

(19) 대한민국특허청(KR)  
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.<sup>4</sup>  
C07D 209/24

(11) 공개번호 특1986-0000258  
(43) 공개일자 1986년01월27일

---

(21) 출원번호	특1985-0004471
(22) 출원일자	1985년06월24일
(30) 우선권주장	624173 1984년06월25일 미국(US)
(71) 출원인	머크 프로스트 캐나다 인코포레이티드 재클린 이. 브레버드 캐나다 퀘벡 커크랜드 트랜스-캐나다 하이웨이 16711
(72) 발명자	이반 권던
(74) 대리인	캐나다 퀘벡 일레 비저드 플레이스 클로세 409 이병호

---

심사청구 : 없음

(54) 인돌-2-알카노산의 제조방법

---

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

인돌-2-알카노산의 제조방법

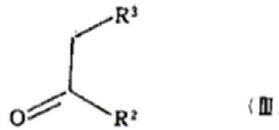
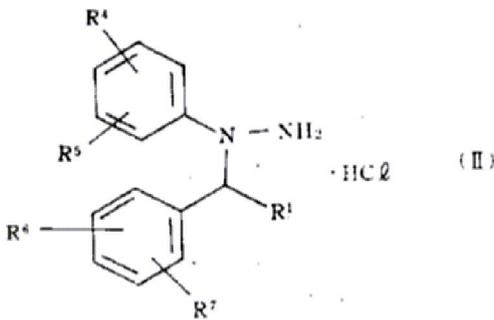
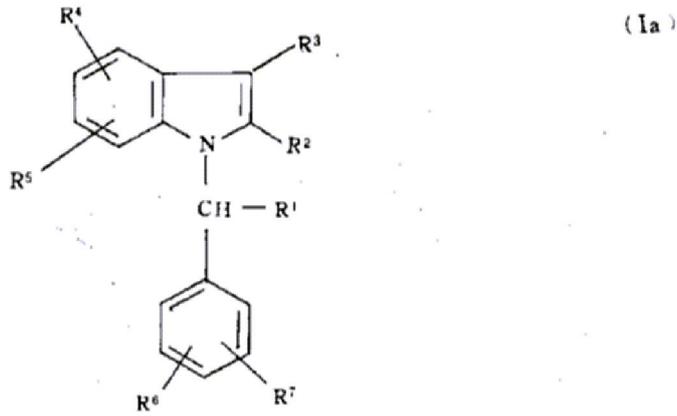
본 건은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

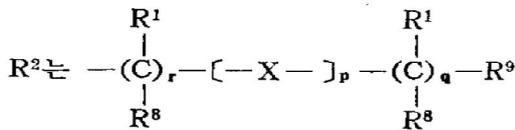
청구항 1

일반식(II)의 페닐하이드라진을 일반식(III)의 케톤과 반응시킴을 특징으로 하여 일반식(Ia)의 화합물

및 그의 약제학적으로 허용되는 염을 제조하는 방법.



상기식에서, R<sup>1</sup>은 H 또는 C<sub>1</sub> 내지 C<sub>6</sub>의 알킬이고;



이며;

R<sup>8</sup>은 각각 독립적으로 H, OH, C<sub>1</sub> 내지 C<sub>4</sub>-O-알킬, C<sub>1</sub> 내지 C<sub>4</sub>의 알킬이거나

R<sup>1</sup> 및 R<sup>8</sup>이 함께 (CH<sub>2</sub>)<sub>v</sub> [여기서 v는 1 내지 7의 정수이다] 그룹을 형성하고; R<sup>9</sup>은 COOR<sup>1</sup>, CH<sub>2</sub>OH, CHO, 테트라졸, NHSO<sub>2</sub>R<sup>10</sup>, 하이드록시-메틸케톤, CN 또는 CON(R<sup>8</sup>)<sub>2</sub> 이며;

R<sup>10</sup>은 OH, C<sub>1</sub> 내지 C<sub>6</sub>의 알킬 또는 알콕시, C<sub>1</sub> 내지 C<sub>3</sub>의 알킬 또는 알콕시그룹, 할로겐, 하이드록시, COOH, CN, 포밀 또는 C<sub>1</sub> 내지 C<sub>3</sub>의 아실로 치환된 페닐이고; X는 O, S, SO, SO<sub>2</sub>NR<sup>11</sup> [여기서, R<sup>11</sup>은 H, C<sub>1</sub> 내지 C<sub>6</sub>의 알킬, C<sub>1</sub> 내지 C<sub>6</sub>의 아실 또는 CN이다],

CR<sup>1</sup>R<sup>8</sup> 또는  $\begin{array}{c} R^1 \quad R^8 \\ | \quad | \\ - C \equiv C - \end{array}$  단위 [여기서, 점선은 임의의 3중 결합을 나타내고, 점선이 3중결합을 나타낼 경우 R<sup>1</sup> 및 R<sup>8</sup>은 존재하지 않는다]이며;

r 및 q는 각각 독립적으로 0 내지 5의 정수이고 p는 0 또는 1인데, 단 p, q 및 r의 합은 2 내지 6이고

R<sup>1</sup> 및 R<sup>8</sup>이 각각 H이고 X가 CH<sub>2</sub>이며, R<sup>4</sup>가 5- 메톡시이고 R<sup>6</sup>가 할로겐이면, p, q 및 r의 합은 3 내지 6이며;

R<sup>3</sup>은 H, C<sub>1</sub> 내지 C<sub>6</sub>의 알킬, 페닐, R<sup>4</sup>로 치환된 페닐, C<sub>1</sub> 내지 C<sub>4</sub> 알킬-페닐 또는 페닐이 R<sup>4</sup>로 치환된 C<sub>1</sub> 내지 C<sub>4</sub> 알킬페닐이고;

R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> 및 R<sup>7</sup>은 각각 독립적으로 (1) 수소, (2) C<sub>1</sub> 내지 C<sub>6</sub> 알킬, (3) C<sub>2</sub> 내지 C<sub>6</sub>의 알케닐, (4) - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>M [여기서 n은 0 내지 3의 정수이고 M은 a)OR<sup>12</sup>, b)할로겐, c)CF<sub>3</sub>, d)SR<sup>12</sup>, e)페닐 또는 하기 R<sup>12</sup>에서

정의되는 바와 같이 치환된 페닐, f)COO<sup>13</sup>, Rg)  $\text{C}(=\text{O})-\text{R}^{14}$ , h)테트라졸, i)-NH-  $\text{C}(=\text{O})-\text{R}^{15}$ , j)-NR<sup>13</sup>R<sup>13</sup>, k)-NHSO<sub>2</sub>R<sup>16</sup>, l)-  $\text{C}(=\text{O})-\text{CH}_2\text{OH}$ , m)-SOR<sup>12</sup> n)-CONR<sup>13</sup>R<sup>13</sup>, o)-SO<sub>2</sub>NR<sup>13</sup>R<sup>13</sup>, p)-SO<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, q) NO<sub>2</sub> r)O-  $\text{C}(=\text{O})-\text{R}^{14}$ , s)O-  $\text{C}(=\text{O})-\text{NR}^{13}\text{R}^{13}$ , t)O-  $\text{C}(=\text{O})-\text{OR}^{15}$  또는 u) CN인데, 여기서 R<sup>12</sup>는 독립적으로 H, C<sub>1</sub> 내지 C<sub>6</sub>의 알킬, 벤질 또는 페닐이거나 C<sub>1</sub> 내지 C<sub>3</sub>의 알킬, 할로겐, CN, CF<sub>3</sub>, COOR<sup>13</sup>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OR<sup>13</sup>, C<sub>1</sub> 내지 C<sub>3</sub>의 알콕시 또는 C<sub>1</sub> 내지 C<sub>4</sub>의 퍼플루오로알킬로 치환된 페닐이고;

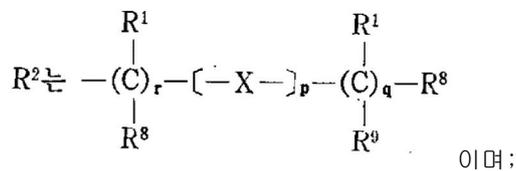
R<sup>13</sup>은 독립적으로 H, 페닐, 또는 C<sub>1</sub> 내지 C<sub>6</sub>의 알킬이며;

R<sup>14</sup>는 독립적으로 H, (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>COOR<sup>13</sup> (n은 0 내지 4의 정수이다), C<sub>1</sub> 내지 C<sub>6</sub>의 알킬, CF<sub>3</sub>, 페틸이거나 R<sup>12</sup>에서 정의된 바와 같이 치환된 페닐이고;

R<sup>15</sup>는 C<sub>1</sub> 내지 C<sub>6</sub>의 알킬, 벤질 또는 페닐이며; R<sup>16</sup>은 C<sub>1</sub> 내지 C<sub>6</sub>의 알킬, 페닐 또는 CF<sub>3</sub>이다] 중에서 선택된다.

**청구항 2**

제1항에 있어서, R<sup>1</sup>은 H 또는 C<sub>1</sub> 내지 C<sub>3</sub>의 알킬이고;



R<sup>8</sup>은 각각 독립적으로 H 또는 C<sub>1</sub> 내지 C<sub>4</sub>의 알킬인데 인돌 질소에 결합된 벤질성 탄소상의 R<sup>1</sup>은 H이고 R<sup>2</sup> 중의 치환체 R<sup>1</sup> 또는 R<sup>8</sup> 중 적어도 하나는 수소가 아니며;

R<sup>9</sup>는 COOH, CH<sub>2</sub>OH, CHO 또는 테트라졸이고; X는 CR<sup>1</sup>R<sup>8</sup>이며;

r 및 q는 각각 독립적으로 0 내지 3의 정수이고, p는 0 또는 1인데, 단, p, q 및 r의 합은 2 내지 3이고;

R<sup>3</sup>는 C<sub>1</sub> 내지 C<sub>6</sub>의 알킬인데, 단 시클로알킬은 아니며;

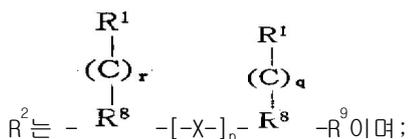
R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> 및 R<sup>7</sup>은 각각 독립적으로 (1) 수소, (2) C<sub>1</sub> 내지 C<sub>6</sub>의 알킬, (3) a)OR<sup>12</sup>, b)할로겐, c)CF<sub>3</sub>,

d)SR<sup>12</sup>, e)-SOR<sup>12</sup>, f)-SO<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, g) O-  $\text{C}(=\text{O})-\text{R}^{14}$ , h)CN,

(상기에서, R<sup>12</sup>는 각기 독립적으로 H, C<sub>1</sub> 내지 C<sub>6</sub>의 알킬 또는 벤질이고, R<sup>14</sup>는 H, C<sub>1</sub> 내지 C<sub>6</sub>의 알킬, CF<sub>3</sub> 또는 페닐이거나 R<sup>12</sup>에서 정의된 바와 같은 치환된 페닐이다) 중에서 선택되는 일반식(1a)의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 제조하는 방법.

**청구항 3**

제1항에 있어서, R<sup>1</sup>은 H 또는 C<sub>1</sub> 내지 C<sub>3</sub>의 알킬인데, 단, 인돌 질소에 결합된 벤질성 탄소상의 R<sup>1</sup>은 H이고;



R<sup>8</sup>은 각각 독립적으로 H 또는 C<sub>1</sub> 내지 C<sub>3</sub>의 알킬이고;

R<sup>9</sup>는 COOH, CH<sub>2</sub>OH, CHO 또는 테트라졸이며; X는 O, S, SO 또는 SO<sub>2</sub>이고;

r 및 q는 각각 독립적으로 0 내지 3의 정수이고, p는 1인데, 단, p, q 및 r의 합은 2 내지 3이며;

R<sup>3</sup>은 C<sub>1</sub> 내지 C<sub>3</sub>의 알킬인데, 단 시클로알킬은 아니고;

R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> 및 R<sup>7</sup>은 각각 독립적으로 (1) 수소, (2) C<sub>1</sub> 내지 C<sub>6</sub>의 알킬, (3) a)OR<sup>12</sup>, b)할로겐, c)CF<sub>3</sub>,

d)SR<sup>12</sup>, e)-SOR<sup>12</sup>, f)-SO<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, g)O-C(=O)-R<sup>14</sup>, h)CN

(상기에서 R<sup>12</sup>는 독립적으로 H, C<sub>1</sub> 내지 C<sub>6</sub>의 알킬 또는 벤질이고, R<sup>14</sup>는 H, C<sub>1</sub> 내지 C<sub>6</sub>의 알킬, CF<sub>3</sub>, 페닐 이거나 R<sup>12</sup>에서 정의된 바와 같은 치환된 페닐이다) 중에서 선택되는 일반식(1a)의 화합물 또는 그의 약 제학적으로 허용되는 염을 제조하는 방법.

**청구항 4**

제1항에 있어서, 3-[1-(p-클로로벤질)-5-클로로-3-메틸-2-인돌릴]-프로피온 산;

3-[1-(p-클로로벤질)-3-메틸-5-플루오로-2-인돌릴]-프로피온 산;

3-[1-(p-클로로벤질)-3-메틸-4,6-디클로로-2-인돌릴]-프로피온 산;

3-[1-(p-클로로벤질)-3-메틸-4-메톡시-2-인돌릴]-프로피온 산;

3-[1-(p-클로로벤질)-3-메틸-6-메톡시-2-인돌릴]-프로피온 산;

3-[1-(p-클로로벤질)-3,4-디메틸-2-인돌릴]프로피온 산 및

3-[1-(p-클로로벤질)-3,6-디메틸-2-인돌릴]-프로피온 산(혼합물);

1-(4-클로로벤질)-3-메틸-5-메톡시-2-(4'-카복시부틸)인돌;

3-[1-(p-클로로벤질)-3,5-디메틸-2-인돌릴]-프로피온 산;

1-(4-클로로벤질)-3-메틸-5-메톡시-2-(3-카복시부틸)인돌;

3-[1-(p-클로로벤질)-3-메틸-2-인돌릴]-프로피온 산;

3-[1-(p-클로로벤질)-5-브로모-3-인돌릴]-프로피온 산;

1-(4-티오메틸벤질)-5-메톡시-3-메틸-2-(2-카복시에틸)인돌;

1-(4-티오메틸벤질)-5-메톡시-3-메틸-2-(2-카복시에틸)인돌 s-옥사이드;

1-(4-티오메틸벤질)-5-메톡시-3-메틸-2-(3-카복시에틸)인돌;

4-[1-(p-클로로벤질)-3-메틸-5-플루오로-2-인돌릴]-부타노 산;

3-[1-(p-티오메틸벤질)-3-메틸-5-플루오로-2-인돌릴]프로파노 산;

3-[1-(p-메틸설폭시벤질)-3-메틸-5-플루오로-2-인돌릴]-프로파노 산;

3-[1-(4-클로로벤질)-3-메틸-5-플루오로-2-인돌릴]부타노 산;

3-메틸-4-[1-(p-클로로벤질)-5-메톡시-3-메틸인돌-2-일]부타노 산;

3-메틸-4-[1-(p-클로로벤질)-5-플루오로-3-메틸인돌-2-일]부타노 산;

3-[1-(p-메틸설폭시벤질)-3-메틸-5-메톡시인돌-2-일]-2,2-디메틸프로파노 산;

3-[1-(p-메틸설폭시벤질)-5-하이드록시-3-메틸인돌-2-일]-프로피온 산;

3-[1-(p-메틸설폭시벤질)-5-아세톡시-3-메틸인돌-2-일]-프로파노 산;

3-[4,6-디클로로-1-(4-클로로벤질)-3-메틸-1H-인돌-2-일]프로파노 산;

3-[1-(4-클로로벤질)-4-메톡시-3-메틸-1H-인돌-2-일]-프로파노 산;

2-[1-(4-클로로벤질)-3-메틸-5-플루오로인돌-2-일]-메톡시아세트 산;

3-[1-(4-브로모벤질)-3-메틸-5-메톡시인돌-2-일]-2,2-디메틸프로파노 산;

3-[1-(4-클로로벤질)-3-메틸-5-메톡시인돌-2-일]-2-메틸-프로파노 산;

3-[1-(4-요도벤질)-3-메틸-5-메톡시인돌-2-일]-2,2-디메틸-프로파노 산;

3-[1-(4-클로로벤질)-3-메틸-5-메톡시인돌-2-일]-2,2-디메틸-프로판올;

3-[1-(4-클로로벤질)-3-메틸-5-하이드록시인돌-2-일]-2,2-디메틸-프로파노산;

3-[1-(4-클로로벤질)-3-메틸-5-메톡시인돌-2-일]-프로판올;

3-[1-(4-클로로벤질)-3-메틸-5-플루오로인돌-2-일]-2,2-디메틸프로파노 산;

3--[1-(4-클로로벤질)-3-메틸-5-플루오로인돌-2-일]-3-메틸프로파노 산;

- 3-[1-(4-클로로벤질)-3-메틸-5-하이드록시인돌-2-일]-부타노 산;  
 메틸4-[1-(4-클로로벤질)-3- 메틸-5-플루오로인돌-2-일]-부타노에이트;  
 3-[1-(4-클로로벤질)-3-메틸-4-프로필-5-하드록시인돌-2-일]-프로파노 산;  
 3-[1-(4-클로로벤질)-3-메틸-5-프로프-2-에녹시인돌-2-일]-프로파노 산;  
 3-[1-(4-클로로벤질)-3-메틸-5-메톡시인돌-2-일]-2,2-디메틸-프로파노에이트;  
 3-[1-(4-클로로벤질)-3-메틸-5-플루오로인돌-2-일]-2-메틸-부타노 산;  
 1-(4-클로로벤질)-3-메틸-5-메톡시-1H-인돌-2-메톡시 아세트 산;  
 3-[1-(4-클로로벤질)-3-메틸-5-플로로인돌-2-일]-2,2-디메틸-프로파노 산;  
 메틸-3-[1-(4-클로로벤질)-5-메톡시--3-메틸-1H-인돌-2-일]-프로파노에이트;  
 3-[1-(4-아미노벤질)-5-메톡시-3-메틸-1H-인돌-2-일]-2,2-디메틸프로파노 산;  
 4-[1-(4-클로로벤질)-5-메톡시-3-메틸-1H-인돌-2-일]-2,2-디메틸부타노 산;  
 4-[1-(4-클로로벤질)-5-플루오로-3-메틸-1H-인돌-2-일]-2,2-디메틸부타노산;  
 4-[1-(4-클로로벤질)-5-하이드록시-3-메틸-1H-인돌-2-일]-3-메틸부타노 산;  
 3-[1-(4-클로로벤질)-5-하이드록시-3-메틸-1H-인돌-2-일]-2,2-디메틸프로파노 산;  
 3-[1-(4-클로로벤질)-5-하이드록시-3-메틸-1H-인돌-2-일]-3-메틸 프로파노 산;  
 3-[1-(4-클로로벤질)-5-에톡시-3-메틸-1H-인돌-2-일]-2,2-디메틸 프로파노 산;  
 4-[1-(4-클로로벤질)-5-플루오로-3-메틸-1H-인돌-2-일]-2,4,3,3-테트라메틸 부타노 산;  
 4-[1-(4-클로로벤질)-5-플루오로-3-메틸-1H-인돌-2-일]-4,3,3-트리메틸 부타노 산;  
 4-[1-(4-클로로벤질)-5-플루오로-3-메틸-1H-인돌-2-일]-2,2,3-트리메틸 부타노 산;  
 4-[1-(4-클로로벤질)-5-플루오로-3-메틸-1H-인돌-2-일]-2,3,3-트리메틸 부타노 산;  
 4-[1-(4-클로로벤질)-5-메톡시-3-메틸-1H-인돌-2-일]-2,2,3-트리메틸 부타노 산;  
 4-[1-(4-클로로벤질)-5-에톡시-3-메틸-1H-인돌-2-일]-2,2,3-트리메틸 부타노 산;  
 4-[1-(4-클로로벤질)-5-클로로-3-메틸-1H-인돌-2-일]-2,2,3-트리메틸 부타노 산;  
 4-[1-(4-클로로벤질)-3-메틸-5-트리플루오로메틸-1H-인돌-2-일]-2,4,3,3-테트라메틸 부타노 산;  
 4-[1-(4-클로로벤질)-3-메틸-5-트리플루오로메틸티오-1H-인돌-2-일]-2,4,3,3-테트라메틸 부타노 산;  
 3-[1-(4-클로로벤질)-5-에톡시-3-메틸-1H-인돌-2-일]-2,2,3-트리메틸 프로파노 산;  
 3-[1-(4-클로로벤질)-5-에톡시-3-메틸-1H-인돌-2-일]-2,3,3-트리메틸 프로파노 산;  
 3-[1-(4-클로로벤질)-5-에톡시-3-메틸-1H-인돌-2-일]-2,2,3,3-테트라메틸 프로파노 산;  
 3-[1-(4-클로로벤질)-5-메톡시-3-메틸-1H-인돌-2-일]-2,2,3-트리메틸 프로파노 산;  
 3-[1-(4-클로로벤질)-5-플루오로-3-메틸-1H-인돌-2-일]-2,2,3-트리메틸 프로파노 산;  
 3-[1-(4-클로로벤질)-5-클로로- 3-메틸-1H-인돌-2-일]-2,2,3-트리메틸 프로파노 산;  
 3-[1-(p-클로로벤질)-3-메틸 -5-메톡시인돌-2-일]-2,2-디에틸 프로파노 산;  
 3-[1-(4-클로로벤질)-3-메틸-5-플루오로인돌-2-일]-2,2-디에틸 프로파노 산;  
 3-[1-(4-클로로벤질)-3-메틸-5-플루오로인돌-2-일]-2-에틸 프로파노 산;  
 3-[1-(4-클로로벤질)-3-메틸-5-플루오로인돌-2-일]-3-메틸 프로파노 산;  
 3-[1-(4-클로로벤질)-3-메틸-5-메톡시-2-일]펜타노 산을 제조하는 방법.
- ※ 참고사항 : 최초출원내용에 의하여 공개하는 것임.