

(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
23. August 2007 (23.08.2007)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2007/093539 A2

(51) Internationale Patentklassifikation:

C07D 307/14 (2006.01) C07D 309/20 (2006.01)
C07D 309/04 (2006.01) C07C 237/36 (2006.01)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2007/051158

(22) Internationales Anmeldedatum:
7. Februar 2007 (07.02.2007)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
06110013.7 16. Februar 2006 (16.02.2006) 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): **WITSCHHEL, 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. 13 e, 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). **REINHARD, Robert** [DE/DE]; Berwartsteinstr. 6, 67117

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

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

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, 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, LV, 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.

(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, 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).

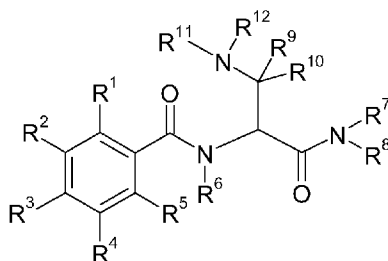
Veröffentlicht:

— ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu veröffentlichen nach Erhalt des Berichts

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: BENZOYL-SUBSTITUTED ALANINES

(54) Bezeichnung: BENZOYLSUBSTITUIERTE ALANINE



(1)

(57) Abstract: The present invention relates to benzoyl-substituted alanines of the formula I in which the variables A and R¹ to R¹² have the meanings stated in the description, and to their agriculturally usable salts, methods and intermediates for their preparation, and the use of these compounds or compositions comprising these compounds for controlling unwanted plants.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft benzoylsubstituierte Alanine der Formel (I) in der die Variablen R¹ bis R¹² 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 2007/093539 A2

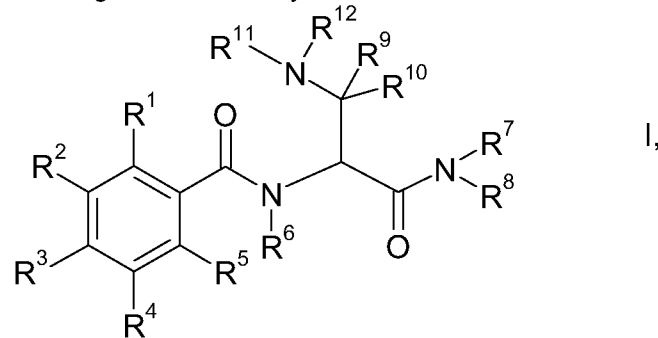


Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

Benzoylsubstituierte Alanine

Beschreibung

- 5 Die vorliegende Erfindung betrifft benzoylsubstituierte Alanine der Formel I



in der die Variablen die folgenden Bedeutungen haben:

- 10 R¹ Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl oder C₁-C₆-Halogenalkoxy;
- R², R³, R⁴, R⁵ Wasserstoff, Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy oder C₁-C₆-Halogenalkoxy;
- 15 R⁶, R⁷ Wasserstoff, Hydroxy oder C₁-C₆-Alkoxy;
- R⁸ C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Cyanoalkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl;
- R⁹ Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl;
- 20 R¹⁰ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₂-C₆-Halogenalkynyl, C₁-C₆-Cyanoalkyl, C₂-C₆-Cyanoalkenyl, C₂-C₆-Cyanoalkynyl, C₁-C₆-Hydroxyalkyl, C₂-C₆-Hydroxyalkenyl, C₂-C₆-Hydroxyalkynyl, 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;
- 30 C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkenyloxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkynyloxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Halogenalkenyloxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Halogenalkynyloxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-
- 35

- 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-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, C₁-C₆-Alkylsulfonylamino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl(C₁-C₆-alkyl)amino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, Hydroxycarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl, Formylamino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonylamino-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, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonylamino-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)amino-carbonylamino]C₁-C₄-alkyl, [Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonylamino]C₁-C₄-alkyl;
- 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-Alkylamino)-carbonylamino, Di-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonylamino, Aryl und Aryl(C₁-C₆-alkyl) tragen können;
- R¹¹ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkinyl, C₃-C₆-Halogenalkenyl, C₃-C₆-Halogenalkinyl, Formyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₃-C₆-

5 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-Alkylaminocarbonyl, 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)-aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkenyl)-N-(C₁-C₆-alkoxy)-aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkinyl)-N-(C₁-C₆-alkoxy)-aminocarbonyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminothiocarbonyl, (C₁-C₆-Alkyl)cyanoimino, (Amino)cyanoimino, [(C₁-C₆-Alkyl)amino]cyanoimino, 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-alkyl)amino]imino-C₁-C₆-alkyl oder Tri-C₁-C₄-alkylsilyl,

15 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;

20 Phenyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl, Phenylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, Phenoxy-carbonyl, Phenylaminocarbonyl, Phenylsulfonylaminocarbonyl, N-(C₁-C₆-Alkyl)-N-(phenyl)-aminocarbonyl, Phenyl-C₁-C₆-alkylcarbonyl,

25 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

SO₂R¹³;

30 R¹² 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 R¹³ C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl 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-Halogen-alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy;

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 Derivate oder diese enthaltende Mittel zur Schädnpflanzenbekämpfung.

- 5 2, ω -Diaminocarbonylverbindungen mit herbizider Wirksamkeit werden u.a. in WO 03/045878 beschrieben.

Weiterhin sind aus der Literatur (z.B. WO 05/061464 und WO 05/061443) heteroaroyl- sowie benzoyl-substituierte Phenylalanine bekannt, welche in β -Position eine gegebenenfalls substituierte Aminogruppe tragen können.

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

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

Demgemäß wurden die benzoylsubstituierten Alanine der Formel I sowie deren herbizide Wirkung gefunden.

20

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.

25

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

30

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.

35

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,

40

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-C₄-alkyl)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-R¹³ oder als Reste an Phenyl-, Heterocyclyl, Aryl- Heteroaryl- oder Heterocyclylringen genannten organischen Molekülteile stellen Sammelbegriffe für individuelle Aufzählungen der einzelnen Gruppenmitglieder dar. Sämtliche Kohlenwasserstoffketten, also alle Alkyl-, Alkylsilyl-, Alkenyl-, Alkinyl-, Cyanoalkyl-, Halogenalkyl-, Halogenalkenyl-, Halogenalkinyl-, Alkoxy-, Halogenalkoxy-, Alkoxyalkyl-, Alkoxyalkoxyalkyl, Alkylcarbonyl-, Alkenylcarbonyl-, Alkinylcarbonyl-, Alkoxycarbonyl-, Alkenyloxycarbonyl-, Alkinyloxycarbonyl-, Alkylamino-, Alkylsulfonylamino-, Halogenalkylsulfonylamino-, Alkylalkoxy-carbonylamino-, Alkylaminocarbonyl-, Alkenylaminocarbonyl-, Alkinylaminocarbonyl-, Alkylsulfonylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl-, N-Alkenyl-N-alkylaminocarbonyl-, N-Alkinyl-N-alkylamino-carbonyl-, N-Alkoxy-N-alkylaminocarbonyl-, N-Alkenyl-N-alkoxyaminocarbonyl-, N-Alkinyl-N-alkoxyaminocarbonyl-, Dialkylaminothiocarbonyl-, Alkylcarbonylalkyl-, Alkoximinoalkyl-, N-(Alkylamino)-iminoalkyl, N-(Dialkylamino)-iminoalkyl, Formylamino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonylamino-C₁-C₄-alkyl, [(C₁-C₆-Alkyl)amino-carbonylamino]C₁-C₄-alkyl, [Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonylamino]-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₆-Alkyl)cianoimino, [(C₁-C₆-Alkyl)amino]cianoimino, [Di(C₁-C₆-alkyl)amino]cianoimino, Phenylalkyl-, Phenylcarbonylalkyl-, N-Alkyl-N-phenylaminocarbonyl-, Phenylalkylcarbonyl-, Arylalkyl-, Heterocyclylcarbonylalkyl-, N-Alkyl-N-heterocyclylaminocarbonyl-, Heterocyclylalkylcarbonyl-, Alkylthio- und Alkylcarbonyloxy-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-C₄-Alkylcarbonyloxy, C₁-C₄-alkyl-C₁-C₄-alkoxy-carbonylamino, C₁-C₆-Alkyliminooxy-C₁-C₄-alkyl, 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-Alkinylthio-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-alkylamino)-C₁-C₄-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-Alkylaminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Di(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl, [(C₁-C₆-Alkyl)amino-carbonylamino]C₁-C₄-alkyl, [Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonylamino]C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkyl-carbonylamino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkyl-carbonyl-(C₁-C₆-alkylamino)-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyloxy-C₁-C₄-alkyl, [Di(C₁-C₆-alkylamino)carbonyloxy]C₁-C₄-alkyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryl-carbonyl-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryl-carbonyloxy-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryloxy-carbonyl-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;
- 20
- C₁-C₆-Alkyl sowie die Alkylteile von C₁-C₆-Cyanoalkyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfonylamino, C₁-C₆-Alkylsulfonylaminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkenyl)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, (C₃-C₆-Alkinyl)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, N-(C₁-C₆-Alkoxy)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, C₁-C₆-Alkyl-carbonyl-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkoxyimino-C₁-C₆-alkyl, N-(C₁-C₆-Alkylamino)-imino-C₁-C₆-alkyl, N-(Di-C₁-C₆-alkyl-amino)-imino-C₁-C₆-alkyl, (C₁-C₆-Alkyl)-cyanoimino, Phenyl-C₁-C₆-alkyl, Phenyl-carbonyl-C₁-C₆-alkyl, N-(C₁-C₆-Alkyl)-N-phenylaminocarbonyl, Heterocyclyl-C₁-C₆-alkyl, Heterocyclyl-carbonyl-C₁-C₆-alkyl und N-(C₁-C₆-Alkyl)-N-heterocyclylaminocarbonyl:
- 30
- 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-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethyl-butyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-3-methylpropyl;
- 35
- C₁-C₄-Alkyl-carbonyl: z.B. Methyl-carbonyl, Ethyl-carbonyl, Propyl-carbonyl, 1-Methyl-ethyl-carbonyl, Butyl-carbonyl, 1-Methylpropyl-carbonyl, 2-Methylpropyl-carbonyl oder 1,1-Dimethylethyl-carbonyl;
- 40

- 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 und Heterocycl-C₁-C₆-alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl-(C₁-C₆-alkylamino)-C₁-C₄-alkyl:
- 5 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-Dimethylbutylcarbonyl, 2,3-Dimethylbutylcarbonyl, 3,3-Dimethylbutylcarbonyl, 1-Ethylbutylcarbonyl, 2-Ethylbutylcarbonyl, 1,1,2-Trimethylpropylcarbonyl, 1,2,2-Trimethylpropylcarbonyl, 1-Ethyl-1-methylpropylcarbonyl oder 1-Ethyl-2-methylpropylcarbonyl;
- 10
- 15
- C₃-C₆-Cycloalkyl sowie die Cycloalkylteile von C₃-C₆-Cycloalkylcarbonyl: monocyclischer, gesättigter Kohlenwasserstoff mit 3 bis 6 Ringgliedern, wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl;
- 20
- 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;
- 25
- 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,
- 30
- 35
- 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,
- 40
- 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;

- 5 - 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, Heteroary-C₂-C₄-alkenyl: C₃-C₆-Alkenyl wie voranstehend genannt sowie Ethenyl;
- 10 - 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-alkoxyaminocarbonyl: z.B. 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 15 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;
- 20 - 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-alkinyl, Heteroaryl-C₂-C₄-alkinyl: C₃-C₆-Alkynyl wie voranstehend genannt sowie Ethinyl;
- 25 - 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-methyl-prop-3-yl, 3-Cyano-2-methyl-prop-3-yl und 2-Cyano-methyl-prop-2-yl;
- 30 - 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, 35 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-
- 40

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;

- C₁-C₆-Hydroxyalkyl: C₁-C₄-Hydroxyalkyl wie voranstehend genannt, sowie z.B. 1-
 5 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-Hydroxypen-4-tyl, 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-
 10 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-
 15 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-
 20 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-
 25 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-
 hdroxymethyl-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-
 30 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-hdroxymethyl-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-
 35 5-yl, 4,5-Dihydroxy-3-methyl-pent-5-yl, 3-Hydroxy-3-hdroxymethyl-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-hdroxymethyl-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-
 40 hdroxymethyl-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;

- 5
- 10
- 15
- 20
- 25
- 30
- 35
- 40
- 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, Nonfluorbutyl, 1,1,2,2-Tetrafluorethyl und 1-Trifluormethyl-1,2,2,2-tetrafluorethyl;
 - C₁-C₆-Halogenalkyl sowie die Halogenalkylteile von C₁-C₆-Halogenalkylsulfonylamino, 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;
 - 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;
 - 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;
 - 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;
 - 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;

- 5 - 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;
- 10 - 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;
- 15 - 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;
- 20 - C₂-C₆-Hydroxyalkinyl sowie die Hydroxy-Teile von Phenyl-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;
- 25 - 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;
- 30 - 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,
- 35
- 40

- 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 Tridecafluorhexylsulfinyl;
- 5
- 10
- 15
- 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-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl-(C₁-C₆-alkylamino)-C₁-C₄-alkyl: z.B. Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Propylsulfonyl, 1-Methylethylsulfonyl, Butylsulfonyl, 1-Methylpropylsulfonyl, 2-Methylpropylsulfonyl, 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;
- 20
- 25
- 30
- 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-Difluorethylsulfonyl, 2,2,2-Trifluorethylsulfonyl, 2-Chlor-2-fluorethylsulfonyl, 2-Chlor-2,2-difluorethylsulfonyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethylsulfonyl, 2,2,2-Trichlorethylsulfonyl, Pentafluorethylsulfonyl, 2-Fluorpropylsulfonyl, 3-Fluorpropylsulfonyl, 2-Chlorpropylsulfonyl, 3-Chlorpropylsulfonyl, 2-Brompropylsulfonyl, 3-Brompropylsulfonyl, 2,2-Difluorpropylsulfonyl, 2,3-
- 35
- 40

- 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 Tridecafluorhexylsulfonyl;
- 10 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-Methyl-ethoxy, Butoxy, 1-Methylpropoxy, 2-Methylpropoxy und 1,1-Dimethylethoxy;
- 15 - C₁-C₆-Alkoxy sowie die Alkoxyteile von Hydroxycarbonyl-C₁-C₆-alkoxy, 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 und C₁-C₆-Alkoxyimino-C₁-C₆-alkyl:
C₁-C₄-Alkoxy wie voranstehend genannt, sowie z.B. Pentoxy, 1-Methyl-butoxy,
- 20 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,
- 25 1-Ethyl-1-methylpropoxy und 1-Ethyl-2-methylpropoxy;
- 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,
- 30 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,
- 35 Heptafluorpropoxy, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethoxy, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethoxy, 1-(Brommethyl)-2-bromethoxy, 4-Fluorbutoxy, 4-Chlorbutoxy, 4-Brombutoxy und Nonafluorbutoxy;
- 40 - 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 Tridecafluorhexoxy;

- 5 - 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 I: 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-Methyl-propoxy)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-Methyl-propoxy)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;
- 25 - 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. Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Propoxycarbonyl, 1-Methylethoxycarbonyl, Butoxycarbonyl, 1-Methylpropoxycarbonyl, 2-Methylpropoxycarbonyl oder 1,1-Dimethylethoxycarbonyl;
- 30 - C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl sowie die Alkoxy-carbonyl-Teile von C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₆-alkoxy und C₁-C₆-Alkoxy-carbonylamino-C₁-C₄-alkyl: C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, wie voranstehend genannt, sowie z.B. Pentoxycarbonyl, 1-Methylbutoxycarbonyl, 2-Methylbutoxycarbonyl, 3-Methyl-butoxycarbonyl, 2,2-Dimethylpropoxycarbonyl, 1-Ethylpropoxycarbonyl, Hexoxy-carbonyl, 1,1-Dimethylpropoxycarbonyl, 1,2-Dimethylpropoxycarbonyl, 1-Methyl-pentoxycarbonyl, 2-Methylpentoxycarbonyl, 3-Methylpentoxycarbonyl, 4-Methyl-pentoxycarbonyl, 1,1-Dimethylbutoxycarbonyl, 1,2-Dimethylbutoxycarbonyl, 1,3-Dimethylbutoxycarbonyl, 2,2-Dimethylbutoxycarbonyl, 2,3-Dimethylbutoxycarbonyl, 3,3-Dimethylbutoxycarbonyl, 1-Ethylbutoxycarbonyl, 2-Ethylbutoxycarbonyl, 1,1,2-Trimethylpropoxycarbonyl, 1,2,2-Trimethylpropoxycarbonyl, 1-Ethyl-1-methyl-propoxycarbonyl oder 1-Ethyl-2-methyl-propoxycarbonyl;
- 40

- 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;
- 5
- 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;
- 10
- 15
- C₁-C₆-Alkylamino sowie die C₁-C₆-Alkylaminoester von N(C₁-C₆-Alkylamino)imino-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkylamino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl-(C₁-C₆-alkylamino)-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl-(C₁-C₆-alkylamino)-C₁-C₄-alkyl, [(C₁-C₆-Alkyl)amino]cyanoimino und C₁-C₆-Alkylaminocarbonyloxy-C₁-C₄-alkyl: 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-Ethylpropylamino, Hexylamino, 1,1-Dimethylpropylamino, 1,2-Dimethylpropylamino, 1-Methylpentylamino, 2-Methylpentylamino, 3-Methylpentylamino, 4-Methylpentylamino, 1,1-Dimethylbutylamino, 1,2-Dimethylbutylamino, 1,3-Dimethylbutylamino, 2,2-Dimethylbutylamino, 2,3-Dimethylbutylamino, 3,3-Dimethylbutylamino, 1-Ethylbutylamino, 2-Ethylbutylamino, 1,1,2-Trimethylpropylamino, 1,2,2-Trimethylpropylamino, 1-Ethyl-1-methylpropylamino oder 1-Ethyl-2-methylpropylamino;
- 20
- 25
- 30
- 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-Ethyl-N-(2-methylpropyl)amino, N-Ethyl-N-(1,1-dimethylethyl)amino, N-(1-Methylethyl)-N-propylamino, N-Butyl-N-propylamino, N-(1-Methylpropyl)-N-propylamino, N-(2-Methylpropyl)-N-propylamino, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-propylamino, N-Butyl-N-(1-methylethyl)amino, N-(1-Methylethyl)-N-(1-methylpropyl)amino, N-(1-Methylethyl)-N-(2-methylpropyl)amino, N-(1,1-Dimethyl-
- 35
- 40

ethyl)-N-(1-methylethyl)amino, 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-Dimethylethyl)-N-(1-methylpropyl)amino und N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(2-methylpropyl)amino;

5

- 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, [Di(C₁-C₆-alkylamino)carbonyloxy]-C₁-C₄-alkyl und [Di(C₁-C₆-alkyl)amino]cyanoimino: 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;

10

- (C₁-C₄-Alkylamino)carbonyl sowie die (C₁-C₄-Alkylamino)carbonyl-Teile von (C₁-C₄-Alkylamino)carbonylamino: z.B. Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, Propylaminocarbonyl, 1-Methylethylaminocarbonyl, Butylaminocarbonyl, 1-Methylpropylaminocarbonyl, 2-Methylpropylaminocarbonyl oder 1,1-Dimethylethylaminocarbonyl;

15

- 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-methylaminocarbonyl, N-Methyl-N-propylaminocarbonyl, N-Methyl-N-(1-methylethyl)aminocarbonyl, N-Butyl-N-methylaminocarbonyl, N-Methyl-N-(1-methylpropyl)aminocarbonyl, N-Methyl-N-(2-methylpropyl)aminocarbonyl, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-methylaminocarbonyl, N-Ethyl-N-propylaminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1-methylethyl)aminocarbonyl, N-Butyl-N-ethylaminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1-methylpropyl)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-Methylpropyl)-N-propylaminocarbonyl, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-propylaminocarbonyl, N-Butyl-N-(1-methylethyl)aminocarbonyl, N-(1-Methylethyl)-N-(1-methylpropyl)aminocarbonyl, N-(1-Methylethyl)-N-(2-methylpropyl)aminocarbonyl, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylethyl)aminocarbonyl, N-Butyl-N-(1-methylpropyl)aminocarbonyl, N-Butyl-N-(2-methylpropyl)aminocarbonyl, N-Butyl-N-(1,1-dimethylethyl)aminocarbonyl, N-(1-Methylpropyl)-N-(2-methylpropyl)aminocarbonyl, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylpropyl)aminocarbonyl oder N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(2-methylpropyl)aminocarbonyl;

20

25

30

35

40

- (C₁-C₆-Alkylamino)carbonyl sowie die (C₁-C₆-Alkylamino)carbonyl-Teile von (C₁-C₆-Alkylamino)carbonylamino, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl und [(C₁-C₆-

- Alkyl)aminocarbonylamino]C₁-C₄-alkyl: (C₁-C₄-Alkylamino)carbonyl, wie voranstehend genannt, sowie z.B. Pentylaminocarbonyl, 1-Methylbutylaminocarbonyl, 2-Methyl-butylaminocarbonyl, 3-Methylbutylaminocarbonyl, 2,2-Dimethylpropylaminocarbonyl, 1-Ethylpropylaminocarbonyl, Hexylaminocarbonyl, 1,1-Dimethylpropylaminocarbonyl, 1,2-Dimethylpropylaminocarbonyl, 1-Methylpentylaminocarbonyl, 2-Methylpentylaminocarbonyl, 3-Methylpentylaminocarbonyl, 4-Methylpentylaminocarbonyl, 1,1-Dimethylbutylaminocarbonyl, 1,2-Dimethylbutylaminocarbonyl, 1,3-Dimethylbutylaminocarbonyl, 2,2-Dimethylbutylaminocarbonyl, 2,3-Dimethylbutylaminocarbonyl, 3,3-Dimethylbutylaminocarbonyl, 1-Ethylbutylaminocarbonyl, 2-Ethylbutylaminocarbonyl, 1,1,2-Trimethylpropylaminocarbonyl, 1,2,2-Trimethylpropylaminocarbonyl, 1-Ethyl-1-methylpropylaminocarbonyl oder 1-Ethyl-2-methylpropylaminocarbonyl;
- Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl sowie die Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl-Teile von Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonylamino, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl und [Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonylamino]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-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)-aminocarbonyl, 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)-amino-carbonyl, N-Ethyl-N-(2-ethylbutyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1,1,2-trimethyl-propyl)-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-hexyl-aminocarbonyl, N-Butyl-N-hexylaminocarbonyl, N-Pentyl-N-hexylaminocarbonyl oder N,N-Dihexylamino-carbonyl;
- 10 - 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-propylaminothiocarbonyl, 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)-aminothio-carbonyl, N-Methyl-N-(2-methylbutyl)-aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(3-methylbutyl)-aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(2,2-dimethylpropyl)-aminothio-carbonyl, N-Methyl-N-(1-ethylpropyl)-aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-hexyl-aminothiocarbonyl, 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)-aminothio-carbonyl, 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-pentyl-aminothiocarbonyl, 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-dimethyl-propyl)-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;

25

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

30

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

35

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-

40

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;

5 z.B. 1-Pyrrolidinyl, 2-Isothiazolidinyl, 2-Isouthiazolidinyl, 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,

10 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,

30 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-Dihydropyrazol-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;

35 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-Hexa-

40

hydrotriazin-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;

5 z.B. 1-Piperidinyl, 1-Hexahydropyridazinyl, 1-Hexahydropyrimidinyl, 1-Piperazinyl, 1,3,5-Hexahydrotriazin-1-yl, 1,2,4-Hexahydrotriazin-1-yl, Tetrahydro-1,3-oxazin-1-yl, 1-Morpholinyl;

10 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, 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;

15 - Aryl sowie der Arylteil von 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 :

20 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.

30 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

40

Bicyclen wie die benzanellierte Derivate der vorgenannten Monocyclen, z.B. Chinolinylyl, Isochinolinylyl, Indolylyl, Benzthienylyl, Benzofuranylyl, Benzoxazolyl, Benzthiazolyl, Benzisothiazolyl, Benzimidazolyl, Benzopyrazolyl, Benzthiadiazolyl, Benzotriazolyl.

5

In einer besonderen Ausführungsform haben die Variablen der benzoylsubstituierten 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:

10

Bevorzugt sind die benzoylsubstituierten Alanine der Formel I, in der

R¹ Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl;

besonders bevorzugt Halogen oder C₁-C₆-Halogenalkyl;

15

insbesondere bevorzugt Halogen oder C₁-C₄-Halogenalkyl;

außerordentlich bevorzugt Fluor, Chlor oder CF₃;

bedeutet.

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

20

R² und R³ unabhängig voneinander

Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl;

sehr bevorzugt Wasserstoff, Halogen oder C₁-C₆-Halogenalkyl;

besonders bevorzugt Wasserstoff, Halogen oder C₁-C₄-Halogenalkyl;

insbesondere bevorzugt Wasserstoff, Fluor, Chlor oder CF₃;

25

außerordentlich bevorzugt Wasserstoff, Fluor oder Chlor;

sehr außerordentlich bevorzugt Wasserstoff oder Fluor;

bedeuten.

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

30

R⁴ Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl;

besonders bevorzugt Wasserstoff, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl;

insbesondere bevorzugt Wasserstoff oder Halogen;

außerordentlich bevorzugt Wasserstoff;

bedeutet.

35

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

R⁵ Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl;

besonders bevorzugt Wasserstoff, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl;

insbesondere bevorzugt Wasserstoff oder Halogen;

40

außerordentlich bevorzugt Wasserstoff;

bedeutet.

- Ebenso bevorzugt sind die benzoylsubstituierten Alanine der Formel I, in der
 R^6 Wasserstoff;
 bedeutet.
- 5 Ebenso bevorzugt sind die benzoylsubstituierten Alanine der Formel I, in der
 R^7 Wasserstoff oder Hydroxy;
 besonders bevorzugt Wasserstoff;
 bedeutet.
- 10 Ebenso bevorzugt sind die benzoylsubstituierten Alanine der Formel I, in der
 R^6 Wasserstoff; und
 R^7 Wasserstoff oder Hydroxy;
 besonders bevorzugt Wasserstoff;
 bedeuten.
- 15 Ebenso bevorzugt sind die benzoylsubstituierten Alanine der Formel I, in der
 R^8 C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl;
 besonders bevorzugt C₁-C₆-Alkyl;
 insbesondere bevorzugt C₁-C₄-Alkyl;
- 20 außerordentlich bevorzugt CH₃;
 bedeutet.
- Ebenso bevorzugt sind die benzoylsubstituierten Alanine der Formel I, in der
 R^9 Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;
- 25 bevorzugt Wasserstoff oder CH₃;
 insbesondere bevorzugt Wasserstoff;
 bedeutet.
- Ebenso bevorzugt sind die benzoylsubstituierten Alanine der Formel I in der
- 30 R^{10} Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, 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,
- 35 wobei die voranstehen genannten Cycloalkyl, Cycloalkenyl oder 3- bis 6-
 gliedrigen Heterocyclylreste partiell oder vollständig halogeniert sein kön-
 nen 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,
 40 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;
- 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,
- 5 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-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, C₁-C₆-Alkylsulfonylamino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl(C₁-C₆-alkyl)amino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, Hydroxycarbonyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, Aminocarbonyl, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl, Formylamino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonylamino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, Hydroxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyloxy-C₁-C₄-alkyl, Aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonylamino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl-(C₁-C₆-alkylamino)-C₁-C₄-alkyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyloxy-C₁-C₄-alkyl, [(C₁-C₆-Alkyl)amino-carbonylamino]C₁-C₄-alkyl, [Di(C₁-C₆-alkyl)amino-carbonylamino]C₁-C₄-alkyl;
- 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,
- 25 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, Heteroarylloxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Heteroarylloxy-C₁-C₄-alkyl, Heteroarylthio-C₁-C₄-alkyl, Heteroarylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl, Heteroarylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl,
- 30 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-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, (C₁-C₆-Alkylamino)carbonylamino, Di-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonylamino, Aryl und Aryl(C₁-C₆-alkyl) tragen können.
- 40

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

R¹⁰ 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, 3- bis 6-gliedriges Heterocyclyl,

wobei die voranstehen genannten Cycloalkyl, Cycloalkenyl oder 3- bis 6-gliedrigen Heterocyclylreste 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-Alkoxycarbonyl 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-Alkoxycarbonyl, 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-alkyl, [(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonylamino]C₁-C₄-alkyl, Di(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonylamino-C₁-C₄-alkyl, [Di(C₁-C₆-alkylamino)carbonyloxy]C₁-C₄-alkyl, Formylamino-C₁-C₄-alkyl; Phenyl-C₁-C₄-alkyl, Phenyl-C₂-C₄-alkenyl, Phenyl-C₂-C₄-alkinyl, Phenyl-C₁-C₄-halogenalkyl, Phenyl-C₂-C₄-halogenalkenyl, Phenyl-C₁-C₄-hydroxyalkyl, Phenyl-C₁-C₄-alkoxy-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,

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;

besonders bevorzugt Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₁-C₆-Hydroxyalkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy-C₁-C₄-alkyl, Hydroxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyloxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonylamino-C₁-C₄-alkyl, [Di(C₁-C₆-alkyl)amino]carbonyloxy]C₁-C₄-alkyl, Formylamino-C₁-C₄-alkyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl, Phenyl-C₂-C₄-alkenyl, Phenyl-C₂-C₄-Alkynyl, Phenyl-C₁-C₄-halogenalkyl, Phenyl-C₂-C₄-halogenalkenyl, Phenyl-C₁-C₄-hydroxyalkyl, Phenyl-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, Phenylthio-C₁-C₄-alkyl, Phenylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl oder Phenylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl,

wobei die vorstehend genannten Phenylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder ein bis drei Reste aus der Gruppe C₁-C₆-

Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, Hydroxycarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₆-Alkylsulfonylamino und C₁-C₆-Halogenalkylsulfonylamino tragen können;

5 insbesondere bevorzugt Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₁-C₆-Hydroxyalkyl, Hydroxycarbo-
nyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl, [Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl-
oxy]C₁-C₄-alkyl, Formylamino-C₁-C₄-alkyl;
10 Phenyl-C₁-C₄-alkyl, Phenyl-C₂-C₄-alkenyl, Phenyl-C₁-C₄-hydroxyalkyl oder Phe-
nylthio-C₁-C₄-alkyl;

außerordentlich bevorzugt Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₁-C₆-
Halogenalkyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₁-C₆-Hydroxyalkyl, Formylamino-C₁-C₄-
alkyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl oder Phenyl-C₁-C₄-hydroxyalkyl;

15 bedeutet.

bedeutet.

Ebenso bevorzugt sind die benzoylsubstituierten Alanine der Formel I, in der
R¹¹ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkinyl, C₃-C₆-
20 Halogenalkenyl, C₃-C₆-Halogenalkinyl, Formyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₃-C₆-
Cycloalkylcarbonyl, C₂-C₆-Alkenylcarbonyl, C₂-C₆-Alkinylcarbonyl, C₁-C₆-
Alkoxy-carbonyl, C₃-C₆-Alkenyloxy-carbonyl, C₃-C₆-Alkinyloxy-carbonyl, C₁-C₆-
Alkylaminocarbonyl, C₃-C₆-Alkenylaminocarbonyl, C₃-C₆-Alkinylaminocarbonyl,
25 C₁-C₆-Alkylsulfonylamino-carbonyl, Di(C₁-C₆-alkyl)amino-carbonyl, 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)-
aminocarbonyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminothiocarbonyl, (C₁-C₆-Alkyl)cianoimino, (A-
mino)cianoimino, [(C₁-C₆-Alkyl)amino]cianoimino, Di(C₁-C₆-alkyl)amino-
30 cyanoimino, C₁-C₆-Alkylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkoxyimino-C₁-C₆-alkyl, N-
(C₁-C₆-Alkylamino)-imino-C₁-C₆-alkyl, N-[Di(C₁-C₆-alkyl)amino]imino-C₁-C₆-alkyl
oder Tri-C₁-C₄-alkylsilyl,

wobei die genannten Alkyl-, Cycloalkyl- und Alkoxyreste partiell oder voll-
ständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden
35 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, Aminocar-
bonyl, C₁-C₄-Alkylaminocarbonyl, Di(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl oder C₁-
40 C₄-Alkylcarbonyloxy;

- 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
 5 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
 SO₂R¹³;
- 10 Ebenso bevorzugt sind die benzoylsubstituierten Alanine der Formel I, in der
 R¹¹ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkynyl, Formyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₂-C₆-Alkenylcarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl, C₁-C₆-Alkylsulfonylaminocarbonyl, Di-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, N-(C₁-C₆-Alkoxy)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl,
 15 Di-(C₁-C₆-alkyl)-aminothiocarbonyl, C₁-C₆-Alkoxyimino-C₁-C₆-alkyl,
 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-Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, C₁-C₄-Alkylaminocarbonyl, Di-(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonyl, oder C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy;
 20 Phenyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl, Phenylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, Phenylsulfonylaminocarbonyl oder Phenyl-C₁-C₆-alkylcarbonyl,
 wobei der Phenylring partiell oder vollständig halogeniert sein kann
 25 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
 SO₂R¹³;
- 30 besonders bevorzugt Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkynyl, Formyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₂-C₆-Alkenylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₆-Alkylsulfonylaminocarbonyl, Di-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, N-(C₁-C₆-Alkoxy)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl oder Di-(C₁-C₆-alkyl)-aminothiocarbonyl,
 wobei die genannten Alkyl- oder Alkoxyreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Cyano, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₄-Alkylaminocarbonyl, Di-(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonyl oder C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy;
 35 Phenyl-C₁-C₆-alkyl, Phenylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, Phenylsulfonylaminocarbonyl oder Phenyl-C₁-C₆-alkylcarbonyl,
 wobei der Phenylring partiell oder vollständig halogeniert sein kann
 40 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
SO₂R¹³;

- 5 insbesondere bevorzugt Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkynyl, Formyl, C₁-C₆-Alkyl-carbonyl, C₂-C₆-Alkenylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, Di-(C₁-C₆-alkyl)-amino-carbonyl, N-(C₁-C₆-Alkoxy)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, Di-(C₁-C₆-alkyl)-aminothiocarbonyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl, Phenylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl oder Phenyl-C₁-C₆-alkylcarbonyl
- 10 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
SO₂R¹³;
- 15 bedeutet.

- Ebenso bevorzugt sind die benzoylsubstituierten Alanine der Formel I, in der
- R¹¹ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkynyl, Formyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₂-C₆-Alkenylcarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkylcarbonyl, C₁-C₆-
- 20 Alkoxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl, Di-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, N-(C₁-C₆-Alkoxy)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, Di-(C₁-C₆-alkyl)-aminothiocarbonyl, C₁-C₆-Alkoxyimino-C₁-C₆-alkyl,
- 25 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
SO₂R¹³;
- 30 bedeutet.

- Ebenso bevorzugt sind die benzoylsubstituierten Alanine der Formel I, in der
- R¹¹ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkynyl, Formyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl, Di-(C₁-C₆-alkyl)-
- 35 aminocarbonyl, N-(C₁-C₆-Alkoxy)-N-(C₁-C₆-alkyl)-amino-carbonyl,
insbesondere bevorzugt Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;
- wobei die genannten Alkyl-, und Alkoxyreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Cyano, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylaminocarbonyl oder Di-(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonyl;
- 40 Phenyl-C₁-C₆-alkyl, Phenylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, Phenylaminocarbonyl oder N-(C₁-C₆-Alkyl)-N-(phenyl)-aminocarbonyl,

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

SO₂R¹³;

5

besonders bevorzugt Wasserstoff, Formyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkylaminocarbonyl, Di-(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonyl, Phenylaminocarbonyl, N-(C₁-C₄-Alkyl)-N-(phenyl)-aminocarbonyl, SO₂CH₃, SO₂CF₃ oder SO₂(C₆H₅);

bedeuten.

10

Ebenso bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der R¹² Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, Hydroxy oder C₁-C₆-Alkoxy;

besonders bevorzugt Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl;

insbesondere bevorzugt Wasserstoff oder Methyl;

15

außerordentlich bevorzugt Wasserstoff;

bedeutet.

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

R¹³ C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl oder Phenyl,

20

wobei der Phenylrest partiell oder vollständig halogeniert sein kann

und/oder durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann;

besonders bevorzugt C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder Phenyl;

insbesondere bevorzugt Methyl, Trifluormethyl oder Phenyl.

bedeutet.

25

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

R¹³ C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl oder Phenyl,

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

30

besonders bevorzugt C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder Phenyl;

insbesondere bevorzugt Methyl, Trifluormethyl oder Phenyl.

bedeutet.

35

Besonders bevorzugt sind die benzoylsubstituierten Alanine der Formel I, in der

R¹ Fluor, Chlor oder CF₃;

R² und R³ unabhängig voneinander Wasserstoff, Fluor oder Chlor;

R⁴, R⁵, R⁶ und R⁷ Wasserstoff;

R⁸ C₁-C₄-Alkyl,

40

besonders bevorzugt CH₃;

R⁹ Wasserstoff;

- R¹⁰ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₁-C₆-Hydroxyalkyl, Hydroxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl oder Phenyl-C₁-C₄-hydroxyalkyl; und
- 5 R¹¹ Wasserstoff, Formyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkylaminocarbonyl, Di-(C₁-C₄-Alkyl)-aminocarbonyl, Phenylaminocarbonyl, N-(C₁-C₄-alkyl)-N-(phenyl)-aminocarbonyl, SO₂CH₃, SO₂CF₃ oder SO₂(C₆H₅);
- R¹² Wasserstoff;
- bedeuten.

10

Außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.a. (entspricht Formel I mit R¹= CF₃, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁹ und R¹² = H; R⁸ = CH₃), insbesondere die Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.210 der Tabelle 1, wobei die Definitionen der Variablen R¹ bis R¹² nicht nur in Kombination miteinander, sondern auch jeweils für sich allein

15 betrachtet für die erfindungsgemäßen Verbindungen eine besondere Rolle spielen.

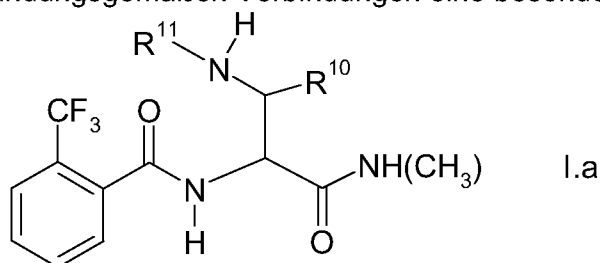


Tabelle 1

Nr.	R ¹⁰	R ¹¹
I.a.1	H	H
I.a.2	CH ₃	H
I.a.3	CH=CH ₂	H
I.a.4	CH=CH(CH ₃)	H
I.a.5	CH=C(CH ₃) ₂	H
I.a.6	C(CH ₃)=CH ₂	H
I.a.7	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	H
I.a.8	C≡CH	H
I.a.9	C≡CCH ₃	H
I.a.10	CF ₃	H
I.a.11	CHF ₂	H
I.a.12	CF ₂ CF ₃	H
I.a.13	CH ₂ OH	H
I.a.14	CH ₂ OCH ₃	H
I.a.15	CH ₂ OC(O)CH ₃	H
I.a.16	CH(OH)CH ₂ OH	H
I.a.17	CH ₂ NHC(O)H	H

Nr.	R ¹⁰	R ¹¹
I.a.18	CH ₂ NHC(O)CH ₃	H
I.a.19	Cyclopropyl	H
I.a.20	Cyclopentyl	H
I.a.21	Cyclohexyl	H
I.a.22	Cyclopenten-2-yl	H
I.a.23	Cyclohexen-2-yl	H
I.a.24	Tetrahydrofur-2-yl	H
I.a.25	Tetrahydrofur-3-yl	H
I.a.26	Tetrahydropyran-2-yl	H
I.a.27	Tetrahydropyran-3-yl	H
I.a.28	Tetrahydropyran-4-yl	H
I.a.29	3,6-Dihydro-2H-pyran-4-yl	H
I.a.30	3,6-Dihydro-2H-pyran-5-yl	H
I.a.31	H	C(O)H
I.a.32	CH ₃	C(O)H
I.a.33	CH=CH ₂	C(O)H
I.a.34	CH=CH(CH ₃)	C(O)H
I.a.35	CH=C(CH ₃) ₂	C(O)H
I.a.36	C(CH ₃)=CH ₂	C(O)H
I.a.37	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	C(O)H
I.a.38	C≡CH	C(O)H
I.a.39	C≡CCH ₃	C(O)H
I.a.40	CF ₃	C(O)H
I.a.41	CHF ₂	C(O)H
I.a.42	CF ₂ CF ₃	C(O)H
I.a.43	CH ₂ OH	C(O)H
I.a.44	CH ₂ OCH ₃	C(O)H
I.a.45	CH ₂ OC(O)CH ₃	C(O)H
I.a.46	CH(OH)CH ₂ OH	C(O)H
I.a.47	CH ₂ NHC(O)H	C(O)H
I.a.48	CH ₂ NHC(O)CH ₃	C(O)H
I.a.49	Cyclopropyl	C(O)H
I.a.50	Cyclopentyl	C(O)H
I.a.51	Cyclohexyl	C(O)H
I.a.52	Cyclopenten-2-yl	C(O)H
I.a.53	Cyclohexen-2-yl	C(O)H
I.a.54	Tetrahydrofur-2-yl	C(O)H
I.a.55	Tetrahydrofur-3-yl	C(O)H
I.a.56	Tetrahydropyran-2-yl	C(O)H
I.a.57	Tetrahydropyran-3-yl	C(O)H

Nr.	R ¹⁰	R ¹¹
I.a.58	Tetrahydropyran-4-yl	C(O)H
I.a.59	3,6-Dihydro-2H-pyran-4-yl	C(O)H
I.a.60	3,6-Dihydro-2H-pyran-5-yl	C(O)H
I.a.61	H	C(O)CH ₃
I.a.62	CH ₃	C(O)CH ₃
I.a.63	CH=CH ₂	C(O)CH ₃
I.a.64	CH=CH(CH ₃)	C(O)CH ₃
I.a.65	CH=C(CH ₃) ₂	C(O)CH ₃
I.a.66	C(CH ₃)=CH ₂	C(O)CH ₃
I.a.67	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	C(O)CH ₃
I.a.68	C≡CH	C(O)CH ₃
I.a.69	C≡CCH ₃	C(O)CH ₃
I.a.70	CF ₃	C(O)CH ₃
I.a.71	CHF ₂	C(O)CH ₃
I.a.72	CF ₂ CF ₃	C(O)CH ₃
I.a.73	CH ₂ OH	C(O)CH ₃
I.a.74	CH ₂ OCH ₃	C(O)CH ₃
I.a.75	CH ₂ OC(O)CH ₃	C(O)CH ₃
I.a.76	CH(OH)CH ₂ OH	C(O)CH ₃
I.a.77	CH ₂ NHC(O)H	C(O)CH ₃
I.a.78	CH ₂ NHC(O)CH ₃	C(O)CH ₃
I.a.79	Cyclopropyl	C(O)CH ₃
I.a.80	Cyclopentyl	C(O)CH ₃
I.a.81	Cyclohexyl	C(O)CH ₃
I.a.82	Cyclopenten-2-yl	C(O)CH ₃
I.a.83	Cyclohexen-2-yl	C(O)CH ₃
I.a.84	Tetrahydrofur-2-yl	C(O)CH ₃
I.a.85	Tetrahydrofur-3-yl	C(O)CH ₃
I.a.86	Tetrahydropyran-2-yl	C(O)CH ₃
I.a.87	Tetrahydropyran-3-yl	C(O)CH ₃
I.a.88	Tetrahydropyran-4-yl	C(O)CH ₃
I.a.89	3,6-Dihydro-2H-pyran-4-yl	C(O)CH ₃
I.a.90	3,6-Dihydro-2H-pyran-5-yl	C(O)CH ₃
I.a.91	H	C(O)NH(CH ₃)
I.a.92	CH ₃	C(O)NH(CH ₃)
I.a.93	CH=CH ₂	C(O)NH(CH ₃)
I.a.94	CH=CH(CH ₃)	C(O)NH(CH ₃)
I.a.95	CH=C(CH ₃) ₂	C(O)NH(CH ₃)
I.a.96	C(CH ₃)=CH ₂	C(O)NH(CH ₃)
I.a.97	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	C(O)NH(CH ₃)

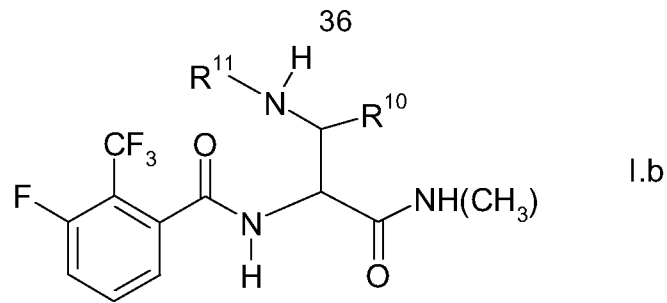
Nr.	R ¹⁰	R ¹¹
I.a.98	C≡CH	C(O)NH(CH ₃)
I.a.99	C≡CCH ₃	C(O)NH(CH ₃)
I.a.100	CF ₃	C(O)NH(CH ₃)
I.a.101	CHF ₂	C(O)NH(CH ₃)
I.a.102	CF ₂ CF ₃	C(O)NH(CH ₃)
I.a.103	CH ₂ OH	C(O)NH(CH ₃)
I.a.104	CH ₂ OCH ₃	C(O)NH(CH ₃)
I.a.105	CH ₂ OC(O)CH ₃	C(O)NH(CH ₃)
I.a.106	CH(OH)CH ₂ OH	C(O)NH(CH ₃)
I.a.107	CH ₂ NHC(O)H	C(O)NH(CH ₃)
I.a.108	CH ₂ NHC(O)CH ₃	C(O)NH(CH ₃)
I.a.109	Cyclopropyl	C(O)NH(CH ₃)
I.a.110	Cyclopentyl	C(O)NH(CH ₃)
I.a.111	Cyclohexyl	C(O)NH(CH ₃)
I.a.112	Cyclopenten-2-yl	C(O)NH(CH ₃)
I.a.113	Cyclohexen-2-yl	C(O)NH(CH ₃)
I.a.114	Tetrahydrofur-2-yl	C(O)NH(CH ₃)
I.a.115	Tetrahydrofur-3-yl	C(O)NH(CH ₃)
I.a.116	Tetrahydropyran-2-yl	C(O)NH(CH ₃)
I.a.117	Tetrahydropyran-3-yl	C(O)NH(CH ₃)
I.a.118	Tetrahydropyran-4-yl	C(O)NH(CH ₃)
I.a.119	3,6-Dihydro-2H-pyran-4-yl	C(O)NH(CH ₃)
I.a.120	3,6-Dihydro-2H-pyran-5-yl	C(O)NH(CH ₃)
I.a.121	H	C(O)N(CH ₃) ₂
I.a.122	CH ₃	C(O)N(CH ₃) ₂
I.a.123	CH=CH ₂	C(O)N(CH ₃) ₂
I.a.124	CH=CH(CH ₃)	C(O)N(CH ₃) ₂
I.a.125	CH=C(CH ₃) ₂	C(O)N(CH ₃) ₂
I.a.126	C(CH ₃)=CH ₂	C(O)N(CH ₃) ₂
I.a.127	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	C(O)N(CH ₃) ₂
I.a.128	C≡CH	C(O)N(CH ₃) ₂
I.a.129	C≡CCH ₃	C(O)N(CH ₃) ₂
I.a.130	CF ₃	C(O)N(CH ₃) ₂
I.a.131	CHF ₂	C(O)N(CH ₃) ₂
I.a.132	CF ₂ CF ₃	C(O)N(CH ₃) ₂
I.a.133	CH ₂ OH	C(O)N(CH ₃) ₂
I.a.134	CH ₂ OCH ₃	C(O)N(CH ₃) ₂
I.a.135	CH ₂ OC(O)CH ₃	C(O)N(CH ₃) ₂
I.a.136	CH(OH)CH ₂ OH	C(O)N(CH ₃) ₂
I.a.137	CH ₂ NHC(O)H	C(O)N(CH ₃) ₂

Nr.	R ¹⁰	R ¹¹
I.a.138	CH ₂ NHC(O)CH ₃	C(O)N(CH ₃) ₂
I.a.139	Cyclopropyl	C(O)N(CH ₃) ₂
I.a.140	Cyclopentyl	C(O)N(CH ₃) ₂
I.a.141	Cyclohexyl	C(O)N(CH ₃) ₂
I.a.142	Cyclopenten-2-yl	C(O)N(CH ₃) ₂
I.a.143	Cyclohexen-2-yl	C(O)N(CH ₃) ₂
I.a.144	Tetrahydrofur-2-yl	C(O)N(CH ₃) ₂
I.a.145	Tetrahydrofur-3-yl	C(O)N(CH ₃) ₂
I.a.146	Tetrahydropyran-2-yl	C(O)N(CH ₃) ₂
I.a.147	Tetrahydropyran-3-yl	C(O)N(CH ₃) ₂
I.a.148	Tetrahydropyran-4-yl	C(O)N(CH ₃) ₂
I.a.149	3,6-Dihydro-2H-pyran-4-yl	C(O)N(CH ₃) ₂
I.a.150	3,6-Dihydro-2H-pyran-5-yl	C(O)N(CH ₃) ₂
I.a.151	H	C(O)OCH ₃
I.a.152	CH ₃	C(O)OCH ₃
I.a.153	CH=CH ₂	C(O)OCH ₃
I.a.154	CH=CH(CH ₃)	C(O)OCH ₃
I.a.155	CH=C(CH ₃) ₂	C(O)OCH ₃
I.a.156	C(CH ₃)=CH ₂	C(O)OCH ₃
I.a.157	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	C(O)OCH ₃
I.a.158	C≡CH	C(O)OCH ₃
I.a.159	C≡CCH ₃	C(O)OCH ₃
I.a.160	CF ₃	C(O)OCH ₃
I.a.161	CHF ₂	C(O)OCH ₃
I.a.162	CF ₂ CF ₃	C(O)OCH ₃
I.a.163	CH ₂ OH	C(O)OCH ₃
I.a.164	CH ₂ OCH ₃	C(O)OCH ₃
I.a.165	CH ₂ OC(O)CH ₃	C(O)OCH ₃
I.a.166	CH(OH)CH ₂ OH	C(O)OCH ₃
I.a.167	CH ₂ NHC(O)H	C(O)OCH ₃
I.a.168	CH ₂ NHC(O)CH ₃	C(O)OCH ₃
I.a.169	Cyclopropyl	C(O)OCH ₃
I.a.170	Cyclopentyl	C(O)OCH ₃
I.a.171	Cyclohexyl	C(O)OCH ₃
I.a.172	Cyclopenten-2-yl	C(O)OCH ₃
I.a.173	Cyclohexen-2-yl	C(O)OCH ₃
I.a.174	Tetrahydrofur-2-yl	C(O)OCH ₃
I.a.175	Tetrahydrofur-3-yl	C(O)OCH ₃
I.a.176	Tetrahydropyran-2-yl	C(O)OCH ₃
I.a.177	Tetrahydropyran-3-yl	C(O)OCH ₃

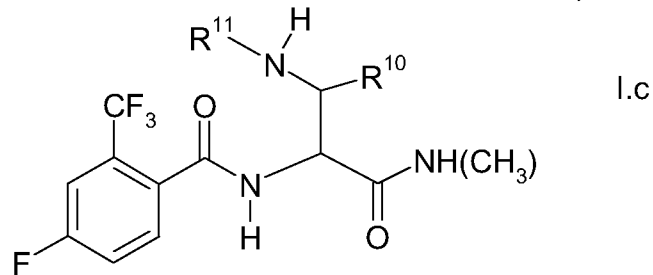
Nr.	R ¹⁰	R ¹¹
I.a.178	Tetrahydropyran-4-yl	C(O)OCH ₃
I.a.179	3,6-Dihydro-2H-pyran-4-yl	C(O)OCH ₃
I.a.180	3,6-Dihydro-2H-pyran-5-yl	C(O)OCH ₃
I.a.181	H	SO ₂ CH ₃
I.a.182	CH ₃	SO ₂ CH ₃
I.a.183	CH=CH ₂	SO ₂ CH ₃
I.a.184	CH=CH(CH ₃)	SO ₂ CH ₃
I.a.185	CH=C(CH ₃) ₂	SO ₂ CH ₃
I.a.186	C(CH ₃)=CH ₂	SO ₂ CH ₃
I.a.187	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	SO ₂ CH ₃
I.a.188	C≡CH	SO ₂ CH ₃
I.a.189	C≡CCH ₃	SO ₂ CH ₃
I.a.190	CF ₃	SO ₂ CH ₃
I.a.191	CHF ₂	SO ₂ CH ₃
I.a.192	CF ₂ CF ₃	SO ₂ CH ₃
I.a.193	CH ₂ OH	SO ₂ CH ₃
I.a.194	CH ₂ OCH ₃	SO ₂ CH ₃
I.a.195	CH ₂ OC(O)CH ₃	SO ₂ CH ₃
I.a.196	CH(OH)CH ₂ OH	SO ₂ CH ₃
I.a.197	CH ₂ NHC(O)H	SO ₂ CH ₃
I.a.198	CH ₂ NHC(O)CH ₃	SO ₂ CH ₃
I.a.199	Cyclopropyl	SO ₂ CH ₃
I.a.200	Cyclopentyl	SO ₂ CH ₃
I.a.201	Cyclohexyl	SO ₂ CH ₃
I.a.202	Cyclopenten-2-yl	SO ₂ CH ₃
I.a.203	Cyclohexen-2-yl	SO ₂ CH ₃
I.a.204	Tetrahydrofur-2-yl	SO ₂ CH ₃
I.a.205	Tetrahydrofur-3-yl	SO ₂ CH ₃
I.a.206	Tetrahydropyran-2-yl	SO ₂ CH ₃
I.a.207	Tetrahydropyran-3-yl	SO ₂ CH ₃
I.a.208	Tetrahydropyran-4-yl	SO ₂ CH ₃
I.a.209	3,6-Dihydro-2H-pyran-4-yl	SO ₂ CH ₃
I.a.210	3,6-Dihydro-2H-pyran-5-yl	SO ₂ CH ₃

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.b, insbesondere die Verbindungen der Formel I.b.1 bis I.b.210, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.210 dadurch unterscheiden, daß R² für Fluor steht:

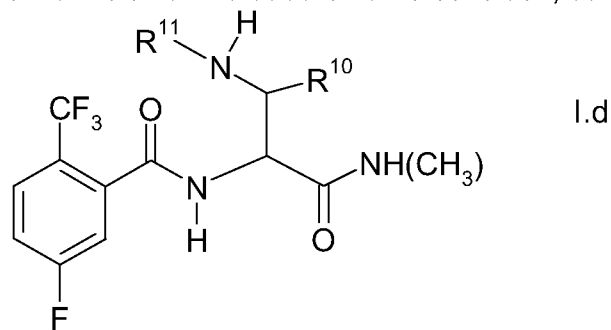
5



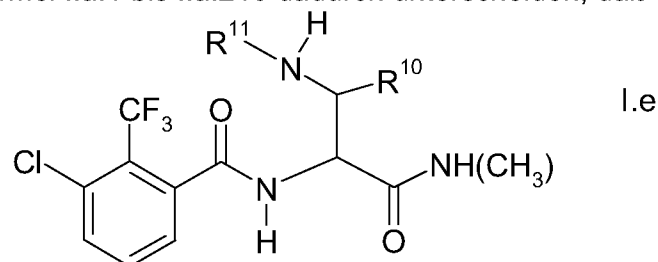
Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.c, insbesondere die Verbindungen der Formel I.c.1 bis I.c.210, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.210 dadurch unterscheiden, daß R³ für Fluor steht:



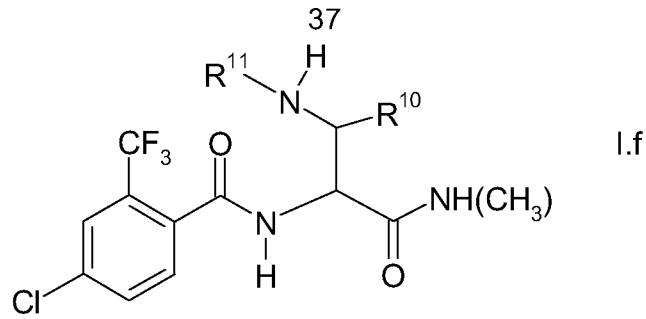
Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.d, insbesondere die Verbindungen der Formel I.d.1 bis I.d.210, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.210 dadurch unterscheiden, daß R⁴ für Fluor steht:



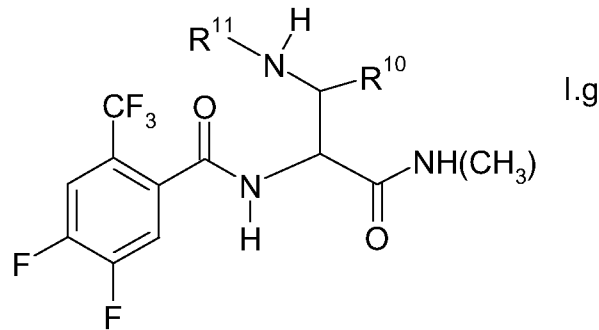
Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.e, insbesondere die Verbindungen der Formel I.e.1 bis I.e.210, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.210 dadurch unterscheiden, daß R² für Chlor steht:



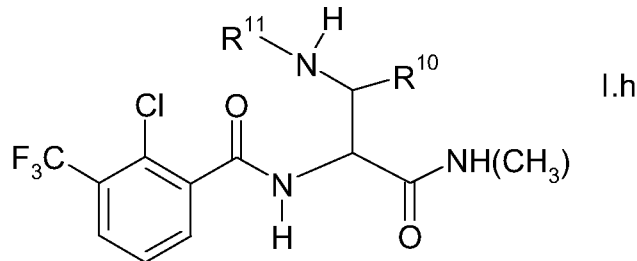
Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.f, insbesondere die Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.210, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.210 dadurch unterscheiden, daß R³ für Chlor steht:



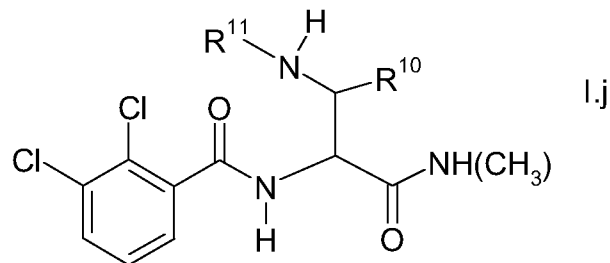
- Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.g, insbesondere die Verbindungen der Formel I.g.1 bis I.g.210, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.210 dadurch unterscheiden, daß R³ und R⁴ für Fluor stehen:



- Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.h, insbesondere die Verbindungen der Formel I.h.1 bis I.h.210, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.210 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Chlor und R² für CF₃ steht:

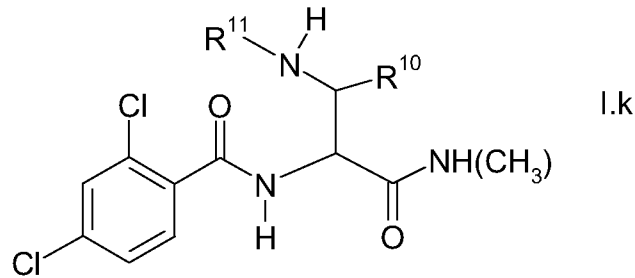


- Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.j, insbesondere die Verbindungen der Formel I.j.1 bis I.j.210, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.210 dadurch unterscheiden, daß R¹ und R² für Chlor stehen:



Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.k, insbesondere die Verbindungen der Formel I.k.1 bis I.k.210, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.210 dadurch unterscheiden, daß R¹ und R³ für Chlor stehen:

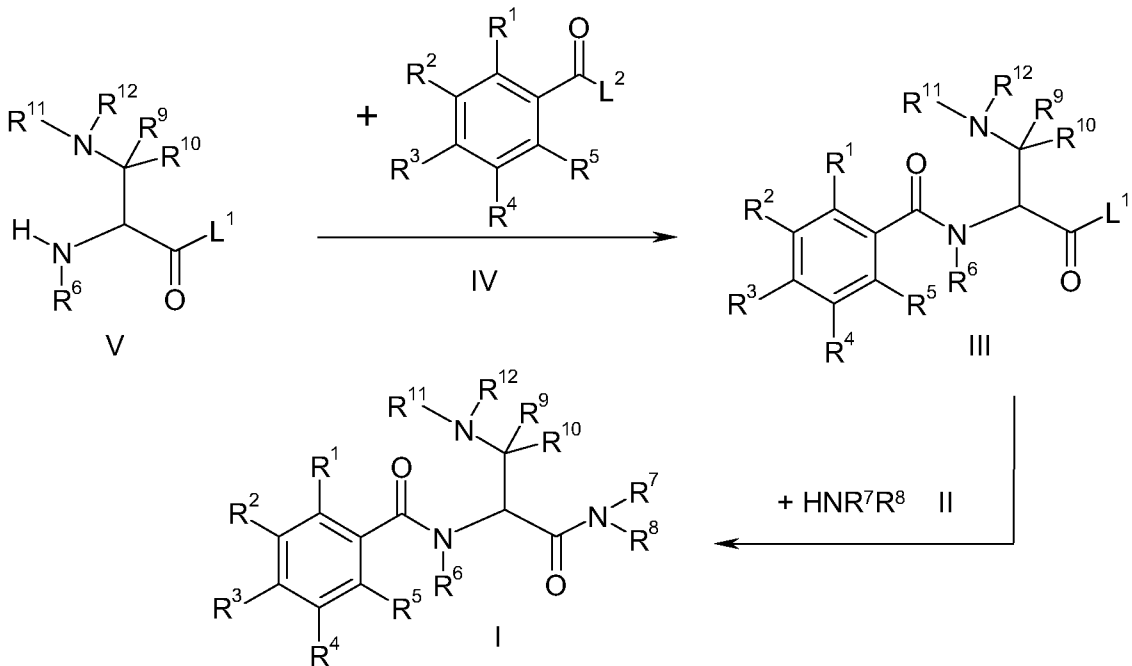
5



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

Verfahren A

Alaninderivate der Formel V werden zunächst mit Benzoesäure(derivate)n der Formel IV zu entsprechenden Benzoylderivaten der Formel III umgesetzt, welche anschließend mit Aminen der Formel II zu den gewünschten benzoylsubstituierten Alaninen der Formel I reagieren:



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

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

- 5 Die Umsetzung der Alaninderivate der Formel V mit Benzoesäure(derivate)n der Formel IV, wobei L² für Hydroxy steht, zu Benzoylderivaten der Formel III erfolgt in Gegenwart eines Aktivierungsreagenz und einer Base üblicherweise bei Temperaturen von 0 °C bis zum Siedepunkt des Reaktionsgemisches, vorzugsweise 0°C bis 110°C, besonders bevorzugt bei Raumtemperatur, in einem inerten organischen Lösungsmittel
- 10 [vgl. K. C. Nicolaou et al., J. of the Am. Chem. Soc. (2005), 127(31), 11176-11183; Shu-Sin Chng et al., Tetrahedron Lett. (2004), 45(52), 9501-9504; Werner W. K. R. Mederski et al., Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters (2004), 14 (23), 5817-5822; Romano Silvestri et al., J. of Med. Chem. (2004), 47(15), 3892-3896; P. Rzepecki et al., J. of Org. Chem. (2004), 69(16), 5168-5178; Justin Bower et al., Bioorg. and Med.
- 15 Chem. Lett. (2003), 13(15), 2455-2458; Jill Arrowsmith et al., J. of Med. Chem. (2002), 45(25), 5458-5470; Ashraf Briket al., Chemistry and Biology (2002), 9(8), 891-896; Andrew D. Abell et al., Tetrahedron Lett. (2002), 43(20), 3673-3675; John F. Okonya et al., J. of Org. Chem. (2002), 67(4), 1102-1108; George R. Pettit et al., J. of Org. Chem. (1985), 50(15), 2654-2659].

20

- Geeignete Aktivierungsreagenzien sind Kondensationsmittel wie z.B. polystyrolgebundenes Dicyclohexylcarbodiimid, Diisopropylcarbodiimid, Carbonyldiimidazol, Chlorkohlensäureester wie Methylchloroformiat, Ethylchloroformiat, Isopropylchloroformiat, Isobutylchloroformiat, sec-Butylchloroformiat oder Allylchloroformiat, Pivaloylchlorid, Polyphosphorsäure, Propanphosphonsäureanhydrid, Bis(2-oxo-3-oxazolidinyl)-phosphorylchlorid (BOPCl) oder Sulfonylchloride wie Methansulfonylchlorid, Toluolsulfonylchlorid oder Benzolsulfonylchlorid.

30

- 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.-
- 35 Butylmethylketon, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid (DMF), Dimethylacetamid (DMA) und N-Methylpyrrolidon (NMP) oder auch in Wasser, besonders bevorzugt sind Methylenchlorid, THF und Wasser.

40

Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide wie Lithiumhydroxid, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid und Calci-

- umhydroxid, 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 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.
- Die Umsetzung der Alaninderivate der Formel V mit Benzoesäure(derivate)n der Formel IV, wobei L² für Halogen, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy carbonyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Phosphoryl oder Isoureyl steht, zu Benzoylderivaten 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. K. C. Nicolaou et al., J. of the Am. Chem. Soc. (2005), 127(31), 11176-11183; Shu-Sin Chng et al., Tetrahedron Lett. (2004), 45(52), 9501-9504; Werner W. K. R. Mederski et al., Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters (2004), 14 (23), 5817-5822; Romano Silvestri et al., J. of Med. Chem. (2004), 47(15), 3892-3896; P. Rzepecki et al., J. of Org. Chem. (2004), 69(16), 5168-5178; Justin Bower et al., Bioorg. and Med. Chem. Lett. (2003), 13(15), 2455-2458; Jill Arrowsmith et al., J. of Med. Chem. (2002), 45(25), 5458-5470; Ashraf Briket al., Chemistry and Biology (2002), 9(8), 891-896; Andrew D. Abell et al., Tetrahedron Lett. (2002), 43(20), 3673-3675; John F. Okonya et al., J. of Org. Chem. (2002), 67(4), 1102-1108; George R. Pettit et al., J. of Org. Chem. (1985), 50(15), 2654-2659].

- 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.-
- 5 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.
- 10 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,
- 15 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.
- 20 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.
- 30 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
- 35 Aminen der Formel II zu den entsprechenden Amidinen umgesetzt werden, welche dann mit Benzoesäure(derivate)n der Formel IV zu den gewünschten benzoylsubstituierten Alaninen der Formel I reagieren.
- 40 Die für die Herstellung der Benzoylderivate 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. Kondensation von dem Enolat eines Glycin-Derivates mit einem Imin-Derivat
5 [vgl. Franklin A. Davis et al., *Org. Lett.* (2004), 6(14), 2397-2399; Alma Viso et al., *J. of Org. Chem.* (2004), 69(5), 1542-1547; Luca Bernardi et al., *J. of Org. Chem.* (2003), 68(7), 2583-2591; Ivanka K. Kavrakova et al., *J. of Chem. Res., Synopses* (1993), (5), 186-187.]
- 10 2. Reduktion eines Azids
[vgl. Mark E. Bunnage et al., *Organ. and Biomol. Chem.* (2003), 1(21), 3708-3715; Anthony J. Burke et al., *Synlett* (1996), (7), 621-622.]
3. Nucleophile Öffnung eines Aziridins
15 [vgl. Michael A. Letavic et al., *Bioorg. and Méd. Chem. Lett.* (2003), 13(19), 3243-3246; Tushar K. Chakraborty et al., *Chem. Lett.* (2003), 32(1), 82-83; K.-D. Lee et al., *Tetrahedron* (2001), 57(39), 8267-8276; Luciano Antolini et al., *J. of Org. Chem.* (1997), 62(25), 8784-8789; Johan Legters et al., *Rec. des Trav. Chim. Pays-Bas* (1992), 111(2), 59-68]
- 20 4. Addition von Nitroenolaten an Glyciminime und anschließende Reduktion:
[vgl. Nagatoshi Nishiwaki et al., *Angew. Chem., Int. Ed.* (2001), 40(16), 2992-2995; Kristian Rahbek Knudsen et al., *J. of the Am. Chem. Soc.* (2001), 123(24), 5843-5844]
- 25 5. Hydrierung von Diaminoacrylaten
[vgl. Andrea J. Robinson et al., *J. of Org. Chem.* (2001), 66(12), 4148-4152; Ryoichi Kuwano et al., *Tetrahedron Asym.* (1998), 9(16), 2773-2775; Hiroyuki Setoi et al., *Chem. and Pharm. Bull.* (1989), 37(4), 1126-1127; Piedad Fernandez-Resa et al., *J. of the Chem. Soc. Perkin Trans. 1* (1989), (1), 67-71]
- 30 6. Oxidative Diaminierung von Acrylaten
[vgl. Guigen Li et al., *Tetrahedron Lett.* (2000), 41(45), 8699-8703]
7. Öffnung von Imidazolinen
35 [vgl. Tamio Hayashi et al., *Tetrahedron Lett.* (1996), 37(28), 4969-4972; Peter J. Dunn et al., *J. of Org. Chem.* (1990), 55(17), 5017-5025.]
8. Addition eines N-Nucleophils an ein Aminoacrylat
[vgl. B. Narasimhulu Naidu et al., *J. of Org. Chem.* (2003), 68(26), 10098-10102;
40 Daeock Choi et al., *Tetrahedron Lett.* (1995), 36(41), 7371-7374; Montserrat Perez et al., *Tetrahedron* (1995), 51(30), 8355-8362 ; Rolf Meyer et al., *Justus Liebigs Ann. Chem.* (1977), (7), 1183-1193.]

Die für die Herstellung der Benzoylderivate der Formel III benötigten Benzoesäure-
(derivate) der Formel IV können käuflich erworben werden oder können analog zu literaturbekanntem
5 Vorschrift über eine Grignard-Reaktion aus dem entsprechenden Halogenid 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-
10 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]

15

Die Umsetzung der Benzoylderivate der Formel III mit $L^1 = \text{Hydroxy}$ bzw. deren Salze mit Aminen der Formel II zu den gewünschten benzoylsubstituierten Serin-Amiden 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. Perich, J. W., Johns, R. B., J. Org. Chem. 53 (17), 4103-4105 (1988); Somlai, C. et al., Synthesis (3), 285-287 (1992) ; Gupta, A. et al., J. Chem. Soc. Perkin Trans. 2, 1911 (1990); Guan et al., J. Comb. Chem. 2, 297 (2000)].

20
25

Geeignete Aktivierungsreagenzien sind Kondensationsmittel wie z.B. polystyrolgebundenes Dicyclohexylcarbodiimid, Diisopropylcarbodiimid, Carbonyldiimidazol, Chlorkohlensäureester wie Methylchloroformiat, Ethylchloroformiat, Isopropylchloroformiat, Isobutylchloroformiat, sec-Butylchloroformiat oder Allylchloroformiat, Pivaloylchlorid, Polyphosphorsäure, Propanphosphonsäureanhydrid, Bis(2-oxo-3-oxazolidinyl)-phosphorylchlorid (BOPCl) oder Sulfonylchloride wie Methansulfonylchlorid, Toluolsulfonylchlorid oder Benzolsulfonylchlorid.

30
35

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Gemische von C_5 - C_8 -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

40

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.

- 5 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-
10 Methylmorpholin, und N-Methylpiperidin, Pyridin, substituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders
15 bevorzugt werden Natriumhydroxid, Triethylamin, Ethyldiisopropylamin, N-methylmorpholin und Pyridin.

- 20 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
25 kann vorteilhaft sein II in einem Überschuß bezogen auf III einzusetzen.

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

30 Die Umsetzung der Benzoylderivate der Formel III mit $L^1 = C_1-C_6$ -Alkoxy mit Aminen der Formel II zu den gewünschten benzoylsubstituierten Serin-Amiden 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
35 einem inerten organischen Lösungsmittel gegebenenfalls in Gegenwart einer Base [vgl. Kawahata, N. H. et al., Tetrahedron Lett. 43 (40), 7221-7223 (2002); Takahashi, K. et al., J. Org. Chem. 50 (18), 3414-3415 (1985); Lee, Y. et al., J. Am. Chem. Soc. 121 (36), 8407-8408 (1999)].

- 40 Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Gemische von C_5-C_8 -Alkanen, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Benzol, Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid

rid, 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.

10

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, 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.

15

20

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

25

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

30

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

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

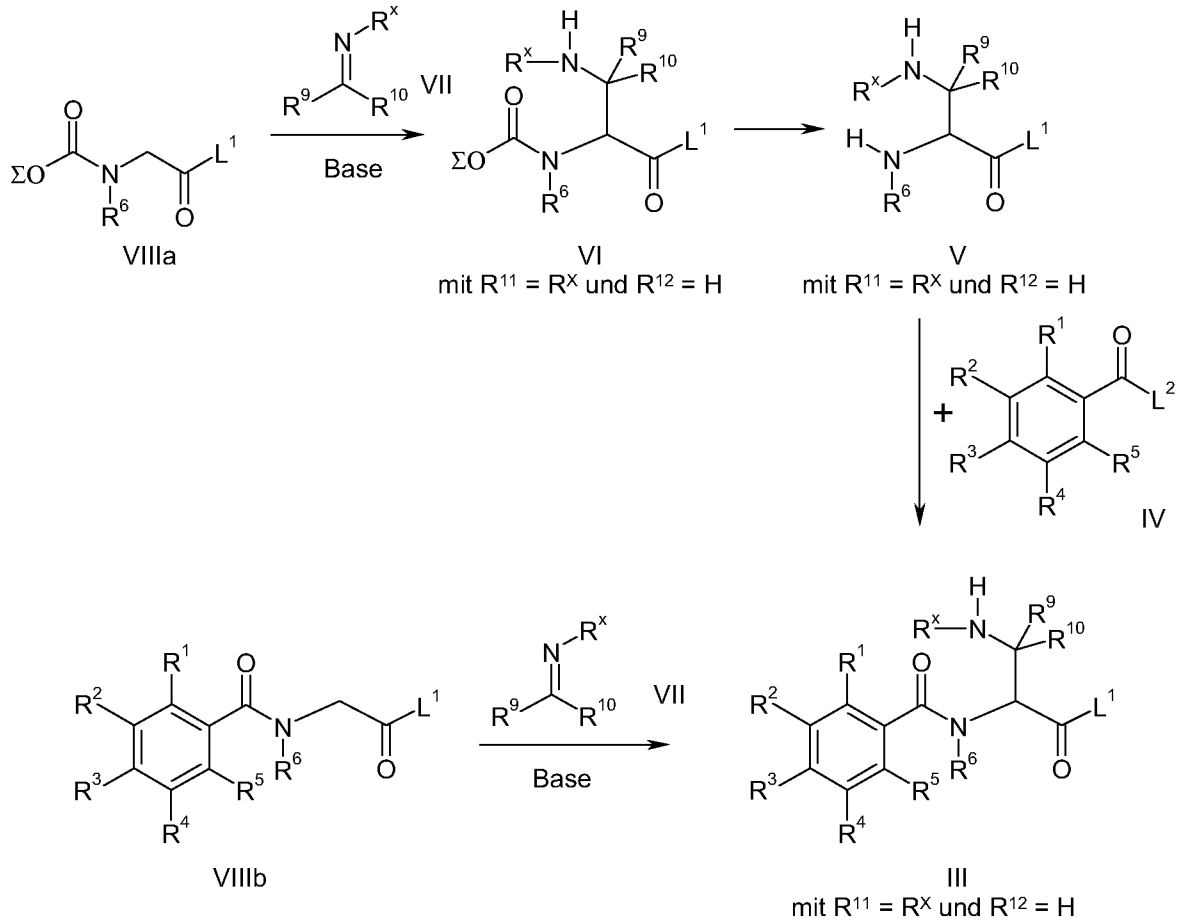
35

Verfahren B

Benzoylderivate der Formel III mit $R^{11} = R^X$ und $R^{12} = \text{Wasserstoff}$ 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.-

40

Butyloxycarbonyl (vgl. VIIIa mit $\Sigma = \text{tert-Butyl}$) sein kann, mit Iminverbindungen VII zu entsprechenden Aldolprodukten VI mit $R^{11} = R^X$ und $R^{12} = \text{Wasserstoff}$ kondensiert wird. Anschließend wird die Schutzgruppe abgespalten und die so entstandenen Alanderivate der Formel V mit $R^{11} = R^X$ und $R^{12} = \text{Wasserstoff}$ mit Benzoesäure(derivate)n der Formel IV acyliert.



R^X steht für R^{11} oder für eine abspaltbare Schutzgruppe wie C_1 - C_6 -Alkyloxycarbonyl (z.B. tert.-Butyloxycarbonyl), C_1 - C_6 -Alkylsulfinyl (z.B. tert.-Butylsulfinyl) oder gegebenenfalls durch C_1 - C_6 -Alkyl substituiertes Arylsulfinyl (z.B. Toluylsulfinyl).

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

L^2 steht für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe, z.B. für Hydroxy, Halogen, C_1 - C_6 -Alkylcarbonyl, C_1 - C_6 -Alkoxycarbonyl, C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl, Phosphoryl oder Isoureyl.

Die Umsetzung der Glycinderivate VIII mit Iminoverbindungen VII zum entsprechenden Aldolprodukt VI mit $R^{11} = R^X$ und $R^{12} = \text{Wasserstoff}$ bzw. Benzoylderivat III mit $R^{11} = R^X$ und $R^{12} = \text{Wasserstoff}$ 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. J.-F. Rousseau et al., J. Org. Chem. 63, 2731-2737 (1998)].

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 Lithiumdiisopropylamid und Lithiumhexamethyldisilazid, metallorganische Verbindungen, insbesondere Alkalimetallalkyle wie Methyllithium, Butyllithium und Phenyllithium, sowie Alkalimetall- und Erdalkalimetallalkoholate wie Natriummethanolat, Natriumethanolat, Kaliummethanolat, 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 Benzoylderivate III mit $R^{11} = R^X$ und $R^{12} = \text{Wasserstoff}$ benötigten Glycinderivate der Formel VIII können käuflich erworben werden, sind in der Lite-

ratur 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 $R^{11} = R^X$ und $R^{12} =$ 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 Fall von $\Sigma =$ Benzyl durch Hydrogenolyse, bevorzugt durch Wasserstoff und Pd/C in Methanol; im Fall von $\Sigma =$ tert.-Butyl durch Säure, bevorzugt Salzsäure in Dioxan.

10 Die Umsetzung der Alaninderivate V mit $R^{11} = R^X$ und $R^{12} =$ Wasserstoff mit Benzoesäure(derivate)n IV zu Benzoylderivaten III mit $R^{11} = R^X$ und $R^{12} =$ Wasserstoff erfolgt üblicherweise analog der unter Verfahren A genannten Umsetzung der Alaninderivate der Formel V mit Benzoesäure(derivate)n der Formel IV zu Benzoylderivaten III.

15

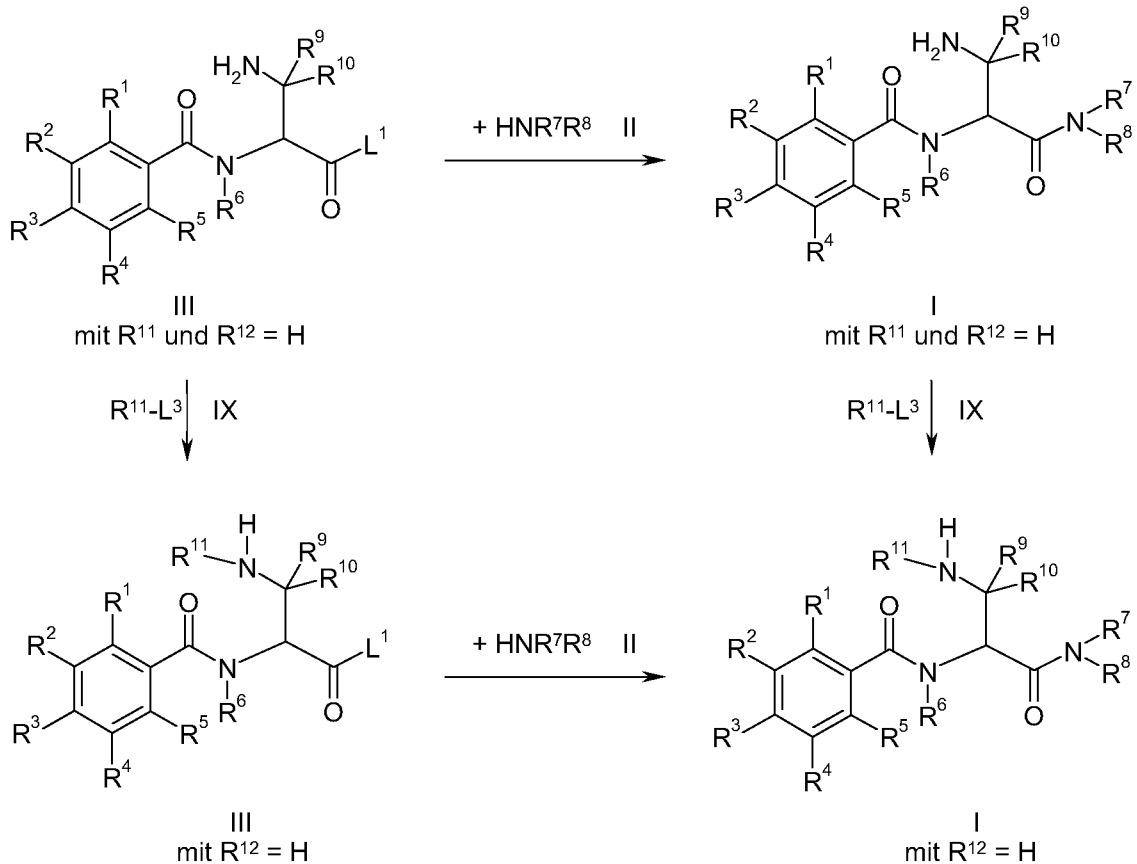
Die, falls R^X für eine abspaltbare Schutzgruppe steht, gegebenenfalls notwendige Abspaltung dieser Schutzgruppe R^X erfolgt nach literaturbekannten Methoden [vgl. J.-F. Rousseau et al., J. Org. Chem. 63, 2731-2737 (1998)]; J. M. Andres, Tetrahedron 56, 1523 (2000)]; im Fall von $\Sigma =$ Benzyl durch Hydrogenolyse, bevorzugt durch Wasserstoff und Pd/C in Methanol; im Fall von $\Sigma =$ tert.-Butyl durch Säure, bevorzugt Salzsäure in Dioxan.

Die auf diesem Weg erhältlichen Benzoylderivate der Formel III mit R^{11} und $R^{12} =$ Wasserstoff lassen sich anschließend mit Aminen der Formel II analog zu Verfahren A zu den gewünschten benzoylsubstituierten Alaninen der Formel I mit R^{11} und $R^{12} =$ Wasserstoff umsetzen, welche dann mit Verbindungen der Formel IX zu benzoylsubstituierten Alaninen der Formel I mit $R^{12} =$ Wasserstoff derivatisiert werden können [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)].

30

Ebenso können die Benzoylderivate der Formel III mit R^{11} und $R^{12} =$ Wasserstoff zunächst mit Verbindungen der Formel IX zu weiteren Benzoylderivaten der Formel III mit $R^{12} =$ Wasserstoff derivatisiert werden [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] und anschließend analog zu Verfahren A mit Aminen der Formel II zu den gewünschten benzoylsubstituierten Alaninen der Formel I mit $R^{12} =$ Wasserstoff umgesetzt werden:

35



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.

10 Die Umsetzung der Benzoylderivate der Formel III (mit $R^{12} =$ Wasserstoff und gegebenenfalls mit $R^{11} =$ Wasserstoff) mit Aminen der Formel II zu benzoylsubstituierten Alaninen der Formel I (mit $R^{12} =$ Wasserstoff und gegebenenfalls mit $R^{11} =$ Wasserstoff) erfolgt üblicherweise analog der unter Verfahren A geschilderten Umsetzung der Benzoylderivate der Formel III mit Aminen der Formel II.

15 Die Umsetzung der Benzoylderivate der Formel III mit R^{11} und $R^{12} =$ Wasserstoff bzw. der benzoylsubstituierten Alanine der Formel I mit R^{11} und $R^{12} =$ Wasserstoff mit Verbindungen der Formel IX zu Benzoylderivaten der Formel III mit $R^{12} =$ Wasserstoff bzw. benzoylsubstituierten Alaninen der Formel I mit $R^{12} =$ Wasserstoff erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von $0^\circ C$ bis $100^\circ C$, 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].

20

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 Dichlormethan, tert.-Butylmethylether, Dioxan und Tetrahydrofuran.

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, Alkalimetallamide wie Lithiumamid, Natriumamid und Kaliumamid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate wie Lithiumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat sowie Alkalimetallhydrogencarbonate wie Natriumhydrogencarbonat, metallorganische Verbindungen, 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 Natriumhydroxid, Natriumhydrid und Triethylamin.

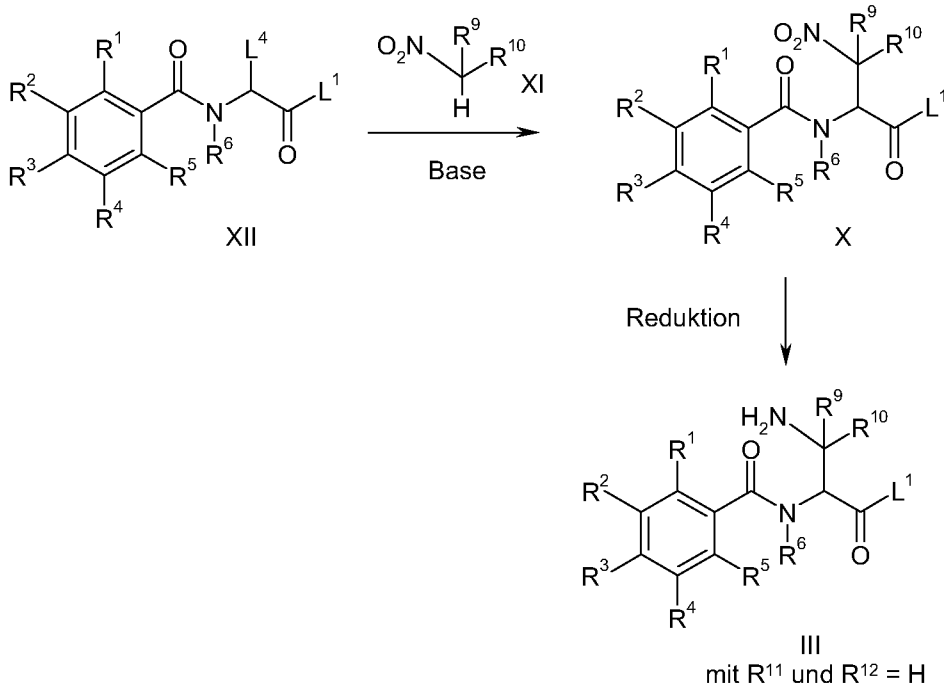
Die Basen werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen eingesetzt, sie können aber auchkatalytisch, im Überschuß oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

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

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

Verfahren C

- Benzoylderivate der Formel III mit R^{11} und $R^{12} = \text{Wasserstoff}$ können auch erhalten werden, indem Glycin-Derivate der Formel XII mit einer Nitroverbindung der Formel XI zu Nitro-Anilinderivaten der Formel X umgesetzt und anschließend reduziert werden:



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

L^4 steht für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe, z.B. Halogen wie Chlor oder Brom.

- Die Umsetzung der Nitroverbindung XI mit dem Glycin-Derivat XII erfolgt üblicherweise bei einer Temperatur von -100°C bis zum Siedepunkt der Reaktionsmischung, bevorzugt bei -80°C bis 20°C , in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base (vgl. Vicky A. Burgess et al., Aust. J. of Chem. (1988), 41(7), 1063-1070).
- 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, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und tert.-Butylmethylether, 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.

5

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, insbesondere Alkalimetallalkyle wie Methylithium, 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 Natriumhydroxid, Natriumhydrid und Triethylamin.

10

15

20

25

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

30

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

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

35

Die benötigten Nitroverbindung der Formel XI können käuflich erworben werden.

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.

40

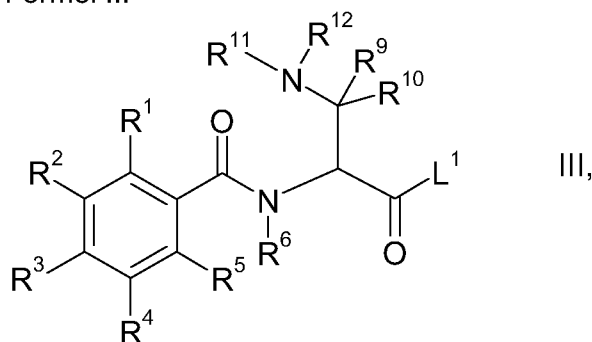
Die Reduktion der Nitro-Anilinderivate der Formel X erfolgt üblicherweise bei einer Temperatur von -100°C bis zum Siedepunkt der Reaktionsmischung, bevorzugt -80°C

bis 20°C, in einem inerten organischen Lösungsmittel mit einem Reduktionsmittel. (vgl. Vicky A. Burgess et al., Aust. J. of Chem. (1988), 41(7), 1063-1070).

- 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 Methylchlorid, 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 Toluol, Methylchlorid oder tert. Butylmethylether.
- 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.

Benzoylderivate der Formel III



- wobei R¹ bis R⁶ sowie R⁹ bis R¹² 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 R¹ bis R⁶ sowie R⁹ bis R¹² der Formel I.

- Besonders bevorzugt werden Benzoylderivate der Formel III, in der
- R¹ Fluor, Chlor oder CF₃;
- R² und R³ unabhängig voneinander Wasserstoff, Fluor oder Chlor;

- R⁴, R⁵ und R⁶ Wasserstoff;
 R⁹ Wasserstoff;
 R¹⁰ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₁-C₆-Hydroxyalkyl, Hydroxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl oder Phenyl-C₁-C₄-hydroxyalkyl; und
 5 R¹¹ Wasserstoff, Formyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkylaminocarbonyl, Di-(C₁-C₄-Alkyl)-aminocarbonyl, Phenylaminocarbonyl, N-(C₁-C₄-alkyl)-N-(phenyl)-aminocarbonyl, SO₂CH₃, SO₂CF₃ oder SO₂(C₆H₅); und
 R¹² Wasserstoff;
 10 bedeuten.

Die folgenden Beispiele dienen der Erläuterung der Erfindung.

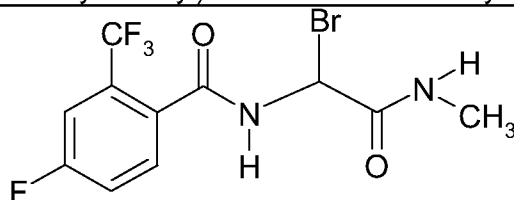
15

Herstellungsbeispiele

Beispiel 1

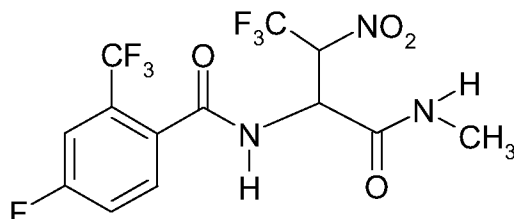
20 N-(2-Amino-3,3,3-trifluor-1-methylcarbamoyl-propyl)-4-fluor-2-trifluormethyl-benzamid
 (Nr. 3.4)

1.1) N-(Brom-methylcarbamoyl-methyl)-4-fluor-2-trifluormethyl-benzamid



- 25 Zu einer Suspension von 5 g (0.018 mol) 4-Fluor-N-methylcarbamoylmethyl-2-trifluormethyl-benzamid in 250 ml CCl₄ wurde unter Bestrahlung (250 W-Glühlampe) unter Rückfluss 2.6 g (0.016 mol) Brom zugetropft. Es wurde weitere 30 min unter Rückfluss belichtet, abgekühlt und das Lösungsmittel im Vakuum entfernt. Man erhielt die Titelverbindung (6.6 g Rohprodukt), die ohne weitere Reinigung auf der nächsten
 30 Stufe eingesetzt wurde.
¹H-NMR (CDCl₃): δ = 2.90 (d, 3H), 6.45 (m, 1H), 6.65 (d, 1H), 7.35 (m, 1H), 7.45 (m, 1H), 7.60 (m, 2H).

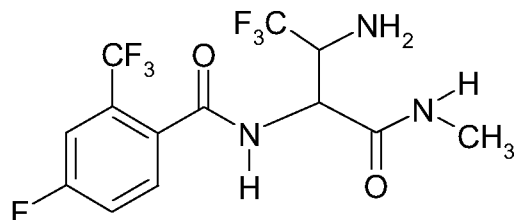
1.2) 4-Fluor-2-trifluormethyl-N-(3,3,3-trifluor-1-methylcarbamoyl-2-nitro-propyl)-benzamid



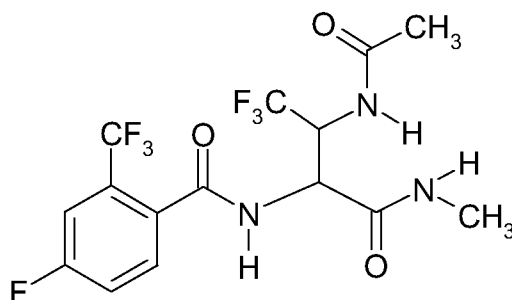
- 5 Bei $-78\text{ }^{\circ}\text{C}$ wurden 7.2 g (0.017 mol) n-Butyllithium (15 %ig in Hexan) zu einer Lösung von 2.2 g (0.017 mol) 1,1,1-Trifluor-2-nitroethan und 0.5 g (0.004 mol) DMPU in 50 ml THF getropft, und es wurde 30 min bei $0\text{ }^{\circ}\text{C}$ gerührt. Anschließend wurde bei $-78\text{ }^{\circ}\text{C}$ eine Lösung von 2 g (0.056 mol) N-(Brom-methylcarbamoyl-methyl)-4-fluor-2-trifluormethyl-benzamid in 5 ml THF zugetropft und noch weitere 4 h bei $-78\text{ }^{\circ}\text{C}$ gerührt.
- 10 Es wurde mit verd. HCl auf pH 1 gestellt und mit Ethylacetat extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden über Na_2SO_4 getrocknet, im Vakuum eingeeengt und an Kieselgel chromatographisch (Cyclohexan/Ethylacetat 4:1) gereinigt. Das Produkt wurde nochmals mit Diethylether verrührt, abfiltriert und getrocknet. Es wurden 0.45 g (20 % der Theorie) Titelverbindung (Diastereomerenverhältnis 1:1) als farbloser
- 15 Feststoff mit dem Fp. $224\text{ }^{\circ}\text{C}$ erhalten.
- $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , Diastereomerenverhältnis 1:1): $\delta = 2.75$ (d), 2.80 (d) [3H], 5.55 (dd), 5.65 (dd) [1H], 5.85 (m), 5.95 (m) [1H], 7.35 (m, 1H), 7.45 (m, 1H), 7.55 (m, 1H), 7.85 (m), 8.10 (m) [1H], 9.05 (d), 9.20 (d) [1H].

20

1.3) N-(2-Amino-3,3,3-trifluor-1-methylcarbamoyl-propyl)-4-fluor-2-trifluormethyl-benzamid (Nr. 3.4)



- Eine Lösung von 1.0 g (2.47 mmol) 4-Fluor-2-trifluormethyl-N-(3,3,3-trifluor-1-methylcarbamoyl-2-nitro-propyl)-benzamid in 70 ml Methanol wurde mit 1.0 g Raney-Nickel (feucht) versetzt und unter leichtem Wasserstoffüberdruck 16 h bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend wurde mit Stickstoff gespült, über Na_2SO_4 filtriert und das Lösungsmittel im Vakuum entfernt. Man erhielt 0.84 g (91 % der Theorie) Titelverbindung (Diastereomerenmischung) als farblosen Feststoff.
- 25
- 30 $^1\text{H-NMR}$ ($d_4\text{-MeOH}$, Diastereomerenmischung): $\delta = 2.80$ (d, 3H), 3.70 (m), 3.90 (m) [1H], 4.80 (d), 5.00 (d) [1H], 7.45 (m, 1H), 7.55 (m, 1H), 7.70 (m, 1H).

Beispiel 2N-(2-Acetylamino-3,3,3-trifluor-1-methylcarbamoyl-propyl)-4-fluor-2-trifluormethyl-benzamid (Nr. 3.6)

5

Zu einer Lösung von 120 mg (0.32 mmol) N-(2-Amino-3,3,3-trifluor-1-methylcarbamoyl-propyl)-4-fluor-2-trifluormethyl-benzamid in 5 ml CH₂Cl₂ wurden 49 mg (0.48 mmol) Triethylamin und 30 mg (0.38 mmol) Acetylchlorid gegeben, und es wurde 16 h bei Raumtemperatur gerührt. Das Reaktionsgemisch wurde mit verdünnter Salzsäure und gesättigter NaHCO₃-Lösung gewaschen, über Na₂SO₄ getrocknet und im Vakuum eingengt. Es wurden 50 mg (37 % der Theorie) Titelverbindung als farbloser Feststoff isoliert.

10

LC-MS (ESI): 440 [M + Na]⁺, 418 [M + H]⁺.

15

In den nachfolgenden Tabellen 2 und 3 werden neben den voranstehenden Verbindungen noch weitere Benzoylderivate der Formel III sowie benzoylsubstituierte Alanine der Formel I aufgeführt, die in analoger Weise nach den voranstehend beschriebenen Verfahren hergestellt wurden oder herstellbar sind.

20

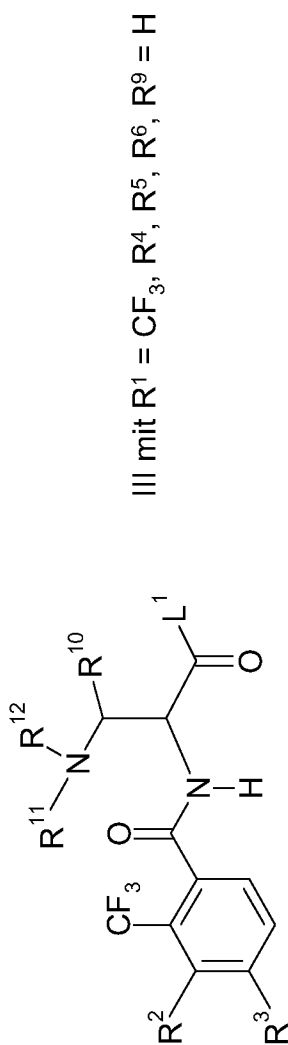
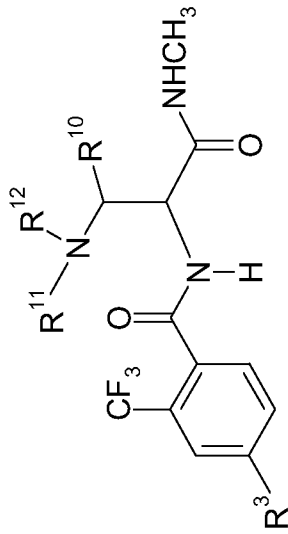


Tabelle 2

Nr.	R ²	R ³	R ¹⁰	R ¹¹	R ¹²	L ¹	Diastereomeren verhältnis	Chiralität	Fp. [°C]	M ⁺⁺ H (m/z)
2.1.	H	H	H	H	H	OH	-	2-S		277
2.2.	H	H	H	SO ₂ -2-Thienyl	H	OCH ₃	-	2-S		437
2.3.	F	H	H	H	H	OH	-	2-S		295
2.4.	H	F	H	H	H	OH	-	2-S		295
2.5.	H	F	H	C(O)NH(CH ₂ CH ₂ CH ₃)	H	OH	-	2-S		380



I mit $R^1 = CF_3$, $R^2, R^4, R^5, R^6, R^7, R^9 = H$;
 $R^8 = CH_3$

Tabelle 3

Nr.	R ³	R ¹⁰	R ¹¹	R ¹²	Diastereomeren- verhältnis	Chiralität	Fp. [°C]	M ⁺⁺ H (m/z)
3.1.	F	H	CH ₃	H	-	rac	172	
3.2.	F	H	C(O)OC(CH ₃) ₃	H	-	2-S	193	
3.3.	F	CH ₃	CH ₃	H	1:0	rac	137	
3.4.	F	CF ₃	H	H	1:1	rac		376
3.5.	F	CF ₃	CH ₃	H	4:1	rac	200	
3.6.	F	CF ₃	COCH ₃	H	1:1	rac		418
3.7.	F	CF ₃	COC(CH ₃) ₃	H	1:1	rac	244	
3.8.	F	CF ₃	CON(CH ₃) ₂	H	1:1	rac		447
3.9.	F	CF ₃	C(O)NHC(O)OCH ₂ CH ₃	H	1:1	rac		491
3.10.	F	CF ₃	C(O)NH(SO ₂)(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)	H	1:1	rac	210	
3.11.	F	C(O)NH(CH ₃)	CH ₃	H	1:1	rac		379
3.12.	F	CH ₂ OH	CH ₃	H	7:3	rac	141	
3.13.	F	CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	1:0	rac	191	
3.14.	F	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H	4:1	rac	190	
3.15.	F	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H	1:0	rac	111	
3.16.	F	CH ₂ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	2:1	rac		440

Nr.	R ³	R ¹⁰	R ¹¹	R ¹²	Diastereomeren- verhältnis	Chiralität	Fp. [°C]	M ⁺⁺ H (m/z)
3.17.	F	CH ₂ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	1:2	rac		440
3.18.	F	CH ₂ C ₆ H ₅	COCH ₃	CH ₃	4:1	rac	103	
3.19.	F	CH ₂ C ₆ H ₅	COC(CH ₃) ₃	CH ₃	4:1	rac		496
3.20.	F	CH ₂ C ₆ H ₅	CON(CH ₃) ₂	H	2:1	rac		469
3.21.	F	CH ₂ C ₆ H ₅	CON(CH ₃) ₂	CH ₃	4:1	rac		483
3.22.	F	CH ₂ C ₆ H ₅	SO ₂ CH ₃	H	2:1	rac		476
3.23.	F	CH ₂ C ₆ H ₅	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4:1	rac		490
3.24.	F	2-Cl-3-Pyridyl	CH ₃	H	1:1	rac	224	
3.25.	F	2-Cl-3-Pyridyl	COCH ₃	CH ₃	1:1	rac	226	
3.26.	F	2-Cl-3-Pyridyl	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1:1	rac		510
3.27.	F	2-OH-3-Indolyl	CH ₃	H	3:2	rac		453
3.28.	H	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H	1:1		149	
3.29.	H	CH ₂ C ₆ H ₅	COCH ₃	CH ₃	1:1	rac	193	
3.30.	H	CH ₂ C ₆ H ₅	COC(CH ₃) ₃	CH ₃	1:0	rac	183	
3.31.	H	CH ₂ C ₆ H ₅	COC(CH ₃) ₃	CH ₃	0:1	rac		478
3.32.	H	CH ₂ C ₆ H ₅	CON(CH ₃) ₂	CH ₃	1:1	rac	77	
3.33.	H	CH ₂ C ₆ H ₅	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1:1	rac	223	
3.34.	H	H	C(O)OC(CH ₃) ₃	H	-	2-S	196	
3.35.	H	H	C(O)-2-Thienyl	H	-	2-S		400
3.36.	H	H	H	H	-	2-S	154	
3.37.	H	H	C(S)NH(C ₂ H ₅)	H	-	2-S		377
3.38.	H	H	C(S)NH(CH ₂ CH=CH ₂)	H	-	2-S		389
3.39.	H	H	C(S)NH[CH ₂ CH(CH ₃) ₂]	H	-	2-S		405
3.40.	H	H	C(S)NH[C(CH ₃) ₃]	H	-			405
3.41.	H	H	C(O)NHCH(CH ₃) ₂	H	-	2-S		375

Nr.	R ³	R ¹⁰	R ¹¹	R ¹²	Diastereomeren- verhältnis	Chiralität	Fp. [°C]	M ⁺⁺ H (m/z)
3.42.	H	H	C(O)NH(CH ₂ CH ₂ CH ₃)	H	-	2-S		375
3.43.	H	H	C(S)NH ₂	H	-	2-S		349
3.44.	H	H	C(O)N(CH ₃) ₂	H	-	2-S	152	
3.45.	F	2-Cl-C ₆ H ₄	C(O)N(CH ₃) ₂	H	3:1	rac	187	491
3.46.	F	2-CH ₃ -3-F-C ₆ H ₃	C(O)N(CH ₃) ₂	H	2:1	rac	180	487

Biologische Wirksamkeit

Die benzoylsubstituierten Alanine der Formel I und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze eignen sich - sowohl als Isomeregemische 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.

10

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:

15

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.

20
25
30

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.

35

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.

40

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 bereitet 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 Fettalkoholglykoether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und seiner Derivate mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethyleno-
ctylphenolether, ethoxyliertes Isooctyl-, Octyl- oder Nonylphenol, Alkylphenyl-, Tributylphenylpolyglykoether, Alkylarylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylen- oder Polyoxypropylenalkylether, Laurylalkoholpolyglykoetheracetat, 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 Mineralölfraction 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 Wetto[®] 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 benzoylsubstituierten Alanine 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, Aminotriazole, Anilide, Aryloxy-/Heteroaryloxyalkansäuren und deren Derivate, Benzoesäure und deren Derivate, Benzothiadiazinone, 2-(Heteroaryl/Aroyl)-1,3-cyclohexandione, Heteroaryl-Aryl-Ketone, Benzylisoxazolidinone, meta-CF₃-Phenyl-derivate, Carbamate, Chinolincarbonsäure und deren Derivate, Chloracetanilide, Cyclohexenoximether-derivate, 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, Phenylelessigsäure und deren Derivate, 2-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 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 und Ölkonzentrate zugesetzt werden.

30

Anwendungsbeispiele

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

35

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

40

Bei Vorauflaufbehandlung wurden die in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffe direkt nach Einsaat mittels fein verteilender Düsen aufgebracht. Die Gefäße wurden leicht beregnet, um Keimung und Wachstum zu fördern, und anschließend mit durchsichtigen Plastikhauben abgedeckt, bis die Pflanzen angewachsen waren. Diese

Abdeckung bewirkt ein gleichmäßiges Keimen der Testpflanzen, sofern dies nicht durch die Wirkstoffe beeinträchtigt wurde.

5 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 0,5 bzw. 1,0 kg/ha a.S. (aktive Substanz).

15 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.

20 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.

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

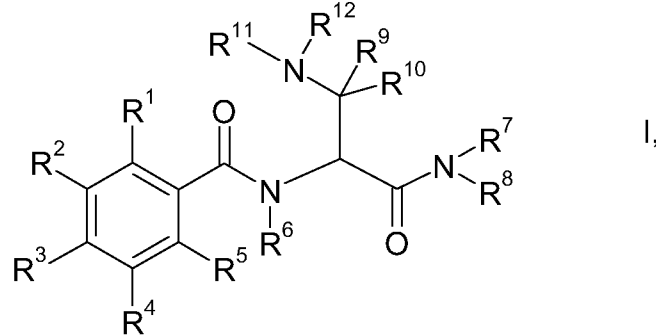
Lateinischer Name	Deutscher Name
Amaranthus retroflexus	Krummer Fuchsschwanz
Chenopodium album	Weißer Gänsefuß

25 Bei Aufwandmengen von 0,5 kg/ha zeigte die Verbindung 3.27 (Tabelle 3) im Nachauflauf eine sehr gute Wirkung gegen die unerwünschten Pflanzen *Amaranthus retroflexus* und *Chenopodium album*.

30 Weiterhin bekämpften Verbindungen 3.18, 3.20, 3.21, 3.22, 3.24, 3.25, 3.26, 3.32 und 3.44 (Tabelle 3) im Nachauflauf bei Aufwandmengen von 1,0 kg/ha die Schadpflanzen *Amaranthus retroflexus* und *Chenopodium album* sehr gut.

Patentansprüche:

1. Benzoylsubstituierte Alanine der Formel I



5

in der die Variablen die folgenden Bedeutungen haben:

R¹ Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl oder C₁-C₆-Halogenalkoxy;

10

R², R³, R⁴, R⁵ Wasserstoff, Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy oder C₁-C₆-Halogenalkoxy;

R⁶, R⁷ Wasserstoff, Hydroxy oder C₁-C₆-Alkoxy;

15

R⁸ C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Cyanoalkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl;

R⁹ Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl;

20

R¹⁰ 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-Alkylsulfonlamino, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonlamino, Aminocarbonylamino, (C₁-C₆-Alkylamino)carbonylamino, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonylamino, Aryl und Aryl(C₁-C₆-alkyl) tragen können;

30

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-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-Alkylamino-C₁-C₄-alkyl, Di(C₁-C₆-alkyl)amino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfonylamino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl(C₁-C₆-alkyl)amino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, Hydroxycarbonyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, Aminocarbonyl, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl, Formylamino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonylamino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, Hydroxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyloxy-C₁-C₄-alkyl, Aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonylamino-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)aminocarbonylamino]C₁-C₄-alkyl;
- 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, 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-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, (C₁-C₆-Alkylamino)carbonylamino, Di-

(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonylamino, Aryl und Aryl(C₁-C₆-alkyl) tragen können;

- 5 R¹¹ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Halogenalkenyl, C₃-C₆-Halogenalkynyl, Formyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkylcarbonyl, C₂-C₆-Alkenylcarbonyl, C₂-C₆-Alkynylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₃-C₆-Alkenyloxycarbonyl, C₃-C₆-Alkinyloxy-
- 10 Alkenylaminocarbonyl, C₃-C₆-Alkynylaminocarbonyl, C₁-C₆-Alkylsulfonylamino-carbonyl, 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, Di(C₁-C₆-alkyl)aminothiocarbonyl, (C₁-C₆-Alkyl)cycanoimino, (Amino)cycanoimino, [(C₁-C₆-Alkyl)amino]cycanoimino, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocycanoimino, C₁-C₆-Alkylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkoxyimino-C₁-C₆-alkyl, N-(C₁-C₆-Alkylamino)-imino-C₁-C₆-alkyl, N-[Di(C₁-C₆-alkyl)amino]imino-C₁-C₆-alkyl oder Tri-C₁-C₄-alkylsilyl,
- 20 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;
- 25 Phenyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl, Phenylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, Phenoxy-carbonyl, Phenylaminocarbonyl, Phenylsulfonylamino-carbonyl, N-(C₁-C₆-Alkyl)-N-(phenyl)aminocarbonyl, Phenyl-C₁-C₆-alkylcarbonyl,
- 30 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
- 35 SO₂R¹³;
- R¹² Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Halogenalkenyl, C₃-C₆-Halogenalkynyl, Hydroxy oder C₁-C₆-Alkoxy;
- 40 R¹³ C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl 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-Halogen-alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy;

sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze.

2. Benzoylsubstituierte Alanine der Formel I gemäß Anspruch 1, wobei R¹ für Halogen oder C₁-C₆-Halogenalkyl steht.
3. Benzoylsubstituierte Alanine der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, wobei R² und R³ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen oder C₁-C₆-Halogenalkyl stehen.
4. Benzoylsubstituierte Alanine der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 3, wobei R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁹ und R¹² für Wasserstoff stehen.
5. Benzoylsubstituierte Alanine der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4, wobei R¹⁰ für C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, 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, 3- bis 6-gliedriges Heterocyclyl,

wobei die voranstehen genannten Cycloalkyl, Cycloalkenyl oder 3- bis 6-gliedrigen Heterocyclylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder einen bis drei Rest aus der Gruppe Oxo, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, Hydroxycarbonyl und C₁-C₆-Alkoxycarbonyl 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-Alkoxycarbonyl, 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-alkyl, Di(C₁-C₆-Alkyl)carbonylamino-C₁-C₄-alkyl, [Di(C₁-C₆-alkylamino)carbonyloxy]C₁-C₄-alkyl, {Di[di(C₁-C₆-alkyl)amino]carbonyloxy}C₁-C₄-alkyl,

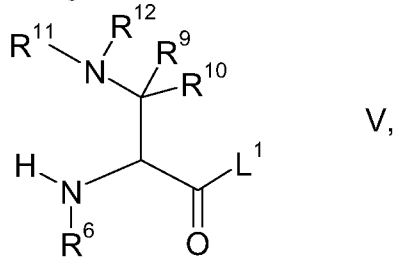
Phenyl-C₁-C₄-alkyl, Phenyl-C₂-C₄-alkenyl, Phenyl-C₂-C₄-alkinyl, Phenyl-C₁-C₄-halogenalkyl, Phenyl-C₂-C₄-halogenalkenyl, Phenyl-C₁-C₄-hydroxyalkyl, Phenyl-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, Phenylthio-C₁-C₄-alkyl, Phenylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl, Phenylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl,

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

wobei die vorstehend genannten Phenyl- und Heteroarylreste 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;

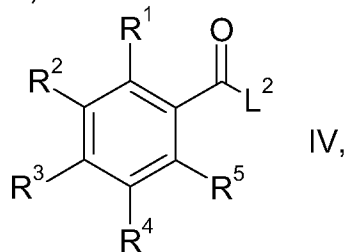
steht.

6. Verfahren zur Herstellung von benzoylsubstituierten Alaninen der Formel I gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet dass Alaninderivate der Formel V



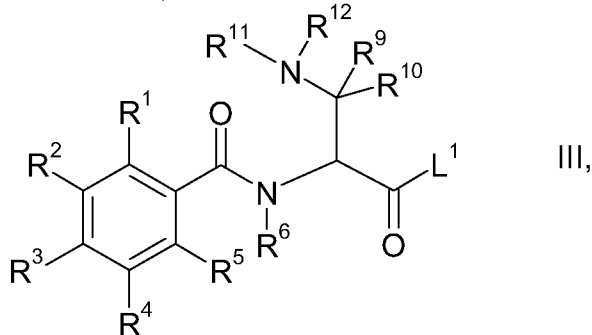
- 5 wobei R⁶, R⁹, R¹⁰, R¹¹ und R¹² die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben und L¹ für Hydroxy oder C₁-C₆-Alkoxy steht,

mit Benzoesäure(derivate)n der Formel IV



- 10 wobei R¹ bis R⁵ die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben und L² für Hydroxy, Halogen, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy carbonyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Phosphoryl oder Isoureyl steht,

zu entsprechenden Benzoylderivaten der Formel III



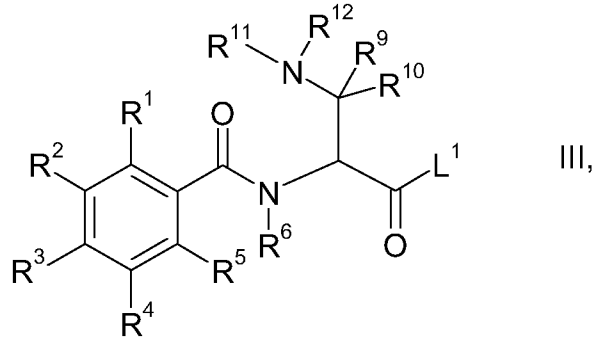
- 15 wobei R¹ bis R⁶ und R⁹ bis R¹² die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben und L¹ für Hydroxy oder C₁-C₆-Alkoxy steht,

- 20 und anschließend die erhaltenen Benzoylderivate der Formel III mit einem Amin der Formel II



wobei R⁷ und R⁸ die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben, umgesetzt werden.

7. Benzoylderivate der Formel III



wobei R¹ bis R⁶ und R⁹ bis R¹² die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben und L¹ für Hydroxy oder C₁-C₆-Alkoxy steht.

5

8. Mittel, enthaltend eine herbizid wirksame Menge mindestens eines benzoyl-substituierten Alanins der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 und für die Formulierung von Pflanzenschutzmitteln übliche Hilfsmittel.

10

9. Verfahren zur Herstellung von Mitteln gemäß Anspruch 8, dadurch gekennzeichnet, daß man eine herbizid wirksame Menge mindestens eines benzoyl-substituierten Alanins der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 und für die Formulierung von Pflanzenschutzmitteln übliche Hilfsmittel mischt.

15

10. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs, dadurch gekennzeichnet, daß man eine herbizid wirksame Menge mindestens eines benzoylsubstituierten Alanins der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 auf Pflanzen, deren Lebensraum und/oder auf Samen einwirken läßt.

20

11. Verwendung der benzoylsubstituierten Alanine der Formel I und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 als Herbizide.

25