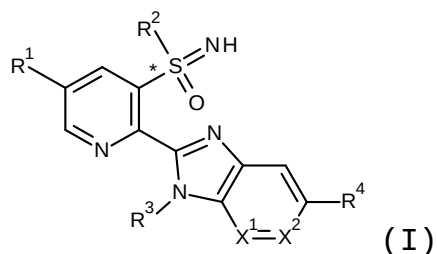


REIVINDICACIONES

Habiéndose descrito la invención como antecede, se reclama como propiedad lo contenido en las siguientes reivindicaciones:

1. Proceso para preparar sulfoximinas de fórmula (I) enriquecidas enantioméricamente.



caracterizado porque

R¹ es halógeno, haloalquilo C₁-C₆, ciano-C₁-alquilo C₆, ciano-C₁-alcoxi C₆, ciano-C₃-C₆-cicloalquilo, o arilo, caracterizado porque dicho arilo no está sustituido o está sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre halógeno, alquilo C₁-C₃ o alcoxi C₁-C₃;

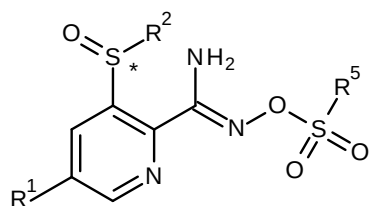
R² es alquilo C₁-C₄;

R³ es hidrógeno o alquilo C₁-C₄;

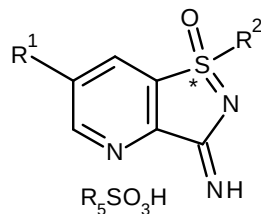
R⁴ es hidrógeno, halógeno o haloalquilo C₁-C₄;

S* es un átomo de azufre estereogénico que se encuentra en configuración R o S;

X^1 y X^2 se seleccionan independientemente entre CH o N, con la condición de que al menos uno de X^1 y X^2 es nitrógeno, caracterizado porque dicho proceso comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula (V) o un compuesto de fórmula (VI)

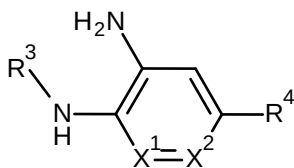


(V) o



, (VI)

caracterizado porque R^1 , R^2 y S^* son como se definen para los compuestos de fórmula (I), y R^5 seleccionado entre C_1 - C_4 -alquilo o fenilo, caracterizado porque dicho fenilo no está sustituido o está sustituido con 1 o 2 sustituyentes seleccionados entre halógeno, ciano, nitro o metilo; con un compuesto de fórmula (VII)

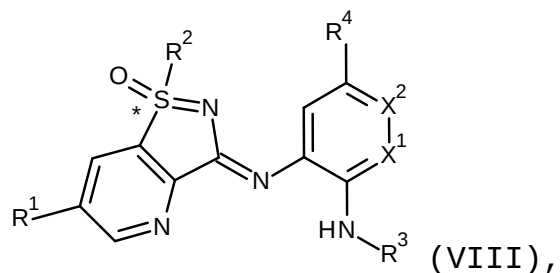


(VII),

caracterizado porque R^3 , R^4 , X^1 y X^2 son como se definen para un compuesto de fórmula (I), en un disolvente adecuado a una temperatura adecuada para producir un compuesto de fórmula (I).

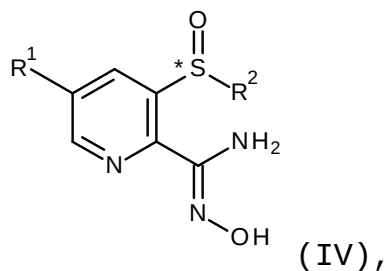
2. El proceso de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque el compuesto de fórmula (VI) se hace reaccionar con un compuesto de fórmula (VII) para obtener un

compuesto de fórmula (I) mediante un producto intermedio de fórmula (VIII).

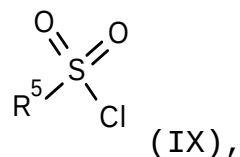


caracterizado porque R¹, R², S*, R³, R⁴, X¹ y X² son como se definen para un compuesto de fórmula (I)

3. El proceso de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque un compuesto de fórmula (IV)

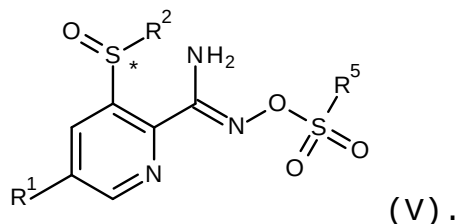


caracterizado porque R¹, R² y S* son como se definen para un compuesto de fórmula (I), se hace reaccionar con un cloruro de sulfonilo de fórmula (IX)

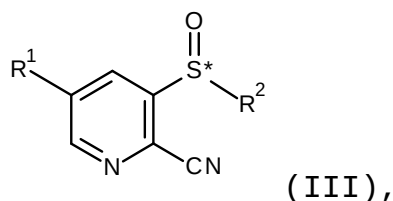


caracterizado porque R⁵ se selecciona entre C₁-C₄-alquilo o fenilo, caracterizado porque dicho fenilo no está sustituido o está sustituido con 1 o 2 sustituyentes seleccionados entre halógeno, ciano, nitro o metilo; en

presencia de una base y en un disolvente para producir un compuesto de fórmula (V)

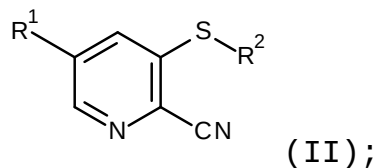


4. El proceso de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque un compuesto de sulfinilo de fórmula (III)



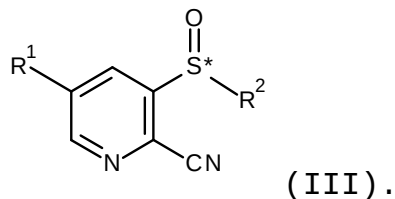
caracterizado porque R¹, R² y S* son como se definen para un compuesto de fórmula (I), se hace reaccionar con hidroxilamina en un disolvente a una temperatura adecuada para producir un compuesto de fórmula (IV).

5. El proceso de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque un compuesto de sulfanilo de fórmula (II)



caracterizado porque R¹ y R² son como se definen para los compuestos de fórmula (I); se oxida estereoselectivamente en presencia de un oxidante, en presencia de un reactivo o catalizador quiral, opcionalmente en presencia de un aditivo

ácido adecuado, en un disolvente (o diluyente); para producir un compuesto de sulfinilo de fórmula (III)



6. El proceso de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque la relación del compuesto de fórmula (VII) usado, en comparación con el compuesto de fórmula (VI), está en el intervalo de 2:1 a 1:1.

7. El proceso de conformidad con la reivindicación 5, caracterizado porque los disolventes (o diluyentes) se seleccionan entre disolventes apróticos polares, nitrilos, ésteres, cetonas, alcoholes, hidrocarburos aromáticos, carbonatos y éteres y mezclas de los mismos.

8. El proceso de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque la reacción del compuesto de fórmula (V) o un compuesto de fórmula (VI) con un compuesto de fórmula (VII) se lleva a cabo en un intervalo de temperatura entre 20 °C a 150 °C.

9. El proceso de conformidad con la reivindicación 3, caracterizado porque la relación del compuesto de fórmula (IX) usado, en comparación con el compuesto de fórmula (IV), está en el intervalo de 3:1 a 1:1.

10. El proceso de conformidad con la reivindicación 3 o la reivindicación 9, caracterizado porque la base se

selecciona entre trialquilaminas tales como trietilamina y tributilamina, carbonatos de metales alcalinos tales como carbonato sódico y carbonato potásico, hidróxido de metales alcalinos tales como hidróxido potásico e hidróxido sódico.

11. El proceso de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 3, 9 o 10, caracterizado porque la relación de una base usada, en comparación con el cloruro de sulfonilo de fórmula (IX), es de 1.5:1 a 1:1.

12. El proceso de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 3, 9, 10 u 11, caracterizado porque los disolventes (o diluyentes) se seleccionan entre ésteres, nitrilos, éteres e hidrocarburos alifáticos, aromáticos o halogenados.

13. El proceso de conformidad con la reivindicación 4, caracterizado porque la reacción se lleva a cabo con una disolución acuosa de hidroxilamina en un disolvente adecuado a una temperatura adecuada.

14. El proceso de conformidad con la reivindicación 4 o la reivindicación 13, caracterizado porque la relación de hidroxilamina usada en comparación con un compuesto de fórmula (III) está en el intervalo entre 2:1 y 1:1.

15. El proceso de conformidad con la reivindicación 4, caracterizado porque en lugar de hidroxilamina se usa hidrocloruro de hidroxilamina de base libre o sulfato de hidroxilamina en combinación con 1 eq (con respecto a la sal

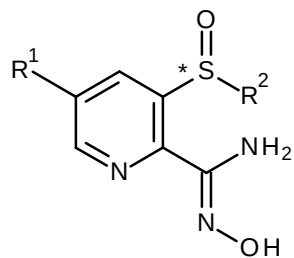
de hidroxilamina) de una base adecuada en lugar de hidroxilamina.

16. El proceso de conformidad con la reivindicación 15, caracterizado porque las bases se seleccionan entre hidróxido sódico, hidróxido potásico, carbonato sódico, carbonato potásico y bicarbonato sódico.

17. El proceso de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 4, 13, 14, 15 o 16, caracterizado porque los disolventes (o diluyentes) se seleccionan entre alcoholes, éteres e hidrocarburos alifáticos, aromáticos o halogenados.

18. El proceso de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 4, 13, 14, 15, 16 o 17, caracterizado porque la reacción se lleva a cabo en un intervalo de temperatura de -20 °C a 80 °C.

19. Un proceso para preparar un compuesto de fórmula (IV)



(IV); caracterizado porque

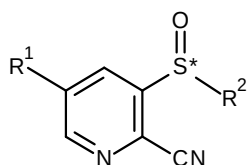
R¹ es halógeno, haloalquilo C₁-C₆, ciano-C₁-alquilo C₆, ciano-C₁-alcoxi C₆, ciano-C₃-C₆-cicloalquilo, o arilo, caracterizado porque dicho arilo no está sustituido o está sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados

independientemente entre halógeno, alquilo C₁-C₃ o alcoxi C₁-C₃;

R² es alquilo C₁-C₄; y

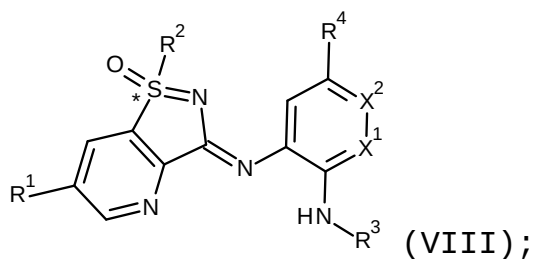
S* es un átomo de azufre estereogénico que se encuentra en configuración R o S;

cuyo proceso comprende hacer reaccionar el compuesto de fórmula (III)



(III), caracterizado porque R¹, R² y S* son como se definen para los compuestos de fórmula (IV), con hidroxilamina en un disolvente adecuado a una temperatura adecuada para producir un compuesto de fórmula (IV).

20. Un compuesto de fórmula (VIII)



caracterizado porque

R¹ es halógeno, haloalquilo C₁-C₆, ciano-C₁-alquilo C₆, ciano-C₁-alcoxi C₆, ciano-C₃-C₆-cicloalquilo, o arilo, caracterizado porque dicho arilo no está sustituido o está sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre halógeno, alquilo C₁-C₃ o alcoxi C₁-C₃;

R^2 es alquilo C_1-C_4 ;

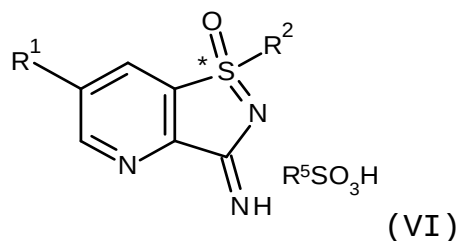
R^3 es hidrógeno o alquilo C_1-C_4 ;

R^4 es hidrógeno, halógeno o haloalquilo C_1-C_4 ;

S^* es un átomo de azufre estereogénico que se encuentra en configuración R o S; y

X^1 y X^2 son independientemente CH o N, con la condición de que al menos uno de X^1 y X^2 sea nitrógeno.

21. Un compuesto de fórmula (VI)



caracterizado porque

R^1 es halógeno, haloalquilo C_1-C_6 , ciano- C_1 -alquilo C_6 , ciano- C_1 -alcoxi C_6 , ciano- C_3-C_6 -cicloalquilo, o arilo, caracterizado porque dicho arilo no está sustituido o está sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre halógeno, alquilo C_1-C_3 o alcoxi C_1-C_3 ;

R^2 es alquilo C_1-C_4 ;

R^5 es C_1-C_4 -alquilo o fenilo, caracterizado porque dicho fenilo no está sustituido o está sustituido con 1 o 2 sustituyentes seleccionados entre halógeno, ciano, nitro, o metilo; y.

S^* es un átomo de azufre estereogénico que se encuentra en configuración R o S;