

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
29. November 2007 (29.11.2007)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2007/134984 A1

(51) Internationale Patentklassifikation:
C07D 231/14 (2006.01) A01N 43/56 (2006.01)

Bertolt-Brecht-Str. 18a, 67454 Hassloch (DE). **GROSS-MANN, Klaus** [DE/DE]; Mainstr. 1, 67141 Neuhofen (DE). **EHRHARDT, Thomas** [DE/DE]; Maulbronner Hof 49, 67346 Speyer (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2007/054562

(22) Internationales Anmeldedatum:
11. Mai 2007 (11.05.2007)

(74) Gemeinsamer Vertreter: **BASF AKTIENGESELLSCHAFT**; 67056 Ludwigshafen (DE).

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(81) Bestimmungsstaaten (*soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart*): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
06114239.4 19. Mai 2006 (19.05.2006) EP

(71) Anmelder (*für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US*): **BASF AKTIENGESELLSCHAFT** [DE/DE]; 67056 Ludwigshafen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (*nur für US*): **WITSCHEL, Matthias** [DE/DE]; Höhenweg 12b, 67098 Bad Dürkheim (DE). **ZAGAR, Cyrill** [DE/CN]; No. 1 Austin Road West, Kowloon, Hong Kong (CN). **HUPE, Eike** [DE/DE]; Bergstr. 13e, 67067 Ludwigshafen (DE). **KÜHN, Toralf** [DE/DE]; Meistersingerstr. 1, 68199 Mannheim (DE). **MOBERG, William Karl** [US/DE]; Meckenheimer Strasse 34, 67454 Hassloch (DE). **PARRA RAPADO, Liliana** [ES/DE]; Zeller Str. 14, 77654 Offenburg (DE). **STELZER, Frank** [DE/DE]; Ida-Dehmel-Ring 40, 68309 Mannheim (DE). **VESCOVI, Andrea** [IT/DE]; Max-Joseph-Str. 23, 68167 Mannheim (DE). **RACK, Michael** [DE/DE]; Hildastr. 11/1, 69214 Eppelheim (DE). **REINHARD, Robert** [DE/DE]; Berwartsteinstr. 6, 67117 Limburgerhof (DE). **SIEVERNICH, Bernd** [DE/DE];

(84) Bestimmungsstaaten (*soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart*): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

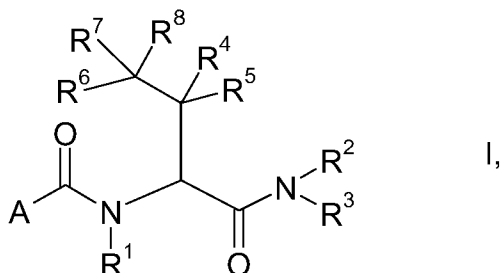
Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: HETEROAROYL-SUBSTITUTED ALANINES WITH A HERBICIDAL ACTION

(54) Bezeichnung: HETEROAROYL-SUBSTITUIERTE ALANINE MIT HERBIZIDER WIRKUNG



(57) Abstract: The invention relates to heteroaroyl-substituted alanines of formula (I), in which the variables A and R¹ to R⁸ are defined as cited in the description, and to their agriculturally useful salts. The invention also relates to methods and intermediates for producing said compounds, to the use of said compounds or to agents containing the latter for controlling undesirable plants.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft heteroaroyl-substituierte Alanine der Formel (I), in der die Variablen A sowie R¹ bis R⁸ die in der Beschreibung genannten Bedeutungen haben, sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze, Verfahren und

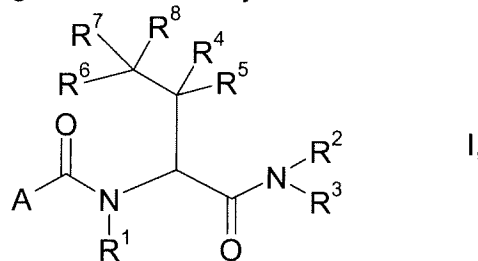
Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung, sowie die Verwendung dieser Verbindungen oder diese Verbindungen enthaltende Mittel zur Bekämpfung unerwünschter Pflanzen.

WO 2007/134984 A1

HETEROAROYL-SUBSTITUIERTE ALANINE MIT HERBIZIDER WIRKUNG.

Beschreibung

- 5 Die vorliegende Erfindung betrifft heteroaroyl-substituierte Alanine der Formel I



in der die Variablen die folgenden Bedeutungen haben:

- 10 A 5- oder 6-gliedriges Heteroaroyl mit ein bis vier Stickstoffatomen, oder mit ein bis drei Stickstoffatomen und einem Sauerstoff- oder Schwefelatom, oder mit einem Sauerstoff- oder Schwefelatom, welches partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder 1 bis 3 Reste aus der Gruppe Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy und C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl tragen kann;
- 15 R¹, R² Wasserstoff, Hydroxy oder C₁-C₆-Alkoxy;
- R³ C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Cyanoalkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl;
- 20 R⁴ Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl;
- R⁵ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₂-C₆-Halogenalkinyl, C₁-C₆-Cyanoalkyl, C₂-C₆-Cyanoalkenyl, C₂-C₆-Cyanoalkinyl, C₁-C₆-Hydroxyalkyl, C₂-C₆-Hydroxyalkenyl, C₂-C₆-Hydroxyalkinyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkenyl, 3- bis 6-gliedriges Heterocyclyl, wobei die voranstehend genannten Cycloalkyl, Cycloalkenyl oder 3- bis 6-gliedrigen Heterocyclylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder ein bis drei Reste aus der Gruppe Oxo, Cyano, Nitro, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, Hydroxy, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Hydroxycarbonyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, Hydroxycarbonyl-C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl-C₁-C₆-alkoxy, Amino, C₁-C₆-Alkylamino, Di(C₁-C₆-alkyl)-amino, C₁-C₆-Alkylsulfonylamino, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonylamino, Aminocarbonylamino, (C₁-C₆-Alkylamino)carbonylamino, Di(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonylamino, Aryl und Aryl(C₁-C₆-alkyl) tragen können;
- 30 C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkenyloxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkinyloxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Halogenalkenyloxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Halogenalkinyloxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-
- 35

Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkenylthio-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl-C₁-C₄-thioalkyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl-C₁-C₄-thioalkyl, C₂-C₆-Halogenalkinyl-C₁-C₄-thioalkyl, C₁-C₆-Alkylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl, Amino-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₆-Alkyl)amino-C₁-C₄-alkyl, Di(C₁-C₆-alkyl)amino-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₆-Alkylsulfonyl)amino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl(C₁-C₆-alkyl)amino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, Hydroxycarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, (C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl, Di(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, Formylamino-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl)amino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, Hydroxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkyl-carbonyloxy-C₁-C₄-alkyl, Aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₆-Alkylcarbonyl)-amino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl(C₁-C₆-alkylamino)C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyloxy-C₁-C₄-alkyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyloxy-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonylamino-C₁-C₄-alkyl, Di(C₁-C₆-alkyl)amino-carbonylamino-C₁-C₄-alkyl;

Phenyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl, Phenyl-C₂-C₄-alkenyl, Phenyl-C₂-C₄-alkinyl, Phenyl-C₁-C₄-halogenalkyl, Phenyl-C₂-C₄-halogenalkenyl, Phenyl-C₂-C₄-halogenalkinyl, Phenyl-C₁-C₄-hydroxyalkyl, Phenyl-C₂-C₄-hydroxyalkenyl, Phenyl-C₂-C₄-hydroxyalkinyl, Phenylcarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Phenylcarbonyloxy-C₁-C₄-alkyl, Phenylloxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Phenylloxy-C₁-C₄-alkyl, Phenylthio-C₁-C₄-alkyl, Phenylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl, Phenylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl,

Heteroaryl, Heteroaryl-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryl-C₂-C₄-alkenyl, Heteroaryl-C₂-C₄-alkinyl, Heteroaryl-C₁-C₄-halogenalkyl, Heteroaryl-C₂-C₄-halogenalkenyl, Heteroaryl-C₂-C₄-halogenalkinyl, Heteroaryl-C₁-C₄-hydroxyalkyl, Heteroaryl-C₂-C₄-hydroxyalkenyl, Heteroaryl-C₂-C₄-hydroxyalkinyl, Heteroarylcarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Heteroarylcarbonyloxy-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryloxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryloxy-C₁-C₄-alkyl, Heteroarylthio-C₁-C₄-alkyl, Heteroarylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl, Heteroarylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl,

wobei die vorstehend genannten Phenyl- und Heteroarylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder ein bis drei Reste aus der Gruppe Cyano, Nitro, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, Hydroxy, C₁-C₆-Hydroxyalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Hydroxycarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl, Hydroxycarbonyl-C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₆-alkoxy, Amino, C₁-C₆-Alkylamino, Di(C₁-C₆-alkyl)amino, C₁-C₆-Alkylsulfonylamino, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonylamino, (C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonylamino, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonylamino, Aryl und Aryl(C₁-C₆-alkyl) tragen können;

40

R⁶ OR⁹, NR¹⁰R¹¹ oder NO₂;

- R⁷ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl;
- R⁸ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl;
- 5 R⁹ und R¹⁰ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkinyl, C₃-C₆-Halogenalkenyl, C₃-C₆-Halogenalkinyl, Formyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkylthiocarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkylcarbonyl, C₂-C₆-Alkenylcarbonyl, C₂-C₆-Alkinylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₃-C₆-Alkenyloxycarbonyl, C₃-C₆-Alkinyloxycarbonyl, Aminocarbonyl, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl, C₃-C₆-Alkenylaminocarbonyl, C₃-C₆-Alkinylaminocarbonyl, C₁-C₆-Alkylsulfonylaminocarbonyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkenyl)-N-(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkinyl)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, N-(C₁-C₆-Alkoxy)-N-(C₁-C₆-alkyl)-amino-carbonyl, N-(C₃-C₆-Alkenyl)-N-(C₁-C₆-alkoxy)aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkinyl)-N-(C₁-C₆-alkoxy)-amino-carbonyl, [(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl(C₁-C₆-alkyl)amino]carbonyl, (C₁-C₆-alkyl)aminothiocarbonyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminothiocarbonyl, (C₁-C₆-Alkyl)cyanoimino, (Amino)cyanoimino, (C₁-C₆-Alkyl)aminocyanoimino, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocyanoimino, C₁-C₆-Alkylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkoxyimino-C₁-C₆-alkyl, N-(C₁-C₆-Alkylamino)-imino-C₁-C₆-alkyl, N-(Di-C₁-C₆-alkylamino)imino-C₁-C₆-alkyl oder Tri-C₁-C₄-alkylsilyl,
- 10 wobei die genannten Alkyl-, Cycloalkyl- und Alkoxyreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Cyano, Hydroxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, Di(C₁-C₄-alkyl)amino, C₁-C₄-Alkyl-C₁-C₆-alkoxy-carbonylamino, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, Hydroxycarbonyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, C₁-C₄-Alkylaminocarbonyl, Di(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl oder C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy;
- 15 Phenyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl, Phenylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, Phenoxy-carbonyl, Phenylaminocarbonyl, Phenylsulfonylaminocarbonyl, N-(C₁-C₆-Alkyl)-N-(phenyl)aminocarbonyl, Phenyl-C₁-C₆-alkylcarbonyl,
- 20 wobei der Phenylrest partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy; oder
- 25 SO₂R¹²;
- 30 R¹¹ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkinyl, C₃-C₆-Halogenalkenyl, C₃-C₆-Halogenalkinyl, Hydroxy oder C₁-C₆-Alkoxy;
- 35 R¹² C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, Di(C₁-C₆-alkyl)amino oder Phenyl,
- 40

wobei der Phenylrest partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl oder C₁-C₆-Alkoxy;

- 5 sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze.

Außerdem betrifft die Erfindung Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung von Verbindungen der Formel I, Mittel welche diese enthalten sowie die Verwendung dieser
10 Derivate oder diese enthaltende Mittel zur Schädnpflanzenbekämpfung.

2,α-Diaminocarbonylverbindungen mit herbizider Wirksamkeit werden u.a. in WO 03/045878 beschrieben.

- 15 Weiterhin sind aus der Literatur (z.B. WO 05/061464) heteroaroyl-substituierte Phenylalanine bekannt, welche in β-Position eine gegebenenfalls substituierte Aminogruppe tragen können.

- 20 Die herbiziden Eigenschaften der bisher bekannten Verbindungen bzw. die Verträglichkeiten gegenüber Kulturpflanzen können jedoch nur bedingt befriedigen.

Es lag daher dieser Erfindung die Aufgabe zugrunde, neue, insbesondere herbizid wirksame, Verbindungen mit verbesserten Eigenschaften zu finden.

- 25 Demgemäß wurden die heteroaroylsubstituierten Alanine der Formel I sowie deren herbizide Wirkung gefunden.

- 30 Ferner wurden herbizide Mittel gefunden, welche die Verbindungen I enthalten und eine sehr gute herbizide Wirkung besitzen. Außerdem wurden Verfahren zur Herstellung dieser Mittel und Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs mit den Verbindungen I gefunden.

- 35 Die Verbindungen der Formel I enthalten je nach Substitutionsmuster zwei oder mehr Chiralitätszentren und liegen dann als Enantiomeren oder Diastereomere vor. Gegenstand der Erfindung sind sowohl die reinen Enantiomeren oder Diastereomeren als auch deren Gemische.

- 40 Die Verbindungen der Formel I können auch in Form ihrer landwirtschaftlich brauchbaren Salze vorliegen, wobei es auf die Art des Salzes in der Regel nicht ankommt. Im allgemeinen kommen die Salze derjenigen Kationen oder die Säureadditionssalze derjenigen Säuren in Betracht, deren Kationen, beziehungsweise Anionen, die herbizide Wirkung der Verbindungen I nicht negativ beeinträchtigen.

Es kommen als Kationen insbesondere Ionen der Alkalimetalle, vorzugsweise Lithium, Natrium und Kalium, der Erdalkalimetalle, vorzugsweise Calcium und Magnesium, und der Übergangsmetalle, vorzugsweise Mangan, Kupfer, Zink und Eisen, sowie Ammonium, wobei hier gewünschtenfalls ein bis vier Wasserstoffatome durch C₁-C₄-Alkyl, Hydroxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, Hydroxy-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, Phenyl oder Benzyl ersetzt sein können, vorzugsweise Ammonium, Dimethylammonium, Diisopropylammonium, Tetramethylammonium, Tetrabutylammonium, 2-(2-Hydroxyeth-1-oxy)eth-1-ylammonium, Di-(2-hydroxyeth-1-yl)-ammonium, Trimethylbenzylammonium, des weiteren Phosphoniumionen, Sulfoniumionen, vorzugsweise Tri(C₁-C₄-alkyl)-sulfonium und Sulfoxoniumionen, vorzugsweise Tri(C₁-C₄alkyl)-sulfoxonium, in Betracht.

Anionen von brauchbaren Säureadditionsalzen sind in erster Linie Chlorid, Bromid, Fluorid, Hydrogensulfat, Sulfat, Dihydrogenphosphat, Hydrogenphosphat, Nitrat, Hydrogencarbonat, Carbonat, Hexafluorosilikat, Hexafluorophosphat, Benzoat sowie die Anionen von C₁-C₄-Alkansäuren, vorzugsweise Formiat, Acetat, Propionat und Butyrat.

Die für die Substituenten R¹-R¹⁶ oder als Reste an Phenyl-, Aryl-, Heteroaryl- oder Hetrocyclyringen genannten organischen Molekülteile stellen Sammelbegriffe für individuelle Aufzählungen der einzelnen Gruppenmitglieder dar.

Sämtliche Kohlenwasserstoffketten, also z.B. alle Alkyl-, Alkenyl-, Alkynyl-, Halogenalkyl-, Halogenalkenyl-, Halogenalkynyl-, Cyanoalkyl-, Cyanoalkenyl-, Cyanoalkynyl-, Hydroxyalkyl-, Hydroxyalkenyl-, Hydroxyalkynyl-, Alkoxy-, Halogenalkoxy- und Alkylthio-Teile können geradkettig oder verzweigt sein.

Sofern nicht anders angegeben tragen halogenierte Substituenten vorzugsweise ein bis fünf gleiche oder verschiedene Halogenatome. Die Bedeutung Halogen steht jeweils für Fluor, Chlor, Brom oder Iod.

Ferner bedeuten beispielsweise:

- C₁-C₄-Alkyl sowie die Alkylteile von Tri-C₁-C₄-alkylsilyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkyl-carbonyloxy, C₁-C₄-alkyl-C₁-C₆-alkoxy-carbonylamino, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkenyloxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkinyloxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Halogenalkenyloxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Halogenalkinyloxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkenylthio-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl, Amino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylamino-C₁-C₄-alkyl, Di(C₁-C₆-Alkyl)amino-C₁-C₄-alkyl, Formylamino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonylamino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfonylamino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl(C₁-C₆-alkyl)amino-C₁-C₄-alkyl, Hydroxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogen-

- alkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyloxy-C₁-C₄-alkyl, Aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Di(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonylamino-C₁-C₄-alkyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonylamino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonylamino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl(C₁-C₆-alkyl)amino-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₆-Alkylamino)carbonyloxy-C₁-C₄-alkyl, Di(C₁-C₆-alkylamino)carbonyloxy-C₁-C₄-alkyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl, Phenylcarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Phenylcarbonyloxy-C₁-C₄-alkyl, Phenylloxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Phenyl-oxy-C₁-C₄-alkyl, Phenylthio-C₁-C₄-alkyl, Phenylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl, Phenylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryl-C₁-C₄-alkyl, Heteroarylcarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryl-carbonyloxy-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryloxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryloxy-C₁-C₄-alkyl, Heteroarylthio-C₁-C₄-alkyl, Heteroarylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl, Heteroarylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl, und Aryl(C₁-C₄-alkyl):
z.B. Methyl, Ethyl, n-Propyl, 1-Methylethyl, n-Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl und 1,1-Dimethylethyl;
- 15 - C₁-C₆-Alkyl sowie die Alkylteile von C₁-C₆-Cyanoalkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, N-(C₃-C₆-Alkenyl)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkynyl)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, N-(C₁-C₆-Alkoxy)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkoxyimino-C₁-C₆-alkyl, N-(C₁-C₆-Alkylamino)-imino-C₁-C₆-alkyl, N-(Di-C₁-C₆-alkylamino)imino-C₁-C₆-alkyl, (C₁-C₆-Alkyl)cyanoimino, Phenyl-C₁-C₆-alkyl, Phenylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, N-(C₁-C₆-Alkyl)-N-phenylaminocarbonyl:
C₁-C₄-Alkyl, wie voranstehend genannt, sowie z.B. n-Pentyl, 1-Methyl-butyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, n-Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Di-methylbutyl, 2,2-Di-methylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethyl-butyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-3-methylpropyl;
- 25 - C₁-C₄-Alkylcarbonyl: z.B. Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, Propylcarbonyl, 1-Methyl-ethylcarbonyl, Butylcarbonyl, 1-Methylpropylcarbonyl, 2-Methylpropylcarbonyl oder 1,1-Dimethylethylcarbonyl;
- 30 - C₁-C₆-Alkylcarbonyl sowie die Alkylcarbonylreste von C₁-C₆-Alkylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyloxy-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonylamino-C₁-C₄-alkyl, Phenyl-C₁-C₆-alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl-(C₁-C₆-alkylamino)-C₁-C₄-alkyl:
C₁-C₄-Alkylcarbonyl, wie voranstehend genannt, sowie z.B. Pentylcarbonyl, 1-Methylbutylcarbonyl, 2-Methylbutylcarbonyl, 3-Methylbutylcarbonyl, 2,2-Dimethylpropylcarbonyl, 1-Ethylpropylcarbonyl, Hexylcarbonyl, 1,1-Dimethylpropylcarbonyl, 1,2-Dimethylpropylcarbonyl, 1-Methylpentylcarbonyl, 2-Methylpentylcarbonyl, 3-Methylpentylcarbonyl, 4-Methylpentylcarbonyl, 1,1-Dimethylbutylcarbonyl, 1,2-Dimethylbutylcarbonyl, 1,3-Dimethylbutylcarbonyl, 2,2-Di-methylbutylcarbonyl, 2,3-Dimethylbutylcarbonyl, 3,3-Dimethylbutylcarbonyl, 1-
- 35
- 40

- Ethylbutylcarbonyl, 2-Ethylbutylcarbonyl, 1,1,2-Trimethylpropylcarbonyl, 1,2,2-Trimethylpropylcarbonyl, 1-Ethyl-1-methylpropylcarbonyl oder 1-Ethyl-2-methylpropylcarbonyl;
- 5 - C₃-C₆-Cycloalkyl sowie die Cycloalkylteile von C₃-C₆-Cycloalkylcarbonyl: monocyclischer, gesättigter Kohlenwasserstoff mit 3 bis 6 Ringgliedern, wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl;
- 10 - C₃-C₆-Cycloalkenyl: z.B. 1-Cyclopropenyl, 2-Cyclopropenyl, 1-Cyclobutenyl, 2-Cyclobutenyl, 1-Cyclopentenyl, 2-Cyclopentenyl, 1,3-Cyclopentadienyl, 1,4-Cyclopentadienyl, 2,4-Cyclopentadienyl, 1-Cyclohexenyl, 2-Cyclohexenyl, 3-Cyclohexenyl, 1,3-Cyclohexadienyl, 1,4-Cyclohexadienyl, 2,5-Cyclohexadienyl;
- 15 - C₃-C₆-Alkenyl sowie die Alkenylteile von C₃-C₆-Alkenyloxycarbonyl, C₃-C₆-Alkenylaminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkenyl)-N-(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl und N-(C₃-C₆-Alkenyl)-N-(C₁-C₆-alkoxy)aminocarbonyl: z.B. 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1-propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;
- 20
- 25
- 30
- 35
- 40 - C₂-C₆-Alkenyl sowie die Alkenylteile von C₂-C₆-Alkenylcarbonyl, C₂-C₆-Alkenyloxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkenylthio-C₁-C₄-alkyl, Phenyl-C₂-C₄-alkenyl, Heteroaryl-C₂-C₄-alkenyl: C₃-C₆-Alkenyl wie voranstehend genannt sowie Ethenyl;
- 40 - C₃-C₆-Alkynyl sowie die Alkynylteile von C₃-C₆-Alkynyloxycarbonyl, C₃-C₆-Alkynylaminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkynyl)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkynyl)-N-(C₁-C₆-alkoxy)aminocarbonyl: z.B. 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl,

- 4-Pentynyl, 1-Methyl-2-butynyl, 1-Methyl-3-butynyl, 2-Methyl-3-butynyl, 3-Methyl-1-butynyl, 1,1-Dimethyl-2-propynyl, 1-Ethyl-2-propynyl, 1-Hexynyl, 2-Hexynyl, 3-Hexynyl, 4-Hexynyl, 5-Hexynyl, 1-Methyl-2-pentynyl, 1-Methyl-3-pentynyl, 1-Methyl-4-pentynyl, 2-Methyl-3-pentynyl, 2-Methyl-4-pentynyl, 3-Methyl-1-pentynyl, 3-Methyl-4-pentynyl, 4-Methyl-1-pentynyl, 4-Methyl-2-pentynyl, 1,1-Dimethyl-2-butynyl, 1,1-Dimethyl-3-butynyl, 1,2-Dimethyl-3-butynyl, 2,2-Dimethyl-3-butynyl, 3,3-Dimethyl-1-butynyl, 1-Ethyl-2-butynyl, 1-Ethyl-3-butynyl, 2-Ethyl-3-butynyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propynyl;
- 10 - C₂-C₆-Alkynyl sowie die Alkynylteile von C₂-C₆-Alkynylcarbonyl, C₂-C₂-Alkynyloxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkynylthio-C₁-C₄-alkyl, Phenyl-C₂-C₄-alkynyl, Heteroaryl-C₂-C₄-alkynyl: C₃-C₆-Alkynyl wie voranstehend genannt sowie Ethynyl;
- 15 - C₁-C₄-Cyanoalkyl: z.B. Cyanomethyl, 1-Cyanoeth-1-yl, 2-Cyanoeth-1-yl, 1-Cyanoprop-1-yl, 2-Cyanoprop-1-yl, 3-Cyanoprop-1-yl, 1-Cyanoprop-2-yl, 2-Cyanoprop-2-yl, 1-Cyanobut-1-yl, 2-Cyanobut-1-yl, 3-Cyanobut-1-yl, 4-Cyanobut-1-yl, 1-Cyanobut-2-yl, 2-Cyanobut-2-yl, 1-Cyanobut-3-yl, 2-Cyanobut-3-yl, 1-Cyano-2-methylprop-3-yl, 2-Cyano-2-methylprop-3-yl, 3-Cyano-2-methylprop-3-yl und 2-Cyano-methyl-prop-2-yl;
- 20 - C₁-C₄-Hydroxyalkyl sowie die C₁-C₄-Hydroxyalkyl-Teile von Phenyl-C₁-C₄-hydroxyalkyl, Heteroaryl-C₁-C₄-hydroxyalkyl: z.B. Hydroxymethyl, 1-Hydroxyeth-1-yl, 2-Hydroxyeth-1-yl, 1-Hydroxyprop-1-yl, 2-Hydroxyprop-1-yl, 3-Hydroxyprop-1-yl, 1-Hydroxyprop-2-yl, 2-Hydroxyprop-2-yl, 1-Hydroxybut-1-yl, 2-Hydroxybut-1-yl, 3-Hydroxybut-1-yl, 4-Hydroxybut-1-yl, 1-Hydroxybut-2-yl, 2-Hydroxybut-2-yl, 1-Hydroxybut-3-yl, 2-Hydroxybut-3-yl, 1-Hydroxy-2-methyl-prop-3-yl, 2-Hydroxy-2-methyl-prop-3-yl, 3-Hydroxy-2-methyl-prop-3-yl und 2-Hydroxymethyl-prop-2-yl, 1,2-Dihydroxyethyl, 1,2-Dihydroxyprop-3-yl, 2,3-Dihydroxyprop-3-yl, 1,2-Dihydroxyprop-2-yl, 1,2-Dihydroxybut-4-yl, 2,3-Dihydroxybut-4-yl, 3,4-Dihydroxybut-4-yl, 1,2-Dihydroxybut-2-yl, 1,2-Dihydroxybut-3-yl, 2,3-Dihydroxybut-3-yl, 1,2-Dihydroxy-2-methyl-prop-3-yl, 2,3-Dihydroxy-2-methyl-prop-3-yl;
- 25 - C₁-C₆-Hydroxyalkyl: C₁-C₄-Hydroxyalkyl wie voranstehend genannt, sowie z.B. 1-Hydroxy-pent-5-yl, 2-Hydroxy-pent-5-yl, 3-Hydroxy-pent-5-yl, 4-Hydroxy-pent-5-yl, 5-Hydroxy-pent-5-yl, 1-Hydroxypent-4-yl, 2-Hydroxypent-4-yl, 3-Hydroxypent-4-yl, 4-Hydroxypent-4-yl, 1-Hydroxy-pent-3-yl, 2-Hydroxy-pent-3-yl, 3-Hydroxy-pent-3-yl, 1-Hydroxy-2-methyl-but-3-yl, 2-Hydroxy-2-methyl-but-3-yl, 3-Hydroxy-2-methyl-but-3-yl, 1-Hydroxy-2-methyl-but-4-yl, 2-Hydroxy-2-methyl-but-4-yl, 3-Hydroxy-2-methyl-but-4-yl, 4-Hydroxy-2-methyl-but-4-yl, 1-Hydroxy-3-methyl-but-4-yl, 2-Hydroxy-3-methyl-but-4-yl, 3-Hydroxy-3-methyl-but-4-yl, 4-Hydroxy-3-methyl-but-4-yl, 1-Hydroxy-hex-6-yl, 2-Hydroxy-hex-6-yl, 3-Hydroxy-hex-6-yl, 4-Hydroxy-hex-6-yl, 5-Hydroxy-hex-6-yl, 6-Hydroxy-hex-6-yl, 1-Hydroxy-2-methyl-pent-5-yl, 2-Hydroxy-2-methyl-pent-5-yl, 3-Hydroxy-2-methyl-pent-5-yl, 4-Hydroxy-2-methyl-pent-5-yl, 5-
- 30
- 35
- 40

- Hydroxy-2-methyl-pent-5-yl, 1-Hydroxy-3-methyl-pent-5-yl, 2-Hydroxy-3-methyl-pent-5-yl, 3-Hydroxy-3-methyl-pent-5-yl, 4-Hydroxy-3-methyl-pent-5-yl, 5-Hydroxy-3-methyl-pent-5-yl, 1-Hydroxy-4-methyl-pent-5-yl, 2-Hydroxy-4-methyl-pent-5-yl, 3-Hydroxy-4-methyl-pent-5-yl, 4-Hydroxy-4-methyl-pent-5-yl, 5-Hydroxy-4-methyl-pent-5-yl, 1-Hydroxy-5-methyl-pent-5-yl, 2-Hydroxy-5-methyl-pent-5-yl, 3-Hydroxy-5-methyl-pent-5-yl, 4-Hydroxy-5-methyl-pent-5-yl, 5-Hydroxy-5-methyl-pent-5-yl, 1-Hydroxy-2,3-dimethyl-but-4-yl, 2-Hydroxy-2,3-dimethyl-but-4-yl, 3-Hydroxy-2,3-dimethyl-but-4-yl, 4-Hydroxy-2,3-dimethyl-but-4-yl, 1,2-Dihydroxy-pent-5-yl, 2,3-Dihydroxy-pent-5-yl, 3,4-Dihydroxy-pent-5-yl, 4,5-Dihydroxy-pent-5-yl, 1,2-Dihydroxypent-4-yl, 2,3-Dihydroxypent-4-yl, 3,4-Dihydroxypent-4-yl, 4,5-Dihydroxypent-4-yl, 1,2-Dihydroxy-pent-3-yl, 2,3-Dihydroxy-pent-3-yl, 1,2-Dihydroxy-2-methyl-but-3-yl, 2,3-Dihydroxy-2-methyl-but-3-yl, 3,4-Dihydroxy-2-methyl-but-3-yl, 2-Hydroxy-2-hydroxymethyl-but-3-yl, 1,2-Dihydroxy-2-methyl-but-4-yl, 2,3-Dihydroxy-2-methyl-but-4-yl, 3,4-Dihydroxy-2-methyl-but-4-yl, 1,2-Dihydroxy-3-methyl-but-4-yl, 2,3-Dihydroxy-3-methyl-but-4-yl, 3,4-Dihydroxy-3-methyl-but-4-yl, 3-Hydroxy-3-hydroxymethyl-but-4-yl, 1,2-Dihydroxy-hex-6-yl, 2,3-Dihydroxy-hex-6-yl, 3,4-Dihydroxy-hex-6-yl, 4,5-Dihydroxy-hex-6-yl, 5,6-Dihydroxy-hex-6-yl, 1,2-Dihydroxy-2-methyl-pent-5-yl, 2,3-Dihydroxy-2-methyl-pent-5-yl, 3,4-Dihydroxy-2-methyl-pent-5-yl, 4,5-Dihydroxy-2-methyl-pent-5-yl, 2-Hydroxy-2-hydroxymethyl-pent-5-yl, 1,2-Dihydroxy-3-methyl-pent-5-yl, 2,3-Dihydroxy-3-methyl-pent-5-yl, 3,4-Dihydroxy-3-methyl-pent-5-yl, 4,5-Dihydroxy-3-methyl-pent-5-yl, 3-Hydroxy-3-hydroxymethyl-pent-5-yl, 1,2-Dihydroxy-4-methyl-pent-5-yl, 2,3-Dihydroxy-4-methyl-pent-5-yl, 3,4-Dihydroxy-4-methyl-pent-5-yl, 4,5-Dihydroxy-4-methyl-pent-5-yl, 4-Hydroxy-4-hydroxymethyl-pent-5-yl, 1,2-Dihydroxy-5-methyl-pent-5-yl, 2,3-Dihydroxy-5-methyl-pent-5-yl, 3,4-Dihydroxy-5-methyl-pent-5-yl, 4,5-Dihydroxy-5-methyl-pent-5-yl, 5-Hydroxy-5-hydroxymethyl-pent-5-yl, 1,2-Dihydroxy-2,3-dimethyl-but-4-yl, 2,3-Dihydroxy-2,3-dimethyl-but-4-yl, 3,4-Dihydroxy-2,3-dimethyl-but-4-yl, 2-Hydroxy-2-hydroxymethyl-3-methyl-but-4-yl, 3-Hydroxy-3-hydroxymethyl-2-methyl-but-4-yl;
- 30 - C₁-C₄-Halogenalkyl sowie die Halogenalkylteile von Phenyl-C₁-C₄-halogenalkyl, Heteroaryl-C₁-C₄-halogenalkyl: ein C₁-C₄-Alkylrest wie vorstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Chlormethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, Brommethyl, Iodmethyl, 2-Fluorethyl, 2-Chlorethyl, 2-Bromethyl, 2-Iodethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl, 2-Fluorpropyl, 3-Fluorpropyl, 2,2-Difluorpropyl, 2,3-Difluorpropyl, 2-Chlorpropyl, 3-Chlorpropyl, 2,3-Dichlorpropyl, 2-Brompropyl, 3-Brompropyl, 3,3,3-Trifluorpropyl, 3,3,3-Trichlorpropyl, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropyl, Heptafluorpropyl, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethyl, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethyl, 1-(Brommethyl)-2-bromethyl, 4-Fluorbutyl, 4-Chlorbutyl, 4-Brombutyl, Nonafluorbutyl, 1,1,2,2-Tetrafluorethyl und 1-Trifluormethyl-1,2,2,2,2-tetrafluorethyl;

- 5

- C₁-C₆-Halogenalkyl sowie die Halogenalkylteile von C₁-C₆-Halogenalkyl-C₁-C₄-thioalkyl: C₁-C₄-Halogenalkyl wie voranstehend genannt, sowie z.B. 5-Fluorpentyl, 5-Chlorpentyl, 5-Brompentyl, 5-Iodpentyl, Undecafluorpentyl, 6-Fluorhexyl, 6-Chlorhexyl, 6-Bromhexyl, 6-Iodhexyl und Tridecafluorhexyl;
- 10

- C₃-C₆-Halogenalkenyl: ein C₃-C₆-Alkenylrest, wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, z.B. 2-Chlorprop-2-en-1-yl, 3-Chlorprop-2-en-1-yl, 2,3-Dichlorprop-2-en-1-yl, 3,3-Dichlorprop-2-en-1-yl, 2,3,3-Trichlor-2-en-1-yl, 2,3-Dichlorbut-2-en-1-yl, 2-Bromprop-2-en-1-yl, 3-Bromprop-2-en-1-yl, 2,3-Dibromprop-2-en-1-yl, 3,3-Dibromprop-2-en-1-yl, 2,3,3-Tribrom-2-en-1-yl oder 2,3-Dibrombut-2-en-1-yl;
- 15

- C₂-C₆-Halogenalkenyl sowie die C₂-C₆-Halogenalkenyl-Teile von C₂-C₆-Halogenalkenyloxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl-C₁-C₄-thioalkyl, Phenyl-C₂-C₄-halogenalkenyl, Heteroaryl-C₂-C₄-halogenalkenyl: ein C₂-C₆-Alkenylrest, wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, z.B. 2-Chlorvinyl, 2-Chlorallyl, 3-Chlorallyl, 2,3-Dichlorallyl, 3,3-Dichlorallyl, 2,3,3-Trichlorallyl, 2,3-Dichlorbut-2-enyl, 2-Bromvinyl, 2-Bromallyl, 3-Bromallyl, 2,3-Dibromallyl, 3,3-Dibromallyl, 2,3,3-Tribromallyl oder 2,3-Dibrombut-2-enyl;

20
- C₂-C₆-Cyanoalkenyl: z.B. 2-Cyanovinyl, 2-Cyanoallyl, 3-Cyanoallyl, 2,3-Dicyanoallyl, 3,3-Dicyanoallyl, 2,3,3-Tricyanoallyl, 2,3-Dicyanobut-2-enyl;
- 25

- C₂-C₆-Hydroxyalkenyl sowie die Hydroxy-Teile von Phenyl-C₁-C₄-hydroxyalkenyl, Heteroaryl-C₁-C₄-hydroxyalkenyl: z.B. 2-Hydroxyvinyl, 2-Hydroxyallyl, 3-Hydroxyallyl, 2,3-Dihydroxyallyl, 3,3-Dihydroxyallyl, 2,3,3-Trihydroxyallyl, 2,3-Dihydroxybut-2-enyl;
- 30

- C₃-C₆-Halogenalkinyl: ein C₃-C₆-Alkinylrest, wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, z.B. 1,1-Difluor-prop-2-in-1-yl, 3-Iod-prop-2-in-1-yl, 4-Fluorbut-2-in-1-yl, 4-Chlorbut-2-in-1-yl, 1,1-Difluorbut-2-in-1-yl, 4-Iodbut-3-in-1-yl, 5-Fluorpent-3-in-1-yl, 5-Iodpent-4-in-1-yl, 6-Fluorhex-4-in-1-yl oder 6-Iodhex-5-in-1-yl;

35
- C₂-C₆-Halogenalkinyl sowie die C₂-C₆-Halogenalkinyl-Teile von C₂-C₆-Halogenalkinyloxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Halogenalkinyl-C₁-C₄-thioalkyl, Phenyl-C₂-C₄-halogenalkinyl, Heteroaryl-C₂-C₄-halogenalkinyl: ein C₂-C₆-Alkinylrest, wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, z.B. 1,1-Difluor-prop-2-in-1-yl, 3-Iod-prop-2-in-1-yl, 4-Fluorbut-2-in-1-yl, 4-Chlorbut-2-in-1-yl, 1,1-Difluorbut-2-in-1-yl, 4-Iodbut-3-in-1-yl, 5-Fluorpent-3-in-1-yl, 5-Iodpent-4-in-1-yl, 6-Fluorhex-4-in-1-yl oder 6-Iodhex-5-in-1-yl;

40

- C₂-C₆-Cyanoalkinyl: z.B. 1,1-Dicyano-prop-2-in-1-yl, 3-Cyano -prop-2-in-1-yl, 4-Cyano-but-2-in-1-yl, 1,1-Dicyanobut-2-in-1-yl, 4-Cyanobut-3-in-1-yl, 5-Cyanopent-3-in-1-yl, 5-Cyanopent-4-in-1-yl, 6-Cyanohex-4-in-1-yl oder 6-Cyanohex-5-in-1-yl;

- 5 - C₂-C₆-Hydroxyalkinyl sowie die Hydroxy-Teile von Phenyl-C₂-C₄-hydroxyalkinyl, Heteroaryl-C₂-C₄-hydroxyalkinyl: z.B. 1,1-Dihydroxy-prop-2-in-1-yl, 3-Hydroxy -prop-2-in-1-yl, 4-Hydroxy-but-2-in-1-yl, 1,1-Dihydroxybut-2-in-1-yl, 4-Hydroxybut-3-in-1-yl, 5-Hydroxypent-3-in-1-yl, 5-Hydroxypent-4-in-1-yl, 6-Hydroxyhex-4-in-1-yl oder 6-Hydroxyhex-5-in-1-yl;

- 10 - C₁-C₆-Alkylsulfinyl (C₁-C₆-Alkyl-S(=O)-) sowie die C₁-C₆-Alkylsulfinyl-Teile von C₁-C₆-Alkylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl: z.B. Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Propylsulfinyl, 1-Methylethylsulfinyl, Butylsulfinyl, 1-Methylpropylsulfinyl, 2-Methylpropylsulfinyl, 1,1-Dimethylethylsulfinyl, Pentylsulfinyl, 1-Methylbutylsulfinyl, 2-Methylbutylsulfinyl, 3-Methylbutylsulfinyl, 2,2-Dimethylpropylsulfinyl, 1-Ethylpropylsulfinyl, 1,1-Dimethylpropylsulfinyl, 1,2-Dimethylpropylsulfinyl, Hexylsulfinyl, 1-Methylpentylsulfinyl, 2-Methylpentylsulfinyl, 3-Methylpentylsulfinyl, 4-Methylpentylsulfinyl, 1,1-Dimethylbutylsulfinyl, 1,2-Dimethylbutylsulfinyl, 1,3-Dimethylbutylsulfinyl, 2,2-Dimethylbutylsulfinyl, 2,3-Dimethylbutylsulfinyl, 3,3-Dimethylbutylsulfinyl, 1-Ethylbutylsulfinyl, 2-Ethylbutylsulfinyl, 1,1,2-Trimethylpropylsulfinyl, 1,2,2-Trimethylpropylsulfinyl, 1-Ethyl-1-methylpropylsulfinyl und 1-Ethyl-2-methylpropylsulfinyl;

- 15 - C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl sowie die C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl-Teile von C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl: C₁-C₆-Alkylsulfinylrest wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Fluormethylsulfinyl, Difluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfinyl, Chlordifluormethylsulfinyl, Bromdifluormethylsulfinyl, 2-Fluorethylsulfinyl, 2-Chlorethylsulfinyl, 2-Bromethylsulfinyl, 2-Iodethylsulfinyl, 2,2-Difluorethylsulfinyl, 2,2,2-Trifluorethylsulfinyl, 2,2,2-Trichlorethylsulfinyl, 2-Chlor-2-fluorethylsulfinyl, 2-Chlor-2,2-difluorethylsulfinyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethylsulfinyl, Pentafluorethylsulfinyl, 2-Fluorpropylsulfinyl, 3-Fluorpropylsulfinyl, 2-Chlorpropylsulfinyl, 3-Chlorpropylsulfinyl, 2-Brompropylsulfinyl, 3-Brompropylsulfinyl, 2,2-Difluorpropylsulfinyl, 2,3-Difluorpropylsulfinyl, 2,3-Dichlorpropylsulfinyl, 3,3,3-Trifluorpropylsulfinyl, 3,3,3-Trichlorpropylsulfinyl, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropylsulfinyl, Heptafluorpropylsulfinyl, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethylsulfinyl, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethylsulfinyl, 1-(Brommethyl)-2-bromethylsulfinyl, 4-Fluorbutylsulfinyl, 4-Chlorbutylsulfinyl, 4-Brombutylsulfinyl, Nonafluorbutylsulfinyl, 5-Fluorpentylsulfinyl, 5-Chlorpentylsulfinyl, 5-Brompentylsulfinyl, 5-Iodpentylsulfinyl, Undecafluorpentylsulfinyl, 6-Fluorhexylsulfinyl, 6-Chlorhexylsulfinyl, 6-Bromhexylsulfinyl, 6-Iodhexylsulfinyl und Dodecafluorhexylsulfinyl;

- 20 - C₁-C₆-Alkylsulfonyl (C₁-C₆-Alkyl-S(O)₂-) sowie die C₁-C₆-Alkylsulfonyl-Teile von C₁-C₆-Alkylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfonylamino, C₁-C₆-Alkylsulfonylamino-C₁-

- 25

- 30

- 35

- 40

- C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl(C₁-C₆-alkyl)amino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfonylaminocarbonyl: z.B. Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Propylsulfonyl, 1-Methylethylsulfonyl, Butylsulfonyl, 1-Methylpropylsulfonyl, 2-Methyl-propylsulfonyl, 1,1-Dimethylethylsulfonyl, Pentylsulfonyl, 1-Methylbutylsulfonyl, 2-Methylbutylsulfonyl, 3-Methylbutylsulfonyl, 1,1-Dimethylpropylsulfonyl, 1,2-Dimethylpropylsulfonyl, 2,2-Dimethylpropylsulfonyl, 1-Ethylpropylsulfonyl, Hexylsulfonyl, 1-Methylpentylsulfonyl, 2-Methylpentylsulfonyl, 3-Methylpentylsulfonyl, 4-Methylpentylsulfonyl, 1,1-Dimethylbutylsulfonyl, 1,2-Dimethylbutylsulfonyl, 1,3-Dimethylbutylsulfonyl, 2,2-Dimethylbutylsulfonyl, 2,3-Dimethylbutylsulfonyl, 3,3-Dimethylbutylsulfonyl, 1-Ethylbutylsulfonyl, 2-Ethylbutylsulfonyl, 1,1,2-Trimethylpropylsulfonyl, 1,2,2-Trimethylpropylsulfonyl, 1-Ethyl- 1-methylpropylsulfonyl und 1-Ethyl-2-methylpropylsulfonyl;
- 5
- 15
- 20
- 25
- 30
- 35
- 40
- C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl sowie die C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl-Teile von C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonylamino: einen C₁-C₆-Alkylsulfonylrest wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Fluormethylsulfonyl, Difluormethylsulfonyl, Trifluormethylsulfonyl, Chlordifluormethylsulfonyl, Bromdifluormethylsulfonyl, 2-Fluorethylsulfonyl, 2-Chlorethylsulfonyl, 2-Bromethylsulfonyl, 2-Iodethylsulfonyl, 2,2-Difluorethyl-sulfonyl, 2,2,2-Trifluorethylsulfonyl, 2-Chlor-2-fluorethylsulfonyl, 2-Chlor-2,2-difluorethylsulfonyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethylsulfonyl, 2,2,2-Trihlorethylsulfonyl, Pentafluorethylsulfonyl, 2-Fluorpropylsulfonyl, 3-Fluorpropylsulfonyl, 2-Chlorpropylsulfonyl, 3-Chlorpropylsulfonyl, 2-Brompropylsulfonyl, 3-Brompropylsulfonyl, 2,2-Difluorpropylsulfonyl, 2,3-Difluorpropylsulfonyl, 2,3-Dichlorpropylsulfonyl, 3,3,3-Trifluorpropylsulfonyl, 3,3,3-Trichlorpropylsulfonyl, 2,2,3,3,3-Pentafluor-propylsulfonyl, Heptafluorpropylsulfonyl, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethylsulfonyl, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethylsulfonyl, 1-(Brommethyl)-2-bromethylsulfonyl, 4-Fluorbutylsulfonyl, 4-Chlorbutylsulfonyl, 4-Brombutylsulfonyl, Nonafluorbutylsulfonyl, 5-Fluorpentylsulfonyl, 5-Chlorpentylsulfonyl, 5-Brompentylsulfonyl, 5-Iod-pentylsulfonyl, 6-Fluorhexylsulfonyl, 6-Bromhexylsulfonyl, 6-Iodhexylsulfonyl und Dodecafluorhexylsulfonyl;
- C₁-C₄-Alkoxy sowie die Alkoxyteile von Hydroxycarbonyl-C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl und C₁-C₄-alkyl-C₁-C₄-alkoxycarbonylamino: z.B. Methoxy, Ethoxy, Propoxy, 1-Methylethoxy, Butoxy, 1-Methylpropoxy, 2-Methylpropoxy und 1,1-Dimethylethoxy;
- C₁-C₆-Alkoxy sowie die Alkoxyteile von Hydroxycarbonyl-C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₄-Alkyl-C₁-C₆-alkoxycarbonylamino, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl-C₁-C₆-alkoxy, N-(C₁-C₆-Alkoxy)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkenyl)-N-(C₁-C₆-alkoxy)-aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkynyl)-N-(C₁-C₆-alkoxy)-aminocarbonyl, C₁-C₆-Alkoxyimino-C₁-C₆-alkyl und C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy: C₁-C₄-Alkoxy wie voranstehend genannt, sowie z.B. Pentoxy, 1-Methylbutoxy,

- 2-Methylbutoxy, 3-Methoxylbutoxy, 1,1-Dimethyl-propoxy, 1,2-Dimethyl-propoxy, 2,2-Dimethylpropoxy, 1-Ethylpropoxy, Hexoxy, 1-Methylpentoxy, 2-Methylpentoxy, 3-Methylpentoxy, 4-Methylpentoxy, 1,1-Di-methylbutoxy, 1,2-Dimethyl-butoxy, 1,3-Dimethylbutoxy, 2,2-Dimethylbutoxy, 2,3-Dimethylbutoxy, 3,3-Dimethyl-butoxy, 1-Ethylbutoxy, 2-Ethylbutoxy, 1,1,2-Tri-methylpropoxy, 1,2,2-Trimethyl-propoxy, 1-Ethyl-1-methylpropoxy und 1-Ethyl-2-methylpropoxy;
- 5
- C₁-C₄-Halogenalkoxy: ein C₁-C₄-Alkoxyrest wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Fluormethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Bromdifluormethoxy, 2-Fluorethoxy, 2-Chlorethoxy, 2-Brommethoxy, 2-Iodethoxy, 2,2-Difluorethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-2-fluorethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy, 2,2-Dichlor-2-fluorethoxy, 2,2,2-Trichlorethoxy, Pentafluorethoxy, 2-Fluorpropoxy, 3-Fluorpropoxy, 2-Chlorpropoxy, 3-Chlorpropoxy, 2-Brompropoxy, 3-Brompropoxy, 2,2-Difluorpropoxy, 2,3-Difluorpropoxy, 2,3-Dichlorpropoxy, 3,3,3-Trifluorpropoxy, 3,3,3-Trichlorpropoxy, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropoxy, Heptafluorpropoxy, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethoxy, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethoxy, 1-(Brommethyl)-2-bromethoxy, 4-Fluorbutoxy, 4-Chlorbutoxy, 4-Brombutoxy und Nonfluorbutoxy;
- 10
- C₁-C₆-Halogenalkoxy sowie die C₁-C₆-Halogenalkoxy-Teile von C₁-C₆-Halogenalkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl: C₁-C₄-Halogenalkoxy wie voranstehend genannt, sowie z.B. 5-Fluorpentoxy, 5-Chlorpentoxy, 5-Brompentoxy, 5-Iodpentoxy, Undecafluorpentoxy, 6-Fluorhexoxy, 6-Chlorhexoxy, 6-Bromhexoxy, 6-Iodhexoxy und Dodecafluorhexoxy;
- 15
- C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl sowie die C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl-Teile von C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl: durch C₁-C₆-Alkoxy wie vorstehend genannt substituiertes C₁-C₄-Alkyl, also z.B. für Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Propoxymethyl, (1-Methylethoxy)methyl, Butoxymethyl, (1-Methylpropoxy)methyl, (2-Methylpropoxy)methyl, (1,1-Dimethylethoxy)methyl, 2-(Methoxy)ethyl, 2-(Ethoxy)ethyl, 2-(Propoxy)ethyl, 2-(1-Methylethoxy)ethyl, 2-(Butoxy)ethyl, 2-(1-Methylpropoxy)-ethyl, 2-(2-Methylpropoxy)ethyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy)ethyl, 2-(Methoxy)-propyl, 2-(Ethoxy)propyl, 2-(Propoxy)propyl, 2-(1-Methylethoxy)propyl, 2-(Butoxy)propyl, 2-(1-Methylpropoxy)propyl, 2-(2-Methylpropoxy)propyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy)propyl, 3-(Methoxy)propyl, 3-(Ethoxy)-propyl, 3-(Propoxy)propyl, 3-(1-Methylethoxy)-propyl, 3-(Butoxy)propyl, 3-(1-Methylpropoxy)propyl, 3-(2-Methylpropoxy)propyl, 3-(1,1-Dimethylethoxy)propyl, 2-(Methoxy)-butyl, 2-(Ethoxy)butyl, 2-(Propoxy)-butyl, 2-(1-Methylethoxy)butyl, 2-(Butoxy)butyl, 2-(1-Methylpropoxy)butyl, 2-(2-Methylpropoxy)butyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy)butyl, 3-(Methoxy)butyl, 3-(Ethoxy)-butyl, 3-(Propoxy)butyl, 3-(1-Methylethoxy)butyl, 3-(Butoxy)-butyl, 3-(1-Methylpropoxy)-butyl, 3-(2-Methylpropoxy)butyl, 3-(1,1-Dimethylethoxy)butyl, 4-(Methoxy)-butyl, 4-(Ethoxy)butyl, 4-(Propoxy)butyl, 4-(1-Methylethoxy)butyl, 4-(Butoxy)butyl, 4-(1-Methylpropoxy)butyl, 4-(2-Methylpropoxy)butyl und 4-(1,1-Dimethylethoxy)-butyl;
- 20
- 25
- 30
- 35
- 40

- 5 - C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl sowie die Alkoxy-carbonyl-teile von C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy-carbonyl und Di(C₁-C₄-alkyl)amino-C₁-C₄-alkoxy-carbonyl: z.B. Methoxy-carbonyl, Ethoxy-carbonyl, Propoxy-carbonyl, 1-Methylethoxy-carbonyl, Butoxy-carbonyl, 1-Methylpropoxy-carbonyl, 2-Methylpropoxy-carbonyl oder 1,1-Dimethylethoxy-carbonyl;
- 10 - C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl sowie die Alkoxy-carbonyl-teile von C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₆-alkoxy (C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl)amino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl -C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkyl-(C₁-C₆-alkoxy-carbonyl)amino: C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, wie voranstehend genannt, sowie z.B. Pentoxy-carbonyl, 1-Methylbutoxy-carbonyl, 2-Methylbutoxy-carbonyl, 3-Methyl-butoxy-carbonyl, 2,2-Dimethylpropoxy-carbonyl, 1-Ethylpropoxy-carbonyl, Hexoxy-carbonyl, 1,1-Dimethylpropoxy-carbonyl, 1,2-Dimethylpropoxy-carbonyl, 1-Methyl-pentoxy-carbonyl, 2-Methylpentoxy-carbonyl, 3-Methylpentoxy-carbonyl, 4-Methyl-pentoxy-carbonyl, 1,1-Dimethylbutoxy-carbonyl, 1,2-Dimethylbutoxy-carbonyl, 1,3-Dimethylbutoxy-carbonyl, 2,2-Dimethylbutoxy-carbonyl, 2,3-Dimethylbutoxy-carbonyl, 3,3-Dimethylbutoxy-carbonyl, 1-Ethylbutoxy-carbonyl, 2-Ethylbutoxy-carbonyl, 1,1,2-Trimethylpropoxy-carbonyl, 1,2,2-Trimethylpropoxy-carbonyl, 1-Ethyl-1-methyl-propoxy-carbonyl oder 1-Ethyl-2-methyl-propoxy-carbonyl;
- 15 - C₁-C₄-Alkylthio sowie die C₁-C₄-Alkylthio-Teile von C₁-C₆-Halogenalkyl-C₁-C₄-thioalkyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl-C₁-C₄-thioalkyl, C₂-C₆-Halogenalkinyl-C₁-C₄-thioalkyl: z.B. Methylthio, Ethylthio, Propylthio, 1-Methylethylthio, Butylthio, 1-Methylpropylthio, 2-Methylpropylthio und 1,1-Dimethylethylthio;
- 20 - C₁-C₆-Alkylthio sowie die C₁-C₆-Alkylthio-Teile von C₁-C₆-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl: C₁-C₄-Alkylthio wie voranstehend genannt, sowie z.B. Pentylthio, 1-Methylbutylthio, 2-Methylbutylthio, 3-Methylbutylthio, 2,2-Dimethylpropylthio, 1-Ethylpropylthio, Hexylthio, 1,1-Dimethylpropylthio, 1,2-Dimethylpropylthio, 1-Methylpentylthio, 2-Methylpentylthio, 3-Methylpentylthio, 4-Methylpentylthio, 1,1-Dimethylbutylthio, 1,2-Dimethylbutylthio, 1,3-Dimethylbutylthio, 2,2-Dimethylbutylthio, 2,3-Dimethylbutylthio, 3,3-Dimethylbutylthio, 1-Ethylbutylthio, 2-Ethylbutylthio, 1,1,2-Trimethylpropylthio, 1,2,2-Trimethylpropylthio, 1-Ethyl-1-methylpropylthio und 1-Ethyl-2-methylpropylthio;
- 25 - C₁-C₆-Alkylamino sowie die C₁-C₆-Alkylamino-reste von N(C₁-C₆-Alkylamino)imino-C₁-C₆-alkyl, (C₁-C₆-Alkyl)amino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl-(C₁-C₆-alkyl)amino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl(C₁-C₆-alkylamino)C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₆-Alkyl)-aminothiocarbonyl und (C₁-C₆-Alkyl)aminocyanoinino: z.B. Methylamino, Ethylamino, Propylamino, 1-Methylethylamino, Butylamino, 1-Methylpropylamino, 2-Methylpropylamino, 1,1-Dimethylethylamino, Pentylamino, 1-Methylbutylamino, 2-Methylbutylamino, 3-Methylbutylamino, 2,2-Dimethylpropylamino, 1-
- 30
- 35
- 40

- Ethylpropylamino, Hexylamino, 1,1-Dimethylpropylamino, 1,2-Dimethylpropylamino, 1-Methylpentylamino, 2-Methylpentylamino, 3-Methyl-pentylamino, 4-Methyl-pentylamino, 1,1-Dimethylbutylamino, 1,2-Dimethylbutyl-amino, 1,3-Dimethylbutyl-amino, 2,2-Dimethylbutylamino, 2,3-Dimethylbutylamino, 3,3-Dimethylbutylamino, 1-
- 5 Ethylbutylamino, 2-Ethylbutylamino, 1,1,2-Trimethylpropylamino, 1,2,2-Trimethylpropylamino, 1-Ethyl-1-methylpropylamino oder 1-Ethyl-2-methylpropylamino;
- Di(C₁-C₄-alkyl)amino: z.B. N,N-Dimethylamino, N,N-Diethylamino, N,N-Dipropylamino, N,N-Di-(1-methylethyl)-amino, N,N-Dibutylamino, N,N-Di-(1-methylpropyl)-amino, N,N-Di-(2-methylpropyl)-amino, N,N-Di-(1,1-dimethylethyl)-amino, N-Ethyl-N-methylamino, N-Methyl-N-propylamino, N-Methyl-N-(1-methylethyl)amino, N-Butyl-N-methylamino, N-Methyl-N-(1-methylpropyl)amino, N-Methyl-N-(2-methylpropyl)-amino, N-(1,1-Dimethyl-ethyl)-N-methylamino, N-Ethyl-N-propylamino, N-Ethyl-N-(1-methylethyl)amino, N-Butyl-N-ethylamino, N-Ethyl-N-(1-methylpropyl)amino, N-
 - 10 N-Ethyl-N-(2-methylpropyl)-amino, N-Ethyl-N-(1,1-dimethyl-ethyl)amino, N-(1-Methylethyl)-N-propylamino, N-Butyl-N-propylamino, N-(1-Methylpropyl)-N-propylamino, N-(2-Methylpropyl)-N-propylamino, N-(1,1-Dimethyl-ethyl)-N-propylamino, N-Butyl-N-(1-methylethyl)-amino, N-(1-Methylethyl)-N-(1-methylpropyl)amino, N-(1-Methylethyl)-N-(2-methyl-propyl)amino, N-(1,1-Dimethyl-ethyl)-N-(1-methylethyl)amino, N-
 - 15 N-Butyl-N-(1-methylpropyl)amino, N-Butyl-N-(2-methylpropyl)amino, N-Butyl-N-(1,1-dimethyl-ethyl)amino, N-(1-Methylpropyl)-N-(2-methylpropyl)amino, N-(1,1-Dimethyl-ethyl)-N-(1-methylpropyl)amino und N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(2-methylpropyl)amino;
 - Di(C₁-C₆-alkyl)amino sowie die Dialkylaminoreste von N-(Di-C₁-C₆-alkylamino)imino-C₁-C₆-alkyl, Di(C₁-C₆-alkyl)amino-C₁-C₄-alkyl und Di(C₁-C₆-alkyl)aminocyanoino: Di(C₁-C₄-alkyl)amino wie voranstehend genannt sowie: z.B. N,N-Dipentylamino, N,N-Dihexylamino, N-Methyl-N-pentylamino, N-Ethyl-N-pentylamino, N-Methyl-N-hexylamino und N-Ethyl-N-hexylamino;(C₁-C₄-Alkylamino)carbonyl: z.B. Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, Propylaminocarbonyl, 1- Methyl-
 - 25 ethylaminocarbonyl, Butylaminocarbonyl, 1- Methylpropylaminocarbonyl, 2- Methylpropylaminocarbonyl oder 1,1- Dimethylethylaminocarbonyl;
 - (C₁-C₄-Alkyl)aminocarbonyl sowie die (C₁-C₄-Alkyl)aminocarbonyl-Teile von (C₁-C₄-Alkylamino)carbonylamino: z.B. Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, Propylaminocarbonyl, 1-Methylethylaminocarbonyl, Butylaminocarbonyl, 1-Methylpropylaminocarbonyl, 2-Methylpropylaminocarbonyl oder 1,1-Dimethylethylaminocarbonyl;
 - 35
 - Di(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl sowie die Di(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl-Teile von Di(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonylamino: z.B. N,N-Dimethylaminocarbonyl, N,N-Diethylaminocarbonyl, N,N-Di-(1-methylethyl)aminocarbonyl, N,N-Dipropylaminocarbonyl, N,N-Dibutylaminocarbonyl, N,N-Di-(1-methylpropyl)aminocarbonyl, N,N-Di-(2-methylpropyl)aminocarbonyl, N,N-Di-(1,1-dimethylethyl)aminocarbonyl, N-Ethyl-N-
 - 40

- methylaminocarbonyl, N-Methyl-N-propylaminocarbonyl, N-Methyl-N-(1-methyl-ethyl)aminocarbonyl, N-Butyl-N-methylaminocarbonyl, N-Methyl-N-(1-methyl-propyl)aminocarbonyl, N-Methyl-N-(2-methylpropyl)aminocarbonyl, N-(1,1-Dimethyl-ethyl)-N-methylaminocarbonyl, N-Ethyl-N-propylaminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1-
 5 methylethyl)aminocarbonyl, N-Butyl-N-ethylaminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1-methyl-propyl)aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(2-methylpropyl)aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1,1-dimethylethyl)aminocarbonyl, N-(1-Methylethyl)-N-propylaminocarbonyl, N-Butyl-N-propylaminocarbonyl, N-(1-Methylpropyl)-N-propylaminocarbonyl, N-(2-Methyl-propyl)-N-propylaminocarbonyl, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-propylaminocarbonyl, N-
 10 Butyl-N-(1-methylethyl)aminocarbonyl, N-(1-Methylethyl)-N-(1-methylpropyl)-amino-carbonyl, N-(1-Methylethyl)-N-(2-methylpropyl)aminocarbonyl, N-(1,1-Dimethyl-ethyl)-N-(1-methylethyl)aminocarbonyl, N-Butyl-N-(1-methylpropyl)-aminocarbonyl, N-Butyl-N-(2-methylpropyl)aminocarbonyl, N-Butyl-N-(1,1-dimethyl-ethyl)amino-carbonyl, N-(1-Methylpropyl)-N-(2-methylpropyl)aminocarbonyl, N-(1,1-Dimethyl-ethyl)-N-(1-methylpropyl)aminocarbonyl oder N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(2-methyl-propyl)aminocarbonyl;
- (C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl sowie die (C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl-Teile von (C₁-C₆-Alkylamino)carbonylamino, (C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₆-
 20 Alkyl)aminocarbonyloxy-C₁-C₄-alkyl und (C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonylamino-C₁-C₄-alkyl: (C₁-C₄-Alkylamino)carbonyl, wie voranstehend genannt, sowie z.B. Pentylami-nocarbonyl, 1-Methylbutylaminocarbonyl, 2-Methyl-butylaminocarbonyl, 3-Methylbutylaminocarbonyl, 2,2-Dimethylpropylamino-carbonyl, 1-Ethyl-propylaminocarbonyl, Hexylaminocarbonyl, 1,1-Dimethylpropyl-aminocarbonyl, 1,2-Dimethylpropylaminocarbonyl, 1-Methylpentylaminocarbonyl, 2-Methylpentyl-aminocarbonyl, 3-Methylpentylaminocarbonyl, 4-Methylpentylamino-carbonyl, 1,1-Dimethylbutylaminocarbonyl, 1,2-Dimethylbutylaminocarbonyl, 1,3-Dimethylbutyl-aminocarbonyl, 2,2-Dimethylbutylaminocarbonyl, 2,3-Dimethylbutyl-aminocarbonyl, 3,3-Dimethylbutylaminocarbonyl, 1-Ethylbutylaminocarbonyl, 2-Ethylbutylamino-carbonyl, 1,1,2-Trimethylpropylaminocarbonyl, 1,2,2-Trimethyl-propylaminocarbonyl, 1-Ethyl-1-methylpropylaminocarbonyl oder 1-Ethyl-2-methyl-propylaminocarbonyl;
 - Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl sowie die Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl-Teile von
 35 Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonylamino, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyloxy-C₁-C₄-alkyl und Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl-amino-C₁-C₄-alkyl: Di(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl, wie voranstehend genannt, sowie z.B. N-Methyl-N-pentylaminocarbonyl, N-Methyl-N-(1-methylbutyl)aminocarbonyl, N-Methyl-N-(2-methylbutyl)aminocarbonyl, N-Methyl-N-(3-methylbutyl)aminocarbonyl, N-Methyl-N-(2,2-dimethylpropyl)aminocarbonyl, N-Methyl-N-(1-
 40 ethylpropyl)aminocarbonyl, N-Methyl-N-hexylaminocarbonyl, N-Methyl-N-(1,1-dimethylpropyl)aminocarbonyl, N-Methyl-N-(1,2-dimethylpropyl)aminocarbonyl, N-Methyl-N-(1-methylpentyl)aminocarbonyl, N-Methyl-N-(2-methylpentyl)-amino-

- carbonyl, N-Methyl-N-(3-methylpentyl)aminocarbonyl, N-Methyl-N-(4-methylpentyl)aminocarbonyl, N-Methyl-N-(1,1-dimethylbutyl)aminocarbonyl, N-Methyl-N-(1,2-dimethylbutyl)aminocarbonyl, N-Methyl-N-(1,3-dimethylbutyl)aminocarbonyl, N-Methyl-N-(2,2-dimethylbutyl)aminocarbonyl, N-Methyl-N-(2,3-dimethylbutyl)aminocarbonyl, N-Methyl-N-(3,3-dimethylbutyl)aminocarbonyl, N-Methyl-N-(1-ethyl-butyl)-aminocarbonyl, N-Methyl-N-(2-ethylbutyl)aminocarbonyl, N-Methyl-N-(1,1,2-trimethylpropyl)aminocarbonyl, N-Methyl-N-(1,2,2-trimethylpropyl)aminocarbonyl, N-Methyl-N-(1-ethyl-1-methylpropyl)aminocarbonyl, N-Methyl-N-(1-ethyl-2-methylpropyl)aminocarbonyl, N-Ethyl-N-pentylaminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1-methylbutyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(2-methylbutyl)aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(3-methylbutyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(2,2-dimethylpropyl)aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1-ethylpropyl)aminocarbonyl, N-Ethyl-N-hexylaminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1,1-dimethylpropyl)aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1,2-dimethylpropyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1-methylpentyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(2-methylpentyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(3-methylpentyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(4-methylpentyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1,1-dimethylbutyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1,2-dimethylbutyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1,3-dimethylbutyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(2,2-dimethylbutyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(2,3-dimethylbutyl)aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(3,3-dimethylbutyl)aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1-ethylbutyl)aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(2-ethylbutyl)aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1,1,2-trimethylpropyl)aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1,2,2-trimethylpropyl)aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1-ethyl-1-methylpropyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1-ethyl-2-methylpropyl)aminocarbonyl, N-Propyl-N-pentylaminocarbonyl, N-Butyl-N-pentylaminocarbonyl, N,N-Dipentylaminocarbonyl, N-Propyl-N-hexylaminocarbonyl, N-Butyl-N-hexylaminocarbonyl, N-Pentyl-N-hexylaminocarbonyl oder N,N-Dihexylaminocarbonyl;
- Di(C₁-C₆-alkyl)aminothiocarbonyl: z.B. N,N-Dimethylaminothiocarbonyl, N,N-Diethylaminothiocarbonyl, N,N-Di-(1-methylethyl)aminothiocarbonyl, N,N-Dipropylaminothiocarbonyl, N,N-Dibutylaminothiocarbonyl, N,N-Di-(1-methylpropyl)aminothiocarbonyl, N,N-Di-(2-methylpropyl)aminothiocarbonyl, N,N-Di-(1,1-dimethylethyl)-aminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-methylaminothiocarbonyl, N-Methyl-N-propyl-aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(1-methylethyl)aminothiocarbonyl, N-Butyl-N-methylaminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(1-methylpropyl)aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(2-methylpropyl)aminothiocarbonyl, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-methylaminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-propylaminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-(1-methylethyl)aminothiocarbonyl, N-Butyl-N-ethylaminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-(1-methylpropyl)aminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-(2-methylpropyl)aminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-(1,1-dimethylethyl)aminothiocarbonyl, N-(1-Methylethyl)-N-propylaminothiocarbonyl, N-Butyl-N-propylaminothiocarbonyl, N-(1-Methylpropyl)-N-propylaminothiocarbonyl, N-(2-Methylpropyl)-N-propylaminothiocarbonyl, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-propylaminothiocarbonyl, N-Butyl-N-(1-methylethyl)aminothiocarbonyl, N-(1-Methylethyl)-N-(1-methylpropyl)-aminothiocarbonyl, N-(1-Methylethyl)-N-(2-methylpropyl)aminothiocarbonyl, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylethyl)- aminothiocarbonyl, N-Butyl-N-(1-methylpropyl)-

- aminothiocarbonyl, N-Butyl-N-(2-methylpropyl)aminothiocarbonyl, N-Butyl-N-(1,1-dimethylethyl)aminothiocarbonyl, N-(1-Methylpropyl)-N-(2-methylpropyl)aminothiocarbonyl, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylpropyl)aminothiocarbonyl, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(2-methylpropyl)aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-pentylaminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(1-methylbutyl)aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(2-methylbutyl)aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(3-methylbutyl)aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(2,2-dimethylpropyl)aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(1-ethylpropyl)aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-hexylaminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(1,1-dimethylpropyl)aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(1,2-dimethylpropyl)aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(1-methylpentyl)aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(2-methylpentyl)aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(3-methylpentyl)aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(4-methylpentyl)aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(1,1-dimethylbutyl)aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(1,2-dimethylbutyl)aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(1,3-dimethylbutyl)aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(2,2-dimethylbutyl)aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(2,3-dimethylbutyl)aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(3,3-dimethylbutyl)aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(1-ethylbutyl)aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(2-ethylbutyl)aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-ethyl-N-(1,1,2-trimethylpropyl)aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(1,2,2-trimethylpropyl)aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(1-ethyl-1-methylpropyl)aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(1-ethyl-2-methylpropyl)aminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-pentylaminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-(1-methylbutyl)aminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-(2-methylbutyl)aminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-(3-methylbutyl)aminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-(2,2-dimethylpropyl)aminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-1-ethylpropyl)aminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-hexylaminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-(1,1-dimethylpropyl)aminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-(1,2-dimethylpropyl)aminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-(1-methylpentyl)aminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-(2-methylpentyl)aminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-(3-methylpentyl)aminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-(4-methylpentyl)aminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-(1,1-dimethylbutyl)aminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-(1,2-dimethylbutyl)aminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-(1,3-dimethylbutyl)aminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-(2,2-dimethylbutyl)aminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-(2,3-dimethylbutyl)aminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-(3,3-dimethylbutyl)aminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-(1-ethylbutyl)aminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-(2-ethylbutyl)aminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-(1,1,2-trimethylpropyl)aminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-(1,2,2-trimethylpropyl)aminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-(1-ethyl-1-methylpropyl)aminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-(1-ethyl-2-methylpropyl)aminothiocarbonyl, N-Propyl-N-pentylaminothiocarbonyl, N-Butyl-N-pentylaminothiocarbonyl, N,N-Dipentylaminothiocarbonyl, N-Propyl-N-hexylaminothiocarbonyl, N-Butyl-N-hexylaminothiocarbonyl, N-Pentyl-N-hexylaminothiocarbonyl oder N,N-Dihexylaminothiocarbonyl;
- drei- bis sechsgliedriges Heterocycl: monocyclische, gesättigte oder partiell ungesättigte Kohlenwasserstoffe mit drei bis sechs Ringgliedern wie voranstehend genannt, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome, oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, oder ein bis drei Sau-

erstoffatome, oder ein bis drei Schwefelatome enthalten können, und welche über ein C-Atom oder ein N-Atom verknüpft sein können, z.B.

5 z.B. 2-Oxiranyl, 2-Oxetanyl, 3-Oxetanyl, 2-Aziridinyl, 3-Thiethanyl, 1-Azetidinyl, 2-Azetidinyl,

z.B. 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isoxazolidinyl, 4-Isoxazolidinyl, 5-Isoxazolidinyl, 3-Isythiazolidinyl, 4-Isythiazolidinyl, 5-Isythiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl, 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 1,2,4-Oxadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Triazolidin-3-yl, 1,3,4-Oxadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Thiadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Triazolidin-2-yl, 1,2,3,4-Tetrazolidin-5-yl;

15 z.B. 1-Pyrrolidinyl, 2-Isythiazolidinyl, 2-Isythiazolidinyl, 1-Pyrazolidinyl, 3-Oxazolidinyl, 3-Thiazolidinyl, 1-Imidazolidinyl, 1,2,4-Triazolidin-1-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-2-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-4-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-2-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-4-yl, 1,2,3,4-Tetrazolidin-1-yl,

20 z.B. 2,3-Dihydrofur-2-yl, 2,3-Dihydrofur-3-yl, 2,4-Dihydrofur-2-yl, 2,4-Dihydrofur-3-yl, 2,3-Dihydrothien-2-yl, 2,3-Dihydrothien-3-yl, 2,4-Dihydrothien-2-yl, 2,4-Dihydrothien-3-yl, 4,5-Dihydropyrrol-2-yl, 4,5-Dihydropyrrol-3-yl, 2,5-Dihydropyrrol-2-yl, 2,5-Dihydropyrrol-3-yl, 4,5-Dihydroisoxazol-3-yl, 2,5-Dihydroisoxazol-3-yl, 2,3-Dihydroisoxazol-3-yl, 4,5-Dihydroisoxazol-4-yl, 2,5-Dihydroisoxazol-4-yl, 2,3-Dihydroisoxazol-4-yl, 4,5-Dihydroisoxazol-5-yl, 2,5-Dihydroisoxazol-5-yl, 2,3-Dihydroisoxazol-5-yl, 4,5-Dihydroisothiazol-3-yl, 2,5-Dihydroisothiazol-3-yl, 2,3-Dihydroisothiazol-3-yl, 4,5-Dihydroisothiazol-4-yl, 2,5-Dihydroisothiazol-4-yl, 2,3-Dihydroisothiazol-4-yl, 4,5-Dihydroisothiazol-5-yl, 2,5-Dihydroisothiazol-5-yl, 2,3-Dihydroisothiazol-5-yl, 2,3-Dihydropyrazol-2-yl, 2,3-Dihydropyrazol-3-yl, 2,3-Dihydropyrazol-4-yl, 2,3-Dihydropyrazol-5-yl, 3,4-Dihydropyrazol-3-yl, 3,4-Dihydropyrazol-4-yl, 3,4-Dihydropyrazol-5-yl, 4,5-Dihydropyrazol-3-yl, 4,5-Dihydropyrazol-4-yl, 4,5-Dihydropyrazol-5-yl, 2,3-Dihydroimidazol-2-yl, 2,3-Dihydroimidazol-3-yl, 2,3-Dihydroimidazol-4-yl, 2,3-Dihydroimidazol-5-yl, 4,5-Dihydroimidazol-2-yl, 4,5-Dihydroimidazol-4-yl, 4,5-Dihydroimidazol-5-yl, 2,5-Dihydroimidazol-2-yl, 2,5-Dihydroimidazol-4-yl, 2,5-Dihydroimidazol-5-yl, 2,3-Dihydrooxazol-3-yl, 2,3-Dihydrooxazol-4-yl, 2,3-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 3,4-Dihydrooxazol-5-yl, 2,3-Dihydrothiazol-3-yl, 2,3-Dihydrothiazol-4-yl, 2,3-Dihydrothiazol-5-yl, 3,4-Dihydrothiazol-3-yl, 3,4-Dihydrothiazol-4-yl, 3,4-Dihydrothiazol-5-yl, 3,4-Dihydrothiazol-2-yl, 3,4-Dihydrothiazol-3-yl, 3,4-Dihydrothiazol-4-yl,

z.B. 4,5-Dihydropyrrol-1-yl, 2,5-Dihydropyrrol-1-yl, 4,5-Dihydroisoxazol-2-yl, 2,3-Dihydroisoxazol-1-yl, 4,5-Dihydroisothiazol-1-yl, 2,3-Dihydroisothiazol-1-yl, 2,3-Di-

hydropyrazol-1-yl, 4,5-Dihydropyrazol-1-yl, 3,4-Dihydropyrazol-1-yl, 2,3-Dihydroimidazol-1-yl, 4,5-Dihydroimidazol-1-yl, 2,5-Dihydroimidazol-1-yl, 2,3-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 2,3-Dihydrothiazol-2-yl, 3,4-Dihydrothiazol-2-yl;

- 5 z.B. 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl, 1,3-Dioxan-2-yl, 1,3-Dioxan-4-yl, 1,3-Dioxan-5-yl, 1,4-Dioxan-2-yl, 1,3-Dithian-2-yl, 1,4-Dithian-3-yl, 1,3-Dithian-4-yl, 1,4-Dithian-2-yl, 2-Tetrahydropyranyl, 3-Tetrahydropyranyl, 4-Tetrahydropyranyl, 2-Tetrahydrothiopyranyl, 3-Tetrahydrothiopyranyl, 4-Tetrahydrothiopyranyl 3-Hexahydropyridazinyl, 4-Hexahydropyridazinyl, 2-Hexahydropyrimidinyl, 4-Hexahydropyrimidinyl, 5-Hexahydropyrimidinyl, 2-Piperazinyl, 1,3,5-Hexahydrotriazin-2-yl, 1,2,4-Hexahydrotriazin-3-yl, Tetrahydro-1,3-oxazin-2-yl, Tetrahydro-1,3-oxazin-6-yl, 2-Morpholinyl, 3-Morpholinyl, 1,3,5-Trioxan-2-yl;
- 10
- z.B. 1-Piperidinyl, 1-Hexahydropyridazinyl, 1-Hexahydropyrimidinyl, 1-Piperazinyl, 15 1,3,5-Hexahydrotriazin-1-yl, 1,2,4-Hexahydrotriazin-1-yl, Tetrahydro-1,3-oxazin-1-yl, 1-Morpholinyl;
- z.B. 2H-Pyran-2-yl, 2H-Pyran-3-yl, 2H-Pyran-4-yl, 2H-Pyran-5-yl, 2H-Pyran-6-yl, 3,6-Dihydro-2H-pyran-2-yl, 3,6-Dihydro-2H-pyran-3-yl, 3,6-Dihydro-2H-pyran-4-yl, 20 3,6-Dihydro-2H-pyran-5-yl, 3,6-Dihydro-2H-pyran-6-yl, 3,4-Dihydro-2H-pyran-3-yl, 3,4-Dihydro-2H-pyran-4-yl, 3,4-Dihydro-2H-pyran-6-yl, 2H-Thiopyran-2-yl, 2H-Thiopyran-3-yl, 2H-Thiopyran-4-yl, 2H-Thiopyran-5-yl, 2H-Thiopyran-6-yl, 5,6-Dihydro-4H-1,3-oxazin-2-yl;
- 25 - Aryl sowie der Arylteil von Aryl(C₁-C₆-alkyl), Aryl(C₁-C₄-alkyl),: ein- bis dreikerniger aromatischer Carbocyclus mit 6 bis 14 Ringgliedern, wie z.B. Phenyl, Naphthyl und Anthracenyl;
- Heteroaryl sowie die Heteroarylreste in Heteroaryl-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryl-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryl-C₂-C₄-alkenyl, Heteroaryl-C₂-C₄-alkinyl, Heteroaryl-C₁-C₄-halogenalkyl, Heteroaryl-C₂-C₄-halogenalkenyl, Heteroaryl-C₂-C₄-halogenalkinyl, Heteroaryl-C₁-C₄-hydroxyalkyl, Heteroaryl-C₂-C₄-hydroxyalkenyl, Heteroaryl-C₂-C₄-hydroxyalkinyl, Heteroarylcarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Heteroarylcarbonyloxy-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryloxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryloxy-C₁-C₄-alkyl, Heteroarylthio-C₁-C₄-alkyl, Heteroarylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl, Heteroarylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl:
- 30 mono- oder bicyclisches aromatisches Heteroaryl mit 5 bis 10 Ringgliedern, welches neben Kohlenstoffatomen 1 bis 4 Stickstoffatome, oder 1 bis 3 Stickstoffatome und ein Sauerstoff- oder ein Schwefelatom, oder ein Sauerstoff- oder ein Schwefelatom enthält, z.B.
- 35
- 40 Monocyclen wie Furyl (z.B. 2-Furyl, 3-Furyl), Thienyl (z.B. 2-Thienyl, 3-Thienyl), Pyrrolyl (z.B. Pyrrol-2-yl, Pyrrol-3-yl), Pyrazolyl (z.B. Pyrazol-3-yl, Pyrazol-4-yl), Isoxazolyl (z.B. Isoxazol-3-yl, Isoxazol-4-yl, Isoxazol-5-yl), Isothiazolyl (z.B. Isothiazol-3-yl, Isothiazol-4-yl, Isothiazol-5-yl), Imidazolyl (z.B. Imidazol-2-yl,

- Imidazol-4-yl), Oxazolyl (z.B. Oxazol-2-yl, Oxazol-4-yl, Oxazol-5-yl), Thiazolyl (z.B. Thiazol-2-yl, Thiazol-4-yl, Thiazol-5-yl), Oxadiazolyl (z.B. 1,2,3-Oxadiazol-4-yl, 1,2,3-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl), Thiadiazolyl (z.B. 1,2,3-Thiadiazol-4-yl, 1,2,3-Thiadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,3,4-Thiadiazolyl-2-yl), Triazolyl (z.B. 1,2,3-Triazol-4-yl, 1,2,4-Triazol-3-yl), Tetrazol-5-yl, Pyridyl (z.B. Pyridin-2-yl, Pyridin-3-yl, Pyridin-4-yl), Pyrazinyl (z.B. Pyridazin-3-yl, Pyridazin-4-yl), Pyrimidinyl (z.B. Pyrimidin-2-yl, Pyrimidin-4-yl, Pyrimidin-5-yl), Pyrazin-2-yl, Triazinyl (z.B. 1,3,5-Triazin-2-yl, 1,2,4-Triazin-3-yl, 1,2,4-Triazin-5-yl, 1,2,4-Triazin-6-yl), Tetrazinyl (z.B. 1,2,4,5-Tetrazin-3-yl); sowie
- Bicyclen wie die benzanellierte Derivate der vorgenannten Monocyclen, z.B. Chinolinylyl, Isochinolinylyl, Indolyl, Benzthienyl, Benzofuranyl, Benzoxazolyl, Benzthiazolyl, Benzisothiazolyl, Benzimidazolyl, Benzopyrazolyl, Benzthiadiazolyl, Benzotriazolyl;
- 5- oder 6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis vier Stickstoffatomen, oder ein bis drei Stickstoffatomen und einem Sauerstoff- oder Schwefelatom, oder mit einem Sauerstoff- oder Schwefelatom:
z.B. über ein C-Atom verknüpfte aromatische 5-Ring-Heterocyclen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome, oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom, oder ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Furylyl, 3-Furylyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 3-Isouthiazolyl, 4-Isouthiazolyl, 5-Isouthiazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,4-Triazol-3-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,3,4-Thiadiazol-2-yl und 1,3,4-Triazol-2-yl;
- z.B. über ein C-Atom verknüpfte aromatische 6-Ring Heterocyclen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier, vorzugsweise ein bis drei Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl und 1,2,4-Triazin-3-yl.

35

In einer besonderen Ausführungsform haben die Variablen der heteroaroylsubstituierten Alanine der Formel I folgende Bedeutungen, wobei diese für sich allein betrachtet als auch in Kombination miteinander besondere Ausgestaltungen der Verbindungen der Formel I darstellen:

40

Bevorzugt sind die heteroaroylsubstituierten Alanine der Formel I, in der

- A 5- oder 6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis vier Stickstoffatomen, oder mit ein bis drei Stickstoffatomen und einem Sauerstoff- oder Schwefelatom, oder mit einem Sauerstoff- oder Schwefelatom, welches durch einen C₁-C₆-Halogenalkyl-Rest,

bevorzugt in 2-Position durch einen C₁-C₆-Halogenalkyl-Rest, substituiert ist, und 1 bis 3 Reste aus der Gruppe Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy und C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl tragen kann;

5 bedeutet.

Ebenso bevorzugt sind die heteroaroylsubstituierten Alanine der Formel I, in der

A 5- oder 6-gliedriges Heteroaryl ausgewählt aus der Gruppe Pyrrolyl, Thienyl, Furyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Thiazolyl, Oxazolyl, Tetrazolyl, Pyridyl und Pyrimidinyl; wobei die genannten Heteroarylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder 1 bis 3 Reste aus der Gruppe Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy und C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl tragen können;

15 bevorzugt 5- oder 6-gliedriges Heteroaryl ausgewählt aus der Gruppe Thienyl, Furyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Thiazolyl, Oxazolyl und Pyridyl; wobei die genannten Heteroarylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder 1 bis 3 Reste aus der Gruppe C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl und C₁-C₆-Halogenalkyl tragen können;

20 sehr bevorzugt 5-gliedriges Heteroaryl ausgewählt aus der Gruppe Thienyl, Furyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Thiazolyl und Oxazolyl; wobei die genannten Heteroarylreste partiell halogeniert sein können und/oder 1 bis 2 Reste aus der Gruppe C₁-C₆-Alkyl und C₁-C₄-Halogenalkyl tragen können;

25 besonders bevorzugt 5-gliedriges Heteroaryl ausgewählt aus der Gruppe Thienyl, Furyl, Pyrazolyl und Imidazolyl; wobei die genannten Heteroarylreste partiell halogeniert sein können und/oder 1 bis 2 Reste aus der Gruppe C₁-C₆-Alkyl und C₁-C₄-Halogenalkyl tragen können;

30 insbesondere bevorzugt 5-gliedriges Heteroaryl ausgewählt aus der Gruppe Pyrazolyl und Imidazolyl; wobei die genannten Heteroarylreste partiell halogeniert sein können und/oder 1 bis 2 Reste aus der Gruppe C₁-C₆-Alkyl und C₁-C₄-Halogenalkyl tragen können;

35 außerordentlich bevorzugt Pyrazolyl, welches partiell halogeniert sein kann und/oder 1 bis 2 Reste aus der Gruppe C₁-C₆-Alkyl und C₁-C₄-Halogenalkyl tragen kann;

40

bedeutet.

Ebenso bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der

A 6-gliedriges Heteroaroyl mit ein bis vier Stickstoffatomen;
besonders bevorzugt Pyridyl oder Pyrimidyl.

5 insbesondere bevorzugt Pyrimidyl;

wobei die genannten Heteroaroylreste partiell oder vollständig halogeniert
sein können und/oder 1 bis 3 Reste aus der Gruppe Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₃-
C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy und
C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl tragen können;

10 bedeutet.

Ebenso bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der

A 5-gliedriges Heteroaroyl mit ein bis vier Stickstoffatomen, oder ein bis drei Stick-
stoffatomen und einem Sauerstoff- oder Schwefelatom, oder mit einem Sauer-
stoffatom;

15

besonders bevorzugt 5-gliedriges Heteroaroyl ausgewählt aus der Gruppe Thie-
nyl, Furyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Thiazolyl und Oxazolyl;

insbesondere bevorzugt 5-gliedriges Heteroaroyl ausgewählt aus der Gruppe
Thienyl, Furyl, Pyrazolyl und Imidazolyl;

20

außerordentlich bevorzugt Pyrazolyl;

wobei die genannten Heteroaroylreste durch einen C₁-C₆-Halogenalkylrest,
bevorzugt in 2-Position durch einen C₁-C₆-Halogenalkylrest substituiert
sind, und 1 bis 3 Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₃-
C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy und C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-
alkyl tragen können;

25

bedeutet.

Ebenso bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der

A 5-gliedriges Heteroaroyl mit ein bis vier Stickstoffen;

30

bevorzugt 5-gliedriges Heteroaroyl mit ein bis drei Stickstoffen;

sehr bevorzugt 5-gliedriges Heteroaroyl mit ein bis zwei Stickstoffen;

besonders bevorzugt 5-gliedriges Heteroaroyl mit zwei Stickstoffen;

außerordentlich bevorzugt Pyrazolyl;

35

wobei die genannten Heteroaroylreste durch 1 bis 3 Reste aus der Gruppe
Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-
Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy und C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl;

bevorzugt durch 1 bis 3 Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl
und C₁-C₆-Halogenalkyl;

40

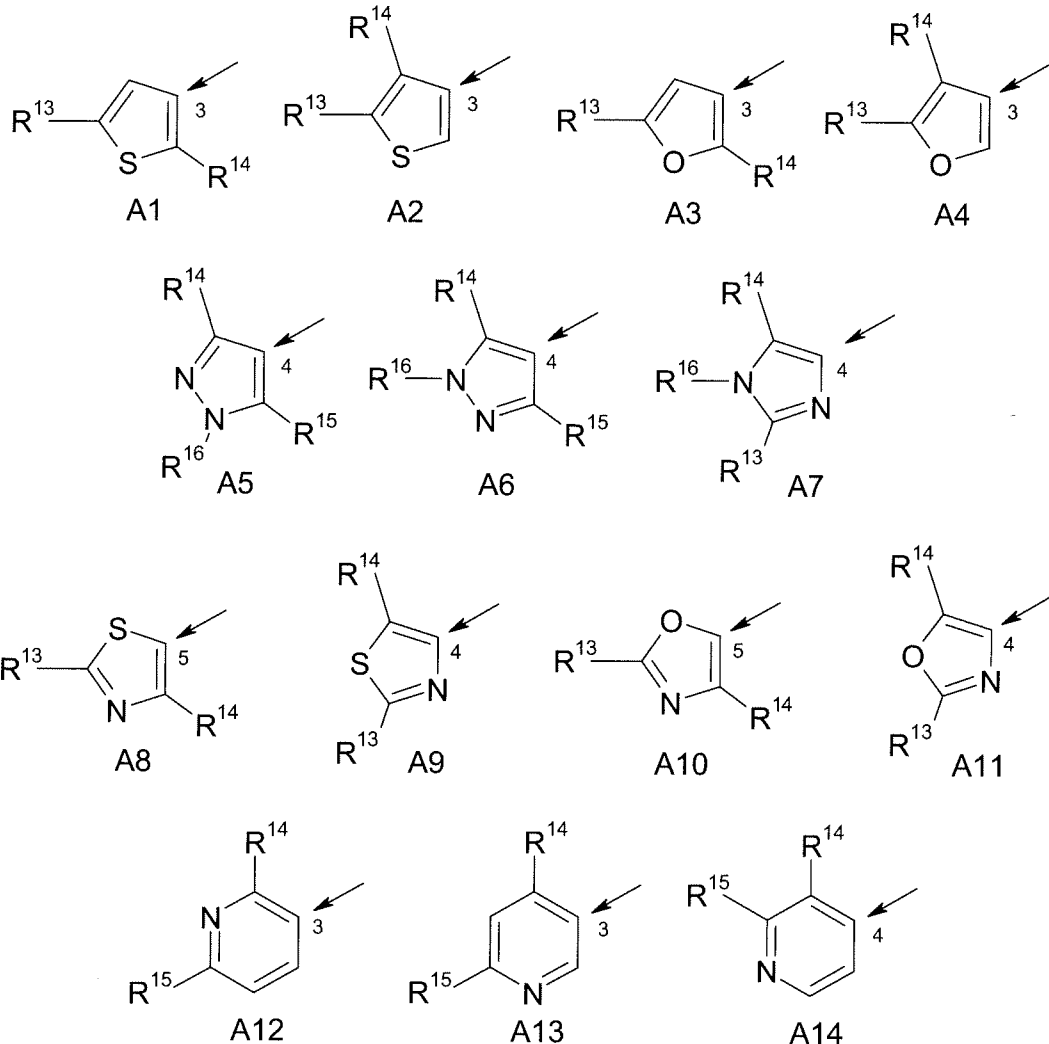
sehr bevorzugt durch 1 bis 2 Reste aus der Gruppe C₁-C₆-Alkyl und C₁-C₆-
Halogenalkyl;

substituiert sein können;

bedeutet.

Ebenso bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der A C-verknüpftes 5- oder 6-gliedriges Heteroaroyl ausgewählt aus der Gruppe A1 bis A14 mit

5



10

wobei der Pfeil die Verknüpfungposition anzeigt und

15

R^{13} Wasserstoff, Halogen, C_1 - C_6 -Alkyl oder C_1 - C_6 -Halogenalkyl;
 besonders bevorzugt Wasserstoff, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl;
 insbesondere bevorzugt Wasserstoff oder C_1 - C_4 -Alkyl;
 außerordentlich bevorzugt Wasserstoff;

20

R^{14} Halogen, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl oder C_1 - C_6 -Halogenalkoxy;
 besonders bevorzugt Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_6 -Halogenalkyl;
 insbesondere bevorzugt Halogen oder C_1 - C_6 -Halogenalkyl;
 sehr bevorzugt C_1 - C_6 -Halogenalkyl;
 außerordentlich bevorzugt C_1 - C_4 -Halogenalkyl

25

sehr außerordentlich bevorzugt CF_3 ;

- 5 R¹⁵ Wasserstoff, Halogen, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl;
besonders bevorzugt Wasserstoff, Halogen oder C₁-C₄-Halogenalkyl;
insbesondere bevorzugt Wasserstoff oder Halogen;
außerordentlich bevorzugt Wasserstoff; und
- 10 R¹⁶ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl oder C₁-
C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl;
besonders bevorzugt C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl
oder C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl;
insbesondere bevorzugt C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl;
außerordentlich bevorzugt C₁-C₄-Alkyl;
sehr außerordentlich bevorzugt CH₃;
- 15 bedeuten;
- sehr bevorzugt A1, A2, A3, A4, A5, A6, A8 oder A9;
wobei R¹³ bis R¹⁶ wie voranstehend genannt definiert werden;
- 20 besonders bevorzugt A1, A2, A5 oder A6;
wobei R¹³ bis R¹⁶ wie voranstehend genannt definiert werden;
- insbesondere bevorzugt A5 oder A6;
wobei R¹⁴ bis R¹⁶ wie voranstehend genannt definiert werden;
- 25 außerordentlich bevorzugt A5;
wobei R¹⁴ bis R¹⁶ wie voranstehend genannt definiert werden;
bedeutet.
- 30 Ebenso bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der
R¹ Wasserstoff;
bedeutet.
- 35 Ebenso bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der
R² Wasserstoff oder Hydroxy;
besonders bevorzugt Wasserstoff;
bedeutet.
- 40 Ebenso bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der
R³ C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl;
besonders bevorzugt C₁-C₆-Alkyl;
insbesondere bevorzugt C₁-C₄-Alkyl;

außerordentlich bevorzugt CH₃;
bedeutet.

- Ebenso bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der
- 5 R⁴ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;
bevorzugt Wasserstoff oder CH₃;
insbesondere bevorzugt Wasserstoff;
bedeutet.
- 10 Ebenso bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der
- R⁵ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-
C₆-Halogenalkenyl, C₂-C₆-Halogenalkinyl, C₁-C₆-Cyanoalkyl, C₁-C₆-Hydroxyalkyl,
C₂-C₆-Hydroxyalkenyl, C₂-C₆-Hydroxyalkinyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-
Cycloalkenyl oder 3- bis 6-gliedriges Heterocyclyl,
- 15 wobei die voranstehend genannten Cycloalkyl-, Cycloalkenyl- oder 3- bis 6-
gliedrigen Heterocyclyl-Reste partiell oder vollständig halogeniert sein kön-
nen und/oder einen bis drei Reste aus der Gruppe Oxo, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-
Halogenalkyl, Hydroxycarbonyl und C₁-C₆-Alkoxycarbonyl tragen können;
- 20 C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-
alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfonylamino-C₁-C₄-
alkyl, Hydroxycarbonyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, Aminocarbonyl, Hydroxycarbonyl-
C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxycarbonyl-C₁-
C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyloxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonylamino-C₁-C₄-
25 alkyl, (C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonylamino-C₁-C₄-alkyl, Di(C₁-C₆-
alkyl)aminocarbonylamino-C₁-C₄-alkyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyloxy-C₁-C₄-
alkyl, Formylamino-C₁-C₄-alkyl;
Phenyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl, Phenyl-C₂-C₄-alkenyl, Phenyl-C₂-C₄-alkinyl, Phenyl-
C₁-C₄-halogenalkyl, Phenyl-C₂-C₄-halogenalkenyl, Phenyl-C₁-C₄-hydroxyalkyl,
Phenyloxy-C₁-C₄-alkyl, Phenylthio-C₁-C₄-alkyl, Phenylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl, Phe-
30 nylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl;
Heteroaryl, Heteroaryl-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryl-C₁-C₄-hydroxyalkyl, Heteroaryloxy-
C₁-C₄-alkyl, Heteroarylthio-C₁-C₄-alkyl, Heteroarylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl oder Hete-
roarylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl,
- 35 wobei die vorstehend genannten Phenyl- und Heteroarylreste partiell oder
vollständig halogeniert sein können und/oder ein bis drei Reste aus der
Gruppe Cyano, Nitro, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, Hydroxy, C₁-C₆-
Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Hydroxycarbonyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, Hy-
droxycarbonyl-C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-Alkylsulfonylamino und C₁-C₆-
Halogenalkylsulfonylamino tragen können;
- 40 besonders bevorzugt C₂-C₆-Alkenyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, 3- bis 6-gliedriges He-
terocyclyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, A-

minocarbonyl, C₁-C₆-Alkylcarbonylamino-C₁-C₄-alkyl, Formylamino-C₁-C₄-alkyl, Phenyl oder Heteroaryl,

5 wobei die vorstehend genannten 3- bis 6-gliedrigen Heterocycl- sowie die Phenyl- und Heteroarylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder ein bis drei C₁-C₆-Alkyl-Reste tragen können;

insbesondere bevorzugt C₂-C₆-Alkenyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, Phenyl oder Heteroaryl;
bedeutet.

10 Ebenso bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der R⁶ NR¹⁰R¹¹ oder OR⁹ besonders bevorzugt OR⁹;
bedeutet.

15 Ebenso bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der R⁶ NR¹⁰R¹¹ oder NO₂; besonders bevorzugt NR¹⁰R¹¹;
bedeutet.

20 Ebenso bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der R⁶ OR⁹ oder NO₂; besonders bevorzugt NO₂;
bedeutet.

25 Ebenso bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der R⁷ Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl; besonders bevorzugt Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl; insbesondere bevorzugt Wasserstoff;
30 bedeutet.

Ebenso bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der R⁸ Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl; besonders bevorzugt Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;
35 insbesondere bevorzugt Wasserstoff;
bedeutet.

40 Ebenso bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der R⁹ und R¹⁰ jeweils unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkynyl, Formyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₂-C₆-Alkenylcarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl, C₁-C₆-

Alkylsulfonylaminocarbonyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl, N-(C₁-C₆-Alkoxy)-N-(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl, [(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl(C₁-C₆-alkyl)amino]-carbonyl, (C₁-C₆-Alkyl)aminothiocarbonyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminothiocarbonyl, C₁-C₆-Alkoxyimino-C₁-C₆-alkyl,

5 wobei die genannten Alkyl, Cycloalkyl- und Alkoxyreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Cyano, Hydroxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, Di(C₁-C₄-alkyl)amino, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, Hydroxycarbonyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, Aminocarbonyl, C₁-C₄-Alkylaminocarbonyl, Di(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl, oder C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy;

10 Phenyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl, Phenylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, Phenylsulfonylaminocarbonyl oder Phenyl-C₁-C₆-alkylcarbonyl,

wobei der Phenylring partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy; oder

15 SO₂R¹²;

20 besonders bevorzugt Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkynyl, Formyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₂-C₆-Alkenylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, Aminocarbonyl, (C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl, C₁-C₆-Alkylsulfonylaminocarbonyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl, N-(C₁-C₆-Alkoxy)-N-(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl, [(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl(C₁-C₆-alkyl)amino]carbonyl, (C₁-C₆-Alkyl)aminothiocarbonyl oder Di(C₁-C₆-alkyl)aminothiocarbonyl,

25 wobei die genannten Alkyl- oder Alkoxyreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, C₁-C₄-Alkylaminocarbonyl oder Di(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl; oder

30 SO₂R¹²;

insbesondere bevorzugt Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, Formyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Halogenalkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, Aminocarbonyl, (C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl, N-(C₁-C₆-Alkoxy)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, [(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl(C₁-C₆-alkyl)amino]carbonyl oder Di(C₁-C₆-alkyl)aminothiocarbonyl; oder

35 SO₂R¹²;

bedeuten.

40 Ebenso bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der R⁹ und R¹⁰ jeweils unabhängig voneinander

Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkynyl, Formyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₂-C₆-Alkenylcarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, Aminocarbonyl, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl, Di(C₁-C₆-alkyl)-

aminocarbonyl, N-(C₁-C₆-Alkoxy)-N-(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl, [(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl(C₁-C₆-alkyl)amino]carbonyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminothio-carbonyl oder C₁-C₆-Alkoxyimino-C₁-C₆-alkyl,

5 wobei die genannten Alkyl-, Cycloalkyl- oder Alkoxyreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Cyano, Hydroxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, Di(C₁-C₄-alkyl)amino, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, Hydroxycarbonyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, Aminocarbonyl, C₁-C₄-Alkylaminocarbonyl, Di-(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonyl oder C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy; oder

10 SO₂R¹²;

bedeuten.

Ebenso bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der R¹¹ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, Hydroxy oder C₁-C₆-Alkoxy;

15 besonders bevorzugt Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl;

insbesondere bevorzugt Wasserstoff oder Methyl;

außerordentlich bevorzugt Wasserstoff;

bedeutet.

20 Ebenso bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der R¹² C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, Di(C₁-C₆-alkyl)amino oder Phenyl,

wobei der Phenylrest partiell oder teilweise halogeniert sein kann und/oder durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann;

besonders bevorzugt C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, Di(C₁-C₆-alkyl)amino oder

25 Phenyl;

insbesondere bevorzugt Methyl, Trifluormethyl oder Phenyl;

bedeutet.

Ebenso bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der

30 R¹² C₁-C₆-Alkyl oder (C₁-C₆-alkyl)amino;

besonders bevorzugt C₁-C₄-Alkyl oder Di(C₁-C₄-alkyl)amino;

bedeutet.

Besonders bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der

35 A 5- oder 6-gliedriges Heteroaroyl ausgewählt aus der Gruppe Thienyl, Furyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Thiazolyl, Oxazolyl und Pyridyl; wobei die

genannten Heteroaroylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder 1 bis 3 Reste aus der Gruppe C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl und C₁-C₆-Halogenalkyl tragen können;

40 R¹ und R² Wasserstoff;

R³ C₁-C₄-Alkyl,

besonders bevorzugt CH₃;

R⁴ Wasserstoff;

5 R^5 C₂-C₆-Alkenyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, 3- bis 6-gliedriges Heterocyclyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, Aminocarbonyl, C₁-C₆-Alkylcarbonylamino-C₁-C₄-alkyl, Formylamino-C₁-C₄-alkyl, Phenyl oder Heteroaryl, wobei die vorstehend genannten 3- bis 6-gliedrigen Heterocyclyl- sowie die Phenyl- und Heteroarylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder ein bis drei C₁-C₆-Alkyl-Reste tragen können;

R^7 und R^8 Wasserstoff;

10 R^9 und R^{10} Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, Formyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Halogenalkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, (C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl, N-(C₁-C₆-Alkoxy)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, [(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl(C₁-C₆-alkyl)amino]carbonyl oder Di(C₁-C₆-alkyl)aminothiocarbonyl oder SO₂R¹²; und

R^{11} Wasserstoff

bedeuten.

15

Außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.a (entspricht Formel I mit A = A-1 mit $R^{13} = H$, $R^{14} = CF_3$, R^1 , R^2 , R^4 , R^7 und $R^8 = H$; $R^3 = CH_3$), insbesondere die Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.384 der Tabelle 1, wobei die Definitionen der Variablen A und R^1 bis R^{16} nicht nur in Kombination miteinander, sondern auch jeweils für sich allein betrachtet für die erfindungsgemäßen Verbindungen eine besondere Rolle spielen.

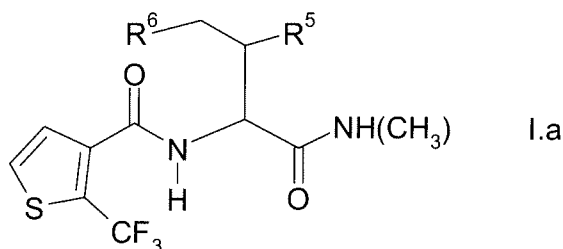


Tabelle 1

Nr.	R^5	R^6
I.a.1	H	OH
I.a.2	CH ₃	OH
I.a.3	CH=CH ₂	OH
I.a.4	CH=CH(CH ₃)	OH
I.a.5	CH=C(CH ₃) ₂	OH
I.a.6	C(CH ₃)=CH ₂	OH
I.a.7	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	OH
I.a.8	C≡CH	OH
I.a.9	C≡CCH ₃	OH
I.a.10	CF ₃	OH
I.a.11	CHF ₂	OH
I.a.12	CF ₂ CF ₃	OH

Nr.	R ⁵	R ⁶
I.a.13	CH ₂ OH	OH
I.a.14	CH ₂ OCH ₃	OH
I.a.15	CH ₂ OC(O)CH ₃	OH
I.a.16	CH(OH)CH ₂ OH	OH
I.a.17	CH ₂ NHC(O)H	OH
I.a.18	CH ₂ NHC(O)CH ₃	OH
I.a.19	Cyclopropyl	OH
I.a.20	Cyclopentyl	OH
I.a.21	Cyclohexyl	OH
I.a.22	Cyclopenten-2-yl	OH
I.a.23	Cyclohexen-2-yl	OH
I.a.24	Tetrahydrofur-2-yl	OH
I.a.25	Tetrahydrofur-3-yl	OH
I.a.26	Tetrahydropyran-2-yl	OH
I.a.27	Tetrahydropyran-3-yl	OH
I.a.28	Tetrahydropyran-4-yl	OH
I.a.29	3,6-Dihydro-2H-pyran-4-yl	OH
I.a.30	3,6-Dihydro-2H-pyran-5-yl	OH
I.a.31	Phenyl	OH
I.a.32	Pyrid-2-yl	OH
I.a.33	H	OC(O)H
I.a.34	CH ₃	OC(O)H
I.a.35	CH=CH ₂	OC(O)H
I.a.36	CH=CH(CH ₃)	OC(O)H
I.a.37	CH=C(CH ₃) ₂	OC(O)H
I.a.38	C(CH ₃)=CH ₂	OC(O)H
I.a.39	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	OC(O)H
I.a.40	C≡CH	OC(O)H
I.a.41	C≡CCH ₃	OC(O)H
I.a.42	CF ₃	OC(O)H
I.a.43	CHF ₂	OC(O)H
I.a.44	CF ₂ CF ₃	OC(O)H
I.a.45	CH ₂ OH	OC(O)H
I.a.46	CH ₂ OCH ₃	OC(O)H
I.a.47	CH ₂ OC(O)CH ₃	OC(O)H
I.a.48	CH(OH)CH ₂ OH	OC(O)H
I.a.49	CH ₂ NHC(O)H	OC(O)H
I.a.50	CH ₂ NHC(O)CH ₃	OC(O)H
I.a.51	Cyclopropyl	OC(O)H
I.a.52	Cyclopentyl	OC(O)H

Nr.	R ⁵	R ⁶
I.a.53	Cyclohexyl	OC(O)H
I.a.54	Cyclopenten-2-yl	OC(O)H
I.a.55	Cyclohexen-2-yl	OC(O)H
I.a.56	Tetrahydrofur-2-yl	OC(O)H
I.a.57	Tetrahydrofur-3-yl	OC(O)H
I.a.58	Tetrahydropyran-2-yl	OC(O)H
I.a.59	Tetrahydropyran-3-yl	OC(O)H
I.a.60	Tetrahydropyran-4-yl	OC(O)H
I.a.61	3,6-Dihydro-2H-pyran-4-yl	OC(O)H
I.a.62	3,6-Dihydro-2H-pyran-5-yl	OC(O)H
I.a.63	Phenyl	OC(O)H
I.a.64	Pyrid-2-yl	OC(O)H
I.a.65	H	OC(O)CH ₃
I.a.66	CH ₃	OC(O)CH ₃
I.a.67	CH=CH ₂	OC(O)CH ₃
I.a.68	CH=CH(CH ₃)	OC(O)CH ₃
I.a.69	CH=C(CH ₃) ₂	OC(O)CH ₃
I.a.70	C(CH ₃)=CH ₂	OC(O)CH ₃
I.a.71	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	OC(O)CH ₃
I.a.72	C≡CH	OC(O)CH ₃
I.a.73	C≡CCH ₃	OC(O)CH ₃
I.a.74	CF ₃	OC(O)CH ₃
I.a.75	CHF ₂	OC(O)CH ₃
I.a.76	CF ₂ CF ₃	OC(O)CH ₃
I.a.77	CH ₂ OH	OC(O)CH ₃
I.a.78	CH ₂ OCH ₃	OC(O)CH ₃
I.a.79	CH ₂ OC(O)CH ₃	OC(O)CH ₃
I.a.80	CH(OH)CH ₂ OH	OC(O)CH ₃
I.a.81	CH ₂ NHC(O)H	OC(O)CH ₃
I.a.82	CH ₂ NHC(O)CH ₃	OC(O)CH ₃
I.a.83	Cyclopropyl	OC(O)CH ₃
I.a.84	Cyclopentyl	OC(O)CH ₃
I.a.85	Cyclohexyl	OC(O)CH ₃
I.a.86	Cyclopenten-2-yl	OC(O)CH ₃
I.a.87	Cyclohexen-2-yl	OC(O)CH ₃
I.a.88	Tetrahydrofur-2-yl	OC(O)CH ₃
I.a.89	Tetrahydrofur-3-yl	OC(O)CH ₃
I.a.90	Tetrahydropyran-2-yl	OC(O)CH ₃
I.a.91	Tetrahydropyran-3-yl	OC(O)CH ₃
I.a.92	Tetrahydropyran-4-yl	OC(O)CH ₃

Nr.	R ⁵	R ⁶
I.a.93	3,6-Dihydro-2H-pyran-4-yl	OC(O)CH ₃
I.a.94	3,6-Dihydro-2H-pyran-5-yl	OC(O)CH ₃
I.a.95	Phenyl	OC(O)CH ₃
I.a.96	Pyrid-2-yl	OC(O)CH ₃
I.a.97	H	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.98	CH ₃	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.99	CH=CH ₂	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.100	CH=CH(CH ₃)	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.101	CH=C(CH ₃) ₂	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.102	C(CH ₃)=CH ₂	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.103	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.104	C≡CH	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.105	C≡CCH ₃	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.106	CF ₃	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.107	CHF ₂	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.108	CF ₂ CF ₃	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.109	CH ₂ OH	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.110	CH ₂ OCH ₃	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.111	CH ₂ OC(O)CH ₃	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.112	CH(OH)CH ₂ OH	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.113	CH ₂ NHC(O)H	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.114	CH ₂ NHC(O)CH ₃	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.115	Cyclopropyl	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.116	Cyclopentyl	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.117	Cyclohexyl	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.118	Cyclopenten-2-yl	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.119	Cyclohexen-2-yl	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.120	Tetrahydrofur-2-yl	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.121	Tetrahydrofur-3-yl	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.122	Tetrahydropyran-2-yl	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.123	Tetrahydropyran-3-yl	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.124	Tetrahydropyran-4-yl	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.125	3,6-Dihydro-2H-pyran-4-yl	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.126	3,6-Dihydro-2H-pyran-5-yl	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.127	Phenyl	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.128	Pyrid-2-yl	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.129	H	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.130	CH ₃	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.131	CH=CH ₂	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.132	CH=CH(CH ₃)	OC(O)N(CH ₃) ₂

Nr.	R ⁵	R ⁶
I.a.133	CH=C(CH ₃) ₂	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.134	C(CH ₃)=CH ₂	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.135	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.136	C≡ CH	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.137	C≡ CCH ₃	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.138	CF ₃	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.139	CHF ₂	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.140	CF ₂ CF ₃	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.141	CH ₂ OH	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.142	CH ₂ OCH ₃	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.143	CH ₂ OC(O)CH ₃	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.144	CH(OH)CH ₂ OH	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.145	CH ₂ NHC(O)H	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.146	CH ₂ NHC(O)CH ₃	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.147	Cyclopropyl	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.148	Cyclopentyl	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.149	Cyclohexyl	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.150	Cyclopenten-2-yl	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.151	Cyclohexen-2-yl	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.152	Tetrahydrofur-2-yl	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.153	Tetrahydrofur-3-yl	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.154	Tetrahydropyran-2-yl	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.155	Tetrahydropyran-3-yl	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.156	Tetrahydropyran-4-yl	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.157	3,6-Dihydro-2H-pyran-4-yl	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.158	3,6-Dihydro-2H-pyran-5-yl	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.159	Phenyl	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.160	Pyrid-2-yl	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.161	H	OC(O)OCH ₃
I.a.162	CH ₃	OC(O)OCH ₃
I.a.163	CH=CH ₂	OC(O)OCH ₃
I.a.164	CH=CH(CH ₃)	OC(O)OCH ₃
I.a.165	CH=C(CH ₃) ₂	OC(O)OCH ₃
I.a.166	C(CH ₃)=CH ₂	OC(O)OCH ₃
I.a.167	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	OC(O)OCH ₃
I.a.168	C≡ CH	OC(O)OCH ₃
I.a.169	C≡ CCH ₃	OC(O)OCH ₃
I.a.170	CF ₃	OC(O)OCH ₃
I.a.171	CHF ₂	OC(O)OCH ₃
I.a.172	CF ₂ CF ₃	OC(O)OCH ₃

Nr.	R ⁵	R ⁶
I.a.173	CH ₂ OH	OC(O)OCH ₃
I.a.174	CH ₂ OCH ₃	OC(O)OCH ₃
I.a.175	CH ₂ OC(O)CH ₃	OC(O)OCH ₃
I.a.176	CH(OH)CH ₂ OH	OC(O)OCH ₃
I.a.177	CH ₂ NHC(O)H	OC(O)OCH ₃
I.a.178	CH ₂ NHC(O)CH ₃	OC(O)OCH ₃
I.a.179	Cyclopropyl	OC(O)OCH ₃
I.a.180	Cyclopentyl	OC(O)OCH ₃
I.a.181	Cyclohexyl	OC(O)OCH ₃
I.a.182	Cyclopenten-2-yl	OC(O)OCH ₃
I.a.183	Cyclohexen-2-yl	OC(O)OCH ₃
I.a.184	Tetrahydrofur-2-yl	OC(O)OCH ₃
I.a.185	Tetrahydrofur-3-yl	OC(O)OCH ₃
I.a.186	Tetrahydropyran-2-yl	OC(O)OCH ₃
I.a.187	Tetrahydropyran-3-yl	OC(O)OCH ₃
I.a.188	Tetrahydropyran-4-yl	OC(O)OCH ₃
I.a.189	3,6-Dihydro-2H-pyran-4-yl	OC(O)OCH ₃
I.a.190	3,6-Dihydro-2H-pyran-5-yl	OC(O)OCH ₃
I.a.191	Phenyl	OC(O)OCH ₃
I.a.192	Pyrid-2-yl	OC(O)OCH ₃
I.a.193	H	NH ₂
I.a.194	CH ₃	NH ₂
I.a.195	CH=CH ₂	NH ₂
I.a.196	CH=CH(CH ₃)	NH ₂
I.a.197	CH=C(CH ₃) ₂	NH ₂
I.a.198	C(CH ₃)=CH ₂	NH ₂
I.a.199	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	NH ₂
I.a.200	C≡CH	NH ₂
I.a.201	C≡CCH ₃	NH ₂
I.a.202	CF ₃	NH ₂
I.a.203	CHF ₂	NH ₂
I.a.204	CF ₂ CF ₃	NH ₂
I.a.205	CH ₂ OH	NH ₂
I.a.206	CH ₂ OCH ₃	NH ₂
I.a.207	CH ₂ OC(O)CH ₃	NH ₂
I.a.208	CH(OH)CH ₂ OH	NH ₂
I.a.209	CH ₂ NHC(O)H	NH ₂
I.a.210	CH ₂ NHC(O)CH ₃	NH ₂
I.a.211	Cyclopropyl	NH ₂
I.a.212	Cyclopentyl	NH ₂

Nr.	R ⁵	R ⁶
I.a.213	Cyclohexyl	NH ₂
I.a.214	Cyclopenten-2-yl	NH ₂
I.a.215	Cyclohexen-2-yl	NH ₂
I.a.216	Tetrahydrofur-2-yl	NH ₂
I.a.217	Tetrahydrofur-3-yl	NH ₂
I.a.218	Tetrahydropyran-2-yl	NH ₂
I.a.219	Tetrahydropyran-3-yl	NH ₂
I.a.220	Tetrahydropyran-4-yl	NH ₂
I.a.221	3,6-Dihydro-2H-pyran-4-yl	NH ₂
I.a.222	3,6-Dihydro-2H-pyran-5-yl	NH ₂
I.a.223	Phenyl	NH ₂
I.a.224	Pyrid-2-yl	NH ₂
I.a.225	H	NHC(O)H
I.a.226	CH ₃	NHC(O)H
I.a.227	CH=CH ₂	NHC(O)H
I.a.228	CH=CH(CH ₃)	NHC(O)H
I.a.229	CH=C(CH ₃) ₂	NHC(O)H
I.a.230	C(CH ₃)=CH ₂	NHC(O)H
I.a.231	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	NHC(O)H
I.a.232	C≡CH	NHC(O)H
I.a.233	C≡CCH ₃	NHC(O)H
I.a.234	CF ₃	NHC(O)H
I.a.235	CHF ₂	NHC(O)H
I.a.236	CF ₂ CF ₃	NHC(O)H
I.a.237	CH ₂ OH	NHC(O)H
I.a.238	CH ₂ OCH ₃	NHC(O)H
I.a.239	CH ₂ OC(O)CH ₃	NHC(O)H
I.a.240	CH(OH)CH ₂ OH	NHC(O)H
I.a.241	CH ₂ NHC(O)H	NHC(O)H
I.a.242	CH ₂ NHC(O)CH ₃	NHC(O)H
I.a.243	Cyclopropyl	NHC(O)H
I.a.244	Cyclopentyl	NHC(O)H
I.a.245	Cyclohexyl	NHC(O)H
I.a.246	Cyclopenten-2-yl	NHC(O)H
I.a.247	Cyclohexen-2-yl	NHC(O)H
I.a.248	Tetrahydrofur-2-yl	NHC(O)H
I.a.249	Tetrahydrofur-3-yl	NHC(O)H
I.a.250	Tetrahydropyran-2-yl	NHC(O)H
I.a.251	Tetrahydropyran-3-yl	NHC(O)H
I.a.252	Tetrahydropyran-4-yl	NHC(O)H

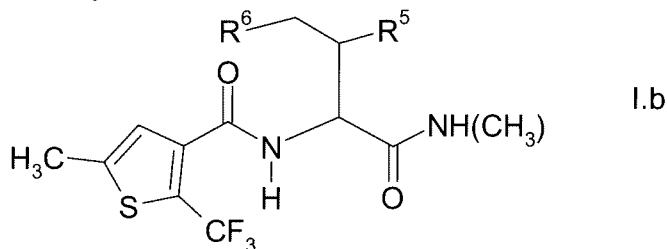
Nr.	R ⁵	R ⁶
I.a.253	3,6-Dihydro-2H-pyran-4-yl	NHC(O)H
I.a.254	3,6-Dihydro-2H-pyran-5-yl	NHC(O)H
I.a.255	Phenyl	NHC(O)H
I.a.256	Pyrid-2-yl	NHC(O)H
I.a.257	H	NHC(O)CH ₃
I.a.258	CH ₃	NHC(O)CH ₃
I.a.259	CH=CH ₂	NHC(O)CH ₃
I.a.260	CH=CH(CH ₃)	NHC(O)CH ₃
I.a.261	CH=C(CH ₃) ₂	NHC(O)CH ₃
I.a.262	C(CH ₃)=CH ₂	NHC(O)CH ₃
I.a.263	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	NHC(O)CH ₃
I.a.264	C≡CH	NHC(O)CH ₃
I.a.265	C≡CCH ₃	NHC(O)CH ₃
I.a.266	CF ₃	NHC(O)CH ₃
I.a.267	CHF ₂	NHC(O)CH ₃
I.a.268	CF ₂ CF ₃	NHC(O)CH ₃
I.a.269	CH ₂ OH	NHC(O)CH ₃
I.a.270	CH ₂ OCH ₃	NHC(O)CH ₃
I.a.271	CH ₂ OC(O)CH ₃	NHC(O)CH ₃
I.a.272	CH(OH)CH ₂ OH	NHC(O)CH ₃
I.a.273	CH ₂ NHC(O)H	NHC(O)CH ₃
I.a.274	CH ₂ NHC(O)CH ₃	NHC(O)CH ₃
I.a.275	Cyclopropyl	NHC(O)CH ₃
I.a.276	Cyclopentyl	NHC(O)CH ₃
I.a.277	Cyclohexyl	NHC(O)CH ₃
I.a.278	Cyclopenten-2-yl	NHC(O)CH ₃
I.a.279	Cyclohexen-2-yl	NHC(O)CH ₃
I.a.280	Tetrahydrofur-2-yl	NHC(O)CH ₃
I.a.281	Tetrahydrofur-3-yl	NHC(O)CH ₃
I.a.282	Tetrahydropyran-2-yl	NHC(O)CH ₃
I.a.283	Tetrahydropyran-3-yl	NHC(O)CH ₃
I.a.284	Tetrahydropyran-4-yl	NHC(O)CH ₃
I.a.285	3,6-Dihydro-2H-pyran-4-yl	NHC(O)CH ₃
I.a.286	3,6-Dihydro-2H-pyran-5-yl	NHC(O)CH ₃
I.a.287	Phenyl	NHC(O)CH ₃
I.a.288	Pyrid-2-yl	NHC(O)CH ₃
I.a.289	H	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.290	CH ₃	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.291	CH=CH ₂	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.292	CH=CH(CH ₃)	NHC(O)NH(CH ₃)

Nr.	R ⁵	R ⁶
I.a.293	CH=C(CH ₃) ₂	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.294	C(CH ₃)=CH ₂	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.295	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.296	C≡ CH	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.297	C≡ CCH ₃	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.298	CF ₃	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.299	CHF ₂	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.300	CF ₂ CF ₃	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.301	CH ₂ OH	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.302	CH ₂ OCH ₃	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.303	CH ₂ OC(O)CH ₃	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.304	CH(OH)CH ₂ OH	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.305	CH ₂ NHC(O)H	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.306	CH ₂ NHC(O)CH ₃	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.307	Cyclopropyl	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.308	Cyclopentyl	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.309	Cyclohexyl	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.310	Cyclopenten-2-yl	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.311	Cyclohexen-2-yl	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.312	Tetrahydrofur-2-yl	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.313	Tetrahydrofur-3-yl	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.314	Tetrahydropyran-2-yl	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.315	Tetrahydropyran-3-yl	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.316	Tetrahydropyran-4-yl	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.317	3,6-Dihydro-2H-pyran-4-yl	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.318	3,6-Dihydro-2H-pyran-5-yl	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.319	Phenyl	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.320	Pyrid-2-yl	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.321	H	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.322	CH ₃	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.323	CH=CH ₂	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.324	CH=CH(CH ₃)	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.325	CH=C(CH ₃) ₂	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.326	C(CH ₃)=CH ₂	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.327	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.328	C≡ CH	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.329	C≡ CCH ₃	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.330	CF ₃	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.331	CHF ₂	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.332	CF ₂ CF ₃	NHC(O)N(CH ₃) ₂

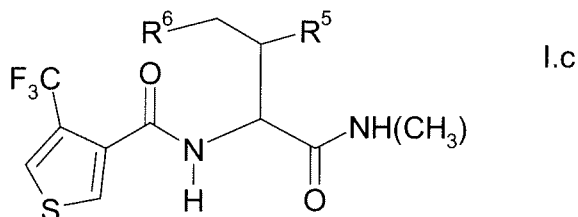
Nr.	R ⁵	R ⁶
I.a.333	CH ₂ OH	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.334	CH ₂ OCH ₃	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.335	CH ₂ OC(O)CH ₃	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.336	CH(OH)CH ₂ OH	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.337	CH ₂ NHC(O)H	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.338	CH ₂ NHC(O)CH ₃	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.339	Cyclopropyl	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.340	Cyclopentyl	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.341	Cyclohexyl	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.342	Cyclopenten-2-yl	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.343	Cyclohexen-2-yl	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.344	Tetrahydrofur-2-yl	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.345	Tetrahydrofur-3-yl	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.346	Tetrahydropyran-2-yl	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.347	Tetrahydropyran-3-yl	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.348	Tetrahydropyran-4-yl	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.349	3,6-Dihydro-2H-pyran-4-yl	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.350	3,6-Dihydro-2H-pyran-5-yl	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.351	Phenyl	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.352	Pyrid-2-yl	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.353	H	NHC(O)OCH ₃
I.a.354	CH ₃	NHC(O)OCH ₃
I.a.355	CH=CH ₂	NHC(O)OCH ₃
I.a.356	CH=CH(CH ₃)	NHC(O)OCH ₃
I.a.357	CH=C(CH ₃) ₂	NHC(O)OCH ₃
I.a.358	C(CH ₃)=CH ₂	NHC(O)OCH ₃
I.a.359	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	NHC(O)OCH ₃
I.a.360	C≡CH	NHC(O)OCH ₃
I.a.361	C≡CCH ₃	NHC(O)OCH ₃
I.a.362	CF ₃	NHC(O)OCH ₃
I.a.363	CHF ₂	NHC(O)OCH ₃
I.a.364	CF ₂ CF ₃	NHC(O)OCH ₃
I.a.365	CH ₂ OH	NHC(O)OCH ₃
I.a.366	CH ₂ OCH ₃	NHC(O)OCH ₃
I.a.367	CH ₂ OC(O)CH ₃	NHC(O)OCH ₃
I.a.368	CH(OH)CH ₂ OH	NHC(O)OCH ₃
I.a.369	CH ₂ NHC(O)H	NHC(O)OCH ₃
I.a.370	CH ₂ NHC(O)CH ₃	NHC(O)OCH ₃
I.a.371	Cyclopropyl	NHC(O)OCH ₃
I.a.372	Cyclopentyl	NHC(O)OCH ₃

Nr.	R ⁵	R ⁶
I.a.373	Cyclohexyl	NHC(O)OCH ₃
I.a.374	Cyclopenten-2-yl	NHC(O)OCH ₃
I.a.375	Cyclohexen-2-yl	NHC(O)OCH ₃
I.a.376	Tetrahydrofuran-2-yl	NHC(O)OCH ₃
I.a.377	Tetrahydrofuran-3-yl	NHC(O)OCH ₃
I.a.378	Tetrahydropyran-2-yl	NHC(O)OCH ₃
I.a.379	Tetrahydropyran-3-yl	NHC(O)OCH ₃
I.a.380	Tetrahydropyran-4-yl	NHC(O)OCH ₃
I.a.381	3,6-Dihydro-2H-pyran-4-yl	NHC(O)OCH ₃
I.a.382	3,6-Dihydro-2H-pyran-5-yl	NHC(O)OCH ₃
I.a.383	Phenyl	NHC(O)OCH ₃
I.a.384	Pyrid-2-yl	NHC(O)OCH ₃

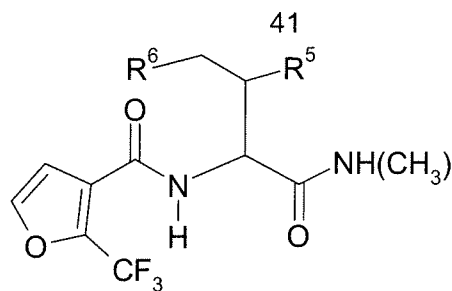
- Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.b, insbesondere die Verbindungen der Formel I.b.1 bis I.b.384, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.384 dadurch unterscheiden, daß A für A1 mit R¹³ = CH₃ und R¹⁴ = CF₃ steht:



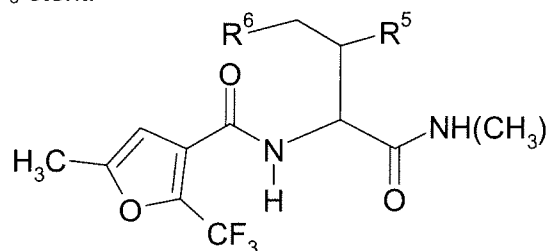
- Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.c, insbesondere die Verbindungen der Formel I.c.1 bis I.c.384, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.384 dadurch unterscheiden, daß A für A2 mit R¹³ = H und R¹⁴ = CF₃ steht:



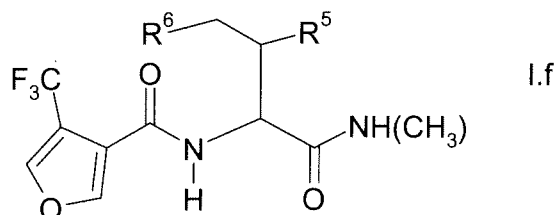
- Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.d, insbesondere die Verbindungen der Formel I.d.1 bis I.d.384, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.384 dadurch unterscheiden, daß A für A3 mit R¹³ = H und R¹⁴ = CF₃ steht:



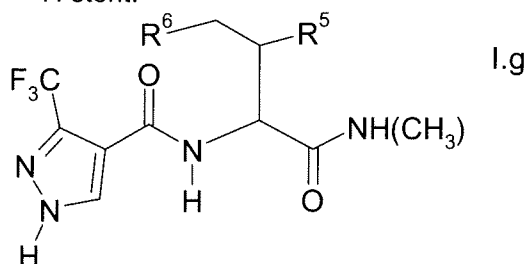
- Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.e, insbesondere die Verbindungen der Formel I.e.1 bis I.e.384, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.384 dadurch unterscheiden, daß A für A3 mit $R^{13} = \text{CH}_3$ und $R^{14} = \text{CF}_3$ steht:



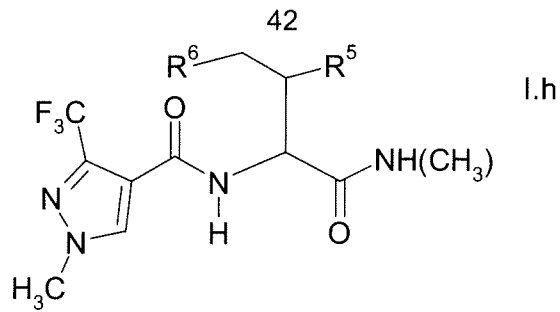
- Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.f, insbesondere die Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.384, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.384 dadurch unterscheiden, daß A für A4 mit $R^{13} = \text{H}$ und $R^{14} = \text{CF}_3$ steht:



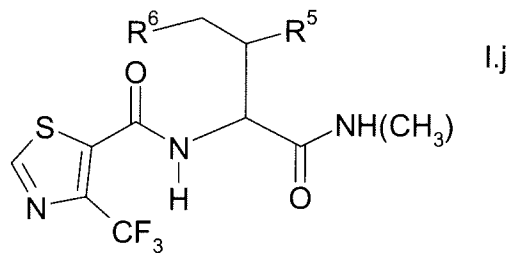
- Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.g, insbesondere die Verbindungen der Formel I.g.1 bis I.g.384, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.384 dadurch unterscheiden, daß A für A5 mit $R^{14} = \text{CF}_3$, sowie R^{15} und $R^{16} = \text{H}$ steht:



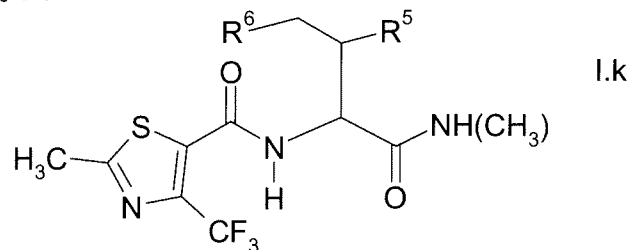
- Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.h, insbesondere die Verbindungen der Formel I.h.1 bis I.h.384, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.384 dadurch unterscheiden, daß A für A5 mit $R^{14} = \text{CF}_3$, $R^{15} = \text{H}$ und $R^{16} = \text{CH}_3$ steht:



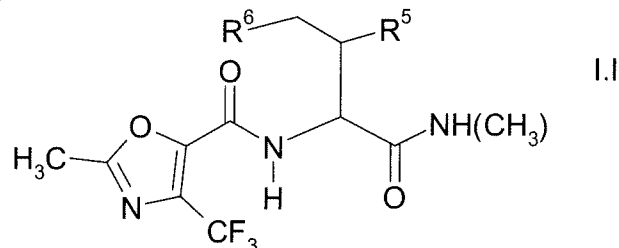
- Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.j, insbesondere die Verbindungen der Formel I.j.1 bis I.j.384, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.384 dadurch unterscheiden, daß A für A8 mit $R^{13} = H$ und $R^{14} = CF_3$ steht:



- Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.k, insbesondere die Verbindungen der Formel I.k.1 bis I.k.384, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.384 dadurch unterscheiden, daß A für A8 mit $R^{13} = CH_3$ und $R^{14} = CF_3$ steht:



- Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.l, insbesondere die Verbindungen der Formel I.l.1 bis I.l.384, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.384 dadurch unterscheiden, daß A für A10 mit $R^{13} = CH_3$ und $R^{14} = CF_3$ steht:

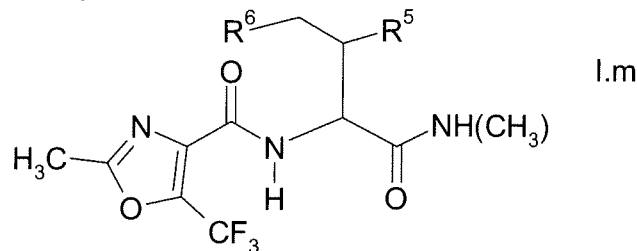


20

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.m, insbesondere die Verbindungen der Formel I.m.1 bis I.m.384, die sich von den entsprechenden

43

Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.384 dadurch unterscheiden, daß A für A11 mit $R^{13} = CH_3$ und $R^{14} = CF_3$ steht:

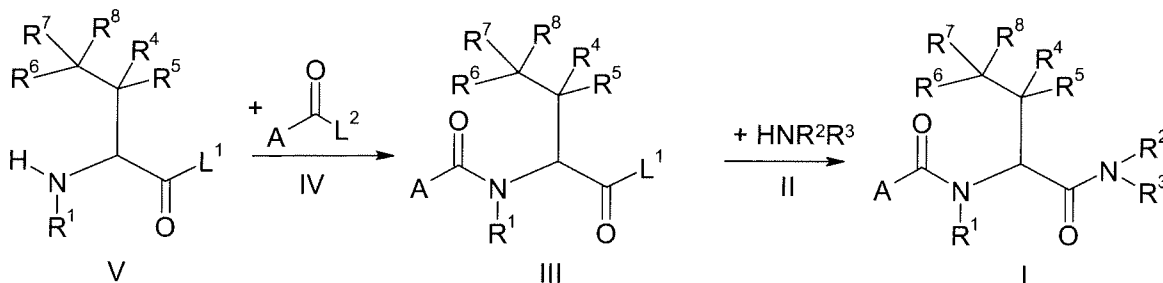


5

Die benzoylsubstituierten Alanine der Formel I sind auf verschiedene Art und Weise erhältlich, beispielsweise nach folgenden Verfahren:

Verfahren A

- 10 Alaninderivate der Formel V werden zunächst mit Heteroarylsäure(derivate)n der Formel IV zu entsprechenden Heteroarylderivaten der Formel III umgesetzt, welche anschließend mit Aminen der Formel II zu den gewünschten heteroaryl-substituierten Alaninen der Formel I reagieren:



15

L^1 steht für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe, z.B. für Hydroxy oder C_1 - C_6 -Alkoxy.

- 20 L^2 steht für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe, z.B. für Hydroxy, Halogen, C_1 - C_6 -Alkylcarbonyl, C_1 - C_6 -Alkoxy-carbonyl, C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl, Phosphoryl oder Iso-ureyl.

- 25 Die Umsetzung der Alaninderivate der Formel V mit Heteroarylsäure(derivate)n der Formel IV, wobei L^2 für Hydroxy steht, zu Heteroarylderivaten der Formel III erfolgt in Gegenwart eines Aktivierungsreagenz und einer Base üblicherweise bei Temperaturen von $0^\circ C$ bis zum Siedepunkt des Reaktionsgemisches, vorzugsweise $0^\circ C$ bis $110^\circ C$, besonders bevorzugt bei Raumtemperatur, in einem inerten organischen Lösungsmittel [vgl. C. Montalbetti et al., *Tetrahedron* 2005, 61, 10827 und darin zitierte Literatur].

- 30 Geeignete Aktivierungsreagenzien sind Kondensationsmittel wie z.B. polystyrolgebundenes Dicyclohexylcarbodiimid, Diisopropylcarbodiimid, Carbonyldiimidazol, Chlorkohlensäureester wie Methylchloroformiat, Ethylchloroformiat, Isoropylchloroformiat, Isobu-

tylchloroformiat, sec-Butylchloroformiat oder Allylchloroformiat, Pivaloylchlorid, Polyphosphorsäure, Propanphosphonsäureanhydrid, Bis(2-oxo-3-oxazolidinyl)-phosphorylchlorid (BOPCI) oder Sulfonylchloride wie Methansulfonylchlorid, Toluolsulfonylchlorid oder Benzolsulfonylchlorid.

5

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Gemische von C₅-C₈-Alkanen, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Benzol, Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-

10

Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran (THF), Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und tert.-Butylmethylketon, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid (DMF), Dimethylacetamid (DMA) und N-Methylpyrrolidon (NMP) oder auch in Wasser, besonders bevorzugt sind Methylenchlorid, THF und Wasser.

15

Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide wie Lithiumhydroxid, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid und Calciumhydroxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetalloxide wie Lithiumoxid, Natriumoxid, Calciumoxid und Magnesiumoxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride wie Lithiumhydrid, Natriumhydrid, Kaliumhydrid und Calciumhydrid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate wie Lithiumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat sowie Alkalimetallhydrogencarbonate wie Natriumhydrogencarbonat, außerdem organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Diisopropylethylamin, N-

20

25

Methylmorpholin, und N-Methylpiperidin, Pyridin, substituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders bevorzugt werden Natriumhydroxid, Triethylamin und Pyridin.

30

Die Basen werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen eingesetzt. Sie können aber auch im Überschuß oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann vorteilhaft sein, IV in einem Überschuß bezogen auf V einzusetzen.

Die Reaktionsgemische werden in üblicher Weise aufgearbeitet, z.B. durch Mischen mit Wasser, Trennung der Phasen und gegebenenfalls chromatographische Reinigung der Rohprodukte. Die Zwischen- und Endprodukte fallen z. T. in Form zäher Öle an, die unter vermindertem Druck und bei mäßig erhöhter Temperatur von flüchtigen Anteilen befreit oder gereinigt werden. Sofern die Zwischen- und Endprodukte als Feststoffe erhalten werden, kann die Reinigung auch durch Umkristallisieren oder Digerieren erfolgen.

40

Die Umsetzung der Alaninderivate der Formel V mit Heteroarylsäure(derivate)n der Formel IV, wobei L² für Halogen, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy carbonyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Phosphoryl oder Isoureyl steht, zu Heteroaroylderivaten der Formel III erfolgt in Gegenwart einer Base üblicherweise bei Temperaturen von 0 °C bis zum Siedepunkt des Reaktionsgemisches, vorzugsweise 0°C bis 100°C, besonders bevorzugt bei Raumtemperatur in einem inerten organischen Lösungsmittel [vgl. C. Montalbetti et al., Tetrahedron 2005, 61, 10827 und darin zitierte Literatur].

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Gemische von C₅-C₈-Alkanen, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Benzol, Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran (THF), Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und tert.-Butylmethylketon, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid (DMF), Dimethylacetamid (DMA) und N-Methylpyrrolidon (NMP) oder auch in Wasser, besonders bevorzugt sind Methylenchlorid, THF und Wasser.

Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide wie Lithiumhydroxid, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid und Calciumhydroxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetalloxide wie Lithiumoxid, Natriumoxid, Calciumoxid und Magnesiumoxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride wie Lithiumhydrid, Natriumhydrid, Kaliumhydrid und Calciumhydrid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate wie Lithiumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat sowie Alkalimetallhydrogencarbonate wie Natriumhydrogencarbonat, außerdem organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Diisopropylethylamin, N-Methylmorpholin, und N-Methylpiperidin, Pyridin, substituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders bevorzugt werden Natriumhydroxid, Triethylamin und Pyridin.

Die Basen werden im allgemeinen in äquimolar Mengen eingesetzt. Sie können aber auch im Überschuß oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann vorteilhaft sein, IV in einem Überschuß bezogen auf V einzusetzen.

Die Aufarbeitung und Isolierung der Produkte kann in an sich bekannter Weise erfolgen.

Natürlich können auch in analoger Weise zunächst die Alaninderivate der Formel V mit Aminen der Formel II zu den entsprechenden Amiden umgesetzt werden, welche dann mit Heteroarylsäure(derivate)n der Formel IV zu den gewünschten heteroaroyl-substituierten Alaninen der Formel I reagieren.

Die für die Herstellung der Heteroaroylderivate der Formel III benötigten Alaninderivate der Formel V (z.B. mit L¹ = Hydroxy oder C₁-C₆-Alkoxy) sind, auch in enantiomeren- und diastereomerenreiner Form, in der Literatur bekannt oder können gemäß der zitierten Literatur hergestellt werden:

1. Addition von Glycinenolat-Äquivalenten an Nitroolefine:

B. Mandler et al., *Org. Lett.* 2005, 7(9), 1715; D. Dixon et al., *Org. Lett.* 2004, 6(24), 4427 ; M. Alcantara et al., *Synthesis* 1996, (1), 64; M. Rowley et al., *Tetrahedron* 1992, 48(17), 3557.

2. Umlagerung von Glycin-allylamin-Derivaten:

J. Blid et al., *J. of the Am. Chem. Soc.* 2005, 27(26), 9352. H. Mues et al., *Synthesis* 2001, (3), 487 ; U. Kazmaier, *Angew. Chem.* 1994, 106(9), 1046.

3. Addition von Glycinenolat-Äquivalenten an Epoxide:

V. Rolland-Fulcrand et al., *Europ. J. of Org. Chem.* 2004, (4), 873; U. Schoellkopf et al., *Angew. Chem.* 1986, 98(8), 755.

20

Die für die Herstellung der Heteroaroylderivate der Formel III benötigten Heteroaroylsäure(derivate) der Formel IV können käuflich erworben werden oder können analog zu literaturbekannten Vorschriften hergestellt werden [z.B. Chang-Ling Liu et al., *J. of Fluorine Chem.* (2004), 125(9), 1287-1290; Manfred Schlosser et al., *Europ. J. of Org. Chem.* (2002), (17), 2913-2920; Hoh-Gyu Hahn et al., *Agricult. Chem. and Biotech. (English Edition)* (2002), 45(1), 37-42; Jonatan O Smith et al., *J. of Fluorine Chem.* (1997), Vol. 1996-1997, 81(2), 123-128 ; Etsuji Okada et al., *Heterocycles* (1992), 34(4), 791-798; Aliyu B. Abubakar et al., *J. of Fluorine Chem.* (1991), 55(2), 189-198; J. Leroy, *J. of Fluorine Chem.* (1991), 53(1), 61-70; Len F. Lee et al., *J. of Heterocyclic Chem.* (1990), 27(2), 243-245; Len F. Lee et al., *J. of Heterocyclic Chem.* (1985), 22(6), 1621-1630; Jacques Leroy et al., *Synthesis* (1982), (4), 313-315].

Die Umsetzung der Heteroaroylderivate der Formel III mit L¹ = Hydroxy bzw. deren Salze mit Aminen der Formel II zu den gewünschten heteroaroyl-substituierten Alaninen der Formel I erfolgt in Gegenwart eines Aktivierungsreagens und gegebenenfalls in Gegenwart einer Base üblicherweise bei Temperaturen von 0 °C bis zum Siedepunkt des Reaktionsgemisches, vorzugsweise 0°C bis 100°C, besonders bevorzugt bei Raumtemperatur in einem inerten organischen Lösungsmittel [vgl. C. Montalbetti et al., *Tetrahedron* 2005, 61, 10827 und darin zitierte Literatur].

Geeignete Aktivierungsreagenzien sind Kondensationsmittel wie z.B. polystyrolgebundenes Dicyclohexylcarbodiimid, Diisopropylcarbodiimid,

Carbonyldiimidazol, Chlorkohlensäureester wie Methylchloroformiat, Ethylchloroformiat, Isoropylchloroformiat, Isobutylchloroformiat, sec-Butylchloroformiat oder Allylchloroformiat, Pivaloylchlorid, Polyphosphorsäure, Propanphosphonsäureanhydrid, Bis(2-oxo-3-oxazolidinyl)-phosphorylchlorid (BOPCl) oder Sulfonylchloride wie Methansulfonylchlorid, Toluolsulfonylchlorid oder Benzolsulfonylchlorid.

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Gemische von C₅-C₈-Alkanen, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Benzol, Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran (THF), Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und tert.-Butylmethylketon, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid (DMF), Dimethylacetamid (DMA) und N-Methylpyrrolidon (NMP) oder auch in Wasser, besonders bevorzugt sind Methylenchlorid, THF, Methanol, Ethanol und Wasser.

Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide wie Lithiumhydroxid, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid und Calciumhydroxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetalloxide wie Lithiumoxid, Natriumoxid, Calciumoxid und Magnesiumoxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride wie Lithiumhydrid, Natriumhydrid, Kaliumhydrid und Calciumhydrid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate wie Lithiumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat sowie Alkalimetallhydrogencarbonate wie Natriumhydrogencarbonat, außerdem organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Diisopropylethylamin, N-Methylmorpholin, und N-Methylpiperidin, Pyridin, substituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders bevorzugt werden Natriumhydroxid, Triethylamin, Ethyldiisopropylamin, N-methylmorpholin und Pyridin.

Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch äquimolar, im Überschuß oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann vorteilhaft sein II in einem Überschuß bezogen auf III einzusetzen.

Die Aufarbeitung und Isolierung der Produkte kann in an sich bekannter Weise erfolgen.

Die Umsetzung der Heteroaroylderivate der Formel III mit $L^1 = C_1-C_6$ -Alkoxy mit Aminen der Formel II zu den gewünschten heteroaroyl-substituierten Alaninen der Formel I erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 0 °C bis zum Siedepunkt des Reaktionsgemisches, vorzugsweise 0°C bis 100°C, besonders bevorzugt bei Raumtemperatur in
5 einem inerten organischen Lösungsmittel gegebenenfalls in Gegenwart einer Base [vgl. C. Montalbetti et al., Tetrahedron 2005, 61, 10827 und darin zitierte Literatur].

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Gemische von C_5-C_8 -Alkanen, aromatische Kohlenwasserstoffe wie
10 Benzol, Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran (THF), Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und tert.-Butylmethylketon, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol
15 und tert.-Butanol, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid (DMF), Dimethylacetamid (DMA) und N-Methylpyrrolidon (NMP) oder auch in Wasser, besonders bevorzugt sind Methylenchlorid, THF, Methanol, Ethanol und Wasser.
Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

20 Die Umsetzung kann gegebenenfalls in Gegenwart einer Base erfolgen. Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide wie Lithiumhydroxid, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid und Calciumhydroxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetalloxide wie Lithiumoxid, Natriumoxid, Calciumoxid und Magnesiumoxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride wie Lithiumhydrid, Natrium-
25 hydrid, Kaliumhydrid und Calciumhydrid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate wie Lithiumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat sowie Alkalimetallhydrogencarbonate wie Natriumhydrogencarbonat, außerdem organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Diisopropylethylamin, N-Methylmorpholin, und N-Methylpiperidin, Pyridin, substituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-
30 Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders bevorzugt werden Natriumhydroxid, Triethylamin, Ethyldiisopropylamin, N-methylmorpholin und Pyridin.

Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch äquimolar, im Überschuß oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet
35 werden.

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann vorteilhaft sein, II in einem Überschuß bezogen auf III einzusetzen.

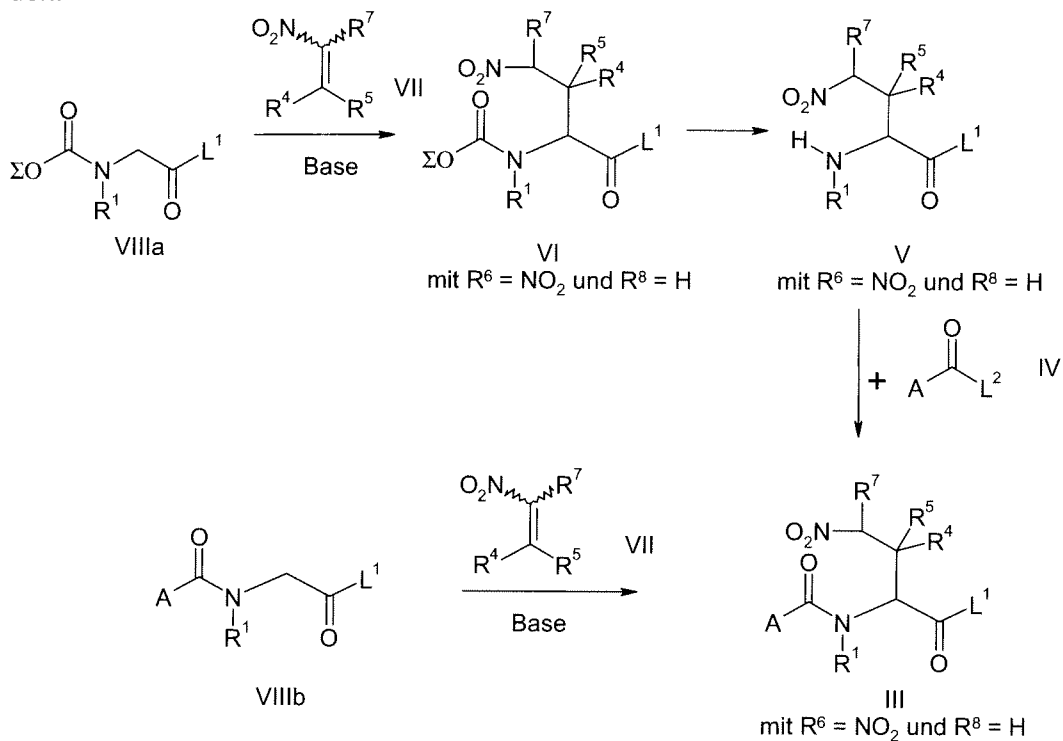
40 Die Aufarbeitung und Isolierung der Produkte kann in an sich bekannter Weise erfolgen.

Die für die Herstellung der heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I benötigten Amine der Formel II können käuflich erworben werden.

5 Verfahren B

Heteroaroylderivate der Formel III mit $R^6 = \text{NO}_2$ und $R^8 = \text{Wasserstoff}$ können auch erhalten werden, indem acylierte Glycin-Derivate der Formel VIII, wobei die Acylgruppe eine abspaltbare Schutzgruppe wie Benzyloxycarbonyl (vgl. VIIIa mit $\Sigma = \text{Benzyl}$) oder tert.-Butyloxycarbonyl (vgl. VIIIa mit $\Sigma = \text{tert-Butyl}$) sein kann, mit Nitroolefinen VII zu entsprechenden Additionsprodukten VI mit $R^6 = \text{NO}_2$ und $R^8 = \text{Wasserstoff}$ kondensiert werden. Anschließend wird die Schutzgruppe abgespalten und das so entstandene Alaninderivat der Formel V mit $R^6 = \text{NO}_2$ und $R^8 = \text{Wasserstoff}$ mit Heteroaroylsäure(derivate)n der Formel IV acyliert.

- 15 Analog kann auch ein acyliertes Glycin-Derivat der Formel VIII, wobei die Acylgruppe ein substituierter Heteroarolyrest (vgl. VIIIb) ist, unter Baseneinfluß mit einem Nitroolefin VII zum Heteroaroylderivat III mit $R^6 = \text{NO}_2$ und $R^8 = \text{Wasserstoff}$ umgesetzt werden:



20

L^1 steht für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe, z.B. für Hydroxy oder $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-Alkoxy}$.

25

L^2 steht für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe, z.B. für Hydroxy, Halogen, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-Alkylcarbonyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-Alkoxy carbonyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkylsulfonyl}$, Phosphoryl oder Isoureyl.

Die Umsetzung der Glycinderivate VIII mit Nitroolefinen VII zum entsprechenden Additionsprodukt VI mit $R^6 = \text{NO}_2$ und $R^8 = \text{Wasserstoff}$ bzw. Heteroaroylderivat III mit $R^6 = \text{NO}_2$ und $R^8 = \text{Wasserstoff}$ erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von -100°C bis zum Siedepunkt der Reaktionsmischung, bevorzugt -80°C bis 20°C , insbesondere bevorzugt -80°C bis -20°C , in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base (vgl. B. Mendler et al., Organic Lett. 2005, 7 (9), 1715; D. Dixon et al., Organic Lett. 2004, 6 (24), 4427; M. Alcantara et al., Synthesis 1996, (1), 64; M. Rowley et al., Tetrahedron 1992, 48 (17), 3557).

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Gemische von C_5 - C_8 -Alkanen, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid, besonders bevorzugt Diethylether, Dioxan und Tetrahydrofuran. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride wie Lithiumhydrid, Natriumhydrid, Kaliumhydrid und Calciumhydrid, Alkalimetallamide wie Lithiumisopropylamid und Lithiumhexamethyldisilazid, metallorganische Verbindungen, insbesondere Alkalimetallalkyle wie Methyllithium, Butyllithium und Phenyllithium, sowie Alkalimetall- und Erdalkalimetallalkoholate wie Natriummethanolat, Natriumethanolat, Kaliumethanolat, Kalium- tert.-Butanolat, Kalium-tert.-Pentanolat und Dimethoxymagnesium, außerdem organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Diisopropylethylamin und N-Methylpiperidin, Pyridin, substituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders bevorzugt werden Natriumhydrid, Lithiumhexamethyldisilazid und Lithiumdiisopropylamid.

Die Basen werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen eingesetzt, sie können aber auch katalytisch, im Überschuß oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

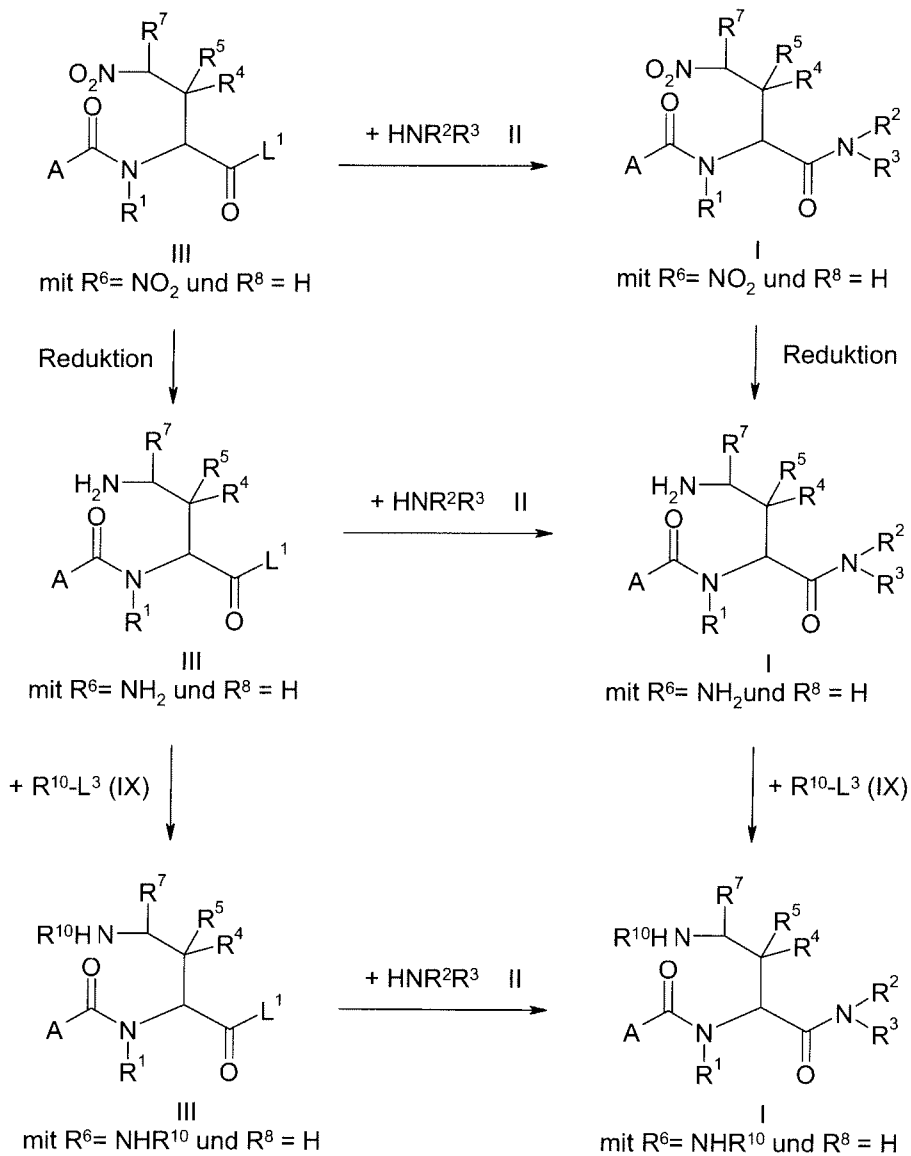
Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann vorteilhaft sein, die Base und/oder die Iminoverbindungen VII in einem Überschuß bezogen auf die Glycinderivate VIII einzusetzen.

Die Aufarbeitung und Isolierung der Produkte kann in an sich bekannter Weise erfolgen.

Die für die Herstellung der Heteroaroylderivate III mit $R^6 = \text{NO}_2$ und $R^8 = \text{Wasserstoff}$ benötigten Glycinderivate der Formel VIII können käuflich erworben werden, sind in der Literatur bekannt [z. B. H. Pessoa-Mahana et al., Synth. Comm. 32, 1437 (2002)] oder können gemäß der zitierten Literatur hergestellt werden.

- Die Abspaltung der Schutzgruppe Σ zu Alaninderivaten der Formel V mit $R^6 = \text{NO}_2$ und $R^8 = \text{Wasserstoff}$ erfolgt nach literaturbekannten Methoden [vgl. J.-F. Rousseau et al., J. Org. Chem. 63, 2731-2737 (1998)]; J. M. Andres, Tetrahedron 56, 1523 (2000)]; im
- 5 Fall von $\Sigma = \text{Benzyl}$ durch Hydrogenolyse, bevorzugt durch Wasserstoff und Pd/C in Methanol; im Fall von $\Sigma = \text{tert.-Butyl}$ durch Säure, bevorzugt Salzsäure in Dioxan.
- Die Umsetzung der Alaninderivate V mit $R^6 = \text{NO}_2$ und $R^8 = \text{Wasserstoff}$ mit Heteroarylsäure(derivate)n IV zu Heteroaroylderivaten III mit $R^6 = \text{NO}_2$ und $R^8 = \text{Wasserstoff}$ erfolgt
- 10 üblicherweise analog der unter Verfahren A genannten Umsetzung der Alaninderivate der Formel V mit Heteroarylsäure(derivate)n der Formel IV zu Heteroaroylderivaten III.
- Die auf diesem Weg erhältlichen Heteroaroylderivate der Formel III mit $R^6 = \text{NO}_2$ und
- 15 $R^8 = \text{Wasserstoff}$ lassen sich mit Amininen der Formel II analog zu Verfahren A zu den gewünschten heteroaroyl-substituierten Alaninen der Formel I mit $R^6 = \text{NO}_2$ und $R^8 = \text{Wasserstoff}$ umsetzen, welche anschließend gewünschtenfalls zunächst zu heteroaroyl-substituierten Alaninen der Formel I mit $R^6 = \text{NH}_2$ und $R^8 = \text{Wasserstoff}$ reduziert werden können. Die auf diesem Weg erhaltenen heteroaroyl-substituierten Alanine der
- 20 Formel I mit $R^6 = \text{NH}_2$ und $R^8 = \text{Wasserstoff}$ können anschließend mit Verbindungen IX zu heteroaroyl-substituierten Alaninen der Formel I mit $R^6 = \text{NHR}^{10}$ derivatisiert werden [vgl. z.B. Yokokawa, F. et al., Tetrahedron Lett. 42 (34), 5903-5908 (2001); Arrault, A. et al., Tetrahedron Lett. 43(22), 4041-4044 (2002)].
- 25 Ebenso können die Heteroaroylderivate der Formel III mit $R^6 = \text{NO}_2$ und $R^8 = \text{Wasserstoff}$ zunächst zu weiteren Heteroaroylderivaten der Formel III mit $R^6 = \text{NH}_2$ und $R^8 = \text{Wasserstoff}$ reduziert und anschließend gewünschtenfalls mit Verbindungen IX zu Heteroaroylderivaten der Formel III mit $R^6 = \text{NHR}^{10}$ und $R^8 = \text{Wasserstoff}$ derivatisiert werden [vgl. z.B. Jung-Hui Sun et al., Heterocycles (2004), 63(7), 585-1599; Christian
- 30 Lherbet et al., Bioorg. and Med. Chem. Lett. (2003), 13(6), 997-1000; Masami Otsuka et al., Chem. and Pharm. Bull. (1985), 33(2), 509-514; J. R Piper et al., J. of Med. Chem. (1985), 28(8), 1016-1025]. Die auf diesem Weg erhaltenen Heteroaroylderivate der Formel III mit $R^6 = \text{NHR}^{10}$ und $R^8 = \text{Wasserstoff}$ können anschließend analog zu Verfahren A mit Amininen der Formel II zu den gewünschten heteroaroyl-substituierten
- 35 Alaninen der Formel I mit $R^6 = \text{NHR}^{10}$ und $R^8 = \text{Wasserstoff}$ umgesetzt werden:

52



L^1 steht für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe, z.B. für Hydroxy oder C_1 - C_6 -Alkoxy.

5

L^3 steht für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe, z.B. für Halogen, Hydroxy, oder C_1 - C_6 -Alkoxy.

Die Umsetzung der Heteroaryl-derivate der Formel III mit $R^6 = \text{NO}_2$, NH_2 oder NHR^{10} , und $R^8 = \text{Wasserstoff}$ mit Aminen der Formel II zu heteroaryl-substituierten Alaninen der Formel I mit $R^6 = \text{NO}_2$, NH_2 oder NHR^{10} , und $R^8 = \text{Wasserstoff}$ erfolgt üblicherweise analog der unter Verfahren A geschilderten Umsetzung der Heteroaryl-derivate der Formel III mit Aminen der Formel II.

15

Die Reduktion der Heteroaroylderivate der Formel III mit $R^6 = \text{NO}_2$ und $R^8 = \text{Wasserstoff}$ zu Heteroaroylderivaten der Formel III mit $R^6 = \text{NH}_2$ und $R^8 = \text{Wasserstoff}$, sowie die Reduktion der heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I mit $R^6 = \text{NO}_2$ und $R^8 = \text{Wasserstoff}$ zu heteroaroyl-substituierten Alaninen der Formel I mit $R^6 = \text{NH}_2$ und $R^8 = \text{Wasserstoff}$ erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 0°C bis 100°C , vorzugsweise 10°C bis 50°C , in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart eines Reduktionsmittels.

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Gemische von C_5 - C_8 -Alkanen, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenechlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und tert.-Butylmethylethylketon, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid, besonders bevorzugt Dichlormethan, tert.-Butylmethylether, Dioxan und Tetrahydrofuran. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

Geeignete Reduktionsmittel sind Übergangsmetall-Katalysatoren (z.B. Pd/C oder Raney-Ni) in Kombination mit Wasserstoff.

Die Aufarbeitung und Isolierung der Produkte kann in an sich bekannter Weise erfolgen.

25

Die Reduktion der Nitroderivate der Formel II oder I mit $R^6 = \text{NO}_2$ erfolgt üblicherweise bei einer Temperatur von -100°C bis zum Siedepunkt der Reaktionsmischung, bevorzugt 0°C bis 100°C , in einem inerten organischen Lösungsmittel mit einem Reduktionsmittel. (vgl. V. Burgess et al., Aust. J. of Chem. (1988), 41(7), 1063-1070).

30

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Gemische von C_5 - C_8 -Alkanen, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran (THF), Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und tert.-Butylmethylethylketon, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid, besonders bevorzugt Toluol, THF oder tert. Butylmethylether.

35
40

Geeignete Reduktionsmittel sind Übergangsmetall-Katalysatoren (z.B. Pd/C oder Raney-Ni) in Kombination mit Wasserstoff.

Die Aufarbeitung und Isolierung des Produkts kann in an sich bekannter Weise erfolgen.

- 5 Die Umsetzung der Heteroaroylderivate der Formel III mit $R^6 = NH_2$ und $R^8 =$ Wasserstoff bzw. der heteroaroyl-substituierten Alaninen der Formel I mit $R^6 = NH_2$ und $R^8 =$ Wasserstoff mit Verbindungen der Formel IX zu Heteroaroylderivaten der Formel III mit $R^6 = NH_2$ und $R^8 =$ Wasserstoff bzw. heteroaroyl-substituierten Alaninen der Formel I mit $R^6 = NH_2$ und $R^8 =$ Wasserstoff erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von $0^\circ C$ bis
10 $100^\circ C$, vorzugsweise $10^\circ C$ bis $50^\circ C$, in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base [vgl. z.B. Jung-Hui Sun et al., *Heterocycles* (2004), 63(7), 585-1599; Christian Lherbet et al., *Bioorg. and Med. Chem. Lett.* (2003), 13(6), 997-1000; Masami Otsuka et al., *Chem. and Pharm. Bull.* (1985), 33(2), 509-514; J. R Piper et al., *J. of Med. Chem.* (1985), 28(8), 1016-1025].

15

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Gemische von C_5 - C_8 -Alkanen, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-

- 20 Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und tert.-Butylmethylketon, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid, besonders bevorzugt Dichlormethan, tert.-Butylmethylether, Dioxan und Tetrahydrofuran. Es können
25 auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

- Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide wie Lithiumhydroxid, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid und Calciumhydroxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetalloxide wie Lithiumoxid, Natriumoxid, Calciumoxid und Magnesiumoxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride wie Lithiumhydrid, Natriumhydrid, Kaliumhydrid und Calciumhydrid, Alkalimetallamide wie Lithiumamid, Natriumamid und Kaliumamid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate wie Lithiumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat sowie Alkalimetallhydrogencarbonate wie Natriumhydrogencarbonat, metallorganische Verbindungen,
35 insbesondere Alkalimetallalkyle wie Methyllithium, Butyllithium und Phenyllithium, Alkylmagnesiumhalogenide wie Methylmagnesiumchlorid sowie Alkalimetall- und Erdalkalimetallalkoholate wie Natriummethanolat, Natriumethanolat, Kaliumethanolat, Kalium-tert.-Butanolat, Kalium-tert.-Pentanolat und Dimethoxymagnesium, außerdem organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Diisopropylethylamin und N-Methylpiperidin, Pyridin, substituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders bevorzugt werden
40 Natriumhydroxid, Natriumhydrid und Triethylamin.

Die Basen werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen eingesetzt, sie können aber auch katalytisch, im Überschuß oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

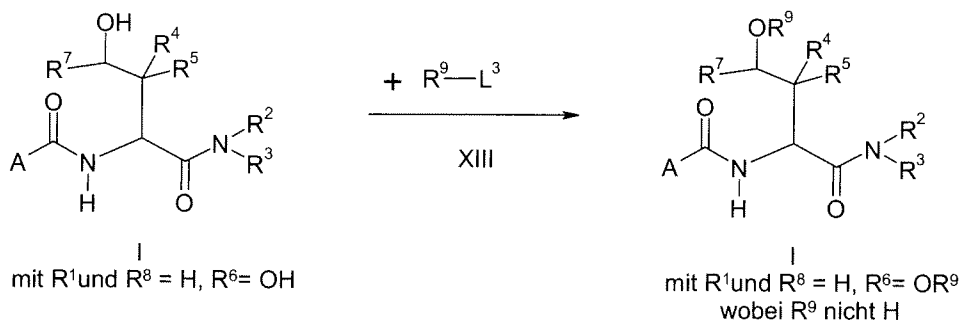
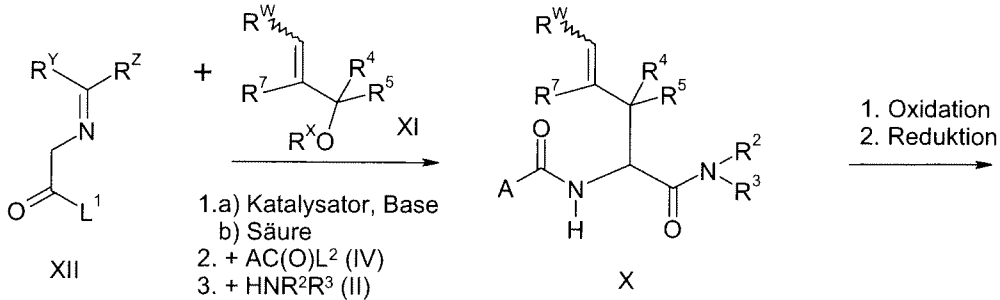
- 5 Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann vorteilhaft sein, die Base und/oder IX in einem Überschuß bezogen auf III bzw. I einzusetzen.

- 10 Die Aufarbeitung und Isolierung der Produkte kann in an sich bekannter Weise erfolgen.

Verfahren C

Heteroaroyl-substituierte Alanine der Formel I mit R^1 und $R^8 =$ Wasserstoff sowie

- 15 $R^6 = OH$ können erhalten werden, indem in einem ersten Schritt Glycin-Derivate der Formel XII mit einem Allylalkohol-Derivat der Formel XI in Gegenwart von einem Übergangsmetallkatalysator und einer Base, sowie anschließender wässrig-saurer Aufarbeitung zu Amino-Derivaten umgesetzt werden, welche anschließend in einem zweiten und dritten Schritt analog Verfahren A acyliert und in ein Amid X überführt werden können. Anschließend kann die Doppelbindung des Amids X oxidativ gespalten werden und der entstehende Aldehyd zu heteroaroyl-substituierten Alaninen der Formel I mit R^1 und $R^8 =$ Wasserstoff sowie $R^6 = OH$ reduziert werden. Die auf diesem Weg erhaltenen heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I mit R^1 und $R^8 =$ Wasserstoff sowie $R^6 = OH$ können wiederum zu weiteren heteroaroyl-substituierte Alaninen der Formel I mit R^1 und $R^8 =$ Wasserstoff sowie $R^6 = OR^9$, wobei R^9 nicht für Wasserstoff
- 25 steht, derivatisiert werden:



L¹ steht für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe, z.B. Hydroxy oder C₁-C₆-Alkoxy.

5 L² steht für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe, z.B. für Hydroxy, Halogen, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Phosphoryl oder Iso-ureyl.

10 L³ steht für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe, z.B. für Halogen, Hydroxy, oder C₁-C₆-Alkoxy.

R^Y und R^Z stehen für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder Aryl.

R^W steht für Wasserstoff oder R⁵.

15 R^X steht für eine Acylgruppe wie C₁-C₆-Alkylcarbonyl (z.B. Methylcarbonyl) oder C₁-C₆-Alkoxycarbonyl (z.B. Methoxycarbonyl).

20 Die Umsetzung der Glycin-Derivate der Formel XII mit einem Allylalkohol-Derivat der Formel XI erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von -100°C bis zum Siedepunkt der Reaktionsmischung, bevorzugt -80°C bis 80°C, insbesondere bevorzugt -20°C bis 50°C, in einem inerten organischen Lösungsmittel in in Gegenwart von einem Übergangsmetallkatalysator und einer Base, sowie anschließender wässrig-saurer Aufarbeitung.

25 Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Gemische von C₅-C₈-Alkanen, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und tert.-Butylmethylketon, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid; besonders bevorzugt sind Toluol, THF und Acetonitril.

35 Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

Als Katalysatoren können bevorzugt Palladium-, Iridium- oder Molybden-Katalysatoren eingesetzt werden, bevorzugt in gegen Gegenwart eines Phosphinliganden wie Triphenylphosphin. In Gegenwart einen chiralen Phosphinliganden ist die Reaktion
40 auch enantioselektiv durchführbar (vgl. D. Ikeda et al., Tetrahedron Lett. 2005, 46(39), 6663; T.Kanayama et al., J. of Org. Chem. 2003, 68(16), 6197; I. Baldwin et al., Tetrahedron Asym. 1995, 6(7), 1515; J. Genet et al., Tetrahedron 1988, 44(17), 5263).

- Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide wie Lithiumhydroxid, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid und Calciumhydroxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetalloxide wie Lithiumoxid, Natriumoxid, Calciumoxid und Magnesiumoxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride wie Lithiumhydrid, Natriumhydrid, Kaliumhydrid und Calciumhydrid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate wie Lithiumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat sowie Alkalimetallhydrogencarbonate wie Natriumhydrogencarbonat, Alkalimetall- und Erdalkalimetallalkoholate wie Natriummethanolat, Natriumethanolat, Kaliumethanolat, Kalium-tert.-Butanolat, Kalium-tert.-Pentanolat und Dimethoxymagnesium, außerdem organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Diisopropylethylamin und N-Methylpiperidin, Pyridin, substituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders bevorzugt werden Carbonate wie Na_2CO_3 .
- Die Basen werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen eingesetzt, sie können aber auch im Überschuß oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

Die anschließenden Schritte 2 und 3 können analog der unter Verfahren A beschriebenen Umsetzung von Alaninderivaten der Formel V mit Heteroarylsäure(derivate)n der Formel IV zu entsprechenden Heteroaroxylderivaten der Formel III und anschließender Reaktion des Reaktionsprodukts mit Aminen der Formel II zu den gewünschten heteroaroxy-substituierten Alaninen der Formel I erfolgen.

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann vorteilhaft sein, die Base und/oder IX in einem Überschuß bezogen auf III bzw. I einzusetzen.

Die Aufarbeitung und Isolierung der Produkte kann in an sich bekannter Weise erfolgen.

Die benötigten Glycin-Derivate der Formel XII können analog literaturbekannter Methoden (vgl. Vicky A. Burgess et al., Aust. J. of Chem. (1988), 41(7), 1063-1070) erhalten werden.

Die benötigten Allylalkohol-Derivate der Formel XI können käuflich erworben werden.

Die Oxidation der Doppelbindung zum Aldehyd erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von -100°C bis zum Siedepunkt der Reaktionsmischung, bevorzugt -80°C bis 40°C , insbesondere bevorzugt -80°C bis 0°C , in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart eines Oxidationsmittels.

Bevorzugt erfolgt die Oxidation mit Ozon oder über die sequenzielle Dihydroxylierung mit Osmium-Katalysatoren wie OsO_4 oder Permanganaten wie KMnO_4 und anschlie-

ßender Diolsplaltung, diese bevorzugt mit NaIO_4 (vgl. A. Siebum et al., J. Europ. J. of Org. Chem. 2004, (13), 2905; S. Hanessian et al., J. of Med. Chem. (2001), 44(19), 3074; J. Sabol et al., Tetrahedron Lett. 1997, 38(21), 3687 ; D. Hallett et al., J. of Chem. Soc., Chem. Comm. 1995, (6), 657).

5

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Gemische von C_5 - C_8 -Alkanen, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran (THF), Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und tert.-Butylmethylketon, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid; besonders bevorzugt Toluol, THF und Aceton.

10

15 Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

Die Aufarbeitung und Isolierung des Produkts kann in an sich bekannter Weise erfolgen.

20

Die danach folgende Reduktion zu heteroaroyl-substituierten Alaninen der Formel I mit R^1 und $\text{R}^8 = \text{Wasserstoff}$ sowie $\text{R}^6 = \text{OH}$ erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von -100°C bis zum Siedepunkt der Reaktionsmischung, bevorzugt -80°C bis 40°C , insbesondere bevorzugt -80°C bis 20°C , in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart eines Reduktionsmittels.

25

Bevorzugte Reduktionsmittel sind Borhydride wie NaBH_4 (vgl. A. Siebum et al., J. Europ. J. of Org. Chem. 2004, (13), 2905; S. Hanessian et al., J. of Med. Chem. (2001), 44(19), 3074; J. Sabol et al., Tetrahedron Lett. 1997, 38(21), 3687 ; D. Hallett et al., J. of Chem. Soc., Chem. Comm. 1995, (6), 657).

30

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Gemische von C_5 - C_8 -Alkanen, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran (THF), Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol, sowie Dimethylformamid und Dimethylacetamid; besonders bevorzugt Toluol, THF und Dioxan.

35

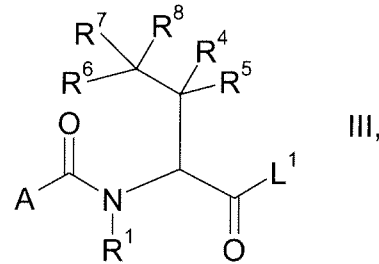
Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

40 Die Aufarbeitung und Isolierung des Produkts kann in an sich bekannter Weise erfolgen.

- Die Derivatisierung der heteroaroyl-substituierte Alanine der Formel I mit R^1 und R^8 sowie $R^6 = OH$ mit Verbindungen der Formel XIII zu heteroaroyl-substituierte Alaninen der Formel I mit R^1 und R^8 sowie $R^6 = OR^9$, wobei R^9 nicht für Wasserstoff steht, erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von $0^\circ C$ bis $100^\circ C$, vorzugsweise $10^\circ C$ bis $50^\circ C$, in
- 5 einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base [vgl. z.B. Jung-Hui Sun et al., *Heterocycles* (2004), 63(7), 585-1599; Christian Lherbet et al., *Bioorg. and Med. Chem. Lett.* (2003), 13(6), 997-1000; Masami Otsuka et al., *Chem. and Pharm. Bull.* (1985), 33(2), 509-514; J. R Piper et al., *J. of Med. Chem.* (1985), 28(8), 1016-1025].
- 10 Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Gemische von C_5 - C_8 -Alkanen, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylethylether,
- 15 Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid, besonders bevorzugt Dichlormethan, tert.-Butylmethylether, Dioxan und Tetrahydrofuran. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.
- 20 Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide wie Lithiumhydroxid, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid und Calciumhydroxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetalloxide wie Lithiumoxid, Natriumoxid, Calciumoxid und Magnesiumoxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride wie Lithiumhydrid, Natriumhydrid, Kaliumhydrid und Calciumhydrid, Alkalimetall- und Erdalkalimetall-
- 25 carbonate wie Lithiumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat sowie Alkalimetallhydrogencarbonate wie Natriumhydrogencarbonat, metallorganische Verbindungen, insbesondere Alkalimetallalkyle wie Methyllithium, Butyllithium und Phenyllithium, Alkylmagnesiumhalogenide wie Methylmagnesiumchlorid sowie organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Diisopropylethylamin und N-
- 30 Methylpiperidin, Pyridin, substituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders bevorzugt werden Natriumcarbonat, Natriumhydrid und Triethylamin.
- Die Basen werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen eingesetzt, sie können aber auch katalytisch, im Überschuß oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.
- 35
- Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann vorteilhaft sein, die Base und/oder XIII in einem Überschuß bezogen auf I einzusetzen.
- 40
- Die Aufarbeitung und Isolierung der Produkte kann in an sich bekannter Weise erfolgen.

60

Heteroaroylderivate der Formel III



wobei A, R¹ sowie R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ und R⁸ die voranstehend genannten Bedeutungen haben und L¹ für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe, z.B. für Hydroxy oder C₁-C₆-Alkoxy steht, sind ebenfalls ein Gegenstand der vorliegenden Erfindung.

Die besonders bevorzugten Ausführungsformen der Zwischenprodukte in Bezug auf die Variablen entsprechen denen der Reste A, R¹ sowie R⁴ bis R⁷ der Formel I.

- 10 Besonders bevorzugt werden Heteroaroylderivate der Formel III, in der
- A 5- oder 6-gliedriges Heteroaryl ausgewählt aus der Gruppe Thienyl, Furyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Thiazolyl, Oxazolyl und Pyridyl; wobei die
- genannten Heteroarylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder 1 bis 3 Reste aus der Gruppe C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl
- 15 und C₁-C₆-Halogenalkyl tragen können;
- R¹ Wasserstoff;
- R⁴ Wasserstoff;
- R⁵ C₂-C₆-Alkenyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, 3- bis 6-gliedriges Heterocyclyl, C₁-C₆-
- Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, Aminocarbonyl, C₁-
- 20 C₆-Alkylcarbonylamino-C₁-C₄-alkyl, Formylamino-C₁-C₄-alkyl, Phenyl oder Heteroaryl, wobei die vorstehend genannten 3- bis 6-gliedrigen Heterocyclyl- sowie die Phenyl- und Heteroarylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder ein bis drei C₁-C₆-Alkyl-Reste tragen können;
- R⁷ und R⁸ Wasserstoff;
- 25 R⁹ und R¹⁰ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, Formyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Halogenalkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, (C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl, N-(C₁-C₆-Alkoxy)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, [(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl(C₁-C₆-alkyl)amino]carbonyl oder Di(C₁-C₆-alkyl)aminothiocarbonyl oder SO₂R¹²; und
- 30 R¹¹ Wasserstoff
- bedeuten.

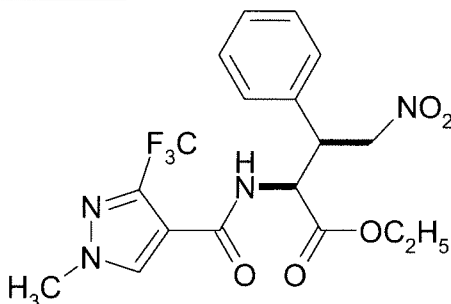
Die folgenden Beispiele dienen der Erläuterung der Erfindung.

Herstellungsbeispiele

5 Beispiel 1

1-Methyl-N-((1RS,2SR)-1-[(methylamino)carbonyl]-3-nitro-2-phenylpropyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazol-4-carboxamid (Tabelle 5, Nr. 5.3)

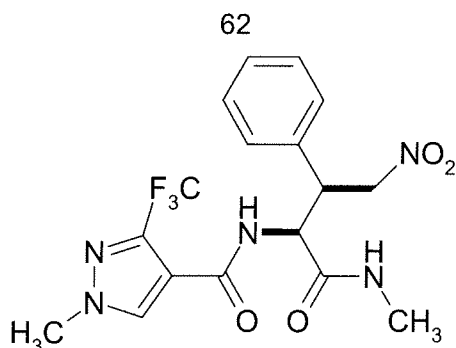
10 1.1) ((2RS,3SR)-2-([1-Methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-yl]carbonyl)amino)-4-nitro-3-phenylbuttersäureethylester (Tabelle 2, Nr. 2.1)



Zu einer Lösung von 34,9 g (138 mmol) (2RS,3SR)-2-Amino-4-nitro-3-phenylbuttersäure-ethylester (hergestellt gemäß M. Rowley et al., Tetrahedron 1992, 48, 3557-3570) und 12,0 g (152 mmol) Pyridin in Dichlormethan (400 ml) wurden bei einer Temperatur von 0 °C 29,4 g (138 mmol) 1-Methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-carbonsäurechlorid zugetropft. Das erhaltene Reaktionsgemisch wurde für weitere 16 Stunden bei Raumtemperatur gerührt und anschließend mit verdünnter Salzsäure (2 M) versetzt. Nach Absaugen und Trocknen des ausgefallenen Niederschlages erhielt man 8,0 g der Titelverbindung. Die organische Phase des Filtrats wurde mit verdünnter Natronlauge (2 M) gewaschen, getrocknet und eingeeengt. Mittels chromatographischer Reinigung (Kieselgel, Cyclohexan/Essigsäureethylester) konnten weitere 11,2 g der Titelverbindung erhalten werden. Man erhielt insgesamt 19,2 g (32,5 % der Theorie) der Titelverbindung.

25 ¹H-NMR (CDCl₃): δ = 1,10 (t, 3H); 3,95 (s, 3H); 3,95-4,10 (m, 3H); 4,85-4,95 (m, 2H); 5,10 (t, 1H); 6,60 (d, 1H); 7,15-7,35 (m, 5H); 7,95 (s, 1H).

30 1.2.) 1-Methyl-N-((1RS,2SR)-1-[(methylamino)carbonyl]-3-nitro-2-phenylpropyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazol-4-carboxamid (Tabelle 5, Nr. 5.3)

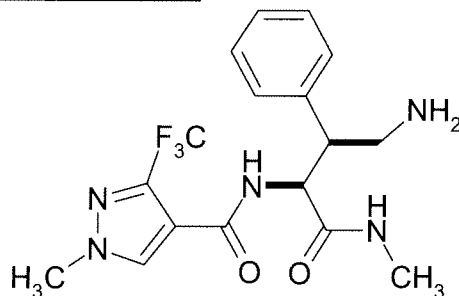


- In eine Lösung von 19,2 g (44,8 mmol) (2RS,3SR)-2-((1-Methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-yl)carbonyl)amino-4-nitro-3-phenylbuttersäureethylester in Methanol (200 ml) wurde Methylamin bei einer Temperatur von 0 °C bis zum Erreichen der Sättigungskonzentration eingeleitet. Das erhaltene Reaktionsgemisch wurde für weitere 16 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Nach anschließender Entfernung des Lösungsmittels wurden 18,8 g der Titelverbindung (100% der Theorie; Diastereomerengemisch, threo/erythro > 5:1) erhalten, die ohne weitere Aufreinigung in die nächste Stufe eingesetzt wurde.
- ¹H-NMR (DMSO) für threo-Isomer: δ = 2,35 (d, 3H); 3,95 (s, 3H); 3,90-4,05 (m, 1H); 4,75 (dd, 1H), 4,90 (dd, 1H); 5,10 (dd, 1H); 7,15-7,40 (m, 5H); 7,90 (br q, 1H); 8,50 (s, 1H); 8,55 (d, 1H).

15

Beispiel 2

N-((1RS,2RS)-3-Amino-1-[(methylamino)carbonyl]-2-phenylpropyl)-1-methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-carboxamid (Tabelle 4, Nr. 4.5)



20

- Eine Suspension von 5,0 g (12,1 mmol) 1-Methyl-N-((1RS,2SR)-1-[(methylamino)carbonyl]-3-nitro-2-phenylpropyl)-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-carboxamid in Methanol (100 ml) wurde mit 1,5 g (30,0 mmol) Hydrazinhydrat versetzt. Anschließend wurden bei einer Temperatur von 40 °C circa 0,5 g Raney-Nickel als methanolische Suspension portionsweise zugegeben. Das erhaltene Reaktionsgemisch wurde für weitere 2 Stunden bei 40 °C gerührt. Nach Abkühlen wurde der Niederschlag abfiltriert und mit Methanol gewaschen. Aus dem Filtrat wurden nach Entfernung des Lösungsmittels 2,7g der Titelverbindung (58,3 % der Theorie, Diastereomerengemisch, threo/erythro >5:1) erhalten, die ohne weitere Aufreinigung in der nachfolgenden Reaktion eingesetzt wurde.

30

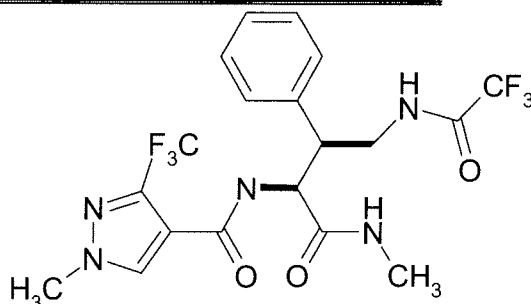
63

¹H-NMR (DMSO) für threo-Isomer: δ = 2,35 (d, 3H); 2,85 (d, 2H); 3,05-3,15 (m, 1H); 3,95 (s, 3H); 4,65 (d, 1H); 7,10-7,40 (m, 5H); 7,85 (br q, 1H); 8,50 (s, 1H); 8,75 (br s, 1H).

5

Beispiel 3

10 1-Methyl-N-((1RS,2SR)-1-[(methylamino)carbonyl]-2-phenyl-3-(2,2,2-trifluoracetyl-amino)propyl)-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-carboxamid (Tabelle 4, Nr. 4.17)



Eine Lösung von 0,40 g (1,04 mmol) N-((1RS,2RS)-3-Amino-1-[(methylamino)-
 15 carbonyl]-2-phenylpropyl)-1-methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-carboxamid und
 0,12 g (1,19 mmol) Triethylamin in Dichlormethan (10 ml) wurde mit 0,24 g (1,14 mmol)
 Trifluoressigsäureanhydrid versetzt. Das Reaktionsgemisch wurde für weitere 16 Stun-
 den bei Raumtemperatur gerührt und anschließend mit verdünnter Salzsäure (2 M)
 versetzt. Der ausgefallene Niederschlag wurde abgesaugt und nacheinander mit ver-
 20 dünnter Natronlauge (2 M) und destilliertem Wasser gewaschen. Nach Trocknen des
 Feststoffs wurden 0,35 g (70,2 % der Theorie) der Titelverbindung als diastereomeren-
 reine Verbindung erhalten.

¹H-NMR (DMSO): δ = 2,40 (d, 3H); 3,40-3,75 (m, 3H); 3,95 (s, 3H); 4,80 (t, 1H); 7,10-
 7,30 (m, 5H); 7,95 (br q, 1H); 8,45 (d, 1H); 8,50 (s, 1H); 9,20 (br t, 1H).

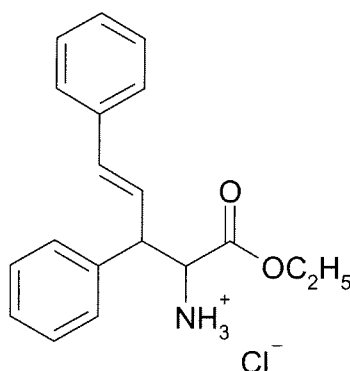
25

Beispiel 4

1-Methyl-3-trifluormethyl-1H-pyrazol-4-carbonsäure (3-hydroxy-1-methylcarbamoyl-2-
 phenyl-propyl)-amid (Tabelle 3, Nr. 3.1, 3.2)

30 4.1) (E)-1-Ethoxycarbonyl-2,4-diphenyl-but-3-enyl-ammoniumchlorid

64

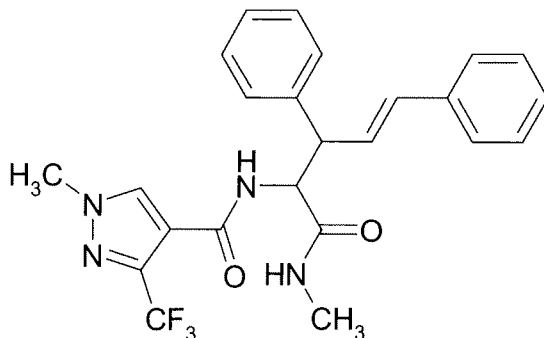


Lösung A: Bei $-60\text{ }^{\circ}\text{C}$ wurden 44 g (0.103 mol) n-Butyllithium (15 %ig in Hexan) zu einer Lösung von 10.4 g (0.103 mol) Diisopropylamin in 500 ml THF getropft. Es wurde 30 min bei $-20\text{ }^{\circ}\text{C}$ gerührt und erneut auf $-60\text{ }^{\circ}\text{C}$ gekühlt. Eine Lösung von 27.5 g (0.103 mol) (Benzhydryliden-amino)-essigsäureethylester in 30 ml THF wurde zuge-

5 tropft, und es wurde 1 h bei $-60\text{ }^{\circ}\text{C}$ gerührt.
 Lösung B: 26 g (0.103 mol) Essigsäure-(E)-1,3-diphenylallylester (hergestellt gemäß J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1, 2001, 2588 – 2594), 5.4 g (0.021 mol) Triphenylphosphin und 1.9 g (0.0052 mol) $[\text{Pd}(\text{allyl})\text{Cl}]_2$ wurden in 40 ml THF gelöst.
 10 Bei $-60\text{ }^{\circ}\text{C}$ wurde Lösung B zu Lösung A getropft, 3 h bei dieser Temperatur gerührt und anschließend auf Raumtemperatur erwärmt. Es wurde mit ges. NH_4Cl -Lösung versetzt und mit MTBE extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden über Na_2SO_4 getrocknet und das Lösungsmittel im Vakuum entfernt. Der Rückstand wurde in 200 ml THF gelöst und mit 200 ml Salzsäure (20 %ig) versetzt. Nach 24 h bei Raum-

15 temperatur wurde das Lösungsmittel im Vakuum entfernt, der Rückstand zweimal mit jeweils 500 ml Methanol versetzt und erneut im Vakuum eingeengt. Das Rohprodukt wurde mit Diethylether/ CH_2Cl_2 verrührt, der Feststoff abfiltriert und getrocknet. Es wurden 32.8 g (96 % der Theorie) der Titelverbindung (Diastereomergemisch) als gelber Feststoff mit dem Fp. $174 - 176\text{ }^{\circ}\text{C}$ erhalten.

4.2) 1-Methyl-3-trifluormethyl-1H-pyrazol-4-carbonsäure (E)-1-methylcarbamoyl-2,4-diphenyl-but-3-enyl)-amid

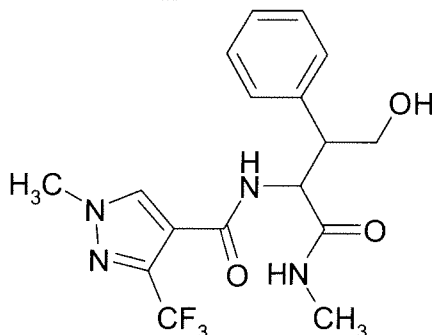


25 15 g (0.045 mol) (E)-1-Ethoxycarbonyl-2,4-diphenyl-but-3-enyl-ammoniumchlorid und 10.119 g (0.1 mol) Triethylamin wurden in 500 ml CH_2Cl_2 gelöst. Zu dieser Lösung wurden bei Raumtemperatur 9.608 g (0.045 mol) 1-Methyl-3-trifluormethyl-1H-pyrazol-

4-carbonylchlorid zugetropft. Es wurde 16 h bei Raumtemperatur gerührt, mit H₂O gewaschen, über Na₂SO₄ getrocknet und im Vakuum eingeengt. Der Rückstand wurde an Kieselgel chromatographisch (CH₂Cl₂/Ethylacetat 9:1) gereinigt. Der erhaltene (E)-2-
 5 [(1-Methyl-3-trifluormethyl-1H-pyrazol-4-carbonyl)-amino]-3,5-diphenyl-pent-4-
 ensäureethylester (18 g, 0.038 mol) wurde in 190 ml Methanol gelöst und mit 59.3 g
 (0.764 mol) einer Lösung von Methylamin in Methanol (40 %ig) versetzt. Es wurde 16 h
 bei Raumtemperatur gerührt, nochmals die gleiche Menge Methylamin in Methanol (40
 %ig) zugegeben und 3 d bei Raumtemperatur gerührt. Der ausgefallene Feststoff wur-
 10 de abfiltriert und getrocknet. Man erhielt 7.4 g der Titelverbindung (Diastereomer 1) als
 farblosen Feststoff mit dem Fp. 192 – 194 °C. Die Mutterlauge wurde eingeengt, mit
 Diethylether verrührt, der Feststoff abfiltriert und getrocknet. Es wurden 8.5 g der Titel-
 verbindung (Diastereomer 2:Diastereomer 1 = 3:2) als farbloser Feststoff mit dem Fp.
 239 – 241 °C erhalten. Die Gesamtausbeute betrug 15.9 g (77 % der Theorie über zwei
 Stufen).

15 ¹H-NMR (d₆-DMSO, Diastereomer 1): δ = 2.50 (d, 3H), 3.85 (m, 1H), 3.90 (s, 3H), 4.90
 (dd, 1H), 6.35 (d, 1H), 6.50 (dd, 1H), 7.15-7.40 (m, 10H), 8.20 (m, 2H), 8.35 (d, 1H).

20 4.3) 1-Methyl-3-trifluormethyl-1H-pyrazol-4-carbonsäure (3-hydroxy-1-
 methylcarbamoyl-2-phenyl-propyl)-amid (Tabelle 3, Nr. 3.1, 3.2)



Bei – 60 °C wurde in eine Lösung von 6 g (13.14 mmol) 1-Methyl-3-trifluormethyl-1H-
 pyrazol-4-carbonsäure ((E)-1-methylcarbamoyl-2,4-diphenyl-but-3-enyl)-amid (Diaste-
 25 reomerenverhältnis 3:2) in 450 ml Methanol/CH₂Cl₂ 2:1 unter Rühren Ozon bis zur Sät-
 tigung der Lösung eingeleitet (40 g/m³, ca. 50 l/h). Die bläuliche Lösung wurde noch
 ca. 45 min bei – 60 °C gerührt (vollständiger Umsatz), dann wurde mit N₂ gespült, 4.84
 g (63.63 mmol) NaBH₄ zugegeben und 16 h bei Raumtemperatur gerührt. Nach Filtra-
 tion wurde die Mutterlauge eingeengt, der Rückstand in CH₂Cl₂/THF 4:1 gelöst, mit
 30 verd. HCl gewaschen, über Na₂SO₄ getrocknet und im Vakuum eingeengt. Der Rück-
 stand wurde mit Diethylether verrührt, abfiltriert und der Feststoff getrocknet. Man er-
 hielt 3.1 g (61 % der Theorie) Titelverbindung (Diastereomerenverhältnis 3:2) als farb-
 losen Feststoff.

Zur Trennung der Diastereomeren wurde der Rückstand mit Aceton versetzt und bei 50
 °C gerührt, der Feststoff abfiltriert und getrocknet. Es wurden 0.5 g Titelverbindung
 35 (Diastereomer 1) als farbloser Feststoff erhalten. Die Mutterlauge wurde eingeengt, in

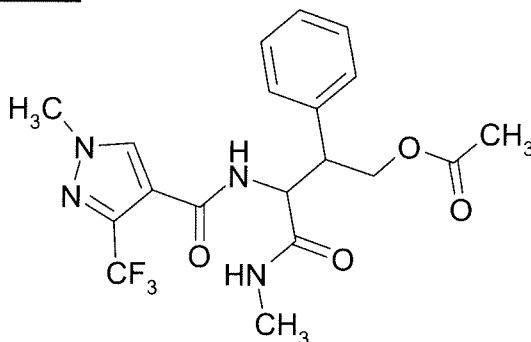
Methanol verrührt, der Feststoff abfiltriert und getrocknet. Es wurden 0.9 g Titelverbindung (Diastereomer 2:Diastereomer 1 = 6:1) als farbloser Feststoff mit dem Fp. 202 °C erhalten. Die Mutterlauge wurde nochmals eingengt, in wenig Methanol verrührt, der Feststoff abfiltriert und getrocknet. Man erhielt 1.1 g der Titelverbindung (Diastereomenverhältnis 1:1) als farblosen Feststoff mit dem Fp. 194 °C.

¹H-NMR (d₆-DMSO, Diastereomer 1): δ = 2.60 (d, 3H), 3.20 (m, 1H), 3.60 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 4.55 (t, 1H), 4.75 (t, 1H), 7.15 (m, 1H), 7.25 (m, 4H), 8.00 (d, 1H), 8.05 (m, 1H), 8.15 (s, 1H).

¹H-NMR (d₆-DMSO, Diastereomer 2): δ = 2.35 (d, 3H), 3.20 (m, 1H), 3.70 (m, 1H), 3.75 (m, 1H), 3.95 (s, 3H), 4.55 (t, 1H), 4.70 (t, 1H), 7.15 (m, 1H), 7.22-7.28 (m, 4H), 7.78 (m, 1H), 8.33 (d, 1H), 8.48 (s, 1H).

Beispiel 5

Essigsäure-3-methylcarbamoyl-3-[(1-methyl-3-trifluormethyl-1H-pyrazol-4-carbonyl)-amino]-2-phenyl-propylester (Tabelle 3, Nr. 3.7)



Zu einer Lösung von 400 mg (1.04 mmol) 1-Methyl-3-trifluormethyl-1H-pyrazol-4-carbonsäure(3-hydroxy-1-methylcarbamoyl-2-phenyl-propyl)-amid (Diastereomer 1) und 202 mg (2 mmol) Triethylamin in 20 ml CH₂Cl₂/THF 1:1 wurden 157 mg (2 mmol)

Acetylchlorid getropft, und es wurde 1 h bei Raumtemperatur gerührt. Das Reaktionsgemisch wurde mit H₂O gewaschen, über Na₂SO₄ getrocknet und das Lösungsmittel im Vakuum entfernt. Der Rückstand wurde in Ethylacetat gelöst, über Kieselgel filtriert und eingengt. Der Rückstand wurde nochmals mit Diethylether verrührt, abfiltriert und der Feststoff getrocknet. Es wurden 200 mg (45 % der Theorie) der Titelverbindung als farblosen Feststoff mit dem Fp. 175 °C erhalten (Diastereomer 1).

¹H-NMR (d₆-DMSO, Diastereomer 1): δ = 1.89 (s, 3H), 2.62 (d, 3H), 3.45 (m, 1H), 3.88 (s, 3H), 4.17 (dd, 1H), 4.24 (dd, 1H), 4.81 (t, 1H), 7.19 (m, 1H), 7.27 (m, 4H), 8.21 (m, 3H).

Beispiel 6

Essigsäure-3-methylcarbamoyl-3-[(1-methyl-3-trifluormethyl-1H-pyrazol-4-carbonyl)-amino]-2-phenyl-propylester (Tabelle 3, Nr. 3.8)

Analog zu obiger Vorschrift wurde aus 1-Methyl-3-trifluormethyl-1H-pyrazol-4-

carbonsäure(3-hydroxy-1-methylcarbamoyl-2-phenyl-propyl)-amid (Diastereomer 2 :

Diastereomer 1 = 6:1) die Verbindung 3.8 (Diastereomer 2 : Diastereomer 1 = 6:1) als farbloser Feststoff mit dem Fp. 204 °C erhalten.

¹H-NMR (d₆-DMSO, Diastereomer 2): δ = 1.86 (s, 3H), 2.35 (d, 3H), 3.47 (m, 1H), 3.95 (s, 3H), 4.16 (dd, 1H), 4.42 (dd, 1H), 4.83 (t, 1H), 7.20 (m, 1H), 7.25-7.30 (m, 4H), 7.90 (m, 1H), 8.48 (d, 1H), 8.50 (s, 1H).

In den nachfolgenden Tabellen 2 bis 5 werden neben den voranstehenden Verbindungen noch weitere Heteroaroylderivate der Formel III sowie heteroaroyl-substituierte Alanine der Formel I aufgeführt, die in analoger Weise nach den voranstehend beschriebenen Verfahren hergestellt wurden oder herstellbar sind.

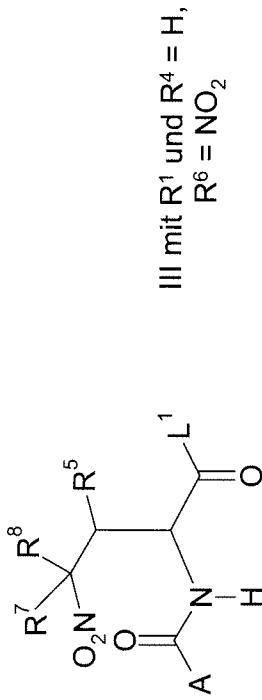


Tabelle 2

Nr.	A	R ⁵	R ⁷	R ⁸	L ¹	Diastereomeren- verhältnis	Chiralität	Fp. [°C]
2.1.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	C ₆ H ₅	H	H	OC ₂ H ₅	5:1	rac	429
2.2.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	2-CH ₃ -3-F-C ₆ H ₅	H	H	OC ₂ H ₅	1:0	rac	461
2.3.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	4-Tetrahydropyranyl	H	H	OC ₂ H ₅	1:0	rac	437

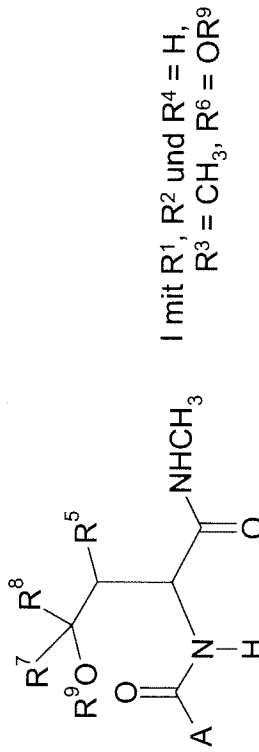


Tabelle 3

Nr.	A	R ⁵	R ⁷	R ⁸	R ⁹	Diastereomeren- verhältnis	Chiralität	Fp. [°C]	M ⁺ +H (m/z)
3.1.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	C ₆ H ₅	H	H	H	1:1	rac.	194	
3.2.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	C ₆ H ₅	H	H	H	6:1	rac.	202	
3.3.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	C ₆ H ₅	H	H	CH ₂ COOCH ₃	1:1	rac.		457

Nr.	A	R ⁵	R ⁷	R ⁸	R ⁹	Diastereomerenverhältnis	Chiralität	Fp. [°C]	M ⁺⁺ H (m/z)
3.4.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	C ₆ H ₅	H	H	(CO)NHCH ₃	1:1	rac.		442
3.5.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	C ₆ H ₅	H	H	(CO)N(CH ₃) ₂	1:1	rac.		456
3.6.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	C ₆ H ₅	H	H	(CO)CH ₃	1:1	rac.		427
3.7.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	C ₆ H ₅	H	H	(CO)CH ₃	0:1	rac.	175	
3.8.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	C ₆ H ₅	H	H	(CO)CH ₃	6:1	rac.	194	
3.9.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	C ₆ H ₅	H	H	(CO)C(CH ₃) ₃	1:1	rac.		469
3.10.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	C ₆ H ₅	H	H	(CO)CH ₂ COOCH ₃	1:1	rac.	205	
3.11.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	C ₆ H ₅	H	H	(CO)CH ₂ CH ₂ COOCH ₃	1:1	rac.		499
3.12.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	C ₆ H ₅	H	H	(CO)CH ₂ CH ₂ CH ₂ COOCH ₃	1:1	rac.		513
3.13.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	C ₆ H ₅	H	H	(CO)CH ₂ CH ₂ CH ₂ COOCH ₃	1:1	rac.	149	
3.14.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	C ₆ H ₅	H	H	(CO)N(CH ₃)[(CO)NHCH ₃]	6:1	rac.	198	

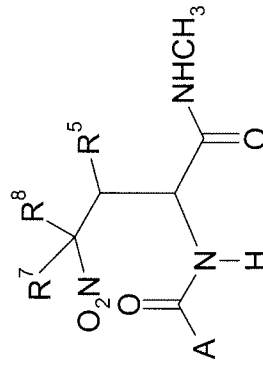


Tabelle 4

Nr.	A	R ⁵	R ⁷	R ⁸	R ¹⁰	Diastereomerenverhältnis	Chiralität	Fp. [°C]	M ⁺⁺ H (m/z)
4.1.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	H	H	H	(CO)OC(CH ₃) ₃	-	2-S	120	

Nr.	A	R ⁵	R ⁷	R ⁸	R ¹⁰	Diastereomerenverhältnis	Chiralität	Fp. [°C]	M ⁺⁺ H (m/z)
4.2.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	H	H	H	(CO)N(CH ₃) ₂	-	2-S		379
4.3.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	H	H	H	(CO)H	-	2-S		335
4.4.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	H	H	H	(CO)CH ₃	-	2-S		350
4.5.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	C ₆ H ₅	H	H	H	> 5:1	rac.	91	
4.6.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	C ₆ H ₅	H	H	(SO ₂)N(CH ₃) ₂	1:0	rac.	210	
4.7.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	C ₆ H ₅	H	H	(SO ₂)CH ₃	9:1	rac.	245	
4.8.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	C ₆ H ₅	H	H	(CS)NHCH ₃	5:1	rac.	193	
4.9.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	C ₆ H ₅	H	H	(CO)SCH ₃	1:0	rac.	243	
4.10.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	C ₆ H ₅	H	H	(CO)SCH ₂ CH ₃	1:0	rac.	200	
4.11.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	C ₆ H ₅	H	H	(CO)OCH ₃	3:1	rac.	230	
4.12.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	C ₆ H ₅	H	H	(CO)NHCH ₃	9:1	rac.	212	
4.13.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	C ₆ H ₅	H	H	(CO)N(CH ₃) ₂	5:1	rac.	171	
4.14.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	C ₆ H ₅	H	H	(CO)H	5:1	rac.	207	
4.15.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	C ₆ H ₅	H	H	(CO)CH ₃	1:0	rac.	155	
4.16.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	C ₆ H ₅	H	H	(CO)CH ₂ CH ₃	1:0	rac.	246	
4.17.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	C ₆ H ₅	H	H	(CO)CF ₃	1:0	rac.	233	
4.18.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	C ₆ H ₅	H	H	(CO)CCl ₃	1:0	rac.	239	
4.19.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	4-Tetrahydropyranyl	H	H	(CO)N(CH ₃) ₂	1:0	rac.	242	
4.20.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	4-Tetrahydropyranyl	H	H	(CO)H	1:0	rac.	231	
4.21.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	4-Tetrahydropyranyl	H	H	(CO)CH ₃	1:0	rac.	298	
4.22.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	3-F-C ₆ H ₄	H	H	(CO)N(CH ₃) ₂	3:1	rac.	168	
4.23.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	3-F-C ₆ H ₄	H	H	(CO)CH ₃	6:1	rac.	235	
4.24.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	2-CH ₃ -3-F-C ₆ H ₅	H	H	(SO ₂)CH ₃	1:0	rac.	250	
4.25.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	2-CH ₃ -3-F-C ₆ H ₅	H	H	(CO)OCH ₃	1:0	rac.	230	

Nr.	A	R ⁵	R ⁷	R ⁸	R ¹⁰	Diastereomerenverhältnis	Chiralität	Fp. [°C]	M ⁺ +H (m/z)
4.26.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	2-CH ₃ -3-F-C ₆ H ₃	H	H	(CO)NHCH ₃	1:0	rac.	252	
4.27.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	2-CH ₃ -3-F-C ₆ H ₃	H	H	(CO)N(CH ₃) ₂	9:1	rac.	210	
4.28.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	2-CH ₃ -3-F-C ₆ H ₃	H	H	(CO)H	1:0	rac.	228	
4.29.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	2-CH ₃ -3-F-C ₆ H ₃	H	H	(CO)CH ₃	9:1	rac.	227	



I mit R¹, R² und R⁴ = H, R³ = CH₃,
R⁶ = NO₂

Tabelle 5

Nr.	A	R ⁵	R ⁷	R ⁸	R ¹⁰	Diastereomerenverhältnis	Chiralität	Fp. [°C]
5.1.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	2-CH ₃ -3-F-C ₆ H ₃	H	H		9:1	rac.	244
5.2.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	2-CH ₃ -3-F-C ₆ H ₃	H	H		1:4	rac.	242
5.3.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	C ₆ H ₅	H	H		> 5:1	rac.	119
5.4.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	3-F-C ₆ H ₄	H	H		4:1	rac.	204
5.5.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	4-Tetrahydropyranyl	H	H		1:0	rac.	250

Biologische Wirksamkeit

Die heteroaroylsubstituierten Alanine der Formel I und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze eignen sich - sowohl als Isomergemische als auch in Form der reinen Isomeren - als Herbizide. Die Verbindungen der Formel I enthaltenden herbiziden Mittel bekämpfen Pflanzenwuchs auf Nichtkulturflächen sehr gut, besonders bei hohen Aufwandmengen. In Kulturen wie Weizen, Reis, Mais, Soja und Baumwolle wirken sie gegen Unkräuter und Schadgräser, ohne die Kulturpflanzen nennenswert zu schädigen. Dieser Effekt tritt vor allem bei niedrigen Aufwandmengen auf.

In Abhängigkeit von der jeweiligen Applikationsmethode können die Verbindungen der Formel I bzw. sie enthaltenden herbiziden Mittel noch in einer weiteren Zahl von Kulturpflanzen zur Beseitigung unerwünschter Pflanzen eingesetzt werden. In Betracht kommen beispielsweise folgende Kulturen:

Allium cepa, Ananas comosus, Arachis hypogaea, Asparagus officinalis, Beta vulgaris spec. altissima, Beta vulgaris spec. rapa, Brassica napus var. napus, Brassica napus var. napobrassica, Brassica rapa var. silvestris, Camellia sinensis, Carthamus tinctorius, Carya illinoensis, Citrus limon, Citrus sinensis, Coffea arabica (Coffea canephora, Coffea liberica), Cucumis sativus, Cynodon dactylon, Daucus carota, Elaeis guineensis, Fragaria vesca, Glycine max, Gossypium hirsutum, (Gossypium arboreum, Gossypium herbaceum, Gossypium vitifolium), Helianthus annuus, Hevea brasiliensis, Hordeum vulgare, Humulus lupulus, Ipomoea batatas, Juglans regia, Lens culinaris, Linum usitatissimum, Lycopersicon lycopersicum, Malus spec., Manihot esculenta, Medicago sativa, Musa spec., Nicotiana tabacum (N.rustica), Olea europaea, Oryza sativa, Phaseolus lunatus, Phaseolus vulgaris, Picea abies, Pinus spec., Pisum sativum, Prunus avium, Prunus persica, Pyrus communis, Ribes sylvestre, Ricinus communis, Saccharum officinarum, Secale cereale, Solanum tuberosum, Sorghum bicolor (s. vulgare), Theobroma cacao, Trifolium pratense, Triticum aestivum, Triticum durum, Vicia faba, Vitis vinifera und Zea mays.

Darüber hinaus können die Verbindungen der Formel I auch in Kulturen, die durch Züchtung einschließlich gentechnischer Methoden gegen die Wirkung von Herbiziden tolerant sind, verwandt werden.

Darüber hinaus können die Verbindungen der Formel I auch in Kulturen, die durch Züchtung einschließlich gentechnischer Methoden gegen Insekten- oder Pilzbefall tolerant sind, verwandt werden.

Die Verbindungen der Formel I bzw. die sie enthaltenden herbiziden Mittel können beispielsweise in Form von direkt versprühbaren wäßrigen Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch hochprozentigen wäßrigen, öligen oder sonstigen Suspensionen oder Dis-

persionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln oder Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

Die herbiziden Mittel enthalten eine herbizid wirksame Menge mindestens einer Verbindung der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I und für die Formulierung von Pflanzenschutzmitteln übliche Hilfsmittel.

Als inerte Hilfsstoffe kommen im Wesentlichen in Betracht:

Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt wie Kerosin und Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Paraffine, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline und deren Derivate, alkylierte Benzole und deren Derivate, Alkohole wie Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol und Cyclohexanol, Ketone wie Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, z.B. Amine wie N-Methylpyrrolidon und Wasser.

Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Suspensionen, Pasten, netzbaren Pulvern oder wasserdispergierbaren Granulaten durch Zusatz von Wasser bereitete werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substrate als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Als oberflächenaktive Stoffe (Adjuvantien) kommen die Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von aromatischen Sulfonsäuren, z.B. Lignin-, Phenol-, Naphthalin- und Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, sowie von Fettsäuren, Alkyl- und Alkylarylsulfonaten, Alkyl-, Laurylether- und Fettalkoholsulfaten, sowie Salze sulfatierter Hexa-, Hepta- und Octadecanolen sowie von Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und seiner Derivate mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoetylphenolether, ethoxyliertes Isooctyl-, Octyl- oder Nonylphenol, Alkylphenyl-, Tributylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylen- oder Polyoxypropylenalkylether, Laurylalkoholpolyglykoletheracetat, Sorbitester, Lignin-Sulfitablaugen oder Methylcellulose in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind Mineralerden wie Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver oder andere feste Trägerstoffe.

10

Die Konzentrationen der Verbindungen der Formel I in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in weiten Bereichen variiert werden. Im allgemeinen enthalten die Formulierungen etwa von 0,001 bis 98 Gew.-%, vorzugsweise 0,01 bis 95 Gew.-%, mindestens eines Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

15

Die folgenden Formulierungsbeispiele verdeutlichen die Herstellung solcher Zubereitungen:

20

I. 20 Gewichtsteile eines Wirkstoffs der Formel I werden in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen alkyliertem Benzol, 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 5 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 5 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Ausgießen und feines Verteilen der Lösung in 100000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs der Formel I enthält.

25

30

II. 20 Gewichtsteile eines Wirkstoffs der Formel I werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 30 Gewichtsteilen Isobutanol, 20 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs der Formel I enthält.

35

40

III. 20 Gewichtsteile eines Wirkstoffs der Formel I werden in einer Mischung gelöst, die aus 25 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 65 Gewichtsteilen einer Mineralölfraktion vom Siedepunkt 210 bis 280°C und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs der Formel I enthält.

- 5 IV. 20 Gewichtsteile eines Wirkstoffs der Formel I werden mit 3 Gewichtsteilen des Natriumsalzes der Diisobutyl-naphthalinsulfonsäure, 17 Gewichtsteilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gewichtsteilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs der Formel I enthält.
- 10 V. 3 Gewichtsteile eines Wirkstoffs der Formel I werden mit 97 Gewichtsteilen feinteiligem Kaolin vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gew.-% des Wirkstoffs der Formel I enthält.
- 15 VI. 20 Gewichtsteile eines Wirkstoffs der Formel I werden mit 2 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure, 8 Gewichtsteilen Fettalkoholpolyglykolether, 2 Gewichtsteilen Natriumsalz eines Phenol-Harnstoff-Formaldehyd-Kondensates und 68 Gewichtsteilen eines paraffinischen Mineralöls innig vermischt. Man erhält eine stabile ölige Dispersion.
- 20 VII. 1 Gewichtsteil eines Wirkstoffs der Formel I wird in einer Mischung gelöst, die aus 70 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 20 Gewichtsteilen ethoxyliertem Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen ethoxyliertem Rizinusöl besteht. Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.
- 25 VIII. 1 Gewichtsteil eines Wirkstoffs der Formel I wird in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen Cyclohexanon und 20 Gewichtsteilen Wettol[®] EM 31 (= nichtionischer Emulgator auf der Basis von ethoxyliertem Rizinusöl) besteht. Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.
- 30 Die Applikation der Verbindungen der Formel I bzw. der herbiziden Mittel kann im Vorauf- oder im Nachaufverfahren erfolgen. Sind die Wirkstoffe für gewisse Kulturpflanzen weniger verträglich, so können Ausbringungstechniken angewandt werden, bei welchen die herbiziden Mittel mit Hilfe der Spritzgeräte so gespritzt werden, daß die Blätter der empfindlichen Kulturpflanzen nach Möglichkeit nicht getroffen werden, während die Wirkstoffe auf die Blätter darunter wachsender unerwünschter Pflanzen oder
- 35 die unbedeckte Bodenfläche gelangen (post-directed, lay-by).
- Die Aufwandmengen an Verbindung der Formel I betragen je nach Bekämpfungsziel, Jahreszeit, Zielpflanzen und Wachstumsstadium 0,001 bis 3,0, vorzugsweise 0,01 bis
- 40 1,0 kg/ha aktive Substanz (a. S.).

Zur Verbreiterung des Wirkungsspektrums und zur Erzielung synergistischer Effekte können die heteroaroylsubstituierten Serin-Amide der Formel I mit zahlreichen Vertretern anderer herbizider oder wachstumsregulierender Wirkstoffgruppen gemischt und gemeinsam ausgebracht werden. Beispielsweise kommen als Mischungspartner 1,2,4-Thiadiazole, 1,3,4-Thiadiazole, Amide, Aminophosphorsäure und deren Derivate, Amino-5 triazole, Anilide, Aryloxy-/Heteroaryloxyalkansäuren und deren Derivate, Benzoesäure und deren Derivate, Benzothiadiazinone, 2-(Heteroaryl/Aroyl)-1,3-cyclohexandione, Heteroaryl-Aryl-Ketone, Benzylisoxazolidinone, meta-CF₃-Phenyl-10 derivate, Carbamate, Chinolincarbonsäure und deren Derivate, Chloracetanilide, Cyclohexenonoximetherderivate, Diazine, Dichlorpropionsäure und deren Derivate, Dihydrobenzofurane, Dihydrofuran-3-one, Dinitroaniline, Dinitrophenole, Diphenylether, Dipyridyle, Halogencarbonsäuren und deren Derivate, Harnstoffe, 3-Phenyluracile, Imidazole, Imidazolinone, N-Phenyl-3,4,5,6-tetrahydrophthalimide, Oxadiazole, Oxirane, Phenole, Aryloxy- und Heteroaryloxyphenoxypropionsäureester, Phenyllessigsäure und deren Derivate, 2-15 Phenylpropionsäure und deren Derivate, Pyrazole, Phenylpyrazole, Pyridazine, Pyridincarbonsäure und deren Derivate, Pyrimidylether, Sulfonamide, Sulfonylharnstoffe, Triazine, Triazinone, Triazolinone, Triazolcarboxamide und Uracile in Betracht.

Außerdem kann es von Nutzen sein, die Verbindungen der Formel I allein oder in 20 Kombination mit anderen Herbiziden auch noch mit weiteren Pflanzenschutzmitteln gemischt, gemeinsam auszubringen, beispielsweise mit Mitteln zur Bekämpfung von Schädlingen oder phytopathogenen Pilzen bzw. Bakterien. Von Interesse ist ferner die Mischbarkeit mit Mineralsalzlösungen, welche zur Behebung von Ernährungs- und Spurenelementmängeln eingesetzt werden. Es können auch nichtphytotoxische Öle 25 und Ölkonzentrate zugesetzt werden.

Anwendungsbeispiele

30 Die herbizide Wirkung der heteroaroylsubstituierten Alanine der Formel I ließ sich durch die folgenden Gewächshausversuche zeigen:

Als Kulturgefäße dienten Plastikblumentöpfe mit lehmigem Sand mit etwa 3,0 % Humus als Substrat. Die Samen der Testpflanzen wurden nach Arten getrennt eingesät. 35

Bei Voraufbehandlung wurden die in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffe direkt nach Einsaat mittels fein verteilter Düsen aufgebracht. Die Gefäße wurden leicht beregnet, um Keimung und Wachstum zu fördern, und anschließend mit 40 durchsichtigen Plastikhauben abgedeckt, bis die Pflanzen angewachsen waren. Diese Abdeckung bewirkt ein gleichmäßiges Keimen der Testpflanzen, sofern dies nicht durch die Wirkstoffe beeinträchtigt wurde.

Zum Zweck der Nachauflaufbehandlung wurden die Testpflanzen je nach Wuchsform erst bis zu einer Wuchshöhe von 3 bis 15 cm angezogen und erst dann mit den in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffen behandelt. Die Testpflanzen wurden dafür entweder direkt gesät und in den gleichen Gefäßen aufgezogen oder sie wurden erst als Keimpflanzen getrennt angezogen und einige Tage vor der Behandlung in die Versuchsgefäße verpflanzt. Die Aufwandmenge für die Nachauflaufbehandlung betrug 1,0 kg/ha a.S. (aktive Substanz).

- 10 Die Pflanzen wurden artenspezifisch bei Temperaturen von 10 bis 25°C bzw. 20 bis 35°C gehalten. Die Versuchsperiode erstreckte sich über 2 bis 4 Wochen. Während dieser Zeit wurden die Pflanzen gepflegt, und ihre Reaktion auf die einzelnen Behandlungen wurde ausgewertet.
- 15 Bewertet wurde nach einer Skala von 0 bis 100. Dabei bedeutet 100 kein Aufgang der Pflanzen bzw. völlige Zerstörung zumindest der oberirdischen Teile und 0 keine Schädigung oder normaler Wachstumsverlauf.

20 Die in den Gewächshausversuchen verwendeten Pflanzen setzten sich aus folgenden Arten zusammen:

Lateinischer Name	Deutscher Name
<i>Amaranthus retroflexus</i>	Krummer Fuchsschwanz
<i>Chenopodium album</i>	Weißer Gänsefuß
<i>Galium aparine</i>	Klettenlabkraut
<i>Setaria viridis</i>	Grüne Borstenhirse

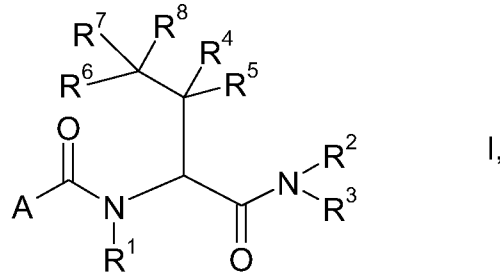
Bei Aufwandmengen von 1 kg/ha zeigten die Verbindungen 3.1, 3.2, 3.7 und 3.14 (Tabelle 3) sowie Verbindungen 4.8, 4.10, 4.11, 4.12, 4.13, 4.14, 4.15, 4.22, 4.23, 4.26, 4.27, 4.28 und 4.29 (Tabelle 4) im Nachauflauf eine sehr gute Wirkung gegen die unerwünschten Pflanzen *Amaranthus retroflexus*, *Chenopodium album* und *Setaria viridis*.

30 Weiterhin zeigten bei Aufwandmengen von 1 kg/ha zeigten die Verbindungen 5.1 und 5.4 (Tabelle 5) sowie die Verbindung 5.3 bei Aufwandmengen von 0,25 kg/ha im Nachauflauf eine sehr gute Wirkung gegen die unerwünschten Pflanzen *Amaranthus retroflexus*, *Chenopodium album* und *Galium aparine*.

35 Bei Aufwandmengen von 1 kg/ha zeigte die Verbindung 5.5 (Tabelle 5) im Nachauflauf eine sehr gute Wirkung gegen die unerwünschten Pflanzen *Amaranthus retroflexus* und *Chenopodium album*, sowie eine gute Wirkung gegen *Galium aparine*.

Patentansprüche:

1. Heteroaroyl-substituierte Alanine der Formel I



5

in der die Variablen die folgenden Bedeutungen haben:

A 5- oder 6-gliedriges Heteroaroyl mit ein bis vier Stickstoffatomen, oder mit ein bis drei Stickstoffatomen und einem Sauerstoff- oder Schwefelatom, oder mit einem Sauerstoff- oder Schwefelatom, welches partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder 1 bis 3 Reste aus der Gruppe Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy und C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl tragen kann;

15 R¹, R² Wasserstoff, Hydroxy oder C₁-C₆-Alkoxy;

R³ C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Cyanoalkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl;

R⁴ Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl;

20

R⁵ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₂-C₆-Halogenalkinyl, C₁-C₆-Cyanoalkyl, C₂-C₆-Cyanoalkenyl, C₂-C₆-Cyanoalkinyl, C₁-C₆-Hydroxyalkyl, C₂-C₆-Hydroxyalkenyl, C₂-C₆-Hydroxyalkinyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkenyl, 3- bis 6-gliedriges Heterocyclyl,

25

wobei die voranstehen genannten Cycloalkyl, Cycloalkenyl oder 3- bis 6-gliedrigen Heterocyclylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder ein bis drei Reste aus der Gruppe Oxo, Cyano, Nitro, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, Hydroxy, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Hydroxycarbonyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, Hydroxycarbonyl-C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl-C₁-C₆-alkoxy, Amino, C₁-C₆-Alkylamino, Di(C₁-C₆-alkyl)amino, C₁-C₆-Alkylsulfonylamino, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonylamino, Aminocarbonylamino, (C₁-C₆-Alkylamino)-carbonylamino, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonylamino, Aryl und Aryl(C₁-C₆-alkyl) tragen können;

35

C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkenyloxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkinyloxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Halogenalkenyloxy-C₁-

- C₄-alkyl, C₂-C₆-Halogenalkinyloxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy-
 C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkenylthio-C₁-C₄-alkyl, C₂-
 C₆-Alkinylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl-C₁-C₄-thioalkyl, C₂-C₆-
 Halogenalkenyl-C₁-C₄-thioalkyl, C₂-C₆-Halogenalkinyl-C₁-C₄-thioalkyl, C₁-C₆-
 5 Alkylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-
 Alkylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl, Amino-C₁-
 C₄-alkyl, (C₁-C₆-Alkyl)amino-C₁-C₄-alkyl, Di(C₁-C₆-alkyl)amino-C₁-C₄-alkyl,
 (C₁-C₆-Alkylsulfonyl)amino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl(C₁-C₆-alkyl)-
 amino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, Hydroxycarbonyl, C₁-C₆-
 10 Alkoxy carbonyl, Aminocarbonyl, (C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl, Di(C₁-C₆-
 alkyl)aminocarbonyl, Formylamino-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₆-Alkoxy carbonyl)-
 amino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, Hydroxycarbonyl-C₁-C₄-
 alkyl, C₁-C₆-Alkoxy carbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy carbonyl-C₁-
 C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyloxy-C₁-C₄-alkyl, Aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl,
 15 (C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl-C₁-
 C₄-alkyl, (C₁-C₆-Alkylcarbonyl)amino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl(C₁-C₆-
 alkylamino)C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyloxy-C₁-C₄-alkyl, Di(C₁-
 C₆-alkyl)aminocarbonyloxyC₁-C₄-alkyl, (C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonylamino--
 C₁-C₄-alkyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonylamino-C₁-C₄-alkyl;
 20 Phenyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl, Phenyl-C₂-C₄-alkenyl, Phenyl-C₂-C₄-alkinyl,
 Phenyl-C₁-C₄-halogenalkyl, Phenyl-C₂-C₄-halogenalkenyl, Phenyl-C₂-C₄-
 halogenalkinyl, Phenyl-C₁-C₄-hydroxyalkyl, Phenyl-C₂-C₄-hydroxyalkenyl,
 Phenyl-C₂-C₄-hydroxyalkinyl, Phenylcarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Phenylcarbonylo-
 xy-C₁-C₄-alkyl, Phenylloxy carbonyl-C₁-C₄-alkyl, Phenylloxy-C₁-C₄-alkyl, Phe-
 25 nylthio-C₁-C₄-alkyl, Phenylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl, Phenylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl,
 Heteroaryl, Heteroaryl-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryl-C₂-C₄-alkenyl, Heteroaryl-C₂-
 C₄-alkinyl, Heteroaryl-C₁-C₄-halogenalkyl, Heteroaryl-C₂-C₄-halogenalkenyl,
 Heteroaryl-C₂-C₄-halogenalkinyl, Heteroaryl-C₁-C₄-hydroxyalkyl, Heteroaryl-
 C₂-C₄-hydroxyalkenyl, Heteroaryl-C₂-C₄-hydroxyalkinyl, Heteroarylcarbonyl-
 30 C₁-C₄-alkyl, Heteroarylcarbonyloxy-C₁-C₄-alkyl, Heteroarylloxy carbonyl-C₁-
 C₄-alkyl, Heteroarylloxy-C₁-C₄-alkyl, Heteroarylthio-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryl-
 sulfinyl-C₁-C₄-alkyl, Heteroarylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl,
 wobei die vorstehend genannten Phenyl- und Heteroarylreste partiell
 oder vollständig halogeniert sein können und/oder ein bis drei Reste
 35 aus der Gruppe Cyano, Nitro, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, Hy-
 droxy, C₁-C₆-Hydroxyalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Hy-
 droxycarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy carbonyl, Hydroxycarbonyl-C₁-C₆-alkoxy,
 C₁-C₆-Alkoxy carbonyl-C₁-C₆-alkoxy, Amino, C₁-C₆-Alkylamino, Di(C₁-
 C₆-alkyl)amino, C₁-C₆-Alkylsulfonylamino, C₁-C₆-Halogenalkyl-
 40 sulfonylamino, (C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonylamino, Di(C₁-C₆-alkyl)-
 aminocarbonylamino, Aryl und Aryl(C₁-C₆-alkyl) tragen können;

- R⁶ OR⁹, NR¹⁰R¹¹ oder NO₂;
- R⁷ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl;
- 5 R⁸ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl;
- R⁹ und R¹⁰ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Halogenalkenyl, C₃-C₆-Halogenalkynyl, Formyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkylthiocarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkylcarbonyl, C₂-C₆-Alkenylcarbonyl, C₂-C₆-Alkynylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₃-C₆-Alkenyloxy- carbonyl, C₃-C₆-Alkinyloxy- carbonyl, Aminocarbonyl, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl, C₃-C₆-Alkenylaminocarbonyl, C₃-C₆-Alkynylaminocarbonyl, C₁-C₆-Alkylsulfonylaminocarbonyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkenyl)-N-(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkynyl)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, N-(C₁-C₆-Alkoxy)-N-(C₁-C₆-alkyl)-amino- carbonyl, N-(C₃-C₆-Alkenyl)-N-(C₁-C₆-alkoxy)aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkynyl)-N-(C₁-C₆-alkoxy)-aminocarbonyl, [(C₁-C₆-Alkyl)amino- carbonyl(C₁-C₆-alkyl)amino]carbonyl, (C₁-C₆-alkyl)amino- thiocarbonyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminothiocarbonyl, (C₁-C₆-Alkyl)cyano- imino, (Amino)cyanoimino, (C₁-C₆-Alkyl)aminocyanoimino, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocyanoimino, C₁-C₆-Alkylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkoxyimino-C₁-C₆-alkyl, N-(C₁-C₆-Alkylamino)-imino-C₁-C₆-alkyl, N-(Di-C₁-C₆-alkylamino)imino-C₁-C₆-alkyl oder Tri-C₁-C₄-alkylsilyl, wobei die genannten Alkyl-, Cycloalkyl- und Alkoxyreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Cyano, Hydroxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, Di(C₁-C₄-alkyl)amino, C₁-C₄-Alkyl-C₁-C₆-alkoxy-carbonylamino, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, Hydroxycarbonyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, Aminocarbonyl, C₁-C₄-Alkylaminocarbonyl, Di(C₁-C₄-alkyl)amino- carbonyl oder C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy;
- 10
- 15
- 20
- 25
- 30
- 35 Phenyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl, Phenylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, Phenoxy- carbonyl, Phenylaminocarbonyl, Phenylsulfonylaminocarbonyl, N-(C₁-C₆-Alkyl)-N-(phenyl)aminocarbonyl, Phenyl-C₁-C₆-alkylcarbonyl, wobei der Phenylrest partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy; oder
- 40 SO₂R¹²;

- R¹¹ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Halogenalkenyl, C₃-C₆-Halogenalkynyl, Hydroxy oder C₁-C₆-Alkoxy;
- 5 R¹² C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, Di(C₁-C₆-alkyl)amino oder Phenyl, wobei der Phenylrest partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl oder C₁-C₆-Alkoxy;
- 10 sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze.
2. Heteroaroyl-substituierte Alanine der Formel I gemäß Anspruch 1 wobei A für 5- oder 6-gliedriges Heteroaroyl ausgewählt aus der Gruppe Pyrrolyl, Thienyl, Furyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Thiazolyl, Oxazolyl, Tetrazolyl, Pyridyl und Pyrimidinyl; wo-
 15 bei die genannten Heteroaroylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder 1 bis 3 Reste aus der Gruppe Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy und C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl tragen können, steht.
- 20 3. Heteroaroyl-substituierte Alanine der Formel I gemäß Ansprüchen 1 oder 2, wobei R¹, R², R⁴, R⁷ und R⁸ für Wasserstoff stehen.
4. Heteroaroyl-substituierte Alanine der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis
 25 3, wobei R⁵ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₂-C₆-Halogenalkynyl, C₁-C₆-Cyanoalkyl, C₁-C₆-Hydroxyalkyl, C₂-C₆-Hydroxyalkenyl, C₂-C₆-Hydroxyalkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkenyl oder 3- bis 6-gliedriges Heterocyclyl,
 wobei die voranstehend genannten Cycloalkyl-, Cycloalkenyl- oder 3- bis 6-
 30 gliedrigen Heterocyclyl-Reste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder einen bis drei Reste aus der Gruppe Oxo, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, Hydroxycarbonyl und C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl tragen können; C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfonylamino-C₁-C₄-alkyl, Hydroxycarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, Hydroxycarbonyl-
 35 C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkyl-carbonyloxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkyl-carbonylamino-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonylamino-C₁-C₄-alkyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonylamino-C₁-C₄-alkyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyloxy-C₁-C₄-alkyl, Formylamino-C₁-C₄-alkyl;
 40 Phenyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl, Phenyl-C₂-C₄-alkenyl, Phenyl-C₂-C₄-alkynyl, Phenyl-C₁-C₄-halogenalkyl, Phenyl-C₂-C₄-halogenalkenyl, Phenyl-C₁-C₄-hydroxyalkyl,

Phenylloxy-C₁-C₄-alkyl, Phenylthio-C₁-C₄-alkyl, Phenylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl, Phenylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl;

Heteroaryl, Heteroaryl-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryl-C₁-C₄-hydroxyalkyl, Heteroaryloxy-C₁-C₄-alkyl, Heteroarylthio-C₁-C₄-alkyl, Heteroarylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl oder Heteroarylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl,

5

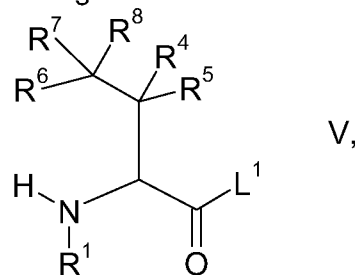
wobei die vorstehend genannten Phenyl- und Heteroarylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder ein bis drei Reste aus der Gruppe Cyano, Nitro, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, Hydroxy, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Hydroxycarbonyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, Hydroxycarbonyl-C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-Alkylsulfonylamino und C₁-C₆-Halogenalkylsulfonylamino tragen können;

10

steht.

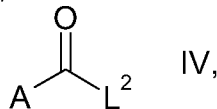
5. Verfahren zur Herstellung von heteroaryl-substituierten Alaninen der Formel I gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet dass Alaninderivate der Formel V

15



wobei R¹, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ und R⁸ die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben und L¹ für Hydroxy oder C₁-C₆-Alkoxy steht,

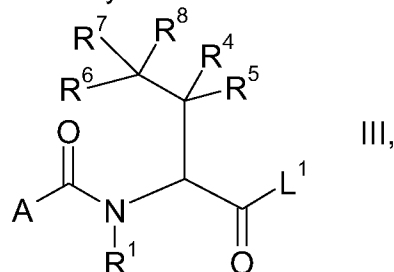
- 20 mit Heteroarylsäure(derivate)n der Formel IV



wobei A die unter Anspruch 1 genannte Bedeutung hat und L² für Hydroxy, Halogen, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Phosphoryl oder Isoureyl steht,

25

zu entsprechenden Heteroarylderivaten der Formel III



wobei A, R¹, R⁴, R⁵, R⁶ und R⁷ die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben und L¹ für Hydroxy oder C₁-C₆-Alkoxy steht,

- 30 und anschließend die erhaltenen Heteroarylderivate der Formel III mit einem

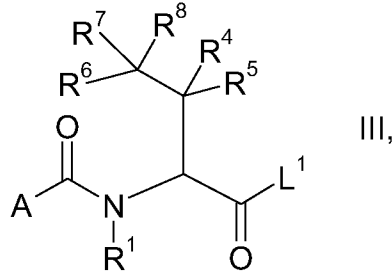
Amin der Formel II



wobei R^2 und R^3 die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben, umgesetzt werden.

5

6. Heteroaroylderivate der Formel III



wobei A, R^1 , R^4 , R^5 , R^6 und R^7 die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben und L^1 für Hydroxy oder C_1 - C_6 -Alkoxy steht.

10

7. Mittel, enthaltend eine herbizid wirksame Menge mindestens eines heteroaroyl-substituierten Alanins der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4 und für die Formulierung von Pflanzenschutzmitteln übliche Hilfsmittel.

15

8. Verfahren zur Herstellung von Mitteln gemäß Anspruch 8, dadurch gekennzeichnet, daß man eine herbizid wirksame Menge mindestens eines heteroaroyl-substituierten Alanins der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4 und für die Formulierung von Pflanzenschutzmitteln übliche Hilfsmittel mischt.

20

9. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs, dadurch gekennzeichnet, daß man eine herbizid wirksame Menge mindestens eines heteroaroyl-substituierten Alanins der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4 auf Pflanzen, deren Lebensraum und/oder auf Samen einwirken läßt.

25

10. Verwendung der heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4 als Herbizide.

30

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2007/054562A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
INV. C07D231/14 A01N43/56

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO 2006/029829 A (BASF AG [DE]; WITSCHEL MATTHIAS [DE]; STELZER FRANK [DE]; KUEHN TORALF) 23 March 2006 (2006-03-23) siehe Anspruch 1, herbizide Wirkung und e.g. Verbindung 4.11 in Tabelle 4 -----	1-10
Y	WO 2005/061464 A (BASF AG [DE]; WITSCHEL MATTHIAS [DE]; PUHL MICHAEL [DE]; RACK MICHAEL) 7 July 2005 (2005-07-07) cited in the application siehe Verbindungen gemäss Anspruch 1 und ihre herbizide Wirkung -----	1-10
P,X	WO 2006/125687 A (BASF AG [DE]; WITSCHEL MATTHIAS [DE]; ZAGAR CYRILL [DE]; HUPE EIKE [DE]) 30 November 2006 (2006-11-30) siehe Definition des Restes R6 in Anspruch 1 und herbizide Wirkung -----	1-10

 Further documents are listed in the continuation of Box C. See patent family annex.

* Special categories of cited documents :

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the international filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- *&* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

10 August 2007

Date of mailing of the international search report

27/08/2007

Name and mailing address of the ISA/

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

TRAEGLER-GOELDEL, M

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No PCT/EP2007/054562

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2006029829 A	23-03-2006	AR 050940 A1	06-12-2006
		AU 2005284348 A1	23-03-2006
		CA 2577181 A1	23-03-2006
		EP 1791829 A1	06-06-2007
WO 2005061464 A	07-07-2005	AR 046792 A1	21-12-2005
		AU 2004303491 A1	07-07-2005
		BR PI0417813 A	27-03-2007
		CA 2548354 A1	07-07-2005
		CN 1898213 A	17-01-2007
		EP 1716120 A1	02-11-2006
		JP 2007514692 T	07-06-2007
		KR 20060111582 A	27-10-2006
		MX PA06005991 A	23-08-2006
		US 2007060480 A1	15-03-2007
WO 2006125687 A	30-11-2006	NONE	

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2007/054562

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
 INV. C07D231/14 A01N43/56

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
 C07D

Recherchierte, aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	WO 2006/029829 A (BASF AG [DE]; WITSCHEL MATTHIAS [DE]; STELZER FRANK [DE]; KUEHN TORALF) 23. März 2006 (2006-03-23) siehe Anspruch 1, herbizide Wirkung und e.g. Verbindung 4.11 in Tabelle 4 -----	1-10
Y	WO 2005/061464 A (BASF AG [DE]; WITSCHEL MATTHIAS [DE]; PUHL MICHAEL [DE]; RACK MICHAEL) 7. Juli 2005 (2005-07-07) in der Anmeldung erwähnt siehe Verbindungen gemäss Anspruch 1 und ihre herbizide Wirkung -----	1-10
P, X	WO 2006/125687 A (BASF AG [DE]; WITSCHEL MATTHIAS [DE]; ZAGAR CYRILL [DE]; HUPE EIKE [DE]) 30. November 2006 (2006-11-30) siehe Definition des Restes R6 in Anspruch 1 und herbizide Wirkung -----	1-10

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen Siehe Anhang Patentfamilie

- * Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :
- *A* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
 - *E* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
 - *L* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
 - *O* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
 - *P* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist
 - *T* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist
 - *X* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden
 - *Y* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist
 - *Z* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

10. August 2007

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

27/08/2007

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde
 Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
 NL - 2280 HV Rijswijk
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
 Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

TRAEGLER-GOELDEL, M

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2007/054562

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 2006029829 A	23-03-2006	AR 050940 A1	06-12-2006
		AU 2005284348 A1	23-03-2006
		CA 2577181 A1	23-03-2006
		EP 1791829 A1	06-06-2007
WO 2005061464 A	07-07-2005	AR 046792 A1	21-12-2005
		AU 2004303491 A1	07-07-2005
		BR PI0417813 A	27-03-2007
		CA 2548354 A1	07-07-2005
		CN 1898213 A	17-01-2007
		EP 1716120 A1	02-11-2006
		JP 2007514692 T	07-06-2007
		KR 20060111582 A	27-10-2006
		MX PA06005991 A	23-08-2006
		US 2007060480 A1	15-03-2007
WO 2006125687 A	30-11-2006	KEINE	