



도식 3

본 발명의 식 II 화합물인 (2-메틸-4-옥소-6,7,8,9-테트라하이드로-4H-피리도[1,2-a]피리미딘-3-일)-아세트알데하이드는 3-(2-하이드록시에틸)-2-메틸-6,7,8,9-테트라하이드로-4H-피리도[1,2-a]피리미딘-4-온(X)으로부터 제조된다(이 화합물의 제조는 후지타 등. Ann. Rep. Sankyo Res. 1977, 29, 75-78에 설명되어있다).

식 III 엔아민인 3-2-[4-(6-플로로벤조[d]아이소옥사졸-3-일)-피페리딘-1-일]-비닐-2-메틸-6,7,8,9-테트라하이드로-피리도[1,2-a]피리미딘-4-온은 알데하이드 II로부터 식 IV의 6-플로로-3-(4-피페리디닐)-벤조[d]아이소옥사졸과의 축합반응에 의해 얻어진다(화합물 IV의 제조는 스페인특허 제8405791에 설명되어있다).

출원인들은 식 III의 엔아민이 환원제의 활동에 의해 쉽게 3-2-[4-(6-플로로벤조(D)아이소옥사졸-3-일)-피페리딘-1-일]-에틸-2-메틸-6,7,8,9-테트라하이드로-4H-피리도-(1,2-a)피리미딘-4-온(I)으로 환원될 수 있다는 것을 알아냈다.