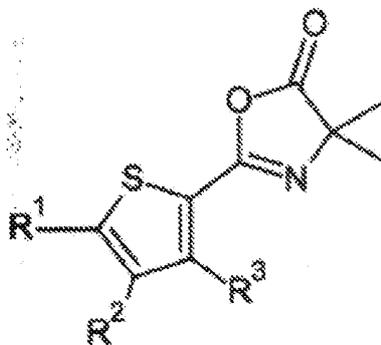


## (12) BREVET D'INVENTION

- (11) N° de publication : **MA 53086 B1**
- (51) Cl. internationale : **A01N 43/10; A01N 43/28;  
C07D 413/04; C07D 333/38;  
A01P 1/00**
- (43) Date de publication : **31.07.2024**
- 
- (21) N° Dépôt : **53086**
- (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/EP2019/067831 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**
- 
- (54) Titre : **THIOPHÈNECARBOXAMIDES SUBSTITUÉS ET ANALOGUES COMME AGENTS ANTIBACTÉRIENS**
- (57) Abrégé : La présente invention concerne des thiényloxazolones et des analogues de celles-ci de formule (III) qui peuvent être utilisées 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 (III) :

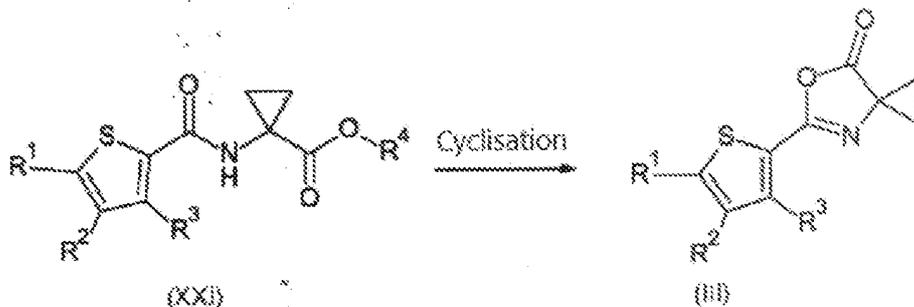


(III)

- 5            R<sup>1</sup> et R<sup>2</sup> étant identiques et étant un atome de brome  
              ou un atome de chlore ;  
              R<sup>3</sup> étant un atome de fluor, un atome de chlore, un  
              atome de brome, un atome d'iode ou un méthyle.
- 10    2.    Composé de formule (III) selon la revendication 1,  
          R<sup>3</sup> étant un atome de fluor, un atome de chlore ou un  
          méthyle.
3.    Composé de formule (III) selon la revendication 1,  
15            R<sup>3</sup> étant différent de R<sup>1</sup> et R<sup>2</sup>.
4.    Composition comprenant au moins un composé de  
          formule (III) selon l'une quelconque des  
          revendications précédentes et au moins un auxiliaire  
20            approprié sur le plan agricole.

5. Procédé pour la lutte contre des maladies bactériennes comprenant l'étape d'application d'au moins un composé de formule (III) selon l'une quelconque des revendications 1 à 3 ou d'une composition selon la revendication 4 sur les végétaux, les parties de végétaux, les semences, les fruits ou sur le sol dans lequel les végétaux poussent.

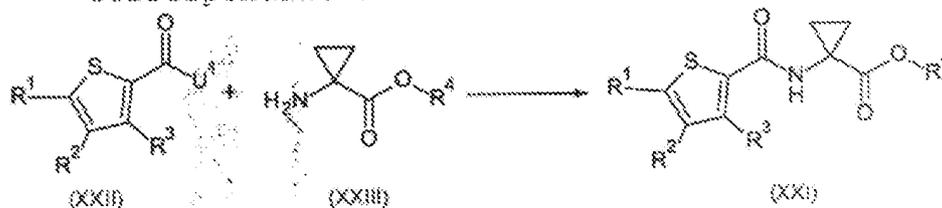
6. Procédé pour la préparation d'un composé de formule (III) selon la revendication 1, 2 ou 3 comprenant l'étape de réalisation de la cyclisation d'un composé de formule (XXI) ou d'un sel correspondant pour fournir un composé de formule (III) :



R<sup>4</sup> étant un atome d'hydrogène ;  
R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> et R<sup>3</sup> étant tels que décrits dans la revendication 1, 2 ou 3.

7. Procédé selon la revendication 6 comprenant les étapes de :

(a) mise en réaction d'un composé de formule (XXII) avec un composé de formule (XXIII) ou un sel correspondant :



Procédé ExxI(1)

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> et R<sup>3</sup> étant tels que décrits dans la revendication 1, 2 ou 3 ;

R<sup>4</sup> étant un atome d'hydrogène ou C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyle ;

et

$U^1$  étant un atome d'halogène, un groupe hydroxy ou un groupe  $C_1-C_6$ -alcoxy ;

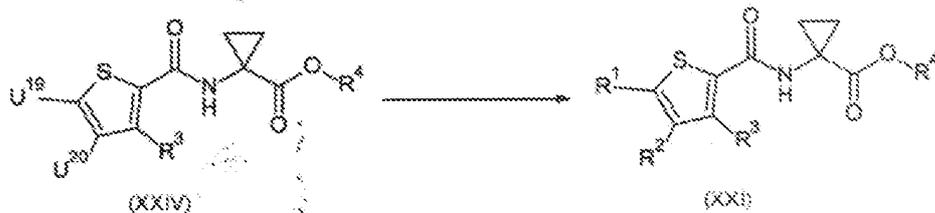
pour fournir un composé de formule (XXI) tel que décrit dans la revendication 6 lorsque

$R^5$  est un atome d'hydrogène ;

(b) réalisation d'une hydrolyse du composé obtenu dans l'étape (a) lorsque  $R^4$  est un  $C_1-C_6$ -alkyle pour fournir un composé de formule (XXI) tel que décrit dans la revendication 6.

8. Procédé selon la revendication 6 comprenant l'étape ou les étapes de :

(a) réalisation d'une diazotation d'un composé de formule (XXIV) suivie par une substitution aromatique :



$R^1$ ,  $R^2$  et  $R^3$  étant tels que décrits dans la revendication 1, 2 ou 3 ;

$R^4$  étant un atome d'hydrogène ou  $C_1-C_6$ -alkyle ;

$U^{19}$  étant un groupe amino, un atome de chlore ou un atome de brome et  $U^{20}$  étant un groupe amino, un atome de chlore ou un atome de brome ;

étant entendu qu'au moins l'un parmi  $U^{19}$  ou  $U^{20}$  est un groupe amino ;

pour fournir un composé de formule (XXI) tel que décrit dans la revendication 6 lorsque  $R^5$  est un atome d'hydrogène ;

(b) réalisation d'une hydrolyse du composé obtenu dans l'étape (a) lorsque  $R^4$  est un  $C_1-C_6$ -alkyle pour fournir un composé de formule (XXI) tel que décrit dans la revendication 6.

9. Procédé selon la revendication 8 comprenant l'étape de mise en réaction d'un composé de formule (XXVI)

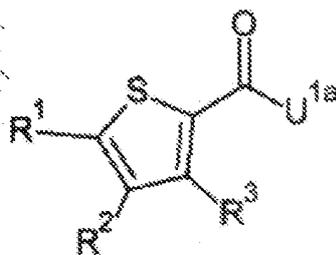


R<sup>1</sup> et R<sup>2</sup> étant identiques et étant un atome de brome ou un atome de chlore ;

R<sup>3</sup> étant un atome de fluor, un atome de chlore, un atome de brome, un atome d'iode ou un méthyle ; et

5 R<sup>4</sup> étant un atome d'hydrogène ou un C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyle.

12. Composé de formule (XXIIa) :



(XXIIa)

R<sup>1</sup> et R<sup>2</sup> étant identiques et étant un atome de brome ou un atome de chlore ;

10

R<sup>3</sup> étant un atome de fluor, un atome de chlore, un atome de brome, un atome d'iode ou un méthyle ; et

U<sup>1a</sup> étant un groupe hydroxy ou un groupe C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alcoxy ;

15

étant entendu que R<sup>3</sup> n'est pas un atome de chlore lorsque R<sup>1</sup> et R<sup>2</sup> sont des atomes de chlore ; et étant entendu que le composé de formule (XXIIa) ne représente pas :

20

- 4,5-dichloro-3-fluorothiophène-2-carboxylate de méthyle [2166596-88-7],

- acide 4,5-dichloro-3-fluorothiophène-2-carboxylique [2166596-87-6],

- 4,5-dibromo-3-fluorothiophène-2-carboxylate d'éthyle [2260624-98-2],

25

- acide 4,5-dibromo-3-fluorothiophène-2-carboxylique [1628447-64-2],

- 4,5-dibromo-3-chlorothiophène-2-carboxylate de méthyle [1501789-47-4],

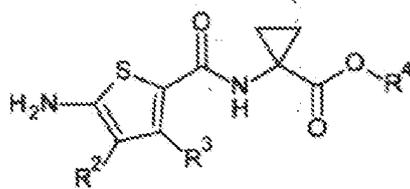
30

- acide 4,5-dibromo-3-iodothiophène-2-carboxylique [854626-46-3],

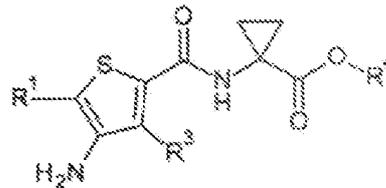
- acide 4,5-dibromo-3-chlorothiophène-2-carboxylique [503308-99-4],

- 4,5-dibromo-3-chlorothiophène-2-carboxylate d'éthyle [503308-98-3],
- 4,5-dibromo-3-fluorothiophène-2-carboxylate de méthyle [395664-58-1],
- 5 - 3,4,5-tribromothiophène-2-carboxylate de tert-butyle [62224-27-5],
- 3,4,5-tribromothiophène-2-carboxylate d'éthyle [54113-44-9],
- acide 3,4,5-tribromothiophène-2-carboxylique
- 10 [53317-05-8],
- 3,4,5-tribromothiophène-2-carboxylate de méthyle [24647-80-1],
- 4,5-dibromo-3-méthylthiophène-2-carboxylate d'éthyle [2088297-63-8],
- 15 - acide 4,5-dichloro-3-méthylthiophène-2-carboxylique [854626-34-9],
- acide 4,5-dibromo-3-méthylthiophène-2-carboxylique [854626-32-7],
- 4,5-dichloro-3-méthylthiophène-2-carboxylate de
- 20 méthyle [854626-27-0], et
- 4,5-dibromo-3-méthylthiophène-2-carboxylate de méthyle [648412-53-7].

13. Composé de formule (XXIVa) ou (XXIVb) :



(XXIVa)



(XXIVb)

25

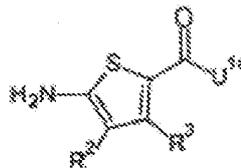
R<sup>1</sup> ou R<sup>2</sup> étant un atome de brome ou un atome de chlore ;

R<sup>3</sup> étant un atome de fluor, un atome de chlore, un atome de brome, un atome d'iode ou un méthyle ; et

30

R<sup>4</sup> étant un atome d'hydrogène ou un C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyle.

14. Composé de formule (XXVIa) :

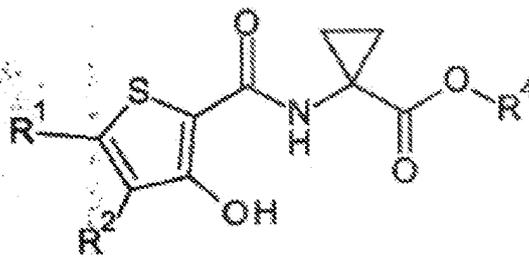


(XXVIa)

R<sup>2</sup> étant un atome de brome ou un atome de chlore ;  
 R<sup>3</sup> étant un atome de fluor, un atome de chlore, un  
 atome de brome, un atome d'iode ou un méthyle ; et  
 U<sup>3</sup> étant un groupe hydroxy ou un groupe C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-  
 alcoxy ;  
 étant entendu que le composé de formule (XXVIa) ne  
 représente pas :

- 5-amino-4-bromo-3-méthylthiophène-2-carboxylate  
 d'éthyle [851443-15-7].

15. Composé de formule (XXXV) :



(XXXV)

R<sup>1</sup> et R<sup>2</sup> étant identiques et étant un atome de brome  
 ou un atome de chlore ;  
 R<sup>4</sup> étant un atome d'hydrogène ou un C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyle.