

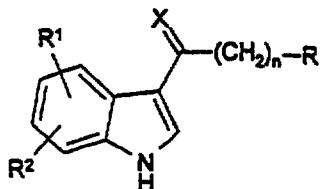
INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(51) International patent classification: C07D 209/10, 209/12	A1	(11) International publication number: WO 00/35872 (43) International publication date: 22 June 2000 (22.06.00)
(21) International application number: PCT/EP99/09334 (22) International filing date: 1 December 1999 (01.12.99) (30) Data relating to the priority: 198 58 340.0 17 December 1998 (17.12.98) DE (71) Applicant (for all designated States except US): MERCK PATENT GMBH [DE/DE]; Frankfurter Strasse 250, D-64293 Darmstadt (DE). (72) Inventors; and (75) Inventors/Applicants (US only): BATHE, Andreas [DE/DE]; Merckstrasse 17, D-64283 Darmstadt (DE). TILLY, Herbert [DE/DE]; An der Pfeffermühle 5, D-64319 Pfungstadt (DE). (74) Joint Representative: MERCK PATENT GMBH; Frankfurter Strasse 250, D-64293 Darmstadt (DE).		(81) Designated states: AE, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW, ARIPO Patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), Eurasian Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG). Published With the International Search Report.

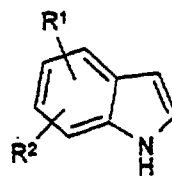
As printed

(54) Title: METHOD FOR PRODUCING 3-ALKANOYLINDOLES AND 3-ALKYLINDOLES

(54) Bezeichnung: VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON 3-ALKANOYL- UND 3-ALKYLINDOLEN



(I)



(II)

(57) Abstract

The invention relates to a method for producing compounds of formula (I), wherein R, R¹, R² and n have the meanings given in Claim 1 and X stands for O or H,H. The invention also relates to the acid addition salts of said compounds. Said method is characterised in that a) when X stands for O and R, R¹, R² and n have the given meanings, a compound of formula (II) wherein R¹ and R² have the meanings given in Claim 1 is converted with a compound of formula (III): R-(CH₂)_n-CO-L wherein R, L and n have the meanings given in Claim 1 in a Friedel-Crafts acylation and using the catalysis of Lewis acid metal halogenides of the type R'-Al(Cl)₂ wherein R' has the meaning given in Claim 1 or b) when X stands for H,H and R, R¹, R² and n have the given meanings, a compound of formula (I), wherein X stands for O and R, R¹, R² and n have the given meanings, is reduced with complex hydrides using activation by means of Lewis acid metal halogenides of the type R'-Al(Cl)₂ wherein R' has the meaning given in Claim 1 and/or in that an obtained base of formula (I) is converted into one of the acid addition salts of said base by treating said base with an acid.

(57) Zusammenfassung

Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I), worin R, R¹, R² und n die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben und X O oder H,H bedeutet sowie ihrer Säureadditionssalze, dadurch gekennzeichnet, daß man a) falls X O bedeutet und R, R¹, R² und n die angegebenen Bedeutungen haben, eine Verbindung der Formel (II), worin R¹ und R² die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben, mit einer Verbindung der Formel (III): R-(CH₂)_n-CO-L, worin R, L und n die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben, in einer Friedel-Crafts Acylierung unter Katalyse von Lewis-sauren Metallhalogeniden des Typs R'-Al(Cl)₂, worin R' die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung hat, umsetzt; oder b) falls X H,H bedeutet und R, R¹, R² und n die angegebenen Bedeutungen haben, eine Verbindung der Formel (I), worin X O bedeutet und R, R¹, R² und n die angegebenen Bedeutungen haben, mit komplexen Hydriden unter Aktivierung durch Lewis-saure Metallhalogenide des Typs R'-Al(Cl)₂, worin R' die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung hat, reduziert, und/oder daß man eine erhaltene Base der Formel (I) durch Behandeln mit einer Säure in eines ihrer Säureadditionssalze umwandelt.