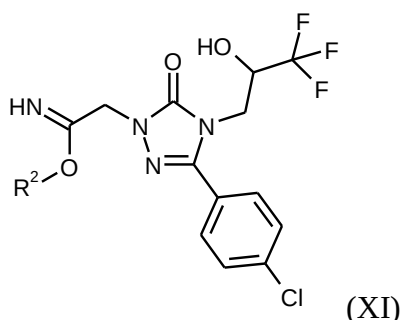


CAPÍTULO REIVINDICATORIO MODIFICADO
(Primer Examen de Fondo)

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

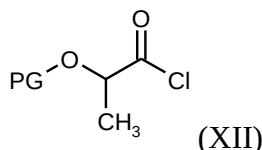


en donde

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

de manera sucesiva, se hace reaccionar en un primer paso

[C-1] en presencia de una base de amina terciaria y en un disolvente orgánico inerte a una temperatura en el intervalo de -20°C a +30°C con un cloruro de ácido de la Fórmula general (XII)

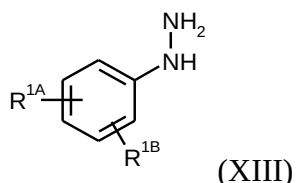


en donde

PG es un grupo acetilo,

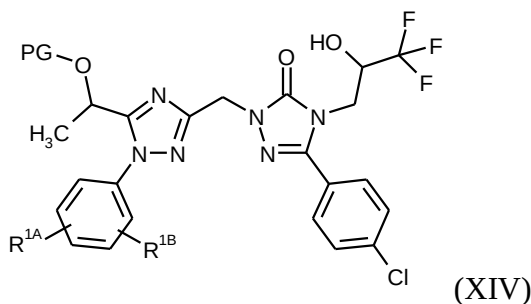
y el producto intermedio resultante se hace reaccionar en un paso subsiguiente

[C-2] en presencia de una base de amina terciaria y en un disolvente orgánico inerte a una temperatura en el intervalo de +20°C a +150°C con un compuesto de fenilhidrazina de la Fórmula general (XIII)



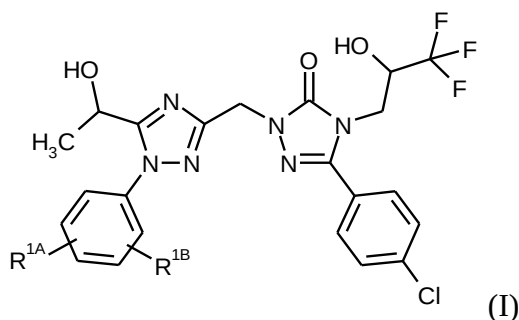
en donde R^{1A} y R^{1B} se seleccionan independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, flúor, cloro, metilo, monofluormetilo, difluormetilo, trifluormetilo, etilo, metoxi, difluormetoxi y trifluormetoxi,

para obtener 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 este último se hace reaccionar en un paso subsiguiente

[D] por escisión del grupo protector PG, mediante una reacción con una base para
obtener un compuesto de la Fórmula general (I)



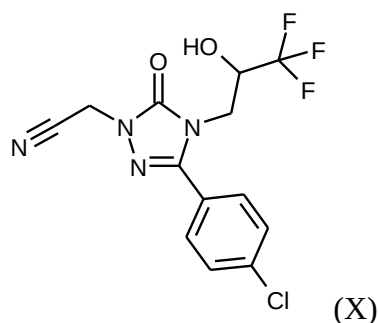
en donde R^{1A} y R^{1B} son como se ha definido anteriormente.

2. El procedimiento de acuerdo con la Reivindicación 1, caracterizado porque se lleva a cabo como reacción en un solo recipiente en presencia de un disolvente orgánico inerte y el producto intermedio resultante del paso [C-1] se hace reaccionar sin aislamiento, es decir, en solución, en un paso subsiguiente [C-2].

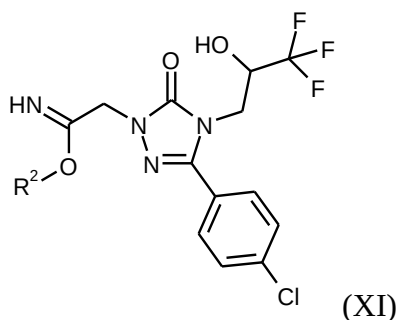
3. El procedimiento de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 1 o 2, caracterizado porque este se lleva a cabo como reacción en un solo recipiente en presencia de un disolvente orgánico inerte y el compuesto 1,2,4-triazolilo de la Fórmula general (XIV) obtenido en el paso [C-2] se hace reaccionar sin aislamiento, es decir, en solución, en un paso subsiguiente [D] para obtener 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} es hidrogeno y R^{1B} es cloro en la posición 3.

5. El procedimiento de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 4, caracterizado porque comprende antes del paso [C] un paso adicional [B] en donde
[B] un compuesto de Fórmula (X)



se hace reaccionar con un alcoxilato básico (C₁-C₄)-, preferiblemente metanolato de sodio, una temperatura en el intervalo de +20 °C a + 80 °C para obtener un compuesto de iminoéster de la Fórmula general (XI),

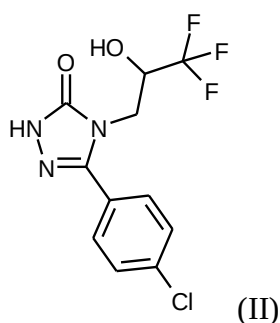


en donde

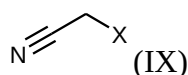
R² es alquilo (C₁-C₄), preferentemente es metilo.

6. El 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 orgánico inerte y el compuesto iminoéster de la Fórmula general (XI) obtenido del paso [B] se hace reaccionar sin aislamiento, es decir, en solución, en un paso subsiguiente [C].

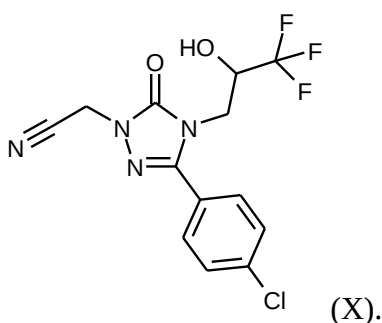
7. El procedimiento de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 6, caracterizado porque comprende antes del paso [B] un paso adicional [A], en donde [A] es un compuesto de Fórmula general (II)



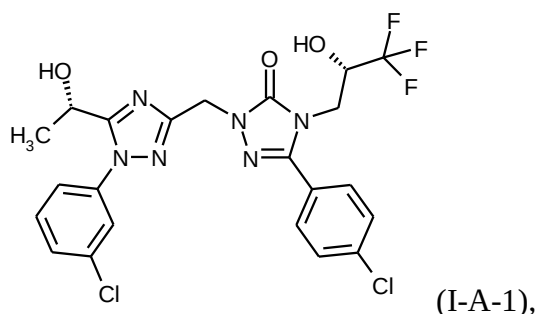
se hace reaccionar con un compuesto de nitrilo (IX) en presencia de una base seleccionada del grupo que consiste en carbonatos de metales alcalinos, alcóxidos de metales alcalinos o aminas orgánicas y en un disolvente inerte a una temperatura en el intervalo de +40°C a +120°C,



en donde X es un grupo saliente, preferiblemente es cloruro o bromuro, para obtener un compuesto de la Fórmula general (X)



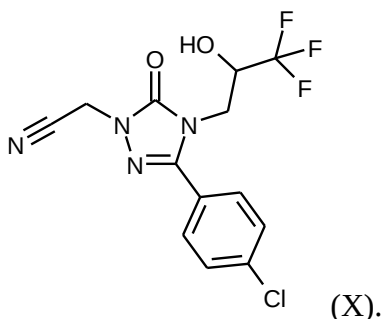
8. (5-(4-clorofenil)-2-({1-(3-clorofenil)-5-[(1S)-1-hidroxietil]-1*H*-1,2,4-triazol-3-ilo}metilo)-4-[(2S)-3,3,3-trifluor-2-hidroxipropil]-2,4-dihidro-3*H*-1,2,4-triazol-3-ona de la Fórmula (I-A-1) en forma cristalina de la modificación I



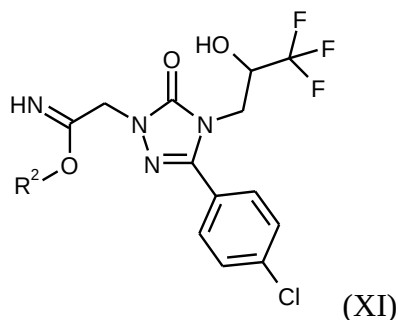
caracterizado porque el difractograma de rayos X del compuesto muestra máximos de pico del ángulo 2 Theta a 7,0, 8,9, 16,8, 17,7, 17,9, 18,1, 21,6, 21,8, 22,4 y 24,6.

9. Un procedimiento para la preparación de (5-(4-clorofenil)-2-({1-(3-clorofenil)-5-[(1S)-1-hidroxietil]-1*H*-1,2,4-triazol-3-ilo}metilo)-4-[(2S)-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 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, en donde el compuesto de la Fórmula (I-A-1) presente en una o más modificaciones o en forma de solvato, se agita en una mezcla de metilo-terc-butil éter/diisopropiléter o en una mezcla de metilo-terc-butil éter/n-heptano, a una temperatura de 20 °C a 80 °C, luego se filtra, se lava y se seca a vacío.

10. Un compuesto de la Fórmula general (X)



11. Un compuesto de la Fórmula general (XI)



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