

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
26. Juni 2008 (26.06.2008)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 2008/074653 A1**

- (51) **Internationale Patentklassifikation:**  
C07C 231/10 (2006.01) C07C 233/58 (2006.01)
- (21) **Internationales Aktenzeichen:** PCT/EP2007/063473
- (22) **Internationales Anmeldedatum:**  
6. Dezember 2007 (06.12.2007)
- (25) **Einreichungssprache:** Deutsch
- (26) **Veröffentlichungssprache:** Deutsch
- (30) **Angaben zur Priorität:**  
10 2006 060 949.2  
20. Dezember 2006 (20.12.2006) DE
- (71) **Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US):** SALTIGO GMBH [DE/DE]; Katzbergstrasse 1, 40764 Langenfeld (DE).
- (72) **Erfinder; und**
- (75) **Erfinder/Anmelder (nur für US):** JOB, Andreas [DE/DE]; René-Magritte-Promenade 15, 50858 Köln (DE). WESTEPPE, Uwe [DE/DE]; Birker Feld 22, 42899 Remscheid (DE). RODEFELD, Lars [DE/DE]; Am Scherfenbrand 110A, 51375 Leverkusen (DE).
- (74) **Anwalt:** WICHMANN, Birgid; c/O LANXESS Deutschland GmbH, 51369 Leverkusen (DE).
- (81) **Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart):** AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.
- (84) **Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart):** ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

**Veröffentlicht:**

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen



WO 2008/074653 A1

(54) **Title:** METHOD FOR PRODUCING MENTHYL DERIVATIVES

(54) **Bezeichnung:** VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON MENTHYLDERIVATEN

(57) **Abstract:** The invention provides an improved method for producing menthyl derivatives through the reaction of menthyl halides with magnesium and the subsequent reaction with electrophiles in the presence of additives.

(57) **Zusammenfassung:** Bereitgestellt wird ein verbessertes Verfahren zur Herstellung von Menthylderivaten durch Umsetzung von Menthylhalogeniden mit Magnesium und nachfolgender Umsetzung mit Elektrophilen in Gegenwart von Additiven.

### Verfahren zur Herstellung von Menthylderivaten

Die vorliegende Erfindung betrifft ein verbessertes Verfahren zur Herstellung von Menthylderivaten.

Menthol ist für seine physiologische Kühlwirkung auf die Haut und die Schleimhautmembranen des Mundes bekannt und wird in großem Umfang als Geschmacksstoff in Nahrungsmitteln, Getränken, Zahncreme, Mundwasser sowie als eine Komponente in einer Vielzahl von Toilettenartikeln, Salben und Lotionen für eine örtliche Aufbringung verwendet. Der Kühleffekt ist ein physiologischer Effekt infolge der direkten Wirkung von Menthol auf die Nervenenden des menschlichen Körpers, die für die Wahrnehmung von Hitze oder Kälte verantwortlich sind, und beruht nicht auf der latenten Verdampfungswärme. Es wird angenommen, dass das Menthol direkt stimulierend auf die Kaltrezeptoren an den Nervenenden wirkt, die ihrerseits das Zentralnervensystem stimulieren.

Die Verwendung von Menthol ist jedoch wegen seines starken pfefferminzartigen Geruchs und infolge seiner relativ starken Flüchtigkeit begrenzt.

In der DE-A-24 136 39 und DE-A-22 052 55 wurden erstmalig spezielle Menthylamide beschrieben, die ebenfalls eine starke physiologische Kühlwirkung auf die Haut und auf die Schleimhautmembranen des Körpers, insbesondere von Nase, Mund, Hals und Gastrointestinaltrakt, besitzen. Diese Kühlwirkung ist in vielen Fällen weit dauerhafter als jene, die man mit Menthol erhält, ohne dass gleichzeitig der starke Geruch gegeben ist. Die Verbindungen besitzen ferner eine geringere Flüchtigkeit als Menthol und werden als sogenannte Cooling Agents in der Lebensmittelindustrie eingesetzt. Ihre wirtschaftliche Herstellung ist somit von großem Interesse.

Aus der DE-A-24 136 39 sowie DE-A-22 052 55 ist ein Verfahren zur Herstellung von Menthylamiden bekannt, bei dem man ausgehend von Menthylchlorid zunächst ein Grignardreagenz formt, das in einem Folgeschritt mit Kohlendioxid zur Menthylcarbonsäure umgesetzt wird. Dieses Intermediat wird dann mit einem Chlorierungsmittel wie Thionylchlorid zum entsprechenden Menthylsäurechlorid umgesetzt, welches mit einem geeigneten mono- oder disubstituierten Amin in einer weiteren Stufe in Gegenwart eines Chlorwasserstoff-Akzeptors wie Natriumhydroxid zum gewünschten Menthylamid reagiert. Diese Vorgehensweise ist dahingehend nachteilig, dass sie ausgehend von Menthylchlorid vier chemische Synthesestufen bis zum Zielmolekül benötigt.

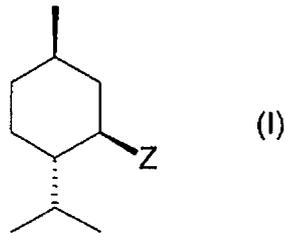
Aus US-A-4,350,832 sowie US-A-4,366,317 ist ein Verfahren bekannt, nach dem die Umsetzung von Menthylmagnesiumchlorid (in einem 0,5%igen Überschuss bezogen auf Isocyanat) mit tert. Butylisocyanat zu dem entsprechenden N-tert. Butyl-p-menthyl-3-carboxamid führt. Gemäß US-A-4,350,832 wird eine Reaktionstemperatur im Bereich zwischen -10°C und + 100°C gewählt. Dabei werden Ausbeuten über 50% erhalten, wobei sich diese Ausbeute allerdings auf die Gesamtausbeute von beiden Epimeren, d.h. dem Menthyl- und Neomenthyl-Epimer bezieht. Wird eine Reaktionstemperatur von 0°C bis 30°C, d.h. im unteren Teil dieses Temperaturbereichs gewählt, so liegt der Anteil des Menthyl-Epimers bei 57-80 Gew.% bezogen auf die Summe aus Menthyl- und Neomenthyl-Epimer. Da dem Menthyl-Epimer eine größere physiologische Kühlwirkung zukommt als dem Neomenthyl-Epimer, wird in US-A-4,366,317 ein verbessertes Verfahren angestrebt, bei dem das erhaltene Produkt mindestens zu 90 Gew.% aus dem Menthyl-Epimer und maximal zu 10 Gew.% aus dem Neomenthyl-Epimer besteht. Hierzu wird die Umsetzung mit tert. Butylisocyanat bei einer Temperatur im Bereich zwischen -20°C und -70°C durchgeführt. Dies führt jedoch zu einer sehr geringen Reaktionsgeschwindigkeit, so dass die Reaktionszeit bei 20 bis 80 Stunden liegt. Gleichzeitig sinkt die Gesamtausbeute an beiden Epimeren ganz deutlich, z.B. auf 24,2 Gew.% bei einer Reaktionstemperatur von -70°C.

Aus Angew. Chem., Int. Ed. 2006, 45, 6509 ist es bekannt, dass sich aus Menthylchlorid und Magnesium eine Mischung (Verhältnis 1:1) von Menthylmagnesiumchlorid und dessen Epimer Neomenthylmagnesiumchlorid bildet. Bei einer nachfolgenden Umsetzung mit Elektrophilen reagiert aus dieser Mischung zunächst sehr bevorzugt das Menthylmagnesiumchlorid zu dem gewünschten Menthylderivat ab. Setzt man also zunächst eine äquimolare Menge von Menthylchlorid mit Magnesium und anschließend mit dem entsprechenden Elektrophil um, erhält man maximal eine Ausbeute von 50%. Dies ist insbesondere nachteilig, da bei diesen Reaktionen üblicherweise das Menthylchlorid die wertvollere Reaktionskomponente ist (im Vergleich zum jeweiligen Elektrophil).

Aufgrund des verbreiteten Einsatzes von Menthylamiden und deren Derivaten in der Lebensmittelindustrie bestand somit ein Bedürfnis nach einem verbesserten, technisch möglichst einfachen und wirtschaftlichen Herstellverfahren.

Überraschenderweise wurde gefunden, dass die Reaktion eines Menthylhalogenids mit Magnesium und anschließend mit Elektrophilen in Gegenwart von Additiven bezüglich des gewünschten Epimers des jeweiligen Menthylderivats zu deutlich höheren Ausbeuten als 50% führt. Dieses Verfahren stellt daher eine erhebliche wirtschaftliche Verbesserung des bisherigen Synthesewegs dar.

Gegenstand der Erfindung ist ein Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I)



wobei

Z C(=O)NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup> oder CH<sub>2</sub>NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup> bedeutet, worin

- R<sup>1</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>30</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Alkynyl, C<sub>7</sub>-C<sub>20</sub>-Alkylaryl, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-Aryl, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>-Heteroaryl, oder durch C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>-Heteroaryl substituiertes Phenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Cycloalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Cycloalkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>-Hydroxyalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Acyloxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>-Alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Alkylthioalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Aminoalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Acylaminoalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Carboxyalkyl, einen Rest -C<sub>n</sub>H<sub>2n</sub>C(=O)R<sup>1</sup> oder einen Rest -C<sub>n</sub>H<sub>2n</sub>COOR<sup>1</sup> bedeutet, wobei -C<sub>n</sub>H<sub>2n</sub> eine geradkettige oder verzweigte Alkylengruppe ist, in der n eine ganze Zahl von 1 bis 10 ist und R<sup>1</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Hydroxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxyalkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Acyloxyalkyl darstellt,
- R<sup>2</sup> die gleichen Bedeutungen wie R<sup>1</sup> besitzt, ferner Wasserstoff oder einen Rest -X-OH bedeuten kann, wobei X eine geradkettige oder verzweigte C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>-Alkylengruppe darstellt, die gegebenenfalls durch ein oder mehrere Heteroatome, bevorzugt Sauerstoff oder Schwefel, unterbrochen ist, oder
- R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen eine gegebenenfalls durch ein oder mehrere Heteroatome, bevorzugt Sauerstoff oder Schwefel, unterbrochene Alkylenkette bilden, die mit dem Stickstoffatom zusammengenommen, an das R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gebunden sind, einen maximal 10-gliedrigen Ring bildet,

oder

Z C(OH)R<sup>4</sup>R<sup>5</sup> bedeutet, worin

- R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> gleich oder verschieden sind und die zuvor für R<sup>1</sup> angegebenen Bedeutungen besitzen und
- R<sup>5</sup> alternativ auch für Wasserstoff stehen kann,

oder

Z C(=O)R<sup>6</sup> bedeutet, worin

- R<sup>6</sup> die für R<sup>1</sup> angegebenen Bedeutungen besitzt,

oder

Z  $CR^7R^8R^9$  bedeutet, worin  
 $R^7$  die für  $R^1$  angegebenen Bedeutungen besitzt und  
 $R^8$  und  $R^9$  gleich oder verschieden sind und für O-C<sub>1</sub>-C<sub>30</sub>-Alkyl stehen,  
 oder worin alternativ  
 $R^7$  und  $R^8$  gleich oder verschieden sind und die für  $R^1$  angegebenen Bedeutungen  
 besitzen und  
 $R^9$  für O-C<sub>1</sub>-C<sub>30</sub>-Alkyl steht,

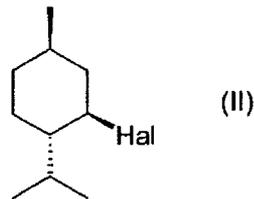
oder

Z  $CHR^{10}CHR^{11}OH$  bedeutet, worin  
 $R^{10}$  und  $R^{11}$  gleich oder verschieden sind und die zuvor für  $R^1$  angegebenen  
 Bedeutungen besitzen,

oder

Z  $SO_2R^{12}$  darstellt, worin  
 $R^{12}$  für einen gegebenenfalls substituierten C<sub>6</sub>-C<sub>18</sub>-Arylrest steht.

indem man zunächst eine Verbindung der allgemeinen Formel (II)



worin

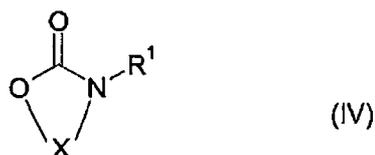
Hal für Chlor, Brom oder Iod steht,  
 mit Magnesium und gegebenenfalls elementarem Jod oder einem Alkylhalogenid umgesetzt,  
 und anschließend in Gegenwart eines Additivs mit einem Elektrophil umgesetzt, welches  
 ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus

- Isocyanaten der allgemeinen Formel (III),



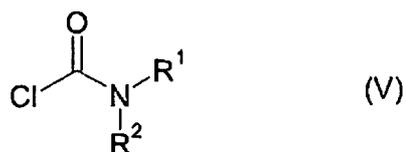
wobei  $R^1$  die für die allgemeine Formel (I) genannten Bedeutungen besitzt,

- Heterocyclen der allgemeinen Formel (IV),



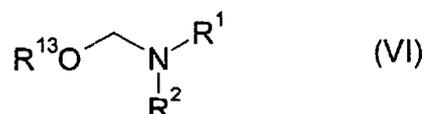
wobei  $R^1$  und X die für die allgemeine Formel (I) genannten Bedeutungen besitzt,

- Carbamoylchloriden der allgemeinen Formel (V),



worin  $\text{R}^1$  und  $\text{R}^2$  die für die allgemeine Formel (I) genannten Bedeutungen besitzen,

- Aminoethern der allgemeinen Formel (VI),



worin  $\text{R}^1$  und  $\text{R}^2$  die für die allgemeine Formel (I) genannten Bedeutungen besitzen und  $\text{R}^{13}$  für einen  $\text{C}_1$ - $\text{C}_{20}$ -Alkylrest steht,

- Aldehyden der allgemeinen Formel (VII),



worin  $\text{R}^4$  die zuvor für Formel (I) genannten Bedeutungen besitzt,

- Ketonen der allgemeinen Formel (VIII),



worin  $\text{R}^4$  und  $\text{R}^5$  gleich oder verschieden sind und die zuvor für  $\text{R}^1$  angegebenen Bedeutungen besitzen,

- Nitrilen der allgemeinen Formel (IX),



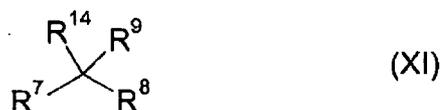
worin  $\text{R}^6$  die zuvor für Formel (I) genannten Bedeutungen besitzt,

- Acetalen der allgemeinen Formel (X),



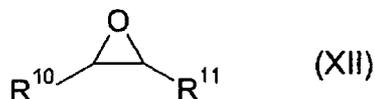
worin  $\text{R}^7$  und  $\text{R}^8$  gleich oder verschieden sind und die für  $\text{R}^1$  in der allgemeinen Formel (I) angegebenen Bedeutungen haben und  $\text{R}^9$  und  $\text{R}^{14}$  gleich oder verschieden sind und für  $\text{O}-\text{C}_1$ - $\text{C}_{30}$ -Alkyl stehen,

- Orthoestern der allgemeinen Formel (XI),



worin  $\text{R}^7$  die für  $\text{R}^1$  in der allgemeinen Formel (I) genannten Bedeutungen besitzt, und  $\text{R}^8$ ,  $\text{R}^9$  und  $\text{R}^{14}$  gleich oder verschieden sind und für  $\text{O}-\text{C}_1$ - $\text{C}_{30}$ -Alkyl stehen,

- Epoxiden der allgemeinen Formel (XII),



worin R<sup>10</sup> und R<sup>11</sup> die für die allgemeine Formel (I) genannten Bedeutungen besitzen, und

- Sulfonylchloriden der allgemeinen Formel (XIII)



worin R<sup>12</sup> die für Formel (I) genannten Bedeutungen hat.

Sofern im Rahmen dieser Anmeldung der Begriff „substituiert“ verwendet wird, bedeutet dies, dass ein Wasserstoff-Atom an einem angegebenen Rest oder Atom durch eine der angegebenen Gruppen ersetzt ist, mit der Maßgabe, dass die Wertigkeit des angegebenen Atoms nicht überschritten wird und die Substitution zu einer stabilen Verbindung führt.

Bei allen Resten, die im Rahmen dieser Anmeldung genannt werden, die in verzweigter oder unverzweigter Form vorliegen können, wie z.B. Alkyl-, Alkoxy-, Alkenyl- und Alkynyl-Resten, umfasst die Nennung dieser Reste sowohl die unverzweigten als auch die verzweigten Formen.

Im Rahmen dieser Anmeldung und Erfindung können alle zuvor genannten und im Folgenden genannten, allgemeinen oder in Vorzugsbereichen genannten Definitionen von Resten, Parametern oder Erläuterungen untereinander, also auch zwischen den jeweiligen Bereichen und Vorzugsbereichen in beliebiger Weise kombiniert werden und sind somit offenbart.

Bei einem C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>-Heteroaryl-Rest handelt es sich um einen aromatischen Rest, bei dem mindestens ein Gerüstkohlenstoffatom im gesamten Rest durch ein Heteroatom, ausgewählt aus der Gruppe Stickstoff, Schwefel oder Sauerstoff, ersetzt ist. Bevorzugt sind ein, zwei, drei oder vier Gerüstkohlenstoffatome im gesamten Rest durch Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Stickstoff, Schwefel oder Sauerstoff, ersetzt.

Allen Verbindungen der oben stehenden allgemeinen Formeln (III) bis (XIII) ist gemeinsam, dass es sich um Elektrophile handelt. Die erfindungsgemäße Umsetzung gelingt unter Einsatz der gesamten Breite dieser Elektrophile nach dem gleichen erfinderischen Prinzip.

Erfindungswesentlich ist es, dass diese Umsetzung in Gegenwart eines Additivs durchgeführt wird. Als derartige Additive werden beispielsweise LiCl, LiBr, ZnCl<sub>2</sub>, ZnBr<sub>2</sub>, SnCl<sub>2</sub>, SnCl<sub>4</sub>,

MgCl<sub>2</sub>, MgBr<sub>2</sub>, AlCl<sub>3</sub>, TiCl<sub>4</sub>, Al(OiPr)<sub>3</sub>, Ti(OiPr)<sub>4</sub>, CeCl<sub>3</sub>, ZnEt, CuBr, LiClO<sub>4</sub>, BCl<sub>3</sub>, BF<sub>3</sub> und deren Etherat, Borsäure, unsubstituierte und substituierte Phenylboronsäuren und andere Lewissäuren eingesetzt.

Durch den Zusatz eines solchen Additivs kann bei allen Umsetzungstypen eine deutliche Steigerung der Ausbeute bezüglich des gewünschten Epimers beobachtet werden.

Der Zusatz des Additivs kann zu allen Zeitpunkten im Verfahrensverlauf erfolgen, d.h. vor, während oder nach Zugabe des Elektrophils der allgemeinen Formeln (III) bis (XIII). Bevorzugt erfolgt die Zugabe des Additivs vor der Zugabe des Elektrophils, wobei die Zugabe dabei entweder zur fertigen Grignardverbindung oder auch vor der Herstellung der Grignardverbindung zum Magnesium erfolgen kann.

Im letzteren Fall wird das Additiv zusammen mit Magnesium unter Inertgas vorgelegt, mit dem Lösungsmittel versetzt und anschließend wird gegebenenfalls elementares Jod oder das Alkylhalogenid zugegeben. Im ersteren Fall wird das Additiv zu der Lösung, welche die Grignardverbindung enthält, gleichzeitig, vor oder nach dem Elektrophil zugegeben.

Es hat sich bewährt, das Additiv in einer Menge von 1-100 Mol%, bevorzugt 10-50 Mol%, bezogen auf die sich bildende Grignardverbindung einzusetzen.

Vereinfachend wird im Rahmen dieser Anmeldung von den Verbindungen der allgemeinen Formel (I) auch als „Menthylderivaten“ gesprochen.

Die Herstellung der Edukte der allgemeinen Formel (II) ist nach dem Fachmann geläufigen Methoden möglich. Die Herstellung des Menthylchlorids aus Menthol ist beispielsweise in der Literatur umfassend beschrieben, z.B. in *J. Org. Chem.* **2000**, *65*, 2337.

Die Umsetzung der Edukte der allgemeinen Formel (II) zur Grignardverbindung kann in verschiedenen Lösungsmitteln durchgeführt werden. (siehe beispielsweise *J. Org. Chem.* **2000**, *65*, 2337 bezüglich möglicher Lösungsmittel für die Herstellung der Grignardverbindung). Geeignet sind als Lösungsmittel THF, Dioxan, Methyl-THF, Cyclopentylmethylether, Ethylenglycoldimethylether, Diethylenglycoldimethylether oder Mischungen der vorgenannten Lösungsmittel mit aromatischen Lösungsmitteln wie Toluol oder Xylol.

**Isocyanate der allgemeinen Formel (III):**

Als Elektrophile können in der erfindungsgemäßen Umsetzung **Isocyanate der allgemeinen Formel (III)** eingesetzt werden, worin

$R^1$   $C_1$ - $C_{30}$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkynyl,  $C_7$ - $C_{20}$ -Alkylaryl,  $C_6$ - $C_{10}$ -Aryl,  $C_5$ - $C_{10}$ -Heteroaryl oder durch  $C_5$ - $C_{10}$ -Heteroaryl substituiertes Phenyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Cycloalkyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Cycloalkenyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Cycloalkynyl,  $C_1$ - $C_{20}$ -Hydroxyalkyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Acyloxyalkyl,  $C_1$ - $C_{20}$ -Alkoxy,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkoxyalkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkylthioalkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Aminoalkyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Acylaminoalkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Carboxyalkyl, einen Rest  $-C_nH_{2n}C(=O)R'$  oder einen Rest  $-C_nH_{2n}COOR'$  bedeutet, wobei  $-C_nH_{2n}$  eine geradkettige oder verzweigte Alkylengruppe ist, in der  $n$  eine ganze Zahl von 1 bis 10 ist und  $R'$  Wasserstoff,  $C_1$ - $C_{10}$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_8$ -Hydroxyalkyl,  $C_1$ - $C_8$ -Alkoxyalkyl oder  $C_1$ - $C_8$ -Acyloxyalkyl darstellt,

Bevorzugt steht  $R^1$  in der allgemeinen Formel (III) für

$C_1$ - $C_{14}$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkynyl,  $C_5$ - $C_{10}$ -Cycloalkyl,  $C_5$ - $C_{10}$ -Cycloalkenyl,  $C_5$ - $C_{10}$ -Cycloalkynyl,  $C_1$ - $C_{10}$ -Hydroxyalkyl,  $C_3$ - $C_{10}$ -Acyloxyalkyl-,  $C_1$ - $C_{10}$ -Alkoxy,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkoxyalkyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkylthioalkyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Aminoalkyl,  $C_3$ - $C_{10}$ -Acylaminoalkyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Carboxyalkyl, einen Benzoxazolyl-, Benzo-1,3-dioxolanyl-, oder einen Oxazolyl-, Triazolyl-, Morpholinyl- oder Pyrazolyl- substituierten Phenyl-Rest, einen Rest  $-C_nH_{2n}C(=O)R'$  oder einen Rest  $-C_nH_{2n}COOR'$ , wobei  $-C_nH_{2n}$  eine geradkettige oder verzweigte Alkylengruppe ist, in der  $n$  eine ganze Zahl von 1 bis 6 ist und  $R'$  Wasserstoff,  $C_1$ - $C_{10}$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_8$ -Hydroxyalkyl,  $C_1$ - $C_8$ -Alkoxyalkyl oder  $C_1$ - $C_8$ -Acyloxyalkyl darstellt.

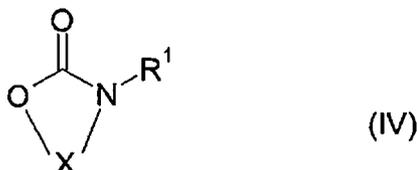
Besonders bevorzugt steht  $R^1$  in der allgemeinen Formel (III) für einen geradkettigen oder verzweigten  $C_1$ - $C_{10}$ -Alkyl-Rest, insbesondere Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec.-Butyl, tert.-Butyl, n-Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, neo-Pentyl, 1-Ethylpropyl, n-Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl, 1-Ethyl-2-methylpropyl, n-Hexyl, n-Heptyl, n-Octyl, n-Nonyl- oder n-Decyl, für einen  $C_5$ - $C_8$ -Cycloalkyl-Rest, insbesondere einen Cyclopentyl- oder einen Cyclohexyl-Rest, für einen Benzoxazolyl-, Benzo-1,3-dioxolanyl-, oder einen Oxazolyl-, Triazolyl-, Morpholinyl- oder Pyrazolyl-substituierten Phenyl-Rest.

Erhalten werden damit **Verbindungen der allgemeinen Formel (I)**, worin **Z** für einen Rest  $C(=O)NR^1R^2$  steht, wobei  $R^1$  die oben für die Verbindungen der allgemeinen Formel (III)

genannten allgemeinen, bevorzugten oder besonders bevorzugten Bedeutungen aufweist, und in denen R<sup>2</sup> Wasserstoff bedeutet.

**Heterocyclen der allgemeinen Formel (IV):**

Als weitere Elektrophile können in der erfindungsgemäßen Umsetzung auch **Heterocyclen der allgemeinen Formel (IV)**



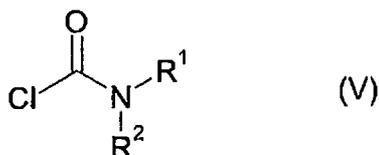
eingesetzt werden, wobei

- R<sup>1</sup> alle allgemeinen, bevorzugten oder besonders bevorzugten Bedeutungen annehmen kann, die R<sup>1</sup> in der allgemeinen Formel (III) besitzt, und
- X eine geradkettige oder verzweigte C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>-Alkylengruppe, bevorzugt eine geradkettige oder verzweigte C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylengruppe, besonders bevorzugt eine Methylen-, Ethylen-, n-Propylen-, n-Butylen- oder n-Pentylen-Gruppe darstellt, wobei diese allgemeinen, bevorzugten oder besonders bevorzugten Alkylengruppen gegebenenfalls durch ein oder mehrere Heteroatome, bevorzugt Sauerstoff oder Schwefel, unterbrochen sind.

Hierbei werden Verbindungen der allgemeinen Formel (I) erhalten, worin Z einen Rest –C(=O)NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup> darstellt, R<sup>1</sup> die zuvor genannten allgemeinen, bevorzugten oder besonders bevorzugten Bedeutungen besitzt, R<sup>2</sup> für einen Rest X-OH steht und X die zuvor für die allgemeine Formel (IV) genannten allgemeinen, bevorzugten und besonders bevorzugten Bedeutungen besitzt. Bei den erhaltenen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) handelt es sich somit um Hydroxy-funktionalisierte Amide.

**Carbamoylchloride der allgemeinen Formel (V):**

Als weitere Elektrophile können in der erfindungsgemäßen Umsetzung auch **Carbamoylchloride der allgemeinen Formel (V)** eingesetzt werden,

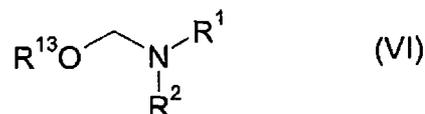


wobei R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gleich oder verschieden sind und alle zuvor für die allgemeine Formel (III) genannten allgemeinen, bevorzugten und besonders bevorzugten Bedeutungen aufweisen können.

Erhalten werden dabei **Verbindungen der allgemeinen Formel (I)**, wobei **Z** für einen Rest  $C(=O)NR^1R^2$  steht, worin  $R^1$  und  $R^2$  gleich oder verschieden sind und alle zuvor für die allgemeine Formel (III) genannten allgemeinen, bevorzugten und besonders bevorzugten Bedeutungen aufweisen.

**Aminoether der allgemeinen Formel (VI):**

Als weitere Elektrophile können in der erfindungsgemäßen Umsetzung auch **Aminoether der allgemeinen Formel (VI)** eingesetzt werden,



worin

$R^1$   $C_1$ - $C_{30}$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkynyl,  $C_7$ - $C_{20}$ -Alkylaryl,  $C_6$ - $C_{10}$ -Aryl,  $C_5$ - $C_{10}$ -Heteroaryl, durch  $C_5$ - $C_{10}$ -Heteroaryl substituiertes Phenyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Cycloalkyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Cycloalkenyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Cycloalkynyl,  $C_1$ - $C_{20}$ -Hydroxyalkyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Acyloxyalkyl,  $C_1$ - $C_{20}$ -Alkoxy,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkoxyalkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkylthioalkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Aminoalkyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Acylaminoalkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Carboxyalkyl, einen Rest  $-C_nH_{2n}C(=O)R'$  oder einen Rest  $-C_nH_{2n}COOR'$  bedeutet, wobei  $-C_nH_{2n}$  eine geradkettige oder verzweigte Alkylengruppe ist, in der  $n$  eine ganze Zahl von 1 bis 10 ist und  $R'$  Wasserstoff,  $C_1$ - $C_{10}$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_8$ -Hydroxyalkyl,  $C_1$ - $C_8$ -Alkoxyalkyl oder  $C_1$ - $C_8$ -Acyloxyalkyl darstellt,

$R^2$  die gleichen Bedeutungen wie  $R^1$  besitzt, ferner Wasserstoff oder einen Rest  $-X-OH$  bedeuten kann, wobei  $X$  eine geradkettige oder verzweigte  $C_1$ - $C_{20}$ -Alkylengruppe darstellt, die gegebenenfalls durch ein oder mehrere Heteroatome unterbrochen ist, oder worin

$R^1$  und  $R^2$  zusammen eine gegebenenfalls durch ein oder mehrere Heteroatome unterbrochene Alkylenkette bilden, die mit dem Stickstoffatom zusammengenommen, an das  $R^1$  und  $R^2$  gebunden sind, einen maximal 10-gliedrigen Ring bildet, und

$R^{13}$  für einen  $C_1$ - $C_{20}$ -Alkylrest steht.

Bevorzugt werden **Aminoether der allgemeinen Formel (VI)** eingesetzt, worin

$R^1$   $C_1$ - $C_{14}$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkynyl,  $C_5$ - $C_{10}$ -Cycloalkyl,  $C_5$ - $C_{10}$ -Cycloalkenyl,  $C_5$ - $C_{10}$ -Cycloalkynyl,  $C_1$ - $C_{10}$ -Hydroxyalkyl,  $C_3$ - $C_{10}$ -Acyloxyalkyl-,  $C_1$ - $C_{10}$ -Alkoxy,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkoxyalkyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkylthioalkyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Aminoalkyl,  $C_3$ - $C_{10}$ -Acylaminoalkyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Carboxyalkyl, einen Benzoxazolyl-, Benzo-1,3-dioxolanyl-, oder einen Oxazolyl-, Triazolyl-, Morpholinyl- oder Pyrazolyl-substituierten Phenyl-Rest, einen Rest  $-C_nH_{2n}C(=O)R'$  oder einen Rest  $-C_nH_{2n}COOR'$ , wobei  $-C_nH_{2n}$  eine geradkettige oder verzweigte Alkylengruppe ist, in der  $n$  eine ganze Zahl von 1 bis 6 ist und  $R'$

- Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Hydroxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxyalkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Acyloxyalkyl darstellt, und
- R<sup>2</sup> die gleichen Bedeutungen wie R<sup>1</sup> besitzt, ferner Wasserstoff oder einen Rest -X-OH bedeuten kann, wobei X eine geradkettige oder verzweigte C<sub>1</sub>-C<sub>14</sub>-Alkylengruppe darstellt, die gegebenenfalls durch ein oder mehrere Heteroatome unterbrochen ist, oder worin
- R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen eine gegebenenfalls durch ein oder mehrere Heteroatome unterbrochene Alkylkette bilden, die mit dem Stickstoffatom zusammengenommen, an das R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gebunden sind, einen maximal 8-gliedrigen Ring bildet, und
- R<sup>13</sup> für einen C<sub>1</sub>-C<sub>14</sub>-Alkylrest steht.

Besonders bevorzugt werden **Aminoether der allgemeinen Formel (VI)** eingesetzt, worin

- R<sup>1</sup> einen geradkettigen oder verzweigten C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkyl-Rest, insbesondere Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec.-Butyl, tert.-Butyl, n-Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, neo-Pentyl, 1-Ethylpropyl, n-Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl, 1-Ethyl-2-methylpropyl, n-Hexyl, n-Heptyl, n-Octyl, n-Nonyl- oder n-Decyl darstellt, für einen C<sub>5</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl-Rest, insbesondere einen Cyclopentyl- oder einen Cyclohexyl-Rest, oder für einen Benzoxazolyl-, Benzo-1,3-dioxolanyl- oder einen Oxazolyl-, Triazolyl-, Morpholinyl- oder Pyrazolyl-substituierten Phenyl-Rest steht,
- R<sup>2</sup> die gleichen Bedeutungen wie R<sup>1</sup> besitzt, ferner Wasserstoff oder einen Rest -X-OH bedeuten kann, wobei X eine geradkettige oder verzweigte C<sub>1</sub>-C<sub>14</sub>-Alkylengruppe darstellt, die gegebenenfalls durch ein oder mehrere Schwefel- oder Sauerstoffatome unterbrochen ist, oder worin
- R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen eine gegebenenfalls durch ein oder mehrere Schwefel- oder Sauerstoffatome unterbrochene Alkylkette bilden, die mit dem Stickstoffatom zusammengenommen, an das R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gebunden sind, einen maximal 8-gliedrigen Ring bildet, und
- R<sup>13</sup> für einen C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkylrest steht, insbesondere für Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec.-Butyl, tert.-Butyl, n-Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, neo-Pentyl, 1-Ethylpropyl, n-Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Di-

methylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl, 1-Ethyl-2-methylpropyl, n-Hexyl, n-Heptyl, n-Octyl, n-Nonyl- oder n-Decyl.

Hierbei werden jeweils **Verbindungen der allgemeinen Formel (I)** erhalten, worin **Z** einen Rest  $-\text{CH}_2\text{NR}^1\text{R}^2$  darstellt und  $\text{R}^1$  und  $\text{R}^2$  die zuvor genannten Bedeutungen haben.

**Aldehyde der allgemeinen Formel (VII):**

Als weitere Elektrophile können in der erfindungsgemäßen Umsetzung auch **Aldehyde der allgemeinen Formel (VII)** eingesetzt werden,



worin

$\text{R}^4$   $\text{C}_1\text{-C}_{30}$ -Alkyl,  $\text{C}_2\text{-C}_{20}$ -Alkenyl,  $\text{C}_2\text{-C}_{20}$ -Alkynyl,  $\text{C}_7\text{-C}_{20}$ -Alkylaryl,  $\text{C}_6\text{-C}_{10}$ -Aryl,  $\text{C}_5\text{-C}_{10}$ -Heteroaryl, durch  $\text{C}_5\text{-C}_{10}$ -Heteroaryl substituiertes Phenyl,  $\text{C}_3\text{-C}_{20}$ -Cycloalkyl,  $\text{C}_3\text{-C}_{20}$ -Cycloalkenyl,  $\text{C}_3\text{-C}_{20}$ -Cycloalkynyl,  $\text{C}_1\text{-C}_{20}$ -Hydroxyalkyl,  $\text{C}_3\text{-C}_{20}$ -Acyloxyalkyl,  $\text{C}_1\text{-C}_{20}$ -Alkoxy,  $\text{C}_2\text{-C}_{20}$ -Alkoxyalkyl,  $\text{C}_2\text{-C}_{20}$ -Alkylthioalkyl,  $\text{C}_2\text{-C}_{20}$ -Aminoalkyl,  $\text{C}_3\text{-C}_{20}$ -Acylaminoalkyl,  $\text{C}_2\text{-C}_{20}$ -Carboxyalkyl, einen Rest  $-\text{C}_n\text{H}_{2n}\text{C}(=\text{O})\text{R}'$  oder einen Rest  $-\text{C}_n\text{H}_{2n}\text{COOR}'$  bedeutet, wobei  $-\text{C}_n\text{H}_{2n}$  eine geradkettige oder verzweigte Alkylengruppe ist, in der  $n$  eine ganze Zahl von 1 bis 10 ist und  $\text{R}'$  Wasserstoff,  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ -Alkyl,  $\text{C}_1\text{-C}_8$ -Hydroxyalkyl,  $\text{C}_1\text{-C}_8$ -Alkoxyalkyl oder  $\text{C}_1\text{-C}_8$ -Acyloxyalkyl oder einen Heterocyclus darstellt.

Bevorzugt werden in der erfindungsgemäßen Umsetzung **Aldehyde der allgemeinen Formel (VII)** eingesetzt, worin

$\text{R}^4$   $\text{C}_1\text{-C}_{14}$ -Alkyl,  $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ -Alkenyl,  $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ -Alkynyl,  $\text{C}_5\text{-C}_{10}$ -Cycloalkyl,  $\text{C}_5\text{-C}_{10}$ -Cycloalkenyl,  $\text{C}_5\text{-C}_{10}$ -Cycloalkynyl,  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ -Hydroxyalkyl,  $\text{C}_3\text{-C}_{10}$ -Acyloxyalkyl-,  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ -Alkoxy,  $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ -Alkoxyalkyl,  $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ -Alkylthioalkyl,  $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ -Aminoalkyl,  $\text{C}_3\text{-C}_{10}$ -Acylaminoalkyl,  $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ -Carboxyalkyl, einen Benzoxazolyl-, Benzo-1,3-dioxolanyl-, oder für einen Oxazolyl-, Triazolyl-, Morpholinyl- oder Pyrazolyl-substituierten Phenyl-Rest, einen Rest  $-\text{C}_n\text{H}_{2n}\text{C}(=\text{O})\text{R}'$  oder einen Rest  $-\text{C}_n\text{H}_{2n}\text{COOR}'$ , wobei  $-\text{C}_n\text{H}_{2n}$  eine geradkettige oder verzweigte Alkylengruppe ist, in der  $n$  eine ganze Zahl von 1 bis 6 ist und  $\text{R}'$  Wasserstoff,  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ -Alkyl,  $\text{C}_1\text{-C}_8$ -Hydroxyalkyl,  $\text{C}_1\text{-C}_8$ -Alkoxyalkyl oder  $\text{C}_1\text{-C}_8$ -Acyloxyalkyl oder einen Heterocyclus darstellt.

Besonders bevorzugt werden in der erfindungsgemäßen Umsetzung **Aldehyde der allgemeinen Formel (VII)** eingesetzt, worin

$R^4$  einen geradkettigen oder verzweigten  $C_1$ - $C_{10}$ -Alkyl-Rest, insbesondere Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec.-Butyl, tert.-Butyl, n-Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, neo-Pentyl, 1-Ethylpropyl, n-Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl, 1-Ethyl-2-methylpropyl, n-Hexyl, n-Heptyl, n-Octyl, n-Nonyl- oder n-Decyl darstellt, oder für einen  $C_5$ - $C_8$ -Cycloalkyl-Rest, insbesondere einen Cyclopentyl- oder einen Cyclohexyl-Rest, oder einen Furanyl-Rest steht.

Hierbei werden **Verbindungen der allgemeinen Formel (I)** erhalten, worin **Z** einen Rest - $C(OH)R^4R^5$  darstellt,  $R^4$  die zuvor genannten allgemeinen, bevorzugten und besonders bevorzugten Bedeutungen hat und  $R^5$  Wasserstoff ist.

**Ketone der allgemeinen Formel (VIII):**

Als weitere Elektrophile können in der erfindungsgemäßen Umsetzung auch **Ketone der allgemeinen Formel (VIII)** eingesetzt werden,



worin

$R^4$  und  $R^5$  gleich oder verschieden sind und  $C_1$ - $C_{30}$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkynyl,  $C_7$ - $C_{20}$ -Alkylaryl,  $C_6$ - $C_{10}$ -Aryl,  $C_5$ - $C_{10}$ -Heteroaryl, durch  $C_5$ - $C_{10}$ -Heteroaryl substituiertes Phenyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Cycloalkyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Cycloalkenyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Cycloalkinyl,  $C_1$ - $C_{20}$ -Hydroxyalkyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Acyloxyalkyl,  $C_1$ - $C_{20}$ -Alkoxy,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkoxyalkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkylthioalkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Aminoalkyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Acylaminoalkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Carboxyalkyl, einen Rest  $-C_nH_{2n}C(=O)R'$  oder einen Rest  $-C_nH_{2n}COOR'$  bedeuten, wobei  $-C_nH_{2n}$  eine geradkettige oder verzweigte Alkylengruppe ist, in der n eine ganze Zahl von 1 bis 10 ist und  $R'$  Wasserstoff,  $C_1$ - $C_{10}$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_8$ -Hydroxyalkyl,  $C_1$ - $C_8$ -Alkoxyalkyl oder  $C_1$ - $C_8$ -Acyloxyalkyl darstellt.

Bevorzugt werden in der erfindungsgemäßen Umsetzung **Ketone der allgemeinen Formel (VIII)** eingesetzt, worin

R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> gleich oder verschieden sind und C<sub>1</sub>-C<sub>14</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkinyl, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>-Cycloalkyl, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>-Cycloalkenyl, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>-Cycloalkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Hydroxyalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Acyloxyalkyl-, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkylthioalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Aminoalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Acylaminoalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Carboxyalkyl, einen Benzoxazolyl-, Benzo-1,3-dioxolanyl-, oder einen Oxazolyl-, Triazolyl-, Morpholinyl- oder Pyrazolyl-substituierten Phenyl-Rest, einen Rest -C<sub>n</sub>H<sub>2n</sub>C(=O)R' oder einen Rest -C<sub>n</sub>H<sub>2n</sub>COOR', wobei -C<sub>n</sub>H<sub>2n</sub> eine geradkettige oder verzweigte Alkylengruppe ist, in der n eine ganze Zahl von 1 bis 6 ist und R' Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Hydroxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxyalkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Acyloxyalkyl darstellen.

Besonders bevorzugt werden in der erfindungsgemäßen Umsetzung **Aldehyde der allgemeinen Formel (VII)** eingesetzt, worin

R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> gleich oder verschieden sind und einen geradkettigen oder verzweigten C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkyl-Rest, insbesondere Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec.-Butyl, tert.-Butyl, n-Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, neo-Pentyl, 1-Ethylpropyl, n-Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl, 1-Ethyl-2-methylpropyl, n-Hexyl, n-Heptyl, n-Octyl, n-Nonyl- oder n-Decyl darstellen oder und für einen C<sub>5</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl-Rest, insbesondere einen Cyclopentyl- oder einen Cyclohexyl-Rest stehen.

Hierbei werden Verbindungen der allgemeinen Formel (I) erhalten, worin **Z** einen Rest -C(OH)R<sup>4</sup>R<sup>5</sup> darstellt und R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> die zuvor genannten Bedeutungen haben.

#### **Nitrile der allgemeinen Formel (IX):**

Als weitere Elektrophile können in der erfindungsgemäßen Umsetzung auch **Nitrile der allgemeinen Formel (IX)** eingesetzt werden,



worin

R<sup>6</sup> alle allgemeinen, bevorzugten oder besonders bevorzugten Bedeutungen annehmen kann, die R<sup>1</sup> in der allgemeinen Formel (III) besitzt.

Hierbei werden Verbindungen der allgemeinen Formel (I) erhalten, worin **Z** einen Rest -C(=O)R<sup>6</sup> darstellt und R<sup>6</sup> die zuvor in der allgemeinen Formel (I) genannten Bedeutungen von R<sup>1</sup> hat.

**Acetale der allgemeinen Formel (X):**

Als weitere Elektrophile können in der erfindungsgemäßen Umsetzung auch Acetale der allgemeinen Formel (X) eingesetzt werden,



worin

$R^7$  und  $R^8$  gleich oder verschieden sind und  $C_1$ - $C_{30}$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkynyl,  $C_7$ - $C_{20}$ -Alkylaryl,  $C_6$ - $C_{10}$ -Aryl,  $C_5$ - $C_{10}$ -Heteroaryl, durch  $C_5$ - $C_{10}$ -Heteroaryl substituiertes Phenyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Cycloalkyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Cycloalkenyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Cycloalkynyl,  $C_1$ - $C_{20}$ -Hydroxyalkyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Acyloxyalkyl,  $C_1$ - $C_{20}$ -Alkoxy,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkoxyalkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkylthioalkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Aminoalkyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Acylaminoalkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Carboxyalkyl, einen Rest  $-C_nH_{2n}C(=O)R'$  oder einen Rest  $-C_nH_{2n}COOR'$  bedeuten, wobei  $-C_nH_{2n}$  eine geradkettige oder verzweigte Alkylengruppe ist, in der n eine ganze Zahl von 1 bis 10 ist und  $R'$  Wasserstoff,  $C_1$ - $C_{10}$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_8$ -Hydroxyalkyl,  $C_1$ - $C_8$ -Alkoxyalkyl oder  $C_1$ - $C_8$ -Acyloxyalkyl darstellt,

$R^9$  und  $R^{14}$  gleich oder verschieden sind und für  $-O-C_1$ - $C_{30}$ -Alkyl stehen.

Bevorzugt werden in der erfindungsgemäßen Umsetzung Acetale der allgemeinen Formel (X) eingesetzt, worin

$R^7$  und  $R^8$  gleich oder verschieden sind und  $C_1$ - $C_{14}$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkynyl,  $C_5$ - $C_{10}$ -Cycloalkyl,  $C_5$ - $C_{10}$ -Cycloalkenyl,  $C_5$ - $C_{10}$ -Cycloalkynyl,  $C_1$ - $C_{10}$ -Hydroxyalkyl,  $C_3$ - $C_{10}$ -Acyloxyalkyl-,  $C_1$ - $C_{10}$ -Alkoxy,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkoxyalkyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkylthioalkyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Aminoalkyl,  $C_3$ - $C_{10}$ -Acylaminoalkyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Carboxyalkyl, einen Benzoxazolyl-, Benzo-1,3-dioxolanyl-, oder einen Oxazolyl-, Triazolyl-, Morpholiny- oder Pyrazolyl-substituierten Phenyl-Rest, einen Rest  $-C_nH_{2n}C(=O)R'$  oder einen Rest  $-C_nH_{2n}COOR'$ , wobei  $-C_nH_{2n}$  eine geradkettige oder verzweigte Alkylengruppe ist, in der n eine ganze Zahl von 1 bis 6 ist und  $R'$  Wasserstoff,  $C_1$ - $C_{10}$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_8$ -Hydroxyalkyl,  $C_1$ - $C_8$ -Alkoxyalkyl oder  $C_1$ - $C_8$ -Acyloxyalkyl darstellen,

$R^9$  und  $R^{14}$  gleich oder verschieden sind und für  $-O-C_1$ - $C_{20}$ -Alkyl stehen.

Besonders bevorzugt werden in der erfindungsgemäßen Umsetzung Acetale der allgemeinen Formel (X) eingesetzt, worin

$R^7$  und  $R^8$  gleich oder verschieden sind und einen geradkettigen oder verzweigten  $C_1$ - $C_{10}$ -Alkyl-Rest, insbesondere Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec.-Butyl, tert.-Butyl, n-Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, neo-Pentyl, 1-Ethylpropyl, n-Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-

Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl, 1-Ethyl-2-methylpropyl, n-Hexyl, n-Heptyl, n-Octyl, n-Nonyl- oder n-Decyl darstellen oder und für einen C<sub>5</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl-Rest, insbesondere einen Cyclopentyl- oder einen Cyclohexyl-Rest stehen, und

R<sup>9</sup> und R<sup>14</sup> gleich oder verschieden sind und für -O-C<sub>1</sub>-C<sub>14</sub>-Alkyl stehen, insbesondere für O-Methyl, O-Ethyl, O-n-Propyl, O-iso-Propyl, O-n-Butyl, O-sec.-Butyl, O-tert.-Butyl, O-n-Pentyl, O-1-Methylbutyl, O-2-Methylbutyl, O-3-Methylbutyl, O-neo-Pentyl, O-1-Ethylpropyl, O-n-Hexyl, O-1,1-Dimethylpropyl, O-1,2-Dimethylpropyl, O-1,2-Dimethylpropyl, O-1-Methylpentyl, O-2-Methylpentyl, O-3-Methylpentyl, O-4-Methylpentyl, O-1,1-Dimethylbutyl, O-1,2-Dimethylbutyl, O-1,3-Dimethylbutyl, O-2,2-Dimethylbutyl, O-2,3-Dimethylbutyl, O-3,3-Dimethylbutyl, O-1-Ethylbutyl, O-2-Ethylbutyl, O-1,1,2-Trimethylpropyl, O-1,2,2-Trimethylpropyl, O-1-Ethyl-1-methylpropyl, O-1-Ethyl-2-methylpropyl, O-n-Hexyl, O-n-Heptyl, O-n-Octyl, O-n-Nonyl- oder O-n-Decyl.

Hierbei werden Verbindungen der allgemeinen Formel (I) erhalten, worin Z einen Rest -CR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>R<sup>9</sup> darstellt, und R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> die oben genannten allgemeinen, bevorzugten und besonders bevorzugten Bedeutungen besitzen.

#### Orthoester der allgemeinen Formel (XI):

Als weitere Elektrophile können in der erfindungsgemäßen Umsetzung auch Orthoester der allgemeinen Formel (XI) eingesetzt werden,



worin

R<sup>7</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>30</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Alkynyl, C<sub>7</sub>-C<sub>20</sub>-Alkylaryl, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-Aryl, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>-Heteroaryl, durch C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>-Heteroaryl substituiertes Phenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Cycloalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Cycloalkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>-Hydroxyalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Acyloxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>-Alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Alkylthioalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Aminoalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Acylaminoalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Carboxyalkyl, einen Rest -C<sub>n</sub>H<sub>2n</sub>C(=O)R' oder einen Rest -C<sub>n</sub>H<sub>2n</sub>COOR' bedeutet, wobei -C<sub>n</sub>H<sub>2n</sub> eine geradkettige oder verzweigte Alkylengruppe ist, in der n eine ganze Zahl von 1 bis 10 ist und R' Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Hydroxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxyalkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Acyloxyalkyl darstellt,

R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> und R<sup>14</sup> gleich oder verschieden sind und -O-C<sub>1</sub>-C<sub>30</sub>-Alkyl bedeuten.

Bevorzugt werden **Orthoester der allgemeinen Formel (XI)** eingesetzt, worin,

$R^7$   $C_1$ - $C_{14}$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkynyl,  $C_5$ - $C_{10}$ -Cycloalkyl,  $C_5$ - $C_{10}$ -Cycloalkenyl,  $C_5$ - $C_{10}$ -Cycloalkinyl,  $C_1$ - $C_{10}$ -Hydroxyalkyl,  $C_3$ - $C_{10}$ -Acyloxyalkyl-,  $C_1$ - $C_{10}$ -Alkoxy,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkoxyalkyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkylthioalkyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Aminoalkyl,  $C_3$ - $C_{10}$ -Acylaminoalkyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Carboxyalkyl, einen Benzoxazolyl-, Benzo-1,3-dioxolanyl-, oder einen Oxazolyl-, Triazolyl-, Morpholinyl- oder Pyrazolyl-substituierten Phenyl-Rest, einen Rest  $-C_nH_{2n}C(=O)R'$  oder einen Rest  $-C_nH_{2n}COOR'$ , wobei  $-C_nH_{2n}$  eine geradkettige oder verzweigte Alkylengruppe ist, in der n eine ganze Zahl von 1 bis 6 ist und  $R'$  Wasserstoff,  $C_1$ - $C_{10}$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_8$ -Hydroxyalkyl,  $C_1$ - $C_8$ -Alkoxyalkyl oder  $C_1$ - $C_8$ -Acyloxyalkyl darstellt, und

$R^8$ ,  $R^9$  und  $R^{14}$  gleich oder verschieden sind und für  $-O-C_1$ - $C_{20}$ -Alkyl stehen.

Besonders bevorzugt werden in der erfindungsgemäßen Umsetzung **Orthoester der allgemeinen Formel (XI)** eingesetzt, worin

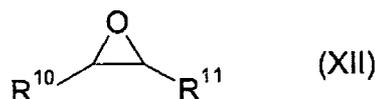
$R^7$  einen geradkettigen oder verzweigten  $C_1$ - $C_{10}$ -Alkyl-Rest, insbesondere Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec.-Butyl, tert.-Butyl, n-Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, neo-Pentyl, 1-Ethylpropyl, n-Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl, 1-Ethyl-2-methylpropyl, n-Hexyl, n-Heptyl, n-Octyl, n-Nonyl- oder n-Decyl darstellen oder und für einen  $C_5$ - $C_8$ -Cycloalkyl-Rest, insbesondere einen Cyclopentyl- oder einen Cyclohexyl-Rest stehen, und

$R^8$ ,  $R^9$  und  $R^{14}$  gleich oder verschieden sind und für  $-O-C_1$ - $C_{14}$ -Alkyl stehen, insbesondere für O-Methyl, O-Ethyl, O-n-Propyl, O-iso-Propyl, O-n-Butyl, O-sec.-Butyl, O-tert.-Butyl, O-n-Pentyl, O-1-Methylbutyl, O-2-Methylbutyl, O-3-Methylbutyl, O-neo-Pentyl, O-1-Ethylpropyl, O-n-Hexyl, O-1,1-Dimethylpropyl, O-1,2-Dimethylpropyl, O-1,2-Dimethylpropyl, O-1-Methylpentyl, O-2-Methylpentyl, O-3-Methylpentyl, O-4-Methylpentyl, O-1,1-Dimethylbutyl, O-1,2-Dimethylbutyl, O-1,3-Dimethylbutyl, O-2,2-Dimethylbutyl, O-2,3-Dimethylbutyl, O-3,3-Dimethylbutyl, O-1-Ethylbutyl, O-2-Ethylbutyl, O-1,1,2-Trimethylpropyl, O-1,2,2-Trimethylpropyl, O-1-Ethyl-1-methylpropyl, O-1-Ethyl-2-methylpropyl, O-n-Hexyl, O-n-Heptyl, O-n-Octyl, O-n-Nonyl- oder O-n-Decyl.

Hierbei werden Verbindungen der allgemeinen Formel (I) erhalten, worin Z einen Rest -CR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>R<sup>9</sup> darstellt, worin R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> die oben genannten Bedeutungen haben.

**Epoxyde der allgemeinen Formel (XII):**

Als weitere Elektrophile können in der erfindungsgemäßen Umsetzung auch Epoxyde der allgemeinen Formel (XII) eingesetzt werden,



worin

R<sup>10</sup> und R<sup>11</sup> gleich oder verschieden sind und C<sub>1</sub>-C<sub>30</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Alkyl, C<sub>7</sub>-C<sub>20</sub>-Alkylaryl, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-Aryl, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>-Heteroaryl, durch C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>-Heteroaryl substituiertes Phenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Cycloalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Cycloalkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>-Hydroxyalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Acyloxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>-Alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Alkylthioalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Aminoalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Acylaminoalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Carboxyalkyl, einen Rest -C<sub>n</sub>H<sub>2n</sub>C(=O)R' oder einen Rest -C<sub>n</sub>H<sub>2n</sub>COOR' bedeuten, wobei -C<sub>n</sub>H<sub>2n</sub> eine geradkettige oder verzweigte Alkylengruppe ist, in der n eine ganze Zahl von 1 bis 10 ist und R' Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Hydroxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxyalkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Acyloxyalkyl darstellt,

Bevorzugt werden Epoxyde der allgemeinen Formel (XII) eingesetzt, worin

R<sup>10</sup> und R<sup>11</sup> gleich oder verschieden sind und C<sub>1</sub>-C<sub>14</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkyl, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>-Cycloalkyl, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>-Cycloalkenyl, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>-Cycloalkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Hydroxyalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Acyloxyalkyl-, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkylthioalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Aminoalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Acylaminoalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Carboxyalkyl, einen Benzoxazolyl-, Benzo-1,3-dioxolanyl-, oder einen Oxazolyl-, Triazolyl-, Morpholinyl- oder Pyrazolyl-substituierten Phenyl-Rest, einen Rest -C<sub>n</sub>H<sub>2n</sub>C(=O)R' oder einen Rest -C<sub>n</sub>H<sub>2n</sub>COOR', wobei -C<sub>n</sub>H<sub>2n</sub> eine geradkettige oder verzweigte Alkylengruppe ist, in der n eine ganze Zahl von 1 bis 6 ist und R' Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Hydroxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxyalkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Acyloxyalkyl darstellen.

Besonders bevorzugt werden Epoxyde der allgemeinen Formel (XII) eingesetzt, worin

R<sup>10</sup> und R<sup>11</sup> gleich oder verschieden sind und einen geradkettigen oder verzweigten C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkyl-Rest, insbesondere Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sec.-Butyl, tert.-Butyl, n-Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, neo-Pentyl, 1-Ethylpropyl, n-Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-

Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl, 1-Ethyl-2-methylpropyl, n-Hexyl, n-Heptyl, n-Octyl, n-Nonyl- oder n-Decyl darstellen oder und für einen C<sub>5</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl-Rest, insbesondere einen Cyclopentyl- oder einen Cyclohexyl-Rest stehen.

Hierbei werden **Verbindungen der allgemeinen Formel (I)** erhalten, worin **Z** einen Rest -CHR<sup>10</sup>CHR<sup>11</sup>OH darstellt, wobei R<sup>10</sup> und R<sup>11</sup> die oben genannten allgemeinen, bevorzugten und besonders bevorzugten Bedeutungen haben.

**Sulfonylchloride der allgemeinen Formel (XIII):**

Als weitere Elektrophile können in der erfindungsgemäßen Umsetzung auch **Sulfonylchloride der allgemeinen Formel (XIII)** eingesetzt werden,



worin

R<sup>12</sup> einen gegebenenfalls substituierten C<sub>6</sub>-C<sub>18</sub>-Arylrest bedeutet.

Bevorzugt werden in der erfindungsgemäßen Umsetzung **Sulfonylchloride der allgemeinen Formel (XIII)** eingesetzt, worin R<sup>12</sup> für Phenyl, Naphthyl, Phenanthryl steht.

Hierbei werden **Verbindungen der allgemeinen Formel (I)** erhalten, worin **Z** einen Rest -SO<sub>2</sub>R<sup>12</sup> bedeutet, worin R<sup>12</sup> die zuvor genannten Bedeutungen besitzt.

Üblicherweise wird das erfindungsgemäße Verfahren so durchgeführt, dass unter Inertgas Magnesium vorgelegt wird und mit einem Lösungsmittel versetzt wird. Anschließend wird gegebenenfalls elementares Iod oder ein Alkylhalogenid wie beispielsweise Ethylbromid, 1,2-Dichlorethan oder 1,2-Dibromethan, bevorzugt Ethylbromid, zugegeben. Die Zugabe von elementarem Iod oder einem Alkylhalogenid hat sich vor allem beim Einsatz von Magnesium bewährt. Die Temperatur wird dabei in einem Bereich von 20°C bis 80°C gehalten und je nach verwendetem Lösungsmittel angepasst. Anschließend wird die Verbindung der allgemeinen Formel (II) zugegeben. Es hat sich bewährt, diese Verbindung der allgemeinen Formel (II) in dem gleichen Lösungsmittel wie dem vorgelegten zu lösen. Üblicherweise beträgt das molare Verhältnis von Magnesium zur Verbindung der allgemeinen Formel (II) (0,9 - 1,6) : 1, bevorzugt (1,0 - 1,4) : 1. Die Zugabe erfolgt in einer Weise, dass sich die Temperatur des Reaktionsgemisches in einem Bereich von 20°C bis 80°C bewegt. Auch hier kann eine Anpassung an das verwendete Lösungsmittel erfolgen. Anschließend wird

üblicherweise noch für einen gewissen Zeitraum nachgerührt, das Reaktionsgemisch auf eine Temperatur von 20°C bis 50°C abgekühlt und abfiltriert bzw. abdekantiert.

Anschließend erfolgt üblicherweise die Zugabe des Additivs und im Anschluss die Umsetzung mit dem Elektrophil in Form des Isocyanats der allgemeinen Formel (III), des Heterocyclus der allgemeinen Formel (IV), des Carbamoylchlorids der allgemeinen Formel (V), des Aminoethers der allgemeinen Formel (VI), des Aldehyds der allgemeinen Formel (VII), des Ketons der allgemeinen Formel (VIII), des Nitrils der allgemeinen Formel (IX), des Acetals der allgemeinen Formel (X), des Orthoesters der allgemeinen Formel (XI), des Epoxids der allgemeinen Formel (XII) oder des Sulfonylchlorids der allgemeinen Formel (XIII). Diese Verbindungen können entweder als solche, d.h. in Substanz oder aber in einem organischen Lösungsmittel verdünnt eingesetzt werden.

Eine Variante der Durchführung besteht darin, das Elektrophil zu dem Reaktionsgemisch zuzugeben, welches bei der Umsetzung der Verbindung der allgemeinen Formel (II) mit Magnesium erhalten wird. Möglich ist es aber auch, die Zugabereihenfolge umzukehren, d.h. es wird das Reaktionsgemisch aus der Umsetzung der Verbindung der allgemeinen Formel (II) mit Magnesium zu den jeweiligen Elektrophilen der Formeln (III) bis (XIII) zugegeben.

Üblicherweise beträgt das molare Verhältnis der Verbindung der allgemeinen Formeln (III) bis (XIII) zur Verbindung der allgemeinen Formel (II) (0,95 - 1,4) : 1, bevorzugt (1,0-1,2) : 1. Möglich ist es auch, vor Zugabe dieser Reagenzien das für die Umsetzung mit Magnesium eingesetzte Lösungsmittel teilweise abzudestillieren. In diesem Fall wird anschließend das zuzugebende Reagenz vorteilhafterweise gelöst in einem organischen Lösungsmittel, beispielsweise Toluol oder Xylol, eingesetzt. Nach erfolgter Umsetzung kann das noch anwesende, ursprünglich für die Umsetzung mit Magnesium eingesetzte und niedriger siedende Lösungsmittel weiter abdestilliert und gegebenenfalls zurückgeführt werden.

Nach erfolgter Umsetzung wird das Reaktionsgemisch mit wässriger Säure versetzt und das Gemisch beispielsweise durch Phasentrennung oder Extraktion mit einem organischen Lösungsmittel aufgearbeitet. Die gewünschte Verbindung der allgemeinen Formel (I) wird über die organischen Phasen entfernt, getrocknet und isoliert.

Die vorgenannten Schritte der Reaktion sowie zur Aufarbeitung können nicht nur diskontinuierlich, sondern auch kontinuierlich durchgeführt werden.

Wird kontinuierlich gearbeitet, so überführt man Vorteilhafterweise die nach der Umsetzung der Verbindung der allgemeinen Formel (II) mit Magnesium erhaltene Lösung über eine Überlaufvorrichtung in den nächsten Reaktionsbehälter und trennt damit den Magnesium-Überschuss ab.

**Beispiele:****Beispiel 1: (Vergleich: Kein Zusatz eines Additivs)**

Unter Stickstoff vorgelegte Magnesiumspäne (0,87 g) wurden in einem ausgeheizten Kolben vorgelegt und mit 7,6 ml THF versetzt. Bei 50°C wurden zum Starten der Reaktion ca. 92 mg Ethylbromid zugegeben. Danach wurde eine Lösung aus 5 g Menthylchlorid in 10,2 ml THF bei 55°C in 3,5 h zu der Mischung gegeben. Anschließend wurde noch 1,3 Stunden bei 70°C weiter gerührt. Nach Abkühlen der Mischung auf 22°C wurde diese filtriert und in einen weiteren Kolben überführt. Zu der filtrierten Reaktionslösung wurden 3,05 g Butylisocyanat gegeben und noch eine Stunde weitergerührt. Unter Kühlung und Rühren wurde diese Mischung auf 127 g 2%ige Salzsäure gegeben. Die Mischung wurde mit dreimal mit je 20 ml Dichlormethan extrahiert. Die vereinten organischen Phasen wurden über Magnesiumsulfat getrocknet und eingengt.

Erhalten wurden 5,70 g schwachgelbes Öl, welches laut gaschromatographischer Analyse 53% Produkt enthält. Dies entspricht einer Ausbeute von 45% der Theorie.

**Beispiel 2: (Vergleich: Kein Zusatz eines Additivs)**

Unter Stickstoff vorgelegte Magnesiumspäne (0,87 g) wurden in einem ausgeheizten Kolben vorgelegt und mit 7,6 ml THF versetzt. Bei 50°C wurden zum Starten der Reaktion ca. 92 mg Ethylbromid zugegeben. Dann wurde eine Lösung aus 5 g Menthylchlorid in 10,2 ml THF bei 55°C in 3,5 h zu der Mischung gegeben. Anschließend wurde noch 1,3 Stunden bei 70°C weiter gerührt. Nach Abkühlen der Mischung auf 22°C wurde diese filtriert und in einen weiteren Kolben überführt. Zu der filtrierten Reaktionslösung wurden 2,23 g Ethylisocyanat gegeben und noch eine Stunde weiter gerührt. Unter Kühlung und Rühren wurde diese Mischung auf 127 g 2%ige Salzsäure gegeben. Die Mischung wurde mit dreimal mit je 20 ml Dichlormethan extrahiert. Die vereinten organischen Phasen wurden über Magnesiumsulfat getrocknet und eingengt.

Erhalten wurden 5,30 g schwachgelbes Öl, welches laut gaschromatographischer Analyse 43% Produkt enthält. Dies entspricht einer Ausbeute von 39% der Theorie.

**Beispiel 3:****Herstellung einer Menthylmagnesiumchlorid-Lösung**

Unter Stickstoff vorgelegtes Magnesium (8,0 g) wurden in einem ausgeheizten Kolben vorgelegt und mit 31,3 ml THF versetzt. Bei 60°C wurden zum Starten der Reaktion 1,5 ml Dibrommethan zugegeben. Dann wurde eine Lösung aus 47,5 g Menthylchlorid in 49 ml THF bei 55-65°C in 3 h zu der Mischung zugegeben. Anschließend wurde noch 3 Stunden unter

Rückfluss, sowie 15 Stunden bei 50°C gerührt. Nach Abkühlen auf 22°C wurden 123,7 g Menthylmagnesium-Lösung erhalten.

**Beispiel 4: (Vergleich; Kein Zusatz eines Additivs)**

**Umsetzung der Menthylmagnesiumchlorid-Lösung mit Ethylisocyanat**

In einem ausgeheizten Kolben wurden unter Stickstoff 6,16 g Ethylisocyanat in 5 ml THF vorgelegt und bei 25-30°C in 15 min mit 37,0 g der in Beispiel 3 hergestellten Lösung von Menthylmagnesiumchlorid versetzt. Diese Lösung wurde 17 Stunden bei 23°C und anschließend 20 Stunden bei 50°C gerührt. Nach Abkühlen auf 23°C wurde die Lösung auf 350 g einer auf 10°C gekühlten 2%igen Salzsäurelösung getropft. Diese Mischung wurde noch 16 Stunden bei 23°C gerührt, bevor sie zweimal mit je 50 ml Dichlormethan extrahiert wurde. Die vereinigten Dichlormethan-Phasen wurden mit 5 g Natriumsulfat getrocknet und dann eingengt.

Es wurden 14,2 g gelbes Öl erhalten, das während der Lagerung kristallisiert. Laut gaschromatographischer Analyse enthält die Mischung 61% des gewünschten N-Ethyl-p-menthyl-3-carboxamid. Dies entspricht einer Ausbeute von 53% der Theorie. Es konnte nur ein Epimer beobachtet werden.

**Beispiel 5: (erfindungsgemäß; Zusatz von Lithiumchlorid)**

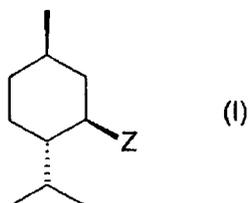
**Umsetzung der Menthylmagnesiumchlorid-Lösung mit Ethylisocyanat**

In einem ausgeheizten Kolben wurden unter Stickstoff 0,72 g Lithiumchlorid zusammen mit 7,17 g Ethylisocyanat in 5 ml THF vorgelegt und bei 25-30°C in 15 min mit 43,1 g der in Beispiel 3 hergestellten Lösung von Menthylmagnesiumchlorid versetzt. Diese Lösung wurde 17 Stunden bei 23°C und anschließend 20 Stunden bei 50°C gerührt. Nach Abkühlen auf 23°C wurde die Lösung auf 410 g einer auf 10°C gekühlten 2%igen Salzsäurelösung getropft. Diese Mischung wurde noch 16 Stunden bei 23°C gerührt, bevor sie zweimal mit je 50 ml Dichlormethan extrahiert wurde. Die vereinigten Dichlormethan-Phasen wurden mit 5 g Natriumsulfat getrocknet und dann eingengt.

Es wurden 17,85 g gelbes Öl erhalten, das während der Lagerung kristallisiert. Laut gaschromatographischer Analyse enthält die Mischung 71% des gewünschten N-Ethyl-p-menthyl-3-carboxamid. Dies entspricht einer Ausbeute von 67% der Theorie. Es konnte nur ein Epimer beobachtet werden.

**Patentansprüche:**

1. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I)



wobei

Z C(=O)NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup> oder CH<sub>2</sub>NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup> bedeutet, worin

- R<sup>1</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>30</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Alkynyl, C<sub>7</sub>-C<sub>20</sub>-Alkylaryl, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-Aryl, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>-Heteroaryl oder durch C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>-Heteroaryl substituiertes Phenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Cycloalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Cycloalkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>-Hydroxyalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Acyloxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>-Alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Alkylthioalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Aminoalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Acylaminoalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Carboxyalkyl, einen Rest -C<sub>n</sub>H<sub>2n</sub>C(=O)R' oder einen Rest -C<sub>n</sub>H<sub>2n</sub>COOR' bedeutet, wobei -C<sub>n</sub>H<sub>2n</sub> eine geradkettige oder verzweigte Alkylengruppe ist, in der n eine ganze Zahl von 1 bis 10 ist und R' Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Hydroxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxyalkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Acyloxyalkyl darstellt,
- R<sup>2</sup> die gleichen Bedeutungen wie R<sup>1</sup> besitzt, ferner Wasserstoff oder einen Rest -X-OH bedeuten kann, wobei X eine geradkettige oder verzweigte C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>-Alkylengruppe darstellt, die gegebenenfalls durch ein oder mehrere Heteroatome, bevorzugt Sauerstoff oder Schwefel, unterbrochen ist, oder
- R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen eine gegebenenfalls durch ein oder mehrere Heteroatome, bevorzugt Sauerstoff oder Schwefel, unterbrochene Alkylenkette bilden, die mit dem Stickstoffatom zusammengenommen, an das R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gebunden sind, einen maximal 10-gliedrigen Ring bildet,

oder

Z C(OH)R<sup>4</sup>R<sup>5</sup> bedeutet, worin

- R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> gleich oder verschieden sind und die zuvor für R<sup>1</sup> angegebenen Bedeutungen besitzen und
- R<sup>5</sup> alternativ auch für Wasserstoff stehen kann,

oder

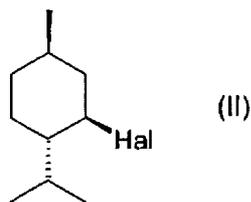
Z C(=O)R<sup>6</sup> bedeutet, worin

- R<sup>6</sup> die für R<sup>1</sup> angegebenen Bedeutungen besitzt,

oder

- Z  $CR^7R^8R^9$  bedeutet, worin  
 $R^7$  die für  $R^1$  angegebenen Bedeutungen besitzt und  
 $R^8$  und  $R^9$  gleich oder verschieden sind und für O-C<sub>1</sub>-C<sub>30</sub>-Alkyl stehen,  
 oder worin alternativ  
 $R^7$  und  $R^8$  gleich oder verschieden sind und die für  $R^1$  angegebenen Bedeutungen  
 besitzen und  
 $R^9$  für O-C<sub>1</sub>-C<sub>30</sub>-Alkyl steht,
- oder
- Z  $CHR^{10}CHR^{11}OH$  bedeutet, worin  
 $R^{10}$  und  $R^{11}$  gleich oder verschieden sind und die zuvor für  $R^1$  angegebenen  
 Bedeutungen besitzen,
- oder
- Z  $SO_2R^{12}$  darstellt, worin  
 $R^{12}$  für einen gegebenenfalls substituierten C<sub>6</sub>-C<sub>18</sub>-Arylrest steht.

indem man zunächst eine Verbindung der allgemeinen Formel (II)



worin

Hal für Chlor, Brom oder Iod steht,

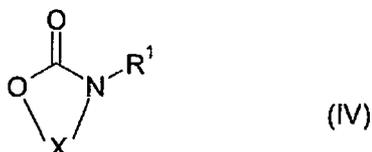
mit Magnesium und gegebenenfalls elementarem Jod oder einem Alkylhalogenid umgesetzt,  
 und anschließend in Gegenwart eines Additivs mit einem Elektrophil umgesetzt, welches  
 ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus

- Isocyanaten der allgemeinen Formel (III),



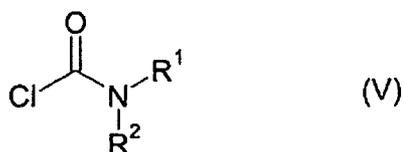
wobei  $R^1$  die für die allgemeine Formel (I) genannten Bedeutungen besitzt,

- Heterocyclen der allgemeinen Formel (IV),



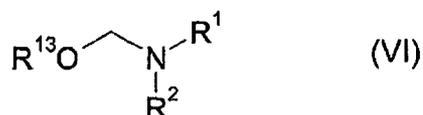
wobei  $R^1$  und X die für die allgemeine Formel (I) genannten Bedeutungen besitzt,

- Carbamoylchloriden der allgemeinen Formel (V),



worin  $\text{R}^1$  und  $\text{R}^2$  die für die allgemeine Formel (I) genannten Bedeutungen besitzen,

- Aminoethern der allgemeinen Formel (VI),



worin  $\text{R}^1$  und  $\text{R}^2$  die für die allgemeine Formel (I) genannten Bedeutungen besitzen und  $\text{R}^{13}$  für einen  $\text{C}_1$ - $\text{C}_{20}$ -Alkylrest steht,

- Aldehyden der allgemeinen Formel (VII),



worin  $\text{R}^4$  die zuvor für die allgemeine Formel (I) genannten Bedeutungen besitzt,

- Ketonen der allgemeinen Formel (VIII),



worin  $\text{R}^4$  und  $\text{R}^5$  gleich oder verschieden sind und die zuvor für  $\text{R}^1$  angegebenen Bedeutungen besitzen,

- Nitrilen der allgemeinen Formel (IX),



worin  $\text{R}^6$  die zuvor für die allgemeine Formel (I) genannten Bedeutungen besitzt,

- Acetalen der allgemeinen Formel (X),



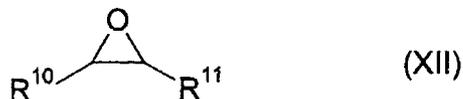
worin  $\text{R}^7$  und  $\text{R}^8$  gleich oder verschieden sind und die für  $\text{R}^1$  in der allgemeinen Formel (I) angegebenen Bedeutungen besitzen und  $\text{R}^9$  und  $\text{R}^{14}$  gleich oder verschieden sind und für O- $\text{C}_1$ - $\text{C}_{30}$ -Alkyl stehen,

- Orthoestern der allgemeinen Formel (XI),



worin  $\text{R}^7$  die für  $\text{R}^1$  in der allgemeinen Formel (I) genannten Bedeutungen besitzt, und  $\text{R}^8$ ,  $\text{R}^9$  und  $\text{R}^{14}$  gleich oder verschieden sind und für O- $\text{C}_1$ - $\text{C}_{30}$ -Alkyl stehen,

- Epoxiden der allgemeinen Formel (XII),



worin R<sup>10</sup> und R<sup>11</sup> die für die allgemeine Formel (I) genannten Bedeutungen besitzen, und

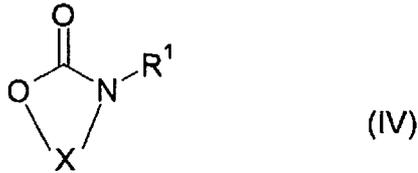
- Sulfonylchloriden der allgemeinen Formel (XIII)



worin R<sup>12</sup> die für Formel (II) genannten Bedeutungen hat.

- Verfahren nach Anspruch 1, wobei das Additiv ausgewählt ist aus der Gruppe bestehend aus LiCl, LiBr, ZnCl<sub>2</sub>, ZnBr<sub>2</sub>, SnCl<sub>2</sub>, SnCl<sub>4</sub>, MgCl<sub>2</sub>, MgBr<sub>2</sub>, AlCl<sub>3</sub>, TiCl<sub>4</sub>, Al(OiPr)<sub>3</sub>, Ti(OiPr)<sub>4</sub>, CeCl<sub>3</sub>, ZnEt, CuBr, LiClO<sub>4</sub>, BCl<sub>3</sub>, BF<sub>3</sub> und deren Etherat, Borsäure, unsubstituierten und substituierten Phenylboronsäuren.
- Verfahren nach Anspruch 1 oder 2, wobei das Additiv vor, während oder nach Zugabe des Elektrophils der allgemeinen Formeln (III) bis (XIII) zugegeben wird, bevorzugt vor der Zugabe des Elektrophils.
- Verfahren nach einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 3, wobei das Additiv in einer Menge von 1-100 Mol%, bevorzugt 10-50 Mol%, bezogen auf die sich durch die Umsetzung der Verbindung der allgemeinen Formel (I) mit Magnesium bildende Grignardverbindung eingesetzt wird.
- Verfahren nach einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 4 unter Einsatz eines Isocyanats der allgemeinen Formel (III), worin  
R<sup>1</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>30</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Alkynyl, C<sub>7</sub>-C<sub>20</sub>-Alkylaryl, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-Aryl, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>-Heteroaryl oder durch C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>-Heteroaryl- substituiertes Phenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Cycloalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Cycloalkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>-Hydroxyalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Acyloxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>-Alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Alkylthioalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Aminoalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Acylaminoalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Carboxyalkyl, einen Rest -C<sub>n</sub>H<sub>2n</sub>C(=O)R' oder einen Rest -C<sub>n</sub>H<sub>2n</sub>COOR' bedeutet, wobei -C<sub>n</sub>H<sub>2n</sub> eine geradkettige oder verzweigte Alkylengruppe ist, in der n eine ganze Zahl von 1 bis 10 ist und R' Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Hydroxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxyalkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Acyloxyalkyl darstellt,  
wobei Verbindungen der allgemeinen Formel (I) erhalten werden, in der Z für einen Rest -C(=O)NR<sup>1</sup>H steht und R<sup>1</sup> die zuvor genannten Bedeutungen besitzt.

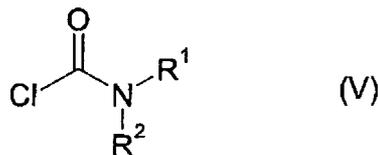
6. Verfahren nach einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 4 unter Einsatz eines Heterocyclus der allgemeinen Formel (IV)



worin

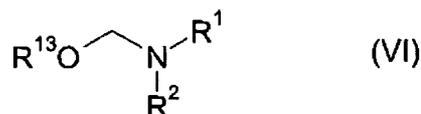
$R^1$  die Bedeutungen besitzt, die  $R^1$  in der allgemeinen Formel (III) nach Anspruch 5 besitzt, und X eine geradkettige oder verzweigte  $C_1$ - $C_{20}$ -Alkylengruppe, bevorzugt eine geradkettige oder verzweigte  $C_1$ - $C_8$ -Alkylengruppe, besonders bevorzugt eine Methylen-, Ethylen-, n-Propylen-, n-Butylen- oder n-Pentylengruppe darstellt, wobei diese allgemeinen, bevorzugten oder besonders bevorzugten Alkylengruppen gegebenenfalls durch ein oder mehrere Heteroatome, bevorzugt Sauerstoff oder Schwefel, unterbrochen sind, wobei eine Verbindung der allgemeinen Formel (I) erhalten wird, in der Z einen Rest  $-C(=O)NR^1R^2$  darstellt, worin  $R^1$  die zuvor genannten für die allgemeine Formel (IV) genannten Bedeutungen besitzt,  $R^2$  für einen Rest X-OH steht und X die zuvor für die allgemeine Formel (IV) genannten Bedeutungen besitzt.

7. Verfahren nach einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 4 unter Einsatz eines Carbamoylchlorids der allgemeinen Formel (V)



worin  $R^1$  und  $R^2$  gleich oder verschieden sind und alle zuvor für die allgemeine Formel (III) genannten Bedeutungen besitzen, wobei Verbindungen der allgemeinen Formel (I) erhalten werden, in der Z für einen Rest  $-C(=O)NR^1R^2$  steht, worin  $R^1$  und  $R^2$  gleich oder verschieden sind und alle zuvor für die allgemeine Formel (III) genannten Bedeutungen besitzen.

8. Verfahren nach einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 4 unter Einsatz eines Aminoethers der allgemeinen Formel (VI)



worin

$R^1$   $C_1$ - $C_{30}$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkynyl,  $C_7$ - $C_{20}$ -Alkylaryl,  $C_6$ - $C_{10}$ -Aryl,  $C_5$ - $C_{10}$ -Heteroaryl oder durch  $C_5$ - $C_{10}$ -Heteroaryl-substituiertes Phenyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Cycloalkyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Cycloalkenyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Cycloalkynyl,  $C_1$ - $C_{20}$ -Hydroxyalkyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Acyloxyalkyl,  $C_1$ - $C_{20}$ -Alkoxy,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkoxyalkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkylthioalkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Aminoalkyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Acylaminoalkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Carboxyalkyl, einen Rest  $-C_nH_{2n}C(=O)R'$  oder einen Rest  $-C_nH_{2n}COOR'$  bedeutet, wobei  $-C_nH_{2n}$  eine geradkettige oder verzweigte Alkylengruppe ist, in der n eine ganze Zahl von 1 bis 10 ist und  $R'$  Wasserstoff,  $C_1$ - $C_{10}$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_8$ -Hydroxyalkyl,  $C_1$ - $C_8$ -Alkoxyalkyl oder  $C_1$ - $C_8$ -Acyloxyalkyl darstellt,

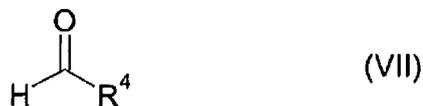
$R^2$  die gleichen Bedeutungen wie  $R^1$  besitzt, ferner Wasserstoff oder einen Rest  $-X-OH$  bedeuten kann, wobei X eine geradkettige oder verzweigte  $C_1$ - $C_{20}$ -Alkylengruppe darstellt, die gegebenenfalls durch ein oder mehrere Heteroatome unterbrochen ist, oder worin

$R^1$  und  $R^2$  zusammen eine gegebenenfalls durch ein oder mehrere Heteroatome unterbrochene Alkylenkette bilden, die mit dem Stickstoffatom zusammengenommen, an das  $R^1$  und  $R^2$  gebunden sind, einen maximal 10-gliedrigen Ring bildet, und

$R^{13}$  für einen  $C_1$ - $C_{20}$ -Alkylrest steht,

wobei Verbindungen der allgemeinen Formel (I) erhalten werden, in denen Z einen Rest  $-CH_2NR^1R^2$  darstellt und  $R^1$  und  $R^2$  die zuvor genannten Bedeutungen haben.

9. Verfahren nach einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 4 unter Einsatz eines Aldehyds der allgemeinen Formel (VII)



worin

$R^4$   $C_1$ - $C_{30}$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkynyl,  $C_7$ - $C_{20}$ -Alkylaryl,  $C_6$ - $C_{10}$ -Aryl,  $C_5$ - $C_{10}$ -Heteroaryl oder durch  $C_5$ - $C_{10}$ -Heteroaryl-substituiertes Phenyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Cycloalkyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Cycloalkenyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Cycloalkynyl,  $C_1$ - $C_{20}$ -Hydroxyalkyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Acyloxyalkyl,  $C_1$ - $C_{20}$ -Alkoxy,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkoxyalkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkylthioalkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Aminoalkyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Acylaminoalkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Carboxyalkyl, einen Rest  $-C_nH_{2n}C(=O)R'$  oder einen Rest  $-C_nH_{2n}COOR'$  bedeutet, wobei  $-C_nH_{2n}$  eine geradkettige oder verzweigte Alkylengruppe ist, in der n eine ganze Zahl von 1 bis 10 ist und  $R'$  Wasserstoff,  $C_1$ - $C_{10}$ -Alkyl,

C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Hydroxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxyalkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Acyloxyalkyl oder einen Heterocyclus darstellt.

wobei Verbindungen der allgemeinen Formel (I) erhalten werden, in denen worin Z einen Rest -C(OH)R<sup>4</sup>R<sup>5</sup> darstellt, R<sup>4</sup> die zuvor genannten allgemeinen, bevorzugten und besonders bevorzugten Bedeutungen hat und R<sup>5</sup> Wasserstoff ist.

10. Verfahren nach einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 4 unter Einsatz eines Ketons der allgemeinen Formel (VIII)



worin

R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> gleich oder verschieden sind und C<sub>1</sub>-C<sub>30</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Alkynyl, C<sub>7</sub>-C<sub>20</sub>-Alkylaryl, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-Aryl, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>-Heteroaryl oder durch C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>-Heteroaryl-substituiertes Phenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Cycloalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Cycloalkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>-Hydroxyalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Acyloxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>-Alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Alkylthioalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Aminoalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Acylaminoalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-Carboxyalkyl, einen Rest -C<sub>n</sub>H<sub>2n</sub>C(=O)R' oder einen Rest -C<sub>n</sub>H<sub>2n</sub>COOR' bedeuten, wobei -C<sub>n</sub>H<sub>2n</sub> eine geradkettige oder verzweigte Alkylengruppe ist, in der n eine ganze Zahl von 1 bis 10 ist und R' Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Hydroxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxyalkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Acyloxyalkyl darstellt.

wobei Verbindungen der allgemeinen Formel (I) erhalten werden, in denen Z einen Rest -C(OH)R<sup>4</sup>R<sup>5</sup> darstellt und R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> die zuvor genannten Bedeutungen haben.

11. Verfahren nach einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 4 unter Einsatz eines Nitrils der allgemeinen Formel (IX)



worin R<sup>6</sup> die Bedeutungen besitzt, die R<sup>1</sup> in der allgemeinen Formel (III) besitzt, wobei Verbindungen der allgemeinen Formel (I) erhalten werden, in denen Z einen Rest -COR<sup>6</sup> darstellt und R<sup>6</sup> die Bedeutungen besitzt, die R<sup>1</sup> in der allgemeinen Formel (III) hat.

12. Verfahren nach einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 4 unter Einsatz eines Acetals der allgemeinen Formel (X)



worin

$R^7$  und  $R^8$  gleich oder verschieden sind und  $C_1$ - $C_{30}$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkynyl,  $C_7$ - $C_{20}$ -Alkylaryl,  $C_6$ - $C_{10}$ -Aryl,  $C_5$ - $C_{10}$ -Heteroaryl oder durch  $C_5$ - $C_{10}$ -Heteroaryl substituiertes Phenyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Cycloalkyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Cycloalkenyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Cycloalkinyl,  $C_1$ - $C_{20}$ -Hydroxyalkyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Acyloxyalkyl,  $C_1$ - $C_{20}$ -Alkoxy,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkoxyalkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkylthioalkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Aminoalkyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Acylaminoalkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Carboxyalkyl, einen Rest  $-C_nH_{2n}C(=O)R'$  oder einen Rest  $-C_nH_{2n}COOR'$  bedeuten, wobei  $-C_nH_{2n}$  eine geradkettige oder verzweigte Alkylengruppe ist, in der  $n$  eine ganze Zahl von 1 bis 10 ist und  $R'$  Wasserstoff,  $C_1$ - $C_{10}$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_8$ -Hydroxyalkyl,  $C_1$ - $C_8$ -Alkoxyalkyl oder  $C_1$ - $C_8$ -Acyloxyalkyl darstellen, und

$R^9$  und  $R^{14}$  gleich oder verschieden sind und für  $-O-C_1$ - $C_{30}$ -Alkyl stehen,

wobei Verbindungen der allgemeinen Formel (I) erhalten werden, in der  $Z$  einen Rest  $-CR^7R^8R^9$  darstellt, und  $R^7$ ,  $R^8$  und  $R^9$  die oben genannten Bedeutungen besitzen.

13. Verfahren nach einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 4 unter Einsatz eines Orthoesters der allgemeinen Formel (XI)



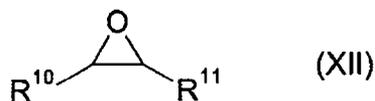
worin

$R^7$   $C_1$ - $C_{30}$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkynyl,  $C_7$ - $C_{20}$ -Alkylaryl,  $C_6$ - $C_{10}$ -Aryl,  $C_5$ - $C_{10}$ -Heteroaryl oder durch  $C_5$ - $C_{10}$ -Heteroaryl- substituiertes Phenyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Cycloalkyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Cycloalkenyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Cycloalkinyl,  $C_1$ - $C_{20}$ -Hydroxyalkyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Acyloxyalkyl,  $C_1$ - $C_{20}$ -Alkoxy,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkoxyalkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkylthioalkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Aminoalkyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Acylaminoalkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Carboxyalkyl, einen Rest  $-C_nH_{2n}C(=O)R'$  oder einen Rest  $-C_nH_{2n}COOR'$  bedeutet, wobei  $-C_nH_{2n}$  eine geradkettige oder verzweigte Alkylengruppe ist, in der  $n$  eine ganze Zahl von 1 bis 10 ist und  $R'$  Wasserstoff,  $C_1$ - $C_{10}$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_8$ -Hydroxyalkyl,  $C_1$ - $C_8$ -Alkoxyalkyl oder  $C_1$ - $C_8$ -Acyloxyalkyl darstellt, und

$R^8$ ,  $R^9$  und  $R^{14}$  gleich oder verschieden sind und  $-O-C_1$ - $C_{30}$ -Alkyl bedeuten,

wobei Verbindungen der allgemeinen Formel (I) erhalten werden, in der  $Z$  einen Rest  $-CR^7R^8R^9$  darstellt, wobei  $R^7$ ,  $R^8$  und  $R^9$  die oben genannten Bedeutungen haben.

14. Verfahren nach einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 4 unter Einsatz eines Epoxids der allgemeinen Formel (XII)



worin

$R^{10}$  und  $R^{11}$  gleich oder verschieden sind und  $C_1$ - $C_{30}$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkynyl,  $C_7$ - $C_{20}$ -Alkylaryl,  $C_6$ - $C_{10}$ -Aryl,  $C_5$ - $C_{10}$ -Heteroaryl oder durch  $C_5$ - $C_{10}$ -Heteroaryl-substituiertes Phenyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Cycloalkyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Cycloalkenyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Cycloalkinyl,  $C_1$ - $C_{20}$ -Hydroxyalkyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Acyloxyalkyl,  $C_1$ - $C_{20}$ -Alkoxy,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkoxyalkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Alkylthioalkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Aminoalkyl,  $C_3$ - $C_{20}$ -Acylaminoalkyl,  $C_2$ - $C_{20}$ -Carboxyalkyl, einen Rest  $-C_nH_{2n}C(=O)R'$  oder einen Rest  $-C_nH_{2n}COOR'$  bedeuten, wobei  $-C_nH_{2n}$  eine geradkettige oder verzweigte Alkylengruppe ist, in der  $n$  eine ganze Zahl von 1 bis 10 ist und  $R'$  Wasserstoff,  $C_1$ - $C_{10}$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_8$ -Hydroxyalkyl,  $C_1$ - $C_8$ -Alkoxyalkyl oder  $C_1$ - $C_8$ -Acyloxyalkyl darstellen.

wobei werden Verbindungen der allgemeinen Formel (I) erhalten werden, in der Z einen Rest  $-CHR^{10}CHR^{11}OH$  darstellt, wobei  $R^{10}$  und  $R^{11}$  die oben genannten Bedeutungen besitzen.

15. Verfahren nach einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 4 unter Einsatz eines Sulfonylchlorids der allgemeinen Formel (XIII)



worin

$R^{12}$  einen gegebenenfalls substituierten  $C_6$ - $C_{18}$ -Arylrest bedeutet, bevorzugt Phenyl, Naphthyl oder Phenanthryl,

wobei Verbindungen der allgemeinen Formel (I) erhalten werden, in der Z einen Rest  $-SO_2R^{12}$  bedeutet, worin  $R^{12}$  die zuvor genannten Bedeutungen besitzt.

16. Verfahren nach einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 15, wobei das molare Verhältnis der Verbindung der allgemeinen Formeln (III) bis (XIII) zur Verbindung der allgemeinen Formel (II) (0,95 - 1,4) : 1, bevorzugt (1,0-1,2) : 1 beträgt.
17. Verfahren nach einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 16, wobei das Verfahren entweder diskontinuierlich oder auch kontinuierlich durchgeführt wird.

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International application No  
PCT/EP2007/063473

**A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER**  
INV. C07C231/10 C07C233/58

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

**B. FIELDS SEARCHED**

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)  
C07C

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, BEILSTEIN Data

**C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT**

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	US 4 366 317 A (HAUT STEPHEN A ET AL) 28 December 1982 (1982-12-28) the whole document	1, 3-17
X	US 4 350 832 A (VAN AUKEN THOMAS V) 21 September 1982 (1982-09-21) the whole document	1, 3-17
Y	WO 2004/020390 A (GRUENENTHAL GMBH [DE]; FINKAM MICHAEL [DE]; AKTERIES BERNHARD [DE]) 11 March 2004 (2004-03-11) the whole document	1-17
	-/--	

Further documents are listed in the continuation of Box C.

See patent family annex.

\* Special categories of cited documents :

- \*A\* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- \*E\* earlier document but published on or after the international filing date
- \*L\* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- \*O\* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- \*P\* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- \*T\* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- \*X\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- \*Y\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- \*&\* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

15 April 2008

Date of mailing of the international search report

10/06/2008

Name and mailing address of the ISA/  
European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer  
  
Breimaier, Waltraud

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2007/063473

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	<p>ARKADY KRASOVSKIY ET AL: "Eine LiCl-vermittelte Br/Mg-Austauschreaktion zur Herstellung funktionalisierter Aryl- und Hetroarylmagnesium-Verbindungen ausgehend von organischen Bromiden"            ANGEW. CHEM.,            vol. 116, no. 25, 2004, pages 3396-3399,            XP002476337            the whole document</p>	1-17
P,X	<p>WO 2007/096074 A (SALTIGO GMBH [DE]; JOB ANDREAS [DE]; WESTEPPE UWE [DE]; RODEFELD LARS) 30 August 2007 (2007-08-30)            the whole document</p>	1,3-7, 16,17
A	<p>JENS BECKMANN ET AL: "New Insights into the Classic Chiral Grignard Reagent (1R,2S,5R)-Menthylmagnesium Chloride"            ANGEW. CHEM. INT. ED,            vol. 45, no. 39, 2006, pages 6509-6512,            XP002476338            cited in the application            the whole document</p>	1-17

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No <b>PCT/EP2007/063473</b>
--

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US 4366317	A	28-12-1982 NONE	
US 4350832	A	21-09-1982 NONE	
WO 2004020390	A	11-03-2004 AT 341534 T AU 2003260379 A1 CN 1675167 A DE 10236510 A1 EP 1527043 A1 ES 2273073 T3 HK 1076096 A1 US 2005215821 A1	15-10-2006 19-03-2004 28-09-2005 19-02-2004 04-05-2005 01-05-2007 16-03-2007 29-09-2005
WO 2007096074	A	30-08-2007 DE 102006007883 A1	30-08-2007

<b>A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES</b> INV. C07C231/10 C07C233/58		
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC		
<b>B. RECHERCHIERTE GEBIETE</b>		
Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) C07C		
Recherchierte, aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen		
Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe) EPO-Internal, WPI Data, BEILSTEIN Data		
<b>C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN</b>		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	US 4 366 317 A (HAUT STEPHEN A ET AL) 28. Dezember 1982 (1982-12-28) das ganze Dokument -----	1,3-17
X	US 4 350 832 A (VAN AUKEN THOMAS V) 21. September 1982 (1982-09-21) das ganze Dokument -----	1,3-17
Y	WO 2004/020390 A (GRUENENTHAL GMBH [DE]; FINKAM MICHAEL [DE]; AKTERIES BERNHARD [DE]) 11. März 2004 (2004-03-11) das ganze Dokument ----- -/--	1-17
<input checked="" type="checkbox"/> Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen <input checked="" type="checkbox"/> Siehe Anhang Patentfamilie		
<ul style="list-style-type: none"> <li>* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen</li> <li>*A* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist</li> <li>*E* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist</li> <li>*L* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)</li> <li>*O* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht</li> <li>*P* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist</li> <li>*T* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist</li> <li>*X* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden</li> <li>*Y* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist</li> <li>*Z* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist</li> </ul>		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche  15. April 2008		Absenddatum des internationalen Recherchenberichts  10/06/2008
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016		Bevollmächtigter Bediensteter  Breimaier, Waltraud

C. (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	<p>ARKADY KRASOVSKIY ET AL: "Eine LiCl-vermittelte Br/Mg-Austauschreaktion zur Herstellung funktionalisierter Aryl- und Hetroarylmagnesium-Verbindungen ausgehend von organischen Bromiden"            ANGEW. CHEM.,            Bd. 116, Nr. 25, 2004, Seiten 3396-3399,            XP002476337            das ganze Dokument</p>	1-17
P,X	<p>WO 2007/096074 A (SALTIGO GMBH [DE]; JOB ANDREAS [DE]; WESTEPPE UWE [DE]; RODEFELD LARS) 30. August 2007 (2007-08-30)            das ganze Dokument</p>	1,3-7, 16,17
A	<p>JENS BECKMANN ET AL: "New Insights into the Classic Chiral Grignard Reagent (1R,2S,5R)-Menthylmagnesium Chloride"            ANGEW. CHEM. INT. ED,            Bd. 45, Nr. 39, 2006, Seiten 6509-6512,            XP002476338            in der Anmeldung erwähnt            das ganze Dokument</p>	1-17

**INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT**

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2007/063473

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
US 4366317	A	28-12-1982 KEINE	
US 4350832	A	21-09-1982 KEINE	
WO 2004020390	A	11-03-2004	AT 341534 T 15-10-2006 AU 2003260379 A1 19-03-2004 CN 1675167 A 28-09-2005 DE 10236510 A1 19-02-2004 EP 1527043 A1 04-05-2005 ES 2273073 T3 01-05-2007 HK 1076096 A1 16-03-2007 US 2005215821 A1 29-09-2005
WO 2007096074	A	30-08-2007	DE 102006007883 A1 30-08-2007