

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 797 777**

51 Int. Cl.:

C07D 295/108 (2006.01)

C07C 43/307 (2006.01)

C07D 301/02 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **24.04.2017** **E 17167816 (2)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **08.04.2020** **EP 3395806**

54 Título: **Funcionalización oxidante simple de alquil aril cetonas**

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
03.12.2020

73 Titular/es:

IGM GROUP B.V. (100.0%)
Gompenstraat 49
5145 RM Waalwijk, NL

72 Inventor/es:

SOMMERLADE, REINHARD

74 Agente/Representante:

CARVAJAL Y URQUIJO, Isabel

ES 2 797 777 T3

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín Europeo de Patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre Concesión de Patentes Europeas).

DESCRIPCIÓN

Funcionalización oxidante simple de alquil aril cetonas

Campo de la invención

5 La presente invención se refiere a un procedimiento para hacer reaccionar una alquil aril cetona obteniendo de ese modo el correspondiente aril oxirano o alquil aril cetal α -funcionalizado.

Antecedentes de la invención

Los procedimientos de fotopolimerización han adquirido gran importancia en una gran cantidad de aplicaciones, por ejemplo, en recubrimientos de sobreimpresión, tintas de impresión, en la fabricación de placas de circuitos impresos electrónicos y placas de impresión, y en el recubrimiento de diversos sustratos, como madera, plásticos, papel, vidrio o metal, debido a sus enormes ventajas sobre los sistemas de endurecimiento convencionales. Una ventaja del fotocurado por irradiación UV en presencia de fotoiniciadores es la gran velocidad. Sin embargo, la velocidad depende en gran medida del fotoiniciador utilizado. Entre los fotoiniciadores más efectivos están las cetonas α -hidroxiladas como se describen, por ejemplo, en la patente alemana número 2,722,264 y en la solicitud de patente estadounidense US 4,740,624. Se describen métodos adicionales para la α -funcionalización de cetonas, por ejemplo, en Gary Jing Chuang y col., "A Dinuclear Palladium Catalyst for α -Hydroxylation of Carbonyls with O₂" [Catalizador de paladio dinuclear para α -hidroxilación de carbonilos con O₂], J. Am. Chem Soc. 133, 1760-1762 (2011). Chengqun Chen y col. "An Efficient Method for the Synthesis of α -Hydroxyalkyl Aryl Ketones" [Un método eficiente para la síntesis de α -hidroxialquil aril cetonas], Synthesis 2008, No. 20, 3205-3208; Marek Koprowski et al., "Asymmetric oxidation of enol phosphates to α -hydroxy ketones by (salen)manganese(III) complex; Effects of the substitution pattern of enol phosphates on the stereochemistry of oxygen transfer" [Oxidación asimétrica de enol fosfatos a α -hidroxicetonas por (salen)manganeso (III) complejo; Efectos del patrón de sustitución de los fosfatos de enol en la estereoquímica de la transferencia de oxígeno], Tetrahedron 62 12363-12374 (2006); Franklin A. Davis et al., "Oxidation of Silyl Enol Ethers Using 2-Sulfonyloxaziridines; Synthesis of α -Siloxy Epoxides and α -Hydroxy Carbonyl Compounds" [Oxidación de éteres de silil enol usando 2-sulfoniloxaziridinas; Síntesis de epóxidos de α -siloxi y compuestos de α -hidroxicarbonilo], J. Org. Chem 52, 954-955 (1987); Yu-Feng Liang et al., "Highly Efficient C-H Hydroxylation of Carbonyl Compounds with Oxygen under Mild Conditions" [Hidroxilación C-H altamente eficiente de compuestos de carbonilo con oxígeno en condiciones suaves], Angew. Chem 2014, 126, 558-562; Yu-Feng Liang et al., "I₂- or NBS-Catalyzed Highly Efficient α -Hydroxylation of Ketones with Dimethyl Sulfoxide" [α -Hidroxilación de cetonas altamente eficiente catalizada con I₂ o NBS de dimetilsulfóxido], Org. Lett. 17, 876-879 (2015); Bang-Chi Chen y col., " α -Hydroxylation of enolates and silyl enol ethers" [α -Hidroxilación de enolatos y silil enol éteres], Organic Reactions, vol. 62, 2003, publicado por John Wiley & Sons, Inc.

Sin embargo, los procedimientos utilizados para la preparación de cetonas α -hidroxiladas muestran una serie de desventajas. En particular, debe observarse que las cetonas α -hidroxiladas se preparan mediante reacciones complejas que dan como resultado una gran variedad de productos intermedios y subproductos no deseados que reducen el rendimiento y la pureza de la cetona α -hidroxilada deseada y que no tienen interés comercial. Además, a menudo se requieren pasos de purificación elaborados. En consecuencia, los procedimientos bien conocidos de la técnica anterior son bastante complejos y consumen mucho tiempo y productos químicos.

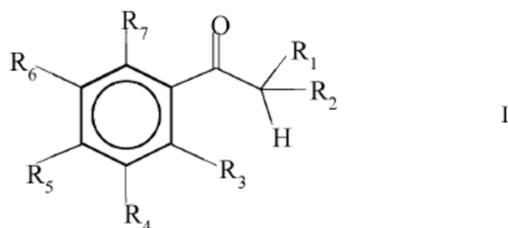
Por lo tanto, existe una necesidad continua en la técnica de proporcionar un procedimiento para la preparación de cetonas α -funcionalizadas que evite las desventajas anteriores. Además, es deseable proporcionar un procedimiento para la preparación de cetonas α -funcionalizadas que utilice materiales de partida baratos. Además, es deseable proporcionar un procedimiento para la preparación de cetonas α -funcionalizadas que evite pasos complejos de tratamiento y de purificación elaborados para obtener las cetonas α -funcionalizadas deseadas. Además de esto, es deseable proporcionar un procedimiento para la preparación de cetonas α -funcionalizadas que evite la formación de subproductos no deseados y, por lo tanto, aumente el rendimiento y la pureza de las cetonas α -funcionalizadas deseadas. Además, es deseable proporcionar un procedimiento que permita la preparación de productos intermedios definidos, tales como alquil aril cetales y/o aril oxiranos.

Por consiguiente, es un objeto de la presente invención proporcionar un procedimiento para la preparación de cetonas α -funcionalizadas. Es un objeto más de la presente invención proporcionar un procedimiento para la preparación de cetonas α -funcionalizadas usando materiales de partida baratos y sin tratamiento complejo o etapas de purificación elaboradas para obtener las cetonas α -funcionalizadas deseadas. Es un objeto más de la presente invención proporcionar un procedimiento para la preparación de cetonas α -funcionalizadas que aumente el rendimiento y la pureza de las cetonas α -funcionalizadas deseadas. Es otro objeto de la presente invención proporcionar un procedimiento que permita la preparación de productos intermedios definidos, tales como alquil aril cetales y/o aril oxiranos.

55 Resumen de la invención

El anterior objeto y otros es resuelto por la materia de estudio de la presente invención.

Según un primer aspecto de la presente invención, (se proporciona) un procedimiento para hacer reaccionar una alquil aril cetona de fórmula general I,



5 en donde R₁ y R₂ son iguales o diferentes y se seleccionan independientemente de H, alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, cicloalquilo de C₃-C₈, alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, cicloalqueno de C₅-C₈, alquilo de C₂-C₈ lineal o ramificado, arilo de C₆-C₁₄ o forman cicloalquilo de C₃-C₁₂ o cicloalqueno de C₅-C₁₂ junto con el átomo C de conexión;

10 R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son iguales o diferentes y se seleccionan independientemente de H, alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, alcoxi de C₁-C₈, alquenilo de C₂-C₈, cicloalquilo de C₃-C₈, arilo de C₆-C₁₄, cicloalcoxi de C₃-C₈, arilalcoxi de C₇-C₁₅, alquilarilalcoxi de C₉-C₁₅, N (R₈)₂ o SR₈ con R₈ seleccionado de alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, arilo de C₆-C₁₄, alcoxi de C₁-C₈, alquenilo de C₂-C₈, cicloalquilo de C₃-C₈, cicloalcoxi de C₃-C₈, arilalcoxi de C₇-C₁₅, alquilarilalcoxi de C₉-C₁₅, o R₈ forman un sistema alicíclico de C₃-C₉ junto con el átomo de N de conexión; opcionalmente uno o más átomos de carbono se reemplazan con O, o dos R adyacentes forman un sistema aromático junto con el anillo de benceno de fórmula I;

15 con un alcano de C₂-C₈ y/o alqueno de C₂-C₈ al menos parcialmente halogenado, y una base seleccionada de alcóxido de C₁-C₈ de metal alcalino, alcóxido de C₁-C₈ de metal alcalino y sus mezclas, obteniendo así el aril oxirano correspondiente o alquil aril cetal α-funcionalizado.

20 Los inventores descubrieron sorprendentemente que dicho procedimiento es adecuado para la preparación de cetonas α-funcionalizadas mediante el uso de materiales de partida baratos y que evita el tratamiento complejo y los pasos de purificación elaborados para obtener las cetonas α-funcionalizadas deseadas. El procedimiento aumenta así el rendimiento y la pureza de las cetonas α-funcionalizadas deseadas. Además, el procedimiento permite la preparación de productos intermedios definidos, es decir, aril oxiranos y alquil aril cetales α-funcionalizados, que son de interés comercial.

25 Formas ventajosas de realización del procedimiento de la invención se definen en las reivindicaciones dependientes correspondientes.

Según una forma de realización, R₁ y R₂ son iguales.

Según otra forma de realización, R₁ y R₂ se seleccionan de H y alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal.

30 Según otra forma de realización, R₁ y R₂ son diferentes y se seleccionan independientemente de H y alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal.

De acuerdo con una forma de realización, R₁ y R₂ forman cicloalquilo de C₄-C₁₀, preferiblemente cicloalquilo de C₄-C₈, y del modo más preferible cicloalquilo de C₆, junto con el átomo C de conexión.

35 Según otra forma de realización, R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son iguales.

Según otra forma de realización, R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ se seleccionan de H y alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal.

40 De acuerdo con una forma de realización, R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son diferentes y al menos uno de ellos se selecciona de alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, alcoxi de C₁-C₈, alquenilo de C₂-C₈, alquilarilalcoxi de C₉-C₁₅ o N (R₈)₂ o SR₈ donde R₈ se selecciona entre alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado o alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado o R₈ forman un sistema alicíclico de C₃-C₉ junto con el átomo de N de conexión.

45 Según otra forma de realización, uno de R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ es alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alqueno de C₂-C₆ y del modo más preferible alqueno de C₂-C₃; alcoxi de C₁-C₈, preferiblemente alcoxi de C₁-C₆ y del modo más preferible alcoxi de C₁-C₃; alquenilo de C₂-C₈, preferiblemente alquenilo de C₂-C₆ y del modo más preferible alquenilo de C₃-C₅; alquilarilalcoxi de C₉-C₁₅, preferiblemente alquilarilalcoxi de C₉-C₁₂ y del modo más preferible alquilarilalcoxi de C₉-C₁₀; o N(R₈)₂ o SR₈ donde R₈ se selecciona entre alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado

o alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado o R₈ forman un sistema alicíclico de C₃-C₉ junto con el átomo de N de conexión; y los restantes se seleccionan independientemente de H y alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal.

- 5 Según otra forma de realización, dos o tres de R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alqueno de C₂-C₆ y del modo más preferible alqueno de C₂-C₃; alcoxi de C₁-C₈, preferiblemente alcoxi de C₁-C₆ y del modo más preferible alcoxi de C₁-C₃; alquenilo de C₂-C₈, preferiblemente alquenilo de C₂-C₆ y del modo más preferible alquenilo de C₃-C₅; y alquenilarilalcoxi de C₉-C₁₅, preferiblemente alquenilarilalcoxi de C₉-C₁₂ y del modo más preferible alquenilarilalcoxi de C₉-C₁₀, y los restantes se seleccionan independientemente de H y alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal.

Según una forma de realización, R₃ y R₄ o R₄ y R₅ forman un sistema aromático junto con el anillo de benceno de fórmula I, preferiblemente un sistema aromático bicíclico, tricíclico o tetracíclico, más preferiblemente un sistema aromático seleccionado de un sistema naftilo, antraceno y fenantreno.

- 15 Según otra forma de realización, uno de los R restantes es alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alqueno de C₂-C₆ y del modo más preferible alqueno de C₂-C₃; alquenilo de C₂-C₈, preferiblemente alquenilo de C₂-C₆ y del modo más preferible alquenilo de C₃-C₅; y alquenilarilalcoxi de C₉-C₁₅, preferiblemente alquenilarilalcoxi de C₉-C₁₂ y del modo más preferible alquenilarilalcoxi de C₉-C₁₀; y los restantes se seleccionan independientemente de H y alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal.

Según otra forma de realización, el alcano de C₂-C₈ y/o el alqueno de C₂-C₈ al menos parcialmente halogenado se halogenan completamente; preferiblemente el alcano de C₂-C₈ y/o el alqueno de C₂-C₈ al menos parcialmente halogenados se seleccionan de hexacloroetano, tetracoroetileno y sus mezclas.

- 25 Según una forma de realización, la base se selecciona del grupo que comprende alcóxido de C₁-C₆ de sodio, preferiblemente alcóxido de C₁-C₄ de sodio y del modo más preferible alcóxido de C₁-C₂ de sodio; alcóxido de C₁-C₆ de litio, preferiblemente alcóxido de C₁-C₄ de litio y del modo más preferible alcóxido de C₁-C₂ de litio; alcóxido de C₁-C₆ de potasio, preferiblemente alcóxido de C₁-C₄ de potasio y del modo más preferible alcóxido de C₁-C₂ de potasio; y mezclas de los mismos.

- 30 Según otra forma de realización, la base está en forma de una solución acuosa o la base se proporciona en un disolvente orgánico; preferiblemente, el disolvente orgánico se selecciona del grupo que comprende metanol, etanol, n-propanol, terc-butanol, diclorometano, tetracloroetileno, tetrahidrofurano, acetato de etilo, acetona, N,N-dimetilformamida, sulfóxido de dimetilo, dioxano, como 1,3-dioxano o 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, éter dimetílico dietilenglicol, dimetílico trietilenglicol éter y sus mezclas.

- 35 Según otra forma de realización, el procedimiento se lleva a cabo a una temperatura en el intervalo de 0 a 120 °C, preferiblemente en el intervalo de 12 a 80 °C, más preferiblemente en el intervalo de 15 a 50 °C, y del modo más preferible en el rango de 15 a 30 °C.

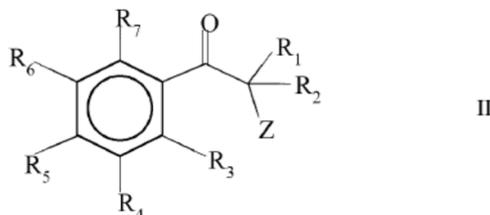
- 40 Según una forma de realización, el procedimiento se lleva a cabo en un disolvente orgánico; preferiblemente, el disolvente orgánico se selecciona del grupo que comprende metanol, etanol, n-propanol, terc-butanol, diclorometano, tetracloroetileno, tetrahidrofurano, acetato de etilo, acetona, N,N-dimetilformamida, dimetilsulfóxido, dioxano, como 1,3-dioxano o 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, éter dimetílico dietilenglicol, éter dimetílico trietilenglicol y mezclas de los mismos.

- 45 Según una forma de realización, el procedimiento comprende una etapa adicional de poner en contacto el ariloxirano obtenido por el procedimiento en condiciones de transferencia de fase con una base seleccionada del grupo que comprende hidróxido de metal alcalino, hidróxido de metal alcalino térreo, alcóxido de C₁-C₈ de metal alcalino, alcóxido de C₁-C₈ de metal alcalino térreo y mezclas y un compuesto seleccionado de HOR₉, HNR₉ o HNR₁₀R₁₁ con R₉, R₁₀ y R₁₁ seleccionados independientemente de H, alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, alcoxi de C₁-C₈, alquenilo de C₂-C₈, cicloalquilo de C₃-C₈, cicloalcoxi de C₃-C₈, arilo de C₆-C₁₄, arilalquilo de C₇-C₁₅, arilalcoxi de C₇-C₁₅, alquenilarilalcoxi de C₉-C₁₅, alquenilarilalquilo de C₉-C₁₅; o R₁₀ y R₁₁ forman un sistema alicíclico de C₃-C₉ junto con el átomo de N o C de conexión, opcionalmente uno o más átomos de carbono se reemplazan con O.

- 50 Según otra forma de realización, la etapa se lleva a cabo en presencia de un catalizador de transferencia de fase; preferiblemente, el catalizador de transferencia de fase se selecciona de una sal de amonio cuaternario, cloruro de tetraalquilfosfonio, bromuro de tetraalquilfosfonio y mezclas de los mismos; preferiblemente, el catalizador de transferencia de fase es una sal de tetraalquilamonio o una sal trialquilarilamonio; más preferiblemente el catalizador de transferencia de fase se selecciona del grupo que comprende hidróxido de benciltrimetilamonio, cloruro de benciltriethylamonio, cloruro de tetrabutilamonio, bromuro de tetrabutilamonio, hidrogenosulfato de tetrabutilamonio, hidróxido de tetrabutilamonio, cloruro de metiltriocilamonio, cetil piridinio y mezclas de los mismos.

Según otra forma de realización, el procedimiento comprende una etapa adicional de poner en contacto el alquil aril cetal α -funcionalizado obtenido por el procedimiento con un ácido, preferiblemente un ácido seleccionado del grupo que comprende ácido clorhídrico, ácido acético, ácido fosfórico, ácido sulfúrico, cítrico ácido, ácido toluenosulfónico, ácido metanosulfónico, ácido cloroacético, ácido tricloroacético, ácido tartárico, ácido succínico, ácido maleico, ácido fumárico, ácido láctico, ácido málico, ácido propiónico, ácido butírico y sus mezclas.

De acuerdo con una forma de realización, se obtiene una cetona α -funcionalizada de la fórmula general II,

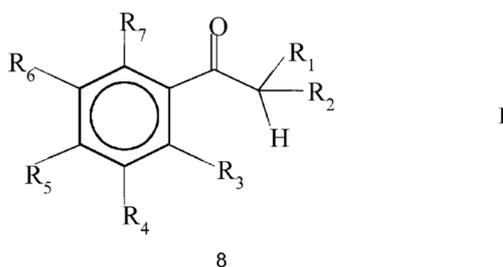


en la cual R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , R_6 y R_7 son como se definieron anteriormente; y Z se selecciona de OR_9 , NHR_9 y $NR_{10}R_{11}$ donde R_9 , R_{10} y R_{11} se seleccionan independientemente de H, alquilo de C_1-C_8 lineal o ramificado, alquenilo de C_2-C_8 lineal o ramificado, alcoxi de C_1-C_8 , alquenilo de C_2-C_8 , cicloalquilo de C_3-C_8 , cicloalcoxi de C_3-C_8 , arilo de C_6-C_{14} , arilalquilo de C_7-C_{15} , arilalcoxi de C_7-C_{15} , alquenilarilalcoxi de C_9-C_{15} , alquenilarilalquilo de C_9-C_{15} ; o R_{10} y R_{11} forman un sistema alicíclico de C_3-C_9 junto con el átomo de N o C de conexión, opcionalmente uno o más átomos de carbono se reemplazan con O.

De acuerdo con otra forma de realización, Z es OR_9 donde R_9 se selecciona entre H, alquilo de C_1-C_8 lineal o ramificado, alquenilo de C_2-C_8 lineal o ramificado, alcoxi de C_1-C_8 , alquenilo de C_2-C_8 , cicloalquilo de C_3-C_8 , cicloalcoxi de C_3-C_8 , arilalcoxi de C_7-C_{15} y alquenilarilalcoxi de C_9-C_{15} , preferiblemente R_9 es H o Z es $NR_{10}R_{11}$ donde R_{10} y R_{11} se seleccionan independientemente de H, alquilo de C_1-C_8 lineal o ramificado, cicloalquilo de C_3-C_8 , arilo de C_6-C_{14} , o R_{10} y R_{11} forman un sistema alicíclico de C_3-C_9 junto con el átomo de N de conexión, opcionalmente uno o más átomos de carbono se reemplazan con O, preferiblemente R_{10} y R_{11} forman un sistema alicíclico de C_5-C_6 junto con el átomo de N de conexión y uno o más átomos de carbono se reemplazan con O.

Descripción detallada de la invención

Se proporciona un procedimiento para hacer reaccionar una alquil aril cetona. En particular, un procedimiento para hacer reaccionar una alquil aril cetona de fórmula general I,

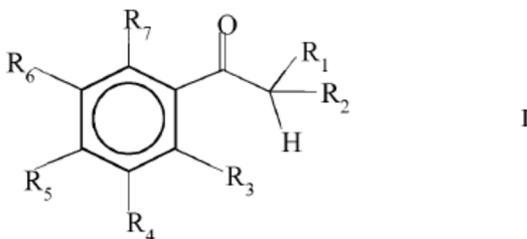


en la cual R_1 y R_2 son iguales o diferentes y se seleccionan independientemente de H, alquilo de C_1-C_8 lineal o ramificado, cicloalquilo de C_3-C_8 , alquenilo de C_2-C_8 lineal o ramificado, cicloalquenilo de C_5-C_8 , alquino de C_2-C_8 lineal o ramificado, arilo de C_6-C_{14} o forman cicloalquilo de C_3-C_{12} o cicloalquenilo de C_5-C_{12} junto con el átomo C de conexión;

R_3 , R_4 , R_5 , R_6 y R_7 son iguales o diferentes y se seleccionan independientemente de H, alquilo de C_1-C_8 lineal o ramificado, alquenilo de C_2-C_8 lineal o ramificado, alcoxi de C_1-C_8 , alquenilo de C_2-C_8 , cicloalquilo de C_3-C_8 , arilo de C_6-C_{14} , cicloalcoxi de C_3-C_8 , arilalcoxi de C_7-C_{15} , alquenilarilalcoxi de C_9-C_{15} , $N(R_8)_2$ o SR_8 donde R_8 se selecciona de alquilo de C_1-C_8 lineal o ramificado, alquenilo de C_2-C_8 lineal o ramificado, arilo de C_6-C_{14} , alcoxi de C_1-C_8 , alquenilo de C_2-C_8 , cicloalquilo de C_3-C_8 , cicloalcoxi de C_3-C_8 , arilalcoxi de C_7-C_{15} , alquenilarilalcoxi de C_9-C_{15} , o R_8 forman un sistema alicíclico de C_3-C_9 junto con el átomo de N de conexión, opcionalmente uno o más átomos de carbono se reemplazan con O, o dos R adyacentes forman un sistema aromático junto con el anillo de benceno de fórmula I;

con un alcano de C_2-C_8 y/o alqueno de C_2-C_8 al menos parcialmente halogenados, y una base seleccionada de alcóxido de C_1-C_8 de metal alcalino, alcóxido de C_1-C_8 de metal alcalino térreo y sus mezclas, obteniendo así el correspondiente aril oxirano o alquil aril cetal α -funcionalizado.

Por lo tanto, se aprecia que se usa como material de partida una alquil aril cetona de fórmula general I,



5 en donde R₁ y R₂ son iguales o diferentes y se seleccionan independientemente de H, alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, cicloalquilo de C₃-C₈, alquenilo de C₂-C₈ lineal o ramificado, cicloalquenilo de C₅-C₈, alquinilo de C₂-C₈ lineal o ramificado, arilo de C₆-C₁₄, o forman cicloalquilo de C₃-C₁₂ o cicloalquenilo de C₅-C₁₂ junto con el átomo C de conexión;

10 R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son iguales o diferentes y se seleccionan independientemente de H, alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, alquenilo de C₂-C₈ lineal o ramificado, alcoxi de C₁-C₈, alquenilo de C₂-C₈, cicloalquilo de C₃-C₈, arilo de C₆-C₁₄, cicloalcoxi de C₃-C₈, arilalcoxi de C₇-C₁₅, alquenilarilalcoxi de C₉-C₁₅, N(R₈)₂ o SR₈ donde R₈ se selecciona de alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, alquenilo de C₂-C₈ lineal o ramificado, arilo de C₆-C₁₄, alcoxi de C₁-C₈, alquenilo de C₂-C₈, cicloalquilo de C₃-C₈, cicloalcoxi de C₃-C₈, arilalcoxi de C₇-C₁₅, alquenilarilalcoxi de C₉-C₁₅, o R₈ forman un sistema alicíclico de C₃-C₉ junto con el átomo de N de conexión, opcionalmente uno o más átomos de carbono se reemplazan con O, o dos R adyacentes forman un sistema aromático junto con el anillo de benceno de fórmula I.

15 Con respecto a R₁ y R₂ en la fórmula general I, debe observarse que pueden ser iguales o diferentes. Preferiblemente, R₁ y R₂ son iguales o diferentes y se seleccionan independientemente de H, alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, cicloalquilo de C₃-C₈, alquenilo de C₂-C₈ lineal o ramificado, cicloalquenilo de C₅-C₈, alquinilo de C₂-C₈ lineal o ramificado, arilo de C₆-C₁₄ o forman cicloalquilo de C₃-C₁₂ o cicloalquenilo de C₅-C₁₂ junto con el átomo de C de conexión.

20 El término "alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado" en el sentido de la presente invención se refiere a un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 8 átomos de carbono, e incluye, por ejemplo, metilo, etilo, propilo, isopropilo, butilo, isobutilo, butilo secundario, butilo terciario, pentilo, isopentilo, neopentilo, hexilo, heptilo, octilo, 2-etilhexilo y 1,1,3,3-tetrametilbutilo.

El término "cicloalquilo de C₃-C₈" en el sentido de la presente invención se refiere a un alquilo cíclico que tiene de 3 a 8 átomos de carbono e incluye, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo y cicloheptilo.

25 El término "cicloalquenilo de C₅-C₈" en el sentido de la presente invención se refiere a un alquenilo cíclico que tiene de 3 a 8 átomos de carbono, e incluye, por ejemplo, ciclopentenilo, ciclohexenilo y cicloheptenilo.

30 El término "alquenilo de C₂-C₈ lineal o ramificado" en el sentido de la presente invención se refiere a un grupo alquenilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 2 a 8 átomos de carbono e incluye, por ejemplo, etenilo, propenilo tal como 2-propenilo, butenilo, triisobutenilo, pentenilo, hexenilo, heptenilo y octenilo. El término "alquenilo" en el significado de la presente invención incluye los isómeros cis y trans.

El término "alquinilo de C₂-C₈ lineal o ramificado" en el sentido de la presente invención se refiere a un grupo alquinilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 2 a 8 átomos de carbono e incluye, por ejemplo, etinilo, propinilo tal como 1-propinilo o 2-propinilo, por ejemplo, propargilo, butinilo, pentinilo, hexinilo, heptinilo y octinilo.

35 El término "arilo de C₆-C₁₄" en el significado de la presente invención se refiere a un grupo que contiene uno o más anillos de hidrocarburo insaturado de 6 miembros, en el que la insaturación está representada formalmente por enlaces dobles conjugados y que puede estar opcionalmente sustituido en uno o más átomos de carbono de tal o tales anillos por grupos alquilo seleccionados independientemente. Por lo tanto, el término "arilo de C₆-C₁₄" incluye preferiblemente arilo de C₆-C₁₀ (no sustituido) y alquilarilo de C₆-C₁₄. Ejemplos adecuados incluyen, por ejemplo, fenilo, naftilo, metilfenilo, dimetoxifenilo, 5-isopropil-2-metilfenilo, metilfenilo, etilfenilo, dimetilfenilo, t-butilfenilo, metilnaftilo y dimetilnaftilo.

El término "formar cicloalquilo de C₃-C₁₂ junto con el átomo C de conexión" en el significado de la presente invención se refiere a un alquilo mono-, bi- o tricíclico que tiene de 3 a 12 átomos de carbono e incluye, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, norbornilo y adamantilo.

45 El término "formar cicloalquenilo de C₅-C₁₂ junto con el átomo C de conexión" en el significado de la presente invención se refiere a un alquenilo mono-, bi- o tricíclico que tiene de 5 a 12 átomos de carbono e incluye, uno o más, preferiblemente uno, doble(s) enlace(s). Ejemplos adecuados incluyen, por ejemplo, ciclopentenilo, ciclohexenilo, ciclohexadienilo y cicloheptenilo. Se aprecia que el doble enlace del cicloalquenilo de C₅-C₁₂ se localiza de tal manera que no se forma un compuesto de carbonilo α, β-insaturado. Por lo tanto, R₁ y R₂ en la fórmula general I pueden formar

cicloalquenilo de C₅-C₁₂ junto con el átomo C de conexión con la condición de que no se forme un compuesto de carbonilo α,β -insaturado.

5 En una forma de realización, R₁ y R₂ son iguales o diferentes y se seleccionan independientemente de H, alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, cicloalquilo de C₃-C₈, o forman cicloalquilo de C₃-C₁₂ junto con el átomo C de conexión. Preferiblemente, R₁ y R₂ son iguales o diferentes y se seleccionan independientemente de H o alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado.

10 Por ejemplo, R₁ y R₂ son iguales. En esta forma de realización, R₁ y R₂ se seleccionan preferiblemente de H, alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, cicloalquilo de C₃-C₈, alquenilo de C₂-C₈ lineal o ramificado, cicloalquenilo de C₅-C₈, alquinilo de C₂-C₈ lineal o ramificado, arilo de C₆-C₁₄ o formar cicloalquilo de C₃-C₁₂ o cicloalquenilo de C₅-C₁₂ junto con el átomo de C de conexión.

En una forma de realización, R₁ y R₂ son iguales y son H.

15 En otra forma de realización, R₁ y R₂ son iguales y son alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₈ lineal. Por ejemplo, R₁ y R₂ son iguales y son alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₆ lineal, preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₄ lineal, y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₃ lineal. Se prefiere especialmente que R₁ y R₂ sean iguales y sean alquilo de C₁ o de C₂, por ejemplo, alquilo de C₁.

En otra forma de realización, R₁ y R₂ forman cicloalquilo de C₃-C₁₂ junto con el átomo C de conexión. Por ejemplo, R₁ y R₂ forman cicloalquilo de C₄-C₁₀, preferiblemente cicloalquilo de C₄-C₈, más preferiblemente cicloalquilo de C₄-C₆, y del modo más preferible cicloalquilo de C₅ o de C₆, por ejemplo, cicloalquilo de C₆, junto con el átomo de C de conexión.

20 En otra forma de realización, R₁ y R₂ son iguales y son alquenilo de C₂-C₈ lineales o ramificados, por ejemplo, alquenilo de C₂-C₈ lineal. Por ejemplo, R₁ y R₂ son iguales y son alquenilo de C₂-C₆ lineal o ramificado, por ejemplo, alquenilo de C₂-C₆ lineal, preferiblemente alquenilo de C₂-C₄ lineal o ramificado, por ejemplo, alquenilo de C₂-C₄ lineal, y del modo más preferible alquenilo de C₂ o C₃ lineal o ramificado, por ejemplo, alquenilo de C₂ o C₃ lineal. Se prefiere especialmente que R₁ y R₂ sean iguales y sean alquenilo de C₃.

25 En otra forma de realización, R₁ y R₂ son iguales y son alquinilo de C₂-C₈ lineal o ramificado, por ejemplo, alquinilo lineal de C₂-C₈. Por ejemplo, R₁ y R₂ son iguales y son alquinilo de C₂-C₆ lineal o ramificado, por ejemplo, alquinilo de C₂-C₆ lineal, preferiblemente alquinilo de C₂-C₄ lineal o ramificado, por ejemplo, alquinilo de C₂-C₄ lineal, y del modo más preferible alquinilo de C₂ o C₃ lineal o ramificado, por ejemplo, alquinilo lineal de C₂ o C₃. Se prefiere especialmente que R₁ y R₂ sean iguales y sean alquinilo de C₃.

30 En otra forma de realización, R₁ y R₂ son iguales y son arilo de C₆-C₁₄ lineal o ramificado, por ejemplo, arilo de C₆-C₁₀ (no sustituido) o alquilarilo de C₆-C₁₄. Por ejemplo, R₁ y R₂ son iguales y son arilo de C₆ o C₁₀ (no sustituido). Alternativamente, R₁ y R₂ son iguales y son alquilarilo de C₈-C₁₂.

35 En otra forma de realización, R₁ y R₂ forman cicloalquenilo de C₅-C₁₂ junto con el átomo C de conexión. Por ejemplo, R₁ y R₂ forman cicloalquenilo de C₅-C₁₀, preferiblemente cicloalquenilo de C₅-C₈ y del modo más preferible cicloalquenilo de C₅ o C₆, por ejemplo, cicloalquenilo de C₆, junto con el átomo C de conexión.

40 Si R₁ y R₂ son iguales, se prefiere que R₁ y R₂ sean alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alquilo de C₁-C₈ lineal, o formen cicloalquilo de C₃-C₁₂, preferiblemente cicloalquilo de C₅ o C₆, junto con el átomo C de conexión. Más preferiblemente, R₁ y R₂ son alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alquilo de C₁-C₈ lineal, o forman cicloalquilo de C₃-C₁₂. Del modo más preferible, R₁ y R₂ son alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alquilo de C₁-C₈ lineal.

45 Alternativamente, R₁ y R₂ son diferentes. En esta forma de realización, R₁ y R₂ se seleccionan preferiblemente de modo independiente de H, alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, cicloalquilo de C₃-C₈, alquenilo de C₂-C₈ lineal o ramificado, cicloalquenilo de C₅-C₈, alquinilo de C₂-C₈ lineal o ramificado o arilo de C₆-C₁₄. Por ejemplo, R₁ y R₂ son diferentes y se seleccionan de H, alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₈ lineal, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₆ lineal, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₄ lineal, y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal, por ejemplo, alquilo de C₁ o C₂, alquenilo de C₂-C₈ lineal o ramificado, por ejemplo, alquenilo de C₂-C₈ lineal, preferiblemente alquenilo de C₂-C₆ lineal o ramificado, por ejemplo, alquenilo de C₂-C₆ lineal, más preferiblemente alquenilo de C₂-C₄ lineal o ramificado, por ejemplo, alquenilo de C₂-C₄ lineal; incluso más preferiblemente alquenilo de C₂ o C₃ lineal o ramificado, por ejemplo, alquenilo de C₂ o C₃ lineal y del modo más preferible alquenilo de C₃, y alquinilo de C₂-C₈ lineal o ramificado, por ejemplo, alquinilo de C₂-C₈ lineal, preferiblemente alquinilo de C₂-C₆ lineal o ramificado, por ejemplo, alquinilo de C₂-C₆ lineal, más preferiblemente alquinilo de C₂-C₄ lineal o ramificado, por ejemplo, alquinilo de C₂-C₄ lineal, incluso más preferiblemente alquinilo de C₂ o C₃ lineal o ramificado, por ejemplo, alquinilo lineal de C₂ o C₃ y del modo más preferible alquinilo de C₃. En una forma de realización, R₁ y R₂ son diferentes y se seleccionan de H y alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₈ lineal, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₆ lineal, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₄ lineal, y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal, por ejemplo, alquilo

de C₁ o C₂. En una forma de realización, R₁ y R₂ son diferentes y se seleccionan de H y alquilo de C₁ o C₂, preferiblemente alquilo C₂.

Si R₁ y R₂ son diferentes, R₁ o R₂ es preferiblemente H y R₁ o R₂ restante es preferiblemente alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₈ lineal, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₆ lineal, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₄ lineal, incluso más preferiblemente alquilo de C₁-C₃ lineal, y del modo más preferible alquilo de C₁ o C₂, por ejemplo, alquilo de C₂.

Preferiblemente, R₁ y R₂ son iguales.

La alquil aril cetona de la fórmula general I comprende además los residuos R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇. Se aprecia que R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ pueden ser iguales o diferentes. Además, R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son iguales o diferentes y se seleccionan independientemente de H, alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, alcoxi de C₁-C₈, alquenoilo de C₂-C₈, cicloalquilo de C₃-C₈, arilo de C₆-C₁₄, cicloalcoxi de C₃-C₈, arilalcoxi de C₇-C₁₅, alquilarilalcoxi C₉-C₁₅, N(R₈)₂ o SR₈ donde R₈ se selecciona de alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, arilo de C₆-C₁₄, alcoxi de C₁-C₈, alquenoilo de C₂-C₈, cicloalquilo de C₃-C₈, cicloalcoxi de C₃-C₈, arilalcoxi de C₇-C₁₅, alquilarilalcoxi de C₉-C₁₅, o R₈ forma un sistema alicíclico de C₃-C₉ junto con el átomo N de conexión, o R₈ forman un sistema alicíclico de C₃-C₉ junto con el átomo N de conexión, opcionalmente uno o más átomos de carbono se reemplazan con O, o dos R adyacentes forman un aromático sistema junto con el anillo de benceno de fórmula I.

El término "alcoxi de C₁-C₈" en el significado de la presente invención significa que el residuo alcoxi tiene un alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 8 átomos de carbono e incluye, por ejemplo, metoxi, etoxi, propoxi, isopropoxi, butoxi, isobutoxi, butoxi terciario, pentiloxi, hexiloxi, heptiloxi y octiloxi.

El término "alquenoilo de C₂-C₈" en el significado de la presente invención significa que el residuo alquenoilo tiene un alqueno de cadena lineal o ramificada que tiene de 2 a 8 átomos de carbono e incluye, por ejemplo, eteniloxi, propeniloxi, buteniloxi, triisobuteniloxi, penteniloxi, hexeniloxi, hepteniloxi y octeniloxi.

El término "cicloalcoxi de C₃-C₈" en el sentido de la presente invención significa que el residuo cicloalcoxi tiene un alquilo cíclico que tiene 3 a 8 átomos de carbono e incluye, por ejemplo, ciclopropiloxi, ciclobutiloxi, ciclopentiloxi, ciclohexiloxi y cicloheptiloxi.

El término "arilalcoxi de C₇-C₁₅" en el significado de la presente invención significa que el residuo alcoxi tiene un alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene 1 a 4 átomos de carbono, preferiblemente 1 o 2 átomos de carbono, que está conectado a arilo de C₆-C₁₄.

El término "arilalquilo de C₇-C₁₅" en el significado de la presente invención significa que el residuo alquilo es un alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene 1 a 4 átomos de carbono, preferiblemente 1 o 2 átomos de carbono, que está conectado a arilo de C₆-C₁₄.

El término "alquilarilalcoxi de C₉-C₁₅" en el sentido de la presente invención significa que el residuo alcoxi tiene un alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene 1 a 4 átomos de carbono, preferiblemente 1 o 2 átomos de carbono, que está conectado a arilo de C₆-C₁₄, preferiblemente arilo de C₆, que está conectado además a alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alqueno de C₂. Preferiblemente, los restos alcoxi y alqueno están conectados en posición para del residuo arilo.

En una forma de realización, R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son iguales. En esta forma de realización, R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son iguales y se seleccionan de H y alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₈ lineal. Por ejemplo, R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son iguales y son alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₆ lineal, preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₄ lineal, y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal, por ejemplo, alquilo de C₁ o C₂. Se prefiere especialmente que R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ sean iguales y sean H.

Alternativamente, R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son diferentes. En esta forma de realización, R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son diferentes y al menos uno de ellos se selecciona de alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, alcoxi de C₁-C₈, alquenoilo de C₂-C₈, alquilarilalcoxi de C₉-C₁₅ o N(R₈)₂ o SR₈ donde R₈ se selecciona entre alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado o alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado o R₈ forman un sistema alicíclico de C₃-C₉ junto con el átomo N de conexión.

El término "al menos uno" en el significado de la presente invención significa que uno o más de R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ se seleccionan de alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, alcoxi de C₁-C₈, alquenoilo de C₂-C₈, alquenalcoxi de C₉-C₁₅ o N(R₈)₂ o SR₈ donde R₈ se seleccionan entre alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado o alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado o R₈ forman un sistema alicíclico de C₃-C₉ junto con el átomo N de conexión.

Por ejemplo, uno o dos o tres de R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ se selecciona(n) de alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, alcoxi de C₁-C₈, alquenoilo de C₂-C₈, alquilarilalcoxi de C₉-C₁₅ o N(R₈)₂ o SR₈ donde R₈ se selecciona entre alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado o alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado o R₈ forman un

sistema alicíclico de C₃-C₉ junto con el átomo N de conexión. Por ejemplo, uno o dos de R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ es/son seleccionan de alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, alcoxi de C₁-C₈, alquenoilo de C₂-C₈, alquenoilarilalcoxi de C₉-C₁₅ o N(R₈)₂ o SR₈ donde R₈ se seleccionan entre alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado o alquenoilo de C₂-C₈ lineal o ramificado o R₈ forman un sistema alicíclico de C₃-C₉ junto con el átomo N de conexión.

- 5 Preferiblemente, uno de R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ se selecciona de alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, alcoxi de C₁-C₈, alquenoilo de C₂-C₈, alquenoilarilalcoxi de C₉-C₁₅ o N(R₈)₂ o SR₈ donde R₈ se selecciona entre alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado o alquenoilo de C₂-C₈ lineal o ramificado o R₈ forman un sistema alicíclico de C₃-C₉ junto con el átomo N de conexión.

- 10 Si R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son diferentes y al menos uno de ellos se selecciona entre alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, alcoxi de C₁-C₈, alquenoilo de C₂-C₈, alquenoilarilalcoxi de C₉-C₁₅ o N(R₈)₂ o SR₈ donde R₈ se selecciona entre alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado o alquenoilo de C₂-C₈ lineal o ramificado o R₈ forman un sistema alicíclico de C₃-C₉ junto con el átomo N de conexión, se prefiere que los restantes se seleccionen de H y alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal, por ejemplo, alquilo de C₁ o C₂. Por ejemplo, R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son diferentes y al menos uno de ellos se selecciona de alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, alcoxi de C₁-C₈, alquenoilo de C₂-C₈, alquenoilarilalcoxi de C₉-C₁₅ o N(R₈)₂ o SR₈ donde R₈ se selecciona entre alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado o alquenoilo de C₂-C₈ lineal o ramificado o R₈ forman un sistema alicíclico de C₃-C₉ junto con el átomo N de conexión y los restantes son H.

- 20 En una forma de realización, R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son diferentes y uno de ellos se selecciona de alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, alcoxi de C₁-C₈, alquenoilo de C₂-C₈, alquenoilarilalcoxi de C₉-C₁₅ o N(R₈)₂ o SR₈ donde R₈ se selecciona entre alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado o alquenoilo de C₂-C₈ lineal o ramificado o R₈ forman un sistema alicíclico de C₃-C₉ junto con el átomo N de conexión.

- 25 Por ejemplo, R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son diferentes y uno de ellos es alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, por ejemplo, alqueno de C₂-C₈ lineal; preferiblemente alqueno de C₂-C₆ lineal o ramificado, por ejemplo, alqueno de C₂-C₆ lineal; y del modo más preferible alqueno de C₂-C₃, por ejemplo, alqueno de C₂ o C₃; y los restantes son H.

Alternativamente, R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son diferentes y uno de ellos es alquenoilo de C₂-C₈, preferiblemente alquenoilo de C₂-C₆ y del modo más preferible alquenoilo de C₃-C₅, por ejemplo, alquenoilo de C₃ o C₄, especialmente alquenoilo de C₃; y los restantes son H.

- 30 En una forma de realización, R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son diferentes y uno de ellos es alquenoilo de C₂-C₈, preferiblemente alquenoilo de C₂-C₆ y del modo más preferible alquenoilo de C₃-C₅, por ejemplo, alquenoilo de C₃ o C₄, especialmente alquenoilo de C₃; y los restantes se seleccionan independientemente de H y alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₈ lineal, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₆ lineal, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado; por ejemplo, alquilo de C₁-C₄ lineal, y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal; por ejemplo, alquilo de C₁ o C₂, especialmente alquilo de C₁.

- 35 Por ejemplo, R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son diferentes y uno de ellos es alquenoilo de C₂-C₈, preferiblemente alquenoilo de C₂-C₆ y del modo más preferible alquenoilo de C₃-C₅, por ejemplo, alquenoilo de C₃ o C₄, especialmente alquenoilo de C₃; y dos de los restantes son H y dos de los restantes son alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₈ lineal, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₆ lineal, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₄ lineal, y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal, por ejemplo, alquilo de C₁ o C₂, especialmente alquilo de C₁.

- 40 Alternativamente, R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son diferentes y uno de ellos es alquenoilarilalcoxi de C₉-C₁₅, preferiblemente alquenoilarilalcoxi de C₉-C₁₂ y del modo más preferible alquenoilarilalcoxi de C₉-C₁₀; y los restantes son H.

- 45 Alternativamente, R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son diferentes y uno de ellos es SR₈ donde R₈ se selecciona de alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₈ lineal, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₆ lineal, preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₄ lineal, y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal, por ejemplo, alquilo C₁ o C₂, especialmente alquilo de C₁; y los restantes son H.

- 50 Alternativamente, R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son diferentes y uno de ellos es N(R₈)₂ donde R₈ forma un sistema alicíclico de C₃-C₉, preferiblemente un sistema alicíclico de C₃-C₇, más preferiblemente un sistema alicíclico de C₄-C₆ y del modo más preferible un sistema alicíclico de C₅ o C₆, junto con el átomo N de conexión; y los restantes son H. Opcionalmente, uno o más átomos de carbono se reemplazan con O. Preferiblemente, R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son diferentes y uno de ellos es N(R₈)₂ donde R₈ forma un sistema alicíclico de C₃-C₉, preferiblemente un sistema alicíclico de C₃-C₇, más preferiblemente un sistema alicíclico de C₄-C₆ y del modo más preferible un sistema alicíclico de C₅ o C₆, junto con el átomo N de conexión, en donde uno o más, preferiblemente uno, átomo(s) de carbono se reemplazan con O; y los restantes son H.

- 55

Si R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son diferentes y uno de ellos se selecciona entre alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, de alcoxi de C₁-C₈, alqueno de C₂-C₈, alquenoarilalcoxi de C₉-C₁₅ o N(R₈)₂ o SR₈ donde R₈ se selecciona entre alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado o alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado o R₈ forman un sistema alicíclico de C₃-C₉ junto con el átomo N de conexión, se prefiere que R₅ sea seleccionado de alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, alcoxi de C₁-C₈, alqueno de C₂-C₈, alquenoarilalcoxi de C₉-C₁₅ o N(R₈)₂ o SR₈ donde R₈ se selecciona de alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado o alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado o R₈ forman un sistema alicíclico de C₃-C₉ junto con el átomo N de conexión.

Por lo tanto, si R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son diferentes y uno de ellos se selecciona entre alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, alcoxi de C₁-C₈, alqueno de C₂-C₈, alquenoarilalcoxi de C₉-C₁₅ o N(R₈)₂ o SR₈ donde R₈ se selecciona entre alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado o alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado o R₈ forman un sistema alicíclico de C₃-C₉ junto con el átomo N de conexión, se prefiere que este grupo esté en posición para con relación al grupo ceto.

En una forma de realización alternativa, R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son diferentes y dos o tres de ellos son alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, por ejemplo, alqueno de C₂-C₈ lineal, preferiblemente alqueno de C₂-C₆ lineal o ramificado, por ejemplo, alqueno de C₂-C₆ lineal, y del modo más preferible alqueno de C₂-C₃; alcoxi de C₁-C₈, preferiblemente alcoxi de C₁-C₆ y del modo más preferible alcoxi de C₁-C₃; alqueno de C₂-C₈, preferiblemente alqueno de C₂-C₆ y del modo más preferible alqueno de C₃-C₅; y alquenoarilalcoxi de C₉-C₁₅, preferiblemente alquenoarilalcoxi de C₉-C₁₂ y del modo más preferible alquenoarilalcoxi de C₉-C₁₀, y los restantes se seleccionan independientemente de H y alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal, por ejemplo, alquilo de C₁ o C₂, especialmente alquilo de C₁.

Por ejemplo, R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son diferentes y dos de ellos son alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, por ejemplo, alqueno de C₂-C₈ lineal, preferiblemente alqueno de C₂-C₆ lineal o ramificado, por ejemplo, alqueno de C₂-C₆ lineal, y del modo más preferible alqueno de C₂-C₃; alcoxi de C₁-C₈, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃; alqueno de C₂-C₈, preferiblemente alqueno de C₂-C₆ y del modo más preferible alqueno de C₃-C₅; y alquenoarilalcoxi de C₉-C₁₅, preferiblemente alquenoarilalcoxi de C₉-C₁₂ y del modo más preferible alquenoarilalcoxi de C₉-C₁₀, y los restantes se seleccionan independientemente de H y alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal, por ejemplo, alquilo de C₁ o C₂, especialmente alquilo C₁. Preferiblemente, R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son diferentes y dos de ellos son alqueno de C₂-C₈, preferiblemente alqueno de C₂-C₆ y del modo más preferible alqueno de C₃-C₅; y los restantes se seleccionan independientemente de H y alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal, por ejemplo, alquilo de C₁ o C₂, especialmente alquilo de C₁, preferiblemente los restantes son H.

Alternativamente, R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son diferentes y dos de ellos son alcoxi de C₁-C₈, preferiblemente alcoxi de C₁-C₆ y del modo más preferible alcoxi de C₁-C₃; y los restantes se seleccionan independientemente de H y alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal, por ejemplo, alquilo de C₁ o C₂, especialmente alquilo de C₁, preferiblemente los restantes son H.

En una forma de realización, R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son diferentes y tres de ellos son alquenoarilalcoxi de C₉-C₁₅, preferiblemente alquenoarilalcoxi de C₉-C₁₂ y del modo más preferible alquenoarilalcoxi de C₉-C₁₀, y los restantes se seleccionan independientemente de H y alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal, por ejemplo, alquilo de C₁ o C₂, especialmente alquilo de C₁, preferiblemente los restantes son H.

Si dos o tres de R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, por ejemplo, alqueno de C₂-C₈ lineal, preferiblemente alqueno de C₂-C₆ lineal o ramificado, por ejemplo, alqueno de C₂-C₆ lineal, y del modo más preferible alqueno de C₂-C₃; alcoxi de C₁-C₈, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃; alqueno de C₂-C₈, preferiblemente alqueno de C₂-C₆ y del modo más preferible alqueno de C₃-C₅; y alquenoarilalcoxi de C₉-C₁₅, preferiblemente alquenoarilalcoxi de C₉-C₁₂ y del modo más preferible alquenoarilalcoxi de C₉-C₁₀, se aprecia que preferiblemente R₄ y/o R₅ y/o R₆ son alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, por ejemplo, alqueno de C₂-C₈ lineal, preferiblemente alqueno de C₂-C₆ lineal o ramificado, por ejemplo, alqueno de C₂-C₆ lineal, y del modo más preferible alqueno de C₂-C₃; alcoxi de C₁-C₈, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃; alqueno de C₂-C₈, preferiblemente alqueno de C₂-C₆ y del modo más preferible alqueno de C₃-C₅; y alquenoarilalcoxi de C₉-C₁₅, preferiblemente alquenoarilalcoxi de C₉-C₁₂ y del modo más preferible alquenoarilalcoxi de C₉-C₁₀.

En una forma de realización, R₃ y R₄ o R₄ y R₅ forman un sistema aromático junto con el anillo de benceno de fórmula general I, preferiblemente un sistema aromático bicíclico, tricíclico o tetracíclico, más preferiblemente un sistema aromático seleccionado de un sistema naftilo, antraceno y fenantreno. El sistema aromático es preferiblemente un sistema aromático bicíclico, del modo más preferible naftilo.

Por ejemplo, R₄ y R₅ forman un sistema aromático junto con el anillo de benceno de fórmula general I, preferiblemente un sistema aromático bicíclico, del modo más preferible naftilo; y los restantes se seleccionan independientemente de H y alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal, por ejemplo, alquilo de C₁ o C₂, especialmente alquilo de C₁, preferiblemente H.

Se aprecia que uno de los R restantes puede ser alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alqueno de C₂-C₆ y del modo más preferible alqueno C₂-C₃; alqueno de C₂-C₈, preferiblemente alqueno de C₂-C₆ y del modo más preferible alqueno de C₃-C₅; y alquenoarilalcoxi de C₉-C₁₅, preferiblemente alquenoarilalcoxi de C₉-C₁₂ y del modo más preferible alquenoarilalcoxi de C₉-C₁₀; y los restantes pueden seleccionarse independientemente de H y alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal, por ejemplo, alquilo de C₁ o C₂, especialmente alquilo de C₁, preferiblemente H.

En una forma de realización, R₄ y R₅ forman un sistema aromático junto con el anillo de benceno de fórmula general I, preferiblemente un sistema aromático bicíclico, del modo más preferible naftilo, y R₃ es alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alqueno de C₂-C₆ y del modo más preferible alqueno de C₂-C₃; alqueno de C₂-C₈, preferiblemente alqueno de C₂-C₆ y del modo más preferible alqueno de C₃-C₅; y alquenoarilalcoxi de C₉-C₁₅, preferiblemente alquenoarilalcoxi de C₉-C₁₂ y del modo más preferible alquenoarilalcoxi de C₉-C₁₀; y los restantes se seleccionan independientemente de H y alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal, preferiblemente H. Por ejemplo, R₄ y R₅ forman un sistema aromático junto con el anillo de benceno de fórmula general I, preferiblemente un sistema aromático bicíclico, más preferiblemente naftilo, y R₃ es alquenoarilalcoxi de C₉-C₁₅, preferiblemente alquenoarilalcoxi de C₉-C₁₂ y del modo más preferible alquenoarilalcoxi de C₉-C₁₀; y los restantes son H.

Una alquil aril cetona especialmente preferida de la fórmula general I es una cetona, en la que R₁ y R₂ son iguales y se seleccionan de alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₈ lineal, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₆ lineal, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₄ lineal, y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal, por ejemplo, alquilo de C₁ o C₂, especialmente alquilo de C₁; y R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son iguales y son H.

Por ejemplo, la alquil aril cetona de la fórmula general I es una cetona, en donde R₁ y R₂ son iguales y son alquilo de C₁; y R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son iguales y son H.

Alternativamente, la alquil aril cetona de la fórmula general I es una cetona, en la que R₁ y R₂ forman cicloalquilo de C₃-C₁₂, preferiblemente cicloalquilo de C₄-C₁₀, más preferiblemente cicloalquilo de C₄-C₈, incluso más preferiblemente cicloalquilo de C₄-C₆, y del modo más preferible cicloalquilo de C₅ o C₆, por ejemplo, cicloalquilo de C₆, junto con el átomo C de conexión; y R₄, R₅, R₆ y R₇ son iguales y son H.

Alternativamente, la alquil aril cetona de la fórmula general I es una cetona, en la que R₁ y R₂ son iguales y se seleccionan de alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₈ lineal, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₆ lineal, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₄ lineal, y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal, por ejemplo, alquilo de C₁ o C₂, especialmente alquilo de C₁; y R₄, R₅, R₆ y R₇ son iguales y son H.

Alternativamente, la alquil aril cetona de la fórmula general I es una cetona, en la que R₁ y R₂ son iguales y se seleccionan de alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₈ lineal, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₆ lineal, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₄ lineal, y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal, por ejemplo, alquilo de C₁ o C₂, especialmente alquilo de C₁; R₄, R₅, R₆ y R₇ son diferentes y uno de ellos, preferiblemente R₅, es alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alqueno de C₂-C₆ lineal o ramificado y del modo más preferible alqueno de C₂-C₃, por ejemplo, alqueno C₂; y los restantes son H.

Por ejemplo, la alquil aril cetona de la fórmula general I es una cetona, en donde R₁ y R₂ son iguales y son alquilo de C₁; R₄, R₅, R₆ y R₇ son diferentes y uno de ellos, preferiblemente R₅, es alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alqueno de C₂-C₆ lineal o ramificado y del modo más preferible alqueno de C₂-C₃, por ejemplo, alqueno de C₂; y los restantes son H.

Alternativamente, la alquil aril cetona de la fórmula general I es una cetona, en la que R₁ y R₂ son iguales y se seleccionan de alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₈ lineal, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₆ lineal, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₄ lineal, y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal, por ejemplo, alquilo de C₁ o C₂, especialmente alquilo de C₁; R₄, R₅, R₆ y R₇ son diferentes y uno de ellos, preferiblemente R₅, es alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alqueno de C₂-C₆ lineal o ramificado y del modo más preferible alqueno de C₂-C₃, por ejemplo, alqueno de C₂; y los restantes son H.

Por ejemplo, la alquil aril cetona de la fórmula general I es una cetona, en donde R_1 y R_2 son iguales y son alquilo de C_1 ; R_3 , R_4 , R_5 , R_6 y R_7 son diferentes y tres de ellos, preferiblemente R_3 y R_4 y R_5 , son alquenilarilalcoxi de C_9 - C_{15} , preferiblemente alquenilarilalcoxi de C_9 - C_{12} y del modo más preferible alquenilarilalcoxi de C_9 - C_{10} , y los restantes, preferiblemente R_6 y R_7 , son H.

- 5 Alternativamente, la alquil aril cetona de la fórmula general I es una cetona, en la que R_1 y R_2 son diferentes y se seleccionan de H y alquilo de C_1 - C_8 lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_8 lineal, preferiblemente alquilo de C_1 - C_6 lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_6 lineal, más preferiblemente alquilo de C_1 - C_4 lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_4 lineal, y del modo más preferible alquilo de C_1 - C_3 lineal, por ejemplo, alquilo de C_1 o C_2 , especialmente alquilo de C_1 ; R_3 , R_4 , R_5 , R_6 y R_7 son diferentes y dos de ellos, preferiblemente R_4 y R_5 , son alcoxi de C_1 - C_8 , preferiblemente alcoxi de C_1 - C_6 y del modo más preferible alcoxi de C_1 - C_3 , especialmente alcoxi de C_1 ; y los restantes, preferiblemente R_3 , R_6 y R_7 , son H.

- 10 Por ejemplo, la alquil aril cetona de la fórmula general I de la fórmula general I es una cetona, en la que R_1 y R_2 son diferentes y son H y alquilo de C_2 ; R_3 , R_4 , R_5 , R_6 y R_7 son diferentes y dos de ellos, preferiblemente R_4 y R_5 , son alcoxi de C_1 - C_8 , preferiblemente alcoxi de C_1 - C_6 y del modo más preferible alcoxi de C_1 - C_3 , especialmente alcoxi de C_1 ; y los restantes, preferiblemente R_3 , R_6 y R_7 , son H.

- 15 Alternativamente, la alquil aril cetona de la fórmula general I es una cetona, en la que R_1 y R_2 son diferentes y se seleccionan de H y alquilo de C_1 - C_8 lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_8 lineal, preferiblemente alquilo de C_1 - C_6 lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_6 lineal, más preferiblemente alquilo de C_1 - C_4 lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_4 lineal, y del modo más preferible alquilo de C_1 - C_3 lineal, por ejemplo, alquilo de C_1 o C_2 , especialmente alquilo de C_1 ; R_3 , R_4 , R_5 , R_6 y R_7 son diferentes y uno de ellos, preferiblemente R_5 , es $N(R_8)_2$ donde R_8 forma un sistema alicíclico de C_3 - C_9 , preferiblemente un sistema alicíclico de C_3 - C_7 , más preferiblemente un sistema alicíclico de C_4 - C_6 y del modo más preferible un sistema alicíclico de C_5 o C_6 , junto con el átomo N de conexión, en el que uno o más, preferiblemente uno, átomos de carbono se reemplazan con O; y los restantes, preferiblemente R_3 , R_4 , R_6 y R_7 , son H.

- 20 Por ejemplo, la alquil aril cetona de la fórmula general I es una cetona, en la que R_1 y R_2 son diferentes y son H y alquilo de C_2 ; R_3 , R_4 , R_5 , R_6 y R_7 son diferentes y uno de ellos, preferiblemente R_5 , es $N(R_8)_2$ donde R_8 forma un sistema alicíclico de C_3 - C_9 , preferiblemente un sistema alicíclico de C_3 - C_7 , más preferiblemente un sistema alicíclico de C_4 - C_6 y del modo más preferible un sistema alicíclico de C_5 o C_6 , junto con el átomo de N de conexión, en el que uno o más, preferiblemente uno, átomos de carbono se reemplazan con O; y los restantes, preferiblemente R_3 , R_4 , R_6 y R_7 , son H.

- 25 Alternativamente, la alquil aril cetona de la fórmula general I es una cetona, en la que R_1 y R_2 son iguales y se seleccionan de alquilo de C_1 - C_8 lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_8 lineal, preferiblemente alquilo de C_1 - C_6 lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_6 lineal, más preferiblemente alquilo de C_1 - C_4 lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_4 lineal, y del modo más preferible alquilo de C_1 - C_3 lineal, por ejemplo, alquilo de C_1 o C_2 , especialmente alquilo de C_1 ; R_4 y R_5 forman un sistema aromático junto con el anillo de benceno de fórmula general I, preferiblemente un sistema aromático bicíclico, del modo más preferible naftilo; y los restantes se seleccionan independientemente de H y alquilo de C_1 - C_8 lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_8 lineal, preferiblemente alquilo de C_1 - C_6 lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_6 lineal, más preferiblemente alquilo de C_1 - C_4 lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_4 lineal, y del modo más preferible alquilo de C_1 - C_3 lineal, por ejemplo, alquilo de C_1 o C_2 , especialmente alquilo C_1 , preferiblemente H.

- 30 Por ejemplo, la alquil aril cetona de la fórmula general I es una cetona, en donde R_1 y R_2 son iguales y son alquilo de C_1 ; R_4 y R_5 forman un sistema aromático junto con el anillo de benceno de fórmula general I, preferiblemente un sistema aromático bicíclico, del modo más preferible naftilo; y los restantes son H.

- 35 Alternativamente, la alquil aril cetona de la fórmula general I es una cetona, en la que R_1 y R_2 son iguales y se seleccionan de alquilo de C_1 - C_8 lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_8 lineal, preferiblemente alquilo de C_1 - C_6 lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_6 lineal, más preferiblemente alquilo de C_1 - C_4 lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_4 lineal, y del modo más preferible alquilo de C_1 - C_3 lineal, por ejemplo, alquilo de C_1 o C_2 , especialmente alquilo de C_1 ; R_4 y R_5 forman un sistema aromático junto con el anillo de benceno de fórmula general I, preferiblemente un sistema aromático bicíclico, del modo más preferible naftilo; y uno de los R restantes, preferiblemente R_3 , es alqueno de C_2 - C_8 lineal o ramificado, preferiblemente alqueno de C_2 - C_6 y del modo más preferible alqueno de C_2 - C_3 ; alqueno de C_2 - C_8 , preferiblemente alqueno de C_2 - C_6 y del modo más preferible alqueno de C_3 - C_5 ; y alquenilarilalcoxi de C_9 - C_{15} , preferiblemente alquenilarilalcoxi de C_9 - C_{12} y del modo más preferible alquenilarilalcoxi de C_9 - C_{10} y los restantes son H.

- 40 Por ejemplo, la alquil aril cetona de la fórmula general I es una cetona, en donde R_1 y R_2 son iguales y son alquilo de C_1 ; R_4 y R_5 forman un sistema aromático junto con el anillo de benceno de fórmula general I, preferiblemente un sistema aromático bicíclico, del modo más preferible naftilo; y uno de los R restantes, preferiblemente R_3 , es el alquenilarilalcoxi de C_9 - C_{15} , preferiblemente alquenilarilalcoxi de C_9 - C_{12} y del modo más preferible alquenilarilalcoxi de C_9 - C_{10} y los restantes son H.

Se aprecia que la alquil aril cetona de la fórmula general I se hace reaccionar con un alcano de C₂-C₈ y/o alqueno de C₂-C₈ al menos parcialmente halogenados, y una base seleccionada de alcóxido C₁-C₈ de metal alcalino, alcóxido de C₁-C₈ de metal alcalino térreo y mezclas de los mismos, por lo cual se obtiene el correspondiente aril oxirano o alquil aril cetol α -funcionalizado.

5 Se prefiere que el alcano de C₂-C₈ y/o alqueno C₂-C₈ al menos parcialmente halogenados sea un alcano de C₂-C₆ y/o un alqueno C₂-C₆ al menos parcialmente halogenados, más preferiblemente un alcano de C₂-C₄ y/o un alqueno de C₂-C₄ al menos parcialmente halogenados. Por ejemplo, el alcano de C₂-C₈ y/o el alqueno de C₂-C₈ al menos parcialmente halogenados son un alcano de C₂ o C₃ y/o un alqueno de C₂ o C₃ al menos parcialmente halogenados, por ejemplo, un alcano de C₂ y/o alqueno de C₂ al menos parcialmente halogenados.

10 El alcano de C₂-C₈ y/o el alqueno de C₂-C₈ al menos parcialmente halogenados pueden estar al menos parcialmente clorados y/o bromados. Por ejemplo, el alcano de C₂-C₈ y/o el alqueno de C₂-C₈ al menos parcialmente halogenados están al menos parcialmente clorados o bromados. Alternativamente, el alcano de C₂-C₈ y/o el alqueno de C₂-C₈ al menos parcialmente halogenados están al menos parcialmente clorados y bromados y, por lo tanto, son un alcano de C₂-C₈ y/o un alqueno C₂-C₈ halogenados mixtos.

15 Preferiblemente, el alcano de C₂-C₈ y/o el alqueno C₂-C₈ al menos parcialmente halogenados están al menos parcialmente clorados.

En una forma de realización, el alcano de C₂-C₈ y/o el alqueno de C₂-C₈ al menos parcialmente halogenados están completamente halogenados. Preferiblemente, el alcano de C₂-C₈ y/o alqueno de C₂-C₈ al menos parcialmente halogenados son un alcano de C₂-C₆ y/o un alqueno de C₂-C₆ completamente halogenados, más preferiblemente un alcano de C₂-C₄ y/o un alqueno de C₂-C₄ completamente halogenados. Por ejemplo, el alcano de C₂-C₈ y/o el alqueno de C₂-C₈ al menos parcialmente halogenados son un alcano de C₂ o C₃ y/o alqueno de C₂ o C₃ completamente halogenados.

Por ejemplo, el alcano de C₂-C₈ y/o el alqueno de C₂-C₈ al menos parcialmente halogenados pueden estar completamente clorados y/o bromados. Por ejemplo, el alcano de C₂-C₈ y/o el alqueno de C₂-C₈ al menos parcialmente halogenados están completamente clorados o bromados. Alternativamente, el alcano de C₂-C₈ y/o el alqueno de C₂-C₈ al menos parcialmente halogenados están completamente clorados y bromados y, por lo tanto, son un alcano de C₂-C₈ y/o alqueno de C₂-C₈ halogenados mixtos.

Preferiblemente, el alcano de C₂-C₈ y/o el alqueno de C₂-C₈ al menos parcialmente halogenados están completamente clorados.

30 En una forma de realización, el alcano de C₂-C₈ y/o el alqueno de C₂-C₈ al menos parcialmente halogenados se seleccionan de hexacloroetano, tetracoroetileno, pentacoroopropano, hexabromoetano, tetrabromoetileno, pentabromopropano y sus mezclas. Preferiblemente, el alcano de C₂-C₈ y/o el alqueno de C₂-C₈ al menos parcialmente halogenados es hexacloroetano, tetracoroetileno y mezclas de los mismos. Por ejemplo, el alcano de C₂-C₈ y/o el alqueno de C₂-C₈ al menos parcialmente halogenados son hexacloroetano o tetracoroetileno.

35 En una forma de realización, el alcano de C₂-C₈ y/o el alqueno de C₂-C₈ al menos parcialmente halogenados son hexacloroetano.

Otro requisito del procedimiento es la adición de una base. Es un requisito de la presente invención que la base se seleccione del grupo que comprende alcóxido de C₁-C₈ de metal alcalino, alcóxido de C₁-C₈ de metal alcalino térreo y sus mezclas.

40 En una forma de realización, la base se selecciona del grupo que comprende alcóxido de sodio de C₁-C₆, preferiblemente alcóxido de C₁-C₄ de sodio y del modo más preferible alcóxido de C₁-C₂ de sodio; alcóxido de C₁-C₆ de litio, preferiblemente alcóxido de C₁-C₄ de litio y del modo más preferible alcóxido de C₁-C₂ de litio; alcóxido de C₁-C₆ de potasio, preferiblemente alcóxido de C₁-C₄ de potasio y del modo más preferible alcóxido de C₁-C₂ de potasio; y mezclas de los mismos. Preferiblemente, la base es alcóxido de C₁-C₆ de sodio, preferiblemente alcóxido de C₁-C₄ de sodio y del modo más preferible alcóxido de C₁-C₂ de sodio. Del modo más preferible, la base es alcóxido de C₁ de sodio.

La base se puede agregar como tal en el procedimiento. Alternativamente, la base está en forma de una solución acuosa o la base se proporciona en un disolvente orgánico, preferiblemente el disolvente orgánico se selecciona del grupo que comprende metanol, etanol, n-propanol, terc-butanol, diclorometano, tetracoroetileno, tetrahidrofurano, acetato de etilo, acetona, N,N-dimetilformamida, dimetilsulfóxido y sus mezclas. Preferiblemente, la base se proporciona en un disolvente orgánico; preferiblemente, el disolvente orgánico es metanol.

El procedimiento de la presente invención puede llevarse a cabo en un amplio intervalo de temperaturas. Por ejemplo, el procedimiento se lleva a cabo a una temperatura en el intervalo de 0 a 120°C, preferiblemente en el intervalo de 12 a 80°C, más preferiblemente en el intervalo de 15 a 50°C, y del modo más preferible en el intervalo de 15 a 30°C.

Preferiblemente, el procedimiento se lleva a cabo a temperatura ambiente, es decir, a una temperatura de aproximadamente 21°C ($\pm 2^\circ\text{C}$).

En una forma de realización, se prefiere que el procedimiento se lleve a cabo a temperatura elevada. Es decir, el procedimiento se lleva a cabo a una temperatura superior a la temperatura ambiente, preferiblemente en el intervalo de 30 a 120°C, más preferiblemente en el intervalo de 40 a 100°C, y del modo más preferible en el intervalo de 40 a 90°C.

Se aprecia además que el procedimiento puede llevarse a cabo en un disolvente orgánico. Preferiblemente, el disolvente orgánico se selecciona del grupo que comprende metanol, etanol, n-propanol, terc-butanol, diclorometano, tetracloroetileno, tetrahidrofurano, acetato de etilo, acetona, N,N-dimetilformamida, dimetilsulfóxido, dioxano tal como 1,3-dioxano o 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, éter dimetílico de dietilenglicol, éter dimetílico de trietilenglicol y sus mezclas.

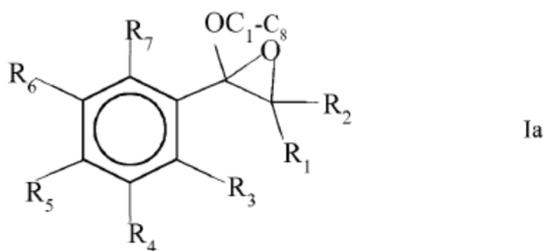
Si la base se proporciona en un disolvente orgánico, el disolvente orgánico es preferiblemente el mismo que el utilizado en el procedimiento. Por lo tanto, el disolvente orgánico es preferiblemente metanol.

La reacción y la puesta en contacto se llevan a cabo mezclando los componentes, es decir, la alquil aril cetona de la fórmula general I, el alcano de C₂-C₈ y/o el alqueno de C₂-C₈ al menos parcialmente halogenados, y la base seleccionada de alcóxido de C₁-C₈ de metal alcalino, alcóxido de C₁-C₈ de metal alcalinotérreo y sus mezclas. El experto en la materia adaptará las condiciones de mezclado (como la configuración de las herramientas de mezclado y la velocidad de mezclado) de acuerdo con su equipo de procedimiento.

Se ha encontrado que la secuencia de adición de los reactivos no es importante para el éxito de la reacción. Por lo tanto, la alquil aril cetona de la fórmula general I, la base seleccionada de alcóxido de C₁-C₈ de metal alcalino, alcóxido de C₁-C₈ de metal alcalino térreo y sus mezclas, el alcano de C₂-C₈ y/o alqueno de C₂-C₈ al menos parcialmente halogenados y, si está presente, el disolvente orgánico, se pueden poner en contacto en cualquier orden.

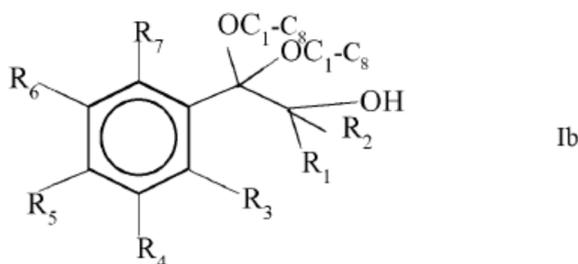
Preferiblemente, la alquil aril cetona de la fórmula general I, la base seleccionada de alcóxido de C₁-C₈ de metal alcalino, alcóxido de C₁-C₈ de metal alcalino térreo y sus mezclas y, si está presente, el disolvente orgánico, se ponen en contacto primero y luego se dosifica el alcano de C₂-C₈ y/o el alqueno de C₂-C₈ al menos parcialmente halogenados.

Se aprecia que el procedimiento para hacer reaccionar la alquil aril cetona de la fórmula general I, con el alcano de C₂-C₈ y/o alqueno de C₂-C₈ al menos parcialmente halogenados, y una base seleccionada de alcóxido de C₁-C₈ de metal alcalino, alcóxido de C₁-C₈ de metal alcalino térreo y mezclas de los mismos, da como resultado el correspondiente aril oxirano o alquil aril cetal α -funcionalizado. El aril oxirano obtenido es preferiblemente de la siguiente fórmula general Ia.



Con respecto a la definición de R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ y sus realizaciones preferidas, se hace referencia a las declaraciones proporcionadas anteriormente cuando se discuten los detalles técnicos del procedimiento y de la alquil aril cetona de la fórmula general I utilizada como material de partida en el procedimiento de la presente invención.

El alquil aril cetal α -funcionalizado obtenido tiene preferiblemente la siguiente fórmula general Ib.



Con respecto a la definición de R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ y sus realizaciones preferidas, se hace referencia a las declaraciones proporcionadas anteriormente cuando se discuten los detalles técnicos del procedimiento y de la alquil aril cetona de la fórmula general I utilizada como material de partida en el procedimiento de la presente invención.

5 El procedimiento de la presente invención puede comprender etapas adicionales para aislar y/o purificar el aril oxirano obtenido o el alquil aril cetal α -funcionalizado.

Por ejemplo, el procedimiento puede comprender además una etapa de

i) separar el aril oxirano o el alquil aril cetal α -funcionalizado obtenidos de la fase orgánica, y/o

ii) tomar el aril oxirano o el alquil aril cetal α -funcionalizado obtenidos en agua y extraer la fase acuosa obtenida con un disolvente orgánico.

10 En una forma de realización, el procedimiento comprende además las etapas de

i) separar el aril oxirano o el alquil aril cetal α -funcionalizado obtenidos de la fase orgánica, y

ii) tomar el aril oxirano o el alquil aril cetal α -funcionalizado obtenidos en agua y extraer la fase acuosa obtenida con un disolvente orgánico.

15 Además, el procedimiento puede comprender además una etapa de secado del aril oxirano o alquil aril cetal α -funcionalizado obtenidos.

Se aprecia que el aril oxirano o el alquil aril cetal α -funcionalizado obtenidos mediante el procedimiento puede seguir haciéndose reaccionar para obtener la correspondiente cetona α -funcionalizada.

20 En una forma de realización, el procedimiento de la presente invención comprende así una etapa adicional de poner en contacto el aril oxirano obtenido por el procedimiento en condiciones de transferencia de fase con una base seleccionada del grupo que comprende hidróxido de metal alcalino, hidróxido de metal alcalino térreo, alcóxido de C₁-C₈ de metal alcalino, alcóxido de C₁-C₈ de metal alcalinotérreo y mezclas y el compuesto seleccionado de HOR₉, HNHR₉ o HNR₁₀R₁₁ y R₉, R₁₀ y R₁₁ se seleccionan independientemente de H, alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, alquenilo de C₂-C₈ lineal o ramificado, alcoxi de C₁-C₈, alquenilo de C₂-C₈, cicloalquilo de C₃-C₈, cicloalcoxi de C₃-C₈, arilo de C₆-C₁₄, arilalquilo de C₇-C₁₅, arilalcoxi de C₇-C₁₅, alquenilarilalcoxi de C₉-C₁₅, alquenilarilalquilo de C₉-C₁₅; o R₁₀ y R₁₁ forman un sistema alicíclico de C₃-C₉ junto con el átomo de N o C de conexión; opcionalmente uno o más átomos de carbono se reemplazan con O, dando como resultado la cetona α -funcionalizada correspondiente.

30 Si se va a preparar una cetona α -funcionalizada a partir del aril oxirano, se requiere, por lo tanto, que el procedimiento se lleve a cabo en condiciones de transferencia de fase. Tales condiciones de transferencia de fase son bien conocidas en la técnica de tal manera que el experto en la materia aplicará fácilmente las condiciones de reacción que son adecuadas para la reacción mencionada. El experto también puede aplicar variantes de tales reacciones que son conocidas per se y no se mencionan aquí en detalle.

35 En particular, la reacción del aril oxirano se lleva a cabo en presencia de un catalizador de transferencia de fase con la base seleccionada del grupo que comprende hidróxido de metal alcalino, hidróxido de metal alcalino térreo, alcóxido de C₁-C₈ de metal alcalino, alcóxido de C₁-C₈ de metal alcalino térreo y mezclas y el compuesto seleccionado de HOR₉, HNHR₉ o HNR₁₀R₁₁, donde R₉, R₁₀ y R₁₁ se seleccionan independientemente de H, alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, alquenilo de C₂-C₈ lineal o ramificado, alcoxi de C₁-C₈, alquenilo de C₂-C₈, cicloalquilo de C₃-C₈, cicloalcoxi de C₃-C₈, arilo de C₆-C₁₄, arilalquilo de C₇-C₁₅, arilalcoxi de C₇-C₁₅, alquenilarilalcoxi de C₉-C₁₅, alquenilarilalquilo de C₉-C₁₅; o R₁₀ y R₁₁ forman un sistema alicíclico de C₃-C₉ junto con el átomo de N o C de conexión, opcionalmente uno o más átomos de carbono se reemplazan con O.

40 El catalizador de transferencia de fase se puede seleccionar de cualquier catalizador de transferencia de fase conocido en la técnica. Sin embargo, el catalizador de transferencia de fase se selecciona preferiblemente de una sal de amonio cuaternario, cloruro de tetraalquilfosfonio, bromuro de tetraalquilfosfonio y mezclas de los mismos. Más preferiblemente, el catalizador de transferencia de fase es una sal de tetraalquilamonio o una sal trialquilarilamonio, y del modo más preferible el catalizador de transferencia de fase se selecciona del grupo que comprende hidróxido de benciltrimetilamonio, cloruro de benciltrietilamonio, cloruro de tetrabutilamonio, bromuro de tetrabutilamonio, hidrogenosulfato de tetrabutilamonio, hidróxido de tetrabutilamonio, cloruro de metiltriocetilamonio, cetilpiridinio y sus mezclas

45 Tales catalizadores de transferencia de fase son bien conocidos en la técnica de tal manera que la persona experta aplicará fácilmente catalizadores que sean adecuados para la reacción mencionada. El experto también puede aplicar variantes de tales catalizadores que son conocidas per se y no se mencionan aquí detalladamente.

50 La cantidad de catalizadores de transferencia de fase se puede elegir según se desee dentro de amplios límites, preferiblemente de 0.1 a 100% en peso, basado en el peso del aril oxirano.

Se prefiere que la base se seleccione del grupo que comprende hidróxido de sodio; hidróxido de potasio; alcóxido de C₁-C₆ de sodio, preferiblemente alcóxido de C₁-C₄ de sodio y del modo más preferible alcóxido de C₁-C₂ de sodio; alcóxido de C₁-C₆ de litio, preferiblemente alcóxido de C₁-C₄ de litio y del modo más preferible alcóxido de C₁-C₂ de litio; alcóxido de C₁-C₆ de potasio, preferiblemente alcóxido de C₁-C₄ de potasio y del modo más preferible alcóxido de C₁-C₂ de potasio; y mezclas de los mismos. Preferiblemente, la base se selecciona del grupo que comprende hidróxido de sodio y alcóxido de C₁-C₆ de sodio, preferiblemente alcóxido de C₁-C₄ de sodio y del modo más preferible alcóxido de C₁-C₂ de sodio. Del modo más preferible, la base es hidróxido de sodio.

La base se puede agregar como tal en el procedimiento. Alternativamente, la base está en forma de una solución acuosa o la base se proporciona en un disolvente orgánico, preferiblemente el disolvente orgánico se selecciona del grupo que comprende metanol, etanol, n-propanol, terc-butanol, diclorometano, tetracloroetileno, tetrahidrofurano, acetato de etilo, acetona, N,N-dimetilformamida, dimetilsulfóxido, dioxano como 1,3-dioxano o 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, éter dimetilico de dietilenglicol, éter dimetilico de trietilenglicol y sus mezclas. Preferiblemente, la base se proporciona en forma de una solución acuosa.

Otro componente esencial que se agregará para hacer reaccionar el aril oxirano obtenido en la cetona α -funcionalizada correspondiente, es un compuesto seleccionado de HOR₉, HNHR₉ o HNR₁₀R₁₁ donde R₉, R₁₀ y R₁₁, se seleccionan independientemente de H, alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, alcoxi de C₁-C₈, alquenoiloxi de C₂-C₈, cicloalquilo de C₃-C₈, cicloalcoxi de C₃-C₈, arilo de C₆-C₁₄, arilalquilo de C₇-C₁₄, arilalcoxi de C₇-C₁₄, alquenoilarilalcoxi de C₉-C₁₅, alquenoilalquilo de C₉-C₁₅; o R₁₀ y R₁₁ forman un sistema alicíclico de C₃-C₉ junto con el átomo de N o C de conexión; opcionalmente uno o más átomos de carbono se reemplazan con O.

En una forma de realización, el compuesto es HOR₉ donde R₉ se selecciona entre alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, alcoxi de C₁-C₈, alquenoiloxi de C₂-C₈, cicloalquilo de C₃-C₈, cicloalcoxi de C₃-C₈, arilalcoxi de C₇-C₁₄ y alquenoilarilalcoxi de C₉-C₁₅; preferiblemente R₉ es alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado; por ejemplo, alquilo de C₁-C₈ lineal, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado; por ejemplo, alquilo de C₁-C₆ lineal, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado; por ejemplo, alquilo de C₁-C₄ lineal, y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal; por ejemplo, alquilo de C₁ o C₂, especialmente alquilo de C₁, cicloalquilo de C₃-C₈, preferiblemente cicloalquilo de C₄-C₈, más preferiblemente cicloalquilo de C₄-C₆, y del modo más preferible cicloalquilo de C₅ o C₆; por ejemplo, cicloalquilo de C₆ y arilo de C₆-C₁₄.

Alternativamente, el compuesto es HNR₁₀R₁₁ donde R₁₀ y R₁₁ se seleccionan independientemente de H, alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, cicloalquilo de C₃-C₈, arilo de C₆-C₁₄, o R₁₀ y R₁₁ forman un sistema alicíclico de C₃-C₆ junto con el átomo de N de conexión, opcionalmente uno o más átomos de carbono se reemplazan con O, preferiblemente R₁₀ y R₁₁ forman un sistema alicíclico de C₅-C₆ junto con el átomo de N de conexión y uno o más átomos de carbono se reemplazan con O.

Preferiblemente, el compuesto es HNR₁₀R₁₁ donde R₁₀ y R₁₁ forman un sistema alicíclico de C₅-C₆, preferiblemente un sistema alicíclico de C₆, junto con el átomo de N de conexión; y uno o más átomos de carbono, preferiblemente un átomo de carbono, se reemplaza con O.

Por ejemplo, el compuesto es morfolina.

El paso adicional de hacer reaccionar el aril oxirano en la correspondiente cetona α -funcionalizada puede llevarse a cabo en un amplio intervalo de temperatura. Por ejemplo, esta etapa se lleva a cabo a una temperatura de al menos 30 °C, preferiblemente en el intervalo de 30 a 120°C, más preferiblemente en el intervalo de 40 a 100°C, y del modo más preferible en el intervalo de 40 a 90°C.

Se aprecia además que la etapa adicional de hacer reaccionar el aril oxirano en la correspondiente cetona α -funcionalizada puede llevarse a cabo en un disolvente orgánico. Preferiblemente, el disolvente orgánico se selecciona del grupo que comprende metanol, etanol, n-propanol, terc-butanol, diclorometano, tetracloroetileno, tetrahidrofurano, acetato de etilo, acetona, N,N-dimetilformamida, dimetilsulfóxido, dioxano como 1,3-dioxano o 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, éter dimetilico de dietilenglicol, éter dimetilico de trietilenglicol y sus mezclas.

Si la base se proporciona en un disolvente orgánico, el disolvente orgánico es preferiblemente el mismo que el utilizado en el procedimiento.

La etapa adicional de hacer reaccionar el aril oxirano en la cetona α -funcionalizada correspondiente se lleva a cabo mezclando los componentes, es decir, el aril oxirano, el catalizador de transferencia de fase, la base seleccionada del grupo que comprende hidróxido de metal alcalino, hidróxido de metal alcalino térreo, alcóxido de C₁-C₈ de metal alcalino, alcóxido de C₁-C₈ de metal alcalino térreo y mezclas y el compuesto seleccionado de HOR₉, HNHR₉ o HNR₁₀R₁₁ donde R₉, R₁₀ y R₁₁ se seleccionan independientemente de H, alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, de alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, alcoxi de C₁-C₈, alquenoiloxi de C₂-C₈, cicloalquilo de C₃-C₈, cicloalcoxi de C₃-C₈, arilo de C₆-C₁₄, arilalquilo de C₇-C₁₄, arilalcoxi de C₇-C₁₄, alquenoilarilalcoxi de C₉-C₁₅, alquenoilalquilo de C₉-C₁₅; o R₁₀ y R₁₁ forman un sistema alicíclico de C₃-C₉ junto con el átomo de N o C de conexión; opcionalmente uno o más átomos de carbono se reemplazan con O. El experto en la materia adaptará las condiciones de mezcla (como la configuración de las herramientas de mezcla y la velocidad de mezcla) de acuerdo con su equipo de procedimiento.

- Se ha encontrado que la secuencia de adición de los reactivos no es importante para el éxito de la reacción. Así, pueden ponerse en contacto en cualquier orden el aril oxirano, el catalizador de transferencia de fase, la base seleccionada del grupo que comprende hidróxido de metal alcalino, hidróxido de metal alcalino térreo, alcóxido de C₁-C₈ de metal alcalino, alcóxido de C₁-C₈ de metal alcalino térreo y mezclas y el compuesto seleccionado de HOR₉, HNHR₉ o HNR₁₀R₁₁ donde R₉, R₁₀ y R₁₁ se seleccionan independientemente de H, alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, alquenilo de C₂-C₈ lineal o ramificado, alcoxi de C₁-C₈, alquenilo de C₂-C₈, cicloalquilo de C₃-C₈, cicloalcoxi de C₃-C₈, arilo de C₆-C₁₄, arilalquilo de C₇-C₁₅, arilalcoxi de C₇-C₁₅, alquenilarilalcoxi de C₉-C₁₅, alquenilarilalquilo de C₉-C₁₅; o R₁₀ y R₁₁ forman un sistema alicíclico de C₃-C₉ junto con el átomo de N o C de conexión; opcionalmente uno o más átomos de carbono se reemplazan con O.
- 5 Se aprecia que la etapa de hacer reaccionar el aril oxirano en condiciones de transferencia de fase con una base seleccionada del grupo que comprende hidróxido de metal alcalino, hidróxido de metal alcalino térreo, alcóxido de C₁-C₈ de metal alcalino, alcóxido de C₁-C₈ de metal alcalino térreo y mezclas y un compuesto seleccionado de HOR₉, HNHR₉ o HNR₁₀R₁₁ donde R₉, R₁₀ y R₁₁ se seleccionan independientemente de H, alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, alquenilo de C₂-C₈ lineal o ramificado, alcoxi de C₁-C₈, alquenilo de C₂-C₈, cicloalquilo de C₃-C₈, cicloalcoxi de C₃-C₈, arilo de C₆-C₁₄, C₇-C₁₅-arilalquilo, arilalcoxi de C₇-C₁₅, alquenilarilalcoxi de C₉-C₁₅, alquenilarilalquilo de C₉-C₁₅; o R₁₀ y R₁₁ forman un sistema alicíclico de C₃-C₉ junto con el átomo de N o C de conexión, opcionalmente uno o más átomos de carbono se reemplazan con O, da como resultado la cetona α -funcionalizada correspondiente.
- 10 Después del paso de hacer reaccionar el aril oxirano, el procedimiento puede comprender pasos adicionales para aislar y/o purificar la cetona α -funcionalizada obtenida.
- 15 Por ejemplo, el procedimiento puede comprender además una etapa de
- separar la cetona α -funcionalizada obtenida de la fase orgánica, y/o
 - llevar la cetona α -funcionalizada obtenida a agua y extraer la fase acuosa obtenida con un disolvente orgánico.
- En una forma de realización, el procedimiento comprende además los pasos de
- separar la cetona α -funcionalizada obtenida de la fase orgánica, y
 - llevar la cetona α -funcionalizada obtenida a agua y extraer la fase acuosa obtenida con un disolvente orgánico.
- Además, el procedimiento también puede comprender una etapa de secado de la cetona α -funcionalizada obtenida.
- Alternativamente, el procedimiento comprende una etapa adicional de poner en contacto el alquil aril cetal α -funcionalizado obtenido por el procedimiento con un ácido obteniendo de ese modo la correspondiente cetona α -funcionalizada.
- 30 Se aprecia que el ácido no está restringido a un ácido específico, pero se prefiere que el ácido tenga un valor de pKa inferior a 5, más preferiblemente en el intervalo de -10 a 10, y del modo más preferible en el intervalo de -8 a 5.
- En una forma de realización, el ácido se selecciona preferiblemente del grupo que comprende ácido clorhídrico, ácido acético, ácido fosfórico, ácido sulfúrico, ácido cítrico, ácido toluenosulfónico, ácido metanosulfónico, ácido cloroacético, ácido tricloroacético, ácido tartárico, ácido succínico, ácido maleico, ácido fumárico, ácido láctico, ácido málico, ácido propiónico, ácido butírico y sus mezclas. Por ejemplo, el ácido se selecciona de ácido clorhídrico, ácido acético, ácido fosfórico, ácido sulfúrico, ácido cítrico y mezclas de los mismos. En una forma de realización, el ácido es ácido clorhídrico.
- 35 El ácido se puede agregar como tal en el procedimiento. Alternativamente, el ácido está en forma de una solución acuosa o el ácido se proporciona en un disolvente orgánico; preferiblemente, el disolvente orgánico se selecciona del grupo que comprende metanol, etanol, n-propanol, terc-butanol, diclorometano, tetracloroetileno, tetrahidrofurano, acetato de etilo, acetona, N,N-dimetilformamida, dimetilsulfóxido, dioxano como 1,3-dioxano o 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, éter dimetilico de dietilenglicol, éter dimetilico de trietilenglicol y sus mezclas. Preferiblemente, el ácido se proporciona en forma de una solución acuosa y, por lo tanto, está en forma de un ácido acuoso diluido. Esto es ventajoso ya que se puede evitar la reacción hacia los éteres enólicos.
- 40 La etapa posterior de hacer reaccionar el alquil aril cetal α -funcionalizado en la correspondiente cetona α -funcionalizada puede llevarse a cabo en un amplio intervalo de temperatura. Por ejemplo, este paso se lleva a cabo a una temperatura en el intervalo de 0 a 120°C, preferiblemente en el intervalo de 12 a 80°C, más preferiblemente en el intervalo de 15 a 50°C, y del modo más preferible en el intervalo de 15 a 30°C.
- 45 Preferiblemente, esta etapa se lleva a cabo a temperatura ambiente; es decir, a una temperatura de aproximadamente 21°C (\pm 2°C).
- 50 Se aprecia además que la etapa posterior de hacer reaccionar el alquil aril cetal α -funcionalizado en la correspondiente cetona α -funcionalizada se puede llevar a cabo en un disolvente orgánico. Preferiblemente, el disolvente orgánico se selecciona del grupo que comprende metanol, etanol, n-propanol, terc-butanol, diclorometano, tetracloroetileno,

tetrahidrofurano, acetato de etilo, acetona, N,N-dimetilformamida, dimetilsulfóxido, dioxano como 1,3-dioxano o 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, éter dimetílico de dietilenglicol, éter dimetílico de trietilenglicol y sus mezclas.

Si el ácido se proporciona en un disolvente orgánico, los disolventes orgánicos son preferiblemente los mismos.

5 La etapa de hacer reaccionar el alquil aril cetal α -funcionalizado en la cetona α -funcionalizada correspondiente se lleva a cabo mezclando los componentes, es decir, el alquil aril cetal α -funcionalizado y el ácido y, si está presente, el disolvente orgánico. El experto en la materia adaptará las condiciones de mezclado (como la configuración de las herramientas de mezclado y la velocidad de mezclado) de acuerdo con su equipo de procedimiento.

10 Se ha encontrado que la secuencia de adición de los reactivos es importante para el éxito de este paso de reacción. Los mejores rendimientos se obtienen cuando el alquil aril cetal α -funcionalizado y, si está presente, el disolvente orgánico se pone en contacto primero y se dosifica el ácido.

Después del paso de hacer reaccionar el alquil aril cetal α -funcionalizado, el procedimiento puede comprender pasos adicionales para aislar y/o purificar la cetona α -funcionalizada obtenida.

Por ejemplo, el procedimiento puede comprender además una etapa de

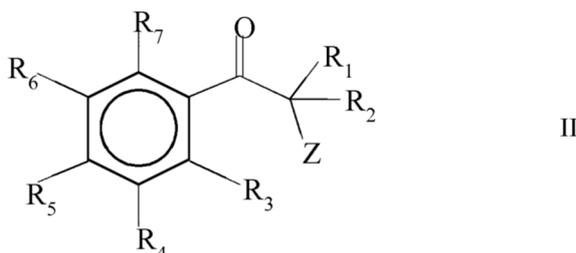
- 15 i) separar la cetona α -funcionalizada obtenida de la fase orgánica, y/o
ii) llevar la cetona α -funcionalizada obtenida a agua y extraer la fase acuosa obtenida con un disolvente orgánico.

En una forma de realización, el procedimiento comprende además los pasos de

- i) separar la cetona α -funcionalizada obtenida de la fase orgánica, y
ii) llevar la cetona α -funcionalizada obtenida en agua y extraer la fase acuosa obtenida con un disolvente orgánico.

Además, el procedimiento puede comprender además una etapa de secado de la cetona α -funcionalizada obtenida.

20 Se aprecia que se obtiene una cetona α -funcionalizada de la fórmula general II haciendo reaccionar adicionalmente el aril oxirano o el alquil aril cetal α -funcionalizado,



25 en donde R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son como se definieron anteriormente; y Z se selecciona de OR₉, NHR₉ y NR₁₀R₁₁ donde R₉, R₁₀ y R₁₁ se seleccionan independientemente de H, alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, alqueniilo de C₂-C₈ lineal o ramificado, alcoxi de C₁-C₈, alqueniilo de C₂-C₈, cicloalquilo de C₃-C₈, cicloalcoxi de C₃-C₈, arilo de C₆-C₁₄, arilalquilo de C₇-C₁₅, arilalcoxi de C₇-C₁₅, alqueniilarilalcoxi de C₉-C₁₅, alqueniilarilalquilo de C₉-C₁₅; o R₁₀ y R₁₁ forman un sistema alicíclico de C₃-C₉ junto con el átomo de N o C de conexión, opcionalmente uno o más átomos de carbono se reemplazan con O.

30 En una forma de realización, Z es OR₉ donde R₉ se selecciona de H, alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, alqueniilo de C₂-C₈ lineal o ramificado, alcoxi de C₁-C₈, alqueniilo de C₂-C₈, cicloalquilo de C₃-C₈, cicloalcoxi de C₃-C₈, arilalcoxi de C₇-C₁₅ y alqueniilarilalcoxi de C₉-C₁₅, preferiblemente R₉ es H o Z es NR₁₀R₁₁ donde R₁₀ y R₁₁ se selecciona independientemente de H, alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, cicloalquilo de C₃-C₈, arilo de C₆-C₁₄, o R₁₀ y R₁₁ forman un sistema alicíclico de C₃-C₆ junto con el átomo de N de conexión; opcionalmente uno o más átomos de carbono se reemplazan con O, preferiblemente R₁₀ y R₁₁ forman un sistema alicíclico de C₅-C₆ junto con el átomo de N de conexión y uno o más carbonos los átomos se reemplazan con O.

35 Preferiblemente, Z es OR₉ donde R₉ es H o NR₁₀R₁₁ donde R₁₀ y R₁₁ forman un sistema alicíclico de C₅-C₆, preferiblemente un sistema alicíclico de C₆, junto con el átomo de N de conexión y uno o más átomos de carbono; preferiblemente un átomo de carbono, es/son reemplazados con O.

40 Con respecto a la definición de R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ y sus formas de realización preferidas, se hace referencia a las declaraciones proporcionadas anteriormente cuando se discuten los detalles técnicos del procedimiento y la alquil aril cetona de la fórmula general I utilizada como material de partida en el procedimiento de la presente invención.

Una cetona α -funcionalizada especialmente preferida de la fórmula general II obtenida por el procedimiento es una cetona, en la que R₁ y R₂ son iguales y se seleccionan de alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de

C₁-C₈ lineal, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₆ lineal, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₄ lineal, y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal, por ejemplo, alquilo de C₁ o C₂, especialmente alquilo de C₁; R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son iguales y son H, y Z es OR₉ donde R₉ es H.

- 5 Por ejemplo, la cetona α -funcionalizada de la fórmula general II obtenida por el procedimiento es una cetona, en la que R₁ y R₂ son iguales y son alquilo de C₁; R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son iguales y son H, y Z es OR₉ donde R₉ es H.

Alternativamente, la cetona α -funcionalizada de la fórmula general II obtenida por el procedimiento es una cetona, en la que R₁ y R₂ forman cicloalquilo de C₃-C₁₂, preferiblemente cicloalquilo de C₄-C₁₀, más preferiblemente cicloalquilo de C₄-C₈, incluso más preferiblemente cicloalquilo de C₄-C₆, y del modo más preferible cicloalquilo de C₅ o C₆, por ejemplo, cicloalquilo de C₆, junto con el átomo C de conexión; R₄, R₅, R₆ y R₇ son iguales y son H, y Z es OR₉ donde R₉ es H.

Alternativamente, la cetona α -funcionalizada de la fórmula general I es una cetona, en la que R₁ y R₂ son iguales y se seleccionan de alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₈ lineal, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₆ lineal, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₄ lineal, y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal, por ejemplo, alquilo de C₁ o C₂, especialmente alquilo de C₁; R₄, R₅, R₆ y R₇ son iguales y son H, y Z es NR₁₀R₁₁ donde R₁₀ y R₁₁ forman un sistema alicíclico de C₅-C₆, preferiblemente un sistema alicíclico de C₆.

Alternativamente, la cetona α -funcionalizada de la fórmula general II obtenida por el procedimiento es una cetona, en la que R₁ y R₂ son iguales y se seleccionan de alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₈ lineal, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₆ lineal, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₄ lineal, y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal, por ejemplo, alquilo de C₁ o C₂, especialmente alquilo de C₁; R₄, R₅, R₆ y R₇ son iguales y son H, y Z es NR₁₀R₁₁ donde R₁₀ y R₁₁ forman un sistema alicíclico de C₅-C₆, preferiblemente un sistema alicíclico de C₆, junto con el átomo de N de conexión y uno o más, preferiblemente uno, átomos de carbono son reemplazados con O.

25 Por ejemplo, la cetona α -funcionalizada de la fórmula general II obtenida por el procedimiento es una cetona, en la que R₁ y R₂ son iguales y son alquilo de C₁; R₄, R₅, R₆ y R₇ son iguales y son H, y Z es NR₁₀R₁₁ donde R₁₀ y R₁₁ forman un sistema alicíclico de C₅-C₆, preferiblemente un sistema alicíclico de C₆, junto con el átomo de N de conexión y uno o más, preferiblemente uno, átomos de carbono son reemplazados con O.

30 Alternativamente, la cetona α -funcionalizada de la fórmula general II obtenida por el procedimiento es una cetona, en la que R₁ y R₂ son iguales y se seleccionan de alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₈ lineal, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₆ lineal, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₄ lineal, y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal, por ejemplo, alquilo de C₁ o C₂, especialmente alquilo de C₁; R₄, R₅, R₆ y R₇ son diferentes y uno de ellos, preferiblemente R₅, es alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alqueno de C₂-C₆ lineal o ramificado y del modo más preferible alqueno de C₂-C₃, por ejemplo, alqueno de C₂; y los restantes son H y Z es OR₉ donde R₉ es H.

35 Por ejemplo, la cetona α -funcionalizada de la fórmula general II obtenida por el procedimiento es una cetona, en la que R₁ y R₂ son iguales y son alquilo de C₁-C₁; R₄, R₅, R₆ y R₇ son diferentes y uno de ellos, preferiblemente R₅, es alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alqueno de C₂-C₆ lineal o ramificado y del modo más preferible alqueno de C₂-C₃, por ejemplo, alqueno de C₂; y los restantes son H y Z es OR₉ donde R₉ es H.

40 Alternativamente, la cetona α -funcionalizada de la fórmula general II obtenida por el procedimiento es una cetona, en la que R₁ y R₂ son iguales y se seleccionan de alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₈ lineal, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₆ lineal, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₄ lineal, y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal, por ejemplo, alquilo de C₁ o C₂, especialmente alquilo de C₁; R₄, R₅, R₆ y R₇ son diferentes y uno de ellos, preferiblemente R₅, es alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alqueno de C₂-C₆ lineal o ramificado y del modo más preferible alqueno de C₂-C₃, por ejemplo, alqueno de C₂; y los restantes son H y Z es NR₁₀R₁₁ donde R₁₀ y R₁₁ forman un sistema alicíclico de C₅-C₆, preferiblemente un sistema alicíclico de C₆, junto con el átomo de N de conexión y uno o más, preferiblemente uno, los átomos de carbono se reemplazan con O.

50 Por ejemplo, la cetona α -funcionalizada de la fórmula general II obtenida por el procedimiento es una cetona, en la que R₁ y R₂ son iguales y son alquilo de C₁; R₄, R₅, R₆ y R₇ son diferentes y uno de ellos, preferiblemente R₅, es alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alqueno de C₂-C₆ lineal o ramificado y del modo más preferible alqueno de C₂-C₃, por ejemplo, alqueno de C₂; y los restantes son H y Z es NR₁₀R₁₁ donde R₁₀ y R₁₁ forman un sistema alicíclico de C₅-C₆, preferiblemente un sistema alicíclico de C₆, junto con el átomo de N de conexión y uno o más, preferiblemente uno, átomos de carbono se reemplazan con O.

55 Alternativamente, la cetona α -funcionalizada de la fórmula general II obtenida por el procedimiento es una cetona, en la que R₁ y R₂ son iguales y se seleccionan de alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₈ lineal, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₆ lineal, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C₁-C₄ lineal, y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal, por

Alternativamente, la cetona α -funcionalizada de la fórmula general II obtenida por el procedimiento es una cetona, en la que R_1 y R_2 son diferentes y se seleccionan de H y alquilo de C_1 - C_8 lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_8 lineal, preferiblemente alquilo de C_1 - C_6 lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_6 lineal, más preferiblemente alquilo de C_1 - C_4 lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_4 lineal, y del modo más preferible alquilo de C_1 - C_3 lineal, por ejemplo, alquilo de C_1 o C_2 , especialmente alquilo de C_1 ; R_3 , R_4 , R_5 , R_6 y R_7 son diferentes y dos de ellos, preferiblemente R_4 y R_5 , son alcoxi de C_1 - C_8 , preferiblemente alcoxi de C_1 - C_6 y del modo más preferible alcoxi de C_1 - C_3 , especialmente alcoxi de C_1 ; y los restantes, preferiblemente R_3 , R_6 y R_7 , son H y Z es OR_9 donde R_9 es H.

Por ejemplo, la cetona α -funcionalizada de la fórmula general II obtenida por el procedimiento es una cetona, en la que R_1 y R_2 son diferentes y son H y alquilo de C_2 ; R_3 , R_4 , R_5 , R_6 y R_7 son diferentes y dos de ellos, preferiblemente R_4 y R_5 , son alcoxi de C_1 - C_8 , preferiblemente alcoxi de C_1 - C_6 y del modo más preferible alcoxi de C_1 - C_3 , especialmente alcoxi de C_1 ; y los restantes, preferiblemente R_3 , R_6 y R_7 , son H y Z es OR_9 donde R_9 es H.

Alternativamente, la cetona α -funcionalizada de la fórmula general II obtenida por el procedimiento es una cetona, en la que R_1 y R_2 son diferentes y se seleccionan de H y alquilo de C_1 - C_8 lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_8 lineal, preferiblemente alquilo de C_1 - C_6 lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_6 lineal, más preferiblemente alquilo de C_1 - C_4 lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_4 lineal, y del modo más preferible alquilo de C_1 - C_3 lineal, por ejemplo, alquilo de C_1 o C_2 , especialmente alquilo de C_1 ; R_3 , R_4 , R_5 , R_6 y R_7 son diferentes y uno de ellos, preferiblemente R_5 , es $N(R_8)_2$ donde R_8 forma un sistema alicíclico de C_3 - C_9 , preferiblemente un sistema alicíclico de C_3 - C_7 , más preferiblemente un sistema alicíclico de C_4 - C_6 y del modo más preferible un sistema alicíclico de C_5 o C_6 , junto con el átomo de N de conexión, en el que uno o más, preferiblemente uno, átomos de carbono se reemplazan con O; y los restantes, preferiblemente R_3 , R_4 , R_6 y R_7 , son H y Z es OR_9 donde R_9 es H.

Por ejemplo, la cetona α -funcionalizada de la fórmula general II obtenida por el procedimiento es una cetona, en la que R_1 y R_2 son diferentes y son H y alquilo de C_2 ; R_3 , R_4 , R_5 , R_6 y R_7 son diferentes y uno de ellos, preferiblemente R_5 , es $N(R_8)_2$ donde R_8 forma un sistema alicíclico de C_3 - C_9 , preferiblemente un sistema alicíclico de C_3 - C_7 , más preferiblemente un sistema alicíclico de C_4 - C_6 y del modo más preferible un sistema alicíclico de C_5 o C_6 , junto con el átomo de N de conexión, en el que uno o más, preferiblemente uno, átomos de carbono se reemplazan con O; y los restantes, preferiblemente R_3 , R_4 , R_6 y R_7 , son H y Z es OR_9 donde R_9 es H.

Alternativamente, la cetona α -funcionalizada de la fórmula general II obtenida por el procedimiento es una cetona, en la que R_1 y R_2 son iguales y se seleccionan de alquilo de C_1 - C_8 lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_8 lineal, preferiblemente alquilo de C_1 - C_6 lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_6 lineal, más preferiblemente alquilo de C_1 - C_4 lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_4 lineal, y del modo más preferible alquilo de C_1 - C_3 lineal, por ejemplo, alquilo de C_1 o C_2 , especialmente alquilo de C_1 ; R_4 y R_5 forman un sistema aromático junto con el anillo de benceno de fórmula general I, preferiblemente un sistema aromático bicíclico, del modo más preferible naftilo; y los restantes se seleccionan independientemente de H y alquilo de C_1 - C_8 lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_8 lineal, preferiblemente alquilo de C_1 - C_6 lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_6 lineal, más preferiblemente alquilo de C_1 - C_4 lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_4 lineal, y del modo más preferible alquilo de C_1 - C_3 lineal, por ejemplo, alquilo de C_1 o C_2 , especialmente alquilo de C_1 , preferiblemente H, y Z es OR_9 donde R_9 es H.

Por ejemplo, la cetona α -funcionalizada de la fórmula general II obtenida por el procedimiento es una cetona, en la que R_1 y R_2 son iguales y son alquilo de C_1 ; R_4 y R_5 forman un sistema aromático junto con el anillo de benceno de fórmula general I, preferiblemente un sistema aromático bicíclico, del modo más preferible naftilo; y los restantes son H y Z es OR_9 donde R_9 es H.

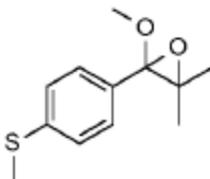
Alternativamente, la cetona α -funcionalizada de la fórmula general II obtenida por el procedimiento es una cetona, en la que R_1 y R_2 son iguales y se seleccionan de alquilo de C_1 - C_8 lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_8 lineal, preferiblemente alquilo de C_1 - C_6 lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_6 lineal, más preferiblemente alquilo de C_1 - C_4 lineal o ramificado, por ejemplo, alquilo de C_1 - C_4 lineal, y del modo más preferible alquilo de C_1 - C_3 lineal, por ejemplo, alquilo de C_1 o C_2 , especialmente alquilo de C_1 ; R_4 y R_5 forman un sistema aromático junto con el anillo de benceno de fórmula general I, preferiblemente un sistema aromático bicíclico, del modo más preferible naftilo; y uno de los R restantes, preferiblemente R_3 , es alqueno de C_2 - C_8 lineal o ramificado, preferiblemente alqueno de C_2 - C_6 y del modo más preferible alqueno de C_2 - C_3 ; alqueno de C_2 - C_8 , preferiblemente alqueno de C_2 - C_6 y del modo más preferible alqueno de C_3 - C_5 ; y alqueno de C_9 - C_{15} , preferiblemente alqueno de C_9 - C_{12} y del modo más preferible alqueno de C_9 - C_{10} y los restantes son H, y Z es OR_9 donde R_9 es H.

Por ejemplo, la cetona α -funcionalizada de la fórmula general II obtenida por el procedimiento es una cetona, en la que R_1 y R_2 son iguales y son alquilo de C_1 ; R_4 y R_5 forman un sistema aromático junto con el anillo de benceno de fórmula general I, preferiblemente un sistema aromático bicíclico, del modo más preferible naftilo; y uno de los R restantes, preferiblemente R_3 , es alqueno de C_9 - C_{15} , preferiblemente alqueno de C_9 - C_{12} y del modo más preferible alqueno de C_9 - C_{10} y los restantes son H, y Z es OR_9 donde R_9 es H.

El alcance y el interés de la invención se entenderán mejor en base a los siguientes ejemplos que pretenden ilustrar ciertas formas de realización de la invención y no son limitativos.

EJEMPLOS

Ejemplo 1: Preparación de 2-metoxi-3,3-dimetil-2-(4-metiltiofenil) oxirano

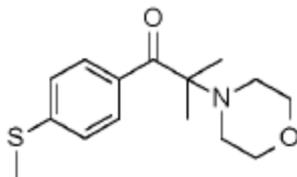


5 Una mezcla de metóxido de sodio (30% en metanol, 8.34 g, 154 mmol), metanol (15.5 ml), 2-metil-1-(4-metiltiofenil) propan-1-ona (3.00 g, 15.4 mmol) y hexacloroetano (5.48 g, 23.2 mmol) se agitó durante la noche a temperatura ambiente. El disolvente se evaporó, el residuo se recogió con agua (25 ml) y se extrajo con acetato de etilo (3 x 20 ml). Las fases orgánicas combinadas se lavaron con salmuera (30 ml), se secaron sobre Na₂SO₄ y se evaporó el disolvente. Se obtuvo 2-metoxi-3,3-dimetil-2-(4-metiltiofenil) oxirano como un aceite amarillo (2.86 g, 12.8 mmoles, 82% de rendimiento).

10 ¹H-NMR (400.1 MHz, CDCl₃): δ = 1.03 (s, 3H), 1.55 (s, 1H), 2.52 (s, 3H), 3.23 (s, 3H), 7.24-7.31 (m, 2H), 7.34-7.43 (m, 2 H) ppm.

¹³C-NMR (100.6 MHz, CDCl₃): δ = 15.5, 19.8, 20.0, 52.6, 67.3, 124.7, 125.8, 128.4, 130.3, 131.4, 139.0 ppm.

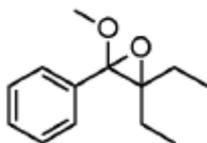
Ejemplo 2: Preparación de 2-metil-1-(4-metiltiofenil)-2-morfolino-propan-1-ona



15 Una mezcla de 2-metoxi-3,3-dimetil-2-(4-metiltiofenil) oxirano (0.13 g, 0.58 mmol), morfolina (2.27 g, 26.1 mmol), solución de hidróxido de sodio (50%, 0.28 g, 3.5 mmol) e hidrogenosulfato de tetrabutilamonio (0.01 g, 0.03 mmol) se agitó a reflujo durante 8 h. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente, el disolvente se evaporó a presión reducida y el residuo se recogió con agua (10 ml). Las fases se separaron y el pH de la capa acuosa se ajustó a 7 con solución saturada de cloruro de amonio. La capa acuosa se extrajo con acetato de etilo (3 x 5 ml). Las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera (10 ml), se secaron sobre Na₂SO₄ y se evaporó el disolvente. Se obtuvo 2-metil-1-(4-metiltiofenil)-2-morfolino-propan-1-ona como un aceite incoloro (70 mg, 0.25 mmol, 43% de rendimiento).

20 ¹H-NMR (400.1 MHz, CDCl₃): δ = 1.31 (s, 6H), 2.53 (s, 3H), 2.55-2.61 (m, 4H), 3.66-3.73 (m, 4H), 7.20-7.26 (m, 2H), 8.49-8.54 (m, 2 H) ppm. ¹³C-NMR (100.6 MHz, CDCl₃): δ = 14.4, 20.4, 47.2, 67.3, 68.3, 124.3, 130.3, 131.8, 144.9, 201.9 ppm.

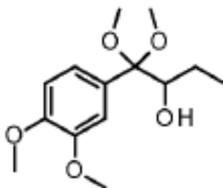
25 Ejemplo 3: Preparación de 2,2-dietil-3-metoxi-3-fenil-oxirano



30 Una mezcla de metóxido de sodio (30% en metanol, 12.3 g, 87.1 mmol), metanol (11.5 ml), 2-etil-1-fenilbutan-1-ona (2.00 g, 11.4 mmol) y hexacloroetano (2.96 g, 12.5 mmol) se agitó durante la noche a temperatura ambiente. El disolvente se evaporó, el residuo se recogió con agua (50 ml) y se extrajo con acetato de etilo (3 x 20 ml). Las fases orgánicas combinadas se lavaron con salmuera (50 ml), se secaron sobre Na₂SO₄ y se evaporó el disolvente.

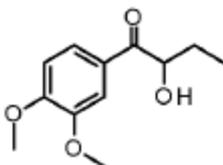
El producto bruto se purificó por cromatografía instantánea [óxido de aluminio básico, c-C₆H₁₂/AcOEt, 1: 1 v: v]. Se obtuvo 2,2-dietil-3-metoxi-3-fenil-oxirano como un aceite incoloro (2.26 g, 11.0 mmol, 96% de rendimiento).

35 ¹H-NMR (400.1 MHz, CDCl₃): δ = 0.79-0.82 (t, 3 H), 1.06-1.10 (t, 3H), 1.16-1.37 (m, 2H), 1.79-1.91 (m, 1H), 1.94-2.04 (m, 1H), 3.21 (s, 3H), 7.34-7.43 (m, 3H), 7.45-7.50 (m, 3H) ppm. ¹³C-NMR (100.6 MHz, CDCl₃): δ = 8.6, 9.3, 22.3, 22.5, 52.4, 73.7, 91.9, 127.9, 128.0, 128.3, 134.9 ppm.

Ejemplo 4: Preparación de 4-(1,1-dimetoxi-2-hidroxibutil)-1,2-dimetoxibenceno

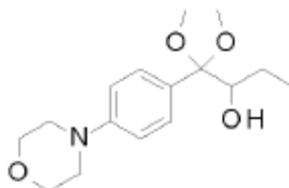
Una mezcla de metóxido de sodio (30% en metanol, 15.82 g, 87.87 mmol), metanol (14.5 ml), 4-butiril-1,2-dimetoxibenceno (3.00 g, 14.4 mmol) y hexafluoroetano (3.79 g, 16.0 mmol) agitado durante la noche a temperatura ambiente. El disolvente se evaporó, el residuo se recogió con agua (25 ml) y se extrajo con acetato de etilo (3 x 20 ml). Las fases orgánicas combinadas se lavaron con salmuera (30 ml), se secaron sobre Na₂SO₄ y se evaporó el disolvente. 4-(1,1-dimetoxi-2-hidroxibutil)-1,2-dimetoxibenceno se obtuvo como un aceite amarillo (2.97 g, 10.9 mmol, 79% de rendimiento).

¹H-NMR (400.1 MHz, CDCl₃): δ = 0.92-0.96 (t, 3H), 0.98-1.11 (m, 1 H), 1.46-1.56 (m, 1H), 2.19-2.24 (dd, 1H), 3.24 (s, 3H), 3.36 (s, 3H), 3.77-3.85 (m, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.91 (s, 3H), 6.85-6.89 (m, 1H), 6.99-7.06 (m, 2 H) ppm. ¹³C-NMR (100.6 MHz, CDCl₃): δ = 10.9, 24.0, 49.3, 49.8, 55.8, 55.9, 76.3, 103.3, 110.3, 111.3, 120.4, 130.3, 148.3, 148.7 ppm.

Ejemplo 5: Preparación de 1-(3,4-dimetoxifenil)-2-hidroxi-butan-1-ona

1-(3,4-dimetoxifenil)-1,1-dimetoxi-butan-2-ol (0,50 g, 1.9 mmol) se disolvió en 1,4-dioxano (8 ml). Se añadió ácido clorhídrico (1 M, 0.14 g, 3,7 mmol) y la mezcla de reacción se agitó durante 6 h a temperatura ambiente. Posteriormente, la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo (3 x 50 ml). Las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera (50 ml) y el disolvente se eliminó a presión reducida. El producto bruto se purificó por cromatografía preparativa en capa fina sobre gel de sílice [c-C₆H₁₂/AcOEt, 2: 1 v: v]. Se obtuvo 1-(3,4-dimetoxifenil)-2-hidroxibutan-1-ona como un aceite incoloro (0.28 g, 1.0 mmol, 55% de rendimiento).

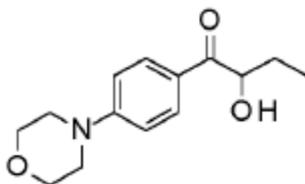
¹H-NMR (400.1 MHz, CDCl₃): δ = 0.94-0.97 (t, 3H), 1.57-1.73 (m, 1H), 1.90-2.01 (m, 1H), 3.73-3.74 (d, 1H), 3.95 (s, 3H), 3.97 (s, 3H), 4.98-5.06 (m, 1H), 6.91-6.95 (m, 1H), 7.51-7.54 (m, 2H) ppm. ¹³C-NMR (100.6 MHz, CDCl₃): δ = 9.0, 29.5, 56.0, 56.1, 73.5, 110.2, 110.6, 123.2, 126.7, 149.4, 154.0, 200.4 ppm.

Ejemplo 6: Preparación de 4-(1,1-dimetoxi-2-hidroxibutil)-fenilmorfolina

Una mezcla de metóxido de sodio (30% en metanol, 4.71 g, 26.1 mmol), metanol (4.5 ml), 4-butiril-fenilmorfolina (1.00 g, 4.29 mmol) y hexafluoroetano (3.79 g, 4.76 mmol) se agitó bajo reflujo durante 6 h. El disolvente se evaporó, el residuo se recogió con agua (25 ml) y se extrajo con acetato de etilo (3 x 20 ml). Las fases orgánicas combinadas se lavaron con salmuera (30 ml), se secaron sobre Na₂SO₄ y se evaporó el disolvente. Se obtuvo 4-(1,1-dimetoxi-2-hidroxibutil)-fenilmorfolina como un aceite amarillo (1.04 g, 3.52 mmol, 92% de rendimiento).

¹H-NMR (400.1 MHz, CDCl₃): δ = 0.91-0.95 (t, 3H), 0.96-1.06 (m, 1H), 1.46-1.55 (m, 1H), 3.18-3.22 (m, 5H; dos señales superpuestas), 3.23 (s, 3H), 3.35 (s, 3H), 3.79-3.84 (m, 1 H), 3.87-3.89 (m, 4H), 6.88-6.91 (m, 2H), 7.34 -7.39 (m, 2H) ppm.

Ejemplo 7: Preparación de 2-hidroxi-1-(4-morfolinofenil)butan-1-ona

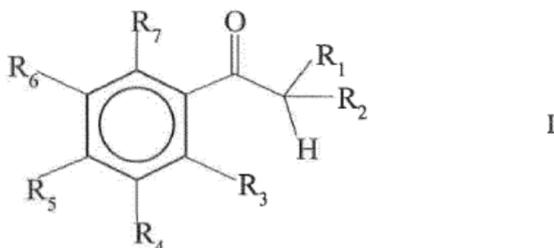


5 1,1-dimetoxi-1-(4-morfolinofenil)butan-2-ol (0.50 g, 1.7 mmol) se disolvió en 1,4-dioxano (7.5 ml). Se añadió ácido clorhídrico (1 M, 0.13 g, 3.4 mmol) y la mezcla de reacción se agitó durante 6 h a temperatura ambiente. Posteriormente, la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo (3 x 50 ml). Las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera (50 ml) y el disolvente se eliminó a presión reducida. Se obtuvo 2-hidroxi-1-(4-morfolinofenil)butan-1-ona como un aceite amarillo (0.31 g, 1.0 mmol, 60% de rendimiento).

$^1\text{H-NMR}$ (400.1 MHz, CDCl_3): δ = 0.89-0.92 (t, 3H), 1.53-1.65 (m, 1H), 1.82-1.96 (m, 1H), 3.29-3.31 (m, 4H), 3.42 (s ancho, 1H), 3.81-3.83 (m, 4H), 4.91-4.97 (m, 1H), 6.82-6.89 (m, 1H), 7.77-7.86 (m, 2H) ppm. $^{13}\text{C-NMR}$ (100.6 MHz, CDCl_3): δ = 8.9, 29.3, 47.4, 66.5, 73.3, 113.1, 122.8, 123.8, 130.3, 130.6, 154.7, 199.7 ppm.

REIVINDICACIONES

1. Un procedimiento para hacer reaccionar una alquil aril cetona de fórmula general I,



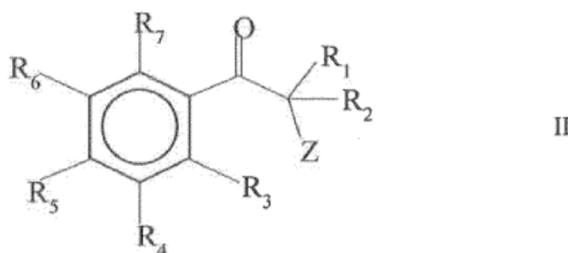
- 5 en donde R_1 y R_2 son iguales o diferentes y se seleccionan independientemente de H, alquilo de C_1-C_8 lineal o ramificado, cicloalquilo de C_3-C_8 , alqueno de C_2-C_8 lineal o ramificado, cicloalqueno de C_5-C_8 , alquino de C_2-C_8 lineal o ramificado, arilo de C_6-C_{14} o forman cicloalquilo de C_3-C_{12} o cicloalqueno de C_5-C_{12} junto con el átomo C de conexión;
- 10 R_3 , R_4 , R_5 , R_6 y R_7 son iguales o diferentes y se seleccionan independientemente de H, alquilo de C_1-C_8 lineal o ramificado, alqueno de C_2-C_8 lineal o ramificado, alcoxi de C_1-C_8 , alquenilo de C_2-C_8 , cicloalquilo de C_3-C_8 , arilo de C_6-C_{14} , cicloalcoxi de C_3-C_8 , arilalcoxi de C_7-C_{15} , alquenilarilalcoxi de C_9-C_{15} , $N(R_8)_2$ o SR_8 donde R_8 se selecciona de alquilo de C_1-C_8 lineal o ramificado, alqueno de C_2-C_8 lineal o ramificado, arilo de C_6-C_{14} , alcoxi de C_1-C_8 , alquenilo de C_2-C_8 , cicloalquilo de C_3-C_8 , cicloalcoxi de C_3-C_8 , arilalcoxi de C_7-C_{15} , alquenilarilalcoxi de C_9-C_{15} , o R_8 forman un sistema alicíclico de C_3-C_9 junto con el átomo de N de conexión, opcionalmente uno o más átomos de carbono se reemplazan con O, o dos R adyacentes forman un sistema aromático junto con el anillo de benceno de fórmula I;
- 15 con un alcano de C_2-C_8 y/o alqueno de C_2-C_8 al menos parcialmente halogenados, y una base seleccionada de alcóxido de C_1-C_8 de metal alcalino, alcóxido de C_1-C_8 de metal alcalino térreo y sus mezclas, por lo cual se obtiene el correspondiente aril oxirano o alquil aril cetal α -funcionalizado.
2. Procedimiento según la reivindicación 1, caracterizado porque R_1 y R_2 son iguales.
- 20 3. El procedimiento de acuerdo con la reivindicación 2, caracterizado porque R_1 y R_2 se seleccionan de H y alquilo de C_1-C_8 lineal o ramificado, preferiblemente alquilo de C_1-C_6 lineal o ramificado, más preferiblemente alquilo de C_1-C_4 lineal o ramificado y del modo más preferible alquilo de C_1-C_3 lineal.
4. El procedimiento de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque R_1 y R_2 son diferentes y se seleccionan independientemente de H y alquilo de C_1-C_8 lineal o ramificado, preferiblemente alquilo de C_1-C_6 lineal o ramificado, más preferiblemente de C_1-C_4 lineal o ramificado. alquilo y del modo más preferible alquilo de C_1-C_3 lineal.
- 25 5. El procedimiento de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque R_1 y R_2 forman cicloalquilo de C_4-C_{10} , preferiblemente cicloalquilo de C_4-C_8 , y del modo más preferible cicloalquilo de C_6 , junto con el átomo C de conexión.
6. El procedimiento de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, caracterizado porque R_3 , R_4 , R_5 , R_6 y R_7 son iguales.
- 30 7. Procedimiento según la reivindicación 6, caracterizado porque R_3 , R_4 , R_5 , R_6 y R_7 se seleccionan entre H y alquilo de C_1-C_8 lineal o ramificado, preferiblemente alquilo de C_1-C_6 lineal o ramificado, más preferiblemente de alquilo de C_1-C_4 lineal o ramificado y del modo más preferible alquilo de C_1-C_3 lineal.
8. El procedimiento de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, caracterizado porque R_3 , R_4 , R_5 , R_6 y R_7 son diferentes y al menos uno de ellos se selecciona de alquilo de C_1-C_8 lineal o ramificado, alqueno de C_2-C_8 lineal o ramificado, alcoxi de C_1-C_8 , alquenilo de C_2-C_8 , alquenilarilalcoxi de C_9-C_{15} o $N(R_8)_2$ o SR_8 donde R_8 se selecciona entre alquilo de C_1-C_8 lineal o ramificado o alqueno de C_2-C_8 lineal o ramificado o R_8 forman un sistema alicíclico de C_3-C_9 junto con el átomo de N de conexión.
- 35 9. El procedimiento de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 u 8, caracterizado porque uno de R_3 , R_4 , R_5 , R_6 y R_7 es alqueno de C_2-C_8 lineal o ramificado, preferiblemente alqueno de C_2-C_6 y del modo más preferible alqueno de C_2-C_3 ; alcoxi de C_1-C_8 , preferiblemente alcoxi de C_1-C_6 y del modo más preferible alcoxi de C_1-C_3 ; alquenilo de C_2-C_8 , preferiblemente alquenilo de C_2-C_6 y del modo más preferible alquenilo de C_3-C_5 ; alquenilarilalcoxi de C_9-C_{15} , preferiblemente alquenilarilalcoxi de C_9-C_{12} y del modo más preferible alquenilarilalcoxi de C_9-C_{10} ; o $N(R_8)_2$ o SR_8 donde R_8 se selecciona de alquilo de C_1-C_8 lineal o ramificado o alqueno de C_2-C_8 lineal o ramificado o R_8 forman un sistema alicíclico de C_3-C_9 junto con el átomo de N de conexión; y los restantes se seleccionan independientemente de H y alquilo de C_1-C_8 lineal o ramificado, preferiblemente alquilo de C_1-C_6 lineal o ramificado, más preferiblemente alquilo de C_1-C_4 lineal o ramificado y del modo más preferible alquilo de C_1-C_3 lineal.
- 40
- 45

10. El procedimiento de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 u 8, caracterizado porque dos o tres de R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son alquenilo de C₂-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alquenilo de C₂-C₆ y del modo más preferible alquenilo de C₂-C₃; alcoxi de C₁-C₈, preferiblemente alcoxi de C₁-C₆ y del modo más preferible alcoxi de C₁-C₃; alqueniloxi de C₂-C₈, preferiblemente alqueniloxi de C₂-C₆ y del modo más preferible alqueniloxi de C₃-C₅; y alquenilarilalcoxi de C₉-C₁₅, preferiblemente alquenilarilalcoxi de C₉-C₁₂ y del modo más preferible alquenilarilalcoxi de C₉-C₁₀, y los restantes se seleccionan independientemente de H y alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal.
11. El procedimiento de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, caracterizado porque R₃ y R₄ o R₄ y R₅ forman un sistema aromático junto con el anillo de benceno de fórmula I, preferiblemente un sistema aromático bicíclico, tricíclico o tetracíclico, más preferiblemente un sistema aromático seleccionado de un sistema de naftilo, antraceno o fenantreno.
12. El procedimiento de acuerdo con la reivindicación 11, caracterizado porque uno de los R restantes es alquenilo de C₂-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alquenilo de C₂-C₆ y del modo más preferible alquenilo de C₂-C₃; alqueniloxi de C₂-C₈, preferiblemente alqueniloxi de C₂-C₆ y del modo más preferible alqueniloxi de C₃-C₅; y alquenilarilalcoxi de C₉-C₁₅, preferiblemente alquenilarilalcoxi de C₉-C₁₂ y del modo más preferible alquenilarilalcoxi de C₉-C₁₀; y los restantes se seleccionan independientemente de H y alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, preferiblemente alquilo de C₁-C₆ lineal o ramificado, más preferiblemente alquilo de C₁-C₄ lineal o ramificado y del modo más preferible alquilo de C₁-C₃ lineal.
13. El procedimiento según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12, caracterizado porque el alcano de C₂-C₈ y/o el alqueno de C₂-C₈ al menos parcialmente halogenados están completamente halogenados, preferiblemente el alcano de C₂-C₈ y/o el alqueno de C₂-C₈ al menos parcialmente halogenados se seleccionan de hexacloroetano, tetracloroetileno y mezclas de los mismos.
14. El procedimiento de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13, caracterizado porque la base se selecciona del grupo que comprende alcóxido de C₁-C₆ de sodio, preferiblemente alcóxido de C₁-C₄ de sodio y del modo más preferible alcóxido de C₁-C₂ de sodio; alcóxido de C₁-C₆ de litio, preferiblemente alcóxido de C₁-C₄ de litio y del modo más preferible alcóxido de C₁-C₂ de litio; alcóxido de C₁-C₆ de potasio, preferiblemente alcóxido de C₁-C₄ de potasio y del modo más preferible alcóxido de C₁-C₂ de potasio; y mezclas de los mismos.
15. El procedimiento de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 14, caracterizado porque la base está en forma de una solución acuosa o la base se proporciona en un disolvente orgánico, preferiblemente el disolvente orgánico se selecciona del grupo que comprende metanol, etanol, n-propanol, terc.-butanol, diclorometano, tetracloroetileno, tetrahydrofurano, acetato de etilo, acetona, N,N-dimetilformamida, dimetilsulfóxido, dioxano como 1,3-dioxano o 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, éter dimetílico de dietilenglicol, éter dimetílico de trietilenglicol y sus mezclas.
16. El procedimiento de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 15, caracterizado porque el procedimiento se lleva a cabo a una temperatura en el intervalo de 0 a 120°C, preferiblemente en el intervalo de 12 a 80°C, más preferiblemente en el intervalo de 15 a 50°C, y del modo más preferible en el intervalo de 15 a 30°C.
17. El procedimiento de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 16, caracterizado porque el procedimiento se lleva a cabo en un disolvente orgánico, preferiblemente el disolvente orgánico se selecciona del grupo que comprende metanol, etanol, n-propanol, terc.-butanol, diclorometano, tetracloroetileno, tetrahydrofurano, acetato de etilo, acetona, N,N-dimetilformamida, dimetilsulfóxido, dioxano como 1,3-dioxano o 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, éter dimetílico de dietilenglicol, éter dimetílico de trietilenglicol y sus mezclas.
18. El procedimiento de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 17, caracterizado porque el procedimiento comprende una etapa adicional de poner en contacto el aril oxirano obtenido por el procedimiento en condiciones de transferencia de fase con una base seleccionada del grupo que comprende hidróxido de metal alcalino, hidróxido de metal alcalino térreo, alcóxido de C₁-C₈ de metal alcalino, alcóxido de C₁-C₈ de metal alcalino térreo y mezclas y un compuesto seleccionado de HOR₉, HNHR₉ o HNR₁₀ R₁₁ donde R₉, R₁₀ y R₁₁ se seleccionan independientemente de H, alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, alquenilo de C₂-C₈ lineal o ramificado, alcoxi de C₁-C₈, alqueniloxi de C₂-C₈, cicloalquilo de C₃-C₈, cicloalcoxi de C₃-C₈, arilo de C₆-C₁₄, arilalquilo de C₇-C₁₅, arilalcoxi de C₇-C₁₅, alquenilarilalcoxi de C₉-C₁₅, alquenilarilalquilo de C₉-C₁₅; o R₁₀ y R₁₁ forman un sistema alicíclico de C₃-C₉ junto con el átomo de N o C de conexión; opcionalmente, uno o más átomos de carbono se reemplazan con O.
19. El procedimiento según la reivindicación 18, caracterizado porque la etapa se lleva a cabo en presencia de un catalizador de transferencia de fase; preferiblemente, el catalizador de transferencia de fase se selecciona de una sal de amonio cuaternario, cloruro de tetraalquilfosfonio, bromuro de tetraalquilfosfonio y mezclas de los mismos; preferiblemente, el catalizador de transferencia de fase es una sal de tetraalquilamonio o una sal trialquilarilamonio, más preferiblemente el catalizador de transferencia de fase se selecciona del grupo que comprende hidróxido de benciltrimetilamonio, cloruro de benciltrietilamonio, cloruro de tetrabutilamonio, bromuro de tetrabutilamonio,

hidrogenosulfato de tetrabutilamonio, hidróxido de tetrabutilamonio, cloruro de metiltrioctilamonio, cetil piridinio y mezclas de los mismos

5 20. El procedimiento de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 17, caracterizado porque el procedimiento comprende una etapa adicional de poner en contacto el alquil aril cetal α -funcionalizado obtenido por el procedimiento con un ácido, preferiblemente un ácido seleccionado del grupo que comprende ácido clorhídrico, acético, ácido fosfórico, ácido sulfúrico, ácido cítrico, ácido toluenosulfónico, ácido metanosulfónico, ácido cloroacético, ácido tricloroacético, ácido tartárico, ácido succínico, ácido maleico, ácido fumárico, ácido láctico, ácido málico, ácido propiónico, ácido butírico y mezclas del mismo.

10 21. El procedimiento de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 18 a 20, caracterizado porque se obtiene una cetona α -funcionalizada de la fórmula general II,



15 en donde R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆ y R₇ son como se definieron anteriormente; y Z se selecciona de OR₉, NHR₉ y NR₁₀ R₁₁ donde R₉, R₁₀ y R₁₁ se seleccionan independientemente de H, alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, alcoxi de C₁-C₈, alquenoiloxi de C₂-C₈, cicloalquilo de C₃-C₈, cicloalcoxi de C₃-C₈, arilo de C₆-C₁₄, arilalquilo de C₇-C₁₅, arilalcoxi de C₇-C₁₅, alquenilarilalcoxi de C₉-C₁₅, alquenilarilalquilo de C₉-C₁₅; o R₁₀ y R₁₁ forman un sistema alicíclico de C₃-C₉ junto con el átomo de N o C de conexión; opcionalmente, uno o más átomos de carbono se reemplazan con O.

20 22. El procedimiento según la reivindicación 21, caracterizado porque Z es OR₉ donde R₉ se selecciona entre H, alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, alqueno de C₂-C₈ lineal o ramificado, alcoxi de C₁-C₈, alquenoiloxi de C₂-C₈, cicloalquilo de C₃-C₈, cicloalcoxi de C₃-C₈, arilalcoxi de C₇-C₁₅ y alquenilarilalcoxi de C₉-C₁₅, preferiblemente R₉ es H o Z es NR₁₀R₁₁ donde R₁₀ y R₁₁ se selecciona independientemente de H, alquilo de C₁-C₈ lineal o ramificado, cicloalquilo de C₃-C₈, arilo de C₆-C₁₄ o R₁₀ y R₁₁ forman un sistema alicíclico de C₃-C₆ junto con el átomo de N de conexión; opcionalmente, uno o más átomos de carbono se reemplazan con O, preferiblemente R₁₀ y R₁₁ forman un sistema alicíclico de C₅-C₆ junto con el átomo de N de conexión y uno o más átomos de carbono se reemplazan con O.