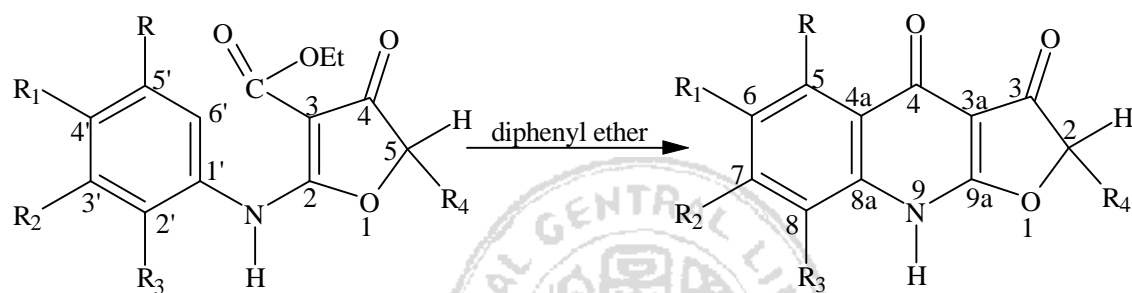


(三) 5,6,7,8-Substituted 2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3-*b*]quinolin-3,4-diones (27-52)之合成

化合物 1-26 分別置於沸騰之 diphenyl ether 高溫環化，則可得到相對應的化合物 27-52。(如 Scheme 3 所示)

Scheme 3



1-26

27-52

27 $R_1=R_2=R_3=R_4=H$

40 $R_1=F, R_2=R_3=R_4=H$

28 $R_2=CH_3, R_1=R_3=R_4=H$

41 $R_1=Br, R_2=R_3=R_4=H$

29 $R_2=C_2H_5, R_1=R_3=R_4=H$

42 $R_1=R_3=OCH_3, R_2=R_4=H$

30 $R_2=OCH_3, R_1=R_3=R_4=H$

43 $R_1=R_2=OCH_3, R_3=R_4=H$

31 $R_2=OC_2H_5,$

44 $R_1=R_2=Cl, R_3=R_4=H$

$R_1=R_3=R_4=H$

32 $R_2=Cl, R_1=R_3=R_4=H$

45 $R_1=R_2=CH_3, R_3=R_4=H$

33 $R_2=F, R_1=R_3=R_4=H$

46 $R_1-OCH_2O-R_2, R_3=R_4=H$

34 $R_2=Br, R_1=R_3=R_4=H$

47 $R_3=Br, R_2=R_3=R_4=H$

35 $R_1=CH_3, R_2=R_3=R_4=H$

48 $R_2=Cl, R_1=R_3=R_4=H$

36 $R_1=C_2H_5, R_2=R_3=R_4=H$

49 $R_1=R_3=Cl, R_2=R_4=H$

37 $R_1=OCH_3, R_2=R_3=R_4=H$

50 $R_4=CH_3, R_1=R_2=R_3=H$

38 $R_1=OC_2H_5,$

51 $R_2=OCH_3, R_4=CH_3, R_1=R_3=H$

$R_2=R_3=R_4=H$

39 $R_1=Cl, R_2=R_3=R_4=H$

52 $R_1=OCH_3, R_4=CH_3, R_2=R_3=H$

在此僅以化合物 49 為例說明之：

化合物 49 熔點為 277-278 ; 其質譜(MS)之分子離子峰 $m/z(\%)$: M^+ 為 268.9 (100) , $(M+2)^+$ 為 270.9 (57.6); IR 光譜分別於 1721.0 cm^{-1} 及 1643.9 cm^{-1} 顯示 2 個 carbonyl group 吸收。另由 $^1\text{H-NMR}$ 光譜顯示: 5.26 (2H, s) 為 furan 環上 methylene 的信號; 8.02 與 8.37 分別為第 7 位及第 5 位上的氫, 互相耦合, 其耦合常數 $J=2.0\text{ Hz}$ 。而原來乙氧基 (ethoxy) 的信號消失, 顯示乙氧基已在環化的過程中脫離, 因此可知化合物 23 已被環化。綜合上述光譜分析數據, 可判定化合物

6,8-dichloro-2,3,4,9-tetrahydro-furo[2,3-*b*]quinolin-3,4-dione (49) 為預期之結

構無誤。

Table 2 化合物 23 和 49 的氫質譜數據對照表

23 diphenyl ether → **49**

*OCH ₂ -CH ₃	1.37(t)	-----	-----
*OCH ₂ -CH ₃	4.37(q)	-----	-----
H-6'	7.74 (d)	-----	-----
H-5'	7.26 (dd)	H-5	8.37 (d)
H-3'	7.46 (d)	H-7	8.02 (d)
NH	10.26(s)	-----	-----

由Table 2 可知: 原本在化合物 23 乙基酯上乙氧基的信號(“ * “所示) 在化合物 49 時已消失, 而由化合物 23 的MS圖譜也可看出乙氧基的斷裂殘基, 可知乙氧基在環化的過程中脫離。由此顯示化合物 23 已被環化成化合物 49, 正如我們所預期。