

(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
09. November 2017 (09.11.2017)



(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2017/191104 A1

(51) Internationale Patentklassifikation:

C07D 403/06 (2006.01) A61P 9/00 (2006.01)
A61K 31/4196 (2006.01) A61P 13/00 (2006.01)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2017/060367

(22) Internationales Anmeldedatum:
02. Mai 2017 (02.05.2017)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:

16168163.0	03. Mai 2016 (03.05.2016)	EP
16168165.5	03. Mai 2016 (03.05.2016)	EP
16168169.7	03. Mai 2016 (03.05.2016)	EP
16168166.3	03. Mai 2016 (03.05.2016)	EP
16168172.1	03. Mai 2016 (03.05.2016)	EP
17160086.9	09. März 2017 (09.03.2017)	EP

(71) Anmelder: BAYER PHARMA AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; Müllerstr. 178, 13353 Berlin (DE).

(72) Erfinder: SCHIRMER, Heiko; Dinghauserstraße 51a, 42655 Solingen (DE). RUBENBAUER, Philipp; Kronenstrasse 55, 40217 Düsseldorf (DE). MILITZER, Hans-Christian; Waldweg 2, 51519 Odenthal (DE). COLLIN, Marie-Pierre; Katemberger Schulweg 52, 42113 Wuppertal (DE). SÜSSMEIER, Frank; Baubergerstraße 5, 80992 München (DE). GERICKE, Kersten, Matthias; Bayreuther Straße 63, 42115 Wuppertal (DE). NEUBAUER, Thomas; Kaiser-Wilhelm-Allee 12, 42117 Wuppertal (DE).

FÜRSTNER, Chantal; Arnoldstraße 33, 45478 Mülheim an der Ruhr (DE).

(74) Anwalt: BIP PATENTS; Alfred-Nobel-Str. 10, NRW, 40789 Monheim am Rhein (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

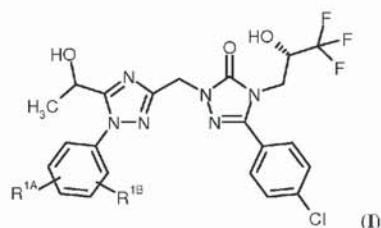
(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), europäisches (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Erklärungen gemäß Regel 4.17:

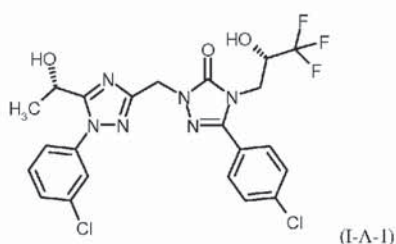
— hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii)

(54) Title: METHOD FOR PRODUCING 5-HYDROXYALKYL-SUBSTITUTED 1-PHENYL-1,2,4- TRIAZOLE DERIVATIVES

(54) Bezeichnung: VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON 5-HYDROXYALKYL-SUBSTITUIERTEN 1-PHENYL-1,2,4- TRIAZOLDERIVATIVEN



(57) Abstract: The invention relates to a novel and improved method for producing 5-(hydroxyalkyl)-1-phenyl-1,2,4-triazole-derivatives of the formula (I), in which R^{1A} and R^{1B} are selected independently of each other from the group comprising hydrogen, fluorine, chlorine, methyl, monofluoromethyl, difluoromethyl, trifluoromethyl, methoxy, difluoromethoxy, and trifluoromethoxy, to novel precursors for the production, and to the production and to the use of the crystalline modification I of (5-(4-chlorophenyl)-2-((1-(3-chlorophenyl)-5-[(1S)-1-hydroxyethyl]-1H-1,2,4-triazol-3-yl)methyl)-4-[(2S)-3,3,3-trifluoro-2-hydroxypropyl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazole-3-one.



(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Anmeldung betrifft ein neues und verbessertes Verfahren zur Herstellung von 5-(Hydroxyalkyl)-1-phenyl-1,2,4-triazol-Derivaten der Formel (I) in welcher R^{1A} und R^{1B} unabhängig voneinander ausgewählt sind aus der Gruppe bestehend aus Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, Monofluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Ethyl, Methoxy, Difluormethoxy und Trifluormethoxy, neue Vorstufen zu deren Herstellung, sowie die Herstellung und Verwendung der kristallinen Modifikation I von (5-(4-Chlorphenyl)-2-((1-(3-chlorophenyl)-5-[(1S)-1-hydroxyethyl]-1H-1,2,4-triazol-3-yl)methyl)-4-[(2S)-3,3,3-trifluor-2-hydroxypropyl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on der Formel (I-A-1).

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht (Artikel 21 Absatz
3)