

(12) BREVET D'INVENTION

(11) N° de publication : **MA 58017 B1** (51) Cl. internationale : **C07D 409/12**

(43) Date de publication :
29.11.2024

(21) N° Dépôt :
58017

(22) Date de Dépôt :
17.12.2020

(30) Données de Priorité :
20.12.2019 EP 19218423

(86) Données relatives à la demande internationale selon le PCT:
PCT/EP2020/086743 17.12.2020

(71) Demandeur(s) :
Bayer Aktiengesellschaft, Kaiser-Wilhelm-Allee 1 51373 Leverkusen (DE)

(72) Inventeur(s) :
BRUNET, Stephane ; KNOBLOCH, Thomas ; NICOLAS, Lionel ; DUFOUR, Jeremy ; LAMPRECHT, Sybille

(74) Mandataire :
TOUNINA CONSTLING

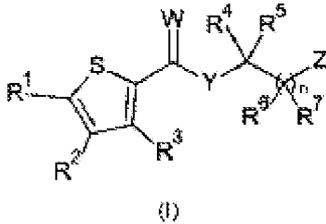
(86) N° de dépôt auprès de l'organisme de validation :20838409.9

(54) Titre : **THIOPHENE CARBOXAMIDES SUBSTITUES ET SES DÉRIVÉS COMME DES AGENTS MICROBIOCIDES**

(57) Abrégé : La présente invention concerne des dérivés de thiophène carboxamides substitués, leur utilisation pour lutter contre des micro-organismes phytopathogènes et des compositions les comprenant.

Revendications

1. Composé de formule (I) :



R¹ et R² étant identiques et étant chlore ou brome ;

R³ étant méthyle ;

R⁴ et R⁵ étant choisis indépendamment l'un de l'autre dans le groupe constitué par hydrogène, halogène, cyano, hydroxyle, C₁-C₆-alkyle, C₁-C₆-hydroxyalkyle, C₁-C₆-alcoxy, C₁-C₆-halogénoalkyle, -O-C(=O)-C₁-C₆-alkyle, C₃-C₆-carbocycle, hétérocyclyle non aromatique à 4, 5 ou 6 chaînons, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH(C₁-C₆-alkyle), -C(=O)-N(C₁-C₆-alkyle)₂, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-C₁-C₆-alkyle, aryle, hétéroaryle à 5 à 9 chaînons, -C₁-C₆-alkyl-C₁-C₆-alcoxy, -C₁-C₆-alkyl-C₁-C₆-halogénoalkyle, -C₁-C₆-alkyl-C₃-C₆-carbocycle, -C₁-C₆-alkyl-hétérocyclyle non aromatique à 4, 5 ou 6 chaînons, -C₁-C₆-alkyl-aryle, -C₁-C₆-alkyl-hydroxyaryle, -C₁-C₆-alkyl-hétéroaryle à 5 à 9 chaînons, -C₁-C₆-alkyl-S-C₁-C₆-alkyle, -C₁-C₆-alkyl-S-C(=O)-C₁-C₆-alkyle, -C₁-C₆-alkyl-O-(C=O)-C₁-C₆-alkyle, -C₁-C₆-alkyl-C(=O)-NH₂, -C₁-C₆-alkyl-C(=O)-NH(C₁-C₆-alkyle), -C₁-C₆-alkyl-C(=O)-N(C₁-C₆-alkyle)₂, -C₁-C₆-alkyl-C(=O)-OH, -C₁-C₆-alkyl-C(=O)-O-C₁-C₆-alkyle, -C₁-C₆-alkyl-NH-C(=NH)-NH₂, -S-C₁-C₆-alkyle, -S-C(=O)-C₁-C₆-alkyle, -S-C(=O)-O-C₁-C₆-alkyle, -S-C(=S)-O-C₁-C₆-alkyle, -S-C(=O)-S-C₁-C₆-alkyle, -S-C(=O)-NH₂, -S-C(=O)-NH(C₁-C₆-alkyle), -S-C(=O)-NH(C₁-C₆-alkyle)₂, -S-C(=S)-NH₂, -S-C(=S)-NH(C₁-C₆-alkyle), -S-C(=S)-NH(C₁-C₆-alkyle)₂, -C₁-C₆-alkyl-S-C(=O)-O-C₁-C₆-alkyle, -C₁-C₆-alkyl-S-C(=O)-S-C₁-C₆-alkyle, -C₁-C₆-alkyl-S-C(=O)-NH₂, -C₁-C₆-alkyl-S-C(=O)-NH(C₁-C₆-alkyle), -C₁-C₆-alkyl-S-C(=O)-NH(C₁-C₆-alkyle)₂, -C₁-C₆-alkyl-S-C(=S)-NH₂, -C₁-C₆-alkyl-S-C(=S)-NH(C₁-C₆-alkyle), -C₁-C₆-alkyl-S-C(=S)-NH(C₁-C₆-alkyle)₂ ; des radicaux R⁴, R⁵ acycliques pouvant être substitués par un ou plusieurs substituants R^w, des radicaux R⁴, R⁵ cycliques pouvant être substitués par un ou plusieurs substituants R^x, au moins l'un parmi R⁴ et R⁵ étant hydrogène, C₁-C₆-alkyle ou C₃-C₆-carbocycle, ou R⁴ et R⁵ formant ensemble avec l'atome de carbone auxquels ils sont fixés un carbonyle, un thiocarbonyle, un C₃-C₆-carbocycle ou un hétérocycle à 3 à 6 chaînons, lesdits C₃-C₆-carbocycle et hétérocycle à 3 à 6 chaînons pouvant être substitués par un ou plusieurs substituants R^x, R^w étant indépendamment choisi dans le groupe constitué par nitro, hydroxyle, cyano, carboxyle, amino, sulfanyle, pentafluoro-λ⁶-sulfanyle, formyle, carbamoyle, carbamate, C₃-C₇-cycloalkyle, C₃-C₇-halogénocycloalkyle ayant 1 à 5 atomes d'halogène, C₁-C₈-alkylamino, di-C₁-C₈-alkylamino, C₁-C₈-alcoxy, C₁-C₈-halogénoalcoxy ayant 1 à 5 atomes d'halogène, C₁-C₈-alkylsulfanyle, C₁-C₈-halogénoalkylsulfanyle ayant 1 à 5 atomes d'halogène, C₁-C₈-alkylcarbonyle, C₁-C₈-halogénoalkylcarbonyle ayant 1 à 5 atomes d'halogène, C₁-C₈-alkylcarbamoyle, di-C₁-C₈-alkylcarbamoyle, C₁-C₈-alcoxycarbonyle, C₁-C₈-halogénoalcoxycarbonyle ayant 1 à 5 atomes d'halogène, C₁-C₈-alkylcarbonyloxy, C₁-C₈-halogénoalkylcarbonyloxy ayant 1 à 5 atomes

d'halogène, C₁-C₈-alkylcarbonylamino, C₁-C₈-halogénoalkylcarbonylamino ayant 1 à 5 atomes d'halogène, C₁-C₈-alkylsulfinyle, C₁-C₈-halogénoalkylsulfinyle ayant 1 à 5 atomes d'halogène, C₁-C₈-alkyl-sulfonyle, C₁-C₈-halogénoalkylsulfonyle ayant 1 à 5 atomes d'halogène ; C₁-C₈-alkylsulfonylamino, C₁-C₈-halogénoalkylsulfonylamino ayant 1 à 5 atomes d'halogène ; sulfamoyle ; C₁-C₈-alkylsulfamoyle et di-C₁-C₈-alkylsulfamoyle, R^x étant indépendamment choisi dans le groupe constitué par halogène, nitro, hydroxyle, cyano, carboxyle, amino, sulfanyle, pentafluoro-λ⁶-sulfanyle, formyle, carbamoyle, carbamate, C₁-C₈-alkyle, C₃-C₇-cycloalkyle, C₁-C₈-halogénoalkyle ayant 1 à 5 atomes d'halogène, C₃-C₇-halogénocycloalkyle ayant 1 à 5 atomes d'halogène, C₂-C₈-alkenyle, C₂-C₈-alkynyle, C₁-C₈-alkylamino, di-C₁-C₈-alkylamino, C₁-C₈-alcoxy, C₁-C₈-halogénoalcoxy ayant 1 à 5 atomes d'halogène, C₁-C₈-alkylsulfanyle, C₁-C₈-halogénoalkylsulfanyle ayant 1 à 5 atomes d'halogène, C₁-C₈-alkylcarbonyle, C₁-C₈-halogénoalkylcarbonyle ayant 1 à 5 atomes d'halogène, C₁-C₈-alkylcarbamoyle, di-C₁-C₈-alkylcarbamoyle, C₁-C₈-alcoxycarbonyle, C₁-C₈-halogénoalcoxycarbonyle ayant 1 à 5 atomes d'halogène, C₁-C₈-alkylcarbonyloxy, C₁-C₈-halogénoalkylcarbonyloxy ayant 1 à 5 atomes d'halogène, C₁-C₈-alkylcarbonylamino, C₁-C₈-halogénoalkylcarbonylamino ayant 1 à 5 atomes d'halogène, C₁-C₈-alkylsulfanyle, C₁-C₈-halogénoalkylsulfanyle ayant 1 à 5 atomes d'halogène, C₁-C₈-alkylsulfinyle, C₁-C₈-halogénoalkylsulfinyle ayant 1 à 5 atomes d'halogène, C₁-C₈-alkylsulfonyle, C₁-C₈-halogénoalkylsulfonyle ayant 1 à 5 atomes d'halogène ; C₁-C₈-alkylsulfonylamino, C₁-C₈-halogénoalkylsulfonylamino ayant 1 à 5 atomes d'halogène ; sulfamoyle ; C₁-C₈-alkylsulfamoyle et di-C₁-C₈-alkylsulfamoyle ;

R⁶ et R⁷ étant indépendamment choisis dans le groupe constitué par hydrogène, C₁-C₆-alkyle, C₃-C₆-carbocycle ; ou R⁶ et R⁷ formant ensemble avec l'atome de carbone auxquels ils sont fixés un C₃-C₆-carbocycle ou un hétérocycle à 3 à 6 chaînons ;

n étant 0 ou 1 ;

W étant oxygène ou soufre ;

Y étant NR⁸, R⁸ étant hydrogène, C₁-C₆-alkyle, C₁-C₆-halogénoalkyle, C₁-C₆-cyanoalkyle, hydroxy, C₁-C₆-alcoxy ou C₃-C₆-carbocycle ;

Z étant choisi dans le groupe constitué par cyano, -C(=O)-OR^a, -C(=O)-SR^a, -C(=O)-NR^bR^c, -C(=S)-NR^bR^c ou -C(=O)-NH-CR^dR^e-C(=O)-OR^a, R^a étant choisi dans le groupe constitué par hydrogène, C₁-C₆-alkyle, C₁-C₆-halogénoalkyle, C₁-C₆-cyanoalkyle, C₂-C₆-alkenyle, C₂-C₆-alkynyle, C₃-C₈-cycloalkyle, aryle, aralkyle, hétérocyclyle non aromatique à 4, 5 ou 6 chaînons, -C₁-C₆-alkyl-Si(C₁-C₆-alkyl)₃, -C₁-C₆-alkyl-C₃-C₈-cycloalkyle, hétéroaryle à 5 à 9 chaînons et -C₁-C₆-alkyl-hétéroaryle à 5 à 9 chaînons, ou R^a pouvant former conjointement avec R⁴ et avec les atomes auxquels sont fixés, un hétérocycle à 4 à 7 chaînons, R^b et R^c étant indépendamment choisi dans le groupe constitué par hydrogène, C₁-C₆-alkyle, hydroxyle, C₁-C₆-alcoxy, cyano, C₁-C₆-cyanoalkyle, ou R^b pouvant former conjointement avec R⁴ et avec les atomes auxquels sont fixés, un hétérocycle à 4 à 7 chaînons, R^d et R^e étant indépendamment choisi dans le groupe constitué par hydrogène, cyano, hydroxyle, C₁-C₆-alkyle, C₁-C₆-hydroxyalkyle, C₁-C₆-alcoxy, -O-C(=O)-C₁-C₆-alkyle, C₃-C₆-carbocycle, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH(C₁-C₆-alkyle), -C(=O)-N(C₁-C₆-alkyle)₂, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-C₁-C₆-alkyle, aryle,

hétéroaryle à 5 à 9 chaînons, -C₁-C₆-alkyl-C₁-C₆-alcoxy, -C₁-C₆-alkyl-C₃-C₆-carbocycle, -C₁-C₆-alkyl-aryle, -C₁-C₆-alkyl-hydroxyaryle, -C₁-C₆-alkyl-hétéroaryle à 5 à 9 chaînons, -C₁-C₆-alkyl-S-C₁-C₆-alkyle, -C₁-C₆-alkyl-S-C(=O)-C₁-C₆-alkyle, -C₁-C₆-alkyl-O-(C=O)-C₁-C₆-alkyle, -C₁-C₆-alkyl-C(=O)-NH₂, -C₁-C₆-alkyl-C(=O)-NH(C₁-C₆-alkyle), -C₁-C₆-alkyl-C(=O)-N(C₁-C₆-alkyle)₂, -C₁-C₆-alkyl-C(=O)-OH, -C₁-C₆-alkyl-C(=O)-O-C₁-C₆-alkyle, -C₁-C₆-alkyl-NH-C(=NH)-NH₂, au moins l'un parmi R^d et R^e étant hydrogène, C₁-C₆-alkyle ou C₃-C₆-carbocycle, ou R^d et R^e formant ensemble avec l'atome de carbone auxquels ils sont fixés un carbonyle, C₃-C₆-carbocycle, ou un hétérocycle à 3 à 6 chaînons ;

si W est oxygène, et Y est NH, et n = 0, et R⁴ est choisi dans le groupe constitué par hydrogène, C₁-C₆-alkyle, -C₁-C₆-alkyl-aryle, -C₁-C₆-alkyl-hydroxyaryle, -C₁-C₆-alkyl-S-C₁-C₆-alkyle et R⁵ est hydrogène, ou R⁴ et R⁵ forment ensemble avec l'atome de carbone auxquels ils sont fixés un cyclopropyle, alors Z choisi dans le groupe constitué par cyano, -C(=O)-SR^a, -C(=O)-NR^bR^c, -C(=S)-NR^bR^c, -C(=O)-NH-CR^dR^e-C(=O)-OR^a ; à condition que {[(4,5-dibromo-3-méthyl-2-thiényl)carbonyl]amino} (phényl)acétate d'éthyle et {[(4,5-dichloro-3-méthyl-2-thiényl)carbonyl]amino} (phényl)acétate d'éthyle soient exclus.

2. Composé selon la revendication 1, R¹ et R² étant chlore, et R³ étant un méthyle.

3. Composé selon la revendication 1, R¹ et R² étant brome, et R³ étant un méthyle.

4. Composé selon l'une quelconque des revendications 1 à 3, R⁴ et R⁵ étant choisis indépendamment l'un de l'autre dans le groupe constitué par hydrogène, C₁-C₆-alkyle, C₁-C₆-hydroxyalkyle, C₃-C₆-carbocycle, aryle, -C₁-C₆-alkyl-C₁-C₆-alcoxy, -C₁-C₆-alkyl-C₃-C₆-carbocycle, C₁-C₆-alkyl-O-(C=O)-C₁-C₆-alkyle, -C₁-C₆-alkyl-C(=O)-OH ; -C₁-C₆-alkyl-aryle, -C₁-C₆-alkyl-S-C₁-C₆-alkyle, des radicaux R⁴, R⁵ acycliques pouvant être substitués par un ou plusieurs substituants R^w, des radicaux R⁴, R⁵ acycliques pouvant être substitués par un ou plusieurs substituants R^w, des radicaux R⁴, R⁵ cycliques pouvant être substitués par un ou plusieurs substituants R^x, ou R⁴ et R⁵ forment ensemble avec l'atome de carbone auxquels ils sont fixés un C₃-C₆-carbocycle ou un hétérocycle à 3 à 6 chaînons, lesdits C₃-C₆-carbocycle et hétérocycle à 3 à 6 chaînons pouvant être substitués par un ou plusieurs substituants R^x.

5. Composé selon l'une quelconque des revendications 1 à 4, W étant oxygène.

6. Composé selon l'une quelconque des revendications 1 à 5, Y étant NR⁸, R⁸ étant C₁-C₆-alkyle, C₁-C₆-halogénoalkyle, C₁-C₆-cyanoalkyle, hydroxy, C₁-C₆-alcoxy ou C₃-C₆-carbocycle, et où, et Y étant préférablement NR⁸, R⁸ étant hydrogène.

7. Composé selon l'une quelconque des revendications 1 à 6, Z étant choisi dans le groupe constitué par cyano, -C(=O)-SR^a, -C(=O)-NR^bR^c, -C(=S)-NR^bR^c ou -C(=O)-NH-CR^dR^e-C(=O)-OR^a ; et Z étant préférablement Z étant -C(=O)-OR^a.

8. Composition comprenant au moins un composé de formule (I) selon l'une quelconque des revendications 1 à 7 et au moins un auxiliaire approprié sur le plan

agricole.

9. Procédé pour la lutte contre des maladies bactériennes et/ou bactériennes dans des végétaux comprenant l'étape d'application d'au moins un composé de formule (I) selon l'une quelconque des revendications 1 à 7 ou d'une composition selon la revendication 8 sur les végétaux, les parties de végétaux, les graines, les fruits ou sur le sol dans lequel les végétaux poussent.

10. Utilisation d'un composé selon l'une quelconque des revendications 1 à 7 d'une composition selon la revendication 8 pour la lutte contre des maladies bactériennes et/ou fongiques sur des végétaux ou des parties de végétaux, le traitement du corps humain ou animal par thérapie étant exclu.