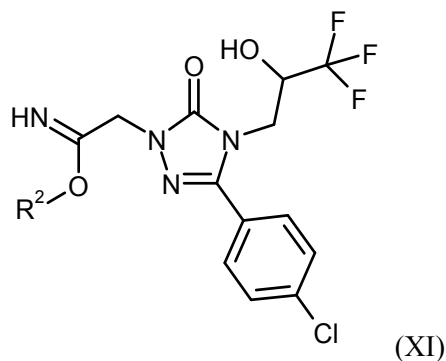


Reivindicaciones

1. Un procedimiento que comprende los pasos [C] y [D], en donde [C] es un compuesto de fórmula general (XI),

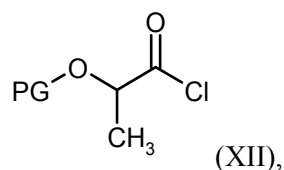


5 en donde

R² es (C₁-C₄)-alquilo, preferentemente es metilo,

se hace reaccionar sucesivamente en un primer paso

[C-1] en presencia de una base cloruro de ácido de la fórmula general (XII)

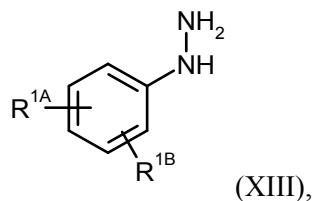


10 en donde

PG es un grupo protector, preferentemente es acetilo,

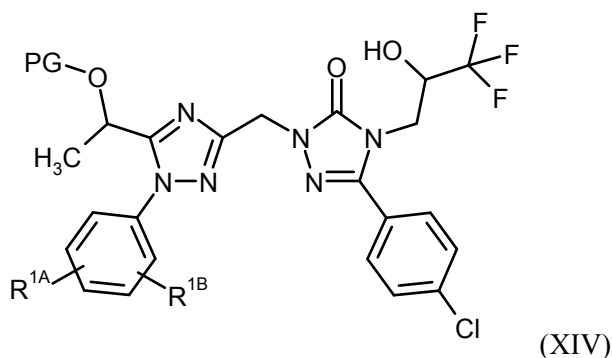
y el producto intermedio resultante se hace reaccionar en un paso subsiguiente

[C-2] en presencia de una base con un compuesto de fenilhidrazina de la fórmula general (XIII)



15 en donde R^{1A} y R^{1B} se seleccionan independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, flúor, cloro, metilo, monofluormetilo, difluormetilo, trifluormetilo, etilo, metoxi, difluormetoxi y trifluormetoxi,

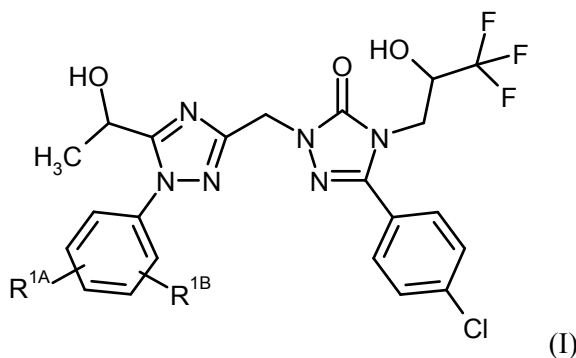
a un compuesto de 1,2,4-triazolilo de la fórmula general (XIV)



en donde PG, R^{1A} y R^{1B} son como se ha definido anteriormente,

y se hace reaccionar en un paso subsiguiente

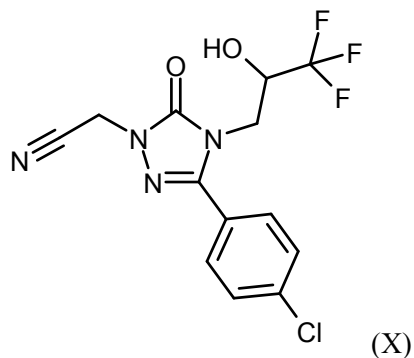
[D] por escisión del grupo protector PG a un compuesto de la fórmula general (I)



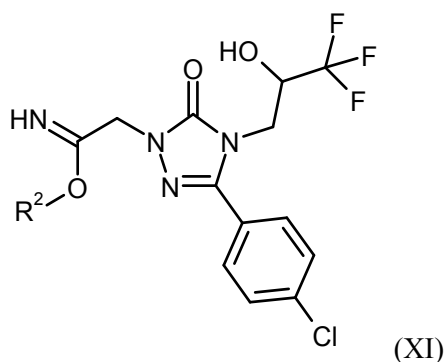
en donde R^{1A} y R^{1B} son como se ha definido anteriormente.

2. Un procedimiento de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque este se lleva a cabo como reacción en un solo recipiente en presencia de un disolvente adecuado y el producto intermedio resultante del paso [C-1] se hace reaccionar sin aislamiento, es decir, en solución, en un paso subsiguiente [C-2].
3. Un procedimiento de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 o 2, caracterizado porque este se lleva a cabo como reacción en un solo recipiente en presencia de un disolvente adecuado y el compuesto 1,2,4-triazolilo de la fórmula general (XIV) obtenido en el paso [C-2] se hace reaccionar sin aislamiento, es decir, en solución, en un paso subsiguiente [D] a un compuesto de la fórmula general (I).
4. Un procedimiento de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizado porque R^{1A} y R^{1B} se seleccionan independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, flúor y cloro, en donde al menos uno de los sustituyentes es diferente de hidrógeno.
5. Un procedimiento de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado porque esto comprende antes del paso [C] un paso [B] adicional, en donde [B] es un compuesto de fórmula general (X)

-3-



que se hace reaccionar con un (C₁-C₄)-alcoxilato básico, preferiblemente metanolato de sodio, a un compuesto de iminoéster de la fórmula general (XI),



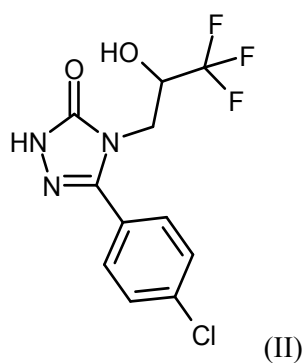
5 en donde

R² es (C₁-C₄)-alquilo, preferentemente es metilo.

6. Un procedimiento de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, caracterizado porque se lleva a cabo como reacción en un solo recipiente en presencia de un disolvente adecuado y el compuesto iminoéster de la fórmula general (XI) obtenido del paso [B] se hace reaccionar sin
10 aislamiento, es decir, en solución, en un paso subsiguiente [C].

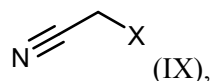
7. Un procedimiento de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, caracterizado porque esto comprende antes del paso [B] un paso [A] adicional, en donde

[A] es un compuesto de fórmula general (II)



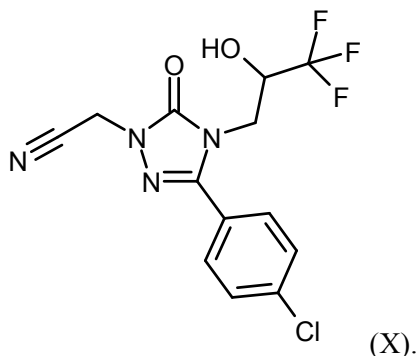
15 con un compuesto de nitrilo (IX),

-4-

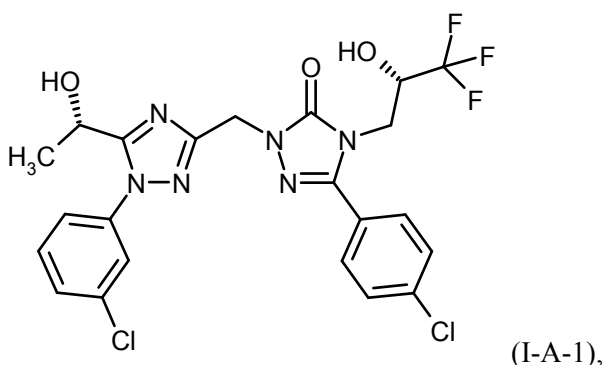


en donde X es un grupo saliente, preferiblemente es cloruro o bromuro,

que se hace reaccionar a un compuesto de la fórmula general (X)



- 5 8. (5-(4-clorofenil)-2-({1-(3-clorofenil)-5-[(1S)-1-hidroxietyl]-1H-1,2,4-triazol-3-ilo} metilo)-4-[(2S)-3,3,3-trifluor-2-hidroxiopropil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona de la fórmula (I-A-1) en forma cristalina de la modificación I

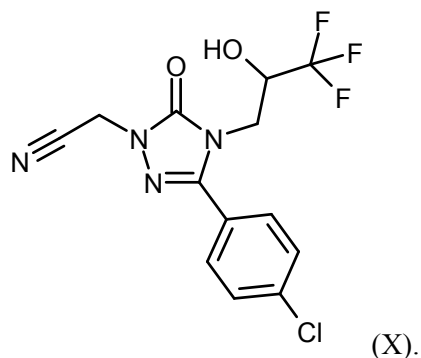


caracterizado porque el difractograma de rayos X del compuesto muestra máximos de pico del ángulo 2 Theta a 7.0, 8.9, 16.8, 17.7, 17.9, 18.1, 21.6, 21.8, 22.4 y 24.6.

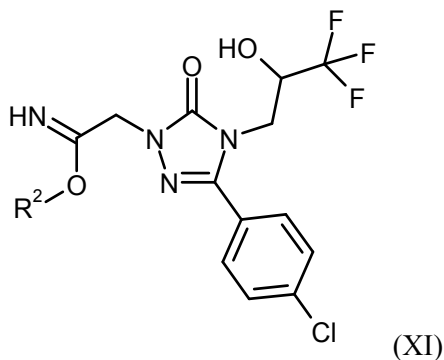
10

9. Un fármaco que comprende un compuesto de acuerdo con la reivindicación 8 que no contiene fracciones mayores de otra forma del compuesto de la fórmula (I-A-1).
10. Un fármaco que comprende un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 8 o 9 en más de 90 por ciento en peso referido a la cantidad total del compuesto de la fórmula (I-A-1).
- 15 11. El uso del compuesto de acuerdo con la reivindicación 8 para la preparación de un fármaco para el tratamiento de enfermedades cardiovasculares y enfermedades renales.
12. Un método para el tratamiento de enfermedades cardiovasculares y enfermedades renales mediante la administración de una cantidad eficaz de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 8.

13. Un procedimiento para la preparación de (5-(4-clorofenil)-2-({1-(3-clorofenil)-5-[(1*S*)-1-hidroxietil]-1*H*-1,2,4-triazol-3-ilo}metilo)-4-[(2*S*)-3,3,3-trifluor-2-hidroxipropil]-2,4-dihidro-3*H*-1,2,4-triazol-3-ona de la fórmula (I-A-1) en forma cristalina de la modificación I, caracterizado porque el compuesto de la fórmula (I-A-1) presente en una o más modificaciones o como un solvato
- 5 en una mezcla de metilo-terc-butil éter/diisopriléter o en una mezcla de metilo-terc-butil éter/n-heptano, se agita a una temperatura de 20 °C a 80 °C, luego se filtra, se lava y se seca a vacío.
14. Un compuesto de la fórmula general (X)



15. Un compuesto de la fórmula general (XI)



en donde

R² es (C₁-C₄)-alquilo, preferentemente es metilo.

Procedimiento para la preparación de derivados de 1-fenilo-1,2,4-triazol sustituidos por 5-hidroxialquilo