

HUMBERTO RUBIO & CIA.

ABOGADOS

Cra. 7a # 74 – 64 Oficina 506
Tel: (571) 3132408 – 3132423 - 3132410 - 3131759
Fax: (571) 3131647 - 3132367
E-mail: mail@rubiolawyers.com
Apartado Aéreo 21848
Bogota, D.C. -Colombia

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-123310- -00008-0000

Fecha: 2011-03-04 14:16:25 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 523 RESPUESTA Follos: 38

Doctora

Jose Luis SALAZAR LOPEZ

Jefe División de Nuevas Creaciones (E)

Superintendencia de Industria y Comercio

E. S. D.

REF: Expediente No.

05-123310

Patente de Invención:

“PROCEDIMIENTO PARA LA
PREPARACION DE UN COMPUESTO
SUBSTITUIDO 3-ARIL-BUTIL-AMINA”

Titular:

GRUNENTHAL GMBH

RESPUESTA A REQUERIMIENTO

OFICIO NO. 00948 CONCEPTO TECNICO NO. 68 NOTIFICADO POR FIJACION EN LISTA DE 21 DE ENERO DE 2011

HUMBERTO RUBIO CAMACHO, mayor de edad, domiciliado en Bogotá, D.C., identificado con la cédula de ciudadanía número 17'192.062 de Bogotá, abogado graduado portador de la Tarjeta Profesional No. 50.007 expedida por el Consejo Superior de la Judicatura, actuando en carácter de Apoderado de GRUNENTHAL GMBH, domiciliado en Zieglerstrasse 6, 52078 Aachen, Alemania; encontrándome dentro de la debida oportunidad procesal para dar respuesta al auto proferido por su Despacho, mediante Oficio No.00948 y Concepto Técnico No.68, notificado por fijación en lista de 21 de enero de 2011, me permito manifestar y anexa:

1. Modificaciones a las reivindicaciones

Teniendo en cuenta las observaciones expuestas por el examinador, en la acción oficial, se han corregido todos los errores, se han cambiado los términos y eliminados otros para permitir que las reivindicaciones definan de manera clara y concisa el objeto de lo que se desea reclamar. Adicionalmente, nos permitimos informar que las modificaciones realizadas a las reivindicaciones están enteramente sustentadas en la memoria descriptiva de la presente solicitud y no contienen materia que no haya sido incluida anteriormente, es decir no incluye materia nueva.

HUMBERTO RUBIO & CIA.

ABOGADOS

Expediente No. 05-123310

Página 2 de 2

Por lo anteriormente expuesto consideramos que la presente solicitud es novedosa tiene nivel inventivo, las reivindicaciones definen la materia que se desea proteger siendo claras, concisas y debidamente sustentadas en la descripción y no está comprendida en el estado de la técnica, conforme lo establece el Art. 14, 16 y 30 de la Decisión 486.

De manera atenta solicito a su Despacho, tener en cuenta todos y cada una de las consideraciones expuestas anteriormente, al momento de estudiar el presente caso.

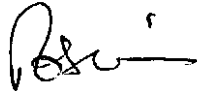
II. Anexo:

Nuevo capítulo reivindicatorio.

III. Petición:

Conforme a lo anterior, una vez atendidos los requerimientos y exigencias del examinador y al tener en cuenta el capítulo reivindicatorio modificado que se presenta con la presente contestación, solicito muy respetuosamente a su Despacho, continuar el trámite de rigor y de ser el caso se hagan las correspondientes observaciones con el ánimo de hacer lo pertinente dentro del presente trámite.

Atentamente,



HUMBERTO RUBIO CAMACHO

C.C. 17'192.062 de Bogotá

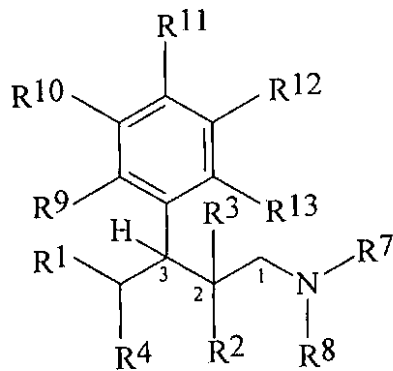
**T.P. 50.007 Consejo Superior
de la Judicatura**

COD. 4134

2

REIVINDICACIONES

1. Procedimiento para la preparación de un compuesto 3-aryl-butil-amina substituida de la fórmula general I siguiente



5

I

en la cual

R^1 se selecciona entre H, alquilo- C_{1-3} , ramificado o sin ramificar o lineal, saturado o insaturado, sin substituir o mono- o polisubstituido.

R^2 y R^3 , cada uno independientemente uno del otro, se seleccionan entre H o alquilo- C_{1-4} , ramificado o sin ramificar, saturado o insaturado, sin substituir o mono- o polisubstituido.

ó

R^2 y R^3 forman, conjuntamente, un radical cicloalquilo C_{4-7} saturado, sin substituir o mono-o polisubstituido,

15 R^4 se selecciona entre H, alquilo- C_{1-3} , ramificado o sin ramificar, saturado o insaturado, sin substituir o mono- o polisubstituido.

R^7 y R^8 , en cada caso independientemente uno del otro, se seleccionan entre H ó alquilo- C_{1-3} , ramificado o sin ramificar, saturado o insaturado, sin sustitutos o mono-o polisubstituido,

20 R^9 hasta R^{13} , en cada caso independientemente uno del otro se selecciona entre H, F, Cl, Br, I, CH_2F , CHF_2 , CF_3 , OH, SH, OR^{14} , OCF_3 , SR^{14} , $NR^{17}R^{18}$, $SOCH_3$,

SOCF₃, SO₂CH₃, SO₂CF₃, CN, COOR¹⁴, NO₂, CONR¹⁷R¹⁸, alquilo-C₁₋₆, ramificado o sin ramificar o lineal, saturado o insaturado, sin substitutos o mono- o polisubstitutos,

donde R¹⁴ se selecciona entre alquilo-C₁₋₆, piridilo, tienilo, tiazolilo, fenilo, bencilo
 5 o fenetilo, en cada caso sin substituir o mono-o polisubstituible, PO(O-alquilo-C₁₋₄)₂, CO (O alquilo-C₁₋₅), CONH-C₆H₄-(alquilo-C₁₋₃), CO(alquilo-C₁₋₅), CO-CHR¹⁷-NHR¹⁸, CO-C₆H₄-R¹⁵, donde R¹⁵ es orto-OCOalquiloC₁₋₃ ó meta-o-para-CH₂N(R¹⁶), donde R¹⁶ es alquilo-C₁₋₄ ó 4-morfolino, donde en los radicales R¹⁴, R¹⁵ y R¹⁶ los grupos alquilo pueden ser ramificados o sin ramificar o lineales,
 10 saturados o insaturados, sin substituir o mono-o polisubstituidas;

donde R¹⁷ y R¹⁸, en cada caso independientemente uno del otro, se seleccionan entre H, alquilo-C₁₋₆, ramificado o sin ramificar o lineal, saturado o insaturado, sin substituir o mono-o polisubstituido, fenilo, bencilo o fenetilo, en cada caso sin substituir o mono-o polisubstituido

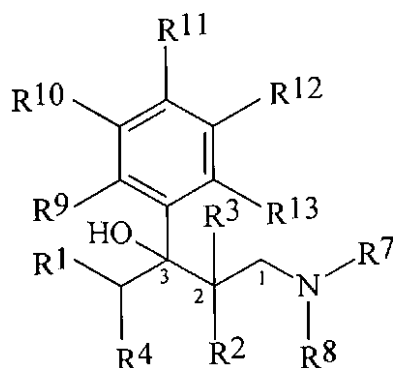
15 ó

R⁹ y R¹⁰ ó R¹⁰ y R¹¹

forman conjuntamente un anillo OCH₂O, CH₂CH₂O, OCH=CH, CH=CHO, CH=C(CH₃) O, OC(CH₃)=CH, (CH₂)₄ ó OCH=CHO,

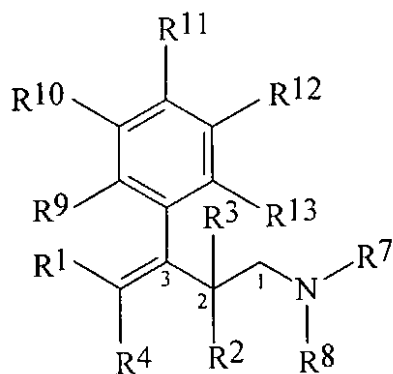
en cada caso en la forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular
 20 enantiómeros o diaestereómero, en cualquier relación de mezcla deseada, o en cada caso en la forma de una sal fisiológicamente o farmacéuticamente aceptable, o en cada caso en la forma de un solvato,

CARACTERIZADO porque en una primera etapa (a) se emplea un compuesto 1-amino-3-anil-butan-3-ol de la fórmula general II siguiente



II

en la cual R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} Y R^{13} tienen los significados indicados anteriormente, en cada caso opcionalmente en la forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular enantiómeros o diasterómeros, sus racematos o en la forma de un mezcla de estereoisómeros, en particular los enantiómeros o diasterómeros, en cualquier proporción o relación de mezcla deseada o en cada caso en la forma de una sal fisiológicamente o farmacéuticamente aceptable, o en cada caso en la forma de un solvato, efectuándose la eliminación mediante la acción de un ácido para entregar un compuesto 3-aryl -but-3-enil-amino substituida de la fórmula general III



III

donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} Y R^{13} tienen el significado indicado anteriormente, en cada caso opcionalmente en la forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular enantiómeros o diastereómeros, sus

racematos o en la forma de una mezcla de estereoisómeros, en particular los enantiómeros o diastereómeros, en cualquier proporción de la mezcla deseada, o en cada caso en la forma de una sal fisiológicamente aceptable, o en cada caso en la forma de un solvato, y en una segunda etapa (b) se hidrogena luego el compuesto 3-aril –but-3-enil-amino substituida de acuerdo a la fórmula general (III) con participación de un catalizador metálico e hidrógeno para entregar un compuesto 3-aril –butil – amina substituida de la fórmula general I.

En donde alquilo y cicloalquilo la expresión substituido se entiende como la sustitución de por lo menos un radical (es) hidrogeno por F, Cl, Br, I NH₂, SH u OH, y polisustituido como que la sustitución que ocurre varias veces, tanto en el mismo y en diferentes átomos, por sustituyentes idénticos o diferentes. Para cicloalquilo, el radical hidrogeno también puede estar reemplazado por –Oalquilo C₂₋₃, o alquilo C₂₋₃ (en cada caso mono—o polisustituido o sin sustituir).

15

En donde en los anillos piridilo, tienilo, tiazolilo fenilo bencilo o fenetilo expresión substituido se entiende como una sustitución por R₂₃ OR₂₃, un halógeno, CF₃, CN, NO₂, un NR²⁴ R²⁵, un alquilo C₁₋₆ saturado, un alcoxi C₁₋₆, un cicloalcoxi C₃₋₆, un cicloalquilo C₃₋₈ o un alquilenos C₂₋₆. En donde R²³, R²⁴, R²⁵ y R²⁶ representan hidrogeno, alquilo C₁₋₁₀, fenilo, naftilo, tiofeno, benzotiofeno, pirrol, piridina, pirimidina, pirazina, quinolina, isoquinolina, ftalazina, benzo-1,2,5-tiadiazol, benzotiazol, indol, benzotriazol, benzodioxano, carbazol, indol y quinazolina, en donde los grupos arilo y heteroarilo anteriormente mencionados pueden estar unidos via un grupo alquilenos C₁₋₃ y pueden ser no substituidos, mono o polisustituidos; o los radicales R²⁴ y R²⁵ significan conjuntamente CH₂CH₂OCH₂CH₂, CH₂CH₂NR₂₆, CH₂CH₂ O (CH₂)₃₋₆.

25

2. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 1, CARACTERIZADO porque para los compuestos de acuerdo a la fórmula I, fórmula II y fórmula III, R^4 se selecciona de H o CH_3 ,
- 5 3. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 1, CARACTERIZADO porque para los compuestos de acuerdo a la fórmula I, fórmula II y fórmula III, R^1 se selecciona entre alquilo- C_{1-3} , saturado o insaturado, substituido o sin substituir, ramificado o sin ramificar.
- 10 4. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 1, CARACTERIZADO porque para los compuestos de acuerdo a la fórmula I, fórmula II y fórmula III, R^4 se selecciona de H ó CH_3 ,
y/o
- 15 R^1 se selecciona de alquilo- C_{1-3} , saturado o insaturado, substituido o sin substituir, ramificado o sin ramificar.
- 20 5. El procedimiento de acuerdo a una de las reivindicaciones 1 hasta 4, CARACTERIZADO para los compuestos de acuerdo a la fórmula I, fórmula II y fórmula III,
 R^7 y R^8 , en cada caso uno independientemente del otro, se selecciona de H ó CH_3 ,
 R^7 y R^8 representa H ó R^7 y R^8 representa CH_3 ó R^7 representa H y R^8
25 representa CH_3 , en particular R^7 y R^8 representa CH_3 .

6. El procedimiento de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 1 hasta 5, CARACTERIZADO porque para los compuestos de acuerdo a la fórmula I, fórmula II y fórmula III,

R^1 se selecciona entre: alquilo- C_{1-3} , saturado y sin substituir, ramificado o no
5 ramificado, CH_3 , C_2H_5 , i-propilo ó n-propilo, en particular de CH_3 ó C_2H_5 .

7. El procedimiento de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 1 hasta 6, CARACTERIZADO porque para los compuestos de fórmula I, fórmula II y fórmula III,

10 R^2 y R^3 , independientemente uno del otro, se selecciona entre:

H, alquilo- C_{1-4} , saturado y sin substituir, ramificado o no ramificar o lineal, de H, CH_3 , C_2H_5 , i-propilo ó t-butilo.

8. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 7, CARACTERIZADO porque
15 el compuesto de acuerdo a la fórmula I, fórmula II y fórmula III, $R^3 = H$ y R^2 es diferente que H, $R^3 = H$ y $R^2 = CH_3$ o C_2H_5 .

9. El procedimiento de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 1 hasta 6, CARACTERIZADO para los compuestos de acuerdo a la fórmula I, fórmula II y
20 fórmula III,

R^2 y R^3 forman conjuntamente un radical cicloalquilo- C_{5-6} , saturado o insaturado, sin substituir o mono o polisustituido.

10. El procedimiento de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 1 hasta 9,
25 CARACTERIZADO para los compuestos de acuerdo a la fórmula I, fórmula II y fórmula III,

R^9 hasta R^{13} donde 3 ó 4 de los radicales R^9 hasta R^{13} deben corresponder a H, independientemente uno del otro se selecciona entre:

H, Cl, F, OH, CF_2H , CF_3 o alquilo- C_{1-4} saturado y sin substituir, ramificado o sin ramificar; OR^{14} ó SR^{14} , donde R^{14} se selecciona de alquilo- C_{1-3} , saturado y sin

5 substituir, ramificado o sin ramificar o lineal; ó

R^{12} Y R^{11} forman un anillo 3,4-OCH=CH

11. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 1, CARACTERIZADO porque para los compuestos de acuerdo a la fórmula I, fórmula II y fórmula III.

10 R^1 se selecciona de:

alquilo- C_{1-3} , saturado o insaturado, substituido o sin substituir, ramificado o sin ramificar, y

R^2 y R^3 , independientemente uno del otro, se seleccionan entre H, alquilo- C_{1-4} , saturado y sin substituir, ramificado o sin ramificar, o R^2 y R^3 forman

15 conjuntamente un radical cicloalquilo- C_{5-6} , saturado o insaturado,

y/o

R^4 se selecciona de H

y/o,

R^7 y R^8 , en cada caso independientemente uno del otro, se seleccionan de:

20 H o CH_3 ,

y

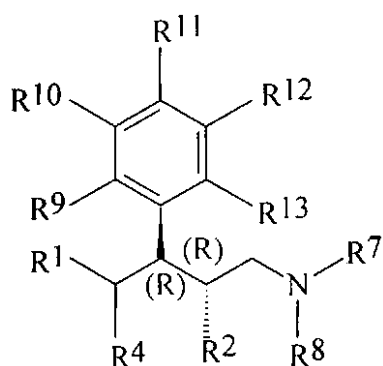
R^9 hasta R^{13} , donde 3 ó 4 de los radicales R^9 hasta R^{13} deben corresponder a H, independientemente uno del otro, se seleccionan entre,

H, Cl, F, OH, CF_2H , CF_3 ó alquilo- C_{1-4} , saturado y sin substituir, ramificado o no

25 ramificado, OR^{14} ó SR^{14} , donde R^{14} se selecciona de alquilo- C_{1-3} , saturado y sin substituir, ramificado o sin ramificar;

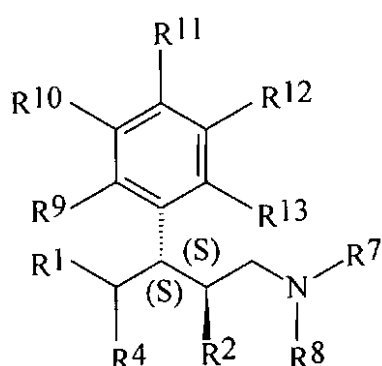
o R^{12} y R^{11} forman un anillo 3,4-OCH=CH.

12. El procedimiento de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 1 hasta 11, CARACTERIZADO porque para los compuestos de acuerdo a la fórmula I donde $R^3 = H$ y R^2 es diferente a H, estas tienen las configuraciones Ia o Ib siguientes.



5

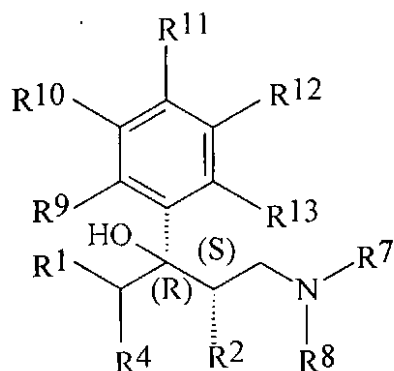
Ia



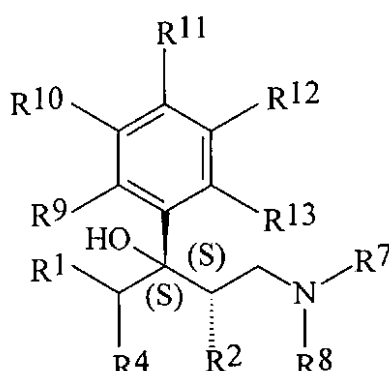
Ib

13. El procedimiento de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 1 hasta 12, CARACTERIZADO porque para los compuestos de acuerdo a la fórmula II, donde $R^3 = H$ y R^2 es diferente a H, estas tienen las configuraciones IIa o IIb siguientes.

10

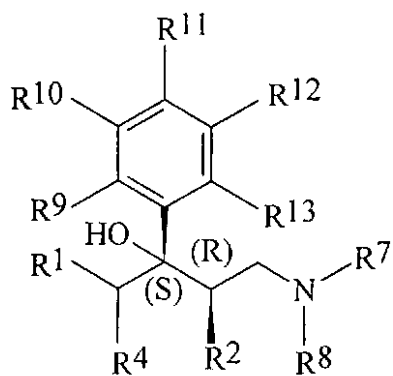


IIa

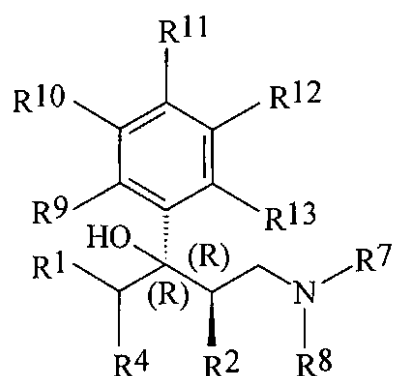


IIb

o tienen las configuraciones IIc y IId siguientes

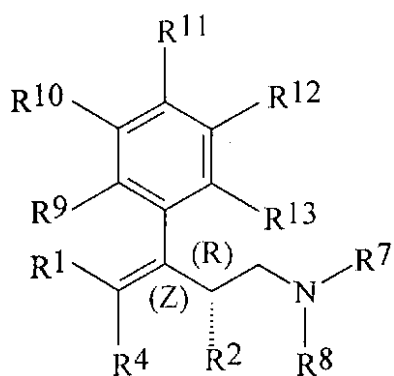


IIc

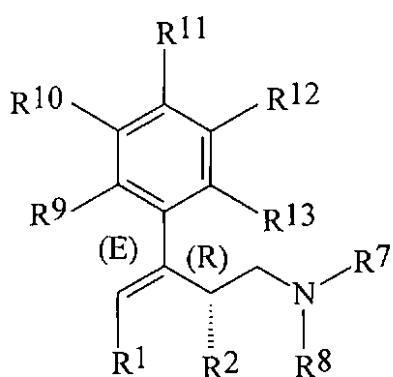


IIId

14. El procedimiento de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 1 hasta 13,
 5 CARACTERIZADO porque para los compuestos de acuerdo a la fórmula III donde $R^3 = H$, R^2 es diferente a H, $R^4 = H$ y R^1 es diferente a H, estas tienen las configuraciones IIIa o IIIb, siguientes.

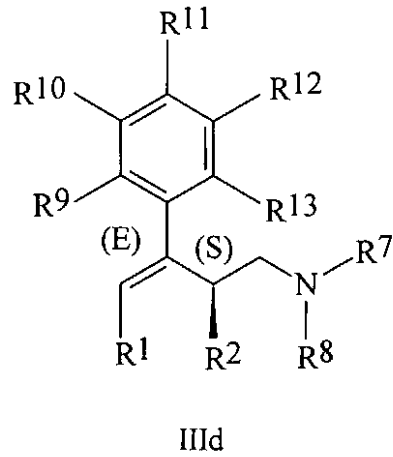
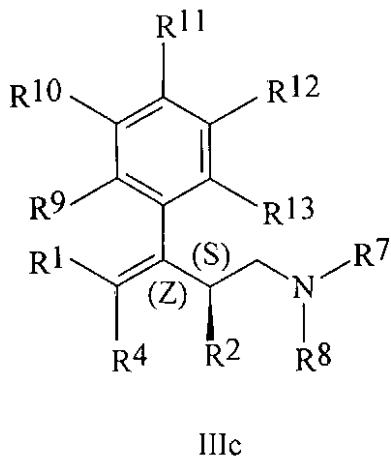


IIIa



IIIb

- 10 o para los compuestos de acuerdo a la fórmula III, donde $R^3 = H$, R^2 es diferente a H, $R^4 = H$ y R^1 es diferente a H, estas tienen las configuraciones IIIc o IIId, siguientes.



15. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 1, CARACTERIZADO porque
5 para el/los compuesto(s) de acuerdo a la fórmula I, por lo menos uno de estos, se selecciona del grupo siguiente:

- 3-(3-dimetilamino-1-etil-2-metil-propil)-fenol,
- (1R,2R)-3-(3-dimetilamino-1-etil-2-metil- propil)-fenol,
- (-)-(1R,2R)-3-(3-dimetilamino-1-etil-2-metil-propil)-fenol,
- 10 • (1S,2S)-3-(3-dimetilamino-1-etil-2-metilpropil)-fenol,
- (+)-(1S,2S)-3-(3-dimetilamino-1-etil-2-metilpropil)-fenol,
- (±)-(1RS,2RS)-3-(3-dimetilamino-1-etil-2metil-propil)-fenol,
- rac-(1RS,2RS)-3-(3-dimetilamino-1-etil-2metil-propil)-fenol,
- [3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentil]-dimetilamina,
- 15 • (2R,3R)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentil]-dimetilamina,
- (-)-(2R,3R)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metilpentil]-dimetilamina,
- (2S,3S)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil- pentil]-dimetilamina,
- (+)-(2S,3S)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metilpentil]-dimetilamina,
- (±)-(2RS,3RS)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metilpentil]-dimetilamina,
- 20 • rac(2RS,3RS)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metilpentil]-dimetilamina,
- 3{[3-(p-isopropil-fenil-carbamoi)-oxi-fenil]-
2-metil-pentil}-dimetilamina,

- (2R,3R)-{3[3-(p-isopropil-fenil-carbamoil)-oxi-fenil]-2-metil-pentil}-dimetilamina,
- (2S,3S)-{3[3-(p-isopropil-fenil-carbamoil)-oxi-fenil]-2-metil-pentil}-dimetilamina,
- 5 • (2SR,3SR)-{3[3-(p-isopropil-fenil-carbamoil)-oxi-fenil]-2-metil-pentil}-dimetilamina.

16. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 1, CARACTERIZADO porque el/los compuesto(s) de acuerdo a la fórmula II, siendo empleado al menos uno
10 de estos, se selecciona del grupo siguiente:

- 3-(3-dimetilamino-l-etil-1-hidroxi-2-metil-propil)-fenol,
- (1S,2S)-3-(3-dimetilamino-l-etil-1-hidroxi-2-metil-propil)-fenol,
- 15 • (1R,2S)-3-(3-dimetilamino-l-etil-1-hidroxi-2-metil-propil)-fenol,
- (1RS,2SS)-3-(3-dimetilamino-1-etil-hidroxi-2-metil-propil)-fenol,
- (1S,2R)-3-(3-dimetilamino-l-etil-1-hidroxi-2-metil-propil)-fenol,
- 20 • (1R,2R)-3-(3-dimetilamino-l-etil-1-hidroxi-2-metil-propil)-fenol,
- (1RS,2RR)-3-(3-dimetilamino-l-etil-1-hidroxi-2-metil-propil)-fenol,
- [3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentan-3-ol]-dimetilamina,
- (2S,3S)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentan-3-ol]-dimetilamina,
- 25 • (2S,3R)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentan-3-ol]- dimetilamina,
- (2SS,3RS)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentan-3-ol]- dimetilamina,
- (2R,3S)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentan-3-ol]- dimetilamina,

- (2R,3R)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentan-3-ol]- dimetilamina,
- (2RR,3RS)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentan-3-ol]- dimetilamina,
- 3{[3-(p-isopropil-fenil-carbamoil)-oxi-fenil]2-metil-pentan-3-ol}-dimetilamina,
- 5 • (2S,3R)-{3[3-(p-isopropil-fenil-carbamoil)-oxifenil]-2-metil-pentan-3-ol}-dimetilamina,
- (2S,3S)-{3[3-(p-isopropil-fenil-carbamoil)-oxifenil]-2-metil-pentan-3-ol}-dimetilamina,
- (2SS,3RS)-{3[3-(p-isopropil-fenil-carbamoil)-oxi-fenil]-2-metil-pentan-3-ol}-dimetilamina,
- 10 • (2R,3S)-{3[3-(p-isopropil-fenil-carbamoil)oxi-fenil]-2-metil-pentan-3-ol}-dimetilamina,
- (2R,3R)-{3[3-(p-isopropil-fenil-carbamoil)oxi-fenil]-2-metil-pentan-3-ol}-dimetilamina,
- 15 • (2RR,3RS)-{3[3-(p-isopropil-fenil-carbamoil)-oxi-fenil]-2-metil-pentan-3-ol}-dimetilamina,

17. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 1, CARACTERIZADO porque para el/los compuesto(s) de acuerdo a la fórmula III, por lo menos uno de estos,

20 se selecciona del grupo siguiente:

- 3-(3-dimetilamino-1-etenil-2-metil-propil)-fenol,
- (Z)-(2R)-3-(3-dimetilamino-1-etenil-2-metilpropil)-fenol,
- (E)-(2R)-3-(3-dimetilamino-1-etenil-2-metilpropil)-fenol,
- 25 • (Z,E)-(2R)-3-(3-dimetilamino-1-etenil-2-metilpropil)-fenol,
- (Z)-(2S)-3-(3-dimetilamino-1-etenil-2-metil-propil)-fenol,
- (E)-(2S)-3-(3-dimetilamino-1-etenil-2-metil-

- propil)-fenol,
- (Z,E)-(2S)-3-(3-dimetilamino-1-etenil-2-metilpropil)-fenol,
 - 3-(3-dimetilamino-1-etenil-2-metil-propil)-
- fenol,
- 5
- (Z)-(2R)-3-(3-dimetilamino-1-etenil-2-metilpropil)-fenol,
 - (E)-(2R)-3-(3-dimetilamino-1-etenil-2-metilpropil)-fenol,
 - (Z,E)-(2R)-3-(3-dimetilamino-1-etenil-2-metil-propil)-fenol,
 - (Z)-(2S)-3-(3-dimetilamino-1-etenil-2-metil- propil)-fenol,
 - (E)-(2S)-3-(3-dimetilamino-1-etenil-2-metil-
- 10 propil)-fenol,
- (Z,E)-(2S)-3-(3-dimetilamino-1-etenil-2-metilpropil)-fenol,
 - [3-(3-metoksi-fenil)-2-metil-pent-3-enil]dimetilamina,
 - (Z)-(2R)-[3-(3-metoksi-fenil)-2-metil-pent-3-enil]-dimetilamina,
 - (E)-(2R)-[3-(3-metoksi-fenil)-2-metil-pent-3-enil]-dimetilamina,
- 15
- (Z,E)-(2R)-[3-(3-metoksi-fenil)-2-metil-pent-3- enil]-dimetilamina,
 - (Z)-(2S)-[3-(3-metoksi-fenil)-2-metil-pent-3-enil]-dimetilamina,
 - (E)-(2S)-[3-(3-metoksi-fenil)-2-metil-pent-3-enil]-dimetilamina,
 - (Z,E)-(2S)-[3-(3-metoksi-fenil)-2-metil-pent-3-enil]-dimetilamina,
 - {3[3-(p-isopropil-fenil-carbamoil)-oxi-fenil]-
- 20 2-metil-pent-3-enil}-dimetilamina,
- (Z)-(2R)-{3[3-(p-isopropil-fenil-carbamoil)-oxi-fenil]-2-metil-pent-3-enil}-dimetilamina,
 - (E)-(2R)-{3[3-(p-isopropil-fenil-carbamoil)-oxi-fenil]-2-metil-pent-3-enil}-dimetilamina,
- 25
- (Z,E)-(2R)-{3[3-(p-isopropil-fenil-carbamoil)-oxi-fenil]-2-metil-pent-3-enil}-dimetilamina,

- (Z)-(2S)-{3[3-(p-isopropil-fenil-carbamoyl)-oxi-fenil]-2-metil-pent-3-enil}-dimetilamina,
- (E)-(2S)-{3[3-(p-isopropil-fenil-carbamoyl)-oxi-fenil]-2-metil-pent-3-enil}-dimetilamina,
- 5 • (Z,E)-(2S)-{3[3-(p-isopropil-fenil-carbamoyl)-oxi-fenil]-2-metil-pent-3-enil}-dimetilamina,

18. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 1, CARACTERIZADO porque el compuesto de acuerdo a la fórmula II empleado, contiene un centro quiral, en
10 la posición 2, de acuerdo a la fórmula II.

19. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 1, CARACTERIZADO porque el compuesto de la fórmula I contiene un centro quiral, en la posición 2, de
15 acuerdo a la fórmula I.

20. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 1, CARACTERIZADO porque el compuesto de la fórmula III, contiene un centro quiral, en la posición 2, de
20 acuerdo a la fórmula III.

21. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 1, CARACTERIZADO porque el compuesto de acuerdo a la fórmula II empleado, es un compuesto
25 enantioméricamente puro.

22. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 1, CARACTERIZADO porque el compuesto de acuerdo a la fórmula II empleado, es un compuesto diaestereoméricamente puro.
- 5 23. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 1, CARACTERIZADO porque el compuesto de acuerdo a la fórmula II empleado, es un compuesto enantioméricamente y diaestereoméricamente puro.
- 10 24. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 1, CARACTERIZADO porque el compuesto de acuerdo a la fórmula II, empleado, se elige entre la:
- (2S,3S)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentan-3-ol]-dimetilamina,
 - (2S,3R)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentan-3-ol]-dimetilamina
 - o
- 15 es una mezcla del compuesto (2S,3S)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentan-3-ol]-dimetilamina y (2S,3R)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentan-3-ol]-dimetilamina, o (2SS,3RS)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentan-3-ol]-dimetilamina.
- 20 25. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 1, CARACTERIZADO porque el compuesto de acuerdo a la fórmula II, empleado, se elige entre la:
- (2R,3R)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentan-3-ol]-dimetilamina,
 - (2R,3S)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentan-3-ol]-dimetilamina
 - o
- 25 es una mezcla del compuesto (2R,3R)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentan-3-ol]-dimetilamina y (2R,3S)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentan-3-ol]-dimetilamina, o (2RR,3RS)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentan-3-ol]-dimetilamina.

26. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 1, CARACTERIZADO porque el compuesto empleado de acuerdo a la fórmula II, se elige entre el:

- 5 • (2S,3S)-1-dimetilamino-3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentan-3-ol,
 • (2S,3R)-1-dimetilamino-3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentan-3-ol
 o

es una mezcla del compuesto (2S,3S)-1-dimetilamino-3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentan-3-ol y (2S,3R)-1-dimetilamino-3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentan-3-ol, o
 10 (2SS,3RS)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentan-3-ol]-dimetilamina.

27. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 1, CARACTERIZADO porque el compuesto empleado, de acuerdo a la fórmula II se elige entre:

- 15 • (2R,3R)-1-dimetilamino-3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentan-3-ol,
 • (2R,3S)-1-dimetilamino-3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentan-3-ol
 ó

es una mezcla del compuesto (2R,3R)-1-dimetilamino-3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentan-3-ol y (2R,3S)-1-dimetilamino-3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentan-3-ol, o
 20 (2RR,3RS)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentan-3-ol]-dimetilamina.

28. El procedimiento de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 1 hasta 17, CARACTERIZADO porque en la etapa (a) se emplean ácidos orgánicos o ácidos
 25 haluros de halógeno.

29. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 18, CARACTERIZADO porque en la etapa (a) se emplea ácido fórmico, ácido clorhídrico o ácido bromhídrico.

5

30. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 18, CARACTERIZADO porque en la etapa (a) se emplea ácido fórmico.

10 31. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 18, CARACTERIZADO porque en la etapa (a) se emplea ácido clorhídrico.

15 32. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 18, CARACTERIZADO porque en la etapa (a) se emplea ácido bromhídrico.

33. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 18, CARACTERIZADO porque en la etapa (a) se aplica el ácido con una alta concentración.

20

34. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 21, CARACTERIZADO porque el ácido clorhídrico empleado en la etapa (a) tiene una concentración superior al 20%.

25

35. El procedimiento de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 1 hasta 24, CARACTERIZADO porque después de la etapa (a), los compuestos de acuerdo a la fórmula III que han experimentado la eliminación se cristalizaron con ácido clorhídrico gaseoso.

5

36. El procedimiento de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 1 hasta 25, CARACTERIZADO porque el tiempo de reacción de la etapa (a) está comprendido entre 2 y 10 horas, preferentemente entre 3 y 8 horas, en particular entre 4 y 6 horas.

10

37. El procedimiento de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 1 hasta 26, CARACTERIZADO porque la temperatura de reacción en la etapa (a) está comprendida entre 35 y 100°C - 45 y 80°C - 50 y 60°C.

15

38. El procedimiento de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 1 hasta 27, CARACTERIZADO porque el solvato empleado en la etapa (a) se selecciona entre:
el agua o alcohol o soluciones alcohólicas acuosas.

20

39. El procedimiento de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 18 hasta 24, CARACTERIZADO porque el solvato empleado en la etapa (a) es un ácido acuoso.

25

40. El procedimiento de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 18 hasta 24, CARACTERIZADO porque en la etapa (a) el compuesto de acuerdo a la fórmula II utilizado, está disuelto en ácido acuoso.

5

41. El procedimiento de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 21 ó 24, CARACTERIZADO porque el compuesto de acuerdo a la fórmula II empleado en la etapa (a) está disuelto en ácido clorhídrico acuoso.

10

42. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 1, CARACTERIZADO porque en la etapa (b), el solvato utilizado se selecciona entre:

agua o alcohol o soluciones alcohólicas acuosas o acuosas ácidas, preferentemente de solución acuosas ácidas.

15

43. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 1, CARACTERIZADO porque en la etapa (b), el solvato utilizado se selecciona entre:

agua o etanol o una solución etanólica acuosa o ácido clorhídrico acuoso.

20

44. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 1, CARACTERIZADO porque en la etapa (b), el catalizador empleado comprende un metal noble.

25

45. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 44, CARACTERIZADO porque el catalizador empleado en la etapa (b) es paladio-sobre-carbón vegetal activado o cloruro de paladio (II).

5

46. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 44, CARACTERIZADO porque el catalizador empleado en la etapa (b) es paladio-sobre-carbón vegetal activado (1-10% en peso.)

10

47. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 1, CARACTERIZADO porque en la etapa (b) se mantiene una temperatura comprendida entre 20 y 40°C.

15 48. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 1, CARACTERIZADO porque en la etapa (b) se aplica una atmósfera de gas inerte, antes de la hidrogenación.

49. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 1, CARACTERIZADO porque en la etapa (b) se efectúa la etapa de hidrogenación bajo una presión previa de hidrógeno de 3-10 bar (0,3-1,0 Mpa),

y/o

la etapa de hidrogenación se desarrolla bajo una presión interna de hidrógeno de 0,5-3 bar (0,05-0,3 Mpa).

25

50. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 1, CARACTERIZADO porque en la etapa (b), la(s) substancia(s) de partida están altamente diluidas(s) en el solvato, al inicio.

5

51. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 1, CARACTERIZADO porque el solvato utilizado en ambas etapas (a) y (b) es una solución acuosa ácida.

10 52. El procedimiento de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 1 y 51, CARACTERIZADO porque entre las etapas (a) y (b) no se aísla ningún producto.

15 53. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 52, CARACTERIZADO porque las substancias de partida inicialmente están muy diluida(s) en el solvato.

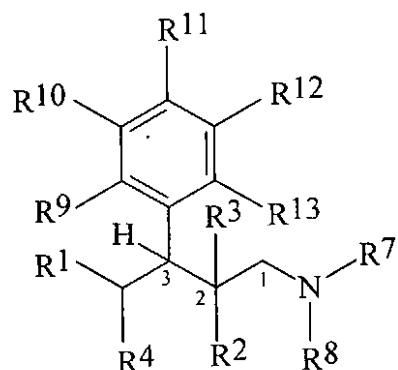
54. El procedimiento de acuerdo a las reivindicaciones 1 ó 52, CARACTERIZADO porque el compuesto de acuerdo a la fórmula II, empleado, se ha disuelto en ácido acuoso.

20

55. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 54, CARACTERIZADO porque el compuesto de acuerdo a la fórmula II, empleado, se ha disuelto en ácido clorhídrico acuoso.

25

56. Procedimiento para preparar un compuesto 3-aryl-butil-amina substituida de la fórmula general I:



I

5 en la cual

R^1 se selecciona entre H, alquilo C_{1-3} , ramificado o sin ramificar o lineal, saturado o insaturado, sin substituir o mono- o polisubstituido,

R^2 y R^3 , en cada caso uno independiente del otro, se seleccionan entre H, alquilo- C_{1-4} , ramificado o sin ramificar, saturado o insaturado, sin substituir o
10 mono- o polisubstituido,

ó

R^2 y R^3 forman conjuntamente un radical cicloalquilo- C_{4-7} saturado, sin substituir o mono- o polisubstituido,

R^4 se selecciona entre H, alquilo C_{1-3} , ramificado o sin ramificar, saturado o
15 insaturado, sin substituir o mono- o polisubstituido,

R^7 y R^8 , en cada caso cada uno independiente del otro, se selecciona de H o alquilo C_{1-3} , ramificado o sin ramificar o no ramificado, saturado o insaturado, sin substituir o mono- o polisubstituido,

R^9 hasta R^{13} , en cada caso uno independiente del otro, se selecciona entre H, F,
20 Cl, Br, I, CH_2F , CHF_2 , CF_3 , OH, SH, OR^{14} , OCF_3 , SR^{14} , $NR^{17}R^{18}$, $SOCH_3$, $SOCF_3$, SO_2CH_3 , SO_2CF_3 , CN, $COOR^{14}$, NO_2 , $CONR^{17}R^{18}$, alquilo- C_{1-6} ,

ramificado o sin ramificar, saturado o insaturado, sin substituir o mono- o polisubstituido,

donde R^{14} se selecciona de alquilo C_{1-6} ; piridilo, tienilo, tiazolilo, fenilo, bencilo o fenetilo, en cada caso sin substituir o mono- o polisubstituido, $PO(O\text{-alquilo-}C_{1-4})_2$, $CO(O\text{-alquilo-}C_{1-5})$, $CONH-C_6H_4\text{-(alquilo-}C_{1-3})$, $CO(\text{alquilo-}C_{1-5})$, $CO-CHR^{17}-NHR^{18}$, $CO-C_6H_4-R^{15}$, donde R^{15} es orto-OCO-alquilo- C_{1-3} , o meta- o para- $CH_2N(R^{16})_2$, donde R^{16} es alquilo C_{1-4} o 4-morfolino, donde en los radicales R^{14} , R^{15} y R^{16} , los grupos alquilo pueden ser ramificados o sin ramificar, saturados o insaturados, sin substituir o mono- o polisubstituidos y

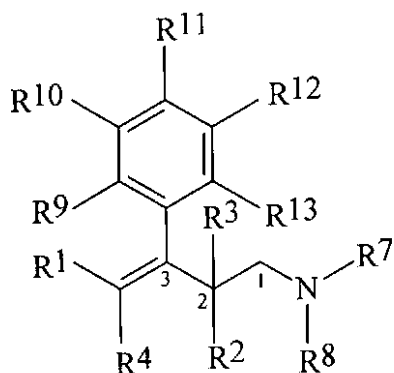
donde R^{17} y R^{18} , en cada caso uno independiente del otro, se seleccionan de H; alquilo- C_{1-6} , ramificados o sin ramificar, saturados o insaturados, sin substituir o mono- o polisubstituidos;

fenilo, bencilo o fenetilo, en cada caso sin substituir o mono- o polisubstituido,

o

R^9 y R^{10} o R^{10} y R^{11} forman un anillo OCH_2O , OCH_2CH_2O , $OCH=CH$, $CH=CHO$, $CH=C(CH_3)O$, $OC(CH_3)=CH$, $(CH_2)_4$ o $OCH=CHO$,

en cada caso en la forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular enantiómeros o diastereómeros, sus racematos o en la forma de una mezcla de estereoisómeros, en particular los enantiómeros o diastereoisómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en la forma de una sal fisiológicamente o farmacéuticamente aceptable, o en cada caso en la forma de un solvato, CARACTERIZADO porque se hidrogena el compuesto 3-aril-but-3-enil-amina substituida de la fórmula general III



III

en la cual R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} y R^{13} , tienen el significado mencionado anteriormente, en cada caso opcionalmente en la forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular enantiómeros o diastereómeros, en cualquier proporción de mezcla deseada, o en cada caso en la forma de una sal fisiológicamente o farmacéuticamente aceptable, o en cada caso en la forma de un solvato, con participación de un catalizador de metal e hidrógeno para entregar el compuesto 3-aryl-butyl-amina substituida de la fórmula general I.

En donde alquilo y cicloalquilo la expresión substituido se entiende como la sustitución de por lo menos un radical (es) hidrogeno por F, Cl, Br, I NH₂, SH u OH, y polisustituido como que la sustitución que ocurre varias veces, tanto en el mismo y en diferentes átomos, por sustituyentes idénticos o diferentes. Para cicloalquilo, el radical hidrogeno también puede estar reemplazado por -O alquilo C₂₋₃, o alquilo C₂₋₃ (en cada caso mono—o polisustituido o sin sustituir).

En donde en los anillos piridilo, tienilo, tiazolilo feniclo bencilo o fenetilo expersion substituido se entiende como una sustitución por R₂₃ OR₂₃, un halógeno, CF₃, CN, No₂, un NR²⁴ R²⁵, un alquilo C₁₋₆ saturado, un alcoxi C₁₋₆, un cicloalcoxi C₃₋₆, un cicloalquilo C₃₋₈ o un alquilenos C₂₋₆. En donde R²³, R²⁴, R²⁵ y R²⁶ representan hidrogeno, alquilo C1-10, fenilo, maftilo, tiofeno, benzotiofeno, pirrol, piridina, pirimidina, pirazina, quinolina, isoquinolina, ftalazina, benzo-1,2,5-

tiadiazol, benzotiazol, indol, benzotriazol, benzodioxano, carbazol, indol y quinazolina, en donde los grupos arilo y heteroarilo anteriormente mencionados pueden estar unidos via un grupo alquileo C_{1-3} y pueden ser no sustituidos, mono o polysustituidos; o los radicales R^{24} y R^{25} significan conjuntamente

5 $CH_2CH_2OCH_2CH_2$, $CH_2CH_2NR_{26}$, $CH_2CH_2O(CH_2)_{3-6}$.

57. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 56, CARACTERIZADO porque para el compuesto de acuerdo a la fórmula I y la fórmula III, R^4 se elige de H o CH_3 .

10

58. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 56, CARACTERIZADO porque para el compuesto de acuerdo a la fórmula I y la fórmula III, R^1 se selecciona de alquilo- C_{1-3} , saturado o insaturado, substituido o sin substituir, ramificado o sin ramificar.

15

59. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 56, CARACTERIZADO porque para los compuestos de acuerdo a la fórmula I y la fórmula III, R^4 se selecciona de H o CH_3 ,

20 y/o

R^1 se selecciona de alquilo- C_{1-3} , saturado o insaturado, substituido o sin substituir, ramificado o sin ramificar.

25 60. El procedimiento de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 56 hasta 59, CARACTERIZADO porque para los compuestos de acuerdo a la fórmula I y la fórmula III,

R^7 y R^8 , en cada caso uno independiente del otro, se seleccionan de H o CH_3 .

61. El procedimiento de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 56 hasta
5 60, CARACTERIZADO porque para los compuestos de acuerdo a la fórmula I y
la fórmula III

R^1 se selecciona entre,

alquilo- C_{1-3} , saturado y sin substituir, ramificado o sin ramificar.

10

62. El procedimiento de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 56 hasta
61, CARACTERIZADO porque para los compuestos de acuerdo a la fórmula I y
la fórmula III,

R^2 y R^3 , se seleccionan, independientemente uno del otro de,

15 H, alquilo- C_{1-4} , saturado y sin substituir, ramificado o sin ramificar.

63. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 62, CARACTERIZADO
porque para los compuestos de acuerdo a la fórmula I y la fórmula III

20 $R^3 = \text{H}$ y R^2 es diferente a H.

64. El procedimiento de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 56 hasta
61, CARACTERIZADO porque para los compuestos de acuerdo a la fórmula I y
25 la fórmula III,

R^2 y R^3 forman conjuntamente un radical cicloalquilo- C_{5-6} , saturado o insaturado,
sin substituir o mono- o polisubstituido,

R^2 y R^3 , en cada caso uno independiente del otro, se seleccionan entre H, alquilo- C_{1-4} , ramificado o sin ramificar, saturado, sin substituir o mono- o polisubstituido.

- 5 65. El procedimiento de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 56 hasta 64, CARACTERIZADO porque para los compuestos de acuerdo a la fórmula I y la fórmula III,

R^9 hasta R^{13} , donde 3 ó 4 de los radicales R^9 hasta R^{13} deben corresponder a H, se seleccionan independientemente entre sí de

- 10 H, Cl, F, OH, CF_2H , CF_3 ó alquilo- C_{1-4} , saturado y sin substituir, ramificado o no ramificado, OR^{14} ó SR^{14} , donde R^{14} se selecciona de alquilo- C_{1-3} , saturado y sin substituir, ramificado o sin ramificar o lineal;
o R^{12} y R^{11} forman un anillo 3,4-OCH=CH,
F, OH, CF_2H , CF_3 , OR^{14} ó SR^{14} .

15

66. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 56, CARACTERIZADO porque para los compuestos de acuerdo a la fórmula I y la fórmula III,

R^1 se selecciona de:

- 20 alquilo- C_{1-3} , saturado y sin substituir, ramificado o sin ramificar,
y/o

R^2 y R^3 , independientemente uno del otro, se seleccionan de:

H, alquilo- C_{1-4} , saturado y sin substituir, ramificado o sin ramificar,

R^2 y R^3 , forman conjuntamente un radical cicloalquilo- C_{5-6} , saturado o insaturado,

- 25 sin substituir o mono- o poli- substituido, y/o

R^4 se selecciona de H,

y/o

R^7 y R^8 , en cada caso uno independiente del otro, se seleccionan entre

H o CH_3 ,

y/o

R^9 hasta R^{13} , donde 3 ó 4 de los radicales R^9 hasta R^{13} deben corresponder a H,

5 se seleccionan independientemente uno del otro de:

H, Cl, F, OH, CF_2H , CF_3 ó alquilo- C_{1-4} , saturado y sin substituir, ramificado o sin

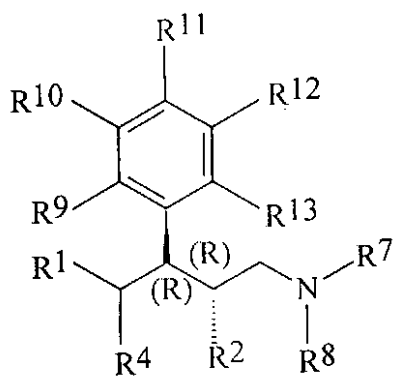
ramificar o lineal; OR^{14} o SR^{14} , donde R^{14} se selecciona de alquilo- C_{1-3} , saturado

y sin substituir, ramificado o sin ramificar;

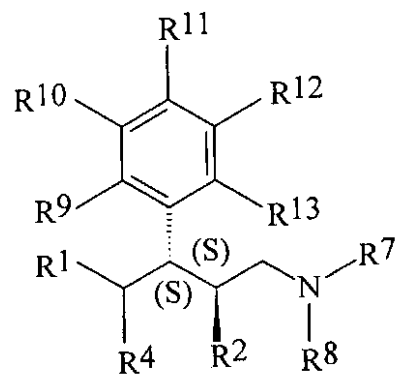
ó R^{12} y R^{11} forman un anillo 3,4- $\text{OCH}=\text{CH}$.

10

67. El procedimiento de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 56 hasta
15 66, CARACTERIZADO porque para los compuestos de acuerdo a la fórmula I, en la cual $R^3 = \text{H}$ y R^2 es diferente a H, estos tienen las configuraciones Ia o Ib, siguientes:



Ia

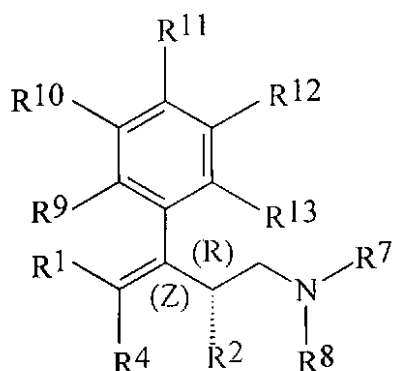


Ib

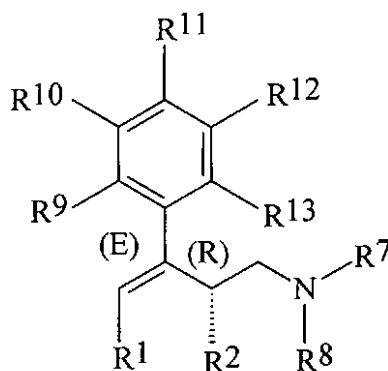
20

68. El procedimiento de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 56 hasta
67, CARACTERIZADO porque para los compuestos de acuerdo a la fórmula III,

en la cual $R^3=H$, R^2 es diferente a H, $R^4=H$ y R^1 es diferente a H, estos tienen las configuraciones IIIa o IIIb

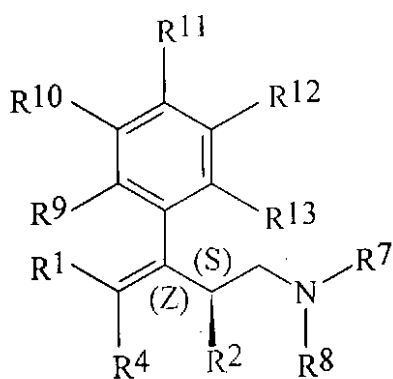


IIIa

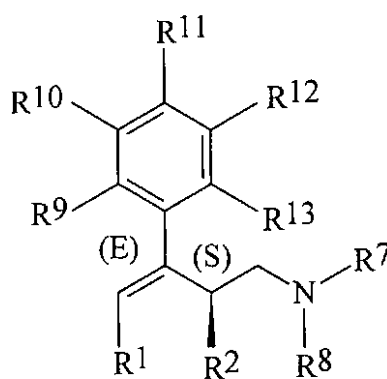


IIIb

o para los compuestos de acuerdo a la fórmula III, en la cual $R^3=H$, R^2 es diferente a H, $R^4=H$ y R^1 es diferente a H, estos tienen las configuraciones IIIc o III d



IIIc



III d

69. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 56, CARACTERIZADO porque para el/los compuesto(s) de acuerdo a la fórmula I, por lo menos uno de estos, se selecciona del grupo siguiente:

- 3-(3-dimetilamino-1-etil-2-metil-propil)-fenol,
- (1R,2R)-3-(3-dimetilamino-1-etil-2-metil- propil)-fenol,
- (-)-(1R,2R)-3-(3-dimetilamino-1-etil-2-metil-propil)-fenol,

- (1S,2S)-3-(3-dimetilamino-1-etil-2-metilpropil)-fenol,
- (+)-(1S,2S)-3-(3-dimetilamino-1-etil-2-metilpropil)-fenol,
- (±)-(1RS,2RS)-3-(3-dimetilamino-1-etil-2-metil-propil)-fenol,
- rac-(1RS,2RS)-3-(3-dimetilamino-1-etil-2-metil-propil)-fenol,
- 5 • [3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentil]-dimetilamino,
- (2R,3R)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentil]-dimetilamina,
- (-)-(2R,3R)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentil]-dimetilamina,
- (2S,3S)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentil]-dimetilamina,
- (+)-(2S,3S)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentil]-dimetilamina,
- 10 • (±)-(2RS,3RS)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentil]-dimetilamina,
- rac(2RS,3RS)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pentil]-dimetilamina,
- 3{[3-(p-isopropil-fenil-carbamoil)-oxi-fenil]-2-metil-pentil}-dimetilamina,
- (2R,3R)-{3[3-(p-isopropil-fenil-carbamoil)-oxi-fenil]-2-metil-pentil}-dimetilamina,
- 15 • (2S,3S)-{3[3-(p-isopropil-fenil-carbamoil)-oxi-fenil]-2-metil-pentil}-dimetilamina,
- (2SR,3SR)-{3[3-(p-isopropil-fenil-carbamoil)-oxi-fenil]-2-metil-pentil}-dimetilamina.

20

70. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 56, CARACTERIZADO porque para el/los compuesto(s) de acuerdo a la fórmula III empleados, por lo menos uno de estos, se selecciona del grupo siguiente:

- 3-(3-dimetilamino-1-etil-2-metil-propil)-fenol,
- 25 • (Z)-(2R)-3-(3-dimetilamino-1-etil-2-metilpropil)-fenol,
- (E)-(2R)-3-(3-dimetilamino-1-etil-2-metilpropil)-fenol,

- (Z,E)-(2R)-3-(3-dimetilamino-1-etenil-2-metilpropil)-fenol,
- (Z)-(2S)-3-(3-dimetilamino-1-etenil-2-metil-propil)-fenol,
- (E)-(2S)-(3-dimetilamino-1-etenil-2-metil-propil)-fenol,
- 5 • (Z,E)-(2S)-3-(3-dimetilamino-1-etenil-2-metilpropil)-fenol,
- 3-(3-dimetilamino-1-etenil-2-metil-propil)-fenol,
- (Z)-(2R)-3-(3-dimetilamino-1-etenil-2-metilpropil)-fenol,
- (E)-(2R)-3-(3-dimetilamino-1-etenil-2-metilpropil)-fenol,
- 10 • (Z,E)-(2R)-3-(3-dimetilamino-1-etenil-2-metil-propil)-fenol,
- (Z)-(2S)-3-(3-dimetilamino-1-etenil-2-metil-propil)-fenol,
- (E)-(2S)-(3-dimetilamino-1-etenil-2-metil-propil)-fenol,
- (Z,E)-(2S)-3-(3-dimetilamino-1-etenil-2-metilpropil)-fenol,
- 15 • [3-(3-metoksi-fenil)-2-metil-pent-3-enil]dimetilamina,
- (Z)-(2R)-[3-(3-metoksi-fenil)-2-metil-pent-3-enil]-dimetilamina,
- (E)-(2R)-[3-(3-metoksi-fenil)-2-metil-pent-3-enil]-dimetilamina,
- (Z,E)-(2R)-[3-(3-metoksi-fenil)-2-metil-pent-3-enil]-dimetilamina,
- (Z)-(2S)-[3-(3-metoksi-fenil)-2-metil-pent-3-enil]-dimetilamina,
- 20 • (E)-(2S)-[3-(3-metoksi-fenil)-2-metil-pent-3-enil]-dimetilamina,
- (Z,E)-(2S)-[3-(3-metoksi-fenil)-2-metil-pent-3-enil]-dimetilamina,
- {3[3-(p-isopropil-fenil-carbamoil)-oksi-fenil]-2-metil-pent-3-enil}-dimetilamina,
- (Z)-(2R)-{3[3-(p-isopropil-fenil-carbamoil)-oksi-fenil]-2-metil-pent-3-enil}-dimetilamina,
- 25 • (E)-(2R)-{3[3-(p-isopropil-fenil-carbamoil)-oksi-fenil]-2-metil-pent-3-enil}-dimetilamina,

- (Z,E)-(2R)-{3[3-(p-isopropil-fenil-carbamoil)-oxi-fenil]-2-metil-pent-3-enil}-dimetilamina,
- (Z)-(2S)-{3[3-(p-isopropil-fenil-carbamoil)-oxi-fenil]-2-metil-pent-3-enil}-dimetilamina,
- 5 • (E)-(2S)-{3[3-(p-isopropil-fenil-carbamoil)-oxi-fenil]-2-metil-pent-3-enil}-dimetilamina,
- (Z,E)-(2S)-{3[3-(p-isopropil-fenil-carbamoil)-oxi-fenil]-2-metil-pent-3-enil}-dimetilamina.

10

71. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 56, CARACTERIZADO porque el compuesto de acuerdo a la fórmula III empleado, presente un centro quiral, en la posición 2, de acuerdo a la fórmula III.

15

72. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 56, CARACTERIZADO porque el compuesto de acuerdo a la fórmula I presenta un centro quiral, en la posición 2, de acuerdo a la fórmula I.

20

73. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 56, CARACTERIZADO porque el compuesto de acuerdo a la fórmula III empleado es enantioméricamente puro.

25

74. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 56, CARACTERIZADO porque el compuesto de acuerdo a la fórmula III empleado es diastereoméricamente puro.

5

75. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 56, CARACTERIZADO porque el compuesto de acuerdo a la fórmula III empleado es enantioméricamente y diastereoméricamente puro.

10 76. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 56, CARACTERIZADO porque el compuesto de acuerdo a la fórmula III, empleado se elige de;

- (Z)-(2R)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pent-3-enil]-dimetilamina,
- (E)-(2R)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pent-3-enil]-dimetilamina

ó

15 es una mezcla del compuesto (Z)-(2R)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pent-3-enil]-dimetilamina y (E)-(2R)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pent-3-enil]-dimetilamina, o (Z,E)-(2R)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pent-3-enil]-dimetilamina.

20 77. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 56, CARACTERIZADO porque el compuesto de acuerdo a la fórmula III empleado se selecciona de:

- (Z)-(2S)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pent-3-enil]-dimetilamina,
- (E)-(2S)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pent-3-enil]-dimetilamina

ó

25 es una mezcla del compuesto (Z)-(2S)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pent-3-enil]-dimetilamina y (E)-(2S)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pent-3-enil]-dimetilamina, o (Z,E)-(2S)-[3-(3-metoxi-fenil)-2-metil-pent-3-enil]-dimetilamina.

78. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 56, CARACTERIZADO porque el solvato se elige entre:

- 5 agua o alcohol o soluciones alcohólicas acuosas o acuosas ácidas.

79. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 56, CARACTERIZADO porque el solvato se elige entre:

- 10 agua o etanol o una solución etanólica acuosa o ácido clorhídrico acuoso.

80. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 56, CARACTERIZADO porque el catalizador utilizado comprende un metal noble.

15

81. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 80, CARACTERIZADO porque el catalizador utilizado es paladio-sobre-carbón vegetal activo o cloruro de paladio (II).

20

82. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 80, CARACTERIZADO porque el catalizador utilizado es paladio-sobre-carbón vegetal activo.

- 25 83. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 56, CARACTERIZADO porque la temperatura se mantiene entre 20 y 40°C.

84. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 56, CARACTERIZADO porque antes de la hidrogenación se aplica una atmósfera de gas inerte.

5

85. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 56, CARACTERIZADO porque la etapa de hidrogenación se realiza bajo una presión previa de hidrógeno de 3-10 bar,

y/o

10 la etapa de hidrogenación se realiza bajo una presión interior de hidrógeno de 0,5-3 bar.

86. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 56, CARACTERIZADO porque las sustancias de partida está(n) altamente diluida(s) en el solvato en un comienzo.

87. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 56, CARACTERIZADO porque el compuesto empleado de acuerdo ala fórmula III se ha disuelto en ácido acuoso.

88. El procedimiento de acuerdo a la reivindicación 56, CARACTERIZADO porque el compuesto empleado de acuerdo ala fórmula III se ha disuelto en ácido clorhídrico acuoso.

89. El procedimiento de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 1 ó 56, CARACTERIZADO porque los productos son precipitados en un solvato orgánico al final del procedimiento.

5

90. El procedimiento de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 1 ó 56, CARACTERIZADO porque los productos se hacen precipitar con un ácido o con un gas ácido.

10

91. El procedimiento de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 1 ó 56, CARACTERIZADO porque los productos se hacen precipitar con un solvato orgánico, con un ácido o gas ácido, al término del procedimiento.

15