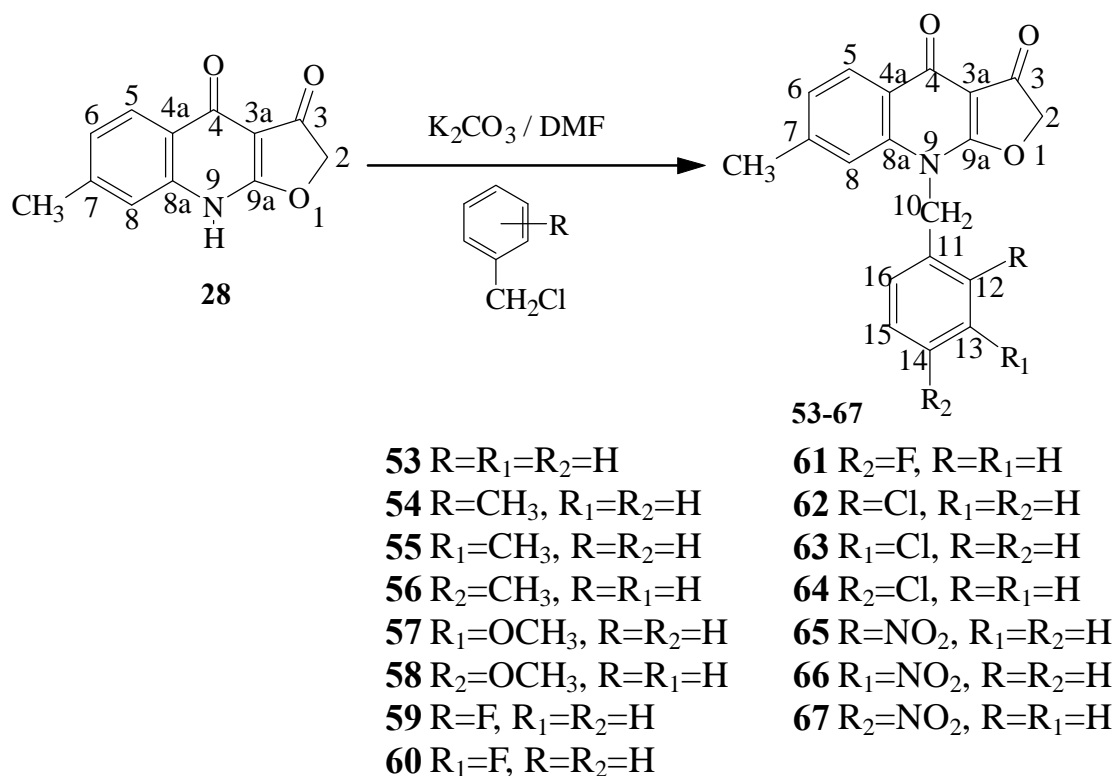


(四) *N*-Substituted benzyl-7-methyl-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3-*b*]-quinolin-3,4-dione 類化合物 (53-67) 之合成

取化合物 28 在 DMF 中與無水  $K_2CO_3$  溫熱溶解，然後分別加入各種不同取代的 benzyl chloride，所得各種粗產物以矽膠管柱層析 ( $CHCl_3$  / EtOH) 來沖提，然後再以  $CHCl_3$  / MeOH 作再結晶，可得化合物 53-67。(如 Scheme 4 所示)

Scheme 4

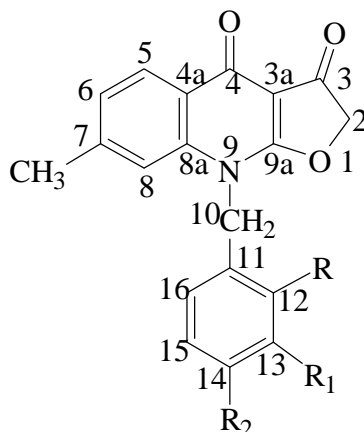


在此僅以化合物 61 為例說明之：

化合物 61 的熔點為 236-238，其質譜(MS)之分子離子峰為(m/z) 323.2; IR 光譜分別於  $1710.5\text{ cm}^{-1}$  及  $1611.8\text{ cm}^{-1}$  顯示 2 個 carbonyl 的吸收，另由  $^1\text{H-NMR}$  光譜顯示: 2.36 (3H, s,  $C_7\text{-CH}_3$ ); 4.89 (2H, s, H-2); 5.53 (2H, s, H-10); 7.12-7.48 (6H, m, H-6, H-8, Ar-H); 8.06 (1H, d,  $J=8.04\text{ Hz}$ , H-5)。而  $^{13}\text{C-NMR}$  光譜顯示: 191.23 為 C-3; 174.80 為 C-4; 76.17 為 C-2; 45.65 為 C-10 之信號，綜合以上之圖譜顯示化合物

*N*-*p*-fluorobenzyl-7-methyl-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3-*b*]quinolin-3,4-dione (61) 為預期之結構無誤。其餘化合物之 2 位，5 位及 10 位氫質譜數據如 Table 3 所示。

**Table 3** 化合物 53-67 的氫質譜數據



| No. | R               | R <sub>1</sub>   | R <sub>2</sub>   | H-2     | H-5     | H-10    |
|-----|-----------------|------------------|------------------|---------|---------|---------|
| 53  | H               | H                | H                | 4.90(s) | 8.07(d) | 5.55(s) |
| 54  | CH <sub>3</sub> | H                | H                | 4.84(s) | 8.12(d) | 5.48(s) |
| 55  | H               | CH <sub>3</sub>  | H                | 4.89(s) | 8.07(d) | 5.50(s) |
| 56  | H               | H                | CH <sub>3</sub>  | 4.89(s) | 8.06(d) | 5.49(s) |
| 57  | H               | OCH <sub>3</sub> | H                | 4.90(s) | 8.07(d) | 5.51(s) |
| 58  | H               | H                | OCH <sub>3</sub> | 4.90(s) | 8.06(d) | 5.47(s) |
| 59  | F               | H                | H                | 4.88(s) | 8.08(d) | 5.57(s) |
| 60  | H               | F                | H                | 4.89(s) | 8.07(d) | 5.56(s) |
| 61  | H               | H                | F                | 4.90(s) | 8.07(d) | 5.53(s) |
| 62  | Cl              | H                | H                | 4.85(s) | 8.10(d) | 5.55(s) |
| 63  | H               | Cl               | H                | 4.89(s) | 8.08(d) | 5.56(s) |
| 64  | H               | H                | Cl               | 4.89(s) | 8.07(d) | 5.55(s) |
| 65  | NO <sub>2</sub> | H                | H                | 4.81(s) | 8.08(d) | 5.89(s) |
| 66  | H               | NO <sub>2</sub>  | H                | 4.89(s) | 8.09(d) | 5.72(s) |
| 67  | H               | H                | NO <sub>2</sub>  | 4.89(s) | 8.19(d) | 5.72(s) |

\*化合物之溶媒為 dimethyl sulfoxide-*d*<sub>6</sub>。

