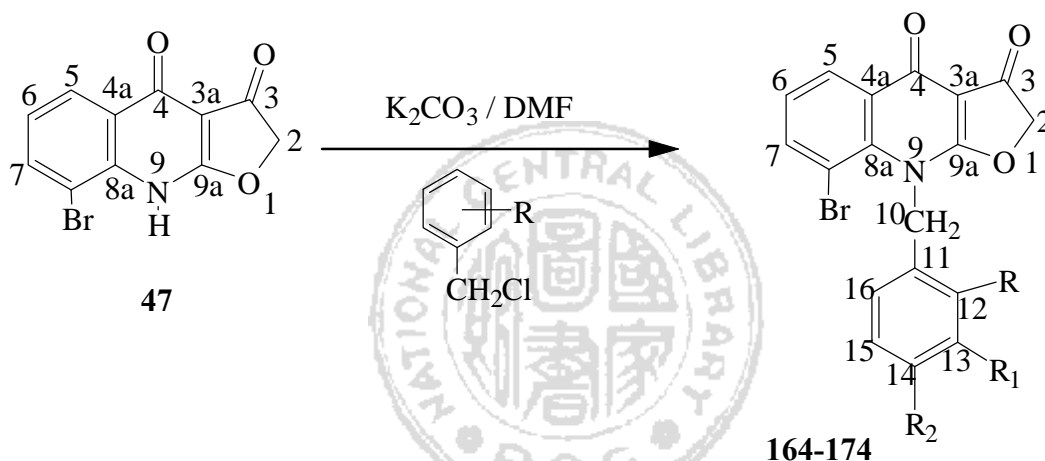


(十二) *N*-Substituted benzyl-8-bromo-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3-*b*]quinolin-3,4-dione 類化合物 (164-174) 之合成

取化合物 47 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，而得化合物 164-174。(如 Scheme 12 所示)

Scheme 12



164 $R=R_1=R_2=H$

165 $R=F, R_1=R_2=H$

166 $R_1=F, R=R_2=H$

167 $R_2=F, R=R_1=H$

168 $R=CH_3, R_1=R_2=H$

169 $R_1=CH_3, R=R_2=H$

170 $R_2=CH_3, R=R_1=H$

171 $R_1=OCH_3, R=R_2=H$

172 $R=Cl, R_1=R_2=H$

173 $R_1=Cl, R=R_2=H$

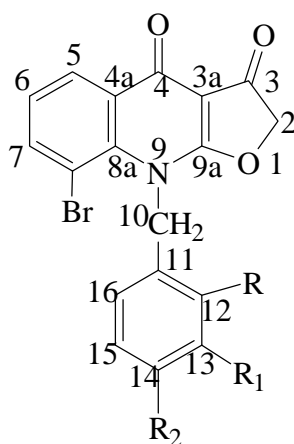
174 $R_2=Cl, R=R_1=H$

在此僅以化合物 170 的圖譜為例說明之：

化合物 170 的熔點為 202-204；其質譜(MS)之分子離子峰(M^+)為 382.8, ($M+2$)⁺ 384.8; 其 IR 光譜分別於 1729.4 cm^{-1} 及 1637.3 cm^{-1} 顯示 2 個羰基的吸收; 另由 1H -NMR 光譜顯示: 2.21 (3H, s, C_{14} - CH_3); 4.86 (2H, s, H-2); 5.82 (2H, s, H-10); 7.05 (4H, d, Ar-H); 7.31 (1H, dd, $J=7.8\text{ Hz}$, H-6); 7.97 (1H, dd, $J=8.8, 1.6\text{ Hz}$, H-7); 8.21 (1H, dd, $J=7.8, 1.6\text{ Hz}$, H-5)。而 ^{13}C -NMR 光譜顯示: 20.84 為 C_{14} - CH_3 之信號; 50.91 為 C-10 之信號; 76.32 為 C-2 之信號; 178.35 為 C-4 之信號; 191.34 為 C-3 之信號。綜合以上之圖譜顯示化合物

N-*p*-methylbenzyl-8-bromo-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3-*b*]quinolin-3,4-dione (170) 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 11 所示。

Table 11 化合物 154-163 的氫質譜數據



No.	R	R ₁	R ₂	H-2	H-5	H-10
164	H	H	H	4.86(s)	8.21(dd)	5.86(s)
165	F	H	H	4.86(s)	8.23(dd)	5.81(s)
166	H	F	H	4.85(s)	8.26(dd)	5.83(s)
167	H	H	F	4.86(s)	8.23(dd)	5.83(s)
168	CH ₃	H	H	4.82(s)	8.28(dd)	5.70(s)
169	H	CH ₃	H	4.86(s)	8.24(dd)	5.83(s)
170	H	H	CH ₃	4.86(s)	8.21(dd)	5.82(s)
171	H	OCH ₃	H	4.88(s)	8.25(dd)	5.84(s)
172	Cl	H	H	4.82(s)	8.27(dd)	5.70(s)
173	H	Cl	H	4.86(s)	8.27(dd)	5.82(s)
174	H	H	Cl	4.85(s)	8.23(dd)	5.81(s)

*化合物之溶媒為DMSO-*d*₆。

表七. 為氮-取代 基-6(7 或 8)-溴基-2,3,4,9-四氫 喃并 [2,3-b] 3,4-雙酮類之物理性質數據

Comp.	Yield(%)	MP(°C)	UV $\lambda_{\text{MeOH}}^{\text{max}}$ nm(log ϵ)	IR(cm ⁻¹)
1	58.14	173-175	280(4.72)	3170(NH) 1663.6(C ₃ =O),1617.6(C ₄ =O)
2	63.58	>300	320(3.87)	1722.9(C ₃ =O),1617.6(C ₄ =O)
3	61.79	258-261	320(3.98)	1729.4(C ₃ =O),1617.6(C ₄ =O)
4	56.07	244-245	319.8(3.86)	1736.0(C ₃ =O),1604.4(C ₄ =O)
5	58.40	258-261	224.6(4.25)	1722.9(C ₃ =O),1611.0(C ₄ =O)
6	66.93	265-268	320(4.16)	1729.4(C ₃ =O),1604.4(C ₄ =O)
7	56.14	>300	320(4.09)	1729.4(C ₃ =O),1611.0(C ₄ =O)
8	64.75	183-185	319.6(4.05)	1716.3(C ₃ =O),1611.0(C ₄ =O)
9	69.19	264-266	320(4.04)	1722.9(C ₃ =O),1611.0(C ₄ =O)
10	49.37	215-220	320(3.97)	1716.3(C ₃ =O),1611.0(C ₄ =O)
11	63.52	212-215	320(3.79)	1729.4(C ₃ =O),1617.6(C ₄ =O)
12	65.51	251-253	318.8(4.10)	1722.9(C ₃ =O),1611.0(C ₄ =O)
13	54.55	160-163	277.6(4.74)	3164.2(NH) 1670(C ₃ =O),1624.1(C ₄ =O)
14	61.09	>300	248.4(4.81)	1709.7(C ₃ =O),1624.1(C ₄ =O)
15	60.70	249-251	252(4.85)	1722.9(C ₃ =O),1604.4(C ₄ =O)
16	53.23	220-222	251.8(4.81)	1729.4(C ₃ =O),1611.0(C ₄ =O)
17	55.30	207-210	309.6(4.03)	1722.9(C ₃ =O),1630.7(C ₄ =O)
18	69.25	169-172	252.4(4.47)	1729.4(C ₃ =O),1630.7(C ₄ =O)
19	54.31	184-186	247.8(4.98)	1722.9(C ₃ =O),1637.3(C ₄ =O)
20	63.19	242-239	251.4(4.96)	1716.3(C ₃ =O),1617.6(C ₄ =O)

*化合物之溶媒為DMSO-*d*₆。

Comp.	Yield(%)	MP(°C)	UV $\lambda_{\text{max}}^{\text{MeOH}}$ nm(log ϵ)	IR(cm ⁻¹)
21	67.36	236-239	257.2(4.98)	1716.3(C ₃ =O),1617.6(C ₄ =O)
22	46.62	259-261	252(5.00)	1736.0(C ₃ =O),1611.0(C ₄ =O)
23	51.38	230-232	310.2(4.11)	1722.9(C ₃ =O),1630.7(C ₄ =O)
24	65.51	250-253	251.6(4.80)	1729.4(C ₃ =O),1611.0(C ₄ =O)
25	71.22	212-215	310.4(4.05)	1736.0(C ₃ =O),1611.0(C ₄ =O)
26	51.28	133-134	278.8(4.40)	3137.8(NH) 1768.9(C ₃ =O),1676.8(C ₄ =O)
27	62.65	>300	251.8(4.60)	1716.3(C ₃ =O),1630.7(C ₄ =O)
28	57.72	208-210	204.6(4.91)	1722.9(C ₃ =O),1637.3(C ₄ =O)
29	52.45	244-247	250.6(4.36)	1729.4(C ₃ =O),1650.5(C ₄ =O)
30	54.01	232-234	202.8(4.91)	1722.9(C ₃ =O),1637.3(C ₄ =O)
31	66.41	226-228	315.4(3.86)	1722.9(C ₃ =O),1637.3(C ₄ =O)
32	48.83	227-230	317(4.20)	1729.4(C ₃ =O),1637.3(C ₄ =O)
33	52.48	241-244	204.6(4.94)	1709.7(C ₃ =O),1643.9(C ₄ =O)
34	54.31	202-204	204.4(4.70)	1729.4(C ₃ =O),1637.3(C ₄ =O)
35	43.61	245-247	221.4(4.74)	1722.9(C ₃ =O),1643.9(C ₄ =O)
36	53.10	250-252	220.2(4.66)	1716.3(C ₃ =O),1630.7(C ₄ =O)
37	54.84	278-280	204.6(4.96)	1722.9(C ₃ =O),1643.9(C ₄ =O)
38	58.06	224-226	222.2(4.80)	1736(C ₃ =O),1650.5(C ₄ =O)