), 3.53 – 3.40 (m, 2H), 3.22 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 1.13 (t, 3H). ESI-MS, m/z : 642.13 $[\text{M}+\text{H}+\text{Na}]^+$.

实施例 7: 化合物 122 的制备



参照实施例 3 的合成方法制得化合物 122 (油状物)。

化合物 122 的核磁及质谱数据如下:

^1H NMR (600 MHz, DMSO- d_6) δ 7.82 (d, 2H), 7.73 – 7.64 (m, 2H), 7.58 (dd, 1H), 5.08 (t, 1H), 4.49 – 4.31 (m, 4H), 4.20 (s, 2H), 3.55 – 3.40 (m, 4H), 2.40 (s, 3H), 1.13 (t, 3H), 1.09 (t, 3H). ESI-MS, m/z : 656.34 $[\text{M}+\text{H}+\text{Na}]^+$.

参照以上实施例可以制备本发明通式 I 中其它化合物。

生物活性测定

实施例 8：粘虫、小菜蛾、二化螟的生物活性测定

用本发明化合物对几种昆虫进行了杀虫活性测定实验。测定方法如下：

待测化合物用丙酮/甲醇（1:1）的混合溶剂溶解后，用含有 0.1%（wt）吐温 80 的水稀释至所需的浓度。

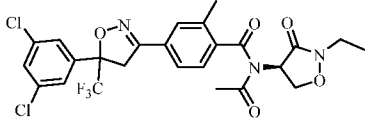
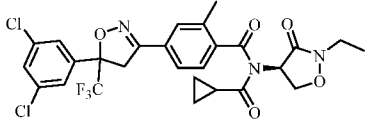
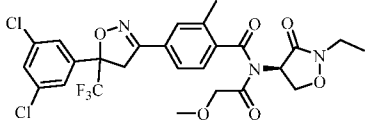
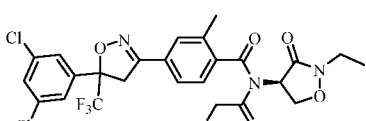
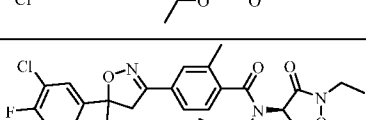
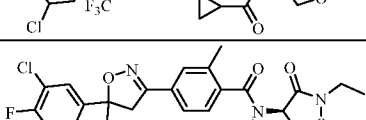
以粘虫、小菜蛾、二化螟为靶标，采用 Airbrush 喷雾法进行活性测定。

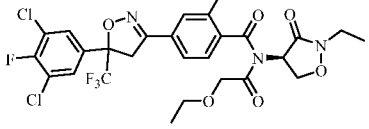
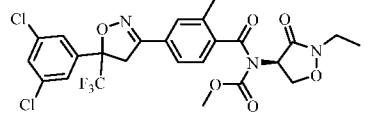
（1）杀粘虫的活性测定

测定方法：将玉米叶片剪成长 2cm 的叶段，Airbrush 喷雾处理的压力为 10psi（约合 $0.7\text{kg}/\text{cm}^2$ ），每叶段正反面喷雾，待测化合物的喷液量为 0.5ml。阴干后每处理接入 10 头 3 龄幼虫，每处理 3 次重复。处理后放入 25°C 、相对湿度 60~70% 观察室内培养，药后 3 天调查存活虫数，计算死亡率。

对粘虫的部分测试结果如表 5 所示：

表 5 本发明化合物对粘虫的杀虫测试结果

编号	结构式	死亡率（%，药后 3 天）			
		10 mg/L	5 mg/L	2.5 mg/L	1.25mg/L
109		100	83.33	63.33	26.67
112		100	100	96.67	80
113		100	100	100	100
114		100	100	100	100
120		100	100	100	100
121		100	100	100	100

122		100	100	100	100
对比化合物		73.33	13.33	0	0

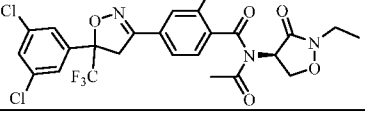
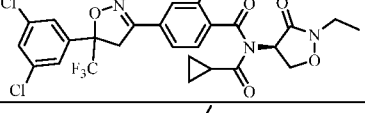
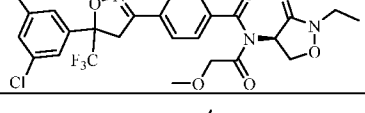
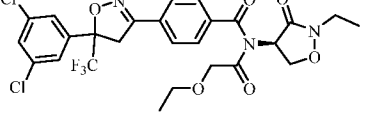
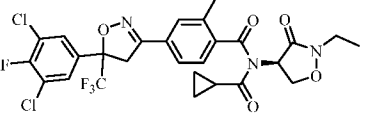
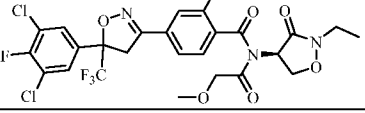
本发明实施例中通过对式 I 化合物中的 R_1 、 R_2 、 R_3 基团进行选择, 获得了杀虫杀螨杀寄生虫效果更好的化合物, 从上表中可以看出, 当 R_3 选择甲氧基 (即上表中按照本发明制备方法制备得到的对比化合物) 时, 其对粘虫的活性要远小于本发明实施例中的化合物。

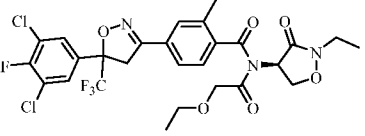
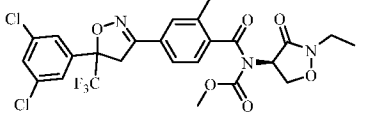
(2) 杀小菜蛾的活性测定

测定方法: 将甘蓝叶片用打孔器打成直径 2cm 的叶碟, Airbrush 喷雾处理的压力为 10psi (约合 $0.7\text{kg}/\text{cm}^2$), 每叶碟正反面喷雾, 待测化合物的喷液量为 0.5ml。阴干后每处理接入 10 头 3 龄幼虫, 每处理 3 次重复。处理后放入 25°C 、相对湿度 60~70% 观察室内培养, 药后 3 天调查存活虫数, 计算死亡率。

对小菜蛾的部分测试结果如表 6 所示:

表 6 本发明化合物对小菜蛾的杀虫测试结果

编号	结构式	死亡率 (% , 药后 3 天)		
		10 mg/L	5 mg/L	2.5 mg/L
109		100	70	-
112		100	70	-
113		100	90	66.67
114		100	86.67	60
120		100	100	83.33
121		100	100	86.67

122		100	100	70
对比化合物		76.67	30	0

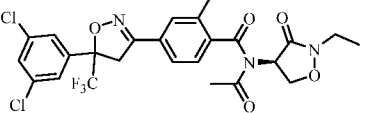
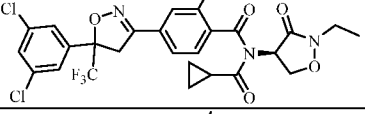
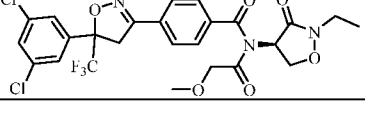
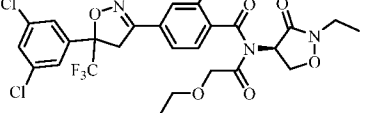
本发明实施例中通过对式 I 化合物中的 R_1 、 R_2 、 R_3 基团进行选择, 获得了杀虫杀螨杀寄生虫效果更好的化合物, 从上表中可以看出, 当 R_3 选择甲氧基 (即上表中按照本发明制备方法制备得到的对比化合物) 时, 其对小菜蛾的活性要远小于本发明实施例中的化合物。

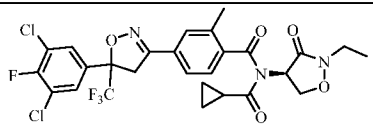
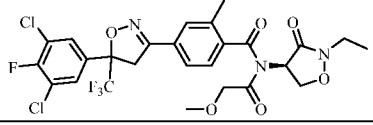
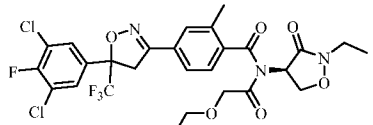
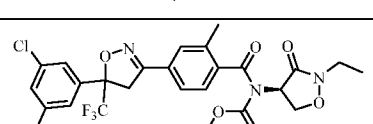
(3) 杀二化螟的活性测定

测定方法: 1) 稻苗准备: 在恒温室 (温度 26~28℃、相对湿度 60~80% 左右, 光照 16hL:8hD) 内用直径为 4.5cm、高 4cm 塑料小杯培养水稻, 待水稻长至 4~5 叶期时, 选择健壮的、长势一致的水稻幼苗进行药剂处理, 每处理设 3 次重复。2) 试虫准备: 室内连续饲养的二化螟, 3 龄幼虫。3) 稻茎喷雾接虫。采用喷雾法, 对稻苗进行全株均匀喷雾处理, 每处理用药 15ml。先处理空白对照, 然后按试验浓度由低到高的顺序重复上述操作。稻苗喷雾处理后, 放置阴凉处将药液晾干, 剪取茎基部上 5 厘米左右茎秆饲喂试虫。准备直径 90mm 的玻璃培养皿, 皿底垫滤纸, 加水保湿, 每皿放入约 5 根稻茎, 接幼虫 10 头, 用无纺布密闭培养皿, 置于恒温房间培养。药后 3 天调查残留活虫数。

对二化螟的部分测试结果如表 7 所示:

表 7 本发明化合物对二化螟的杀虫测试结果

编号	结构式	死亡率 (% , 药后 3 天)		
		10 mg/L	2.5 mg/L	0.625 mg/L
109		100	100	80
112		100	100	96.67
113		100	100	86.67
114		100	100	83.33

120		100	100	96.67
121		100	100	90
122		100	100	93.33
对比化合物		16.67	0	0

本发明实施例中通过对式 I 化合物中的 R_1 、 R_2 、 R_3 基团进行选择, 获得了杀虫杀螨杀寄生虫效果更好的化合物, 从上表中可以看出, 当 R_3 选择甲氧基 (即上表中按照本发明制备方法制备得到的对比化合物) 时, 其对二化螟的活性要远小于本发明实施例中的化合物。

实施例9: 朱砂叶螨的生物活性测定

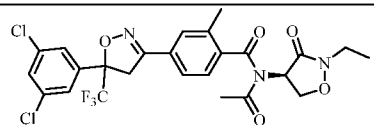
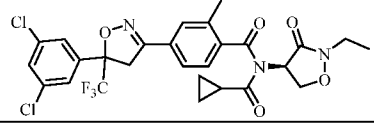
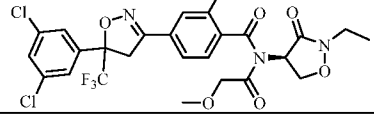
用本发明化合物进行温室杀螨活性测定。测定的方法如下:

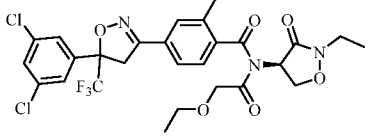
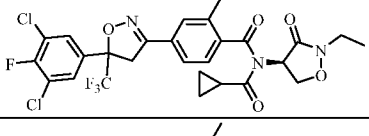
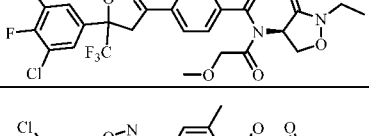
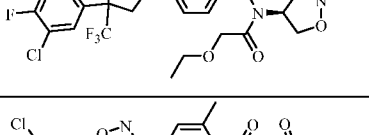
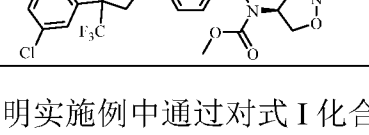
根据待测化合物的溶解性, 用丙酮或二甲基亚砜溶解, 并用0.1%的吐温80溶液配制所需浓度的待测溶液50毫升, 丙酮或二甲基亚砜在溶液中的含量不超过10%。

取两片真叶菜豆苗, 接种朱砂叶螨成螨30-40头, 调查基数后, 用手持喷雾器进行整株喷雾处理, 每处理3次重复, 处理后置于标准观察室, 72小时后调查存活螨数, 计算死亡率。

对朱砂叶螨的部分测试结果如表 8 所示:

表 8 本发明化合物对朱砂叶螨的杀螨测试结果

编号	结构式	死亡率(%, 药后 3 天)			
		5 mg/L	2.5 mg/L	1.25 mg/L	0.625mg/L
109		100	100	70	16.7
112		100	100	100	96.7
113		100	100	100	100

114		100	100	100	100
120		100	100	100	100
121		100	100	100	100
122		100	100	100	100
对比化合物		100	73.3	20	-

本发明实施例中通过对式 I 化合物中的 R_1 、 R_2 、 R_3 基团进行选择, 获得了杀虫杀螨杀寄生虫效果更好的化合物, 从上表中可以看出, 当 R_3 选择甲氧基 (即上表中按照本发明制备方法制备得到的对比化合物) 时, 其对朱砂叶螨的活性要远小于本发明实施例中的化合物。

实施例10: 对猫蚤的杀虫试验

将4mg待测化合物溶解于40ml丙酮, 获得浓度100ppm的丙酮溶液, 在内径5.3cm的培养皿的底面和侧面上涂布400 μ l药液, 然后待丙酮挥发, 在培养皿的内壁上制作本发明化合物的薄膜。所使用的培养皿的内壁为40cm², 处理药量为1 μ g/cm²; 向其中放入10只猫蚤成虫(雌雄混合), 盖好后在25℃的恒温室内保存。检查72h后的死虫数, 计算死虫率。试验按3次重复进行。测试结果: 化合物109、112、113、114、120、121、122显示出70%以上的死虫率。

实施例11: 对美洲犬蜱的杀虫试验

将4mg待测化合物溶解于40ml丙酮, 获得浓度100ppm的丙酮溶液, 在2个内径5.3cm的培养皿的底面和侧面上, 涂布400 μ l药液, 然后待丙酮挥发, 在培养皿的内壁上制作本发明化合物的薄膜。所使用的培养皿的内壁为40cm², 处理药量为1 μ g/cm²。向其中放入10只美洲犬蜱的第1若虫(雌雄混合), 合并2个培养皿, 使用胶带密封结合部以防止逃亡, 在25℃的恒温室中保存。检查24h后的死虫数, 计算死虫率。试验按3次重复进行。测试结果: 化合物109、112、113、114、120、121、122显示出70%以上的死虫率。

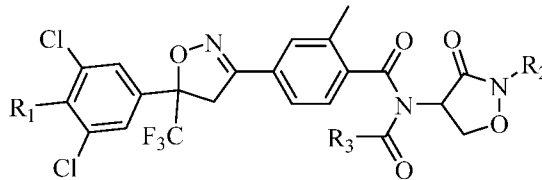
工业实用性

本发明公开了一种异噁唑啉类化合物及其制备方法和应用, 该异噁唑啉类化合物具

有意想不到的优异的杀虫杀螨效果，其也对有毒的害虫展现出合适的防治效果，且对栽培的作物植物没有植物毒性。此外，本发明的化合物可用于防治多种害虫，例如有害的刺吸式昆虫、咀嚼式昆虫以及其他植物寄生害虫、储存谷物害虫、卫生害虫等，并且可用于消毒和杀灭它们。

权利要求

1、一种异噁唑啉类化合物，其特征在于：如通式 I 所示：



通式 I

式中：

R₁ 选自氢、氯或氟；

R₂ 选自乙基或 2, 2, 2-三氟乙基；

R₃ 选自 C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 卤代烷基、C₃-C₈ 环烷基或 C₁-C₆ 烷氧基 C₁-C₆ 烷基；

或为通式 I 化合物的立体异构体；

或为通式 I 化合物的盐；

或为通式 I 化合物的立体异构体的盐。

2、根据权利要求 1 所述的异噁唑啉类化合物，其特征在于：通式 I 中

R₁ 选自氢、氯或氟；

R₂ 选自乙基或 2, 2, 2-三氟乙基；

R₃ 选自 C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₄ 环烷基或 C₁-C₄ 烷氧基 C₁-C₃ 烷基。

3、根据权利要求 2 所述的异噁唑啉类化合物，其特征在于：通式 I 中

R₁ 选自氢、氯或氟；

R₂ 选自乙基或 2, 2, 2-三氟乙基；

R₃ 选自 C₁-C₄ 烷基、环丙基或 C₁-C₄ 烷氧基 C₁-C₂ 烷基。

4、根据权利要求 1-3 之一所述的异噁唑啉类化合物，其特征在于，通式 I 化合物的盐包括：通式 I 化合物与盐酸、氢溴酸、硫酸、磷酸、甲酸、乙酸、丙酸、丁酸、戊酸、三氟乙酸、草酸、丙二酸、甲磺酸、4-甲苯磺酸、苹果酸、富马酸、乳酸、马来酸、水杨酸、酒石酸或柠檬酸形成的盐；

和/或，通式 I 化合物的立体异构体的盐包括：通式 I 化合物的立体异构体与盐酸、氢溴酸、硫酸、磷酸、甲酸、乙酸、丙酸、丁酸、戊酸、三氟乙酸、草酸、丙二酸、甲磺酸、4-甲苯磺酸、苹果酸、富马酸、乳酸、马来酸、水杨酸、酒石酸或柠檬酸形成的盐。

5、根据权利要求 1 所述的异噁唑啉类化合物，其特征在于，异噁唑啉类化合物选自

表 1 化合物, 所述表 1 化合物具有如通式 I 的结构且 R_1 、 R_2 和 R_3 如表 1 中所示;

表 1

化合物编号	R_1	R_2	R_3
1	H	乙基	甲基
2	H	乙基	乙基
3	H	乙基	正丙基
4	H	乙基	异丙基
5	H	乙基	正丁基
6	H	乙基	异丁基
7	H	乙基	叔丁基
8	H	乙基	环丙基
9	H	乙基	CH_3OCH_2-
10	H	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
11	H	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
12	H	乙基	$(\text{CH}_3)_2\text{CHOCH}_2-$
13	H	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
14	H	乙基	$(\text{CH}_3)_3\text{COCH}_2-$
15	H	乙基	$\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
16	H	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
17	H	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
18	H	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
19	F	乙基	甲基
20	F	乙基	乙基
21	F	乙基	正丙基
22	F	乙基	异丙基
23	F	乙基	正丁基
24	F	乙基	异丁基
25	F	乙基	叔丁基
26	F	乙基	环丙基
27	F	乙基	CH_3OCH_2-
28	F	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
29	F	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
30	F	乙基	$(\text{CH}_3)_2\text{CHOCH}_2-$
31	F	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$

32	F	乙基	$(\text{CH}_3)_3\text{COCH}_2-$
33	F	乙基	$\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
34	F	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
35	F	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
36	F	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
37	H	2, 2, 2-三氟乙基	甲基
38	H	2, 2, 2-三氟乙基	乙基
39	H	2, 2, 2-三氟乙基	正丙基
40	H	2, 2, 2-三氟乙基	异丙基
41	H	2, 2, 2-三氟乙基	正丁基
42	H	2, 2, 2-三氟乙基	异丁基
43	H	2, 2, 2-三氟乙基	叔丁基
44	H	2, 2, 2-三氟乙基	环丙基
45	H	2, 2, 2-三氟乙基	CH_3OCH_2-
46	H	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
47	H	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
48	H	2, 2, 2-三氟乙基	$(\text{CH}_3)_2\text{CHOCH}_2-$
49	H	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
50	H	2, 2, 2-三氟乙基	$(\text{CH}_3)_3\text{COCH}_2-$
51	H	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
52	H	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
53	H	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
54	H	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
55	F	2, 2, 2-三氟乙基	甲基
56	F	2, 2, 2-三氟乙基	乙基
57	F	2, 2, 2-三氟乙基	正丙基
58	F	2, 2, 2-三氟乙基	异丙基
59	F	2, 2, 2-三氟乙基	正丁基
60	F	2, 2, 2-三氟乙基	异丁基
61	F	2, 2, 2-三氟乙基	叔丁基
62	F	2, 2, 2-三氟乙基	环丙基
63	F	2, 2, 2-三氟乙基	CH_3OCH_2-
64	F	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
65	F	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$

66	F	2, 2, 2-三氟乙基	$(\text{CH}_3)_2\text{CHOCH}_2-$
67	F	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
68	F	2, 2, 2-三氟乙基	$(\text{CH}_3)_3\text{COCH}_2-$
69	F	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
70	F	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
71	F	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
72	F	2, 2, 2-三氟乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
73	Cl	乙基	甲基
74	Cl	乙基	乙基
75	Cl	乙基	正丙基
76	Cl	乙基	异丙基
77	Cl	乙基	正丁基
78	Cl	乙基	异丁基
79	Cl	乙基	叔丁基
80	Cl	乙基	环丙基
81	Cl	乙基	CH_3OCH_2-
82	Cl	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
83	Cl	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
84	Cl	乙基	$(\text{CH}_3)_2\text{CHOCH}_2-$
85	Cl	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$
86	Cl	乙基	$(\text{CH}_3)_3\text{COCH}_2-$
87	Cl	乙基	$\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
88	Cl	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
89	Cl	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
90	Cl	乙基	$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$
91	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	甲基
92	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	乙基
93	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	正丙基
94	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	异丙基
95	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	正丁基
96	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	异丁基
97	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	叔丁基
98	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	环丙基
99	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	CH_3OCH_2-

100	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ -
101	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	CH ₃ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -
102	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	(CH ₃) ₂ CHOCH ₂ -
103	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -
104	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	(CH ₃) ₃ COCH ₂ -
105	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ -
106	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -
107	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	CH ₃ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -
108	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -

或, 选自任意一个表 1 化合物的立体异构体;

或, 选自任意一个表 1 化合物与盐酸、氢溴酸、硫酸、磷酸、甲酸、乙酸、丙酸、丁酸、戊酸、三氟乙酸、草酸、丙二酸、甲磺酸、4-甲苯磺酸、苹果酸、富马酸、乳酸、马来酸、水杨酸、酒石酸或柠檬酸形成的盐;

或选自任意一个表 1 化合物的立体异构体与盐酸、氢溴酸、硫酸、磷酸、甲酸、乙酸、丙酸、丁酸、戊酸、三氟乙酸、草酸、丙二酸、甲磺酸、4-甲苯磺酸、苹果酸、富马酸、乳酸、马来酸、水杨酸、酒石酸或柠檬酸形成的盐。

6、根据权利要求 5 所述的异噁唑啉类化合物, 其特征在于, 异噁唑啉类化合物选自表 2 化合物, 所述表 2 化合物具有如通式 I 的结构且 R₁、R₂ 和 R₃ 如表 2 中所示;

表 2

化合物编号	R ₁	R ₂	R ₃
1	H	乙基	甲基
2	H	乙基	乙基
3	H	乙基	正丙基
4	H	乙基	异丙基
5	H	乙基	正丁基
6	H	乙基	异丁基
7	H	乙基	叔丁基
8	H	乙基	环丙基
9	H	乙基	CH ₃ OCH ₂ -
10	H	乙基	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ -
11	H	乙基	CH ₃ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -
12	H	乙基	(CH ₃) ₂ CHOCH ₂ -
19	F	乙基	甲基
20	F	乙基	乙基

21	F	乙基	正丙基
22	F	乙基	异丙基
23	F	乙基	正丁基
24	F	乙基	异丁基
25	F	乙基	叔丁基
26	F	乙基	环丙基
27	F	乙基	CH ₃ OCH ₂ -
28	F	乙基	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ -
29	F	乙基	CH ₃ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -
30	F	乙基	(CH ₃) ₂ CHOCH ₂ -
37	H	2, 2, 2-三氟乙基	甲基
38	H	2, 2, 2-三氟乙基	乙基
39	H	2, 2, 2-三氟乙基	正丙基
40	H	2, 2, 2-三氟乙基	异丙基
41	H	2, 2, 2-三氟乙基	正丁基
42	H	2, 2, 2-三氟乙基	异丁基
43	H	2, 2, 2-三氟乙基	叔丁基
44	H	2, 2, 2-三氟乙基	环丙基
45	H	2, 2, 2-三氟乙基	CH ₃ OCH ₂ -
46	H	2, 2, 2-三氟乙基	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ -
47	H	2, 2, 2-三氟乙基	CH ₃ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -
48	H	2, 2, 2-三氟乙基	(CH ₃) ₂ CHOCH ₂ -
55	F	2, 2, 2-三氟乙基	甲基
56	F	2, 2, 2-三氟乙基	乙基
57	F	2, 2, 2-三氟乙基	正丙基
58	F	2, 2, 2-三氟乙基	异丙基
59	F	2, 2, 2-三氟乙基	正丁基
60	F	2, 2, 2-三氟乙基	异丁基
61	F	2, 2, 2-三氟乙基	叔丁基
62	F	2, 2, 2-三氟乙基	环丙基
63	F	2, 2, 2-三氟乙基	CH ₃ OCH ₂ -
64	F	2, 2, 2-三氟乙基	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ -
65	F	2, 2, 2-三氟乙基	CH ₃ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -
66	F	2, 2, 2-三氟乙基	(CH ₃) ₂ CHOCH ₂ -

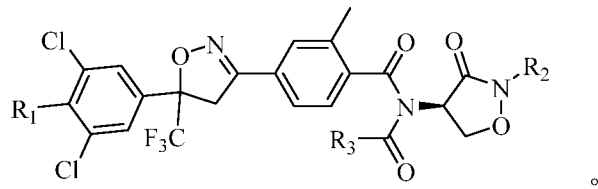
73	Cl	乙基	甲基
74	Cl	乙基	乙基
75	Cl	乙基	正丙基
76	Cl	乙基	异丙基
77	Cl	乙基	正丁基
78	Cl	乙基	异丁基
79	Cl	乙基	叔丁基
80	Cl	乙基	环丙基
81	Cl	乙基	CH ₃ OCH ₂ -
82	Cl	乙基	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ -
83	Cl	乙基	CH ₃ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -
84	Cl	乙基	(CH ₃) ₂ CHOCH ₂ -
91	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	甲基
92	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	乙基
93	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	正丙基
94	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	异丙基
95	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	正丁基
96	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	异丁基
97	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	叔丁基
98	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	环丙基
99	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	CH ₃ OCH ₂ -
100	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ -
101	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	CH ₃ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -
102	Cl	2, 2, 2-三氟乙基	(CH ₃) ₂ CHOCH ₂ -

或，选自任意一个表 2 化合物的立体异构体，

或，选自任意一个表 2 化合物与盐酸、氢溴酸、硫酸、磷酸、甲酸、乙酸、丙酸、丁酸、戊酸、三氟乙酸、草酸、丙二酸、甲磺酸、4-甲苯磺酸、苹果酸、富马酸、乳酸、马来酸、水杨酸、酒石酸或柠檬酸形成的盐，

或，选自任意一个表 2 化合物的立体异构体与盐酸、氢溴酸、硫酸、磷酸、甲酸、乙酸、丙酸、丁酸、戊酸、三氟乙酸、草酸、丙二酸、甲磺酸、4-甲苯磺酸、苹果酸、富马酸、乳酸、马来酸、水杨酸、酒石酸或柠檬酸形成的盐。

7、根据权利要求 1-6 之一所述的异噁唑啉类化合物，其特征在于：通式 I 化合物的立体异构体为通式 IA 所示化合物：



通式 IA

8、根据权利要求 7 所述的异噁唑啉类化合物，其特征在于，通式 IA 所示化合物选自表 3 中的化合物，所述表 3 中的化合物具有如通式 IA 的结构且 R_1 、 R_2 和 R_3 如表 3 中所示；

表 3

化合物编号	R_1	R_2	R_3
109	H	乙基	甲基
110	H	乙基	乙基
111	H	乙基	异丙基
112	H	乙基	环丙基
113	H	乙基	CH ₃ OCH ₂ -
114	H	乙基	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ -
115	H	乙基	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ -
116	H	乙基	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -
117	F	乙基	甲基
118	F	乙基	乙基
119	F	乙基	异丙基
120	F	乙基	环丙基
121	F	乙基	CH ₃ OCH ₂ -
122	F	乙基	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ -
123	F	乙基	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ -
124	F	乙基	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -

9、根据权利要求 8 所述的化合物，其特征在于，通式 IA 所示化合物选自表 4 中的化合物，所述表 4 中的化合物具有如通式 IA 的结构且 R_1 、 R_2 和 R_3 如表 4 中所示；

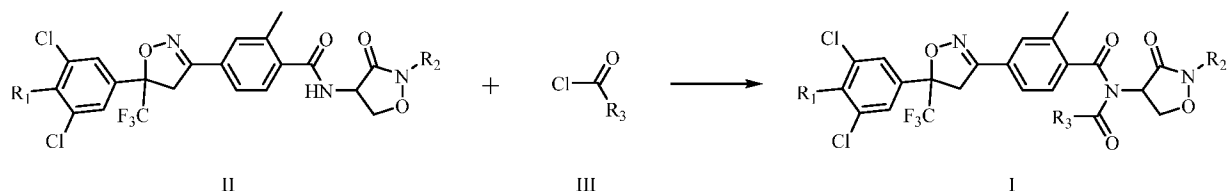
表 4

化合物编号	R_1	R_2	R_3
109	H	乙基	甲基
110	H	乙基	乙基
111	H	乙基	异丙基

112	H	乙基	环丙基
113	H	乙基	CH ₃ OCH ₂ -
114	H	乙基	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ -
117	F	乙基	甲基
118	F	乙基	乙基
119	F	乙基	异丙基
120	F	乙基	环丙基
121	F	乙基	CH ₃ OCH ₂ -
122	F	乙基	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ -

。

10、一种权利要求 1 所述的异噁唑啉类化合物的制备方法，其特征在于，当异噁唑啉类化合物为通式 I 化合物时，其制备方法如下，反应式中 R₁、R₂ 和 R₃ 的含义与权利要求 1 中相同：



通式 II 化合物与通式 III 化合物在溶剂中，在温度从 -10°C 到溶剂沸点下反应 0.5~48 小时可制得通式 I 化合物；反应可在碱的存在下进行。

11、一种根据权利要求 1-9 之一所述的异噁唑啉类化合物在制备杀虫剂和/或杀螨剂中的用途。

12、根据权利要求 11 所述的用途，其特征在于：所述杀虫剂和/或杀螨剂用于防治粘虫、小菜蛾、二化螟、朱砂叶螨中的一种或几种。

13、一种杀虫剂制剂或杀螨剂制剂，其特征在于：所述杀虫剂制剂或杀螨剂制剂中含有权利要求 1-9 之一所述的异噁唑啉类化合物作为活性组分，还含有一种或多种辅料；可选地，杀虫剂制剂或杀螨剂制剂中权利要求 1-9 之一所述的异噁唑啉类化合物的量为 0.1 至 99 重量%，进一步可选地为 0.5 至 90 重量%。

14、一种杀虫剂组合物或杀螨剂组合物，其特征在于：包括权利要求 1-9 之一所述的异噁唑啉类化合物和其他活性化合物的混合物，所述其他活性化合物选自杀虫剂、毒饵剂、消毒剂、杀螨剂、杀线虫剂、杀真菌剂、生长调节剂、除草剂中的一种或多种。

15、一种控制农业或林业害虫和/或害螨的方法，其特征在于：将有效剂量的材料施用于需要控制的害虫害螨或其生长介质上，所述材料选自下组中的一种或多种：

权利要求 1-9 之一所述的异噁唑啉类化合物；

权利要求 13 所述的杀虫剂制剂或杀螨剂制剂；

权利要求 14 所述的杀虫剂组合物或杀螨剂组合物。

16、一种根据权利要求 1-9 之一所述的异噁唑啉类化合物在制备动物寄生虫防治剂中的用途。

17、根据权利要求 16 所述的用途，其特征在于：所述动物寄生虫防治剂用于防治猫蚤、美洲犬蜱中的一种或几种。

18、一种动物寄生虫防治剂，其特征在于：所述动物寄生虫防治剂中含有权利要求 1-9 之一所述的异噁唑啉类化合物作为活性组分，还含有一种或多种辅料；可选地，动物寄生虫防治剂中权利要求 1-9 之一所述的异噁唑啉类化合物的量为 1 至 80 重量%。

19、一种动物寄生虫防治组合物，其特征在于：包括权利要求 1-9 之一所述的异噁唑啉类化合物和其他动物寄生虫防治活性化合物的混合物，所述其他动物寄生虫防治活性化合物选自杀螨剂、杀昆虫剂、杀寄生虫剂、抗疟原虫剂中的一种或多种。

20、一种控制动物寄生虫的方法，其特征在于：包括以下步骤：将有效剂量的材料施于需要控制的动物寄生虫或其生长介质上，所述材料选自下组中的一种或多种：

权利要求 1-9 之一所述的异噁唑啉类化合物；

权利要求 18 所述的动物寄生虫防治剂；

权利要求 19 所述的动物寄生虫防治组合物。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/CN2020/099377

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

C07D 261/04(2006.01)i; C07D 275/02(2006.01)i; C07D 261/12(2006.01)i; C07D 417/12(2006.01)i; C07D 413/12(2006.01)i; A01N 43/80(2006.01)i; A01P 7/04(2006.01)i; A01P 7/02(2006.01)i

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

C07D A01N A01P

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CNABS; CNTXT; CJFD; DWPI; SIPOABS; WOTXT; USTXT; EPTXT; CNKI; PATENTICS; 万方; 超星读秀; ISI-Web of Science; STN-registry; STN-caplus; 沈阳化工大学, 张立新, 张静, 高一星, 康卓, 异噁唑啉, 苯甲酰, 杀虫, 杀螨, 动物寄生虫, Isoxazolin?, Benzamide, Insecticide, Insecticidal, Parasite, Insect, Pesticid+, Pest Control, structural formula (I)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	CN 102639529 A (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG) 15 August 2012 (2012-08-15) claims 1, 15, description paragraphs [0151]-[0162], [0353], [0361], [0388]	1-20
X	WO 2012067235 A1 (NISSAN CHEMICAL IND LTD et al.) 24 May 2012 (2012-05-24) claims 1-19	1-20
A	CN 103842346 A (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG) 04 June 2014 (2014-06-04) entire document	1-20
A	WO 2017140614 A1 (BASF SE) 24 August 2017 (2017-08-24) entire document	1-20
A	JP 2008239611 A (NISSAN CHEMICAL IND LTD.) 09 October 2008 (2008-10-09) entire document	1-20



Further documents are listed in the continuation of Box C.



See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

“A” document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

“E” earlier application or patent but published on or after the international filing date

“L” document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

“O” document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

“P” document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

“T” later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

“X” document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

“Y” document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

“&” document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

21 July 2020

Date of mailing of the international search report

22 September 2020

Name and mailing address of the ISA/CN

China National Intellectual Property Administration (ISA/
CN)
No. 6, Xitucheng Road, Jimenqiao Haidian District, Beijing
100088
China

Facsimile No. (86-10)62019451

Authorized officer

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/CN2020/099377**Box No. II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)**

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☒ Claims Nos.: **20**
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
 - [1] Claim 20 sets forth a method for controlling an animal parasite. Since the growth medium of an animal parasite is an animal or a person, the method therefore falls into the category of methods for treatment of the human or animal body, i.e. a case listed in PCT Rule 39.1(iv) as not requiring an international search to be performed.
 - [2] A search for claim 20 has been performed on the basis of the following reasonably expected subject matter:
 - [3] 20. A use of the isoxazoline compounds of any one of claims 1-9, or the animal parasite control agent of claim 18, or the animal parasite control composition of claim 19 in preparing a drug which controls an animal parasite.
2. ☐ Claims Nos.:
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3. ☐ Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.

PCT/CN2020/099377

Patent document cited in search report			Publication date (day/month/year)	Patent family member(s)			Publication date (day/month/year)
CN	102639529	A	15 August 2012	MX	2012006171	A	30 June 2012
				JP	2013512274	A	11 April 2013
				KR	101771199	B1	05 September 2017
				KR	20120102066	A	17 September 2012
				US	8735362	B2	27 May 2014
				AU	2010326766	B2	10 July 2014
				ZA	201203587	A	29 October 2014
				ID	201204296	A	25 October 2012
				MY	157849	A	29 July 2016
				IL	243017	A1	31 January 2016
				EP	2507230	B1	17 January 2018
				US	2019166842	A1	06 June 2019
				CA	2780522	A1	09 June 2011
				US	2012238517	A1	20 September 2012
				US	2014228577	A1	14 August 2014
				IN	201204224	P1	06 November 2015
				JP	5980119	B2	31 August 2016
				US	2017152250	A1	01 June 2017
				ES	2666415	T3	04 May 2018
				US	10206400	B2	19 February 2019
				IN	307232	B	15 February 2019
				TW	201528952	A	01 August 2015
				MX	333722	B	02 October 2015
				PH	12012500937	B1	13 January 2016
				HK	1169985	A1	06 July 2018
				EP	2507230	A1	10 October 2012
				TW	I487486	B	11 June 2015
				CN	102639529	B	19 August 2015
				US	9609869	B2	04 April 2017
				CA	2780522	C	09 January 2018
				GE	201406161	B	10 September 2014
				TW	201130417	A	16 September 2011
				VN	32136	A	25 January 2013
				BR	112012013085	A2	08 September 2015
				BR	112012013085	B1	18 February 2020
				HK	1169985	A0	15 February 2013
				NZ	600036	A	31 May 2013
				PH	12012500937	A1	26 November 2012
				EA	022114	B1	30 November 2015
				WO	2011067272	A1	09 June 2011
				AU	2010326766	A1	07 June 2012
				AU	2010326766	C1	29 January 2015
				IL	219912	A	29 September 2016
WO	2012067235	A1	24 May 2012	US	2017190695	A1	06 July 2017
				JP	2014028758	A	13 February 2014
				US	2013338197	A1	19 December 2013
				US	9637480	B2	02 May 2017
CN	103842346	A	04 June 2014	ID	201603395	A	13 May 2016
				BR	112014007847	A2	18 April 2017
				US	2014243375	A1	28 August 2014

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.

PCT/CN2020/099377

Patent document cited in search report				Publication date (day/month/year)		Patent family member(s)	Publication date (day/month/year)
				EP	2763970	A1	13 August 2014
				VN	38836	A	25 August 2014
				WO	2013050302	A1	11 April 2013
				JP	2014534182	A	18 December 2014
				KR	20140075749	A	19 June 2014
WO	2017140614	A1	24 August 2017	BR	112018015328	A2	18 December 2018
				CA	3012579	A1	24 August 2017
				US	2019059381	A1	28 February 2019
				IN	201827033155	A	18 December 2018
JP	2008239611	A	09 October 2008	None			

国际检索报告

国际申请号

PCT/CN2020/099377

A. 主题的分类

C07D 261/04(2006.01)i; C07D 275/02(2006.01)i; C07D 261/12(2006.01)i; C07D 417/12(2006.01)i; C07D 413/12(2006.01)i; A01N 43/80(2006.01)i; A01P 7/04(2006.01)i; A01P 7/02(2006.01)i

按照国际专利分类(IPC)或者同时按照国家分类和IPC两种分类

B. 检索领域

检索的最低限度文献(标明分类系统和分类号)

C07D A01N A01P

包含在检索领域中的除最低限度文献以外的检索文献

在国际检索时查阅的电子数据库(数据库的名称,和使用的检索词(如使用))

CNABS;CNTXT;CJFD;DWPI;SIPOABS;WOTXT;USTXT;EPTXT;CNKI;PATENTICS;万方;超星读秀;ISI-Web of Science;STN-registry;STN-caplus; 沈阳化工大学, 张立新, 张静, 高一星, 康卓, 异噁唑啉, 苯甲酰, 杀虫, 杀螨, 动物寄生虫, Isoxazolin?, Benzamide, Insecticide, Insecticidal, Parasite, Insect, Pesticid+, Pest Control, 结构式I

C. 相关文件

类 型*	引用文件, 必要时, 指明相关段落	相关的权利要求
X	CN 102639529 A (先正达参股股份有限公司) 2012年 8月 15日 (2012 - 08 - 15) 权利要求1、15, 说明书第[0151]-[0162]、[0353]、[0361]、[0388]段	1-20
X	WO 2012067235 A1 (NISSAN CHEMICAL IND LTD 等) 2012年 5月 24日 (2012 - 05 - 24) 权利要求1-19	1-20
A	CN 103842346 A (先正达参股股份有限公司) 2014年 6月 4日 (2014 - 06 - 04) 全文	1-20
A	WO 2017140614 A1 (BASF SE) 2017年 8月 24日 (2017 - 08 - 24) 全文	1-20
A	JP 2008239611 A (NISSAN CHEMICAL IND LTD) 2008年 10月 9日 (2008 - 10 - 09) 全文	1-20

☐ 其余文件在C栏的续页中列出。

☒ 见同族专利附件。

* 引用文件的具体类型:

“A” 认为不特别相关的表示了现有技术一般状态的文件

“E” 在国际申请日的当天或之后公布的在先申请或专利

“L” 可能对优先权要求构成怀疑的文件, 或为确定另一篇引用文件的公布日而引用的或者因其他特殊理由而引用的文件(如具体说明的)

“O” 涉及口头公开、使用、展览或其他方式公开的文件

“P” 公布日先于国际申请日但迟于所要求的优先权日的文件

“T” 在申请日或优先权日之后公布, 与申请不相抵触, 但为了理解发明之理论或原理的在后文件

“X” 特别相关的文件, 单独考虑该文件, 认定要求保护的发明不是新颖的或不具有创造性

“Y” 特别相关的文件, 当该文件与另一篇或者多篇该类文件结合并且这种结合对于本领域技术人员为显而易见时, 要求保护的发明不具有创造性

“&” 同族专利的文件

国际检索实际完成的日期

2020年 7月 21日

国际检索报告邮寄日期

2020年 9月 22日

ISA/CN的名称和邮寄地址

中国国家知识产权局(ISA/CN)

中国北京市海淀区蓟门桥西土城路6号 100088

传真号 (86-10)62019451

受权官员

蒋薇薇

电话号码 (86-512)88996871

第II栏

某些权利要求被认为是不能检索的意见(续第I页第2项)

根据条约第17条(2)(a)，对某些权利要求未做国际检索报告的理由如下：

1. ☒ 权利要求： 20
因为它们涉及不要求本单位进行检索的主题，即：
[1] 权利要求20请求保护一种控制动物寄生虫的方法。由于动物寄生虫的生长介质为动物或人，因此上述方法属于针对人体或动物体的治疗方法的范畴，即属于PCT实施细则39.1(iv)所列的无需进行国际检索的情形。
[2] 对权利要求20的检索是基于合理预期将其主题作如下修改作出的：
[3] 20. 权利要求1-9之一所述的异噁唑啉类化合物，或权利要求18所述的动物寄生虫防治剂，或权利要求19所述的动物寄生虫防治组合物在制备控制动物寄生虫药物中的用途。
2. ☐ 权利要求：
因为它们涉及国际申请中不符合规定的要求的部分，以致不能进行任何有意义的国际检索，具体地说：
3. ☐ 权利要求：
因为它们是从属权利要求，并且没有按照细则6.4(a)第2句和第3句的要求撰写。

国际检索报告
关于同族专利的信息

国际申请号

PCT/CN2020/099377

检索报告引用的专利文件			公布日 (年/月/日)	同族专利			公布日 (年/月/日)
CN	102639529	A	2012年 8月 15日	MX	2012006171	A	2012年 6月 30日
				JP	2013512274	A	2013年 4月 11日
				KR	101771199	B1	2017年 9月 5日
				KR	20120102066	A	2012年 9月 17日
				US	8735362	B2	2014年 5月 27日
				AU	2010326766	B2	2014年 7月 10日
				ZA	201203587	A	2014年 10月 29日
				ID	201204296	A	2012年 10月 25日
				MY	157849	A	2016年 7月 29日
				IL	243017	A1	2016年 1月 31日
				EP	2507230	B1	2018年 1月 17日
				US	2019166842	A1	2019年 6月 6日
				CA	2780522	A1	2011年 6月 9日
				US	2012238517	A1	2012年 9月 20日
				US	2014228577	A1	2014年 8月 14日
				IN	201204224	P1	2015年 11月 6日
				JP	5980119	B2	2016年 8月 31日
				US	2017152250	A1	2017年 6月 1日
				ES	2666415	T3	2018年 5月 4日
				US	10206400	B2	2019年 2月 19日
				IN	307232	B	2019年 2月 15日
				TW	201528952	A	2015年 8月 1日
				MX	333722	B	2015年 10月 2日
				PH	12012500937	B1	2016年 1月 13日
				HK	1169985	A1	2018年 7月 6日
				EP	2507230	A1	2012年 10月 10日
				TW	1487486	B	2015年 6月 11日
				CN	102639529	B	2015年 8月 19日
				US	9609869	B2	2017年 4月 4日
				CA	2780522	C	2018年 1月 9日
				GE	201406161	B	2014年 9月 10日
				TW	201130417	A	2011年 9月 16日
				VN	32136	A	2013年 1月 25日
				BR	112012013085	A2	2015年 9月 8日
				BR	112012013085	B1	2020年 2月 18日
				HK	1169985	A0	2013年 2月 15日
				NZ	600036	A	2013年 5月 31日
				PH	12012500937	A1	2012年 11月 26日
				EA	022114	B1	2015年 11月 30日
				WO	2011067272	A1	2011年 6月 9日
				AU	2010326766	A1	2012年 6月 7日
				AU	2010326766	C1	2015年 1月 29日
				IL	219912	A	2016年 9月 29日
WO	2012067235	A1	2012年 5月 24日	US	2017190695	A1	2017年 7月 6日
				JP	2014028758	A	2014年 2月 13日
				US	2013338197	A1	2013年 12月 19日
				US	9637480	B2	2017年 5月 2日
CN	103842346	A	2014年 6月 4日	ID	201603395	A	2016年 5月 13日
				BR	112014007847	A2	2017年 4月 18日
				US	2014243375	A1	2014年 8月 28日

国际检索报告
关于同族专利的信息

国际申请号

PCT/CN2020/099377

检索报告引用的专利文件				公布日 (年/月/日)		同族专利		公布日 (年/月/日)	
						EP	2763970	A1	2014年 8月 13日
						VN	38836	A	2014年 8月 25日
						WO	2013050302	A1	2013年 4月 11日
						JP	2014534182	A	2014年 12月 18日
						KR	20140075749	A	2014年 6月 19日
WO	2017140614	A1	2017年 8月 24日			BR	112018015328	A2	2018年 12月 18日
						CA	3012579	A1	2017年 8月 24日
						US	2019059381	A1	2019年 2月 28日
						IN	201827033155	A	2018年 12月 18日
JP	2008239611	A	2008年 10月 9日			无			