碘促进吡喃并[3,2-*c*]喹啉-4,5-二酮类衍生物的有效合成

周 婷 王道林* 钱建华 赵 伟

(渤海大学化学化工学院 辽宁省功能化合物合成与应用重点实验室 锦州 121003)

摘要 在超声波辅助及吡啶和聚乙二醇-400 的协同作用下, 通过 1-甲基-3-乙酰基-4-羟基-2-喹啉酮与芳香醛的 Aldol 缩合反应, 合成了 1-甲基-3-肉桂酰基-4-羟基-2-喹啉酮。该缩合产物在 I₂ 促进下, 经过分子内的环化反应, 成功制备了一系列吡喃并[3,2-*c*]喹啉-4,5-二酮衍生物。该方法具有反应操作简单、条件温和、收率良好的特点。

关键词 喹啉; 杂环; 超声波; 碘; 合成

Iodine Promoted Synthesis of Pyrano[3,2-*c*]quinoline-4,5-diones

Zhou, Ting Wang, Daolin* Qian, Jianhua Zhao, Wei

(Key Laboratory of Synthesis & Application of Functional Compound, College of Chemistry and Chemical Engineering, Bohai University, Jinzhou 121003)

Abstract An efficient method for the synthesis of pyrano[3,2-*c*]quinoline-4,5-dione derivatives via iodine promoted intramolecular cyclization of 1-methyl-3-cinnamoyl-4-hydroxyquinolin-2-one, synthesized from aldol condensation of 1-methyl-3-acetyl-4-hydroxyquinolin-2-one with aromatic aldehydes in the presence of pyridine and PEG-400 under ultrasound irradiation, has been described. This method offers the advantages of a green approach, easy work-up, mild conditions and good yields.

Keywords quinoline; heterocycle; ultrasound irradiation; iodine; synthesis

吡喃并[3,2-*c*]喹啉酮来源于 *Rutaceae* 植物家族中的生物碱, 它的许多衍生物具有广泛的生物活性, 如抗凝血、抗肿瘤、抗高血压、抗炎和抗疟活性^[1]。其中一些衍生物显示出对癌细胞生长的抑制活性, 被认为是潜在的抗癌药物^[2]。在有机合成上被用于制备其他天然产物, 如二聚喹啉生物碱和多环杂环化合物等^[3]。

吡喃并[3,2-*c*]喹啉酮骨架结构由喹啉酮和吡喃酮拼接组成。喹啉酮衍生物已发现具有抗疟^[4]、抗增殖^[5]、抗乙型肝炎病毒^[6]和抗 HIV^[7]活性。吡喃酮类化合物由于良好的抗菌^[8]、抗肿瘤^[9]等生物活性和药理活性, 在临床医学上得以应用。

在过去的几十年里, 由于分子碘的无毒、廉价和环境友好等特性, 使其成为一种应用广泛的有机催化剂^[10], 用于有效促进化学反应^[11], 如 Michael 加成^[12]、催化氧化^[13]等。分子碘在有机合成中的重要作用, 已经愈来愈受到人们的关注^[14]。

近年来, 我们以喹啉类杂环化合物为研究对象, 合

成了具有潜在生物活性的含有呋喃^[15a]、噻吩^[15b]、嘧啶^[15c]和香豆素^[15d]等结构单元的喹啉类稠杂环化合物。为进一步开展此领域的研究工作, 本文以 1-甲基-3-乙酰基-4-羟基-2-喹啉酮为反应底物, 在碘的促进下, 对吡喃并[3,2-*c*]喹啉-4,5-二酮类衍生物的合成方法进行探讨, 合成路线如 Scheme 1 所示。

1 结果与讨论

1.1 3-肉桂酰基-4-羟基-2-喹啉酮的合成

有关 3-肉桂酰基-4-羟基-2-喹啉酮的制备, 文献报道了在 *L*-脯氨酸催化下^[16a], 通过 1-甲基-3-乙酰基-4-羟基-2-喹啉酮(**1**)和芳香醛的 Aldol 缩合反应可以得到较好收率, 但反应时间长(3 d)。超声波技术的应用使得该反应得以改进, 反应时间缩短为 1.5 h^[16b], 收率良好, 成为一种合成该类化合物的有效方法。

本实验方法以水代替有机溶剂, 在超声波辐射下, 通过吡啶与聚乙二醇(PEG-400)的协同作用, 以较高收

* Corresponding author. E-mail: wangdaolin@sina.com

Received December 1, 2016; revised January 11, 2017; published online February 17, 2017.

Project supported by the Innovation Team Project of Liaoning Province Education Department (No. 2015001).

辽宁省教育厅创新团队(No. 2015001)资助项目。

图式 1 合成路线

Scheme 1 Synthetic route

率制备了 3-肉桂酰基-4-羟基-2-喹啉酮(**3**)。在这一研究工作中,我们考察了反应条件对该反应的影响(表 1),发现 10 mol%的哌啶与 2.5%的 PEG-400 用量比较合适,反应可以在 2 h 内完成(Entry 4),产率较高;与已有方法相比(Entries 1~3),具有明显优势;使用更多的催化剂(20 mol%的哌啶与 5%的 PEG-400)时,产物收率差别不大(Entry 5);当使用 EtOH 作为反应溶剂时,2 h 后, **3a** 的收率为 53% (Entry 6);无 PEG-400 参与时 **3a** 收率显著下降(Entry 7)。进一步证明 PEG-400 在 Aldol 缩合反应中的有效性^[17]。

在此基础上,我们选择以哌啶(10 mol%)与 PEG-400 (2.5 mol%)作为该反应的协同催化剂,在超声波辅助下,于 80 °C 合成 3-肉桂酰基-4-羟基-2-喹啉酮,实验结果列于表 2。

1.2 吡喃并[3,2-*c*]喹啉-4,5-二酮类衍生物的合成

在黄酮及其相关类似物的合成过程中利用 I₂/DMSO 体系是一种重要的合成途径^[18]。我们曾经报道

物的合成方法^[17a]。作为该方法的延续,本工作旨在探讨 I₂ 对 1-甲基-3-肉桂酰基-4-羟基-2-喹啉酮类化合物的环化反应性能。首先以 1-甲基-3-肉桂酰基-4-羟基-2-喹啉酮(**3a**)为反应底物,主要考察溶剂、催化剂用量和反应温度对反应的影响,结果见表 3。实验发现在 100 °C 下无任何催化剂参与时,该反应无法进行(Entry 1);在 I₂ 存在下反应可以较为顺利地进行(Entries 2~6)。其中,碘的用量为 15 mol%时(Entry 4),目标产物收率可达到 84%。增加催化剂的用量(20 mol%)或升高反应温度(110 °C),产物收率并没有得到改善(Entries 5, 6)。其次,通过与 *N,N*-二甲基甲酰胺(DMF)和 HOAc 为反应溶剂的比较(Entries 7, 8),发现二甲基亚砜(DMSO)作为溶剂效果较佳,可能源于良好的溶解性能以及弱氧化性作用^[19]。因此选择以 DMSO 为反应溶剂、碘的用量为 15 mol%作为该反应的优化条件。

在以上优化反应条件下,对吡喃并[3,2-*c*]喹啉-4,5-二酮类衍生物(**4**)的合成进行扩展实验(表 4)。

从反应结果中可以看出,1-甲基-3-肉桂酰基-4-羟基-2-喹啉酮类化合物在 I₂/DMSO 体系中,表现出较高的反应活性,可以顺利实现环化:当苯环上含有供电子取代基(如 Me, OMe, OH)时(Entries 2~8),表现出良好的选择性和高的收率(82~88%);含有吸电子取代基(如 Cl, F)时(Entries 9, 10),也得到良好收率(78%, 75%)。另外,杂环芳香醛、如糠醛和噻吩-2-甲醛(Entries 11, 12)应用于该反应也得到较好收率(70%, 72%)。

所制备产物结构经 IR、¹H NMR、¹³C NMR 和元素分析数据得以确认。在 IR 谱图中,目标化合物吡喃并[3,2-*c*]喹啉-4,5-二酮(**4**)的共同特征为在 1756~1771 cm⁻¹ 范围内表现出喹啉酮羰基的伸缩振动吸收峰,在了在 I₂/DMSO 体系中香豆素并[4,3-*b*]吡喃-4-酮类衍生

表 1 3-肉桂酰基-4-羟基-2-喹啉酮合成条件的优化

Table 1 Optimization of reaction conditions on the synthesis of 1-methyl-3-cinnamoyl-4-hydroxyquinoline-2-one (**3a**)^a

Entry	Catalyst	Solvent	Conditions	Time ^b /h	Yield ^c /%
1	<i>L</i> -Proline (30 mol%)	EtOH	80 °C	72	25 ^[16a]
2	Piperidine	BuOH	Reflux	6	38 ^[16b]
3	Al ₂ O ₃	BuOH	Ultrasonic irradiation, 60 °C	1.5	83 ^[16b]
4	Piperidine (10 mol%)/PEG-400 (2.5 mol%)	H ₂ O	Ultrasonic irradiation, 80 °C	2	85
5	Piperidine (20 mol%)/PEG-400 (5 mol%)	H ₂ O	Ultrasonic irradiation, 80 °C	2	86
6	Piperidine (10 mol%)/PEG-400 (2.5 mol%)	EtOH	Ultrasonic irradiation, 80 °C	2	53
7	Piperidine (10 mol%)	H ₂ O	Ultrasonic irradiation, 80 °C	2	67

^a Reaction conditions: 1-methyl-3-acetyl-4-hydroxyquinoline-2-one (**1**, 1 mmol), solvent (10 mL); ^b Reaction progress was monitored by TLC. ^c Isolated yield.

表 2 化合物 3 的反应时间及产率

Table 2 Reaction times and yields of the products 3^a

Entry	Ar	Product 3	Time ^b /h	Yield ^c /%
1	Ph	3a	2	85
2	4-MeC ₆ H ₄	3b	3	83
3	2-MeOC ₆ H ₄	3c	3	79
4	3-MeOC ₆ H ₄	3d	3	87
5	4-MeOC ₆ H ₄	3e	2	85
6	2,4-(MeO) ₂ C ₆ H ₃	3f	2	80
7	3,4-(MeO) ₂ C ₆ H ₃	3g	1.5	86
8	2,4,5-(MeO) ₃ C ₆ H ₂	3h	1.5	82
9	4-ClC ₆ H ₄	3i	3	80
10	2-FC ₆ H ₄	3j	3	75
11	2-Furyl	3k	3	77
12	2-Thienyl	3l	3	75

^a Reaction conditions: 1-methyl-3-cinnamoyl-4-hydroxyquinoline-2-one (**1**, 10.0 mmol), H₂O (10 mL), aldehyde (**2**, 12.0 mmol), pyridine (1.0 mmol), PEG-400 (100 mg), 80 °C; ^b Reaction progress was monitored by TLC. ^c Isolated yield.

表 3 吡喃并[3,2-c]喹啉-4,5-二酮(4a)合成条件的优化^a

Table 3 Optimization of reaction conditions on the synthesis of pyrano[3,2-c]quinoline-4,5-dione (4a)

Entry	I ₂ /mol%	Solvent	Time ^b /h	Yield ^c /%
1	0	DMSO	24	0 ^d
2	5	DMSO	24	38
3	10	DMSO	16	73
4	15	DMSO	10	84
5	20	DMSO	9	82
6	15	DMSO	9	80
7	15	DMF	18	67
8	15	HOAc	8	54

^a Reaction conditions: 1-methyl-3-cinnamoyl-4-hydroxyquinoline-2-one (**3a**, 1 mmol), solvent (10 mL), 100 °C; ^b Reaction progress was monitored by TLC. ^c Isolated yield. ^d The starting materials were recovered.

1632~1644 cm⁻¹ 范围内出现的吸收峰为吡喃-4-酮羰基的伸缩振动吸收峰. 在 ¹H NMR 谱图中, 目标产物 **4** 在 δ 6.76~7.23 处的单峰吸收, 为吡喃酮环 3-位质子的特征吸收峰. 在 ¹³C NMR 谱图中, 目标产物 **4**, 在 δ 174~177 处的吸收为喹啉酮羰基碳的特征吸收峰, δ 159~162 为吡喃酮羰基碳的特征吸收峰.

依据相关文献[11a]及实验结果, 推测该反应进行

的可能机理如下(Scheme 2): 首先 1-甲基-3-肉桂酰基-4-

表 4 化合物 4 的反应时间及产率

Table 4 Reaction times and yields of the products 4

Entry	Ar	Product 4	Time/h	Yield/%
1	Ph	4a	7	84
2	4-MeC ₆ H ₄	4b	6	86
3	2-MeOC ₆ H ₄	4c	8	82
4	3-MeOC ₆ H ₄	4d	6	85
5	4-MeOC ₆ H ₄	4e	5	87
6	2,4-(MeO) ₂ C ₆ H ₃	4f	7	85
7	3,4-(MeO) ₂ C ₆ H ₃	4g	5	88
8	2,4,5-(MeO) ₃ C ₆ H ₂	4h	6	85
9	4-ClC ₆ H ₄	4i	10	78
10	2-FC ₆ H ₄	4j	12	75
11	2-Furyl	4k	9	70
12	2-Thienyl	4l	8	72

羟基 2-喹啉酮(**3**)在分子碘的作用下, 通过加成反应得到碘代鎓盐 **A**, 接着通过分子内亲核取代得到环化产物 **B**, 最后经过分子内脱除一分子 HI 得到最终产物: 吡喃并[3,2-c]喹啉-4,5-二酮(**4**).

图式 2 反应机理

Scheme 2 Reaction mechanism

2 结论

通过 1-甲基-3-乙酰基-4-羟基-2-喹啉酮与芳香醛的 Aldol 缩合及在碘促进下的环化反应, 成功地合成了一系列吡喃并[3,2-c]喹啉-4,5-二酮类化合物, 为新型吡喃并喹啉酮类衍生物提供了有效的合成策略. 该方法反应条件温和、操作简便、收率良好, 有较好的实用价值及应用前景.

3 实验部分

3.1 仪器与试剂

熔点用 WRS-1B 数字熔点仪测定, 熔点未校正; NMR 用 Bruker DPX-400 MHz 核磁共振仪测定, 四甲基硅烷为内标; IR 用 BIO-RAD FTS-40 型傅立叶变换红外

分光光度计测定, KBr 压片; MS 采用 ZAB-HS 型质谱仪测定; 元素分析用 Vario EL 元素分析仪测定; 超声波用频率为 40 kHz 和 250 W 输出功率的 KQ-250B 医用超声清洁剂. 所用试剂均为分析纯试剂, 1-甲基-3-乙酰基-4-羟基-2-喹啉酮(**1**)按照文献[20]方法制备.

3.2 实验方法

3.2.1 1-甲基-3-肉桂酰基-4-羟基-2-喹啉酮(**3**)的制备

合成的一般步骤: 于超声波辐射下, 将 1-甲基-3-乙酰基-4-羟基-2-喹啉酮(**1**) (2.17 g, 10.0 mmol)、哌啶(85 mg, 1.0 mmol)、芳香醛(**2**) (12.0 mmol)、水(20 mL)和 PEG-400 (100 mg), 在 80 °C 下反应 1.5~3 h, 用硅胶层析板(TLC)监控反应. 反应结束后, 冷却, 过滤, 无水乙醇重结晶, 得到产物 **3**. 产物 **3a**~**3l** 的物理分析数据与光谱数据如下:

1-甲基-3-肉桂酰基-4-羟基-2-喹啉酮(**3a**): 黄色针状晶体. m.p. 155~157 °C (文献值^[16a] 148~150 °C); ¹H NMR (CDCl₃, 400 MHz) δ : 3.65 (s, 3H, OCH₃), 7.25~7.31 (m, 1H), 7.38~7.40 (m, 3H), 7.66~7.71 (m, 3H), 7.95 (d, $J=8.0$ Hz, 1H), 8.24 (d, $J=8.0$ Hz, 1H), 8.68 (d, $J=8.0$ Hz, 1H); ¹³C NMR (CDCl₃, 100 MHz) δ : 29.2, 114.2, 116.0, 122.1, 125.2, 126.2, 128.8, 129.4, 130.7, 134.9, 135.1, 141.6, 145.1, 161.6, 176.8, 176.9, 194.4; IR (KBr) ν : 3231 (OH), 1654 (C=O), 1577 (C=O) cm⁻¹. Anal. calcd for C₁₉H₁₅NO₃: C 74.74, H 4.95, N 4.59; found C 74.89, H 4.97, N 4.61.

1-甲基-3-(4-甲基肉桂酰基)-4-羟基-2-喹啉酮(**3b**): 黄色针状晶体. m.p. 170~172 °C (文献值^[16a] 166~168 °C); ¹H NMR (CDCl₃, 400 MHz) δ : 2.37 (s, 3H, CH₃), 3.66 (s, 3H, NCH₃), 7.18~7.30 (m, 4H), 7.60 (d, $J=7.6$ Hz, 2H), 7.67 (dd, $J=7.6, 8.4$ Hz, 1H), 8.14 (d, $J=15.6$ Hz, 1H), 8.23 (d, $J=8.0$ Hz, 1H), 8.82 (d, $J=15.6$ Hz, 1H); ¹³C NMR (CDCl₃, 100 MHz) δ : 19.3, 26.1, 103.2, 111.8, 113.8, 119.7, 121.7, 123.8, 126.7, 127.3, 130.1, 132.6, 138.9, 139.3, 143.0, 159.4, 173.9, 191.8; IR (KBr) ν : 3236 (OH), 1658 (C=O), 1594 (C=O) cm⁻¹. Anal. calcd for C₂₀H₁₇NO₃: C 75.22, H 5.37, N 4.39; found C 75.37, H 5.36, N 4.41.

1-甲基-3-(2-甲氧基肉桂酰基)-4-羟基-2-喹啉酮(**3c**): 黄色针状晶体. m.p. 162~163 °C; ¹H NMR (CDCl₃, 400 MHz) δ : 3.65 (s, 3H, NCH₃), 3.90 (s, 3H, OCH₃), 6.89~6.98 (m, 2H), 7.22~7.27 (m, 2H), 7.36 (t, $J=7.6$ Hz, 1H), 7.66 (dd, $J=7.8, 8.0$ Hz, 1H), 7.80 (d, $J=8.0$ Hz, 1H), 8.24 (d, $J=8.0$ Hz, 1H), 8.57 (d, $J=15.6$ Hz, 1H), 8.86 (d, $J=15.6$ Hz, 1H); ¹³C NMR (CDCl₃, 100 MHz) δ : 29.2, 55.5, 105.6, 111.4, 114.3, 116.2, 120.7, 122.0, 124.1,

124.9, 126.3, 128.7, 132.1, 134.8, 140.1, 141.6, 158.7, 161.8, 176.4, 194.5; IR (KBr) ν : 3230 (OH), 1652 (C=O), 1589 (C=O) cm⁻¹. Anal. calcd for C₂₀H₁₇NO₄: C 71.63, H 5.11, N 4.18; found C 71.78, H 5.10, N 4.19.

1-甲基-3-(3-甲氧基肉桂酰基)-4-羟基-2-喹啉酮(**3d**): 黄色针状晶体. m.p. 139~141 °C; ¹H NMR (CDCl₃, 400 MHz) δ : 3.66 (s, 3H, NCH₃), 3.85 (s, 3H, OCH₃), 6.94 (d, $J=7.6$ Hz, 1H), 7.20~7.31 (m, 5H), 7.68 (t, $J=7.6$ Hz, 1H), 7.92 (d, $J=15.6$ Hz, 1H), 8.24 (d, $J=7.6$ Hz, 1H), 8.65 (d, $J=15.6$ Hz, 1H); ¹³C NMR (CDCl₃, 100 MHz) δ : 29.2, 55.4, 105.6, 113.8, 114.3, 116.1, 116.7, 121.7, 122.1, 125.5, 126.3, 129.8, 134.9, 136.5, 141.7, 145.0, 159.8, 161.8, 176.2, 194.4; IR (KBr) ν : 3234 (OH), 1659 (C=O), 1582 (C=O) cm⁻¹. Anal. calcd for C₂₀H₁₇NO₄: C 71.63, H 5.11, N 4.18; found C 71.75, H 5.12, N 4.20.

1-甲基-3-(4-甲氧基肉桂酰基)-4-羟基-2-喹啉酮(**3e**): 黄色针状晶体. m.p. 171~173 °C (文献值^[16a] 170~172 °C); ¹H NMR (CDCl₃, 400 MHz) δ : 3.71 (s, 3H, NCH₃), 3.92 (s, 3H, OCH₃), 7.05 (d, $J=8.4$ Hz, 1H), 7.14 (t, $J=7.6, 8.0$ Hz, 1H), 7.32~7.41 (m, 4H), 7.50 (d, $J=7.6, 8.0$ Hz, 1H), 7.72 (d, $J=7.6, 8.0$ Hz, 1H), 7.76 (d, $J=15.6$ Hz, 1H), 8.24 (d, $J=15.6$ Hz, 1H); ¹³C NMR (CDCl₃, 100 MHz) δ : 27.4, 53.6, 112.3, 112.5, 114.5, 120.2, 120.8, 124.4, 126.2, 127.5, 129.1, 132.9, 139.7, 143.5, 160.0, 160.1, 174.5, 192.2; IR (KBr) ν : 3235 (OH), 1659 (C=O), 1586 (C=O) cm⁻¹. Anal. calcd for C₂₀H₁₇NO₄: C 71.63, H 5.11, N 4.18; Found C 71.74, H 5.13, N 4.20.

1-甲基-3-(2,4-二甲氧基肉桂酰基)-4-羟基-2-喹啉酮(**3f**): 黄色针状晶体. m.p. 191~193 °C (文献值^[16a] 187~189 °C); ¹H NMR (CDCl₃, 400 MHz) δ : 3.66 (s, 3H, NCH₃), 3.84 (s, 3H, OCH₃), 3.89 (s, 3H, OCH₃), 6.43 (s, 1H), 6.50 (d, $J=8.4$ Hz, 1H), 7.22~7.29 (m, 2H), 7.65 (t, $J=7.6$ Hz, 1H), 7.76 (d, $J=8.4$ Hz, 1H), 8.23 (d, $J=8.0$ Hz, 1H), 8.37 (d, $J=15.6$ Hz, 1H), 8.61 (d, $J=15.6$ Hz, 1H); ¹³C NMR (CDCl₃, 100 MHz) δ : 27.3, 53.7, 96.2, 96.3, 103.7, 112.3, 114.6, 115.6, 120.1, 120.2, 124.4, 128.6, 132.7, 138.7, 139.2, 158.7, 160.1, 161.7, 174.7, 192.3; IR (KBr) ν : 3235 (OH), 1656 (C=O), 1594 (C=O) cm⁻¹. Anal. calcd for C₂₁H₁₉NO₅: C 69.03, H 5.24, N 3.83; found C 69.16, H 5.25, N 3.85.

1-甲基-3-(3,4-二甲氧基肉桂酰基)-4-羟基-2-喹啉酮(**3g**): 黄色针状晶体. m.p. 194~196 °C; ¹H NMR (CDCl₃, 400 MHz) δ : 3.66 (s, 3H, NCH₃), 3.91 (s, 3H, OCH₃), 3.95 (s, 3H, OCH₃), 6.86 (d, $J=7.6$ Hz, 1H),

7.22~7.30 (m, 4H), 7.67 (dd, $J=7.6, 8.0$ Hz, 1H), 7.94 (d, $J=15.6$ Hz, 1H), 8.23 (d, $J=8.4$ Hz, 1H), 8.56 (d, $J=15.6$ Hz, 1H); ^{13}C NMR (CDCl_3 , 100 MHz) δ : 29.2, 55.9, 105.4, 110.5, 110.9, 114.2, 116.3, 122.1, 122.7, 124.0, 126.2, 138.3, 134.8, 141.6, 145.7, 149.1, 151.6, 161.9, 176.4, 193.9; IR (KBr) ν : 3230 (OH), 1652 (C=O), 1589 (C=O) cm^{-1} . Anal. calcd for $\text{C}_{21}\text{H}_{19}\text{NO}_5$: C 69.03, H 5.24, N 3.83; found C 69.14, H 5.23, N 3.85.

1-甲基-3-(2,4,5-三甲氧基肉桂酰基)-4-羟基-2-喹啉酮(**3h**): 黄色针状晶体. m.p. 223~224 $^{\circ}\text{C}$; ^1H NMR (CDCl_3 , 400 MHz) δ : 3.65 (s, 3H, NCH_3), 3.90 (s, 3H, OCH_3), 3.91 (s, 3H, OCH_3), 3.93 (s, 3H, OCH_3), 6.48 (s, 1H), 7.22~7.29 (m, 3H), 7.66 (dd, $J=7.2, 7.6$ Hz, 1H), 8.23 (d, $J=7.6$ Hz, 1H), 8.42 (d, $J=15.6$ Hz, 1H), 8.56 (d, $J=15.6$ Hz, 1H); ^{13}C NMR (CDCl_3 , 100 MHz) δ : 26.9, 53.6, 54.1, 54.2, 94.1, 103.1, 108.3, 111.2, 113.6, 114.3, 119.5, 119.6, 123.8, 132.3, 138.6, 139.3, 140.9, 150.7, 152.6, 159.6, 174.2, 191.6; IR (KBr) ν : 3227 (OH), 1646 (C=O), 1589 (C=O) cm^{-1} . Anal. calcd for $\text{C}_{22}\text{H}_{21}\text{NO}_6$: C 66.83, H 5.35, N 3.54; found C 66.96, H 5.36, N 3.53.

1-甲基-3-(4-氯肉桂酰基)-4-羟基-2-喹啉酮(**3i**): 黄色针状晶体. m.p. 186~188 $^{\circ}\text{C}$ (文献值^[16b] 182~184 $^{\circ}\text{C}$). ^1H NMR (CDCl_3 , 400 MHz) δ : 3.64 (s, 3H, NCH_3), 7.22~7.37 (m, 4H), 7.61 (d, $J=8.4$ Hz, 2H), 7.67 (dd, $J=7.6, 8.0$ Hz, 1H), 7.86 (d, $J=15.6$ Hz, 1H), 8.22 (d, $J=7.6$ Hz, 1H), 8.63 (d, $J=15.6$ Hz, 1H); ^{13}C NMR (CDCl_3 , 100 MHz) δ : 29.2, 105.6, 114.3, 115.9, 122.1, 125.7, 126.2, 129.7, 130.8, 133.7, 134.9, 136.5, 141.6, 143.3, 161.7, 176.7, 194.1; IR (KBr) ν : 3234 (OH), 1647 (C=O), 1583 (C=O) cm^{-1} . Anal. calcd for $\text{C}_{19}\text{H}_{14}\text{ClNO}_3$: C 67.16, H 4.15, N 4.12; found C 67.23, H 4.16, N 4.10.

1-甲基-3-(2-氟肉桂酰基)-4-羟基-2-喹啉酮(**3j**): 黄色针状晶体. m.p. 223~224 $^{\circ}\text{C}$; ^1H NMR (CDCl_3 , 400 MHz) δ : 3.71 (3H, NCH_3 , s), 7.13~7.17 (m, 2H), 7.21~7.42 (m, 3H), 7.74 (t, $J=7.6$ Hz, 1H), 7.85 (t, $J=6.8$ Hz, 1H), 8.17 (d, $J=8.0$ Hz, 1H), 8.29 (d, $J=7.6$ Hz, 1H), 8.76 (d, $J=15.6$ Hz, 1H); ^{13}C NMR (CDCl_3 , 100 MHz) δ : 27.4, 112.4, 114.0, 114.4, 120.3, 121.4, 122.5, 124.4, 125.4, 127.2, 130.2, 133.2, 134.8, 139.9, 158.6, 159.9, 161.1, 174.3, 192.5; IR (KBr) ν : 3233 (OH), 1668 (C=O), 1580 (C=O) cm^{-1} . Anal. calcd for $\text{C}_{19}\text{H}_{14}\text{FNO}_3$: C 70.58, H 4.36, N 4.33; found C 70.75, H 4.38, N 4.34.

1-甲基-3-(3-(2-呋喃基)烯丙酰基)-4-羟基-2-喹啉酮(**3k**): 黄色针状晶体. m.p. 168~170 $^{\circ}\text{C}$ (文献值^[16c] 160~162 $^{\circ}\text{C}$); ^1H NMR (CDCl_3 , 400 MHz) δ : 3.65 (s, 3H,

NCH_3), 6.50 (s, 1H), 6.75 (d, $J=2.8$ Hz, 1H), 7.22~7.29 (m, 2H), 7.54~7.55 (m, 1H), 7.65~7.73 (m, 2H), 8.22 (d, $J=8.0$ Hz, 1H), 8.51 (d, $J=15.6$ Hz, 1H); ^{13}C NMR (CDCl_3 , 100 MHz) δ : 29.2, 112.3, 112.7, 114.2, 116.1, 116.6, 122.5, 122.7, 126.3, 130.9, 134.8, 141.3, 145.5, 152.1, 161.7, 176.1, 193.7; IR (KBr) ν : 3231 (OH), 1656 (C=O), 1582 (C=O) cm^{-1} . Anal. calcd for $\text{C}_{17}\text{H}_{13}\text{NO}_4$: C 69.15, H 4.44, N 4.74; found C 69.26, H 4.45, N 4.73.

1-甲基-3-(3-(2-噻吩基)烯丙酰基)-4-羟基-2-喹啉酮(**3l**): 黄色针状晶体. m.p. 211~212 $^{\circ}\text{C}$; ^1H NMR (CDCl_3 , 400 MHz) δ : 3.66 (s, 3H, NCH_3), 7.08 (d, $J=7.6, 8.4$ Hz, 1H), 7.27~7.40 (m, 2H), 7.44~7.45 (m, 2H), 7.68 (dd, $J=7.6, 8.0$ Hz, 1H), 8.10 (d, $J=15.6$ Hz, 1H), 8.23 (d, $J=8.0$ Hz, 1H), 8.51 (d, $J=15.6$ Hz, 1H); ^{13}C NMR (CDCl_3 , 100 MHz) δ : 29.2, 105.4, 114.2, 116.2, 122.1, 123.8, 126.2, 128.3, 129.1, 132.3, 134.9, 137.7, 141.0, 141.7, 161.8, 176.2, 197.6; IR (KBr) ν : 3226 (OH), 1650 (C=O), 1584 (C=O) cm^{-1} . Anal. calcd for $\text{C}_{17}\text{H}_{13}\text{NO}_3\text{S}$: C 65.58, H 4.21, N 4.50; found C 65.74, H 4.22, N 4.52.

3.2.2 吡喃并[3,2-*c*]喹啉-4,5-二酮(**4**)的合成

合成的一般步骤: 将碘(38.00 mg, 0.15 mmol)加入到 1-甲基-3-肉桂酰基-4-羟基-2-喹啉酮(**3**) (1.00 mmol)的 DMSO (10 mL)溶剂中, 100 $^{\circ}\text{C}$ 下反应 5~12 h (TLC 跟踪检测). 反应完毕后, 将反应混合物转入水中(50 mL), 过滤, 水洗涤, 干燥, 用冰乙酸重结晶, 得到目标化合物 **4**. 产物 **4a**~**4l** 的物理分析数据与光谱数据如下:

1-甲基-2-苯基-6-甲基吡喃并[3,2-*c*]喹啉-4,5-二酮(**4a**): 黄色针状晶体. m.p. 239~241 $^{\circ}\text{C}$; ^1H NMR (CDCl_3 , 400 MHz) δ : 3.71 (s, 3H, NCH_3), 6.88 (s, 1H), 7.34~7.38 (m, 2H), 7.41~7.43 (m, 3H), 7.76 (t, $J=6.6$ Hz, 1H), 7.86~7.87 (m, 2H), 8.25 (d, $J=6.8$ Hz, 1H); ^{13}C NMR (CDCl_3 , 100 MHz) δ : 27.6, 109.1, 110.9, 111.0, 111.3, 112.9, 120.0, 122.3, 124.1, 127.5, 128.8, 130.6, 132.4, 138.9, 159.1, 160.1, 174.2; IR (KBr) ν : 1756 (C=O), 1639 (C=O) cm^{-1} . Anal. calcd for $\text{C}_{19}\text{H}_{13}\text{NO}_3$: C 75.24, H 4.32, N 4.62; found C 75.35, H 4.34, N 4.61.

1-甲基-2-(4-甲基苯基)-6-甲基吡喃并[3,2-*c*]喹啉-4,5-二酮(**4b**): 黄色针状晶体. m.p. 263~265 $^{\circ}\text{C}$; ^1H NMR (CDCl_3 , 400 MHz) δ : 2.44 (s, 3H, CH_3), 3.71 (s, 1H, NCH_3), 6.84 (s, 1H), 7.32~7.40 (m, 4H), 7.71~7.76 (m, 3H), 8.24 (d, $J=8.0$ Hz, 1H); ^{13}C NMR (CDCl_3 , 100 MHz) δ : 19.2, 27.0, 107.6, 109.2, 109.6, 110.8, 112.4, 120.2, 121.8, 123.5, 125.4, 127.7, 131.8, 138.4, 140.3, 158.9, 159.5, 173.8; IR (KBr) ν : 1759 (C=O), 1632 (C=O)

cm^{-1} . Anal. calcd for $\text{C}_{20}\text{H}_{15}\text{NO}_3$: C 75.70, H 4.76, N 4.41; found C 75.85, H 4.77, N 4.40.

1-甲基-2-(2-甲氧基苯基)-6-甲基吡喃并[3,2-*c*]喹啉-4,5-二酮(**4c**): 黄色针状晶体. m.p. 253~255 $^{\circ}\text{C}$; ^1H NMR (CDCl_3 , 400 MHz) δ : 3.71 (s, 3H, NCH_3), 3.92 (s, 1H, OCH_3), 7.05 (d, $J=8.4$ Hz, 1H), 7.13 (t, $J=7.6$ Hz, 1H), 7.23 (s, 1H), 7.32~7.41 (m, 2H), 7.50 (t, $J=7.6$ Hz, 1H), 7.72 (dd, $J=7.6, 7.8$ Hz, 1H), 7.88 (d, $J=7.6$ Hz, 1H), 8.21 (d, $J=8.0$ Hz, 1H); ^{13}C NMR (CDCl_3 , 100 MHz) δ : 27.6, 53.9, 109.4, 110.1, 111.5, 112.9, 115.4, 117.5, 119.1, 120.7, 122.4, 126.9, 131.1, 132.3, 138.9, 156.3, 156.8, 156.9, 160.3, 174.9; IR (KBr) ν : 1762 (C=O), 1636 (C=O) cm^{-1} . Anal. calcd for $\text{C}_{20}\text{H}_{15}\text{NO}_3$: C 72.06, H 4.54, N 4.20; found C 72.17, H 4.56, N 4.21.

1-甲基-2-(3-甲氧基苯基)-6-甲基吡喃并[3,2-*c*]喹啉-4,5-二酮(**4d**): 黄色针状晶体. m.p. 240~242 $^{\circ}\text{C}$; ^1H NMR (CDCl_3 , 400 MHz) δ : 3.72 (s, 3H, NCH_3), 3.89 (s, 3H, OCH_3), 6.89 (s, 1H), 7.09 (s, 1H), 7.35~7.47 (m, 4H), 7.45 (d, $J=8.0$ Hz, 2H), 8.25 (d, $J=8.0$ Hz, 1H); ^{13}C NMR (CDCl_3 , 100 MHz) δ : 27.6, 53.7, 109.7, 109.9, 111.1, 111.4, 112.9, 115.3, 116.5, 120.7, 122.3, 128.6, 130.2, 132.4, 139.0, 156.7, 158.3, 158.9, 160.1, 174.2; IR (KBr) ν : 1760 (C=O), 1633 (C=O) cm^{-1} . Anal. calcd for $\text{C}_{20}\text{H}_{15}\text{NO}_3$: C 72.06, H 4.54, N 4.20; found C 72.15, H 4.56, N 4.21.

1-甲基-2-(4-甲氧基苯基)-6-甲基吡喃并[3,2-*c*]喹啉-4,5-二酮(**4e**): 黄色针状晶体. m.p. 263~265 $^{\circ}\text{C}$; ^1H NMR (CDCl_3 , 400 MHz) δ : 3.75 (s, 3H, CH_3), 3.91 (s, 3H, OCH_3), 6.80 (s, 1H), 7.05 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.30~7.42 (m, 2H), 7.75 (t, $J=7.6$ Hz, 1H), 7.83 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J=8.0$ Hz, 1H); ^{13}C NMR (CDCl_3 , 100 MHz) δ : 29.3, 55.5, 111.0, 111.1, 111.5, 113.2, 114.6, 122.4, 122.8, 124.1, 127.5, 134.0, 140.7, 158.5, 160.9, 161.7, 162.4, 175.9; IR (KBr) ν : 1765 (C=O), 1639 (C=O) cm^{-1} . Anal. calcd for $\text{C}_{20}\text{H}_{15}\text{NO}_3$: C 72.06, H 4.54, N 4.20; found C 72.19, H 4.56, N 4.19.

1-甲基-2-(2,4-二甲氧基苯基)-6-甲基吡喃并[3,2-*c*]喹啉-4,5-二酮(**4f**): 黄色针状晶体. m.p. 268~269 $^{\circ}\text{C}$; ^1H NMR (CDCl_3 , 400 MHz) δ : 3.70 (s, 3H, NCH_3), 3.88 (s, 3H, OCH_3), 3.89 (s, 3H, OCH_3), 6.52 (s, 1H), 6.64 (d, $J=8.4$ Hz, 1H), 7.16 (s, 1H), 7.30~7.38 (m, 2H), 7.70 (dd, $J=7.4, 8.0$ Hz, 1H), 7.83 (d, $J=8.4$ Hz, 1H), 8.18 (d, $J=8.0$ Hz, 1H); ^{13}C NMR (CDCl_3 , 100 MHz) δ : 27.4, 53.8, 97.1, 103.6, 109.6, 110.5, 111.7, 112.7, 114.2, 120.5, 122.3, 127.9, 131.9, 138.8, 156.5, 156.6, 157.8, 159.9,

161.5, 174.8; IR (KBr) ν : 1768 (C=O), 1635 (C=O) cm^{-1} . Anal. calcd for $\text{C}_{21}\text{H}_{17}\text{NO}_5$: C 69.41, H 4.72, N 3.85; found C 69.56, H 4.73, N 3.84.

1-甲基-2-(3,4-二甲氧基苯基)-6-甲基吡喃并[3,2-*c*]喹啉-4,5-二酮(**4g**): 黄色针状晶体. m.p. >300 $^{\circ}\text{C}$; ^1H NMR (CDCl_3 , 400 MHz) δ : 3.72 (s, 3H, NCH_3), 3.94 (s, 3H, OCH_3), 3.96 (s, 3H, OCH_3), 6.84 (s, 1H), 7.01 (d, $J=8.4$ Hz, 1H), 7.27 (s, 1H), 7.37~7.42 (m, 2H), 7.55 (d, $J=7.6$ Hz, 1H), 7.75 (d, $J=7.6$ Hz, 1H), 8.23 (d, $J=7.2$ Hz, 1H); ^{13}C NMR (CDCl_3 , 100 MHz) δ : 29.4, 56.0, 56.1, 108.3, 109.9, 111.2, 111.4, 111.6, 113.2, 114.7, 119.5, 122.5, 122.9, 124.0, 134.6, 140.7, 149.4, 152.8, 160.8, 161.7, 176.6; IR (KBr) ν : 1767 (C=O), 1634 (C=O) cm^{-1} . Anal. calcd for $\text{C}_{21}\text{H}_{17}\text{NO}_5$: C 69.41, H 4.72, N 3.85; found C 69.55, H 4.74, N 3.86.

1-甲基-2-(2,4,5-三甲氧基苯基)-6-甲基吡喃并[3,2-*c*]喹啉-4,5-二酮(**4h**): 黄色针状晶体. m.p. >300 $^{\circ}\text{C}$; ^1H NMR (CDCl_3 , 400 MHz) δ : 3.72 (s, 3H, NCH_3), 3.89 (s, 3H, OCH_3), 3.94 (s, 3H, OCH_3), 3.98 (s, 3H, OCH_3), 6.59 (s, 1H), 7.23 (s, 1H), 7.35 (s, 1H), 7.37~7.43 (m, 2H), 7.73 (t, $J=7.6$ Hz, 1H), 8.18 (d, $J=8.0$ Hz, 1H); ^{13}C NMR (CDCl_3 , 100 MHz) δ : 29.5, 56.2, 56.4, 56.7, 96.9, 109.9, 110.5, 111.2, 113.2, 113.3, 114.9, 122.5, 122.7, 123.9, 134.3, 140.8, 143.1, 153.4, 154.5, 159.6, 161.8, 176.8; IR (KBr) ν : 1771 (C=O), 1635 (C=O) cm^{-1} . Anal. calcd for $\text{C}_{22}\text{H}_{19}\text{NO}_6$: C 67.17, H 4.87, N 3.56; found C 67.25, H 4.88, N 3.55.

1-甲基-2-(4-氯苯基)-6-甲基吡喃并[3,2-*c*]喹啉-4,5-二酮(**4i**): 黄色针状晶体. m.p. >300 $^{\circ}\text{C}$; ^1H NMR (CDCl_3 , 400 MHz) δ : 3.72 (s, 3H, NCH_3), 6.86 (s, 1H), 7.36~7.43 (m, 2H), 7.53 (d, $J=8.0$ Hz, 2H), 7.74~7.77 (m, 1H), 7.81 (d, $J=8.0$ Hz, 2H), 8.24 (d, $J=7.8$ Hz, 1H); ^{13}C NMR (CDCl_3 , 100 MHz) δ : 27.6, 109.9, 111.0, 111.2, 112.9, 120.7, 122.2, 125.4, 127.4, 127.8, 132.5, 136.4, 139.0, 156.5, 158.1, 160.1, 173.9; IR (KBr) ν : 1768 (C=O), 1637 (C=O) cm^{-1} . Anal. calcd for $\text{C}_{19}\text{H}_{12}\text{ClNO}_3$: C 67.56, H 3.58, N 4.15; found C 67.68, H 3.60, N 4.16.

1-甲基-2-(2-氟苯基)-6-甲基吡喃并[3,2-*c*]喹啉-4,5-二酮(**4j**): 黄色针状晶体. m.p. 216~218 $^{\circ}\text{C}$; ^1H NMR (CDCl_3 , 400 MHz) δ : 3.71 (s, 3H, NCH_3), 6.98 (s, 1H), 7.23~7.340 (m, 4H), 7.51~7.54 (m, 1H), 7.73 (dd, $J=7.6, 8.0$ Hz, 1H), 7.86 (dd, $J=7.2, 7.6$ Hz, 1H), 8.21 (d, $J=8.0$ Hz, 1H); ^{13}C NMR (CDCl_3 , 100 MHz) δ : 29.4, 111.6, 113.7, 114.8, 117.1, 119.2, 122.6, 124.2, 124.9, 128.6, 133.3, 134.3, 140.7, 156.9, 158.5, 159.7, 161.6,

162.1, 175.8. IR (KBr) ν : 1764 (C=O), 1644 (C=O) cm^{-1} . Anal. calcd for $\text{C}_{19}\text{H}_{12}\text{FNO}_3$: C 71.02, H 3.76, N 4.36; found C 71.17, H 3.75, N 4.37.

1-甲基-2-(呋喃-2-基)-6-甲基吡喃并[3,2-*c*]喹啉-4,5-二酮(**4k**): 黄色针状晶体. m.p. > 300 °C; ^1H NMR (CDCl_3 , 400 MHz) δ : 3.71 (s, 3H, NCH_3), 6.63~6.64 (m, 1H), 6.78 (s, 1H), 7.14~7.17 (m, 1H), 7.33~7.41 (m, 2H), 7.64~7.65 (m, 1H), 7.74 (t, $J=7.6$ Hz, 1H), 8.19 (d, $J=7.6$ Hz, 1H); ^{13}C NMR (CDCl_3 , 100 MHz) δ : 29.5, 110.0, 110.2, 111.7, 112.5, 112.9, 113.0, 114.7, 122.5, 124.0, 134.3, 140.8, 145.1, 146.1, 153.0, 161.5, 175.4; IR (KBr) ν : 1761 (C=O), 1635 (C=O) cm^{-1} . Anal. calcd for $\text{C}_{17}\text{H}_{11}\text{NO}_4$: C 69.62, H 3.78, N 4.78; found C 69.76, H 3.79, N 4.77.

1-甲基-2-(噻吩-2-基)-6-甲基吡喃并[3,2-*c*]喹啉-4,5-二酮(**4l**): 黄色针状晶体. m.p. > 300 °C; ^1H NMR (CDCl_3 , 400 MHz) δ : 3.71 (s, 3H, NCH_3), 6.76 (s, 1H), 7.20~7.23 (m, 1H), 7.34~7.40 (m, 2H), 7.59 (d, $J=7.6$ Hz, 1H), 7.68~7.75 (m, 2H), 8.22 (d, $J=8.0$ Hz, 1H); ^{13}C NMR (CDCl_3 , 100 MHz) δ : 27.5, 109.1, 109.8, 111.1, 112.8, 120.7, 122.2, 126.3, 126.9, 128.5, 131.9, 132.4, 138.9, 154.8, 156.5, 159.6, 173.6; IR (KBr) ν : 1764 (C=O), 1637 (C=O) cm^{-1} . Anal. calcd for $\text{C}_{17}\text{H}_{11}\text{NO}_3\text{S}$: C 66.01, H 3.58, N 4.53; found C 66.12, H 3.59, N 4.53.

辅助材料(Supporting Information) 合成产物的 ^1H NMR 和 ^{13}C NMR 图谱. 这些材料可以免费从本刊网站 (<http://sioc-journal.cn/>) 上下载.

References

- [1] (a) Chen, J. J.; Chen, P. H.; Liao, C. H.; Huang, S. Y.; Chen, I. S. *J. Nat. Prod.* **2007**, *70*, 1444.
(b) Hanawa, F.; Fokialakis, N.; Skaltsounis, A. L. *Planta Med.* **2004**, *70*, 531.
(c) Madkour, H. M. F.; Mahmoud, M. R.; Sakr, A. M.; Habasy, M. *M. Sci. Pharm.* **2001**, *69*, 33.
- [2] Chen, I. S.; Wu, S. J.; Tsai, I. L.; Wu, T. S.; Pezzuto, J. M.; Lu, M. C.; Chai, H.; Suh, N.; Teng, C. M. *J. Nat. Prod.* **1994**, *57*, 1206.
- [3] (a) Barr, S. A.; Neville, C. F.; Grundon, M. F.; Boyd, D. R.; Malone, J. F.; Evans, T. A. *J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1* **1995**, 445.
(b) Ngadjui, B. T.; Ayafor, J. F.; Bilon, A. E. N.; Sondengam, B. L.; Connolly, J. D.; Rycroft, D. S. *Tetrahedron*, **1992**, *48*, 8711.
(c) Grundon, M. F. *Tetrahedron*, **1978**, *34*, 143.
- [4] Ghorab, M. M.; Heiba, H. I.; Amin, N. E. *Pharmazie* **1999**, *54*, 226.
- [5] Tavares, L. C.; Johann, S.; Alves, T. M. A.; Guerra, J. C.; Souza-Fagundes, E. M.; Cicalpino, P. Silva; Bortoluzzi, A. J.; Caramori, G. F.; Piccoli, R. M.; Braibante, H. T. S.; Braibante, M. E. F.; Pizzolatti, M. G. *Eur. J. Med. Chem.* **2011**, *46*, 4448.
- [6] Guo, R. H.; Zhang, Q.; Ma, Y. B.; Luo, J.; Geng, C. A.; Wang, L. J.; Zhang, X. M.; Zhou, J.; Jiang, Z. Y.; Chen, J. J. *Eur. J. Med. Chem.* **2011**, *46*, 307.
- [7] Curreli, F.; Zhang, H.; Zhang, X.; Pyatkin, I.; Victor, Z.; Altieri, A.; Debnath, A. K. *Bioorg. Med. Chem.* **2011**, *19*, 77.
- [8] (a) Rahman, M. M.; Gray, A. I.; Khondkar, P.; Sarker, S. D. *Pharm. Biol.* **2008**, *46*, 356.
(b) Meragelman, T. L.; Tucker, K. D.; McClord, T. G.; Cardel-lina, J. H.; Shoemaker, R. H. *J. Nat. Prod.* **2005**, *68*, 1790.
- [9] Hirpara, K. V.; Aggarwal, P.; Mukherjee, A. J.; Joshi, N.; Burman, A. C. *Curr. Med. Chem.* **2009**, *9*, 138.
- [10] (a) Mao, J.; Hua, Q.; Xie, G.; Guo, J.; Yao, Z.; Shi, D.; Ji, S. *Adv. Synth. Catal.* **2009**, *351*, 635.
(b) Naik, M. M.; Kamat, D. P.; Tilve, S. G.; Kamat, V. P. *Tetrahedron* **2014**, *70*, 5221.
- [11] (a) Parvatkar, P. T.; Parameswaran, P. S.; Tilve, S. G. *Chem. Eur. J.* **2012**, *18*, 5460.
(b) Shen, S. S.; Xu, X. P.; Ji, S. J. *Chin. J. Org. Chem.* **2009**, *29*, 806 (in Chinese).
(沈舒芬, 徐小平, 纪顺俊, 有机化学, **2009**, *29*, 806.)
- [12] (a) Yin, G.; Fan, L.; Ren, T.; Zheng, C.; Tao, Q.; Wu, A.; She, N. *Org. Biomol. Chem.* **2012**, *10*, 8877.
(b) Ahmed, N.; Babu, B. V. *Synth. Commun.* **2013**, *43*, 3044.
- [13] (a) Panarese, J. D.; Waters, S. P. *Org. Biomol. Chem.* **2013**, *11*, 3428.
(b) Wu, X.; Gao, Q.; Liu, S.; Wu, A. *Org. Lett.* **2014**, *16*, 2888.
- [14] (a) Meng, D. J.; Chen, R. X.; Liu, L. T.; Wang, T.; Liu, X. M.; Zhao, W. X. *Chin. J. Org. Chem.* **2015**, *35*, 2108 (in Chinese).
(孟团结, 陈荣祥, 刘澜涛, 王涛, 刘新明, 赵文献, 有机化学, **2015**, *35*, 2108.)
(b) Luo, Q.; Xie, Y. X.; Chen, C. Y.; Yan, S. Y.; Den, W. Y. *Chin. J. Org. Chem.* **2014**, *34*, 2537 (in Chinese).
(罗倩, 谢永新, 陈朝阳, 闫世友, 邓文叶, 有机化学, **2014**, *34*, 2537.)
(c) Hu, F.; Gao, W. C.; Chang, H. H.; Li, X.; Wei, W. L. *Chin. J. Org. Chem.* **2015**, *35*, 1848 (in Chinese).
(胡飞, 高文超, 常宏宏, 李兴, 魏文璇, 有机化学, **2015**, *35*, 1848.)
(d) Wang, D. Y.; Zhang, R. X.; Lin, S.; Deng, R. H.; Yan, Z. H. *Chin. J. Org. Chem.* **2016**, *36*, 2757 (in Chinese).
(王丁意, 张荣兴, 林森, 邓瑞红, 严兆华, 有机化学, **2016**, *36*, 2757.)
- [15] (a) Wang, D. L.; Wu, D.; Zhao, W.; Wang, Y. Y.; Wu, J. Y. *Chin. Chem. Lett.* **2015**, *26*, 251.
(b) Wang, D. L.; Zhou, T.; Xing, J. J.; Qiang, J. H.; Liu, L. *Heterocycles*, **2016**, *92*, 733.
(c) Wang, D. L.; Shi, X. C.; Wang, Y. Y.; Ma, J. *Chin. Chem. Lett.* **2016**, *27*, 261.
- [16] (a) Ye, J. H.; Wu, J.; Huang, N. F.; Zhang, W. C.; Yu, S. Y.; Qin, Z. C.; Wang, Z. Y.; Shang, Y. J. *Chin. J. Org. Chem.* **2010**, *30*, 1548 (in Chinese).
(叶家海, 吴俊, 黄年峰, 张文超, 余述燕, 秦志春, 王智勇, 商永嘉, 有机化学, **2010**, *30*, 1548.)
(b) Munawar, M. A.; Azad, M.; Siddiqui, H. L.; Nasim, F. H. *J. Chin. Chem. Soc.* **2008**, *55*, 394.
(c) Azad, M.; Munawar, M. A.; Siddiqui, H. L. *J. Applied Sci.* **2007**, *7*, 2485.
- [17] (a) Wang, D. L.; Yang, F. F.; Liu, Z.; Dong, Z.; Zhao, W. *Chin. J. Org. Chem.* **2014**, *34*, 204 (in Chinese).
(王道林, 杨菲菲, 刘忠, 董哲, 赵伟, 有机化学, **2014**, *34*, 204.)
(b) Gao, W. T.; Cheng, X. P.; Li, Y. *Chin. J. Org. Chem.* **2010**, *30*, 456 (in Chinese).
(高文涛, 程秀萍, 李阳, 有机化学, **2010**, *30*, 456.)

- [18] (a) Menezes, M. J.; Manjrekar, S.; Pai, V.; Patre, R. E.; Tilve, S. G. *Indian J. Chem., Sect. B* **2009**, *48*, 1311.
(b) Gao, W.; Li, Y.; Zhang, H.; Chang, M. Q.; Imafuku, K. *J. Heterocycl. Chem.* **2009**, *46*, 1107.
- [19] Santosusso, T. M.; Swern, D. *J. Org. Chem.* **1975**, *40*, 2764.
- [20] Chen, H.; Li, J.; Chen, G. L.; Zhou, X.; Lu, X. H. *Chem. Reag.* **2010**, *32*, 80 (in Chinese).
(陈浩, 李杰, 陈国良, 周勋, 陆秀宏, 化学试剂, **2010**, *32*, 80.)
(Li, L.; Fan, Y.)