

LÜHIKOKKUVÕTE

Käesoleva töö raames töötati välja uus organokatalüütiline kaskaadreaktsioon enantiomeerselt puhaste oksa-spirooksindoolide **51(a-k)**, **71(a-f)** ja **73** sünteesiks. Kaskaad põhineb aldoolreaktsioonil ja sellele järgneval oksa-Michaeli liitumisel konjugeeritud süsteemil. Lähteainetena kasutati enoliseeruvaid küllastumata 1,4-diketoone **50(a-j)** ning isatiini **2b** või selle derivaate **70(a-f)**, **72**. Kaskaadreaktsiooni katalüüsib efektiivselt bifunktsionaalne tiokarbamiid **63**. Saadud produktid **51(a-j)**, **71(a-f)**, **73** sisaldavad ühte kvaternaarset ja ühte tertsaarset stereotsentrit. Leitud reaktsioonid kulgevad kõrge enantio- ja diastereoselektiivsusega (*ee* kuni 99%; d.r. kuni >25:1) ning tekkinud produktidel on üldiselt kõrge saagis (47%-96%). Samuti leiti, et pürrooli tsükli sisaldava küllastumata 1,4-diketooni **51j** korral on võimalik saada kolmekordse kaskaadi pentatsükliilist produkti **51k** (*ee* = 99%, d.r = 4,5:1), millel on kaks kvaternaarset ja üks tertsaarne stereotsenter.

ABSTRACT

An efficient organocatalytic method was developed for the synthesis of new enantioenriched oxa-spirooxindoles **51(a-k)**, **71(a-f)** and **73**. The cascade reaction between enolizable unsaturated 1,4-diketones **50(a-j)** and isatin **2b** or its derivatives **70(a-f)**, **72** was catalyzed by chiral bifunctional thiourea catalyst **63**. The cascade consists of aldol reaction followed by oxa-Michael addition to the conjugated system. All reactions proceeded smoothly giving the desired products in excellent enantioselectivities (up to 99%) and diastereoselectivities (up to >25:1) and generally high yields (47%-96%). The synthesized products **51(a-j)**, **71(a-f)**, **73** contain one quaternary and one tertiary stereocenter. It has been found that the triple cascade reaction could occur between pyrrole fragment containing enolizable unsaturated 1,4-diketone **51j** and isatin **2b**, providing the pentacyclic product **51k** with two quaternary and one tertiary stereocenter (*ee* = 99%, d.r = 4.5:1).