

A1

**DEMANDE
DE BREVET D'INVENTION**

(21)

N° 81 04212

(54)

Composés nouveaux de la classe des 3-amino-oxazolidin-2-ones.

(51)

Classification internationale (Int. Cl. ³). C 07 D 263/26 // A 01 N 43/76.

(22)

Date de dépôt..... 3 mars 1981.

(33) (32) (31)

Priorité revendiquée : *Italie, 7 septembre 1979, n° 25538 A/79.*

(41)

Date de la mise à la disposition du
public de la demande..... B.O.P.I. — « Listes » n° 28 du 10-7-1981.

(71)

Déposant : MONTEDISON SpA, résidant en Italie.

(72)

Invention de : Luigi Garlaschelli, Franco Gozzo et Luigi Mirena.

(73)

Titulaire : *Idem* (71)

(74)

Mandataire : Marc-Roger Hirsch, conseil en brevets,
34, rue de Bassano, 75008 Paris.

2° demande divisionnaire bénéficiant de la date de dépôt du 2 septembre 1980 de la
demande de brevet initiale n° 80 18915 (art. 14 de la loi du 2 janvier 1968 modifiée).

COMPOSES NOUVEAUX DE LA CLASSE DES 3-AMINO-OXAZOLIDIN-2-ONES

La présente invention a pour objet des composés nouveaux de la classe des 3-amino-oxazolidin-2-ones; ces composés sont pourvus d'une activité fongicide élevée, et présente une bonne compatibilité avec les plantes supérieures que l'on veut défendre contre les fungus ou champignons.

5 Les composés fongicides appartenant à la classe des N-phényl-1,3-oxazolidin-2,4-diones ont été décrits, par exemple, dans la demande de brevet néerlandais publiée No. 68/17249 (Sumitomo), dans le brevet français No. 2 172 295 (BASF), et dans la demande de brevet en Italie No. 20579 A/78 au nom de la Demanderesse.

10 On a décrit récemment l'activité bactéricide et fongicide de certains dérivés de l'aniline et de la glycine qui portent sur l'atome d'azote un radical phényle à substitutions diverses et un groupe acyle de nature variée.

15 Plus particulièrement, ce groupe acyle peut consister en un α ou β -haloalkanoyl (demande de brevet en République Fédérale d'Allemagne divulguée sous le No. 2 513 789 de CIBA-GEIGY), ou un groupe acétyle substitué en α par un atome de soufre ou d'oxygène, qui est à son tour lié à des groupes de natures variées (demande de brevet français No. 7 510 722 de CIBA-GEIGY), ou encore un groupe 2-furoyle, 2-thiényloyle ou pyridil-2-carbonyl (demande de brevet en République Fédérale d'Allemagne divulguée sous le No. 2 513 732 et 2 513 788
20 de CIBA-GEIGY).

De même, a également été décrite l'activité microbienne de méthylalaninates portant sur l'atome d'azote un 2,6-dialkyl-phényle et un des groupes suivants :

5 cyclopropanoyle, acryloyle, crotonoyle (demandes de brevets en Suisse Nos. 4988/74 et 2 906/75).

D'autres dérivés d'acyl-anilines à propriétés fongicides ont également été décrits récemment dans le brevet belge n° 863 615 (CIBA-GEIGY) et dans la demande de brevet en République Fédérale d'Allemagne divulguée sous le n° 2 745 533 (CHEVRON).

10 L'intérêt d'effectuer des recherches en vue de disposer de nouveaux dérivés d'acylanilines ayant une action fongicide résulte de la nécessité de disposer de dérivés d'acylanilines qui ont une activité fongicide élevée en même temps qu'ils ne donnent pas lieu à une phytotoxicité.

15 En fait, certains des produits déjà connus, quoiqu'ils développent une excellente activité fongicide, se sont révélés toutefois être toxiques vis-à-vis des plantes que l'on souhaite protéger vis-à-vis des infections dues aux champignons.

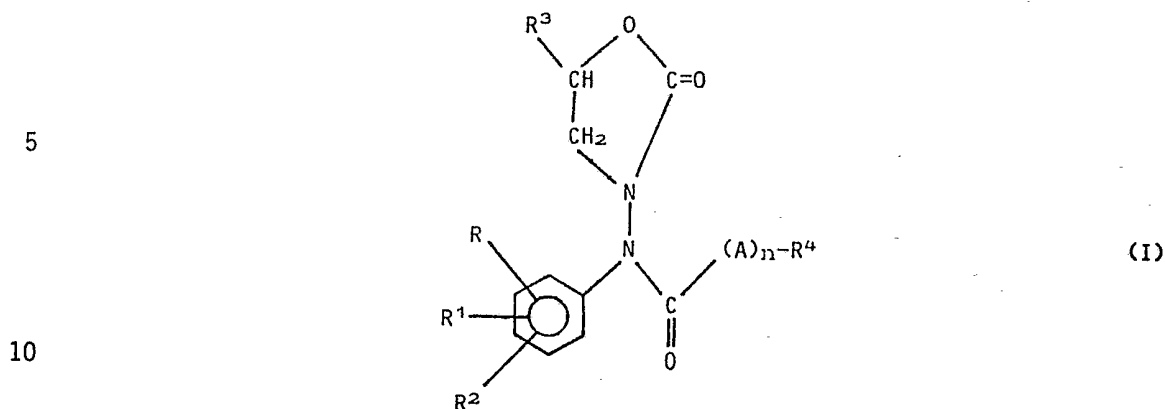
20 Les dommages dus à la phytotoxicité vis-à-vis des plantes à protéger peuvent difficilement être évités par l'emploi d'une dose de composés fongicides, qui soit le meilleur compromis entre l'activité fongicide du composé et sa phytotoxicité.

25 En fait, dans les applications pratiques effectuées dans le domaine agricole, la quantité de produit qui reste véritablement sur la plante varie considérablement en fonction de différents facteurs tels que, par exemple, les conditions climatiques (notamment la fréquence des précipitations), la précision et la fréquence des applications effectuées par le fermier, etc.

30 Il est par conséquent nécessaire de disposer de produits fongicides ayant une bonne activité fongicide, et, en même temps, offrant une large marge de sécurité, de sorte que des quantités, même importantes de produits, n'entraînent aucun dommage aux plantes à traiter.

La présente invention a pour objet à titre de produits industriels nouveaux,

les composés présentant la formule générale:



dans laquelle:

R, R¹ et R², identiques ou différents, sont un atome d'hydrogène, d'halogène, ou des radicaux alkyle ou alcoyle comprenant 1 à 4 atomes de carbone;

R³ est un atome d'hydrogène ou un radical méthyle;

A = $\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ | \\ -\text{CH}_2-, \quad -\text{CH}-; \end{array}$

n est égal à 0 ou 1;

R⁴ est un atome d'hydrogène ou un radical alkyle comprenant 1 à 5 atomes de carbone, éventuellement substitué par des atomes d'halogène;

cycloalkyle comprenant 3 à 6 atomes de carbone;

alkényle comprenant 2 à 5 atomes de carbone; éthylnyle,

un halogène (lorsque n = 1); un groupe CN; SCN;

phényle éventuellement substitué par des radicaux alkyles comprenant 1 à 5 atomes de carbone ou des atomes d'halogène;

des groupes hétérocycliques comprenant 5 ou 6 atomes, dont notamment 1 à 3 hétéro-atomes (en particulier: les groupes furyle, tétrahydrofuryle, thiényle, pyrimidyle, pyridyle, imidazolyle, pyrazolyle, triazolyle);

acétyle; COO-alkyle;

-OR⁵; -SR⁵; $\begin{array}{c} -\text{N}-\text{R}^6 \\ | \\ \text{R}^6 \end{array}$ (R⁵ et R⁶ (identiques ou différents) étant un atome d'hydrogène ou un radical alkyle comprenant 1 à 5 atomes de carbone;

alkényle comprenant 2 à 5 atomes de carbone;

alkynyle comprenant 2 à 5 atomes de carbone;

phényle; un groupe hétérocyclique comprenant 5 ou 5 atomes dont 1 à 3 hétéro-atomes;

un groupe SO₂-alkyle, ou acétyle],

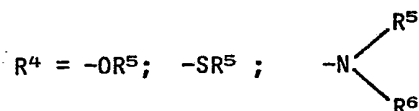
étant entendu qu'au moins un des radicaux R, R¹, R² et R³ n'est pas un atome d'hydrogène lorsque -(A)_n-R⁴=CH₃.

La préparation des composés de formule générale (I) est effectuée à l'aide des procédés connus de l'organicien moyen.

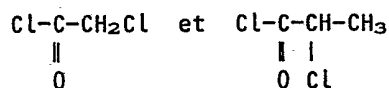
Par exemple, on peut préparer un arylhydrazine (3) par réaction de l'aniline correspondante (1) avec du nitrite de sodium (NaNO_2) dans l'acide chlorhydrique, puis par réduction du sel de diazonium (2) ainsi obtenu (Schéma 1, Equation I, ci-après), ainsi que décrit, par exemple, dans la revue "Journal of American Chemical Society", 81, p. 4673 (1959).

L'aryl-hydrazine est alors amenée à réagir avec le 2-halo-éthyle ou 1-méthyl-2-haloéthyl-chloroformiate (4) (à son tour préparé par action de phosgène sur un halohydrine), en présence d'une base, et l'intermédiaire (5) ainsi obtenu est alors cyclisé en présence de bases, de façon à conduire à l'obtention de l'intermédiaire (6) (Schéma 1, Equation II, ci-après). Ce procédé a été décrit dans le "Journal of American Chemical Society", 48, 1951 (1926).

Le produit intermédiaire (6) est alors condensé à l'aide de l'halogénure d'acyle (7) convenable, selon les techniques connues (Schéma 1, Equation 3). La réaction de condensation entre le produit intermédiaire (6) et l'halogénure d'acyle (7) peut être remplacée par une réaction analogue connue dans la littérature technique, qui permet d'introduire des groupes acyles particuliers. Par exemple, les composés de formule générale (I), dans laquelle la partie acyle:



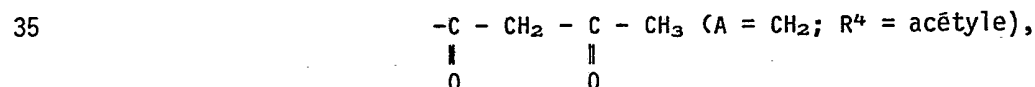
peut être préparée par réaction du produit intermédiaire (6) avec du phosgène ou avec des halogénures d'haloacétyle ou halopropionyle (tels que, par exemple,



respectivement), puis par substitution de l'atome d'halogène selon les techniques connues.

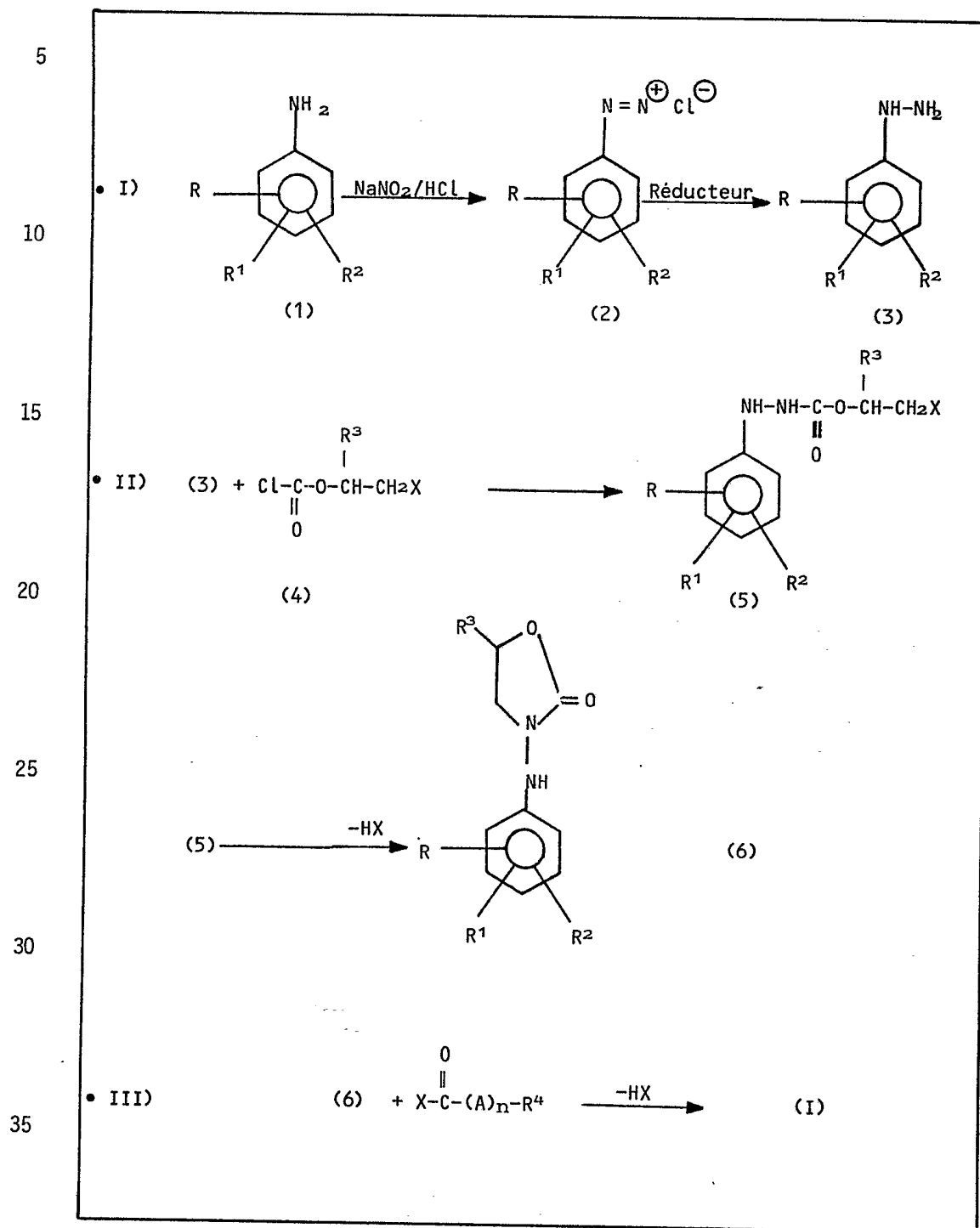
Les composés de formule (I), dans lesquels la partie acylique est $-\text{C}-\text{R}^4$, et où: $R^4 = \text{NHR}^5$, peuvent être préparés par réaction du produit intermédiaire (6) avec un isocyanate de formule: $R^5 - \text{N} = \text{C} = \text{O}$.

Les composés de formule (I), dans laquelle la partie acylique est:



peuvent être préparés par réaction du produit intermédiaire (6) avec le dicétène.

S C H E M A 1



[X est un atome d'halogène;

R, R¹, R², R³, R⁴, A et n ayant les significations indiquées ci-dessus pour la
40 formule générale (I)].

La réaction III est effectuée dans un solvant inerte, en présence d'une base accepteur d'acide halohydrique, à la température du reflux.

Les composés de formule générale (I) sont pourvus d'une excellente activité fongicide vis-à-vis des champignons phytopathogènes et leur action a à la fois un caractère préventif (c'est-à-dire qu'ils empêchent que se produisent le décès), aussi bien que curatif (c'est-à-dire qu'ils agissent même lorsque l'infection est déjà en voie de développement).

La classe la plus importante des champignons phytopathogènes susceptible d'être combattue à l'aide des composés selon la présente invention est celle des *Phytophyctes*, qui comprennent:

- *Plasmopora* spp.,
- *Phytophthora* spp.,
- *Peronospora* spp.,
- *Pseudoperonospora* spp., et
- *Phythium* spp.

Les composés fongicides de la présente invention sont utiles pour lutter contre les infections de champignons sur les plantes utiles telles que vignoble, tomate, tabac, pomme de terre et autres cultures.

Ces composés possèdent de bonnes propriétés systémiques (c'est-à-dire qu'ils agissent sur les différentes parties de la plante), ce qui rend par conséquent possible de les appliquer aussi bien sur les feuilles que dans le sol.

De plus, ces composés de formule générale (I) s'avèrent être compatibles avec les plantes qu'il s'agit de protéger vis-à-vis de l'attaque des champignons.

La plus grande partie des composés de formule générale (I) ne présentent aucun signe de phytotoxicité aux quantités auxquelles ils ont été testés, alors que les autres présentent seulement une petite phytotoxicité inférieure en tous les cas à celle des fongicides connus.

Dans les applications agricoles courantes, les composés fongicides de formule (I) peuvent être utilisés tels quels ou sous forme de compositions convenables comprenant les composés de formule (I) qui en forment le principe actif, ainsi que des supports ou véhicules inertes, liquides ou solides et, éventuellement, des agents tensio-actifs et autres additifs.

Le cas échéant, dans les compositions peuvent être présents d'autres composés actifs tels que d'autres fongicides, insecticides, régulateurs de croissance des plantes, etc.

Les composés peuvent être mis sous la forme de formulations, conformes aux techniques agricoles connues telles que poudres, poussières, poudres humidifiables, liquides émulsifiables, granules, etc.

Les quantités de composés de formule (I) à répartir pour lutter contre les infections dues aux champignons dépendent de nombreux facteurs tels que le composé actif utilisé, le type de composition ou de formulation utilisé, le type de l'infection et son taux, le type de culture traitée à protéger de l'action des champignons, les conditions climatiques et d'humidité ambiante, etc.

En général, les quantités de composés fongicides de formule (I) employées sont comprises entre 10 et 500 g/ha, quoiqu'il soit tout particulièrement préférable que celles-ci soient comprises entre 100 et 250 g/ha.

D'autres avantages et caractéristiques de l'invention seront mis en évidence, dans la suite de la description, donnée à titre d'exemple non limitatif, en référence aux dessins annexés dans lesquels:-

EXEMPLE 1

• Préparation de N-(méthoxyacétyl)-N-(2,6-diméthyl-phényl)-3-amino-oxazolidin-2-one.

20 A — Préparation de 2,6-diméthylphénylhydrazine —

107g de 2,6-xylidine sont versés, goutte à goutte, dans une solution de 220 ml d'acide chlorhydrique concentré dans 150 ml d'eau.

Après refroidissement à une température de -5°C, le mélange est alors additionné par une solution de 66 ml de NaNO₂ dans 150 ml de H₂O, pendant une période d'environ 1 heure et sous agitation vigoureuse.

A la suspension de couleur jaune-orangée obtenue, on ajoute, à 0°C et en environ 4 heures, 450g de SnCl₂.2H₂O dans 600 ml d'une solution aqueuse 5N de HCl.

Le mélange est alors maintenu sous agitation durant 24 heures, tandis qu'on laisse la température revenir à +20°C environ. Le produit solide ainsi formé est séparé par filtration, dissout dans 700 ml d'H₂O, puis traité par une solution de 230g de NaOH dans 300 ml d'H₂O, à une température de l'ordre de 10 à 15°C, après quoi, il subit une extraction à l'aide de diéthyldéther (3 × 250 ml).

L'extrait étheré, après lavage par H₂O et anhydrification sur Na₂SO₄, est alors porté à un volume de 1500 ml par le diéthyldéther, puis traité par HCl gazeux anhydre, jusqu'à ce que l'on obtienne la précipitation complète du chlorhydrate de 2,6-diméthylhydrazine.

Le sel est alors filtré et séché et l'on obtient ainsi 40g d'un solide blanc, présentant un point de fusion (P_F) de l'ordre de 205 à 207°C (avec décomposition).

Par traitement à l'aide de NaOH, on obtient à partir du chlorhydrate
5 le 2,6-diméthyl-phénylhydrazine.

B — Préparation de 3-(2,6-diméthylaniline)-oxazolidin-2-one —

A 41,4g de 2-bromoéthyl-chloroformiate, préparés à partir de phosgène et de bromohydrine éthylénique, dans 200 ml de benzène, on ajoute, à 10°C, les
10 réactifs suivants:

- 36,5g de 2,6-diméthyl-phénylhydrazine (cf. le point A), et
- 18,0g de pyridine dans 100 ml de benzène.

Lorsque cette addition est achevée, on laisse la température revenir à 20°C sous agitation vigoureuse constante.

15 Le chlorhydrate de pyridine est éliminé par lavage à l'aide d'eau.

La solution benzénique est alors lavée à nouveau à l'aide d'HCl, puis à l'aide d'eau, jusqu'à l'obtention d'un pH neutre, puis elle est séchée sur Na_2SO_4 et évaporée.

On obtient ainsi 61g d'un produit huileux qui, cristallisé dans la ligroïne,
20 donne 43g d'un solide légèrement coloré, présentant un point de fusion de 58 à 63°C, et qui est formé de 1-(2,6-diméthylphényl)-2-(β -bromoéthyl)-oxy-carbonyl hydrazine.

[Le spectre infrarouge (IR) de ce composé conduit aux résultats suivants:

- 25 $\nu (\text{C} = \text{O}) = 1710 \text{ cm}^{-1}$;
 $\nu (\text{NH-CO}) = 3180 \text{ cm}^{-1}$;
 $\nu (\text{NH-Ar}) = 3340 \text{ cm}^{-1}$].

40g de ce produit intermédiaire sont dissouts dans 500 ml de toluène puis traités par 16g de tétraméthylguanidine. Le mélange est alors chauffé à la température du reflux durant 3 heures, sous agitation.

30 Après refroidissement, le mélange est lavé à l'aide de 200 ml d' H_2O , puis à l'aide de 100 ml de HCl dilué et, enfin, avec 200 ml d' H_2O .

Les phases aqueuses réunies sont extraites par CH_2Cl_2 ($2 \times 200 \text{ ml}$).

Les phases organiques combinées sont rendues anhydres sur Na_2SO_4 , puis on évapore le solvant de façon à obtenir un résidu solide que l'on cristal-
35 lise dans un mélange de ligroïne et d'éthylacétate (2/1).

On obtient ainsi 22,5g de 3-(2,6-diméthylaniline)-oxazolidin-2-one, présentant un point de fusion de l'ordre de 107 à 110°C.

[Le spectre infrarouge (IR) de ce composé conduit aux résultats suivants:

- ν (C=O) = 1770 cm^{-1} ;
- ν (NH) = 3340 cm^{-1}].

La réaction de cyclisation est répétée par dissolution du produit inter-
5 médiaire présentant un point de fusion de 58 à 62°C , dans de l'éthanol conte-
nant de l'éthylate de sodium, puis par chauffage au reflux de la solution.

Après un traitement analogue du mélange réactionnel, on isole le même
intermédiaire présentant un point de fusion de l'ordre de 107 à 110°C .

10 C — A 2g du produit intermédiaire préparé ainsi que décrit dans le point B),
dans 70 ml de toluène et 0,2 ml de diméthylformamide, on ajoute 1,1g de chlo-
rure de méthoxyacétyle. Le mélange réactionnel est alors chauffé à la tempé-
rature du reflux durant 8 heures. Après refroidissement, le mélange réactionnel
est soumis à une évaporation complète des solvants. Le résidu, formé de 2,9g
15 d'une huile épaisse, est purifié sur une colonne de silica gel, l'éluant étant
formé d'un mélange de benzène et d'acétate d'éthyle (en un rapport 1/1).

On obtient ainsi, après élimination des solvants, 1,1g d'un produit
sirupeux, qui cristallise spontanément et qui, après recristallisation dans
le mélange ligroïne/acétate d'éthyle (1/1), conduit à l'obtention de 1g du
20 composé recherché, dont les caractéristiques sont consignées dans le Tableau I,
ci-après (Composé No. 6).

[Le spectre infrarouge (IR) de ce composé conduit aux résultats suivants:

- ν (N-CO-CH₂) = 1680 cm^{-1} ;
- ν (N-CO-O) = 1780 cm^{-1}].

25

EXEMPLE 2

En opérant de la façon analogue à celle décrite dans l'Exemple 1, on
prépare les composés consignés dans le Tableau I, ci-après:

30

5

TABLEAU I

10

15

20

25

30

Composé No.	R	R ¹	R ²	R ³	n	A	R ⁴	P _F ⁽²⁾ (°C)	I.R. ⁽³⁾ (cm ⁻¹)
1	H	H	H	H	1	CH ₂	Cl	71-4	1690-1760
2	H	H	H	H	1	CH ₂	C ₆ H ₅	112-4	1680-1760
3	H	H	H	H	1	CH ₂	i.-C ₃ H ₇	huile	1680-1770
4	2-CH ₃	6-CH ₃	H	H	1	CH ₂	Cl	88-92	1635-1770
5	2-CH ₃	6-CH ₃	H	H	1	CH ₂	C ₆ H ₅	huile	1670-1770
6	2-CH ₃	6-CH ₃	H	H	1	CH ₂	OCH ₃	103-6	1680-1780
7	H	H	H	H	1	CH ₂	OCH ₃	86-91	1690-1760
8	2-CH ₃	6-CH ₃	H	H	1	CH ₂	O-CO-CH ₃	huile	1690-1770
9	2-CH ₃	6-CH ₃	H	H	1	CH ₂	OH	135-8	1690-1770 ⁽⁴⁾
10	2-CH ₃	6-CH ₃	H	H	0	-	CO-OCH ₃	116-9	1680-1730-1790
11	2-CH ₃	6-CH ₃	H	H	1	CH ₂	H	132-5	1670-1770
12	2-CH ₃	6-CH ₃	H	H	1	CH ₂	OC ₆ H ₅	109-12	1690-1780

(1) L'analyse élémentaire de tous les composés montre qu'ils présentent la structure indiquée.

(2) Les points de fusion n'ont pas été corrigés.

(3) Seules les bandes correspondant à ν C=O sont consignées.

(4) ν OH = 3300 cm⁻¹.

35

5

TABLEAU II

Activité curative vis-à-vis du *Peronospora*
de la vigne par application foliaire à
des doses de 0,5‰.

10

15

20

25

30

Composé No.	Activité
1	3
2	3
3	4
4	4
5	4
6	4
7	4
8	4
9	4
10	4
11	4
12	4

EXEMPLE 3

- Activité curative vis-à-vis du *Peronospora* de la vigne [*Plasmopora viticola* (B. et C) Berl et de Toni].

Des feuilles de vigne de type Dolcetto, ayant poussé en pots dans un environnement conditionné stabilisé à 25°C et à 60% d'humidité relative, sont pulvérisées sur la partie inférieure des feuilles d'une suspension aqueuse de conidies de *Plasmopora viticola* . (200 000 conidie/cm³).

Après 24 heures de traitement dans un environnement saturé d'humidité, stabilisé à 21°C , les plantes sont traitées par pulvérisation des deux faces à l'aide des produits testés dans une solution hydroacétonique à 20% d'acétone (volume/volume).

A la fin de l'incubation (7 jours), le taux d'infection est déterminé à la vue sur la base de l'échelle de valeurs suivante:

- 0 : aucun contrôle, l'infestation est égale à celle des plantes témoins (plantes infectées mais non-traitées);
- 1 : réduction de 1 à 20% de l'infestation;
- 2 : réduction de 20 à 60% de l'infestation;
- 3 : réduction de 60 à 90% de l'infestation;
- 4 : réduction de l'infestation supérieure à 90%.

Sur le Tableau II, ci-avant, ont été consignés les résultats obtenus.

EXEMPLE 4

- Activité curative vis-à-vis du *Peronospora* du tabac (*Peronospora tabacina* Adam).

Des feuilles de plants de tabac de type Burley, ayant poussé en pots dans un environnement conditionné, sont pulvérisées sur la partie inférieure de leurs feuilles d'une suspension aqueuse de conidies de *Peronospora tabacina* (200 000 conidia/cm³).

Six heures après ce traitement dans un environnement saturé d'humidité, les plantes sont transférées dans une enceinte conditionnée stabilisée à 20°C et à 70% d'humidité relative, pour permettre l'incubation des champignons. 24 heures après l'infestation, les traitements sont effectués par pulvérisation sur les deux faces du produit testé, dans une solution hydroacétonique à 20% dans l'acétone (volume/volume).

A la fin de la période d'incubation (6 jours), le taux d'infestation est déterminé à la vue sur la base de l'échelle de valeurs indiquée dans l'Exemple 3. Les résultats testés ont été consignés dans le Tableau III, ci-après.

TABLEAU III

Activité curative par application foliaire à des doses de 0,5%
sur des plantes infestées de Peronospora du
tabac.

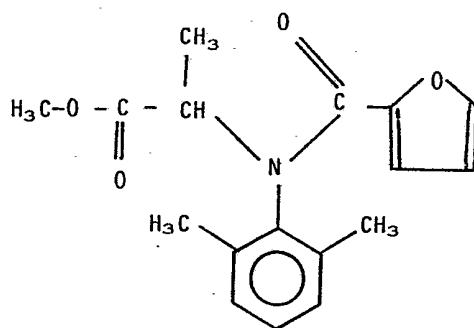
Composé No.	Activité
4	4
6	4

TABLEAU IV

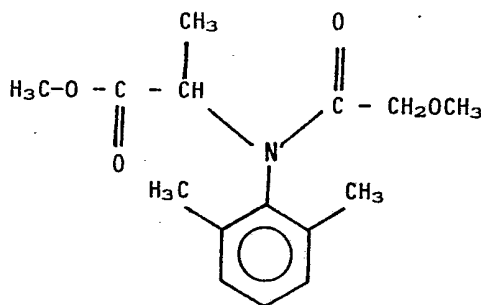
Indice de phytotoxicité pour des doses de 0,6%.

Composé No.	Indice de phytotoxicité
1	0
3	10
4	0
6	0
"Furalaxyle" (1)	100
"Ridomile" (2)	60

(1) "Furalaxyle": Il s'agit du composé consistant en N-(2,6-diméthylphényl)-N-(1'-carbo-méthoxyéthyl)-2-furoyl-amide:



(2) "Ridomile" : Il s'agit du composé consistant en N-(2,6-diméthylphényl)-N-(1'-carbo-méthoxyéthyl)-méthoxyacétamide:



EXEMPLE 5

• Détermination du taux de phytotoxicité

Des feuilles de plants de vigne de type Dolcetto, ayant poussé en pots dans une enceinte conditionnée stabilisée à 25°C et à 60% d'humidité relative, 5 sont traitées par pulvérisation sur leurs deux faces d'une solution hydro-acétonique à 20% d'acétone (volume/volume) des produits testés.

Après 7 jours, le taux ou degré des symptômes phytotoxiques est déterminé à la vue selon l'échelle de valeurs par des indices compris entre 100 (pour des plantes totalement endommagées) et 0 (pour des plantes saines).

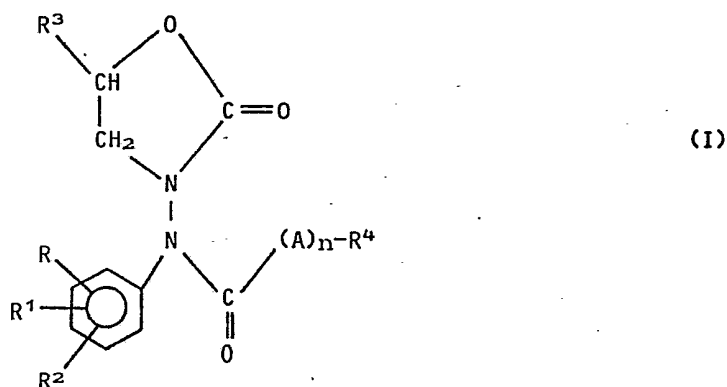
10 Les données correspondantes ont été consignées dans le Tableau IV, ci-après, par comparaison avec l'indice de phytotoxicité des deux composés qui ont été récemment mis sur le marché, à savoir:

- "Furalaxyle" (brevet britannique Numéro 1 448 810, de CIBA-GEIGY), et
- "Ridomile" (demande de brevet français No. 2 267 042, de CIBA-GEIGY).

15 Bien entendu, la présente invention n'est nullement limitée aux exemples et modes de mise en oeuvre mentionnés ci-dessus; elle est susceptible de nombreuses variantes accessibles à l'homme de l'art, suivant les applications envisagées et sans que l'on ne s'écarte de l'esprit de l'invention.

REVENDECATIONS

1.- A titre de produits industriels nouveaux, les composés de formule générale (I):



dans laquelle:

R, R¹ et R², identiques ou différents, consistent en un atome d'hydrogène, ou d'halogène, un radical alkyle ou alcoyle comprenant 1 à 4 atomes de carbone;

R³ est H ou CH³;

A est -CH₂-; -CH- ;

n est 0 ou 1; et

R⁴ est un atome d'hydrogène, ou un radical alkyle comprenant 1 à 5 atomes de carbone, éventuellement substitué par des atomes d'halogène;

cycloalkyle comprenant 3 à 6 atomes de carbone;

alkényle comprenant 2 à 5 atomes de carbone; éthylyle;

halogène (lorsque n = 1);

un groupe CN; SCN; phényle éventuellement substitué par des radicaux

alkyles comprenant 1 à 5 atomes de carbone ou par des atomes d'halogène;

le groupe hétérocyclique comprenant 5 ou 6 atomes, dont 1 à 3 hétéro-atomes;

acétyle; COO-alkyle;

-OR⁵; SR⁵; -N-R⁵ [R⁵ et R⁶, identiques ou différents, consistent en atomes

d'hydrogène, un radical alkyle comprenant 1 à 5 atomes de carbone; alkényle comprenant

2 à 5 atomes de carbone; alkynyle comprenant

2 à 5 atomes de carbone; phényle;

un groupe hétérocyclique comportant 5 ou 6

atomes, dont 1 à 3 hétéro-atomes;

SO₂-alkyle, ou acétyle].

étant entendu que lorsque -(A)_n-R⁴ = CH₃, au moins un des groupes R, R¹, R² ou R³, n'est pas de l'hydrogène.

2.- Composés selon la revendication 1, caractérisés en ce que:

$R = R^1 = R^2 = R^3 = H$, et

$n = 1$.

3.- A titre de produit industriel nouveau, le composé:

5 •N-phényl-N-chloroacétyl-3-amino-oxazolidin-2-one.

4.- A titre de produit industriel nouveau, le composé:

•N-phényl-N-phénylacétyl-3-amino-oxazolidin-2-one.

5.- A titre de produit industriel nouveau, le composé:

10 •N-phényl-N-(β -méthyl-)propionyl-3-amino-oxazolidin-2-one.

6.- A titre de produit industriel nouveau, le composé:

•N-phényl-N-méthoxyacétyl-3-amino-oxazolidin-2-one.

7.- Composé selon la revendication 1, caractérisé en ce que:

15 $R = R^1 = CH_3$, et

$R^2 = R^3 = H$.

8.- A titre de produit industriel nouveau, le composé:

•N-(2,6-diméthylphényl)-N-chloroacétyl-3-amino-oxazolidin-2-one.

9.- A titre de produit industriel nouveau, le composé:

20 •N-(2,6-diméthylphényl)-N-phénylacétyl-3-amino-oxazolidin-2-one.

10.- A titre de produit industriel nouveau, le composé:

•N-(2,6-diméthylphényl)-N-méthoxyacétyl-3-amino-oxazolidin-2-one.

11.- A titre de produit industriel nouveau, le composé:

25 •N-(2,6-diméthylphényl)-N-acétoxyacétyl-3-amino-oxazolidin-2-one.

12.- A titre de produit industriel nouveau, le composé:

•N-(2,6-diméthylphényl)-N-hydroxyacétyl-3-amino-oxazolidin-2-one.

13.- A titre de produit industriel nouveau, le composé:

30 •N-(2,6-diméthylphényl)-N-carbométhoxycarbonyl-3-amino-oxazolidin-2-one.

14.- A titre de produit industriel nouveau, le composé:

•N-(2,6-diméthylphényl)-[N-méthoxyoxalyl]-3-amino-oxazolidin-2-one.

15.- A titre de produit industriel nouveau, le composé:

•N-(2,6-diméthylphényl)-N-acétyl-3-amino-oxazolidin-2-one.

16.- A titre de produit industriel nouveau, le composé:

35 •N-(2,6-diméthylphényl)-N-phénoxyacétyl-3-amino-oxazolidin-2-one.