三组分一锅法合成 3-苯并[d]咪唑色烯衍生物

王翔* 陈平 支三军 胡华友 阚玉和 张载超*

(淮阴师范学院化学化工学院 江苏省低维材料化学重点实验室 江苏淮安 223300)

摘要 苯并咪唑和色烯类化合物具有广泛的生物活性, 同时含有苯并咪唑和色烯骨架的杂环化合物具有较强的 Rho 激酶抑制活性。然而, 目前还缺乏有效的合成方法来制备该类化合物。报道了芳醛、2-氰甲基苯并咪唑和 5,5-二甲基-1,3-环己二酮的三组分串联反应, 合成了一系列多取代 3-苯并咪唑色烯衍生物, 产率为 48%~89%。该反应以乙醇为溶剂, 吡啶为催化剂, 在回流条件下反应 1~3 h 即可得到目标产物。

关键词 苯并咪唑; 色烯; 多组分反应; 杂环骨架

One-Pot Three-Component Synthesis of 3-(1*H*-Benzo[d]imidazol-2-yl)chromen Derivatives

Wang, Xiang* Chen, Ping Zhi, Sanjun Hu, Huayou Kan, Yuhe Zhang, Zaichao*

(Jiangsu Key Laboratory for Chemistry of Low-Dimensional Materials, School of Chemistry and Chemical Engineering, Huaiyin Normal University, Huai'an, Jiangsu 223300)

Abstract Benzoimidazole and chromen derivatives exhibit a variety of important biological activities. Chromens incorporating benzoimidazole moiety have high Rho kinase inhibitory activity. However, the effective synthetic method for the preparation of these compounds is rare. The efficient synthesis of new substituted 3-(1*H*-benzo[d]imidazol-2-yl)-4*H*-chromens in 48%~89% yields via one-pot, three-component reaction of 2-(1*H*-benzo[d]imidazol-2-yl)acetonitrile with aromatic aldehydes and 5,5-dimethylcyclohexane-1,3-dione was studied. This reaction was carried out in EtOH in the presence of pyridine under reflux conditions. All reactions were completed within 1 to 3 h.

Keywords benzoimidazole; chromen; multicomponent reaction; heterocyclic skeleton

色烯类化合物存在于多种天然产物中, 具有重要的生理和药理活性, 如抗菌、抗肿瘤和抗病毒等活性^[1]。苯并咪唑类化合物具有抗高血压、抗寄生虫、镇痛等活性, 是药物研发领域的研究热点^[2]。因此, 苯并咪唑和色烯类化合物的合成方法受到有机合成工作者的广泛关注。同时含有苯并咪唑 **I** 和色烯结构 **II** 的杂环化合物(图 1)具有较强的 Rho 激酶抑制活性^[3]。然而, 对于该类重要杂环化合物的制备, 目前还缺少有效的合成方法。

多组分反应可以从简单易得的起始原料出发, 通过高效的转化过程, 实现结构复杂多样的有机小分子化合物库的构建^[4]。与传统的多步反应相比, 这种合成策略可以有效避免官能团的保护和脱保护等操作步骤, 减少

图 1 含苯并咪唑和色烯结构的药物活性分子

Figure 1 Medicinal structures containing benzimidazole and chromen

试剂和溶剂的使用以及废弃物的排放, 具有更高的原子经济性、步骤经济性和成键的有效性。

发展反应条件温和、后处理方便和环境友好的多组分反应来构建同时含有苯并咪唑和色烯骨架的杂环化合物库, 对 Rho 激酶抑制剂等新药的研究开发具有重要

* Corresponding authors. E-mail: hurricanwx@163.com; zhangzc@hytc.edu.cn

Received March 17, 2019; revised May 21, 2019; published online June 19, 2019.

Project supported by the National Natural Science Foundation of China (Nos. 21601061, 51403073), the Department of Education of Jiangsu Province (No. 16KJB150006) and the Jiangsu Key Laboratory for Chemistry of Low-Dimensional Materials (No. JSKC15145).

国家自然科学基金(Nos. 21601061, 51403073)、江苏省高校园面上基金(No. 16KJB150006)、江苏省低维材料化学重点实验室开放基金(No. JSKC15145)资助项目。

意义^[5]. 本工作实现了在吡啶催化下, 芳醛、2-氰甲基苯并咪唑和 5,5-二甲基-1,3-环己二酮的三组分反应, 在温和的条件下高效合成了一系列 2-氨基-3-(1*H*-苯并[*d*]咪唑)-4-芳基-7,7-二甲基-7,8-二氢-4*H*-苯并吡喃-5-酮. 产物的结构经过核磁共振氢谱、碳谱和高分辨质谱的证实.

1 结果与讨论

本课题组研究了四溴化碳促进下芳醛与 2-氰甲基苯并咪唑的缩合反应, 高效制备了一系列 2-(1*H*-苯并[*d*]咪唑)-3-芳基丙烯腈衍生物^[6]. 我们设想如果在上述反应体系中引入烯醇类化合物, 将有可能构筑含有苯并咪唑结构单元的多取代色烯类化合物.

基于以上设想, 本文研究了四溴化碳促进下 4-溴苯甲醛(2a)、2-氰甲基苯并咪唑(1)和 5,5-二甲基-1,3-环己二酮(3)的三组分串联反应(表 1). 该反应以乙醇为溶剂, 在 0.1 equiv.四溴化碳促进下, 回流反应 2 h, 以 31%的产率得到 2-氨基-3-(1*H*-苯并[*d*]咪唑)-4-(4-溴苯基)-7,7-二甲基-7,8-二氢-4*H*-苯并吡喃-5-酮. 产物的结构经核磁共振氢谱和碳谱的表征. 随后对反应条件进行了筛选, 实验结果表明, 上述三组分反应在不同的有机碱催化下均可顺利发生反应, 其中以吡啶为催化剂时, 产率最高.

表 1 反应条件优化^a

Table 1 Optimization of reaction conditions

Entry	Catalyst	Yield ^b /%
1	CBr ₄	31
2	Et ₃ N	79
3	Piperidine	29
4	Morpholine	65
5	Pyridine	85

^a Reaction condition: 2-(1*H*-benzo[*d*]imidazol-2-yl)acetonitrile (1, 1.0 mmol), 4-bromobenzaldehyde (2a, 1.0 mmol), 5,5-dimethylcyclohexane-1,3-dione (3, 1.0 mmol), catalyst (0.1 mmol), solvent (2 mL). ^b Isolated yield.

在条件优化的基础上, 考察了该反应对底物的适用范围(表 2). 当芳醛环上连有吸电子基团时, 反应时间较短, 且产率较高. 以 3-硝基苯甲醛(2e)为原料时, 产率

表 2 3-(1*H*-苯并[*d*]咪唑)-4*H*-苯并吡喃衍生物 4 合成^a

Table 2 Synthesis of 3-(1*H*-benzo[*d*]imidazol-2-yl)-4*H*-chromen derivatives 4

Entry	4	Ar	Time/h	Yield ^b /%
1	4a	4-Bromophenyl	2	85
2	3b	4-Chlorophenyl	2	79
3	4c	4-Fluorophenyl	2	72
4	4d	4-Methoxyphenyl	3	56
5	4e	3-Nitrophenyl	1	89
6	4f	2-Cyanophenyl	2	48
7	4g	2,3-Dichlorophenyl	2	79
8	4h	2,4-Dichlorophenyl	2	75
9	4i	3,4-Dichlorophenyl	2	63

^a Reaction condition: 2-(1*H*-benzo[*d*]imidazol-2-yl)acetonitrile (1, 1.0 mmol), aromatic aldehyde (2, 1.0 mmol), 5,5-dimethylcyclohexane-1,3-dione (3, 1.0 mmol), pyridine (0.1 mmol), solvent (2 mL). ^b Isolated yield.

达 89%. 当芳醛环上连有卤素时, 反应的产率为 63%~85%. 当芳醛环上连有供电子基团时, 反应时间需要延长, 且产率有所降低, 为 56%. 可能的原因是芳醛环上连有供电子基团时, 降低了醛羰基的缺电子程度, 不利于亲核试剂的进攻. 当芳醛组分为苯甲醛或 3-甲基噻吩-2-甲醛时, 或将 5,5-二甲基-1,3-环己二酮换为 1,3-环己二酮时, 反应得到一类新产物, 没有发现目标产物生成. 新产物的结构和反应历程正在进一步研究中. 以脂肪醛为原料时, 2-氰甲基苯并咪唑没有参与反应. 将 5,5-二甲基-1,3-环己二酮换为乙酰丙酮时, 得到的产物是芳醛和 2-氰甲基苯并咪唑的缩合产物. 可能的原因是乙酰丙酮的亲核性相对较弱, 不能进行后续的反应.

根据实验事实推测了可能的反应机理(Scheme 1). 首先, 芳醛和 2-氰甲基苯并咪唑在碱性条件下缩合, 得到中间体 5, 随后与 5,5-二甲基-1,3-环己二酮(3)发生亲核加成反应, 生成中间体 6. 进而发生分子内环化反应, 异构化得到目标产物 4.

2 结论

报道了芳醛、2-氰甲基苯并咪唑和 5,5-二甲基-1,3-环己二酮的三组分串联反应, 简便高效地合成了一系列 2-氨基-3-(1*H*-苯并[*d*]咪唑)-4-芳基-7,7-二甲基-7,8-二氢-4*H*-苯并吡喃-5-酮衍生物. 反应以乙醇为溶剂, 在吡啶催化下反应 1~3 h, 即可以 48%~89%的产率得到目标

图式 1 可能的反应机理

Scheme 1 Proposed reaction mechanism

产物。该方法对反应底物具有良好的普适性, 当芳醛环上连有供电子基团或吸电子基团时, 反应都可以顺利发生。反应条件温和, 后处理方便, 为构建同时含有苯并咪唑和色烯结构的杂环骨架提供了高效的合成策略。

3 实验部分

3.1 仪器与试剂

核磁共振(NMR)波谱仪(AVANCE 400 MHz 德国 Bruker BioSpin 公司), DMSO- d_6 为溶剂, TMS 为内标; 傅立叶变换红外光谱仪-FTIR (iS50 美国、尼高力)。所用试剂均为市售分析纯。

3.2 实验方法

在 25 mL 圆底烧瓶中加入芳醛(1.0 mmol)、2-氰甲基苯并咪唑(1.0 mmol)、5,5-二甲基-1,3-环己二酮(1.0 mmol)、吡啶(0.1 mmol)以及 2 mL 无水乙醇, 在回流条件下反应, 薄层色谱(TLC)跟踪反应。反应结束后, 冷却至室温, 产物析出, 抽滤, 粗品用乙醇洗涤, 得 2-氨基-3-(1*H*-苯并[*d*]咪唑-4-芳基-7,7-二甲基-7,8-二氢-4*H*-苯并吡喃-5-酮)。所有目标产物的结构经红外光谱、核磁共振氢谱、碳谱以及高分辨质谱表征。

2-氨基-3-(1*H*-苯并[*d*]咪唑-4-(4-溴苯基)-7,7-二甲基-7,8-二氢-4*H*-苯并吡喃-5-酮(**4a**): 黄色固体。m.p. 227~228 °C; ^1H NMR (DMSO- d_6 , 400 MHz) δ : 11.80 (s, 1H), 7.88 (s, 2H), 7.42~7.35 (m, 5H), 7.30 (d, $J=6.8$ Hz, 1H), 7.04~7.01 (m, 2H), 4.98 (s, 1H), 2.60 (d, $J=17.6$ Hz, 1H), 2.49~2.32 (m, 2H), 2.11 (d, $J=16.0$ Hz, 1H), 1.06 (s, 3H), 0.88 (s, 3H); ^{13}C NMR (DMSO- d_6 , 100 MHz) δ : 196.4, 163.4, 154.2, 153.3, 145.6, 143.4, 134.1, 131.3,

130.3, 121.4, 121.1, 119.7, 117.0, 115.10, 110.7, 76.2, 50.5, 33.2, 32.3, 29.2, 26.8; IR (KBr) ν : 3445, 3216, 1682, 1647, 1532, 1484, 1454, 1378, 1278, 1230 cm^{-1} ; HRMS (ESI) calcd for $\text{C}_{24}\text{H}_{21}\text{BrN}_3\text{O}_2$ ($\text{M}-\text{H}$) $^+$ 463.0895, found 463.0908.

2-氨基-3-(1*H*-苯并[*d*]咪唑-4-(4-氯苯基)-7,7-二甲基-7,8-二氢-4*H*-苯并吡喃-5-酮(**4b**): 黄色固体。m.p. 227~228 °C; ^1H NMR (DMSO- d_6 , 400 MHz) δ : 11.81 (s, 1H), 7.89 (s, 2H), 7.44~7.42 (m, 3H), 7.31 (d, $J=6.8$ Hz, 1H), 7.26 (d, $J=7.2$ Hz, 2H), 7.06~7.00 (m, 2H), 5.01 (s, 1H), 2.59 (d, $J=17.6$ Hz, 1H), 2.46 (d, $J=17.6$ Hz, 1H), 2.34 (d, $J=16.0$ Hz, 1H), 2.11 (d, $J=16.0$ Hz, 1H), 1.06 (s, 3H), 0.87 (s, 3H); ^{13}C NMR (DMSO- d_6 , 100 MHz) δ : 196.4, 163.4, 154.2, 153.3, 145.2, 143.4, 134.1, 131.2, 129.9, 128.4, 121.4, 121.1, 117.0, 115.2, 110.7, 76.3, 50.5, 33.2, 32.3, 29.2, 26.8; IR (KBr) ν : 3446, 3215, 1683, 1647, 1529, 1479, 1454, 1378, 1278, 1253 cm^{-1} ; HRMS (ESI) calcd for $\text{C}_{24}\text{H}_{21}\text{ClN}_3\text{O}_2$ ($\text{M}-\text{H}$) $^+$ 418.1322, found 418.1348.

2-氨基-3-(1*H*-苯并[*d*]咪唑-4-(4-氟苯基)-7,7-二甲基-7,8-二氢-4*H*-苯并吡喃-5-酮(**4c**): 黄色固体。m.p. 235~236 °C; ^1H NMR (DMSO- d_6 , 400 MHz) δ : 11.81 (s, 1H), 7.86 (s, 2H), 7.45~7.40 (m, 3H), 7.31 (d, $J=6.8$ Hz, 1H), 7.04~7.00 (m, 4H), 5.01 (s, 1H), 2.60 (d, $J=16.0$ Hz, 1H), 2.47 (d, $J=18.4$ Hz, 1H), 2.34 (d, $J=16.4$ Hz, 1H), 2.12 (d, $J=16.0$ Hz, 1H), 1.06 (s, 3H), 0.88 (s, 3H); ^{13}C NMR (DMSO- d_6 , 100 MHz) δ : 196.4, 163.2, 162.3, 159.9, 154.2, 153.4, 143.4, 142.4, 142.4, 134.1, 129.8, 129.8, 121.4, 121.0, 116.9, 115.5, 115.2, 114.9, 110.7, 76.6, 50.6, 32.9, 32.4, 29.2, 26.8; IR (KBr) ν : 3441, 3290, 1682, 1638, 1616, 1529, 1504, 1380, 1356, 1276, 1223 cm^{-1} ; HRMS (ESI) calcd for $\text{C}_{24}\text{H}_{21}\text{FN}_3\text{O}_2$ ($\text{M}-\text{H}$) $^+$ 402.1618, found 402.1634.

2-氨基-3-(1*H*-苯并[*d*]咪唑-4-(4-甲氧基苯基)-7,7-二甲基-7,8-二氢-4*H*-苯并吡喃-5-酮(**4d**): 黄色固体。m.p. 206~207 °C; ^1H NMR (DMSO- d_6 , 400 MHz) δ : 11.76 (s, 1H), 7.80 (s, 2H), 7.41 (d, $J=7.2$ Hz, 1H), 7.33~7.31 (m, 3H), 7.05~7.00 (m, 2H), 6.75 (d, $J=8.4$ Hz, 2H), 4.93 (s, 1H), 3.63 (s, 3H), 2.58 (d, $J=17.6$ Hz, 1H), 2.46 (d, $J=17.6$ Hz, 1H), 2.32 (d, $J=16.0$ Hz, 1H), 2.10 (d, $J=16.0$ Hz, 1H), 1.06 (s, 3H), 0.89 (s, 3H); ^{13}C NMR (DMSO- d_6 , 100 MHz) δ : 196.4, 162.9, 158.0, 154.1, 153.5, 143.4, 138.3, 134.1, 129.0, 121.4, 121.0, 116.9, 115.8, 113.8, 110.7, 77.1, 55.3, 50.6, 32.8, 32.3, 29.3, 26.8; IR (KBr) ν : 3449, 3283, 1680, 1639, 1617, 1541, 1508, 1454, 1378,

1257, 1225 cm^{-1} ; HRMS (ESI) calcd for $\text{C}_{25}\text{H}_{24}\text{N}_3\text{O}_3$ ($\text{M}-\text{H}$)⁺ 414.1818, found 414.1817.

2-氨基-3-(1*H*-苯并[d]咪唑)-7,7-二甲基-4-(3-硝基苯基)-7,8-二氢-4*H*-苯并吡喃-5-酮(**4e**): 黄色固体. m.p. 245~246 °C; ¹H NMR (DMSO-*d*₆, 400 MHz) δ : 11.29 (s, 1H), 8.36 (s, 1H), 8.00~7.95 (m, 3H), 7.83 (d, *J*=7.6 Hz, 1H), 7.53 (t, *J*=8.0 Hz, 1H), 7.42 (d, *J*=7.2 Hz, 1H), 7.30 (d, *J*=7.2 Hz, 1H), 7.05~7.00 (m, 2H), 5.19 (s, 1H), 2.62 (d, *J*=17.6 Hz, 1H), 2.51 (d, *J*=16.4 Hz, 1H), 2.35 (d, *J*=16.0 Hz, 1H), 2.14 (d, *J*=16.0 Hz, 1H), 1.06 (s, 3H), 0.86 (s, 3H); ¹³C NMR (DMSO-*d*₆, 100 MHz) δ : 196.5, 163.8, 154.4, 153.1, 148.5, 148.0, 143.4, 134.7, 134.1, 130.0, 122.9, 121.9, 121.5, 121.2, 117.0, 114.7, 110.7, 75.6, 50.4, 33.6, 32.4, 29.2, 26.7; IR (KBr) ν : 3431, 3353, 1678, 1646, 1522, 1478, 1377, 1350, 1277, 1229 cm^{-1} ; HRMS(ESI) calcd for $\text{C}_{24}\text{H}_{21}\text{N}_4\text{O}_4$ ($\text{M}-\text{H}$)⁺ 429.1563, found 429.1590.

2-(2-氨基-3-(1*H*-苯并[d]咪唑)-7,7-二甲基-5-氧代-5,6,7,8-四氢-4*H*-苯并吡喃)-苯甲腈(**4f**): 黄色固体. m.p. 223~224 °C; ¹H NMR (DMSO-*d*₆, 400 MHz) δ : 11.55 (s, 1H), 8.10 (d, *J*=8.0 Hz, 1H), 7.86 (s, 2H), 7.63 (d, *J*=7.6 Hz, 1H), 7.55 (t, *J*=7.6 Hz, 1H), 7.39 (d, *J*=7.2 Hz, 1H), 7.30~7.23 (m, 2H), 7.03~7.01 (m, 2H), 5.16 (s, 1H), 2.63 (d, *J*=17.2 Hz, 1H), 2.50~2.30 (m, 2H), 2.10 (d, *J*=16.4 Hz, 1H), 1.08 (s, 3H), 0.98 (s, 3H); ¹³C NMR (DMSO-*d*₆, 100 MHz) δ : 196.4, 163.7, 153.8, 153.3, 150.8, 135.1, 132.6, 132.2, 127.6, 118.0, 111.9, 110.7, 74.8, 50.5, 35.3, 32.1, 29.2, 27.3; IR (KBr) ν : 3444, 3376, 2223, 1683, 1666, 1635, 1521, 1457, 1371, 1279, 1253 cm^{-1} ; HRMS (ESI) calcd for $\text{C}_{25}\text{H}_{21}\text{N}_4\text{O}_2$ ($\text{M}-\text{H}$)⁺ 409.1665, found 409.1698.

2-氨基-3-(1*H*-苯并[d]咪唑)-4-(2,3-二氯苯基)-7,7-二甲基-7,8-二氢-4*H*-苯并吡喃-5-酮(**4g**): 黄色固体. m.p. 241~242 °C; ¹H NMR (DMSO-*d*₆, 400 MHz) δ : 11.48 (s, 1H), 7.84 (d, *J*=8.4 Hz, 1H), 7.80 (s, 2H), 7.40~7.24 (m, 4H), 7.06~7.00 (m, 2H), 5.32 (s, 1H), 2.62 (d, *J*=17.6 Hz, 1H), 2.47 (d, *J*=18.0 Hz, 1H), 2.32 (d, *J*=16.0 Hz, 1H), 2.10 (d, *J*=16.4 Hz, 1H), 1.07 (s, 3H), 0.95 (s, 3H); ¹³C NMR (DMSO-*d*₆, 100 MHz) δ : 196.3, 164.2, 154.3, 153.3, 143.9, 143.2, 134.0, 133.0, 132.2, 130.6, 129.2, 127.7, 121.5, 121.2, 117.0, 112.1, 110.8, 74.0, 50.5, 35.6, 32.2, 29.2, 27.0; IR (KBr) ν : 3450, 3328, 1686, 1636, 1525, 1454, 1426, 1379, 1277, 1253 cm^{-1} ; HRMS (ESI) calcd for $\text{C}_{24}\text{H}_{20}\text{Cl}_2\text{N}_3\text{O}_2$ ($\text{M}-\text{H}$)⁺ 452.0933, found 452.0950.

2-氨基-3-(1*H*-苯并[d]咪唑)-4-(2,4-二氯苯基)-7,7-二甲基-7,8-二氢-4*H*-苯并吡喃-5-酮(**4h**): 黄色固体. m.p. 219~220 °C; ¹H NMR (DMSO-*d*₆, 400 MHz) δ : 11.49 (s, 1H), 7.92 (d, *J*=6.8 Hz, 1H), 7.80 (s, 2H), 7.39 (d, *J*=6.4 Hz, 1H), 7.34~7.30 (m, 3H), 7.04~7.02 (m, 2H), 5.23 (s, 1H), 2.62 (d, *J*=17.6 Hz, 1H), 2.50~2.30 (m, 2H), 2.08 (d, *J*=16.4 Hz, 1H), 1.06 (s, 3H), 0.95 (s, 3H); ¹³C NMR (DMSO-*d*₆, 100 MHz) δ : 196.3, 164.0, 154.2, 153.3, 143.3, 140.1, 135.0, 134.0, 133.5, 132.2, 130.1, 126.9, 121.5, 121.2, 117.0, 111.8, 110.7, 73.9, 50.5, 34.5, 32.2, 29.3, 26.9; IR (KBr) ν : 3433, 3315, 1681, 1640, 1560, 1546, 1528, 1467, 1454, 1407, 1274 cm^{-1} ; HRMS (ESI) calcd for $\text{C}_{24}\text{H}_{20}\text{Cl}_2\text{N}_3\text{O}_2$ ($\text{M}-\text{H}$)⁺ 452.0933, found 452.0933.

2-氨基-3-(1*H*-苯并[d]咪唑)-4-(3,4-二氯苯基)-7,7-二甲基-7,8-二氢-4*H*-苯并吡喃-5-酮(**4i**): 黄色固体. m.p. 220~221 °C; ¹H NMR (DMSO-*d*₆, 400 MHz) δ : 11.84 (s, 1H), 7.98 (s, 2H), 7.70 (s, 1H), 7.48 (d, *J*=8.4 Hz, 1H), 7.43 (d, *J*=6.4 Hz, 1H), 7.32 (d, *J*=8.0 Hz, 2H), 7.04~7.02 (m, 2H), 5.03 (s, 1H), 2.59 (d, *J*=17.6 Hz, 1H), 2.50~2.32 (m, 2H), 2.14 (d, *J*=16.0 Hz, 1H), 1.06 (s, 3H), 0.88 (s, 3H); ¹³C NMR (DMSO-*d*₆, 100 MHz) δ : 196.5, 163.7, 154.3, 153.1, 147.2, 143.4, 134.1, 130.8, 130.8, 130.3, 129.2, 128.2, 121.5, 121.2, 117.0, 114.6, 110.7, 75.6, 56.5, 50.5, 33.1, 32.4, 29.1, 26.8; IR (KBr) ν : 3446, 3220, 1677, 1644, 1577, 1457, 1379, 1268, 1222, 1168 cm^{-1} ; HRMS (ESI) calcd for $\text{C}_{24}\text{H}_{20}\text{Cl}_2\text{N}_3\text{O}_2$ ($\text{M}-\text{H}$)⁺ 452.0933, found 452.0932.

辅助材料(Supporting Information) 目标化合物的 ¹H NMR 和 ¹³C NMR. 这些材料可以免费从本刊网站 (<http://sioc-journal.cn/>)上下载.

References

- [1] (a) Qiang, D. Z.; Shi, J. B.; Song, B. A.; Liu, X. H. *RSC Adv.* **2014**, 4, 5607.
(b) Sashidhara, K. V.; Rosaiah, J. N.; Bhatia, G.; Saxena, J. K. *Eur. J. Med. Chem.* **2008**, 43, 2592.
(c) Ding, X.; Xu, F. *Chin. J. Org. Chem.* **2018**, 38, 3345 (in Chinese).
(丁晓友, 徐凡, 有机化学, **2018**, 38, 3345.)
- [2] (a) Akhtar, W.; Faraz Khan, M.; Verma, G.; Shaquiquzzaman, M.; Rizvib, M. A.; Hassan Mehdi, S.; Akhter, M.; Mumtaz Alam, M. *Eur. J. Med. Chem.* **2017**, 126, 705.
(b) Bansal, Y.; Silakari, O. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2012**, 20, 6208.
(c) Yan, L.; Hou, Y.; Li, X.; Chen, H. *Chin. J. Org. Chem.* **2018**, 38, 3332 (in Chinese).
(闫连海, 侯宇恒, 李小六, 陈华, 有机化学, **2018**, 38, 3332.)
(d) Zhang, Z.; Zheng, X.; Guo, C. *Chin. J. Org. Chem.* **2016**, 36, 1241 (in Chinese).
(张钊瑞, 郑晓霖, 郭长彬, 有机化学, **2016**, 36, 1241.)
(e) Cheng, Z.; Zhang, Q. F.; Xu, X. L.; Li, X. N. *Chin. J. Org.*

Chem. **2015**, *35*, 1189 (in Chinese).

(程正, 张群峰, 许孝良, 李小年, 有机化学, **2015**, *35*, 1189.)

- [3] (a) Sessions, E. H.; Yin, Y.; Bannister, T. D.; Weiser, A.; Griffin, E.; Pocas, J.; Cameron, M. D.; Ruiz, C.; Lin, L.; Schürer, S. C.; Schröter, T.; LoGrasso, P.; Feng, Y. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2008**, *18*, 6390.

(b) Sessions, E. H.; Smolinski, M.; Wang, B.; Frackowiak, B.; Chowdhury, S.; Yin, Y.; Chen, Y. T.; Ruiz, C.; Lin, L.; Pocas, J.; Schröter, T.; Cameron, M. D.; LoGrasso, P.; Feng, Y.; Bannister, T. D. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2010**, *20*, 1939.

- [4] (a) Cioc, R. C.; Ruijter, E.; Orru, R. V. A. *Green Chem.* **2014**, *16*, 2958.

(b) Sunderhaus, J. D.; Dockendorff, C.; Martin, S. F. *Org. Lett.* **2007**, *9*, 4223.

(c) Dömling, A.; Wang, W.; Wang, K. *Chem. Rev.* **2012**, *112*, 3083.

- [5] Fadda, A. A.; Youssif, E. H. E. *Synth. Commun.* **2011**, *41*, 677.

- [6] Wang, X.; Chen, P.; Zhi, S.; Hu, H.; Kan, Y. *Chin. J. Org. Chem.* **2018**, *38*, 3123 (in Chinese).

(王翔, 陈平, 支三军, 胡华友, 阚玉和, 有机化学, **2018**, *38*, 3123.)

(Cheng, F.)

更 正

2019 年第 39 卷第 1 期

从 α -三氟甲基苄溴合成烷基硫酸盐——脱卤亚磺化反应的延伸

付晓林^a 孙 岩^{*,b} 赵志刚^{*,a} 郭 勇^b 陈庆云^b 念保义^c

(^a 西南民族大学化学与环境保护工程学院 成都 610041)

(^b 中国科学院上海有机化学研究所 上海 200032)

(^c 三明学院三明氟化工产业技术研究院 三明 365004)

第 144 页的页脚处删除第 3 行 “Dedicated to Professor Qingyun Chen on the occasion of his 90th birthday”。第 145 页第 2 栏 Scheme 2 中, 第 2 个和第 3 个结构式下面数据分别修改为 δ : -61.3 (d) 和 δ : -76.4.