

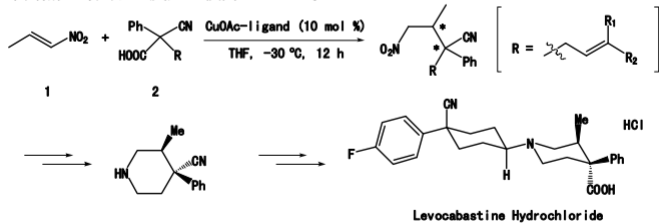
28P-pm382Q

Levocabastine の触媒的不斉合成研究

○王 建一¹, 殷 亮¹, 金井 求¹, 柴崎 正勝¹(¹東大院薬)

<目的> Levocabastine Hydrochloride はアレルギーを抑える点眼薬として使われ、アレルギー性結膜炎の治療に用いられる。この薬は、ヒスタミン H1 受容体に対する親和性・特異性が非常に高いの特徴で、アレルギー症状による目の痒みや充血をすみやかに改善し、花粉症にもよく用いられる。この化合物に関する不斉合成の報告がなかったため、触媒的不斉合成法の開発を目指して、研究を開始した。

<結果> Cu 触媒による **2** からの脱炭酸により求核剤を生成し^[1]、これを **1** へ不斉 Michael 付加反応させることにより、炭素-炭素結合形成と同時に、一挙に二つの不斉点を導入する反応を検討している。



[1] Yin, L.; Kanai, M.; Shibasaki, M.. J. Am. Chem. Soc. 2009, 31, 9610.