

(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 2007/093529 A2

(51) Internationale Patentklassifikation:
Nicht klassifiziert

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

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2007/051144

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

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

(25) Einreichungssprache: Deutsch

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

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
06110017.8 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): **WITSCHEL, Matthias** [DE/DE]; Höhenweg 12b, 67098 Bad Dürkheim (DE). **ZAGAR, Cyrill** [DE/CN]; No. 1 Austin Road West, Kowloon, Hong Kong (CN). **HUPE, Eike** [DE/DE]; Bergstr. 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). **RACK, Michael** [DE/DE]; Hildastr. 11/1, 69214 Eppelheim (DE). **REINHARD, Robert** [DE/DE]; Berwartsteinstr. 6, 67117 Limburgerhof (DE). **SIEVERNICH, Bernd** [DE/DE];

(84) **Bestimmungsstaaten** (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, 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).

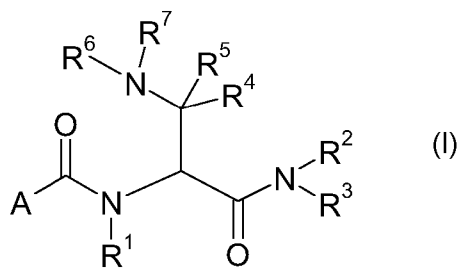
Veröffentlicht:

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

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

(54) **Title:** HETEROAROYL-SUBSTITUTED ALANINES

(54) **Bezeichnung:** HETEROAROYLSUBSTITUIERTE ALANINE



(57) **Abstract:** The present invention relates to heteroaroyl-substituted alanines of the formula I in which the variables A and R¹ to R⁷ 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 heteroaroylsubstituierte Alanine der Formel I in der die Variablen A sowie R¹ bis R⁷ 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

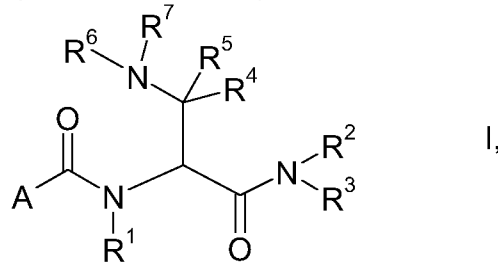
Verbindungen enthaltende Mittel zur Bekämpfung unerwünschter Pflanzen.

WO 2007/093529 A2

Heteroaroylsubstituierte Alanine

Beschreibung

- 5 Die vorliegende Erfindung betrifft heteroaroylsubstituierte Alanine der Formel I



in der die Variablen die folgenden Bedeutungen haben:

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

15

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

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

20

R⁴ Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl;

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

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

35

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

- C₆-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkenylthio-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkinylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl-C₁-C₄-thioalkyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl-C₁-C₄-thioalkyl, C₂-C₆-Halogenalkinyl-C₁-C₄-thioalkyl, C₁-C₆-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)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, 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;
- R⁶ 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-Cycloalkylcarbonyl, C₂-C₆-Alkenylcarbonyl, C₂-C₆-Alkinylcarbonyl, C₁-C₆-

Alkoxy-carbonyl, C₃-C₆-Alkenyloxycarbonyl, C₃-C₆-Alkinyloxycarbonyl, Aminocar-
 bonyl, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl, C₃-C₆-Alkenylaminocarbonyl, C₃-C₆-
 Alkinylaminocarbonyl, C₁-C₆-Alkylsulfonylaminocarbonyl, Di(C₁-C₆-
 alkyl)aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkenyl)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-
 Alkinyl)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, N-(C₁-C₆-Alkoxy)-N-(C₁-C₆-alkyl)-amino-
 carbonyl, N-(C₃-C₆-Alkenyl)-N-(C₁-C₆-alkoxy)-aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkinyl)-
 N-(C₁-C₆-alkoxy)-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,

wobei die genannten Alkyl-, Cycloalkyl- und Alkoxyreste partiell oder voll-
 ständig 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-alkoxycarbonylamino,
 C₁-C₄-Alkylcarbonyl, Hydroxycarbonyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, Aminocar-
 bonyl, C₁-C₄-Alkylaminocarbonyl, Di(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl oder C₁-
 C₄-Alkylcarbonyloxy;

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

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

SO₂R⁸;

R⁷ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkinyl, C₃-C₆-
 Halogenalkenyl, C₃-C₆-Halogenalkinyl, Hydroxy oder C₁-C₆-Alkoxy;

R⁸ 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-Halogenalkyl oder C₁-C₆-Alkoxy;

sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze.

40

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 Schädigpflanzenebekämpfung.

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

- 5 Weiterhin sind aus der Literatur (z.B. WO 05/061443 und WO 05/061464) benzoyl- sowie heteroaroyl-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.

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

- 15 Demgemäß wurden die heteroaroylsubstituierten 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 Diastereomerengemische 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, Diisopropylammonium, Tetramethylammonium, Tetrabutylammonium, 2-(2-Hydroxyeth-1-oxy)eth-1-ylammonium, Di-(2-hydroxyeth-1-yl)-ammonium, Trimethylbenzylammonium, des weiteren Phosphoniumionen, Sulfoniumionen, vorzugsweise
- 40

Tri(C₁-C₄-alkyl)sulfonium und Sulfoxoniumionen, vorzugsweise Tri(C₁-C₄alkyl)-sulfoxonium, in Betracht.

- Anionen von brauchbaren Säureadditionsalzen sind in erster Linie Chlorid, Bromid, Fluorid, Hydrogensulfat, Sulfat, Dihydrogenphosphat, Hydrogenphosphat, Nitrat, Hydrogencarbonat, Carbonat, Hexafluorosilikat, Hexafluorophosphat, Benzoat sowie die Anionen von C₁-C₄-Alkansäuren, vorzugsweise Formiat, Acetat, Propionat und Butyrat.
- Die für die Substituenten R¹-R¹² oder als Reste an Phenyl-, Aryl-, Heteroaryl- oder Hetrocyclyringen genannten organischen Molekülteile stellen Sammelbegriffe für individuelle Aufzählungen der einzelnen Gruppenmitglieder dar. Sämtliche Kohlenwasserstoffketten, also alle Alkyl-, Alkylsilyl-, Alkenyl-, Alkynyl-, Cyanoalkyl-, Halogenalkyl-, Halogenalkenyl-, Halogenalkinyl-, Alkoxy-, Halogenalkoxy-, Alkoxyalkyl-, Alkoxyalkoxyalkyl, Alkylcarbonyl-, Alkenylcarbonyl-, Alkynylcarbonyl-, Alkoxycarbonyl-, Alkenyloxy-carbonyl-, Alkynyloxy-carbonyl-, Alkylamino-, Alkylsulfonylamino-, Halogenalkylsulfonylamino-, Alkylalkoxycarbonylamino-, Alkylaminocarbonyl-, Alkenylaminocarbonyl-, Alkylaminocarbonyl-, Alkylsulfonylamino-carbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, N-Alkenyl-N-alkylaminocarbonyl-, N-Alkynyl-N-alkylamino-carbonyl-, N-Alkoxy-N-alkylamino-carbonyl-, N-Alkenyl-N-alkoxyaminocarbonyl-, N-Alkynyl-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)amino-carbonylamino]-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₆-Alkyl)cyanoimino, [(C₁-C₆-Alkyl)amino]cyanoimino, [Di(C₁-C₆-alkyl)amino]cyanoimino, 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-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-C₆-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkenylthio-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkynylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl-sulfinyl-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-Halogen-alkoxy-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)amino-carbonylamino]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, Heteroarylcarbonyloxy-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;
- C₁-C₆-Alkyl sowie die Alkylteile von C₁-C₆-Cyanoalkyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfonylamino, C₁-C₆-Alkylsulfonylamino-carbonyl, 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-carbonyl-C₁-C₆-alkyl und N-(C₁-C₆-Alkyl)-N-heterocyclylaminocarbonyl:
 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;
- C₁-C₄-Alkyl-carbonyl: z.B. Methyl-carbonyl, Ethyl-carbonyl, Propyl-carbonyl, 1-Methylethyl-carbonyl, Butyl-carbonyl, 1-Methylpropyl-carbonyl, 2-Methylpropyl-carbonyl oder 1,1-Dimethylethyl-carbonyl;
- C₁-C₆-Alkyl-carbonyl sowie die Alkyl-carbonylreste von C₁-C₆-Alkyl-carbonyl-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkyl-carbonyloxy-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkyl-carbonylamino-C₁-C₄-alkyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl-carbonyl und Heterocyclyl-C₁-C₆-alkyl-carbonyl, C₁-C₆-Alkyl-carbonyl-(C₁-C₆-alkylamino)-C₁-C₄-alkyl:
 C₁-C₄-Alkyl-carbonyl, wie voranstehend genannt, sowie z.B. Pentyl-carbonyl, 1-Methylbutyl-carbonyl, 2-Methylbutyl-carbonyl, 3-Methylbutyl-carbonyl, 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;
- 5
- 10 - C₃-C₆-Cycloalkyl sowie die Cycloalkylteile von C₃-C₆-Cycloalkylcarbonyl: monocyclischer, gesättigter Kohlenwasserstoff mit 3 bis 6 Ringgliedern, wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl;
- 15 - 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;
- 20 - C₃-C₆-Alkenyl sowie die Alkenylteile von C₃-C₆-Alkenyloxycarbonyl, C₃-C₆-Alkenylaminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkenyl)-N-(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl und N-(C₃-C₆-Alkenyl)-N-(C₁-C₆-alkoxy)aminocarbonyl: z.B. 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1-propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;
- 25
- 30
- 35
- 40 - C₂-C₆-Alkenyl sowie die Alkenylteile von C₂-C₆-Alkenylcarbonyl, C₂-C₆-Alkenyloxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkenylthio-C₁-C₄-alkyl, Phenyl-C₂-C₄-alkenyl, Heteroary-C₂-C₄-alkenyl: C₃-C₆-Alkenyl wie voranstehend genannt sowie Ethenyl;

- 5

10

15

20

25

30

35

40
- C₃-C₆-Alkinyll sowie die Alkinyllteile von C₃-C₆-Alkinyllloxycarbonyll, C₃-C₆-Alkinyllaminocarbonyll, N-(C₃-C₆-Alkinyll)-N-(C₁-C₆-alkylyl)-aminocarbonyll, N-(C₃-C₆-Alkinyll)-N-(C₁-C₆-alkoxyaminocarbonyll: z.B. 1-Propinyll, 2-Propinyll, 1-Butinyll, 2-Butinyll, 3-Butinyll, 1-Methyl-2-propinyll, 1-Pentyll, 2-Pentyll, 3-Pentyll, 4-Pentyll, 1-Methyl-2-butinyll, 1-Methyl-3-butinyll, 2-Methyl-3-butinyll, 3-Methyl-1-butinyll, 1,1-Dimethyl-2-propinyll, 1-Ethyl-2-propinyll, 1-Hexinyll, 2-Hexinyll, 3-Hexinyll, 4-Hexinyll, 5-Hexinyll, 1-Methyl-2-pentyll, 1-Methyl-3-pentyll, 1-Methyl-4-pentyll, 2-Methyl-3-pentyll, 2-Methyl-4-pentyll, 3-Methyl-1-pentyll, 3-Methyl-4-pentyll, 4-Methyl-1-pentyll, 4-Methyl-2-pentyll, 1,1-Dimethyl-2-butinyll, 1,1-Dimethyl-3-butinyll, 1,2-Dimethyl-3-butinyll, 2,2-Dimethyl-3-butinyll, 3,3-Dimethyl-1-butinyll, 1-Ethyl-2-butinyll, 1-Ethyl-3-butinyll, 2-Ethyl-3-butinyll und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyll;
- C₂-C₆-Alkinyll sowie die Alkinyllteile von C₂-C₆-Alkinyllcarbonyll, C₂-C₆-Alkinylloxy-C₁-C₄-alkylyl, C₂-C₆-Alkinyllthio-C₁-C₄-alkylyl, Phenyl-C₂-C₄-alkinyll, Heteroaryl-C₂-C₄-alkinyll: C₃-C₆-Alkinyll wie voranstehend genannt sowie Ethinyll;
- C₁-C₄-Cyanoalkylyl: z.B. Cyanomethyl, 1-Cyanoeth-1-yl, 2-Cyanoeth-1-yl, 1-Cyano-prop-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-methyl-prop-3-yl, 2-Cyano-2-methyl-prop-3-yl, 3-Cyano-2-methyl-prop-3-yl und 2-Cyano-methyl-prop-2-yl;
- C₁-C₄-Hydroxyalkylyl sowie die C₁-C₄-Hydroxyalkylyl-Teile von Phenyl-C₁-C₄-hydroxyalkylyl, Heteroaryl-C₁-C₄-hydroxyalkylyl: z.B. Hydroxymethyl, 1-Hydroxyeth-1-yl, 2-Hydroxyeth-1-yl, 1-Hydroxyprop-1-yl, 2-Hydroxyprop-1-yl, 3-Hydroxyprop-1-yl, 1-Hydroxyprop-2-yl, 2-Hydroxyprop-2-yl, 1-Hydroxybut-1-yl, 2-Hydroxybut-1-yl, 3-Hydroxybut-1-yl, 4-Hydroxybut-1-yl, 1-Hydroxybut-2-yl, 2-Hydroxybut-2-yl, 1-Hydroxybut-3-yl, 2-Hydroxybut-3-yl, 1-Hydroxy-2-methyl-prop-3-yl, 2-Hydroxy-2-methyl-prop-3-yl, 3-Hydroxy-2-methyl-prop-3-yl und 2-Hydroxymethyl-prop-2-yl, 1,2-Dihydroxyethyl, 1,2-Dihydroxyprop-3-yl, 2,3-Dihydroxyprop-3-yl, 1,2-Dihydroxyprop-2-yl, 1,2-Dihydroxybut-4-yl, 2,3-Dihydroxybut-4-yl, 3,4-Dihydroxybut-4-yl, 1,2-Dihydroxybut-2-yl, 1,2-Dihydroxybut-3-yl, 2,3-Dihydroxybut-3-yl, 1,2-Dihydroxy-2-methyl-prop-3-yl, 2,3-Dihydroxy-2-methyl-prop-3-yl;
- C₁-C₆-Hydroxyalkylyl: C₁-C₄-Hydroxyalkylyl wie voranstehend genannt, sowie z.B. 1-Hydroxy-pent-5-yl, 2-Hydroxy-pent-5-yl, 3-Hydroxy-pent-5-yl, 4-Hydroxy-pent-5-yl, 5-Hydroxy-pent-5-yl, 1-Hydroxypent-4-yl, 2-Hydroxypent-4-yl, 3-Hydroxypent-4-yl, 4-Hydroxypent-4-yl, 1-Hydroxy-pent-3-yl, 2-Hydroxy-pent-3-yl, 3-Hydroxy-pent-3-yl, 1-Hydroxy-2-methyl-but-3-yl, 2-Hydroxy-2-methyl-but-3-yl, 3-Hydroxy-2-methyl-but-3-yl, 1-Hydroxy-2-methyl-but-4-yl, 2-Hydroxy-2-methyl-but-4-yl, 3-Hydroxy-2-methyl-

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

Brompropyl, 3-Brompropyl, 3,3,3-Trifluorpropyl, 3,3,3-Trichlorpropyl, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropyl, Heptafluorpropyl, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethyl, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethyl, 1-(Brommethyl)-2-bromethyl, 4-Fluorbutyl, 4-Chlorbutyl, 4-Brombutyl, Nonafluorbutyl, 1,1,2,2-Tetrafluorethyl und 1-Trifluormethyl-1,2,2,2-tetrafluorethyl;

5

- 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

10

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;

15

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

20

25

- 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;

30

- 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;

35

- 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;

40

- 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;
- 5
- 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;
- 10
- 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;
- 15
- 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;
- 20
- C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl sowie die C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl-Teile von C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl: C₁-C₆-Alkylsulfinylrest wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Fluormethylsulfinyl, Difluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfinyl, Chlordifluormethylsulfinyl, Bromdifluormethylsulfinyl, 2-Fluorethylsulfinyl, 2-Chlorethylsulfinyl, 2-Bromethylsulfinyl, 2-Iodethylsulfinyl, 2,2-Difluorethylsulfinyl, 2,2,2-Trifluor-ethylsulfinyl, 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,
- 25
- 30
- 35
- 40

Nonafluorbutylsulfinyl, 5-Fluorpentylsulfinyl, 5-Chlorpentyl-sulfinyl, 5-Brompentylsulfinyl, 5-Iodpentylsulfinyl, Undecafluorpentylsulfinyl, 6-Fluorhexylsulfinyl, 6-Chlorhexylsulfinyl, 6-Bromhexylsulfinyl, 6-Iodhexylsulfinyl und Tridecafluorhexylsulfinyl;

5

- 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,

10

Butylsulfonyl, 1-Methylpropylsulfonyl, 2-Methyl-propylsulfonyl, 1,1-Dimethylethylsulfonyl, Pentylsulfonyl, 1-Methylbutylsulfonyl, 2-Methylbutylsulfonyl, 3-Methylbutylsulfonyl, 1,1-Dimethylpropylsulfonyl, 1,2-Di-methylpropylsulfonyl, 2,2-Dimethylpropylsulfonyl, 1-Ethylpropylsulfonyl, Hexylsulfonyl, 1-

15

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

- 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,

25

Difluormethylsulfonyl, Trifluormethylsulfonyl, Chlordifluormethylsulfonyl, Bromdifluormethylsulfonyl, 2-Fluorethylsulfonyl, 2-Chlorethylsulfonyl, 2-Bromethylsulfonyl, 2-Iodethylsulfonyl, 2,2-Difluorethyl-sulfonyl, 2,2,2-Trifluorethylsulfonyl, 2-Chlor-2-fluorethylsulfonyl, 2-Chlor-2,2-difluorethylsulfonyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethylsulfonyl, 2,2,2-Trichlorethylsulfonyl, Pentafluorethylsulfonyl,

30

2-Fluorpropylsulfonyl, 3-Fluorpropylsulfonyl, 2-Chlor-propylsulfonyl, 3-Chlorpropylsulfonyl, 2-Brompropylsulfonyl, 3-Brompropylsulfonyl, 2,2-Difluorpropylsulfonyl, 2,3-Difluorpropylsulfonyl, 2,3-Dichlorpropylsulfonyl, 3,3,3-Trifluorpropylsulfonyl, 3,3,3-Trichlorpropylsulfonyl, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropylsulfonyl, Heptafluorpropylsulfonyl, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethylsulfonyl, 1-

35

(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;

40

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;

- 5 - 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, 2-Methylbutoxy, 3-Methoxybutoxy, 1,1-Dimethyl-propoxy, 1,2-Dimethyl-propoxy, 10 2,2-Dimethylpropoxy, 1-Ethylpropoxy, Hexoxy, 1-Methylpentoxy, 2-Methylpentoxy, 3-Methylpentoxy, 4-Methylpentoxy, 1,1-Di-methylbutoxy, 1,2-Dimethyl-butoxy, 1,3-Dimethylbutoxy, 2,2-Dimethylbutoxy, 2,3-Dimethylbutoxy, 3,3-Dimethyl-butoxy, 1-Ethylbutoxy, 2-Ethylbutoxy, 1,1,2-Tri-methylpropoxy, 1,2,2-Trimethyl-propoxy, 1-Ethyl-1-methylpropoxy und 1-Ethyl-2-methylpropoxy;
- 15 - C₁-C₄-Halogenalkoxy: ein C₁-C₄-Alkoxyrest wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Fluormethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Bromdifluormethoxy, 2-Fluorethoxy, 2-Chlorethoxy, 2-Brommethoxy, 2-Iodethoxy, 2,2-Difluorethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-2-fluorethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy, 2,2-Dichlor-2-fluorethoxy, 2,2,2-Trichlorethoxy, Pentafluorethoxy, 2-Fluorpropoxy, 3-Fluorpropoxy, 2-Chlorpropoxy, 3-Chlorpropoxy, 2-Brompropoxy, 3-Brompropoxy, 2,2-Difluorpropoxy, 2,3-Difluorpropoxy, 2,3-Dichlorpropoxy, 3,3,3-Trifluorpropoxy, 3,3,3-Trichlorpropoxy, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropoxy, Heptafluorpropoxy, 1-25 (Fluormethyl)-2-fluorethoxy, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethoxy, 1-(Brommethyl)-2-bromethoxy, 4-Fluorbutoxy, 4-Chlorbutoxy, 4-Brombutoxy und Nonafluorbutoxy;
- C₁-C₆-Halogenalkoxy sowie die C₁-C₆-Halogenalkoxy-Teile von C₁-C₆-Halogenalkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl: C₁-C₄-30 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;
- C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl sowie die C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl-Teile von C₁-C₆-35 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, 2-40 (Methoxy)-propyl, 2-(Ethoxy)propyl, 2-(Propoxy)propyl, 2-(1-Methylethoxy)propyl, 2-(Butoxy)propyl, 2-(1-Methylpropoxy)propyl, 2-(2-Methylpropoxy)propyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy)propyl, 3-(Methoxy)propyl, 3-(Ethoxy)-propyl, 3-(Propoxy)propyl,

- 3-(1-Methylethoxy)-propyl, 3-(Butoxy)propyl, 3-(1-Methylpropoxy)propyl, 3-(2-Methylpropoxy)propyl, 3-(1,1-Dimethylethoxy)propyl, 2-(Methoxy)-butyl, 2-(Ethoxy)butyl, 2-(Propoxy)-butyl, 2-(1-Methylethoxy)butyl, 2-(Butoxy)butyl, 2-(1-Methylpropoxy)butyl, 2-(2-Methylpropoxy)butyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy)butyl, 3-(Methoxy)butyl, 3-(Ethoxy)-butyl, 3-(Propoxy)butyl, 3-(1-Methylethoxy)butyl, 3-(Butoxy)-butyl, 3-(1-Methylpropoxy)butyl, 3-(2-Methylpropoxy)butyl, 3-(1,1-Dimethylethoxy)butyl, 4-(Methoxy)-butyl, 4-(Ethoxy)butyl, 4-(Propoxy)butyl, 4-(1-Methylethoxy)butyl, 4-(Butoxy)butyl, 4-(1-Methylpropoxy)butyl, 4-(2-Methylpropoxy)butyl und 4-(1,1-Dimethylethoxy)-butyl;
- 10
- C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl sowie die Alkoxy-carbonylteile 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;
- 15
- C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl sowie die Alkoxy-carbonylteile 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;
- 20
- 25
- 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;
- 30
- 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;
- 35
- 40

- 5
- 10
- 15
- 20
- 25
- 30
- 35
- 40
- C₁-C₆-Alkylamino sowie die C₁-C₆-Alkylaminoreste 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;
 - 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-Dimethylethyl)-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;
 - 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;
 - (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-Methyl-

propylaminocarbonyl, 2-Methylpropylaminocarbonyl oder 1,1-Dimethylethylaminocarbonyl;

- 5 - 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;
- 10
- 15
- 20
- 25
- 30 - (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)amino-carbonylamino]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;
- 35
- 40
- 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-ethylbutyl)-aminocarbonyl, N-Methyl-N-(2-ethylbutyl)-aminocarbonyl, N-Methyl-N-(1,1,2-trimethylpropyl)-aminocarbonyl, N-Methyl-N-(1,2,2-trimethylpropyl)-aminocarbonyl, N-Methyl-N-(1-ethyl-1-methylpropyl)-aminocarbonyl, N-Methyl-N-(1-ethyl-2-methylpropyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-pentylaminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1-methylbutyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(2-methylbutyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(3-methylbutyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(2,2-dimethylpropyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1-ethylpropyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-hexylaminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1,1-dimethylpropyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1,2-dimethylpropyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1-methylpentyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(2-methylpentyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(3-methylpentyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(4-methylpentyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1,1-dimethylbutyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1,2-dimethylbutyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1,3-dimethylbutyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(2,2-dimethylbutyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(2,3-dimethylbutyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(3,3-dimethylbutyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1-ethylbutyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(2-ethylbutyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1,1,2-trimethylpropyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1,2,2-trimethylpropyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1-ethyl-1-methylpropyl)-aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1-ethyl-2-methylpropyl)-aminocarbonyl, N-Propyl-N-pentylaminocarbonyl, N-Butyl-N-pentylaminocarbonyl, N,N-Dipentylaminocarbonyl, N-Propyl-N-hexylaminocarbonyl, N-Butyl-N-hexylaminocarbonyl, N-Pentyl-N-hexylaminocarbonyl oder N,N-Dihexylaminocarbonyl;

- Di(C₁-C₆-alkyl)aminothiocarbonyl: z.B. N,N-Dimethylaminothiocarbonyl, N,N-Diethylaminothiocarbonyl, N,N-Di-(1-methylethyl)aminothiocarbonyl, N,N-Dipropylaminothiocarbonyl, N,N-Dibutylaminothiocarbonyl, N,N-Di-(1-methylpropyl)-aminothiocarbonyl, N,N-Di-(2-methylpropyl)-aminothiocarbonyl, N,N-Di-(1,1-dimethylethyl)-aminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-methylaminothiocarbonyl, N-Methyl-N-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)-aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(2-methylbutyl)-aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(3-methylbutyl)-aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(2,2-dimethylpropyl)-aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(1-ethylpropyl)-aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-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)-aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(1,1-dimethylbutyl)-aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(1,2-dimethylbutyl)-aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(1,3-dimethylbutyl)-aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(2,2-dimethylbutyl)-aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(2,3-dimethylbutyl)-aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(3,3-dimethylbutyl)-aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(1-ethylbutyl)-aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(2-ethylbutyl)-aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-ethyl-N-(1,1,2-trimethylpropyl)-aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(1,2,2-trimethylpropyl)-aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(1-ethyl-1-methylpropyl)-aminothiocarbonyl, N-Methyl-N-(1-ethyl-2-methylpropyl)-aminothiocarbonyl, N-Ethyl-N-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;
- 5
- 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.
- 10
- z.B. 2-Oxiranyl, 2-Oxetanyl, 3-Oxetanyl, 2-Aziridinyl, 3-Thiethanyl, 1-Azetidinyl, 2-Azetidinyl,
- 15
- z.B. 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isloxazolidinyl, 4-Isloxazolidinyl, 5-Isloxazolidinyl, 3-Isythiazolidinyl, 4-Isythiazolidinyl, 5-Isythiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl, 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 1,2,4-Oxadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Triazolidin-3-yl, 1,3,4-Oxadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Thiadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Triazolidin-2-yl, 1,2,3,4-Tetrazolidin-5-yl;
- 20
- z.B. 1-Pyrrolidinyl, 2-Isythiazolidinyl, 2-Isythiazolidinyl, 1-Pyrazolidinyl, 3-Oxazolidinyl, 3-Thiazolidinyl, 1-Imidazolidinyl, 1,2,4-Triazolidin-1-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-2-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-4-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-2-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-4-yl, 1,2,3,4-Tetrazolidin-1-yl,
- 25
- 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-
- 30
- 35
- 40

- Dihydropyrazol-5-yl, 2,3-Dihydroimidazol-2-yl, 2,3-Dihydroimidazol-3-yl, 2,3-Di-
 hydroimidazol-4-yl, 2,3-Dihydroimidazol-5-yl, 4,5-Dihydroimidazol-2-yl, 4,5-Di-
 hydroimidazol-4-yl, 4,5-Dihydroimidazol-5-yl, 2,5-Dihydroimidazol-2-yl, 2,5-Di-
 hydroimidazol-4-yl, 2,5-Dihydroimidazol-5-yl, 2,3-Dihydrooxazol-3-yl, 2,3-Dihydro-
 5 oxazol-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-Di-
 hydrothiazol-5-yl, 3,4-Dihydrothiazol-3-yl, 3,4-Dihydrothiazol-4-yl, 3,4-Dihydro-
 thiazol-5-yl, 3,4-Dihydrothiazol-2-yl, 3,4-Dihydrothiazol-3-yl, 3,4-Dihydrothiazol-4-yl,
- 10 z.B. 4,5-Dihydropyrrol-1-yl, 2,5-Dihydropyrrol-1-yl, 4,5-Dihydroisoxazol-2-yl, 2,3-
 Dihydroisoxazol-1-yl, 4,5-Dihydroisothiazol-1-yl, 2,3-Dihydroisothiazol-1-yl, 2,3-Di-
 hydropyrazol-1-yl, 4,5-Dihydropyrazol-1-yl, 3,4-Dihydropyrazol-1-yl, 2,3-Dihydro-
 imidazol-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;
- 15 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
- 20 Hexahydropyridazinyl, 4-Hexahydropyridazinyl, 2-Hexahydropyrimidinyl, 4-
 Hexahydropyrimidinyl, 5-Hexahydropyrimidinyl, 2-Piperazinyl, 1,3,5-Hexa-
 hydrotriazin-2-yl, 1,2,4-Hexahydrotriazin-3-yl, Tetrahydro-1,3-oxazin-2-yl, Tetra-
 hydro-1,3-oxazin-6-yl, 2-Morpholinyl, 3-Morpholinyl, 1,3,5-Trioxan-2-yl;
- 25 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;
- 30 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;
- 35 - Aryl sowie der Arylteil von Aryl(C₁-C₄-alkyl): ein- bis dreikerniger aromatischer Car-
 bicyclus mit 6 bis 14 Ringgliedern, wie z.B. Phenyl, Naphthyl und Anthracenyl;
- 40 - 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 :

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.

Monocyclen wie Furyl (z.B. 2-Furyl, 3-Furyl), Thienyl (z.B. 2-Thienyl, 3-Thienyl), Pyrrolyl (z.B. Pyrrol-2-yl, Pyrrol-3-yl), Pyrazolyl (z.B. Pyrazol-3-yl, Pyrazol-4-yl), Isoxazolyl (z.B. Isoxazol-3-yl, Isoxazol-4-yl, Isoxazol-5-yl), Isothiazolyl (z.B. Isothiazol-3-yl, Isothiazol-4-yl, Isothiazol-5-yl), Imidazolyl (z.B. Imidazol-2-yl, Imidazol-4-yl), Oxazolyl (z.B. Oxazol-2-yl, Oxazol-4-yl, Oxazol-5-yl), Thiazolyl (z.B. Thiazol-2-yl, Thiazol-4-yl, Thiazol-5-yl), Oxadiazolyl (z.B. 1,2,3-Oxadiazol-4-yl, 1,2,3-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl), Thiadiazolyl (z.B. 1,2,3-Thiadiazol-4-yl, 1,2,3-Thiadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,3,4-Thiadiazolyl-2-yl), Triazolyl (z.B. 1,2,3-Triazol-4-yl, 1,2,4-Triazol-3-yl), Tetrazol-5-yl, Pyridyl (z.B. Pyridin-2-yl, Pyridin-3-yl, Pyridin-4-yl), Pyrazinyl (z.B. Pyridazin-3-yl, Pyridazin-4-yl), Pyrimidinyl (z.B. Pyrimidin-2-yl, Pyrimidin-4-yl, Pyrimidin-5-yl), Pyrazin-2-yl, Triazinyl (z.B. 1,3,5-Triazin-2-yl, 1,2,4-Triazin-3-yl, 1,2,4-Triazin-5-yl, 1,2,4-Triazin-6-yl), Tetrazinyl (z.B. 1,2,4,5-Tetrazin-3-yl); sowie

Bicyclen wie die benzanellierte Derivate der vorgenannten Monocyclen, z.B. Chinoliny, Isochinoliny, Indolyl, Benzthienyl, Benzofuranyl, Benzoxazolyl, Benzthiazolyl, Benzisothiazolyl, Benzimidazolyl, Benzopyrazolyl, Benzthiadiazolyl, Benzotriazolyl.

5- oder 6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis vier Stickstoffatomen, oder ein bis drei Stickstoffatomen und einem Sauerstoff- oder Schwefelatom, oder mit einem Sauerstoff- oder Schwefelatom:

z.B. über ein C-Atom verknüpfte aromatische 5-Ring-Heterocyclen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome, oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom, oder ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 3-Isothiazolyl, 4-Isothiazolyl, 5-Isothiazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,4-Triazol-3-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,3,4-Thiadiazol-2-yl und 1,3,4-Triazol-2-yl;

z.B. über ein C-Atom verknüpfte aromatische 6-Ring Heterocyclen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier, vorzugsweise ein bis drei Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl und 1,2,4-Triazin-3-yl;

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

Bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der
A 5-gliedriges Heteroaryl mit ein bis vier Stickstoffatomen, oder ein bis drei Stick-
10 stoffatomen und einem Sauerstoff- oder Schwefelatom, oder mit einem Sauerstoff oder Schwefelatom;
besonders bevorzugt 5-gliedriges Heteroaryl ausgewählt aus der Gruppe Thienyl, Furyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Thiazolyl und Oxazolyl;
insbesondere bevorzugt 5-gliedriges Heteroaryl ausgewählt aus der Gruppe
15 Thienyl, Furyl, Pyrazolyl und Imidazolyl;
wobei die genannten Heteroarylreste durch einen C₁-C₆-Halogenalkyl-Rest, bevorzugt in 2-Position durch einen C₁-C₆-Halogenalkyl-Rest substituiert sind, und 1 bis 3 Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy und C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl tragen können;
20 bedeutet.

Ebenso bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der
A 5-gliedriges Heteroaryl mit ein bis vier Stickstoffatomen, oder ein bis drei Stick-
25 stoffatomen und einem Sauerstoff- oder Schwefelatom, oder mit einem Sauerstoff oder Schwefelatom;
besonders bevorzugt 5-gliedriges Heteroaryl ausgewählt aus der Gruppe Thienyl, Furyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Thiazolyl und Oxazolyl;
insbesondere bevorzugt 5-gliedriges Heteroaryl ausgewählt aus der Gruppe
30 Thienyl, Furyl, Pyrazolyl und Imidazolyl;
wobei die genannten Heteroarylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder 1 bis 3 Reste aus der Gruppe Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy und C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl tragen können;
35 bedeutet.

Ebenso bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der
A 5-gliedriges Heteroaryl mit ein bis vier Stickstoffatomen, oder ein bis drei Stick-
40 stoffatomen und einem Sauerstoff- oder Schwefelatom, oder mit einem Sauerstoffatom;
besonders bevorzugt 5-gliedriges Heteroaryl ausgewählt aus der Gruppe Furyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Thiazolyl und Oxazolyl;

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

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

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

- 10 A 6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis vier Stickstoffatomen;

besonders bevorzugt Pyridyl oder Pyrimidyl.

insbesondere bevorzugt Pyrimidyl;

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

bedeutet.

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

- 20 A 5- oder 6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis vier Stickstoffatomen, oder mit ein bis drei Stickstoffatomen und einem Sauerstoff- oder Schwefelatom, oder mit einem Sauerstoff- oder Schwefelatom, welches durch einen C₁-C₆-Halogenalkyl-Rest, bevorzugt in 2-Position durch einen C₁-C₆-Halogenalkyl-Rest, substituiert ist, und 1 bis 3 Reste aus der Gruppe Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy und C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl tragen kann;

25 bedeutet.

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

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

35

besonders bevorzugt 5- oder 6-gliedriges Heteroaryl ausgewählt aus der Gruppe Thienyl, Furyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Thiazolyl, Oxazolyl und Pyridyl;

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

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

5 wobei die genannten Heteroarylreste partiell halogeniert sein können und/oder 1 bis 2 Reste aus der Gruppe C₁-C₆-Alkyl und C₁-C₄-Halogenalkyl tragen können;

außerordentlich bevorzugt 5-gliedriges Heteroaryl ausgewählt aus der Gruppe Thienyl, Furyl, Pyrazolyl und Imidazolyl;

10 wobei die genannten Heteroarylreste partiell halogeniert sein können und/oder 1 bis 2 Reste aus der Gruppe C₁-C₆-Alkyl und C₁-C₄-Halogenalkyl tragen können.

bedeutet.

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

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

besonders bevorzugt 5- oder 6-gliedriges Heteroaryl ausgewählt aus der Gruppe Furyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Thiazolyl, Oxazolyl und Pyridyl;

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

insbesondere bevorzugt 5-gliedriges Heteroaryl ausgewählt aus der Gruppe Furyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Thiazolyl und Oxazolyl;

30 wobei die genannten Heteroarylreste partiell halogeniert sein können und/oder 1 bis 2 Reste aus der Gruppe C₁-C₆-Alkyl und C₁-C₄-Halogenalkyl tragen können;

außerordentlich bevorzugt 5-gliedriges Heteroaryl ausgewählt aus der Gruppe Furyl, Pyrazolyl und Imidazolyl;

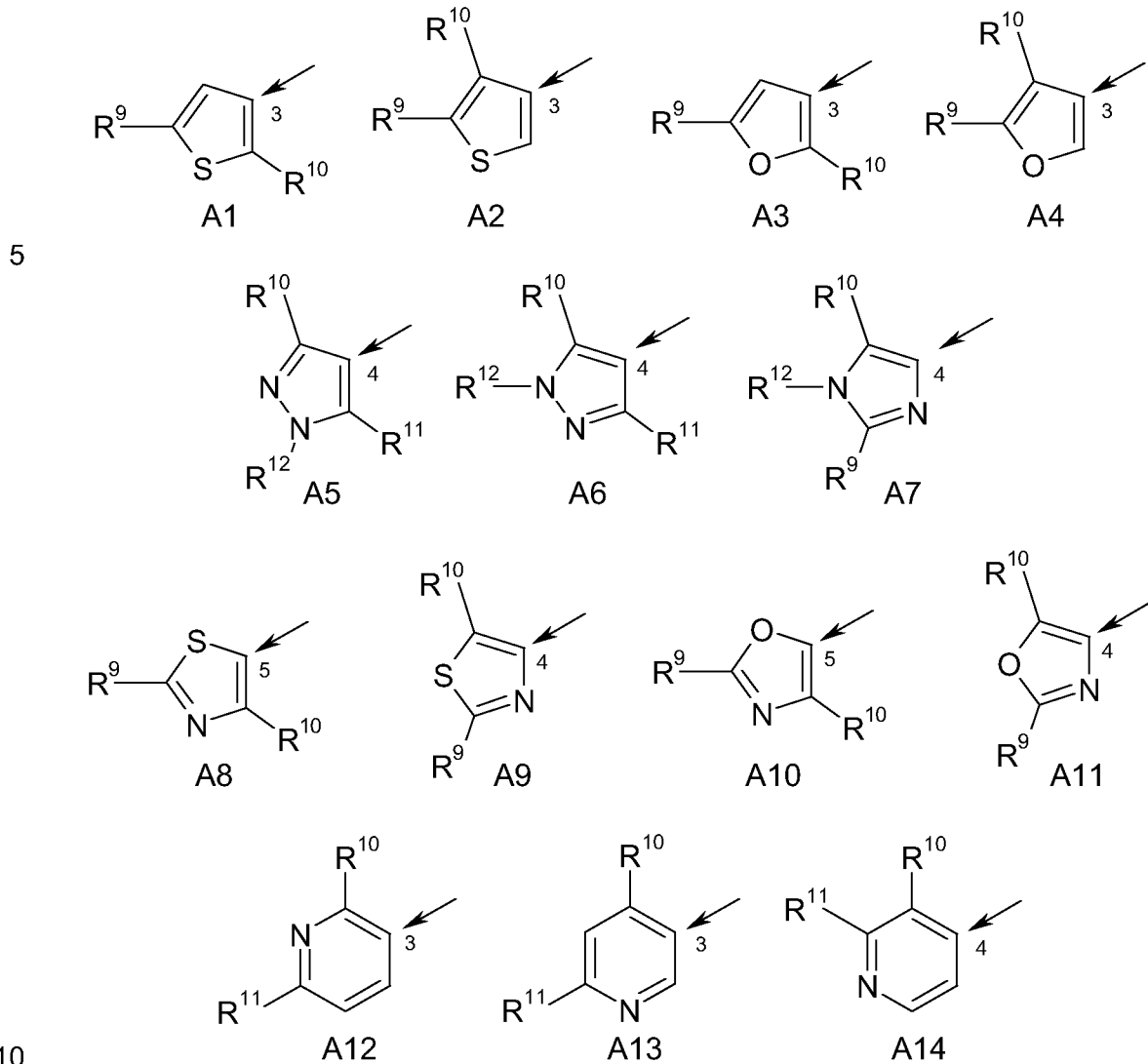
35 wobei die genannten Heteroarylreste partiell halogeniert sein können und/oder 1 bis 2 Reste aus der Gruppe C₁-C₆-Alkyl und C₁-C₄-Halogenalkyl tragen können;

bedeutet.

40

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

A C-verknüpftes 5-oder 6-gliedriges Heteroaryl ausgewählt aus der Gruppe A1 bis A14 mit



wobei der Pfeil die Verknüpfungposition anzeigt und

15 R⁹ Wasserstoff, Halogen, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl;
 besonders bevorzugt Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl;
 insbesondere bevorzugt Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;
 außerordentlich bevorzugt Wasserstoff;

20 R¹⁰ Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl oder C₁-C₆-Halogenalkoxy;
 besonders bevorzugt Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl;
 insbesondere bevorzugt Halogen oder C₁-C₆-Halogenalkyl;
 sehr bevorzugt C₁-C₆-Halogenalkyl;
 außerordentlich bevorzugt C₁-C₄-Halogenalkyl
 sehr außerordentlich bevorzugt CF₃;

25 R¹¹ Wasserstoff, Halogen, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl;

besonders bevorzugt Wasserstoff, Halogen oder C₁-C₄-Halogenalkyl;
insbesondere bevorzugt Wasserstoff oder Halogen;
außerordentlich bevorzugt Wasserstoff; und

- 5 R¹² Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl oder C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl;
besonders bevorzugt C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl
oder C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl;
insbesondere bevorzugt C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl;
10 außerordentlich bevorzugt C₁-C₄-Alkyl;
sehr außerordentlich bevorzugt CH₃;

bedeuten;

- 15 besonders bevorzugt A1, A2, A3, A4, A5, A6, A8 oder A9;
wobei R⁹ bis R¹² wie voranstehend genannt definiert werden;
außerordentlich bevorzugt A1, A2, A5 oder A6;
wobei R⁹ bis R¹² wie voranstehend genannt definiert werden;
20 bedeutet.

- Ebenso bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der
R¹ Wasserstoff;
25 bedeutet.

- Ebenso bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der
R² Wasserstoff oder Hydroxy;
besonders bevorzugt Wasserstoff;
30 bedeutet.

- Ebenso bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der
R¹ Wasserstoff; und
R² Wasserstoff oder Hydroxy;
35 besonders bevorzugt Wasserstoff;
bedeuten.

- Ebenso bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der
R³ C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl;
besonders bevorzugt C₁-C₆-Alkyl;
40 insbesondere bevorzugt C₁-C₄-Alkyl;
außerordentlich bevorzugt CH₃;
bedeutet.

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

R⁴ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;
bevorzugt Wasserstoff oder CH₃;
insbesondere bevorzugt Wasserstoff;

5 bedeutet.

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

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

wobei die voranstehen genannten Cycloalkyl, Cycloalkenyl oder 3- bis 6-
gliedrigen Heterocyclylreste partiell oder vollständig halogeniert sein kön-
15 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,
C₁-C₆-Alkoxycarbonyl-C₁-C₆-alkoxy, Amino, C₁-C₆-Alkylamino, Di(C₁-C₆-
alkyl)amino, C₁-C₆-Alkylsulfonylamino, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonylamino,
20 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,
C₂-C₆-Halogenalkinyloxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-
25 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-
30 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, Hydroxycar-
bonyl, 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-
35 Alkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy-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-
40 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, Phe-
nyl-C₁-C₄-hydroxyalkyl, Phenyl-C₂-C₄-hydroxyalkenyl, Phenyl-C₂-C₄-

- hydroxyalkinyl, Phenylcarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Phenylcarbonyloxy-C₁-C₄-alkyl, Phenylloxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Phenylthio-C₁-C₄-alkyl, Phenylsulfanyl-C₁-C₄-alkyl, Phenylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl,
- 5 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, Heteroarylsulfanyl-C₁-C₄-alkyl, Heteroarylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl,
- 10 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.
- 15
- 20 Ebenso bevorzugt sind die heteroaryl-substituierten Alanine der Formel I, in der
- R⁵ Wasserstoff, 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,
- 25 wobei die voranstehend 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-Alkoxy-carbonyl tragen können;
- 30 C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfonylamino-C₁-C₄-alkyl, Hydroxycarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl, Hydroxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy-carbonyl-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, Phenylsulfanyl-C₁-C₄-alkyl, Phenylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl;
- 35 Heteroaryl, Heteroaryl-C₁-C₄-alkyl, Heteroaryl-C₁-C₄-hydroxyalkyl, Heteroaryloxy-C₁-C₄-alkyl, Heteroarylthio-C₁-C₄-alkyl, Heteroarylsulfanyl-C₁-C₄-alkyl oder Heteroarylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl,
- 40

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

besonders bevorzugt Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, 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-Alkoxy-carbonyl-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-Alkinyl, Phenyl-C₁-C₄-halogenalkyl, Phenyl-C₂-C₄-halogenalkenyl, Phenyl-C₁-C₄-hydroxyalkyl, Phenyl-C₁-C₄-alkoxy, 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;

insbesondere bevorzugt Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₁-C₆-Hydroxyalkyl, Hydroxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl, [Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyloxy]C₁-C₄-alkyl, Formylamino-C₁-C₄-alkyl; Phenyl-C₁-C₄-alkyl, Phenyl-C₂-C₄-alkenyl, Phenyl-C₁-C₄-hydroxyalkyl oder Phenylthio-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;

bedeutet.

Ebenso bevorzugt sind die heteroaryl-substituierten Alanine der Formel I, in der R⁶ 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-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, C₁-C₆-Alkylsulfonylaminocarbonyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkenyl)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkinyl)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, N-(C₁-C₆-Alkoxy)-N-(C₁-C₆-alkyl)-amino-carbonyl, N-(C₃-C₆-

- Alkenyl)-N-(C₁-C₆-alkoxy)-aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkynyl)-N-(C₁-C₆-alkoxy)-aminocarbonyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminothiocarbonyl, (C₁-C₆-Alkyl)cianoimino, (Amino)cianoimino, [(C₁-C₆-Alkyl)amino]cianoimino, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocianoimino, 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 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-alkoxycarbonylamino, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, Hydroxycarbonyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, Aminocarbonyl, C₁-C₄-Alkylaminocarbonyl, Di(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl oder C₁-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 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
- SO₂R⁸.
- Ebenso bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der
- R⁶ 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, 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;
- Phenyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl, Phenylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, Phenylsulfonylaminocarbonyl oder Phenyl-C₁-C₆-alkylcarbonyl,
- wobei der Phenylring partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy; oder
- SO₂R⁸;

- 5 besonders bevorzugt Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkinyl, Formyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₂-C₆-Alkenylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, 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-Alkoxycarbonyl, C₁-C₄-Alkylaminocarbonyl, Di-(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonyl oder C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy;
- 10 Phenyl-C₁-C₆-alkyl, Phenylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, Phenylsulfonyl-aminocarbonyl oder Phenyl-C₁-C₆-alkylcarbonyl, wobei der Phenylring partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;
- 15 oder
SO₂R⁸;
- 20 insbesondere bevorzugt Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkinyl, 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, wobei der Phenylring partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Nitro, Cyano,
- 25 C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy; oder
SO₂R⁸;
- 30 bedeutet.
- 30 Ebenso bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der R⁶ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkinyl, Formyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₂-C₆-Alkenylcarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl, Di-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, N-(C₁-C₆-Alkoxy)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, Di-(C₁-C₆-alkyl)-
- 35 aminothiocarbonyl, C₁-C₆-Alkoxyimino-C₁-C₆-alkyl, 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
- 40 SO₂R⁸;
- bedeutet.

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

R⁶ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkynyl, Formyl, C₁-C₆-

Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl, Di-(C₁-C₆-alkyl)-

5 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 halo-

geniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen

können: Cyano, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylaminocarbonyl oder Di-(C₁-C₄-

10 alkyl)-aminocarbonyl;

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-

15 Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl; oder

SO₂R⁸;

besonders bevorzugt Wasserstoff, Formyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-

Alkylaminocarbonyl, Di-(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonyl, Phenylaminocarbonyl, N-

20 (C₁-C₄-Alkyl)-N-(phenyl)-aminocarbonyl, SO₂CH₃, SO₂CF₃ oder SO₂(C₆H₅);

bedeutet.

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

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

25 besonders bevorzugt Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl;

insbesondere bevorzugt Wasserstoff oder Methyl;

außerordentlich bevorzugt Wasserstoff;

bedeutet.

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

R⁸ C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl oder Phenyl,

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;

35 insbesondere bevorzugt Methyl, Trifluormethyl oder Phenyl.

bedeutet.

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

R⁸ C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl oder Phenyl,

40 wobei der Phenylrest partiell halogeniert sein kann und/oder durch C₁-C₄-

Alkyl substituiert sein kann;

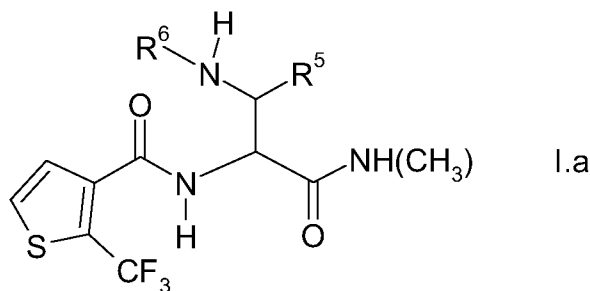
besonders bevorzugt C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder Phenyl;

insbesondere bevorzugt Methyl, Trifluormethyl oder Phenyl.

bedeutet.

- Besonders bevorzugt sind die heteroaroyl-substituierten Alanine der Formel I, in der
- 5 A 5- oder 6-gliedriges Heteroaryl ausgewählt aus der Gruppe Thienyl, Furyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Thiazolyl, Oxazolyl und Pyridyl; wobei die genannten Heteroarylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder 1 bis 3 Reste aus der Gruppe C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl und C₁-C₆-Halogenalkyl tragen können;
- 10 R¹ und R² Wasserstoff;
 R³ C₁-C₄-Alkyl, besonders bevorzugt CH₃;
 R⁴ Wasserstoff;
 R⁵ 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;
 15 R⁶ 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
 20 R⁷ Wasserstoff
 bedeuten.

- Außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.a (entspricht Formel I mit A = A-1 mit R⁹ = H, R¹⁰ = CF₃, R¹, R², R⁴ und R⁷ = H; R³ = CH₃), insbesondere die Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.210 der Tabelle 1, wobei die Definitionen der Variablen A und R¹ bis R⁷ nicht nur in Kombination miteinander, sondern auch jeweils für sich allein betrachtet für die erfindungsgemäßen Verbindungen eine besondere Rolle spielen.
- 25



30

Tabelle 1

Nr.	R ⁵	R ⁶
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

Nr.	R ⁵	R ⁶
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
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

Nr.	R ⁵	R ⁶
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
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

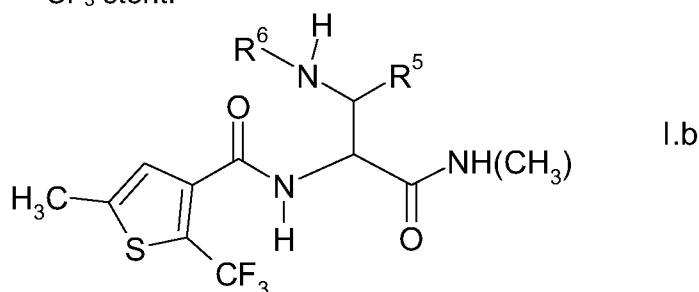
Nr.	R ⁵	R ⁶
I.a.86	Tetrahydropyran-2-yl	C(O)CH ₃
I.a.87	Tetrahydropyran-3-yl	C(O)CH ₃
I.a.88	Tetrahydropyran-4-yl	C(O)CH ₃
I.a.89	3,6-Dihydro-2H-pyran-4-yl	C(O)CH ₃
I.a.90	3,6-Dihydro-2H-pyran-5-yl	C(O)CH ₃
I.a.91	H	C(O)NH(CH ₃)
I.a.92	CH ₃	C(O)NH(CH ₃)
I.a.93	CH=CH ₂	C(O)NH(CH ₃)
I.a.94	CH=CH(CH ₃)	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)
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

Nr.	R ⁵	R ⁶
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
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

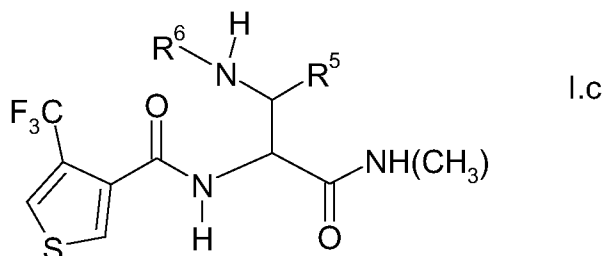
Nr.	R ⁵	R ⁶
I.a.166	CH(OH)CH ₂ OH	C(O)OCH ₃
I.a.167	CH ₂ NHC(O)H	C(O)OCH ₃
I.a.168	CH ₂ NHC(O)CH ₃	C(O)OCH ₃
I.a.169	Cyclopropyl	C(O)OCH ₃
I.a.170	Cyclopentyl	C(O)OCH ₃
I.a.171	Cyclohexyl	C(O)OCH ₃
I.a.172	Cyclopenten-2-yl	C(O)OCH ₃
I.a.173	Cyclohexen-2-yl	C(O)OCH ₃
I.a.174	Tetrahydrofur-2-yl	C(O)OCH 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
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

Nr.	R ⁵	R ⁶
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

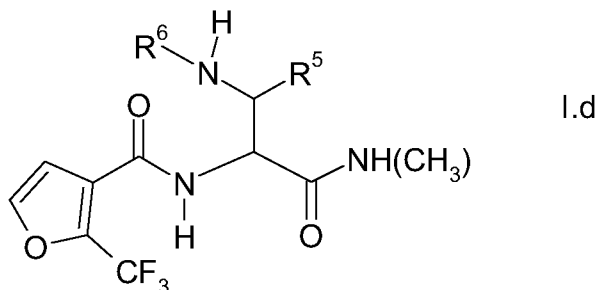
- Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.b, insbesondere die Verbindungen der Formel I.b.1 bis I.b.210, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.210 dadurch unterscheiden, daß A für A1 mit R⁹ = CH₃ und R¹⁰ = CF₃ steht:



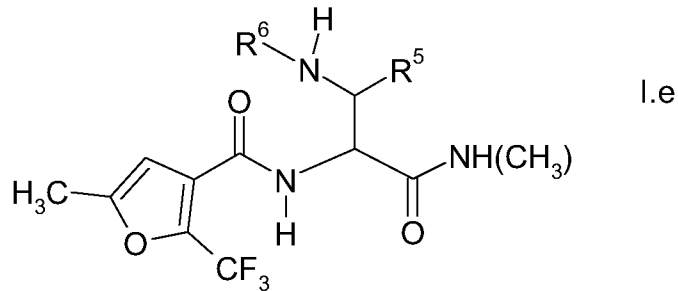
- Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.c, insbesondere die Verbindungen der Formel I.c.1 bis I.c.210, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.210 dadurch unterscheiden, daß A für A2 mit R⁹ = H und R¹⁰ = CF₃ steht:



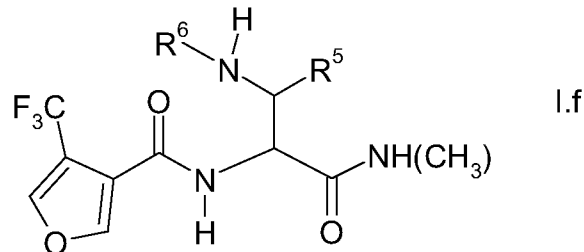
- Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.d, insbesondere die Verbindungen der Formel I.d.1 bis I.d.210, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.210 dadurch unterscheiden, daß A für A3 mit R⁹ = H und R¹⁰ = CF₃ steht:



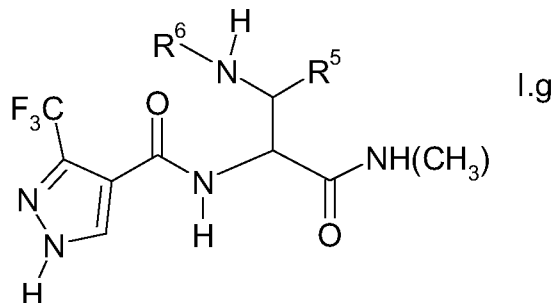
Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.e, insbesondere die Verbindungen der Formel I.e.1 bis I.e.210, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.210 dadurch unterscheiden, daß A für A3 mit $R^9 = \text{CH}_3$ und $R^{10} = \text{CF}_3$ steht:



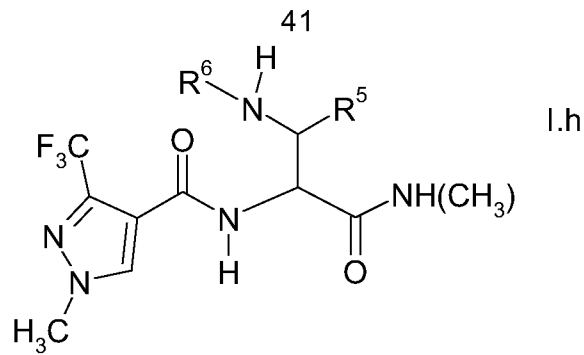
10 Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.f, insbesondere die Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.210, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.210 dadurch unterscheiden, daß A für A4 mit $R^9 = \text{H}$ und $R^{10} = \text{CF}_3$ steht:



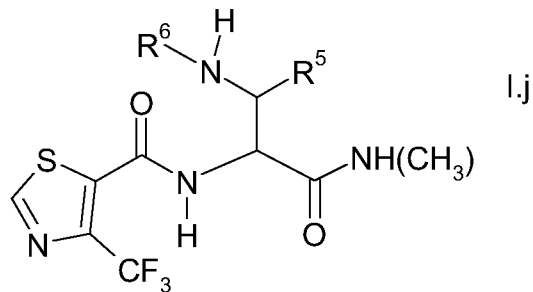
15 Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.g, insbesondere die Verbindungen der Formel I.g.1 bis I.g.210, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.210 dadurch unterscheiden, daß A für A5 mit $R^{10} = \text{CF}_3$, sowie R^{11} und $R^{12} = \text{H}$ steht:



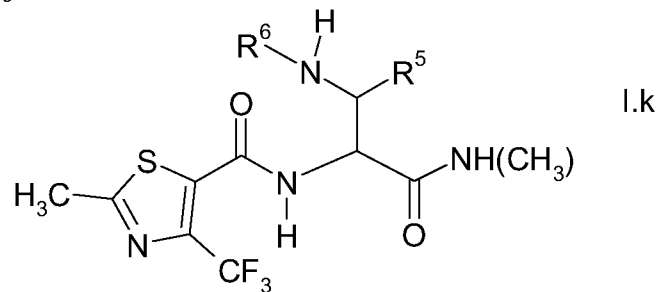
20 Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.h, insbesondere die Verbindungen der Formel I.h.1 bis I.h.210, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.210 dadurch unterscheiden, daß A für A5 mit $R^{10} = \text{CF}_3$, $R^{11} = \text{H}$ und $R^{12} = \text{CH}_3$ steht:



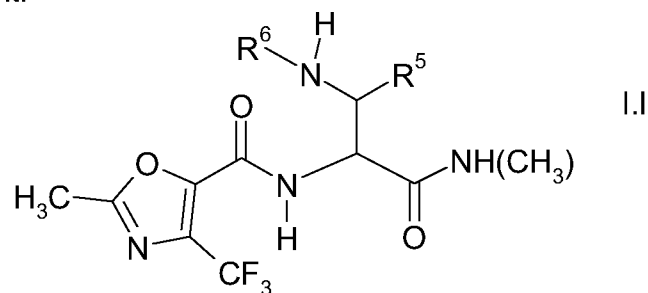
- 5 Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.j, insbesondere die Verbindungen der Formel I.j.1 bis I.j.210, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.210 dadurch unterscheiden, daß A für A8 mit $R^9 = H$ und $R^{10} = CF_3$ steht:



- 10 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 A für A8 mit $R^9 = CH_3$ und $R^{10} = CF_3$ steht:

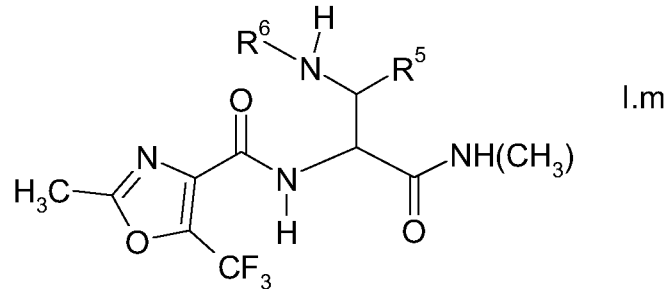


- 15 Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.l, insbesondere die Verbindungen der Formel I.l.1 bis I.l.210, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.210 dadurch unterscheiden, daß A für A10 mit $R^9 = CH_3$ und $R^{10} = CF_3$ steht:



Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.m, insbesondere die Verbindungen der Formel I.m.1 bis I.m.210, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.210 dadurch unterscheiden, daß A für A11 mit

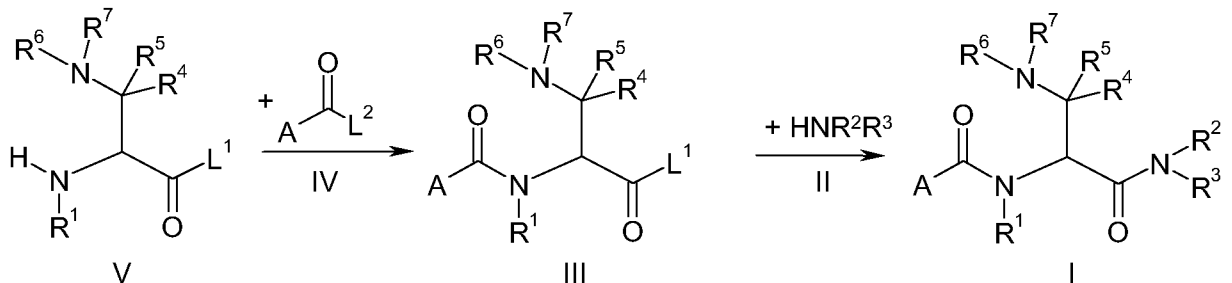
- 5 $R^9 = \text{CH}_3$ und $R^{10} = \text{CF}_3$ steht:



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



- 20 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 -Alkoxy-carbonyl, C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl, Phosphoryl oder Iso-
25 ureyl.

- Die Umsetzung der Alaninderivate der Formel V mit Heteroarylsäure(derivate)n der Formel IV, wobei L^2 für Hydroxy steht, zu Heteroarylderivaten der Formel III erfolgt in Gegenwart eines Aktivierungsreagenz und einer Base üblicherweise bei Temperaturen
30 von 0 °C bis zum Siedepunkt des Reaktionsgemisches, vorzugsweise 0°C bis 110°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; 5 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. 10 (1985), 50(15), 2654-2659].

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.

20

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

30

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, 40 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.

- 5 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.

15

Die Umsetzung der Alaninderivate der Formel V mit Heteroarylsäure(derivate)n der Formel IV, wobei L² für Halogen, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy carbonyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Phosphoryl oder Isoureyl steht, zu Heteroarylderivaten 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.-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.

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

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

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

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

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

Die für die Herstellung der Heteroaroylderivate der Formel III benötigten Alaninderivate der Formel V (z.B. mit $L^1 = \text{Hydroxy}$ oder $C_1\text{-}C_6\text{-Alkoxy}$) 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 [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.]

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
[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.*
5 (1997), 62(25), 8784-8789; Johan Legters et al., *Rec. des Trav. Chim. Pays-Bas*
(1992), 111(2), 59-68]
4. Addition von Nitroenolaten an Glycinimine und anschließende Reduktion:
[vgl. Nagatoshi Nishiwaki et al., *Angew. Chem., Int. Ed.* (2001), 40(16), 2992-2995;
10 Kristian Rahbek Knudsen et al., *J. of the Am. Chem. Soc.* (2001), 123(24), 5843-5844]
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;
15 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]
6. Oxidative Diaminierung von Acrylaten
[vgl. Guigen Li et al., *Tetrahedron Lett.* (2000), 41(45), 8699-8703]
20
7. Öffnung von Imidazolinen
[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.]
- 25 8. Addition eines N-Nucleophils an ein Aminoacrylat
[vgl. B. Narasimhulu Naidu et al., *J. of Org. Chem.* (2003), 68(26), 10098-10102;
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.]
30
- Die für die Herstellung der Heteroaroylderivate der Formel III benötigten Heteroaroyl-
säure(derivate) der Formel IV können käuflich erworben werden oder können analog
zu literaturbekannten Vorschrift hergestellt werden [z.B. Chang-Ling Liu et al., *J. of*
35 *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 a., *J. of Fluorine Chem.*
(1997), Vol. 1996-1997, 81(2), 123-128 ; Etsuji Okada et al., *Heterocycles* (1992),
34(4), 791-798; Aliyu B.Abubakar et al., *J. of Fluorine Chem.* (1991), 55(2), 189-198; J.
40 Leroy, *J of Fluorine Chem.* (1991), 53(1), 61-70; Len F. Lee et al., *J. of Heterocyclic*
Chem. (1990), 27(2), 243-245; Len F. Lee et al., *J. of Heterocyclic Chem.* (1985),
22(6), 1621-1630; Jacques Leroy et al., *Synthesis* (1982), (4), 313-315]

Die Umsetzung der Heteroaroylderivate der Formel III mit $L^1 =$ Hydroxy bzw. deren Salze mit Aminen der Formel II zu den gewünschten heteroaroyl-substituierten Alaninen der Formel I erfolgt in Gegenwart eines Aktivierungsreagenz 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)].

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.

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

Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

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

bevorzugt werden Natriumhydroxid, Triethylamin, Ethyldiisopropylamin, N-methylmorpholin und Pyridin.

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

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

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

Die Umsetzung der Heteroaroylderivate der Formel III mit $L^1 = C_1-C_6$ -Alkoxy mit Aminen der Formel II zu den gewünschten heteroaroyl-substituierten Alaninen der Formel I erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 0 °C bis zum Siedepunkt des Reaktionsgemisches, vorzugsweise 0°C bis 100°C, besonders bevorzugt bei Raumtemperatur in 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)].

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 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.

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 Alkalimetallhydrogencar-

bonate wie Natriumhydrogencarbonat, außerdem organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Diisopropylethylamin, N-Methylmorpholin, und N-Methylpiperidin, Pyridin, substituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders bevorzugt werden Natriumhydroxid, Triethylamin, Ethyldiisopropylamin, N-methylmorpholin und Pyridin.

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

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

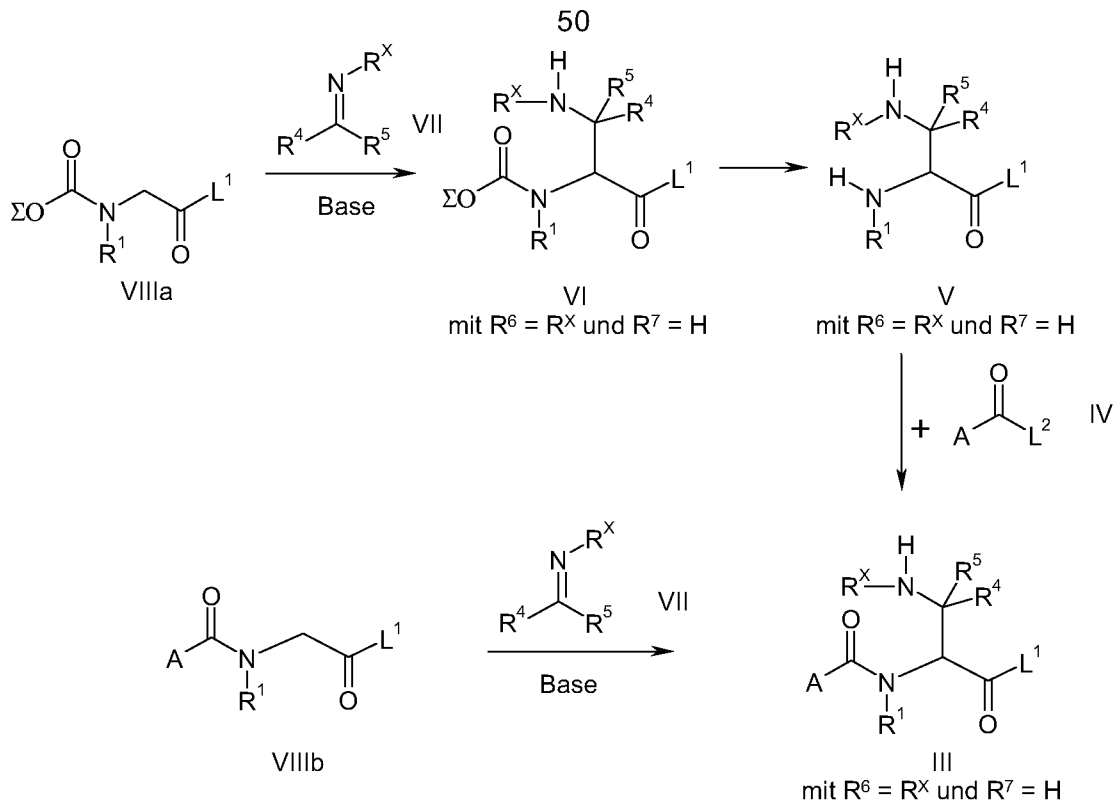
Die Aufarbeitung und Isolierung der Produkte kann in an sich bekannter Weise erfolgen.

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

Verfahren B

Heteroaroylderivate der Formel III mit $R^6 = R^X$ und $R^7 = \text{Wasserstoff}$ können auch erhalten werden, indem acylierte Glycin-Derivate der Formel VIII, wobei die Acylgruppe eine abspaltbare Schutzgruppe wie Benzyloxycarbonyl (vgl. VIIIa mit $\Sigma = \text{Benzyl}$) oder tert.-Butyloxycarbonyl (vgl. VIIIa mit $\Sigma = \text{tert-Butyl}$) sein kann, mit Iminverbindungen VII zu entsprechenden Aldolprodukten VI mit $R^6 = R^X$ und $R^7 = \text{Wasserstoff}$ kondensiert werden. Anschließend wird die Schutzgruppe abgespalten und das so entstandene Alaninderivat der Formel V mit $R^6 = R^X$ und $R^7 = \text{Wasserstoff}$ mit Heteroaroylsäure(derivate)n der Formel IV acyliert.

Analog kann auch ein acyliertes Glycin-Derivat der Formel VIII, wobei die Acylgruppe ein substituierter Heteroarolyrest (vgl. VIIIb) ist, unter Baseneinfluß mit einer Iminverbindung VII zum Heteroaroylderivat III mit $R^6 = R^X$ und $R^7 = \text{Wasserstoff}$ umgesetzt werden:



R^X steht für R^6 oder für eine abspaltbare Schutzgruppe wie $\text{C}_1\text{-C}_6$ -Alkyloxycarbonyl (z.B. tert.-Butyloxycarbonyl), $\text{C}_1\text{-C}_6$ -Alkylsulfinyl (z.B. tert.-Butylsulfinyl) oder gegebenenfalls durch $\text{C}_1\text{-C}_6$ -Alkyl substituiertes Arylsulfinyl (z.B. Toluylsulfinyl).

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

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

Die Umsetzung der Glycinderivate VIII mit Iminoverbindungen VII zum entsprechenden Aldolprodukt VI mit $\text{R}^6 = \text{R}^X$ und $\text{R}^7 = \text{Wasserstoff}$ bzw. Heteroaroylderivat III mit $\text{R}^6 = \text{R}^X$ und $\text{R}^7 = \text{Wasserstoff}$ 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. F. A. Davis, Organic letters (2004) 6 (16), 2789 - 2792].

20

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Gemische von $\text{C}_5\text{-C}_8$ -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.

25

Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

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

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

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

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

Die für die Herstellung der Heteroaroylderivate III mit $R^6 = R^X$ und $R^7 =$ Wasserstoff benötigten Glycinderivate der Formel VIII können käuflich erworben werden, sind in der Literatur bekannt [z. B. H. Pessoa-Mahana et al., Synth. Comm. 32, 1437 (2002)] oder können gemäß der zitierten Literatur hergestellt werden.

Die Abspaltung der Schutzgruppe Σ zu Alaninderivaten der Formel V mit $R^6 = R^X$ und $R^7 =$ 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.

Die Umsetzung der Alaninderivate V mit $R^6 = R^X$ und $R^7 =$ Wasserstoff mit Heteroarylsäure(derivate)n IV zu Heteroaroylderivaten III mit $R^6 = R^X$ und $R^7 =$ Wasserstoff erfolgt üblicherweise analog der unter Verfahren A genannten Umsetzung der Alaninderivate der Formel V mit Heteroarylsäure(derivate)n der Formel IV zu Heteroaroylderivaten III.

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 Σ = Benzyl durch Hydrogenolyse, bevorzugt durch Wasserstoff und Pd/C in Methanol; im Fall von Σ = tert.-Butyl durch Säure, bevorzugt Salzsäure in Dioxan.

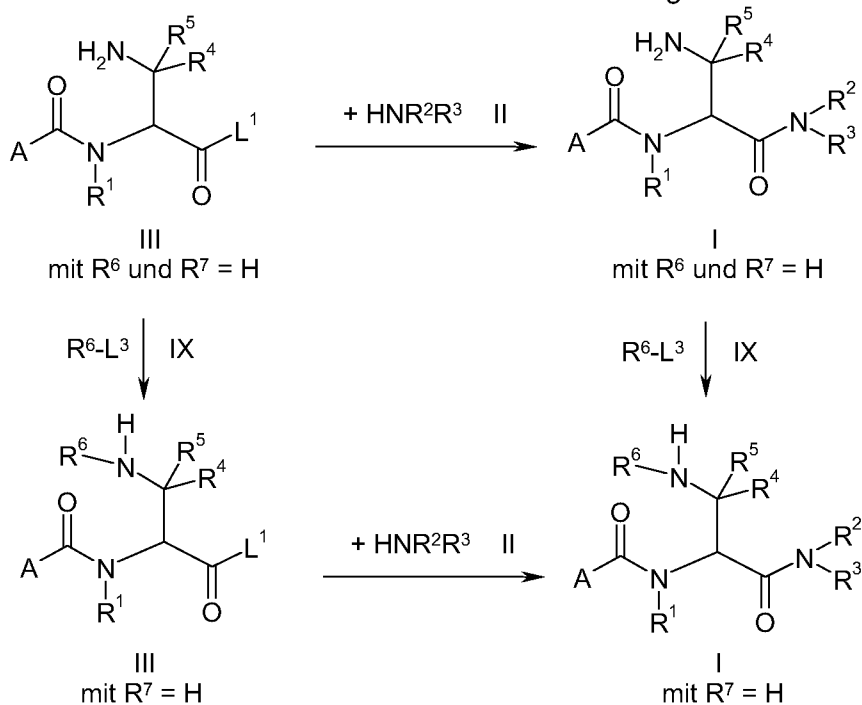
5

Die auf diesem Weg erhältlichen Heteroaroylderivate der Formel III mit R^6 und R^7 = Wasserstoff lassen sich mit Aminen der Formel II analog zu Verfahren A zu den gewünschten heteroaroyl-substituierten Alaninen der Formel I mit R^7 = Wasserstoff um-

10 setzen, welche dann mit Verbindungen der Formel IX zu heteroaroyl-substituierten Alaninen der Formel I 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)].

15 Ebenso können die Heteroaroylderivate der Formel III mit R^6 und R^7 = Wasserstoff zunächst mit Verbindungen der Formel IX zu weiteren Heteroaroylderivaten der Formel III mit R^7 = 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

20 analog zu Verfahren A mit Aminen der Formel II zu den gewünschten heteroaroyl-substituierten Alaninen der Formel I mit R^7 = Wasserstoff umgesetzt werden:



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

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

Die Umsetzung der Heteroaroylderivate der Formel III (mit R⁷ = Wasserstoff und gegebenenfalls mit R⁶ = Wasserstoff) mit Amininen der Formel II zu heteroaroyl-substituierten Alaninen der Formel I (mit R⁷ = Wasserstoff und gegebenenfalls mit R⁶ = Wasserstoff) erfolgt üblicherweise analog der unter Verfahren A geschilderten Umsetzung der Heteroaroylderivate der Formel III mit Amininen der Formel II.

Die Umsetzung der Heteroaroylderivate der Formel III mit R⁶ und R⁷ = Wasserstoff bzw. der heteroaroyl-substituierten Alaninen der Formel I mit R⁶ und R⁷ = Wasserstoff mit Verbindungen der Formel IX zu Heteroaroylderivaten der Formel III mit R⁷ = Wasserstoff bzw. heteroaroyl-substituierten Alaninen der Formel I mit R⁷ = Wasserstoff erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 0°C bis 100°C, vorzugsweise 10°C bis 50°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].

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 Methylolithium, Butyllithium und Phenyllithium, Alkylmagnesiumhalogenide wie Methylmagnesiumchlorid sowie Alkalimetall- und Erdalkalimetallalkoholate wie Natriummethanolat, Natriumethanolat, Kaliumethanolat, Kali-

um- 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

5 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.

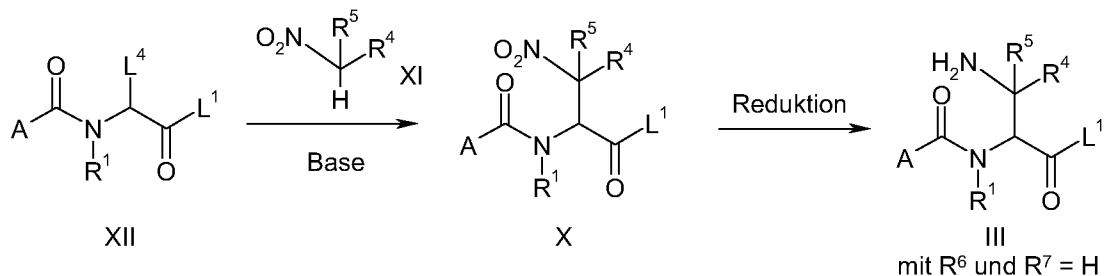
10

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.

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

20 Verfahren C

Heteroaroxyl-Derivate der Formel III mit R⁶ und R⁷ = 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:



25

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

30 L⁴ 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

35 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 C₅-C₈-Alkanen, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-

5 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.

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, Alkalimetallamide wie Lithiumamid, Natriumamid und Kaliumamid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate wie Lithiumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat sowie Alkalimetall-

15

20 hydrogencarbonate 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.

30 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 XI in einem Überschuß bezogen auf XII einzusetzen.

35

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

40

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.

5

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).

10

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

15

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, Methylenechlorid oder tert. Butylmethylether.

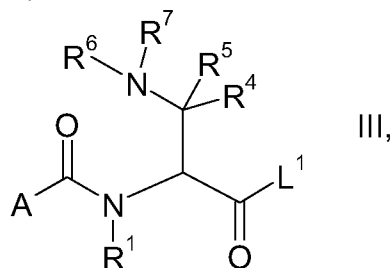
20

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

25

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

30 Heteroaroylderivate der Formel III



wobei A, R^1 sowie R^4 , R^5 , R^6 und R^7 die voranstehend genannten Bedeutungen haben und L^1 für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe, z.B. für Hydroxy oder C_1 - C_6 -

35

Alkoxy steht, sind ebenfalls ein Gegenstand der vorliegenden Erfindung.

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

Besonders bevorzugt werden Heteroaroylderivate der Formel III, in der

- 5 A 5- oder 6-gliedriges Heteroaryl ausgewählt aus der Gruppe Thienyl, Furyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Thiazolyl, Oxazolyl und Pyridyl; wobei die genannten Heteroarylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder 1 bis 3 Reste aus der Gruppe C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, und C₁-C₆-Halogenalkyl tragen können;
- 10 R¹ Wasserstoff;
 R⁴ Wasserstoff;
 R⁵ 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;
- 15 R⁶ 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
 R⁷ Wasserstoff;
- bedeuten.

20

Die folgenden Beispiele dienen der Erläuterung der Erfindung.

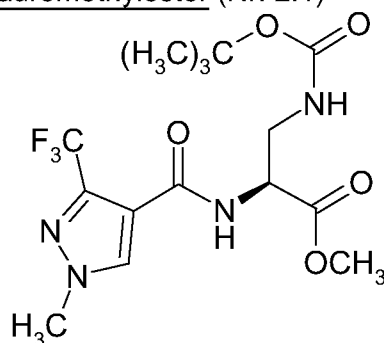
25 Herstellungsbeispiele

Beispiel 1

N-[(2S)-3-(Methylamino)-2-([1-methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-yl]carbonyl)-amino]-3-oxopropyl]-O-tert-butylcarbamate (Nr. 3.11)

30

1.1) (2S)-3-[(tert-Butoxycarbonyl)amino]-2-([1-methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-yl] carbonyl)amino)propionsäuremethylester (Nr. 2.1)



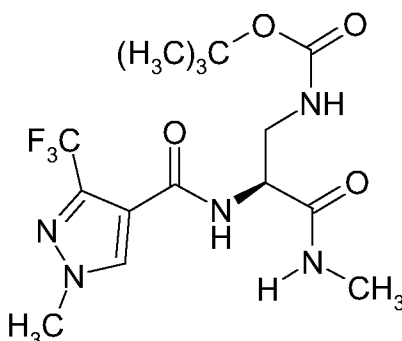
- 35 Zu einer Lösung von 14.7 g (57.8 mmol) (2S)-2-Amino-3-[(tert-butoxycarbonyl)amino]-propionsäuremethylester-Hydrochlorid und 9.9 g (125.3 mmol) Pyridin in Dichlor-

methan wurden 12.3 g (57.9 mmol) 1-Methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-carbonsäurechlorid bei einer Temperatur von 0 °C zugetropft. Das erhaltene Reaktionsgemisch wurde für weitere 16 Stunden bei Raumtemperatur gerührt und anschließend mit verdünnter Salzsäure (2 M) versetzt. Anschließend wurden die Phasen getrennt und die organische Phase mit Natriumcarbonatlösung gewaschen und getrocknet. Nach Entfernen des Lösungsmittels erhielt man 16.6 g der Titelverbindung als Feststoff, der ohne weitere Reinigung in die nachfolgende Reaktion eingesetzt wurde.

¹H-NMR (DMSO): δ = 1.35 (s, 9H); 3.25-3.45 (m, 2H); 3.60 (s, 3H); 3.95 (s, 3H); 4.45 (q, 1H); 6.95 (br t, 1H); 8.35-8.45 (m, 2H).

10

1.2) N-[(2S)-3-(Methylamino)-2-({[1-methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-yl]carbonyl})amino]-3-oxopropyl]-O-tert-butylcarbamate (Nr. 3.11)



15

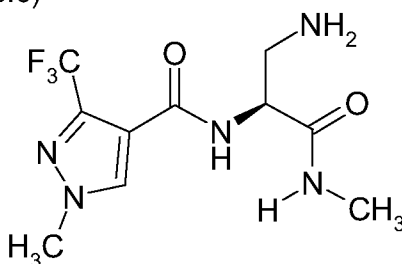
In eine Lösung von 16.6 g (42.1 mmol) (2S)-3-[(tert-Butoxycarbonyl)amino]-2-({[1-methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-yl]carbonyl})amino)propionsäuremethylester in Methanol wurde über eine Stunde Methylamin bei Raumtemperatur eingeleitet. Nach anschließender Entfernung des Lösungsmittels wurden 15.7 g der Titelverbindung in Form eines weißen Feststoffs erhalten, der ohne weitere Aufreinigung in Beispiel 2 eingesetzt wurde.

20

¹H-NMR (CDCl₃): δ = 1.40 (s, 9H); 2.80 (d, 3H); 3.50-3.65 (m, 2H); 3.95 (s, 3H); 4.60 (q, 1H); 5.40 (t, 1H); 7.10 (br s, 1H); 7.70 (d, 1H); 7.95 (s, 1H).

25 Beispiel 2

N-[(1S)-1-(Aminomethyl)-2-(methylamino)-2-oxoethyl]-1-methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-carboxamid (Nr. 3.6)



30

Zu einer Lösung von 15.7 g (39.9 mmol) N-[(2S)-3-(Methylamino)-2-({[1-methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-yl]carbonyl})amino]-3-oxopropyl]-O-tert-butylcarbamate in

1,4-Dioxan wurden 40 mL einer Lösung von Chlorwasserstoff in 1,4-Dioxan (4 M) zugetropft. Das Reaktionsgemisch wurde für weitere 16 Stunden bei Raumtemperatur gerührt und im Anschluss eingeeengt. Der Rückstand wurde in gesättigter Natriumcarbonat-Lösung aufgenommen und mit Essigsäureethylester versetzt. Nach Trocknen der organischen Phase über Natriumsulfat und Entfernen des Lösungsmittels erhielt man 7.6 g der Titelverbindung in Form eines weißen Feststoffs, der ohne weitere Auf-

5

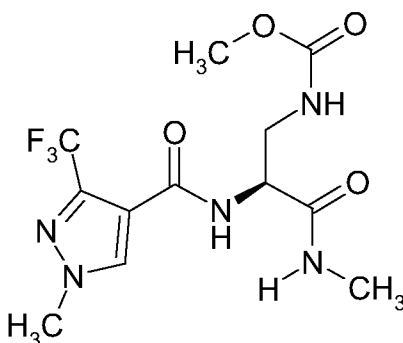
reinigung in Beispiel 3 eingesetzt wurde.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): δ = 2.75 (dd, 1H); 2.80 (d, 3H); 3.40 (dd, 1H); 3.95 (s, 3H); 4.40-4.50 (m, 1H); 7.40 (br s, 2H); 7.95 (s, 1H).

Beispiel 3

N-[(2S)-3-(Methylamino)-2-([1-methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-yl]carbonyl)-amino]-3-oxopropyl]-O-methylcarbammat (Nr. 3.10)

10



Eine Lösung von 0.80 g (2.73 mmol) N-[(1S)-1-(Aminomethyl)-2-(methylamino)-2-oxoethyl]-1-methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-carboxamid und 0.25 g (3.16 mmol) Pyridin in Dichlormethan wurde mit 0.25 g (2.65 mmol) Chlorameisensäuremethyl-ester versetzt. Das Reaktionsgemisch wurde über Nacht bei Raumtemperatur gerührt. Nach Abfiltrieren und Trocknen des ausgefallenen Niederschlags erhielt man 0.35 g der Titelverbindung in Form eines weißen Feststoffs.

20

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO): δ = 2.60 (d, 3H); 3.20-3.40 (m, 2H); 3.55 (s, 3H); 3.95 (s, 3H); 4.40 (q, 1H); 7.10 (t, 1H); 7.90 (br q, 1H); 8.15 (d, 1H); 8.40 (s, 1H).

25

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

30

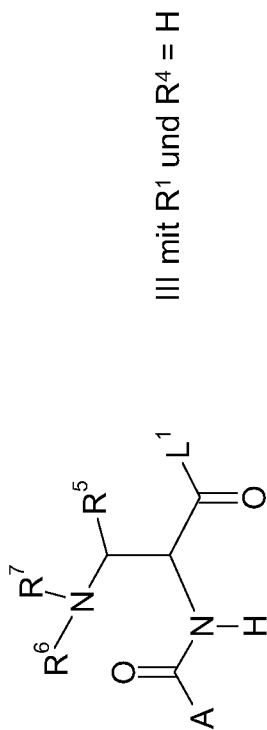


Tabelle 2

Nr.	A	R ⁵	R ⁶	R ⁷	L ¹	Diastereo- merenver- hältnis	Chiralität	¹ H-NMR (DMSO) δ =
2.1.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	H	C(O)OC(CH ₃) ₃	H	OCH ₃	-	2-S	vgl. Bsp. 1.1

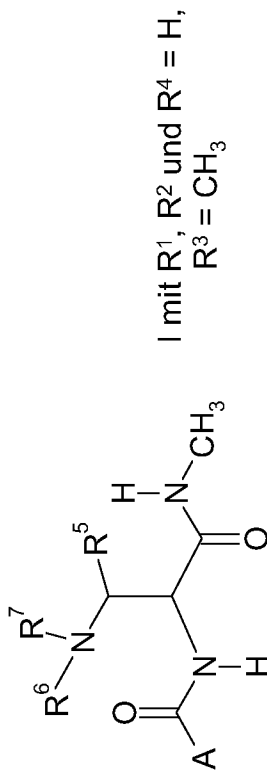


Tabelle 3

Nr.	A	R ⁵	R ⁶	R ⁷	Diastereo- merenver- hältnis	Chiralität	Fp.[°C]	M ⁺⁺ H (m/z)
3.1.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	CH ₂ (C ₆ H ₅)	H	CH ₃	3:1	rac	181	

Nr.	A	R ⁵	R ⁶	R ⁷	Diastereo- merenver- hälltnis	Chiralität	Fp.[°C]	M ⁺⁺ H (m/z)
3.2.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	CH ₂ (C ₆ H ₅)	COCH ₃	CH ₃	7:3	rac	204	
3.3.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	CH ₂ (C ₆ H ₅)	COC(CH ₃) ₃	CH ₃	7:3	rac	148	
3.4.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	CH ₂ (C ₆ H ₅)	CON(CH ₃) ₂	CH ₃	3:2	rac	216	
3.5.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	CH ₂ (C ₆ H ₅)	SO ₂ CH ₃	CH ₃	7:3	rac		476
3.6.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	H	H	H	-	2-S	127	
3.7.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	H	CH ₃	H	-	rac	150	
3.8.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	H	C(CH ₃)(CNCN)	H	-	2-S	121	
3.9.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	H	COCH ₃	H	-	2-S	241	
3.10.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	H	C(O)OCH ₃	H	-	2-S	205	
3.11.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	H	C(O)OC(CH ₃) ₃	H	-	2-S	78	
3.12.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	H	CON(CH ₃) ₂	H	-	2-S	121	
3.13.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	H	C(O)N(CH ₃)(C ₆ H ₅)	H	-	2-S	165	
3.14.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	H	CONH(CH ₃)	H	-	2-S	228	
3.15.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	H	SO ₂ CH ₃	H	-	2-S	160	
3.16.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	H	SO ₂ CF ₃	H	-	2-S	88	
3.17.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	4-Tetrahydropyrynyl	H	H	1:1	rac	170	
3.18.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	4-Hydroxymethyl-2-Furyl	CH ₃	H	1:1	rac		404
3.19.	3-CF ₃ -4-Thienyl	CH ₂ (C ₆ H ₅)	H	CH ₃	7:3	rac	150	
3.20.	3-CF ₃ -4-Thienyl	CH ₂ (C ₆ H ₅)	COCH ₃	CH ₃	4:1	rac	202	
3.21.	3-CF ₃ -4-Thienyl	CH ₂ (C ₆ H ₅)	COC(CH ₃) ₃	CH ₃	1:0	rac	211	
3.22.	3-CF ₃ -4-Thienyl	CH ₂ (C ₆ H ₅)	COC(CH ₃) ₃	CH ₃	0:1	rac	202	
3.23.	3-CF ₃ -4-Thienyl	CH ₂ (C ₆ H ₅)	CON(CH ₃) ₂	CH ₃	7:3	rac		471
3.24.	3-CF ₃ -4-Thienyl	CH ₂ (C ₆ H ₅)	SO ₂ CH ₃	CH ₃	7:3	rac	188	
3.25.	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	4-Pyrynyl	H	H	1:1	rac	170	378

Nr.	A	R ⁵	R ⁶	R ⁷	Diastereo merenver h�altnis	Chiralit�at	Fp.[�C]	M ⁺⁺ H (m/z)
3.26	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	4-Pyranyl	CON(CH ₃) ₂	H	7:6	rac	138	449
3.27	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	4-Pyranyl	CON(CH ₃) ₂	H	1:0	rac	188	449
3.28	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	4-Pyranyl	CON(CH ₃) ₂	H	1:1	rac	214	449
3.29	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	4-Pyranyl	CO(2-F-C ₆ H ₄)	H	8:1	rac	220	500
3.30	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	4-Pyranyl	COCH ₃	H	2:1	rac	175	420
3.31	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	3-Pyranyl	CON(CH ₃) ₂	H	1:1:1:1	rac	158	449
3.32	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	2-Cl-C ₆ H ₄	CON(CH ₃) ₂	H	3:2	rac	162	477
3.33	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	3-F-C ₆ H ₄	CON(CH ₃) ₂	H	3:1	rac	210	459
3.34	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	3-F-C ₆ H ₄	CO(2-F-C ₆ H ₄)	H	2:1	rac		510
3.35	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	2-CH ₃ -3-F-C ₆ H ₃	CON(CH ₃) ₂	H	1:0	rac	230	473
3.36	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	2-CH ₃ -3-F-C ₆ H ₃	CON(CH ₃) ₂	H	1:3	rac	211	473
3.37	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	3-Pyren-3-yl	CON(CH ₃) ₂	H	1:1	rac	174	447
3.38	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	2-Pyridyl	CON(CH ₃) ₂	H	1:1	rac	182	442
3.39	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	3-Pyridyl	CON(CH ₃) ₂	H	1:0	rac	212	442
3.40	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	Cyclopentyl	CON(CH ₃) ₂	H	1:0	rac	207	433
3.41	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	Cyclopropyl	CON(CH ₃) ₂	H	1:1	rac		405
3.42	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	CH(CH ₃)-O-CH ₂ -CH ₂ -O- CH ₃	CON(CH ₃) ₂	H	1:0:0:0	rac	185	467
3.43	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	CH(CH ₃)-O-CH ₂ -CH ₂ -O- CH ₃	CON(CH ₃) ₂	H	1:1	rac		467
3.44	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₃	CON(CH ₃) ₂	H	1:1	rac		423
3.45	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₃	CON(CH ₃) ₂	H	1:0	rac	170	423
3.46	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pyrazolyl	CH ₂ -O-CH ₂ -(C ₆ H ₅)	CON(CH ₃) ₂	H	1:1	rac		485

Biologische Wirksamkeit

Die heteroaroylsubstituierten 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, Polyoxyethylenoctylphenolether, 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 heteroaroylsubstituierten 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, Cyclohexenonoximetherderivate, Diazine, Dichlorpropionsäure und deren Derivate, Dihydrobenzofurane, Dihydrofuran-3-one, Dinitroaniline, Dinitrophenole, Diphenylether, Dipyridyle, Halogencarbonsäuren und deren Derivate, Harnstoffe, 3-Phenyluracile, Imidazole, Imidazolinone, N-Phenyl-3,4,5,6-tetrahydrophthalimide, Oxadiazole, Oxirane, Phenole, Aryloxy- und Heteroaryloxyphenoxypropionsäureester, Phenyllessigsäure und deren Derivate, 2-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.

Anwendungsbeispiele

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

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

Bei Voraufbehandlung 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.

Zum Zweck der Nachaufbehandlung 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 Nachaufbehandlung betrug 1,0 kg/ha a.S. (aktive Substanz).

- 5
- 10 Die Pflanzen wurden artenspezifisch bei Temperaturen von 10 bis 25°C bzw. 20 bis 35°C gehalten. Die Versuchsperiode erstreckte sich über 2 bis 4 Wochen. Während dieser Zeit wurden die Pflanzen gepflegt, und ihre Reaktion auf die einzelnen Behandlungen wurde ausgewertet.
- 15 Bewertet wurde nach einer Skala von 0 bis 100. Dabei bedeutet 100 kein Aufgang der Pflanzen bzw. völlige Zerstörung zumindest der oberirdischen Teile und 0 keine Schädigung oder normaler Wachstumsverlauf.

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

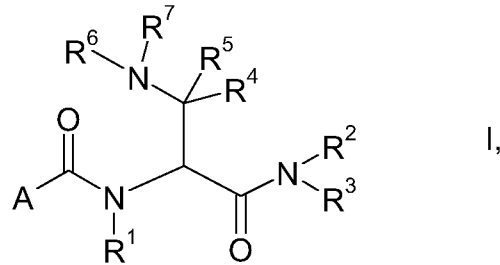
Lateinischer Name	Deutscher Name
<i>Amaranthus retroflexus</i>	Krummer Fuchsschwanz
<i>Chenopodium album</i>	Weißer Gänsefuß
<i>Setaria viridid</i>	Grüne Borstenhirse

Bei Aufwandmengen von 1,0 kg/ha zeigten die Verbindungen 3.4, 3.5, 3.9, 3.10, 3.12, 3.13 und 3.15 (Tabelle 3) im Nachauf eine sehr gute Wirkung gegen die unerwünschten Pflanzen Krummer Fuchsschwanz, Weißer Gänsefuß und Grüne Borstenhirse.

25

Patentansprüche:

1. Heteroaroylsubstituierte Alanine der Formel I



5

in der die Variablen die folgenden Bedeutungen haben:

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

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

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

R⁴ Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl;

20

R⁵ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-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-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, 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-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, (C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonyloxy-C₁-C₄-alkyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyloxy-C₁-C₄-alkyl, [(C₁-C₆-Alkyl)aminocarbonylamino]C₁-C₄-alkyl, [Di(C₁-C₆-alkyl)amino-carbonylamino]C₁-C₄-alkyl;
- Phenyl-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-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-Halogenalkyl-

sulfonylamino, (C₁-C₆-Alkylamino)carbonylamino, Di-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonylamino, Aryl und Aryl(C₁-C₆-alkyl) tragen können;

- 5 R⁶ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Halogenalkenyl, C₃-C₆-Halogenalkinyl, Formyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkylcarbonyl, C₂-C₆-Alkenylcarbonyl, C₂-C₆-Alkynylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₃-C₆-Alkenyloxycarbonyl, C₃-C₆-Alkinyloxycarbonyl, Aminocarbonyl, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl, C₃-C₆-Alkenylaminocarbonyl, C₃-C₆-Alkynylaminocarbonyl, C₁-C₆-Alkylsulfonylamino-
- 10 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-
- 15 carbonyl, N-(C₃-C₆-Alkenyl)-N-(C₁-C₆-alkoxy)-aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkynyl)-N-(C₁-C₆-alkoxy)-aminocarbonyl, Di(C₁-C₆-alkyl)amino-
- thiocarbonyl, (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,
- 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-
- 25 carbonylamino, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, Hydroxycarbonyl, C₁-C₄-Alkoxy-
- carbonyl, Aminocarbonyl, C₁-C₄-Alkylaminocarbonyl, Di(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl oder C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy;
- Phenyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl, Phenylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, Phenoxycarbonyl, Phenylaminocarbonyl, Phenylsulfonylamino-
- 30 carbonyl, N-(C₁-C₆-Alkyl)-N-(phenyl)aminocarbonyl, Phenyl-C₁-C₆-alkylcarbonyl,
- wobei der Phenylrest partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy; oder
- 35 SO₂R⁸;
- R⁷ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Halogenalkenyl, C₃-C₆-Halogenalkinyl, Hydroxy oder C₁-C₆-Alkoxy;
- 40 R⁸ C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl oder Phenyl,

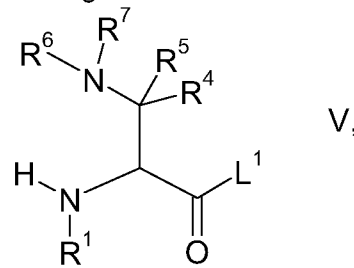
wobei der Phenylrest partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl oder C₁-C₆-Alkoxy;

- 5 sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze.
2. Heteroaroylsubstituierte Alanine der Formel I gemäß Anspruch 1 wobei A für 5- oder 6-gliedriges Heteroaryl ausgewählt aus der Gruppe Pyrrolyl, Thienyl, Furyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Thiazolyl, Oxazolyl, Tetrazolyl, Pyridyl und Pyrimidinyl; wobei die genannten Heteroarylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder 1 bis 3 Reste aus der Gruppe Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy und C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl tragen können,
- 10 steht.
- 15 3. Heteroaroylsubstituierte Alanine der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, wobei R¹, R², R⁴ und R⁷ für Wasserstoff stehen.
- 20 4. Heteroaroylsubstituierte Alanine der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 3, wobei R⁵ für C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₂-C₆-Halogenalkynyl, C₁-C₆-Cyanoalkyl, C₁-C₆-Hydroxyalkyl, C₂-C₆-Hydroxyalkenyl, C₂-C₆-Hydroxyalkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkenyl, 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 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,
- 30 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-alkyl, Phenylthio-C₁-C₄-alkyl, Phenylsulfinyl-C₁-C₄-alkyl, Phenylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl,
- 35 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,
- 40

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;

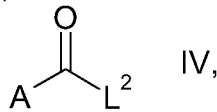
steht.

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



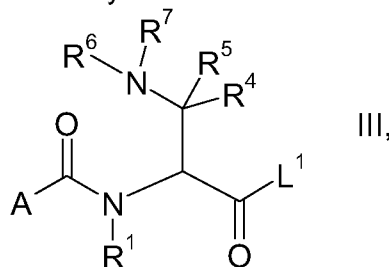
wobei R¹, R⁴, R⁵, R⁶ und R⁷ die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben und L¹ für Hydroxy oder C₁-C₆-Alkoxy steht,

- mit Heteroarylsäure(derivate)n der Formel IV



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

- zu entsprechenden Heteroarylderivaten der Formel III



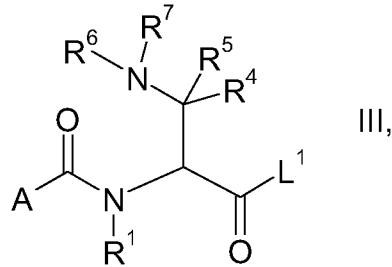
wobei A, R¹, R⁴, R⁵, R⁶ und R⁷ die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben und L¹ für Hydroxy oder C₁-C₆-Alkoxy steht,

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



wobei R² und R³ die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben, umgesetzt werden.

6. Heteroaroylderivate der Formel III



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

5

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

10

8. Verfahren zur Herstellung von Mitteln gemäß Anspruch 7, dadurch gekennzeichnet, daß man eine herbizid wirksame Menge mindestens eines heteroaroylsubstituierten Alanins der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4 und für die Formulierung von Pflanzenschutzmitteln übliche Hilfsmittel mischt.

15

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

20

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

25