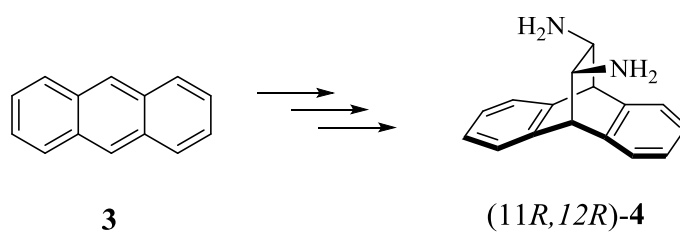


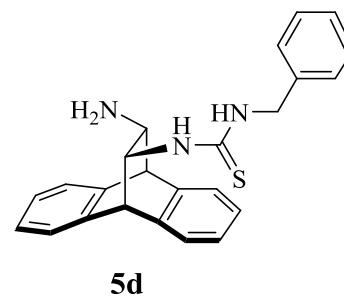
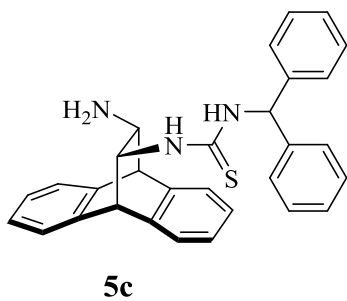
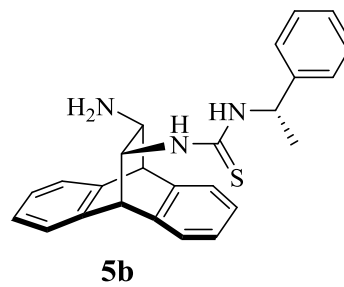
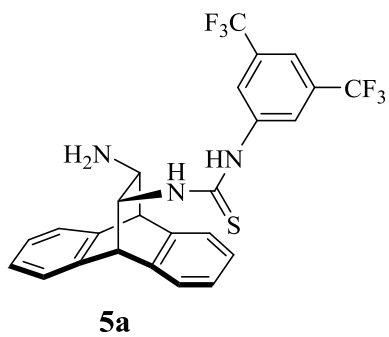
CAPÍTULO 6

CONCLUSIONES

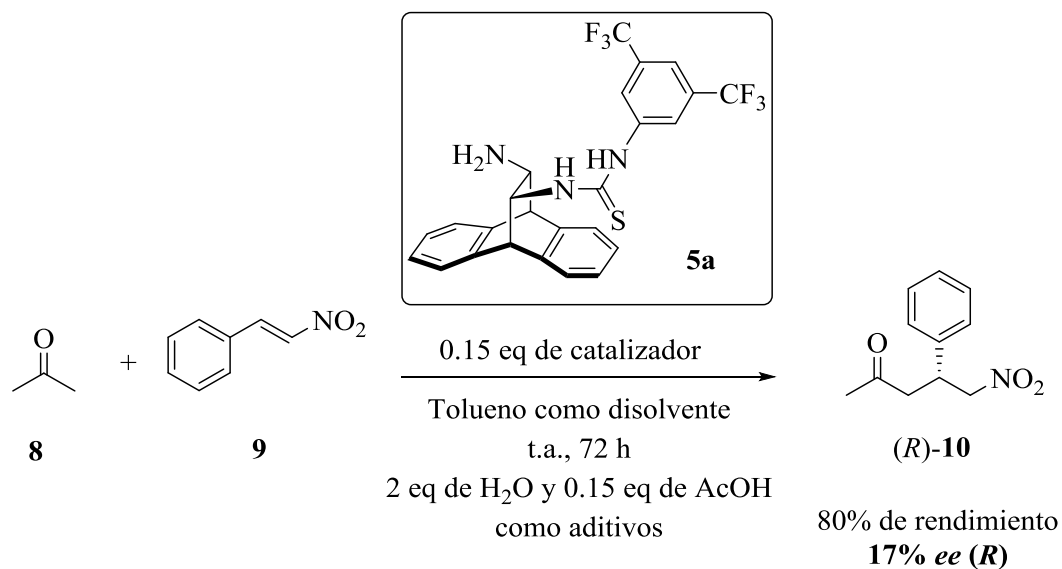
1. Se sintetizaron cinco nuevos organocatalizadores bifuncionales **5a**, **5b**, **5c**, **5d**, y **7**, a partir de la diamina enantioméricamente pura (*R,R*)-11,12-diamino-9,10-dihidro-9,10-etanoantraceno, (*11R,12R*)-**4**, la cual fue preparada siguiendo la metodología descrita en la literatura por el grupo de Fox.²⁶

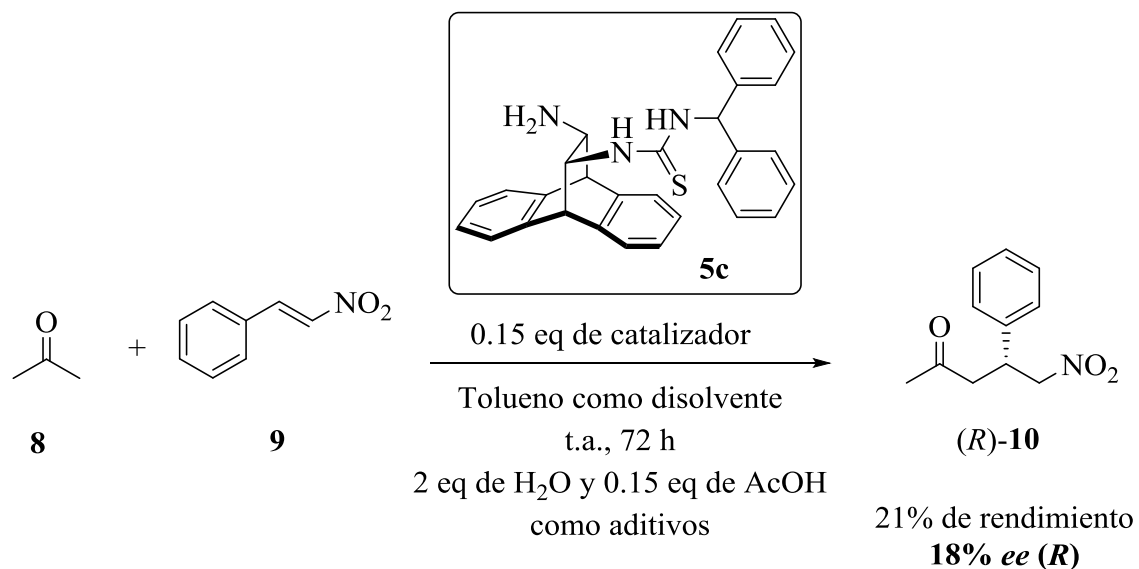


2. Primeramente la diamina (11*R*,12*R*)-**4** fue puesta a reaccionar con los isotiocianatos correspondientes para dar paso a la formación de las aminotiureas primarias **5a-d** en rendimientos que van del 88 al 91%.

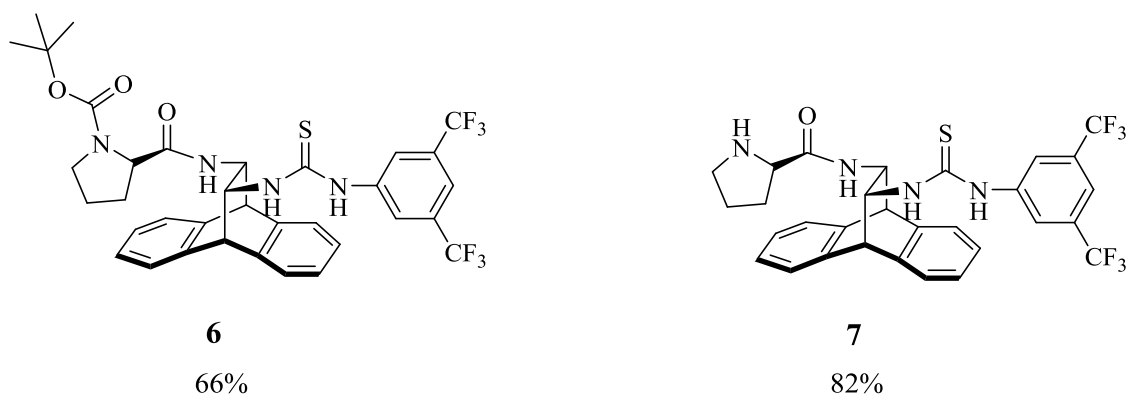


3. Una vez obtenidas las monotioureas se llevó a cabo la prueba de las mismas en la reacción de Michael utilizando las condiciones reportadas en la literatura por el grupo de Schmatz.⁸ Los resultados obtenidos indicaron que tanto el organocatalizador **5a** como el organocatalizador **5c** daban las mejores enantioselectividades (17% *ee* y 18% *ee* respectivamente), obteniendo el producto en mejores rendimientos al utilizar el organocatalizador **5a** en comparación a los rendimientos obtenidos con el organocatalizador **5b** (80% y 21% de rendimiento respectivamente).

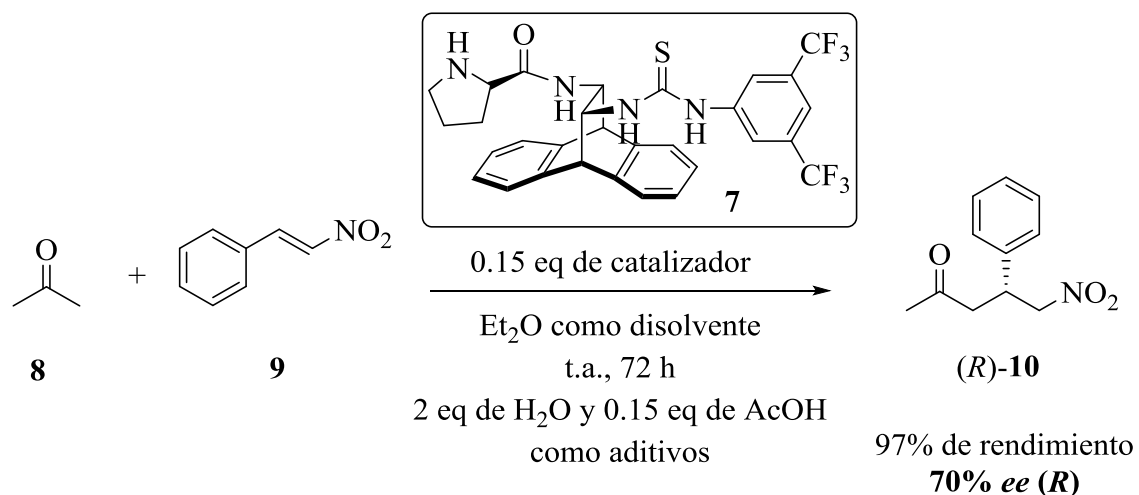




4. En base a estos resultados se decidió sustituir la amina primaria del organocatalizador **5a** con una amina secundaria quiral; por lo que se llevó a cabo la formación de la amida **6** haciendo reaccionar la L-prolina protegida con el grupo Boc con la monotiourea **5a**, obteniendo el producto en un rendimiento del 66%. Finalmente, se llevó a cabo la desprotección de la amida de la L-prolina **6** en condiciones ácidas dando la correspondiente prolinamidotiourea **7** en un rendimiento del 82%.



5. La prolinamido tiourea **7** se probó en la reacción de adición de Michael utilizando las condiciones reportadas por el grupo de Schmatz⁸ se realizó la optimización en base a los resultados obtenidos por el grupo de Xu.²¹ Inicialmente se probó el efecto de 6 distintos disolventes con constantes dieléctricas que iban de 2.2 a 47, obteniendo los mejores resultados con éter dietílico (constante dieléctrica 4.3) al obtener la formación del producto de adición de Michael con un rendimiento del 97% y una enantioselectividad del 70% *ee*. Posteriormente se probó el efecto de agregar agua como aditivo y el efecto de usar aditivos básicos, sin obtener una mejora en los resultados. La obtención de todos los productos se confirmó por espectroscopía de RMN ¹H, ¹³C e IR. Los excesos enantioméricos se determinaron por HPLC usando una columna quiral AS-H.



En conclusión se obtuvieron 4 nuevas aminotioureas primarias, **5a-d**, y una nueva prolinamidotiourea **7** utilizando como esqueleto carbonado a la diamina (*R,R*)-11,12-diamino-9,10,dihidro-9,10-etanoantraceno, (*11R,12R*)-**4**, enantioméricamente pura. El organocatalizador **7** promovió la formación del aducto correspondiente con excelentes rendimientos y enantioselectividades moderadas bajo condiciones de reacción optimizadas. Por lo tanto, se propone llevar a cabo cálculos teóricos para verificar la razón por la cual no se alcanzan mejores enantioselectividades y poder modificar el esqueleto carbonado en base a ello.