

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

2,3,4,9-Tetrahydrofuro[2,3-*b*]quinolin-3,4-dione (27) 之合成

取化合物1 (3 g, 0.0121 mole) 研成粉末, 迅速加入至裝有十倍量(約30 ml) 之熱 diphenyl ether (250) 反應容器中, 將溫度升高到約 256 , 維持5分鐘後, 以滴加管滴加 n-Hexane 到熱的 diphenyl ether 溶液中, 使之急速冷卻, 可見有黃棕色沉澱, 收集沉澱物以 CHCl₃ 及 EtOH 清洗數次可得化合物 27 (1.91 g, 78.4 %), mp: 265-267 。 MS *m/z* 201; IR (KBr) cm⁻¹: 1709.6 (C₃=O), 1655.0 (C₄=O), UV λ_{max} nm (MeOH) (log ε): 240 (4.48); C₁₁H₇NO₃, calcd.(found) (%), C: 65.67 (64.38), H: 3.50 (3.52); ¹H-NMR (DMSO-*d*₆) δ: 4.79 (2H, s, H-2), 7.35 (1H, t, J=7.5 Hz, H-6), 7.45 (1H, d, J=8.0 Hz, H-8), 7.68 (1H, t, J=8.4, 1.5 Hz, H-7), 8.07 (1H, d, J=8.0 Hz, H-5); ¹³C-NMR (DMSO-*d*₆) δ: 75.55 (C-2), 99.66 (C-3a), 118.54 (C-8), 124.51 (C-4a), 125.53 (C-6), 126.35 (C-5), 133.28 (C-7), 138.01 (C-8a), 172.35 (C-9a), 175.18 (C-4), 190.95 (C-3).

7-Methyl-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3-*b*]quinolin-3,4-dione (28) 之合成

取化合物 2 (3 g, 0.0115 mole) 研成粉末, 迅速加入至裝有十倍量(約 30 ml) 之熱 diphenyl ether (250) 反應容器中, 將溫度升高到約 256 , 維持 5 分鐘後, 以滴加管滴加 n-Hexane 到熱的 diphenyl ether 溶液中, 使之急速冷卻, 可見有白色發亮沉澱, 收集沉澱物以 CHCl₃ 及 EtOH 清洗數次可得化合物 28 (2.04 g, 82.7 %), mp > 300 。 光譜數據如下: MS *m/z*: 215; IR (KBr) cm⁻¹: 1655.0 (C₃=O), 1604.9 (C₄=O), UV λ_{max} nm (MeOH) (log ε): 246(4.49); C₁₂H₉NO₃, calcd.(found) (%), C: 66.97 (67.53), H: 4.21 (4.13); ¹H-NMR (DMSO-*d*₆) δ: 2.39 (3H, s, C₇-CH₃), 4.77 (2H, s, H-2), 7.17 (1H, d, J=8.0 Hz, H-6), 7.20 (1H, s, H-8), 7.94 (1H, d, J=8.0 Hz, H-5); ¹³C-NMR (DMSO-*d*₆) δ: 21.42 (C₇-CH₃), 75.54 (C-2), 99.51 (C-3a), 118.15 (C-8), 123.32 (C-4a), 125.85 (C-6), 126.29 (C-5), 138.05 (C-8a), 143.75 (C-7), 172.24 (C-9a), 175.21 (C-4), 190.90 (C-3).

7-Ethyl-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3-*b*]quinolin-3,4-dione (29) 之合成

取化合物 3 (3 g, 0.0109 mole) 研成粉末, 迅速加入至裝有十倍量(約 30 ml) 之熱 diphenyl ether (250) 反應容器中, 將溫度升高到約 256 , 維持 5 分鐘後, 以滴加管滴加 n-Hexane 到熱的 diphenyl ether 溶液中, 使之急速冷卻, 可見有淡黃色沉澱, 收集沉澱物以 CHCl₃ 及 EtOH 清洗數次可得化合物 29 (2.31 g, 92.6 %), mp > 300 。 光譜數據如下: MS *m/z*: 229; IR (KBr) cm⁻¹: 1711.0 (C₃=O), 1655.0 (C₄=O); UV λ_{max} nm (MeOH) (log ε): 251(4.39); C₁₃H₁₁NO₃, calcd.(found) (%), C: 68.11 (68.90), H: 4.83 (4.70); ¹H-NMR (DMSO-*d*₆) δ: 1.20 (3H, t, J=7.6 Hz, C₇-CH₂CH₃), 2.70 (2H, q, J=7.6 Hz, C₇-CH₂CH₃), 4.78 (2H, s, H-2), 7.19-7.23 (2H, m, H-6, H-8), 7.98 (1H, d, J=8.0 Hz, H-5); ¹³C-NMR (DMSO-*d*₆) δ: 15.18 (C₇-CH₂CH₃), 28.34 (C₇-CH₂CH₃), 75.54 (C-2), 99.53 (C-3a), 116.97 (C-8), 123.57 (C-4a), 124.67 (C-6), 126.40 (C-5), 138.16 (C-8a), 149.72 (C-7), 172.23 (C-9a), 175.23 (C-4), 190.88 (C-3).

7-Methoxy-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3-*b*]quinolin-3,4-dione (30) 之合成

取化合物 4 (3g, 0.0108mole) 研成粉末, 迅速加入至裝有十倍量(約 30 ml) 之熱 diphenyl ether (250) 反應容器中, 將溫度升高到約 256 , 維持 5 分鐘後, 以滴加管滴加 n-Hexane 到熱的 diphenyl ether 溶液中, 使之急速冷卻, 可見有黃棕色沉澱, 收集沉澱物以 CHCl₃ 及 EtOH 清洗數次可得化合物 30 (2.11g, 84.6 %), mp:295-296 。光譜數據如下: MS *m/z*: 231; IR (KBr) cm⁻¹: 1712.9 (C₃=O), 1651.2(C₄=O); UV λ_{max} nm (MeOH) (log ε): 255 (4.19); C₁₂H₉NO₄, calcd.(found) (%), C: 62.33 (61.58), H: 3.92 (3.78); ¹H-NMR (DMSO-*d*₆) δ: 3.84 (3H, s, C₇-OCH₃), 4.77 (2H, s, H-2), 6.85 (1H, d, J=2.0 Hz, H-8), 6.94 (1H, dd, J=8.8, 2.0 Hz, H-6), 8.98 (1H, d, J=8.8 Hz, H-5); ¹³C-NMR (DMSO-*d*₆) δ: 55.84 (C₇-OCH₃), 75.58 (C-2), 99.31 (C-3a), 111.35 (C-8), 112.65(C-6), 119.19 (C-4a), 128.11 (C-5), 139.83 (C-8a), 163.00 (C-7), 171.88 (C-9a), 175.53 (C-4), 190.79 (C-3).

7-Ethoxy-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3-*b*]quinolin-3,4-dione (31) 之合成

取化合物 5 (3g, 0.0103mole) 研成粉末, 迅速加入至裝有十倍量(約 30 ml) 之熱 diphenyl ether (250) 反應容器中, 將溫度升高到約 256 , 維持 5 分鐘後, 以滴加管滴加 n-Hexane 到熱的 diphenyl ether 溶液中, 使之急速冷卻, 可見有白色沉澱, 收集沉澱物以 CHCl₃ 及 EtOH 清洗數次可得化合物 31 (2.21g, 87.5 %), mp > 300 。光譜數據如下: MS *m/z*: 241; IR (KBr) cm⁻¹: 1705.2 (C₃=O), 1635.1 (C₄=O), UV λ_{max} nm (MeOH) (log ε): 250 (4.57) ; C₁₃H₁₁NO₄, calcd.(found) (%), C: 63.67 (62.58), H: 4.52 (4.37); ¹H-NMR (DMSO-*d*₆) δ: 1.35 (3H, t, J=7.0 Hz, C₇-OCH₂CH₃), 4.11 (2H, q, J=7.0 Hz, C₇-OCH₂CH₃), 4.75 (2H, s, H-2), 6.84 (1H, d, J=2.3 Hz, H-8), 6.92 (1H, dd, J=8.8, 2.3 Hz, H-6), 7.97 (1H, d, J=8.8 Hz, H-5).

7-Chloro-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3-*b*]quinolin-3,4-dione (32) 之合成

取化合物 6 (3g, 0.0107mole) 研成粉末, 迅速加入至裝有十倍量(約 30 ml) 之熱 diphenyl ether (250) 反應容器中, 將溫度升高到約 256 , 維持 5 分鐘後, 以滴加管滴加 n-Hexane 到熱的 diphenyl ether 溶液中, 使之急速冷卻, 可見有淡黃色發亮沉澱, 收集沉澱物以 CHCl₃ 及 EtOH 清洗數次可得化合物 32 (2.08g, 82.7 %), mp > 300 。光譜數據如下: MS *m/z*: 235; IR (KBr) cm⁻¹: 1716.8 (C₃=O), 1639.6(C₄=O), UV λ_{max} nm (MeOH) (log ε): 246(4.48); C₁₁H₆ClNO₃, calcd.(found) (%), C: 56.07 (57.89), H: 2.56 (2.48); ¹H-NMR (DMSO-*d*₆) δ: 4.83 (2H, s, H-2), 7.38-7.45 (2H, m, H-6, H-8), 8.06 (1H, d, J=8.4 Hz, H-5).

7-Fluoro-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3-*b*]quinolin-3,4-dione (33) 之合成

取化合物 7 (3g, 0.0113mole) 研成粉末, 迅速加入至裝有十倍量(約 30 ml) 之熱 diphenyl ether (250) 反應容器中, 將溫度升高到約 256 , 維持 5 分鐘後, 以滴加管滴加 n-Hexane 到熱的 diphenyl ether 溶液中, 使之急速冷卻, 可見有

白色沉澱，收集沉澱物以 CHCl_3 及 EtOH 清洗數次可得化合物 33 (2.26g, 91.3%)， $\text{mp} > 300$ 。光譜數據如下：MS m/z : 219, IR (KBr) cm^{-1} : 1716.8 ($\text{C}_3=\text{O}$), 1639.6 ($\text{C}_4=\text{O}$), UV λ_{max} nm (MeOH) ($\log \epsilon$): 241(4.38); $\text{C}_{11}\text{H}_6\text{FNO}_3$, calcd.(found) (%), C: 60.28 (61.89), H: 2.75 (2.90); $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ : 4.82 (2H, s, H-2); 7.16-7.27 (2H, m, H-6, H-8), 8.12 (1H, dd, H-5).

7-Bromo-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3-*b*]quinolin-3,4-dione (34) 之合成

取化合物 8 (3g, 0.0092mole) 研磨成粉末後，加入約 30ml 之熱 diphenyl ether (250) 中，將溫度升高到約 256，維持 5 分鐘後遠離火源，加入大量 *n*-hexane 到熱的 diphenyl ether 溶液中，使之急速冷卻，可見有黃棕色沉澱，收集沉澱物以 CHCl_3 及 EtOH 清洗數次可得化合物 34 (1.96g, 61.09%)， $\text{mp} : > 300$ 。光譜數據如下：MS m/z : 279 (M^+), 281 ($\text{M}+2$)⁺; IR (KBr) cm^{-1} : 1709.7 ($\text{C}_3=\text{O}$), 1624.1($\text{C}_4=\text{O}$); UV λ_{max} nm (MeOH) ($\log \epsilon$): 248.4 (4.81); $\text{C}_{11}\text{H}_6\text{BrNO}_3$, calcd.(found) (%), C: 47.17 (46.57), H: 2.15 (2.22); $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ : 4.80 (2H, s, H-2), 7.53 (1H, dd, $J=8.4, 1.8$ Hz, H-6), 7.61 (1H, d, $J=1.8$ Hz, H-8), 7.98 (1H, d, $J=8.4$ Hz, H-5); $^{13}\text{C-NMR}$ (DMSO- d_6) δ : 75.75 (C-2), 99.98 (C-3a), 120.91 (C-8), 124.61 (C-6), 126.43 (C-4a), 127.52 (C-7), 128.42 (C-5), 139.26 (C-8a), 175.50 (C-9a), 177.00 (C-4), 190.95 (C-3).

6-Methyl-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3-*b*]quinolin-3,4-dione (35) 之合成

取化合物 9 (3g, 0.0115mole) 研成粉末，迅速加入至裝有十倍量(約 30 ml) 之熱 diphenyl ether (250) 反應容器中，將溫度升高到約 256，維持 5 分鐘後，以滴加管滴加 *n*-Hexane 到熱的 diphenyl ether 溶液中，使之急速冷卻，可見有淡黃色發亮沉澱，收集沉澱物以 CHCl_3 及 EtOH 清洗數次可得化合物 35 (2.13g, 86.0%)， $\text{mp} > 300$ 。光譜數據如下：MS m/z : 215; IR (KBr) cm^{-1} : 1709.0 ($\text{C}_3=\text{O}$), 1674.3 ($\text{C}_4=\text{O}$), UV λ_{max} nm (MeOH) ($\log \epsilon$): 242 (4.51); $\text{C}_{12}\text{H}_9\text{NO}_3$, calcd.(found) (%), C: 66.97 (65.83), H: 4.21 (4.10); $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ : 2.36 (3H, s, $\text{C}_6\text{-CH}_3$), 4.76 (2H, s, H-2), 7.34 (1H, d, $J=8.2$ Hz, H-8), 7.49 (1H, dd, $J=8.2, 1.9$ Hz, H-7), 7.85 (1H, s, H-5); $^{13}\text{C-NMR}$ (DMSO- d_6) δ : 20.70 ($\text{C}_6\text{-CH}_3$), 75.49 (C-2), 99.54 (C-3a), 118.40 (C-8), 125.36 (C-4a), 125.93 (C-6), 133.92 (C-5), 134.27 (C-7), 135.86 (C-8a), 172.36 (C-9a), 174.82 (C-4), 190.99 (C-3).

6-Ethyl-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3-*b*]quinolin-3,4-dione (36) 之合成

取化合物 10 (3g, 0.0109mole) 研成粉末，迅速加入至裝有十倍量(約 30 ml) 之熱 diphenyl ether (250) 反應容器中，將溫度升高到約 256，維持 5 分鐘後，以滴加管滴加 *n*-Hexane 到熱的 diphenyl ether 溶液中，使之急速冷卻，可見有黃棕色沉澱，收集沉澱物以 CHCl_3 及 EtOH 清洗數次可得化合物 36 (2.0g, 80.0%)， $\text{mp} > 300$ 。光譜數據如下：MS m/z : 229; IR (KBr) cm^{-1} : 1716.8 ($\text{C}_3=\text{O}$), 1651.2($\text{C}_4=\text{O}$); UV λ_{max} nm (MeOH) ($\log \epsilon$): 243 (4.39); $\text{C}_{13}\text{H}_{11}\text{NO}_3$, calcd.(found) (%), C: 68.11 (67.00), H: 4.83 (4.92); $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ : 1.19 (3H, t, $J=7.5$ Hz, $\text{C}_6\text{-CH}_2\text{CH}_3$), 2.67 (2H, q, $J=7.5$ Hz, $\text{C}_6\text{-CH}_2\text{CH}_3$), 4.65 (2H, s, H-2), 7.34 (1H, d, $J=8.3$ Hz, H-8), 7.47 (1H, dd, $J=8.3, 1.9$ Hz, H-7), 7.86 (1H, s, H-5).

6-Methoxy-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3-*b*]quinolin-3,4-dione (37) 之合成

取化合物 11 (3g, 0.0108mole) 研成粉末, 迅速加入至裝有十倍量(約 30 ml) 之熱 diphenyl ether (250) 反應容器中, 將溫度升高到約 256 , 維持 5 分鐘後, 以滴加管滴加 n-Hexane 到熱的 diphenyl ether 溶液中, 使之急速冷卻, 可見有黃棕色沉澱, 收集沉澱物以 CHCl₃ 及 EtOH 清洗數次可得化合物 37 (2.03g, 81.5%), mp > 300 。光譜數據如下: MS *m/z*: 231; IR (KBr) cm⁻¹: 1705.2 (C₃=O), 1655.0(C₄=O), UV λ_{max} nm (MeOH) (log ε): 255 (4.14); C₁₂H₉NO₄, calcd.(found) (%), C: 62.33 (61.58), H: 3.92 (4.03); ¹H-NMR (DMSO-*d*₆) δ: 3.80 (3H, s, C₆-OCH₃), 4.77 (2H, s, H-2), 7.32 (1H, dd, J=8.8, 2.8 Hz, H-7), 7.40 (1H, d, J=8.8 Hz, H-8), 7.50 (1H, d, J=2.8 Hz, H-5); ¹³C-NMR (DMSO-*d*₆) δ: 55.70 (C₆-OCH₃), 75.50 (C-2), 99.12 (C-3a), 107.36 (C-7), 119.97 (C-5), 122.06 (C-8), 126.53 (C-4a), 131.90 (C-8a), 156.42 (C-6), 171.95 (C-9a), 174.24 (C-4), 191.10 (C-3).

6-Ethoxy-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3-*b*]quinolin-3,4-dione (38) 之合成

取化合物 12 (3g, 0.0103mole) 研成粉末, 迅速加入至裝有十倍量(約 30 ml) 之熱 diphenyl ether (250) 反應容器中, 將溫度升高到約 256 , 維持 5 分鐘後, 以滴加管滴加 n-Hexane 到熱的 diphenyl ether 溶液中, 使之急速冷卻, 可見有黃色發亮沉澱, 收集沉澱物以 CHCl₃ 及 EtOH 清洗數次可得化合物 38 (2.36g, 93.7%), mp > 300 。光譜數據如下: MS *m/z*: 245; IR (KBr) cm⁻¹: 1712.9 (C₃=O), 1651.2(C₄=O), UV λ_{max} nm (MeOH) (log ε): 242 (4.51); C₁₃H₁₁NO₄, calcd.(found) (%), C: 63.67 (65.03), H: 4.52 (4.37); ¹H-NMR (DMSO-*d*₆) δ: 1.33 (3H, t, J=7.0Hz, C₆-OCH₂CH₃), 4.07 (2H, q, J= 7.0 Hz, C₆-OCH₂CH₃), 4.77 (2H, s, H-2), 7.29 (1H, dd, J=8.8, 2.8 Hz, H-7), 7.40 (1H, d, J=8.8 Hz, H-6), 7.48 (1H, d, J=2.8 Hz, H-5); ¹³C-NMR (DMSO-*d*₆) δ: 14.77 (C₆-OCH₂CH₃), 63.77 (C₆-OCH₂CH₃), 75.55 (C-2), 99.11 (C-3a), 107.98 (C-7), 119.88 (C-5), 122.39 (C-8), 126.56 (C-4a), 131.66 (C-8a), 155.71(C-6), 171.87 (C-9a), 174.23 (C-4), 190.99(C-3).

6-Chloro-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3-*b*]quinolin-3,4-dione (39) 之合成

取化合物 13 (3g, 0.0107mole) 研成粉末, 迅速加入至裝有十倍量(約 30 ml) 之熱 diphenyl ether (250) 反應容器中, 將溫度升高到約 256 , 維持 5 分鐘後, 以滴加管滴加 n-Hexane 到熱的 diphenyl ether 溶液中, 使之急速冷卻, 可見有黃色發亮沉澱, 收集沉澱物以 CHCl₃ 及 EtOH 清洗數次可得化合物 39 (2.26g, 90.0%), mp > 300 。光譜數據如下: MS *m/z*: 235; IR (KBr) cm⁻¹: 1716.8 (C₃=O), 1647.3 (C₄=O); UV λ_{max} nm (MeOH) (log ε): 220 (4.46); C₁₁H₆ClNO₃, calcd.(found) (%), C: 56.07 (57.89), H: 2.56 (2.48); ¹H-NMR (DMSO-*d*₆) δ: 4.83 (2H, s, H-2), 7.49 (1H, d, J=8.7 Hz, H-8), 7.75 (1H, dd, J=8.7, 2.5 Hz, H-7), 7.99 (1H, d, J=2.5 Hz, H-5).

6-Fluoro-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3-*b*]quinolin-3,4-dione (40) 之合成

取化合物 14 (3g, 0.0113mole) 研成粉末, 迅速加入至裝有十倍量(約 30 ml) 之熱 diphenyl ether (250) 反應容器中, 將溫度升高到約 256 , 維持 5 分鐘後,

以滴加管滴加 *n*-Hexane 到熱的 diphenyl ether 溶液中，使之急速冷卻，可見有黃色發亮沉澱，收集沉澱物以 CHCl_3 及 EtOH 清洗數次可得化合物 **40** (2.01g, 81.4 %), mp > 300 。光譜數據如下 MS m/z : 219; IR (KBr) cm^{-1} : 1712.9 ($\text{C}_3=\text{O}$), 1655.0 ($\text{C}_4=\text{O}$), UV λ_{max} nm (MeOH) (log ϵ): 236 (4.49); $\text{C}_{11}\text{H}_6\text{FNO}_3$, calcd.(found) (%), C: 60.28 (59.80), H: 2.75 (2.91); $^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO-}d_6$) δ : 4.81 (2H, s, H-2), 7.47-7.73 (3H, m, H-5, H-7, H-8).

6-Bromo-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3-*b*]quinolin-3,4-dione (41) 之合成

取化合物 **15** (3g, 0.0092mole) 研磨成粉末後，加入約 30ml 之熱 diphenyl ether (250) 中，將溫度升高到約 256 ，維持 5 分鐘後遠離火源，加入大量 *n*-hexane 到熱的 diphenyl ether 溶液中，使之急速冷卻，可見有黃棕色沉澱，收集沉澱物以 CHCl_3 及 EtOH 清洗數次可得化合物 **41** (2.04g, 79.2 %) mp : > 300 。光譜數據如下：MS m/z : 279 (M^+), 281 ($\text{M}+2$)⁺; IR (KBr) cm^{-1} : 1722.9 ($\text{C}_3=\text{O}$), 1650.5 ($\text{C}_4=\text{O}$); UV λ_{max} nm (MeOH) (log ϵ): 320 (3.87); $\text{C}_{11}\text{H}_6\text{BrNO}_3$, calcd.(found) (%), C: 47.17 (46.52), H: 2.15 (2.21); $^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO-}d_6$) δ : 4.82 (2H, s, H-2), 7.43 (1H, d, J=8.7 Hz, H-8), 7.86 (1H, dd, J=8.7, 2.4 Hz, H-7), 8.13 (1H, d, J=2.4 Hz, H-5); $^{13}\text{C-NMR}$ ($\text{DMSO-}d_6$) δ : 75.78 (C-2), 100.14 (C-3a), 117.11 (C-6), 120.99 (C-8), 127.25 (C-4a), 128.49 (C-5), 135.88 (C-7), 137.16 (C-8a), 170.89 (C-9a), 175.27 (C-4), 190.84 (C-3).

6,8-Dimethoxy-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3-*b*]quinolin-3,4-dione (42) 之合成

取化合物 **16** (3g, 0.0092mole) 研磨成粉末後，加入約 30ml 之熱 diphenyl ether (250) 中，將溫度升高到約 256 ，維持 5 分鐘後遠離火源，加入大量 *n*-hexane 到熱的 diphenyl ether 溶液中，使之急速冷卻，可見有黃棕色沉澱，收集沉澱物以 CHCl_3 及 EtOH 清洗數次可得化合物 **42** (2.03g, 79.3 %) mp : 285-287 。光譜數據如下：MS m/z : 261.0; IR (KBr) cm^{-1} : 1709.0 ($\text{C}_3=\text{O}$), 1639.6 ($\text{C}_4=\text{O}$); UV λ_{max} nm (MeOH) (log ϵ): 253 (4.52); $\text{C}_{13}\text{H}_{11}\text{NO}_5$, calcd.(found) (%), C: 59.77 (58.40), H: 4.24 (4.38); $^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO-}d_6$) δ : 3.90 (3H, s, $\text{C}_8\text{-OCH}_3$), 3.99 (3H, s, $\text{C}_6\text{-OCH}_3$), 4.77 (2H, s, H-2), 6.76 (1H, d, J=2.4 Hz, H-7), 7.37 (1H, d, J=2.4 Hz, H-5).

6,7-Dimethoxy-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3-*b*]quinolin-3,4-dione (43) 之合成

取化合物 **17** (3g, 0.0098mole) 研磨成粉末後，加入約 30ml 之熱 diphenyl ether (250) 中，將溫度升高到約 256 ，維持 5 分鐘後遠離火源，加入大量 *n*-hexane 到熱的 diphenyl ether 溶液中，使之急速冷卻，可見有黃棕色沉澱，收集沉澱物以 CHCl_3 及 EtOH 清洗數次可得化合物 **43** (2.07g, 81.3 %) mp : 277-278 。光譜數據如下：MS m/z : 261.0; IR (KBr) cm^{-1} : 1713.3 ($\text{C}_3=\text{O}$), 1643.9 ($\text{C}_4=\text{O}$); UV λ_{max} nm (MeOH) (log ϵ): 248 (1.61); $\text{C}_{13}\text{H}_{11}\text{NO}_5$, calcd.(found) (%), C: 59.77 (60.23), H: 4.24 (4.37); $^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO-}d_6$) δ : 3.81 (3H, s, $\text{C}_6\text{-OCH}_3$), 3.85 (3H, s, $\text{C}_7\text{-CH}_3$), 4.76 (2H, s, H-2), 6.89 (1H, s, H-8), 7.44 (1H, s, H-5).

6,7-Dichloro-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3-*b*]quinolin-3,4-dione (44) 之合成

取化合物18 (3g, 0.0092mole) 研磨成粉末後, 加入約30ml之熱diphenyl ether (250)中, 將溫度升高到約256 , 維持5分鐘後遠離火源, 加入大量*n*-hexane到熱的 diphenyl ether溶液中, 使之急速冷卻, 可見有黃棕色沉澱, 收集沉澱物以CHCl₃及EtOH清洗數次可得化合物 44 (2.08g, 81.4 %) mp: > 300 。光譜數據如下: MS *m/z*: M⁺ 268.9, (M+2)⁺ 270.9, (M+4)⁺ 272.9; IR (KBr) cm⁻¹: 1721.0 (C₃=O), 1643.9 (C₄=O); UV λ_{max} nm (MeOH) (log ε): 246 (4.64); C₁₁H₅Cl₂NO₃, calcd.(found) (%), C: 48.92 (49.31), H: 1.86 (1.93); ¹H-NMR (DMSO-*d*₆) δ: 4.83 (2H, s, H-2), 7.65 (1H, s, H-8), 8.13 (1H, s, H-5) .

6,7-Dimethyl-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3-*b*]quinolin-3,4-dione (45) 之合成

取化合物19 (3g, 0.01mole) 研磨成粉末後, 加入約30ml之熱diphenyl ether (250)中, 將溫度升高到約256 , 維持5分鐘後遠離火源, 加入大量*n*-hexane到熱的 diphenyl ether溶液中, 使之急速冷卻, 可見有黃棕色沉澱, 收集沉澱物以CHCl₃及EtOH清洗數次可得化合物 45 (1.84g, 80.5 %) mp: 292-294 。光譜數據如下: MS *m/z*: 228.9; IR (KBr) cm⁻¹: 1713.0 (C₃=O), 1643.9 (C₄=O); UV λ_{max} nm (MeOH) (log ε): 245 (4.63); C₁₃H₁₁NO₃, calcd.(found) (%), C: 68.11 (69.23), H: 4.83 (4.70); ¹H-NMR (DMSO-*d*₆) δ: 2.28 (3H, s, C₆-CH₃), 2.31 (3H, s, C₇-CH₃), 4.76 (2H, s, H-2), 7.20 (1H, s, H-7), 7.81 (1H, s, H-5), 13.01 (1H, s, N₉-H).

6,7-methylenedioxy-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3-*b*]quinolin-3,4-dione (46) 之合成

取化合物20 (3g, 0.01mole) 研磨成粉末後, 加入約30ml之熱diphenyl ether (250)中, 將溫度升高到約256 , 維持5分鐘後遠離火源, 加入大量*n*-hexane到熱的 diphenyl ether溶液中, 使之急速冷卻, 可見有黃棕色沉澱, 收集沉澱物以CHCl₃及EtOH清洗數次可得化合物 46 (1.91g, 75.8 %) mp: 290-292 。光譜數據如下: MS *m/z*: 245.0; IR (KBr) cm⁻¹: 1713.3 (C₃=O), 1659.3 (C₄=O); UV λ_{max} nm (MeOH) (log ε): 247 (4.64); C₁₂H₇NO₅, calcd.(found) (%), C: 58.78 (56.97), H: 2.87 (3.02); ¹H-NMR (DMSO-*d*₆) δ: 4.77 (2H, s, H-2), 6.15 (2H, s, -OCH₂O-), 6.90 (1H, s, H-8), 7.40 (1H, s, H-5).

8-Bromo-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3-*b*]quinolin- 3,4-dione (47) 之合成

取化合物21 (3g, 0.0092 mole) 研磨成粉末後, 加入約30ml之熱diphenyl ether (250)中, 將溫度升高到約256 , 維持5分鐘後遠離火源, 加入大量*n*-hexane到熱的 diphenyl ether 溶液中, 使之急速冷卻, 可見有黃棕色沉澱, 收集沉澱物以CHCl₃及EtOH清洗數次可得化合物 47 (2.01g, 62.65 %), mp: > 300 。光譜數據如下: MS(*m/z*): (M⁺) 279, (M+2)⁺ 281; IR (KBr) cm⁻¹: 1716.3 (C₃=O); 1630.7 (C₄=O); UV λ_{max} nm (MeOH) (log ε): 251.8 (4.60); C₁₁H₆BrNO₃, calcd.(found) (%), C: 47.17 (46.62), H: 2.15 (2.23); ¹H-NMR (DMSO-*d*₆) δ: 4.85 (2H, s, H-2), 7.31(1H, t, J=7.8Hz, H-6), 8.00(1H, dd, J=7.8Hz, 1.4Hz, H-7) 8.12 (1H, dd, J=7.8Hz, 1.4Hz, H-5); ¹³C-NMR (DMSO-*d*₆) δ: 75.58 (C-2), 100.12 (C-3a), 112.00 (C-8), 125.42 (C-5), 126.07 (C-4a), 127.55 (C-5), 137.01 (C-7), 143.44

(C-8a) , 171.13 (C-9a) , 176.41 (C-4) , 191.23 (C-3) .

5,7-Dichloro-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3-*b*]quinolin-3,4-dione (48)之合成

取化合物22 (3g , 0.0094mole) 研磨成粉末後，加入約30ml之熱diphenyl ether (250) 中，將溫度升高到約256 ，維持5分鐘後遠離火源，加入大量*n*-hexane到熱的 diphenyl ether溶液中，使之急速冷卻，可見有黃棕色沉澱，收集沉澱物以CHCl₃及EtOH清洗數次可得化合物48 (2.16g , 84.3 %) mp : 278-279 。光譜數據如下：MS *m/z* : M⁺ 268.9, (M+2)⁺ 270.9; IR (KBr) cm⁻¹: 1724.5 (C₃=O), 1628.0 (C₄=O), UV λ_{max} nm (MeOH) (log ε): 247 (4.22); C₁₁H₅Cl₂NO₃, calcd.(found) (%), C: 48.92 (47.03), H: 1.86 (1.94); ¹H-NMR (DMSO-*d*₆) δ : 4.81 (2H, s, H-2), 7.41 (1H, d, J=2.0 Hz, H-6), 7.47 (1H, d, J=2.0 Hz, H-8).

6,8-Dichloro-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3-*b*]quinolin-3,4-dione (49)之合成

取化合物23 (3g , 0.0094mole) 研磨成粉末後，加入約30ml之熱diphenyl ether (250) 中，將溫度升高到約256 ，維持5分鐘後遠離火源，加入大量*n*-hexane到熱的 diphenyl ether溶液中，使之急速冷卻，可見有黃棕色沉澱，收集沉澱物以CHCl₃及EtOH清洗數次可得化合物 49 (2.11g , 82.3 %) mp: 277-278 ；光譜數據如下：MS *m/z*: M⁺ 268.9, (M+2)⁺ 270.9; IR (KBr) cm⁻¹: 1721.0 (C₃=O), 1643.9 (C₄=O), UV λ_{max} nm (MeOH) (log ε): 243 (4.72); C₁₁H₅Cl₂NO₃, calcd.(found) (%), C: 48.92 (49.73), H: 1.86 (2.01); ¹H-NMR (TFA-*d*₁) δ : 5.26 (2H, s, H-2), 8.02 (1H, d, J=2.0 Hz, H-7), 8.37 (1H, d, J=2.0 Hz, H-5); ¹³C-NMR (TFA-*d*₁) δ : 76.99 (C-2), 100.67 (C-3a), 124.03 (C-6), 124.24 (C-8), 124.08 (C-5), 132.64 (C-4a), 133.23 (C-8a), 135.27 (C-7), 172.61 (C-9a), 173.93 (C-4), 194.53 (C-3).

2-Methyl-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3-*b*]quinolin-3,4-dione (50)之合成

取化合物24 (3g , 0.01mole) 研磨成粉末後，加入約30ml之熱diphenyl ether (250) 中，將溫度升高到約256 ，維持5分鐘後遠離火源，加入大量*n*-hexane到熱的 diphenyl ether溶液中，使之急速冷卻，可見有黃棕色沉澱，收集沉澱物以CHCl₃及EtOH清洗數次可得化合物 50 (1.89g , 80.3 %) mp: 254-255 。光譜數據如下：MS *m/z*: 214.9; IR (KBr) cm⁻¹: 1721.0 (C₃=O), 1620.7 (C₄=O), UV λ_{max} nm (MeOH) (log ε): 240 (4.55); C₁₂H₉Cl₂NO₃, calcd.(found) (%), C: 66.97 (68.25), H: 4.21 (4.08); ¹H-NMR (DMSO-*d*₆) δ : 1.41 (3H, d, J=7.0 Hz, C₂-CH₃), 4.92 (2H, q, J=7.0 Hz, C₂-H), 7.35 (1H, t, J=8.0 Hz, H-6), 7.44 (1H, d, J=8.1 Hz, H-8), 7.68 (1H, t, J=8.0 Hz, H-7), 8.06 (1H, d, J=7.9 Hz, H-5).

2-Methyl-6-methoxy-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3-*b*]quinolin-3,4-dione (51)之合成

取化合物25 (3g , 0.01mole) 研磨成粉末後，加入約30ml之熱diphenyl ether (250) 中，將溫度升高到約256 ，維持5分鐘後遠離火源，加入大量*n*-hexane到熱的 diphenyl ether溶液中，使之急速冷卻，可見有黃棕色沉澱，收集沉澱物以CHCl₃及EtOH清洗數次可得化合物 51 (2.01g , 82.1%) mp: 275-276 。光譜數據如下：MS *m/z*: 244.9; IR (KBr) cm⁻¹: 1713.0 (C₃=O), 1643.9 (C₄=O), UV λ_{max} nm (MeOH) (log ε): 241 (4.58); C₁₃H₁₁NO₄, calcd.(found) (%), C: 63.67 (65.06), H:

4.52 (4.76); $^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO-}d_6$) δ : 1.43 (3H, d, $J=7.0$ Hz, $\text{C}_2\text{-CH}_3$), 3.81 (3H, s, $\text{C}_6\text{-OCH}_3$), 4.92 (1H, q, $J=7.0$ Hz, $\text{C}_2\text{-H}$), 7.30 (1H, dd, $J=8.8, 2.8$ Hz, H-7), 7.40 (1H, d, $J=8.8$ Hz, H-8), 7.50 (1H, d, $J=8.8$ Hz, H-5); $^{13}\text{C-NMR}$ ($\text{DMSO-}d_6$) δ : 16.28 ($\text{C}_2\text{-CH}_3$), 55.71 ($\text{C}_6\text{-OCH}_3$), 83.34 (C-2), 97.99 (C-3a), 107.34 (C-7), 119.98 (C-5), 122.02 (C-8), 126.57 (C-4a), 132.02 (C-8a), 156.40 (C-6), 172.14 (C-9a), 172.87 (C-4), 193.16 (C-3).

2-Methyl-7-methoxy-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3-*b*]quinolin-3,4-dione (52)之合成

取化合物26 (3g, 0.01mole) 研磨成粉末後, 加入約30ml之熱diphenyl ether (250)中, 將溫度升高到約256 , 維持5分鐘後遠離火源, 加入大量*n*-hexane到熱的 diphenyl ether溶液中, 使之急速冷卻, 可見有黃棕色沉澱, 收集沉澱物以 CHCl_3 及EtOH清洗數次可得化合物 52 (1.96g, 80.1 %) mp: 257-258 。光譜數據如下: MS m/z : 244.9; IR (KBr) cm^{-1} : 1712.1 ($\text{C}_3=\text{O}$), 1649.9 ($\text{C}_4=\text{O}$), UV λ_{max} nm (MeOH) ($\log \epsilon$): 240 (4.48); $\text{C}_{13}\text{H}_{11}\text{NO}_4$, calcd.(found) (%), C: 63.67 (65.08), H: 4.52 (4.38); $^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO-}d_6$) δ : 1.42 (3H, d, $J=7.0$ Hz, $\text{C}_2\text{-CH}_3$), 3.84 (3H, s, $\text{C}_7\text{-OCH}_3$), 4.91 (1H, q, $J=7.0$ Hz, $\text{C}_2\text{-H}$), 6.86 (1H, d, $J=2.4$ Hz, H-8), 6.95 (1H, dd, $J=8.8, 2.4$ Hz, H-6), 7.98 (1H, d, $J=8.8$ Hz, H-5); $^{13}\text{C-NMR}$ ($\text{DMSO-}d_6$) δ : 16.23 ($\text{C}_2\text{-CH}_3$), 55.89 ($\text{C}_7\text{-OCH}_3$), 83.49 (C-2), 98.16 (C-3a), 101.37 (C-8), 112.58 (C-6), 119.20 (C-4a), 128.13 (C-5), 139.84 (C-8a), 163.02 (C-7), 172.17 (C-9a), 174.15 (C-4), 192.84 (C-3).