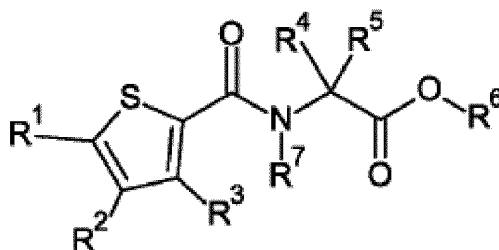


## (12) BREVET D'INVENTION

- (11) N° de publication : **MA 53089 B1**
- (51) Cl. internationale : **A01N 43/10; C07D 333/38;  
A01P 1/00; A01N 43/28**
- (43) Date de publication : **30.11.2022**
- 
- (21) N° Dépôt : **53089**
- (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/EP2019/067827 03.07.2019**
- (71) Demandeur(s) : **Bayer Aktiengesellschaft, Kaiser-Wilhelm-Allee 1 51373 Leverkusen (DE)**
- (72) Inventeur(s) : **COQUERON, Pierre-Yves ; 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: **EP19741976.5**
- 
- (54) Titre : **THIOPHÈNECARBOXAMIDES SUBSTITUÉS ET ANALOGUES COMME AGENTS ANTIBACTÉRIENS**
- (57) Abrégé : La présente invention concerne des thiophène carboxamides substitués et des analogues de ceux-ci de formule (II) 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.

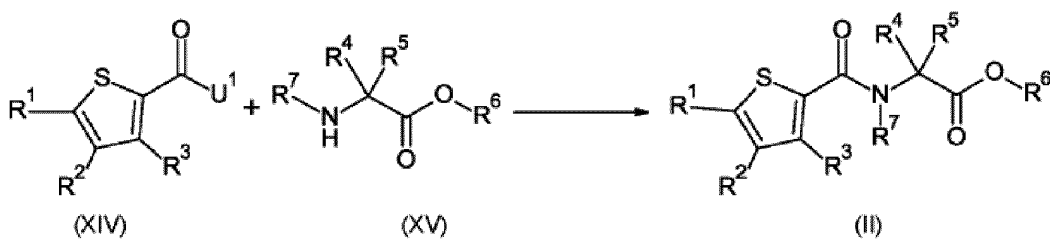
## Revendications

1. Composé de formule (II) :



- 5  $R^1$ ,  $R^2$  et  $R^3$  étant un atome de chlore ;  
 $R^4$  étant choisi dans le groupe constitué par un atome  
d'hydrogène, 2-méthylpropyle, 1-méthylpropyle,  
cyclopropyle, cyclopropyle substitué par C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-  
alcényle, aralkyle et aralkyle substitué par  
10 hydroxyle et  $R^5$  étant un atome d'hydrogène ; ou  
 $R^4$  et  $R^5$  formant, conjointement avec l'atome de  
carbone auquel ils sont liés, un cyclopropyle ;  
 $R^6$  étant choisi dans le groupe constitué par un atome  
d'hydrogène, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyle, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-halogénoalkyle, C<sub>1</sub>-  
15 C<sub>6</sub>-cyanoalkyle, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alcényle, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alcynyle, C<sub>3</sub>-  
C<sub>8</sub>-cycloalkyle, aryle, aralkyle, -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl-Si(C<sub>1</sub>-  
C<sub>6</sub>-alkyle)<sub>3</sub> et -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cycloalkyle ;  
 $R^7$  étant un atome d'hydrogène ou un C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyle.
- 20 2. Composé de formule (II) selon la revendication 1,  
 $R^6$  étant choisi dans le groupe constitué par un atome  
d'hydrogène, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyle, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-halogénoalkyle, C<sub>1</sub>-  
C<sub>6</sub>-cyanoalkyle, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alcényle, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alcynyle,  
cyclopropyle, phényle, benzyle, -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl-Si(C<sub>1</sub>-  
25 C<sub>6</sub>-alkyle)<sub>3</sub> et -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl-cyclopropyle.

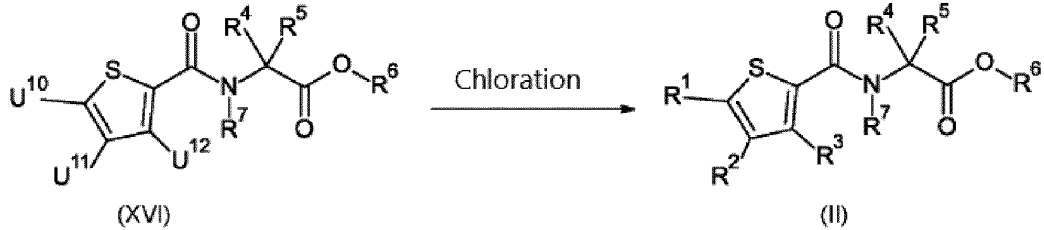
3. Composé de formule (II) selon la revendication 1 ou 2, R<sup>7</sup> étant un atome d'hydrogène ou un méthyle.
- 5 4. Composé de formule (II) selon l'une quelconque des revendications précédentes, R<sup>4</sup> étant un atome d'hydrogène ou isobutyle.
- 10 5. Composé de formule (II) selon la revendication 1, 2 ou 3, R<sup>4</sup> et R<sup>5</sup> formant, conjointement avec l'atome de carbone auquel ils sont liés, un cyclopropyle.
- 15 6. Composition comprenant au moins un composé de formule (II) selon l'une quelconque des revendications précédentes et au moins un auxiliaire approprié sur le plan agricole.
- 20 7. Procédé pour la lutte contre des maladies bactériennes comprenant l'étape d'application d'au moins un composé de formule (II) selon l'une quelconque des revendications 1 à 5 ou d'une composition selon la revendication 6 aux végétaux, aux parties de végétaux, aux semences, aux fruits ou sur le sol dans lequel les végétaux poussent.
- 25 8. Procédé pour la préparation d'un composé de formule (II) selon l'une quelconque des revendications 1 à 5 comprenant l'étape de mise en réaction d'un composé de formule (XIV) ou d'un sel correspondant avec un composé de formule (XV) ou un sel correspondant :
- 30



R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> et R<sup>7</sup> étant tels que décrits dans les revendications 1 à 5 ;

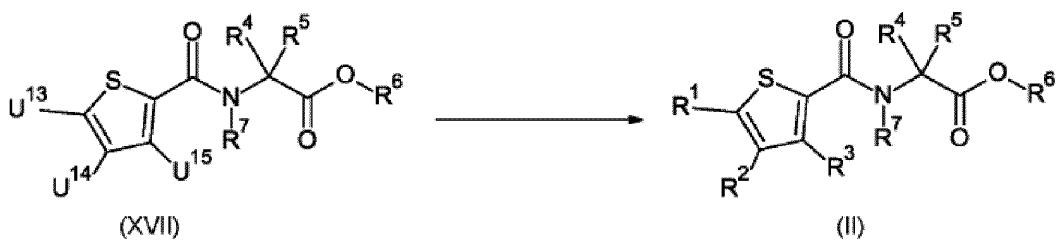
$U^1$  étant un atome d'halogène, un groupe hydroxy ou un groupe  $C_1$ - $C_6$ -alcoxy.

9. Procédé pour la préparation d'un composé de formule (II) selon l'une quelconque des revendications 1 à 5 comprenant l'étape de réalisation d'une réaction de chloration sur un composé de formule (XVI)



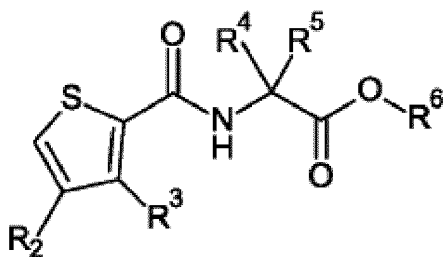
- $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  et  $R^7$  étant tels que décrits dans les revendications 1 à 5 ;  
 $U^{10}$ ,  $U^{11}$  et  $U^{12}$  étant indépendamment un atome d'hydrogène ou un atome de chlore ;  
 étant entendu qu'au moins l'un parmi  $U^{10}$ ,  $U^{11}$  et  $U^{12}$  est un atome d'hydrogène.

10. Procédé pour la préparation d'un composé de formule (II) selon l'une quelconque des revendications 1 à 5 comprenant l'étape de réalisation d'une diazotation d'un composé de formule (XVII) ou d'un sel correspondant suivie par une substitution aromatique :

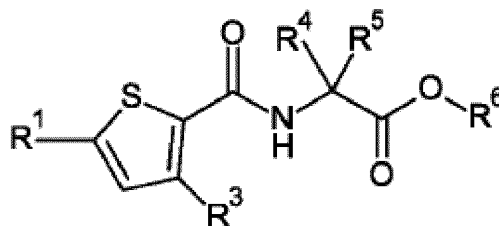


- $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  et  $R^7$  étant tels que décrits dans les revendications 1 à 5 ;  
 $U^{13}$ ,  $U^{14}$  et  $U^{15}$  étant indépendamment un groupe amino ou un atome de chlore ;  
 étant entendu qu'au moins l'un parmi  $U^{13}$ ,  $U^{14}$  et  $U^{15}$  est un groupe amino.

11. Composé de formule (XVIa) ou (XVIb) :



(XVIa)



(XVIb)

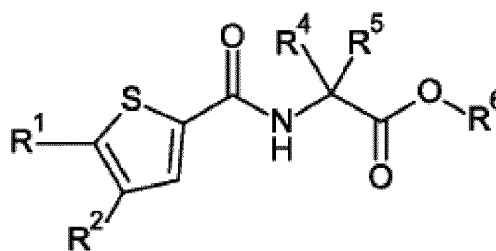
$R^1$ ,  $R^2$  et  $R^3$  étant un atome de chlore ;

$R^4$  étant choisi dans le groupe constitué par un atome d'hydrogène, 2-méthylpropyle, 1-méthylpropyle, cyclopropyle, cyclopropyle substitué par C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alcényle, aralkyle et aralkyle substitué par hydroxyle et  $R^5$  étant un atome d'hydrogène ; ou

$R^4$  et  $R^5$  formant, conjointement avec l'atome de carbone auquel ils sont liés, un cyclopropyle ;

$R^6$  étant choisi dans le groupe constitué par un atome d'hydrogène, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyle, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-halogénoalkyle, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-cyanoalkyle, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alcényle, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alcynyle, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cycloalkyle, aryle, aralkyle, -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl-Si(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyle)<sub>3</sub> et -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cycloalkyle.

12. Composé de formule (XVIc) :



(XVIc)

$R^1$ ,  $R^2$  étant un atome de chlore ;

$R^4$  étant choisi dans le groupe constitué par un atome d'hydrogène, 2-méthylpropyle, 1-méthylpropyle, cyclopropyle, cyclopropyle substitué par C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alcényle, aralkyle et aralkyle substitué par hydroxyle et  $R^5$  étant un atome d'hydrogène ; ou

$R^4$  et  $R^5$  formant, conjointement avec l'atome de carbone auquel ils sont liés, un cyclopropyle ;

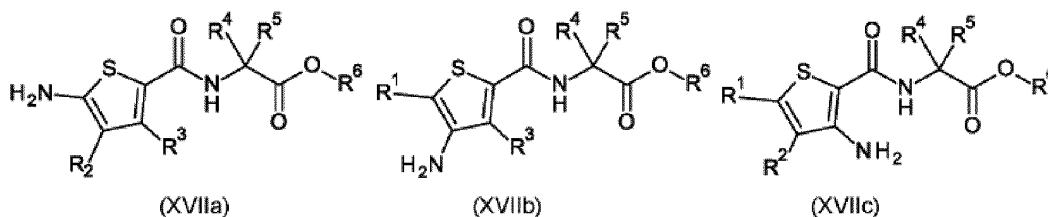
$R^6$  étant choisi dans le groupe constitué par un atome d'hydrogène, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyle, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-halogénoalkyle, C<sub>1</sub>-

C<sub>6</sub>-cyanoalkyle, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alcényle, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alcynyle, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cycloalkyle, aryle, aralkyle, -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl-Si(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyle)<sub>3</sub> et -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cycloalkyle ;

étant entendu que le composé de formule (XVIc) ne représente pas :

- 5  
- N-[(4,5-dichloro-2-thiényle)carbonyl]glycine [138326-45-1],  
- N-[(4,5-dichloro-2-thiényle)carbonyl]isoleucine [138326-47-3],  
10 - N-[(4,5-dichloro-2-thiényle)carbonyl]leucine [138326-54-2],  
- N-[(4,5-dichloro-2-thiényle)carbonyl]leucinate de méthyle [138326-32-6],  
- N-[(4,5-dichloro-2-thiényle)carbonyl]isoleucinate de méthyle [138326-33-7],  
15 - N-[(4,5-dichloro-2-thiényle)carbonyl]valinate de 2,2,2-trifluoroéthyle [138326-35-9],  
- N-[(4,5-dichloro-2-thiényle)carbonyl]leucinate de 2,2,2-trifluoroéthyle [138326-36-0], et  
20 - N-[(4,5-dichloro-2-thiényle)carbonyl]isoleucinate de 2,2,2-trifluoroéthyle [138326-37-1].

13. Composé de formule (XVIIa), (XVIIb) ou (XVIIc) :



- 25 R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> et R<sup>3</sup> étant un atome de chlore ;  
R<sup>4</sup> étant choisi dans le groupe constitué par un atome d'hydrogène, 2-méthylpropyle, 1-méthylpropyle, cyclopropyle, cyclopropyle substitué par C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alcényle, aralkyle et aralkyle substitué par  
30 hydroxyle et R<sup>5</sup> étant un atome d'hydrogène ; ou  
R<sup>4</sup> et R<sup>5</sup> formant, conjointement avec l'atome de carbone auquel ils sont liés, un cyclopropyle ;  
R<sup>6</sup> étant choisi dans le groupe constitué par un atome d'hydrogène, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyle, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-halogénoalkyle, C<sub>1</sub>-  
35 C<sub>6</sub>-cyanoalkyle, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alcényle, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alcynyle, C<sub>3</sub>-

- 6 -

C<sub>8</sub>-cycloalkyle, aryle, aralkyle, -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl-Si(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyle)<sub>3</sub> et -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl- C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cycloalkyle ;

5 R<sup>4</sup> étant choisi dans le groupe constitué par un atome d'hydrogène, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyle, aralkyle, aralkyle substitué par hydroxyle, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyle substitué par un C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylsulfanyle et R<sup>5</sup> étant un atome d'hydrogène lorsque R<sup>6</sup> est un atome d'hydrogène ou C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyle.