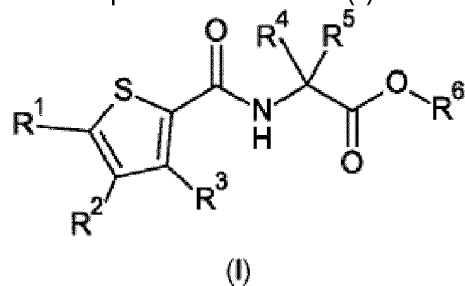


(12) BREVET D'INVENTION

- (11) N° de publication : **MA 53085 B1**
- (51) Cl. internationale : **A01N 43/10; A01N 43/28;
C07D 413/04; C07D 333/38;
C07D 333/40; A01P 1/00**
- (43) Date de publication : **30.12.2022**
-
- (21) N° Dépôt : **53085**
- (22) Date de Dépôt : **03.07.2019**
- (30) Données de Priorité : **05.07.2018 EP 18181930**
- (86) Données relatives à la demande internationale selon le PCT: **PCT/EP2019/067824 03.07.2019**
- (71) Demandeur(s) : **Bayer Aktiengesellschaft, Kaiser-Wilhelm-Allee 1 51373 Leverkusen (DE)**
- (72) Inventeur(s) : **BERNIER, David ; BRUNET, Stéphane ; DUFOUR, Jérémy ; KNOBLOCH, Thomas ; NICOLAS, Lionel ; TSUCHIYA, Tomoki**
- (74) Mandataire : **TOUNINA CONSULTING**
- (86) N° de dépôt auprès de l'organisme de validation: **EP19736663.6**
-
- (54) Titre : **THIOPHÈNECARBOXAMIDES SUBSTITUÉS ET ANALOGUES COMME AGENTS ANTIBACTÉRIENS**
- (57) Abrégé : La présente invention concerne des thiophénecarboxamides substitués et des analogues de ceux-ci de formule (I) qui peuvent être utilisés pour protéger des plantes contre des maladies bactériennes, en particulier des maladies bactériennes provoquées par des bactéries appartenant au genre Xanthomonas.

Revendications

1. Composé de formule (I) :



R¹ et R² étant identiques et étant un atome de chlore ou un atome de brome ;
 R³ étant méthyle ;
 R⁴ étant choisi dans le groupe constitué par un atome d'hydrogène, C₁-C₆-alkyle, aralkyle, aralkyle substitué par hydroxyle, C₁-C₆-alkyle substitué par un C₁-C₆-alkylsulfanyle et R⁵ étant un atome d'hydrogène ; ou
 R⁴ et R⁵ formant, conjointement avec l'atome de carbone auxquels ils sont liés, un cyclopropyle ; R⁶ étant choisi dans le groupe constitué par un atome d'hydrogène, C₁-C₆-alkyle, C₁-C₆-halogénoalkyle, C₁-C₆-cyanoalkyle, C₂-C₆-alcényle, C₂-C₆-alcynyle, C₃-C₈-cycloalkyle, aryle, aralkyle, hétérocyclyle à 4, 5 ou 6 chaînons, -C₁-C₆-alkyl-Si(C₁-C₆-alkyle)₃ et -C₁-C₆-alkyl-C₃-C₈-cycloalkyle.

2. Composé de formule (I) selon la revendication 1, R⁴ étant choisi dans le groupe constitué par un atome d'hydrogène, C₁-C₆-alkyle, benzyle, benzyle substitué par hydroxyle, C₁-C₆-alkyle substitué par un C₁-C₆-alkylsulfanyle et R⁵ étant un atome d'hydrogène ; ou R⁴ et R⁵ formant, conjointement avec l'atome de carbone auxquels ils sont liés, un cyclopropyle.

3. Composé de formule (I) selon la revendication 1 ou 2, R⁶ étant choisi dans le groupe constitué par un atome d'hydrogène, C₁-C₆-alkyle, C₁-C₆-halogénoalkyle, C₁-C₆-cyanoalkyle, C₂-C₆-alcényle, C₂-C₆-alcynyle, C₃-C₈-cycloalkyle, phényle, benzyle, hétérocyclyle à 4, 5 ou 6 chaînons, -C₁-C₆-alkyl-Si(C₁-C₆-alkyle)₃ et -C₁-C₆-alkyl-cyclopropyle.

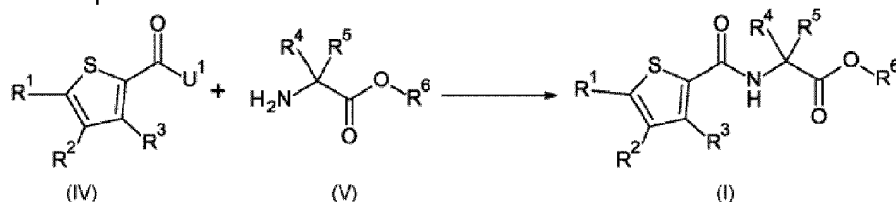
4. Composé de formule (I) selon la revendication 1, 2 ou 3, R⁶ étant choisi dans le groupe constitué par un atome d'hydrogène, C₁-C₆-alkyle, C₁-C₆-halogénoalkyle, C₁-C₆-cyanoalkyle, C₂-C₆-alcényle, C₂-C₆-alcynyle, C₃-C₈-cycloalkyle, phényle, benzyle, oxétanyle, thiétanyle, dioxothiétanyle, oxolanyle, oxanyle, -C₁-C₆-alkyl-Si(C₁-C₆-alkyle)₃ et -C₁-C₆-alkyl-cyclopropyle.

5. Composition comprenant au moins un composé de formule (I) selon l'une quelconque des revendications précédentes et au moins un auxiliaire approprié sur le plan agricole.

6. Procédé pour la lutte contre des maladies bactériennes comprenant l'étape d'application d'au moins un composé de formule (I) selon l'une quelconque des revendications 1 à 4 ou d'une composition selon la revendication 5 aux végétaux,

aux parties de végétal, aux semences, aux fruits ou au sol dans lequel les végétaux croissent.

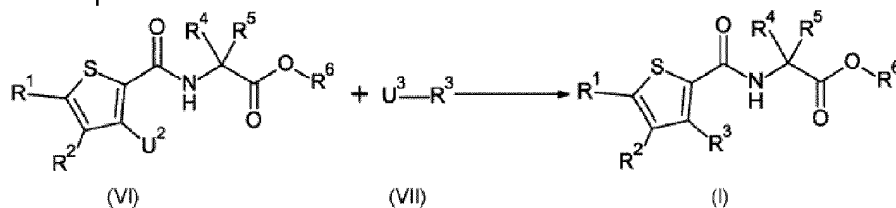
7. Procédé pour la préparation d'un composé de formule (I) selon l'une quelconque des revendications 1 à 4 comprenant l'étape de mise en réaction d'un composé de formule (IV) ou d'un sel correspondant avec un composé de formule (V) ou un sel correspondant :



Procédé A1

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 et R^6 étant tels que décrits dans les revendications 1 à 4 ;
 U^1 étant un atome d'halogène, un groupe hydroxy ou un groupe C₁-C₆-alcoxy.

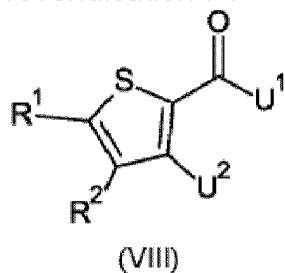
8. Procédé pour la préparation d'un composé de formule (I) selon l'une quelconque des revendications 1 à 4 comprenant l'étape de mise en réaction d'un composé de formule (VI) ou d'un sel correspondant avec un composé de formule (VII) ou un sel correspondant :



Procédé B1

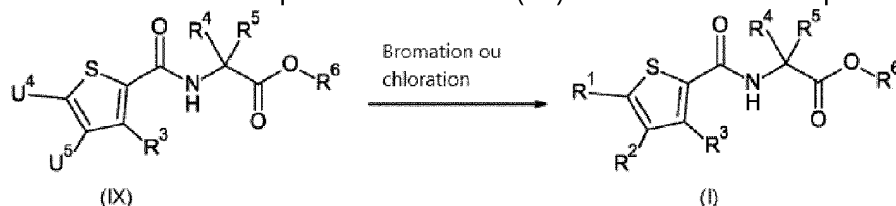
R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 et R^6 étant tels que décrits dans les revendications 1 à 4 ;
 U^2 étant un atome de brome, un atome d'iode, un groupe mésylate, un groupe tosylate ou un groupe triflate et U^3 étant un dérivé du bore ou un halogénométal ;
 étant entendu que lorsque R^1 et R^2 sont des atomes de brome, U^2 n'est pas un atome de brome.

9. Procédé selon la revendication 8 comprenant l'étape de mise en réaction d'un composé de formule (VIII) avec un composé de formule (V) tel que décrit dans la revendication 7 :



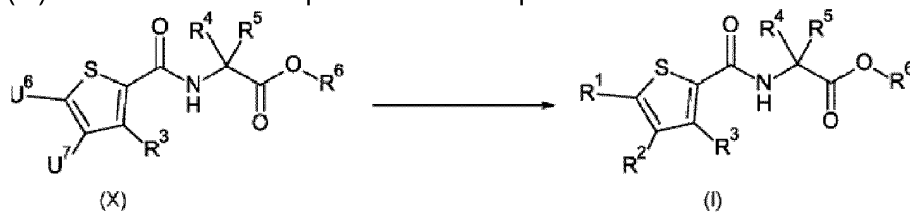
R^1 et R^2 étant tels que décrits dans la revendication 1 ;
 U^1 étant un atome d'halogène, un groupe hydroxy ou un groupe C₁-C₆-alcoxy ;
 U^2 étant un atome de brome, un atome d'iode, un groupe mésylate, un groupe tosylate ou un groupe triflate ;
 pour fournir un composé de formule (VI).

10. Procédé pour la préparation d'un composé de formule (I) selon l'une quelconque des revendications 1 à 4 comprenant l'étape de réalisation d'une bromation ou d'une chloration d'un composé de formule (IX) ou d'un sel correspondant :



R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 et R^6 étant tels que décrits dans les revendications 1 à 4 ;
 U^4 étant un atome d'hydrogène, un atome de chlore ou un atome de brome ;
 et
 U^5 étant un atome d'hydrogène, un atome de chlore ou un atome de brome ;
 étant entendu qu'au moins l'un parmi U^4 et U^5 est un atome d'hydrogène.

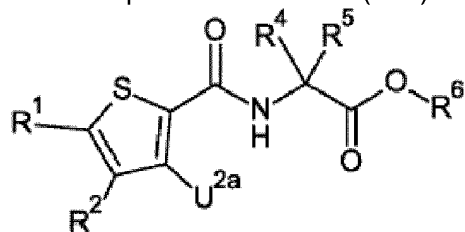
11. Procédé pour la préparation d'un composé de formule (I) selon l'une quelconque des revendications 1 à 4 comprenant l'étape de diazotation d'un composé de formule (X) ou d'un sel correspondant suivie par une substitution aromatique :



Procédé D1

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 et R^6 étant tels que décrits dans les revendications 1 à 4 ;
 U^6 étant un groupe amino, un atome de chlore ou un atome de brome ;
 U^7 étant un groupe amino, un atome de chlore ou un atome de brome ;
 étant entendu qu'au moins l'un parmi U^6 et U^7 est un groupe amino.

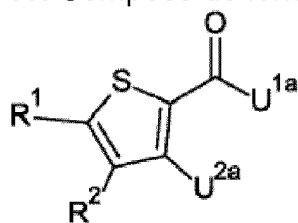
12. Composé de formule (VIa) :



(VIa)

R^1 et R^2 étant identiques et étant un atome de chlore ou un atome de brome ;
 R^4 étant choisi dans le groupe constitué par un atome d'hydrogène, C_1 - C_6 -alkyle, aralkyle, aralkyle substitué par hydroxyle, C_1 - C_6 -alkyle substitué par un C_1 - C_6 -alkylsulfanyle et R^5 étant un atome d'hydrogène ; ou
 R^4 et R^5 formant, conjointement avec l'atome de carbone auxquels ils sont liés, un cyclopropyle ; R^6 étant choisi dans le groupe constitué par un atome d'hydrogène, C_1 - C_6 -alkyle, C_1 - C_6 -halogénoalkyle, C_1 - C_6 -cyanoalkyle, C_2 - C_6 -alcényle, C_2 - C_6 -alcynyle, C_3 - C_8 -cycloalkyle, aryle, aralkyle, hétérocyclyle à 4, 5 ou 6 chaînons, $-C_1$ - C_6 -alkyl-Si (C_1 - C_6 -alkyle) $_3$ et $-C_1$ - C_6 -alkyl- C_3 - C_8 -cycloalkyle ;
 U^2_a étant un atome de brome, un atome d'iode, un groupe mésylate, un groupe tosylate ou un groupe triflate, R^4 étant choisi dans le groupe constitué par un atome d'hydrogène, C_1 - C_6 -alkyle, aralkyle, aralkyle substitué par hydroxyle, C_1 - C_6 -alkyle substitué par un C_1 - C_6 -alkylsulfanyle et R^5 étant un atome d'hydrogène lorsque R^6 est un atome d'hydrogène ou C_1 - C_6 -alkyle ; et étant entendu que lorsque R^1 et R^2 sont des atomes de brome, U^2_a n'est pas un atome de brome.

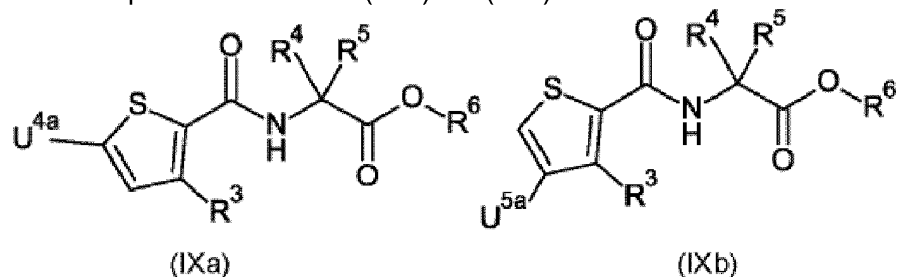
13. Composé de formule (VIIIa):



(VIIIa)

R^1 et R^2 étant identiques et étant un atome de chlore ou un atome de brome ;
 U^{1a} étant un groupe hydroxy ou un groupe C_1 - C_6 -alcoxy ; et
 U^{2a} étant un groupe mésylate, un groupe tosylate ou un groupe triflate.

14. Composé de formule (IXa) ou (IXb) :



R³ étant méthyle ;

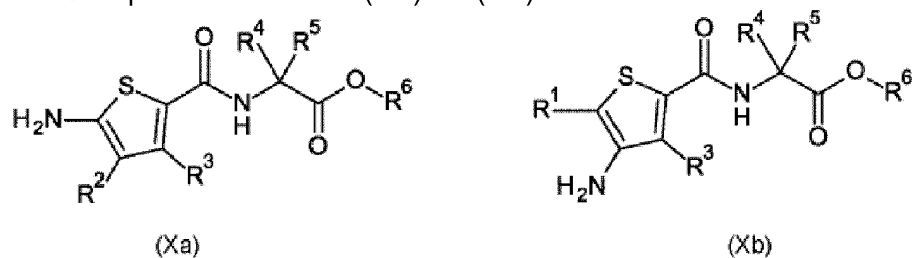
R⁴ étant choisi dans le groupe constitué par un atome d'hydrogène, C₁-C₆-alkyle, aralkyle, aralkyle substitué par hydroxyle, C₁-C₆-alkyle substitué par un C₁-C₆-alkylsulfanyle et R⁵ étant un atome d'hydrogène ; ou

R⁴ et R⁵ formant, conjointement avec l'atome de carbone auxquels ils sont liés, un cyclopropyle ; R⁶ étant choisi dans le groupe constitué par un atome d'hydrogène, C₁-C₆-alkyle, C₁-C₆-halogénoalkyle, C₁-C₆-cyanoalkyle, C₂-C₆-alcényle, C₂-C₆-alcynyle, C₃-C₈-cycloalkyle, aryle, aralkyle, hétérocyclyle à 4, 5 ou 6 chaînons, -C₁-C₆-alkyl-Si(C₁-C₆-alkyle)₃ et -C₁-C₆-alkyl-C₃-C₈-cycloalkyle ;

U^{4a} étant un atome de chlore ou un atome de brome ; et

U^{5a} étant un atome de chlore ou un atome de brome.

15. Composé de formule (Xa) ou (Xb) :



R¹ ou R² étant un atome de chlore ou un atome de brome ;

R³ étant méthyle ;

R⁴ étant choisi dans le groupe constitué par un atome d'hydrogène, C₁-C₆-alkyle, aralkyle, aralkyle substitué par hydroxyle, C₁-C₆-alkyle substitué par un C₁-C₆-alkylsulfanyle et R⁵ étant un atome d'hydrogène ; ou

R⁴ et R⁵ formant, conjointement avec l'atome de carbone auxquels ils sont liés, un cyclopropyle ; R⁶ étant choisi dans le groupe constitué par un atome d'hydrogène, C₁-C₆-alkyle, C₁-C₆-halogénoalkyle, C₁-C₆-cyanoalkyle, C₂-C₆-alcényle, C₂-C₆-alcynyle, C₃-C₈-cycloalkyle, aryle, aralkyle, hétérocyclyle à 4, 5 ou 6 chaînons, -C₁-C₆-alkyl-Si(C₁-C₆-alkyle)₃ et -C₁-C₆-alkyl-C₃-C₈-cycloalkyle ;

R⁴ étant choisi dans le groupe constitué par un atome d'hydrogène, C₁-C₆-alkyle, aralkyle, aralkyle substitué par hydroxyle, C₁-C₆-alkyle substitué par un C₁-C₆-alkylsulfanyle et R⁵ étant un atome d'hydrogène lorsque R⁶ est un atome d'hydrogène ou C₁-C₆-alkyle.