

16 Literaturverzeichnis

- [1] J. N. Langley, **1878**, *J. Physiol. (London)*, 1, 339 - 369.
- [2] P. Ehrlich, **1913**, *Lancet*, 2, 445 - 451.
- [3] E. Fischer, **1894**, *Ber. Dtsch. Chem. Ges.*, 27, 2985 - 2993. 673 - 679.
- [4] L. Pauling, **1946**, *Chem. Eng. News*, 24, 1375 - 1377.
- [5] D. E. Koshland Jr., **1958**, *Proc. Natl. Acad. Sci.*, 44, 98 - 103.
- [6] H. J. Böhm, G. Klebe, H. Kubinyi, **1996**, *Wirkstoffdesign*, Steptum Akademischer Verlag, Heidelberg.
- [7] P. R. Andrews, **1993**, *Drug-Receptor Interactions*, H. Kubinyi, Ed., 3D-QSAR in Drug Design. Theory, Methods and Applications, Escom, Leiden, 13 - 40.
- [8] R. B. Silverman, **2002**, *The Organic Chemistry of Drug Design and Drug Action*, Academic Press Oxford.
- [9] A. Kleemann, J. Engel, B. Kutscher, D. Reichert, **1999**, *Pharmaceutical Substances*, 3rd. Edition, Thieme Stuttgart.
- [10] E. V. Jensen, H. I. Jacobson, **1960**, Fate of steroidal estrogens in target tissues. *Biological Activities of Steroids in Relation to Cancer*, G. Pincus, E. P. Vollmer, Eds., Academic Press, New York, 161 - 174.
- [11] M. Muramatsu, S. Inoue, **2000**, *Biochem. Biophys. Res. Commun.*, 270, 1 - 10.
- [12] T. Watanabe, S. Inoue, S. Ogawa, Y. Ishii, H. Hiroi, K. Ikeda, A. Orimo, M. Muramatsu, **1997**, *Biochem. Biophys. Res. Commun.*, 236, 140 - 145.
- [13] G. Leclercq, **2002**, *J. Steroid Biochem. Mol. Biol.*, 80, 259 - 272.
- [14] E. V. Jensen, H. I. Jacobson, **1962**, *Recent Prog. Horm. Res.*, 18, 387 - 414.
- [15] S. Green, P. Walter, V. Kumar, A. Krust, J. M. Bornert, P. Argos, P. Chambon, **1986**, *Nature*, 320, 134 - 139.
- [16] G. L. Greene, P. Gilna, M. Waterfield, A. Baker, Y. Hort, J. Shine, **1986**, *Science*, 231, 1150 - 1154.
- [17] G. G. J. M. Kuiper, E. Enmark, M. Pelto-Huikko, S. Nilsson, J. Å. Gustafsson, **1996**, *Proc. Natl. Acad. Sci. USA*, 93, 5925 - 5930.
- [18] S. Mosselman, J. Polman, R. Dijkema, **1996**, *FEBS Letters*, 392, 49 - 53.
- [19] E. Enmark, M. Pelto-Huikko, K. Grandien, G. Fried, S. Lagerkrantz, J. Lagerkrantz, M. Nordenskjöld, J. Å. Gustafsson, **1997**, *J. Clin. Endocrinol. Metab.*, 82, 4258 - 4265.
- [20] J. Å. Gustafsson, **1999**, *J. Endocrinol.*, 163, 379 - 383.
- [21] E. Leygue, H. Dotzlaw, P. H. Watson, L. C. Murphy, **1998**, *Cancer Res.*, 58, 3197 - 3201.
- [22] V. Speirs, A. T. Parkes, M. J. Kerin, D. S. Walton, P. J. Carleton, J. N. Fox, S. L. Atkin, **1999**, *Cancer Res.*, 59, 525 - 528.
- [23] W. J. King, G. L. Greene, **1984**, *Nature*, 307, 745 - 747.
- [24] W. V. Welshorns, M. E. Lieberman, J. Groski, **1984**, *Nature*, 307, 747 - 749.
- [25] D. C. Márquez, R. J. Pietras, **2001**, *Oncogene*, 20, 5420 - 5430.
- [26] C. E. Powell, A. M. Soto, C. Sonnenschein, **2001**, *J. Steroid Biochem. Mol. Biol.*, 77, 97 - 108.
- [27] E. R. Levin, **2002**, *Steroids*, 67, 471 - 475.

- [28] M. Razandi, A. Pedram, G. L. Greene, E. R. Levin, **1999**, *Mol. Endo.*, 13, 307 - 319.
- [29] M. Razandi, A. Pedram, E. R. Levin, **2000**, *Mol. Endo.*, 14, 1434 - 1447.
- [30] H. Htun, L. T. Holth, D. Walker, J. R. Davie, G. L. Hager, **1999**, *Mol. Bio. Cell.*, 10, 471 - 486.
- [31] S. Ogawa, S. Inoue, T. Watanabe, H. Hiroi, A. Orimo, T. Hosoi, Y. Ouchi, M. Muramatsu, **1998**, *Biochem. Biophys. Res. Com.*, 243, 122 -126.
- [32] V. Kumar, S. Green, A. Staub, P. Chambon, **1986**, *EMBO J.*, 5, 2231 - 2236.
- [33] V. Kumar, S. Green, G. Stack, M. Berry, J. R. Jin, P. Chambon, **1986**, *Cell*, 51, 941 - 951.
- [34] S. Ogawa, S. Inoue, T. Watanabe, A. Orimo, T. Hosoi, Y. Ouchi, M. Muramatsu, **1998**, *Nucleic Acids Res.*, 26, 3505 - 3512.
- [35] V. Giguere, S. M. Hollenberg, M. G. Rosenfeld, R. M. Evans, **1986**, *Cell*, 46, 645 - 652.
- [36] P. J. Godowski, D. Picard, K. R. Yamamoto, **1988**, *Science*, 241, 812 - 816.
- [37] N. L. Weigel, Y. Zhang, **1998**, *J. Mol. Med.*, 76, 469 - 479.
- [38] S. M. Aronica, B. S. Katzenellenbogen, **1993**, *Mol. Endocrinol.*, 7, 743 - 752.
- [39] G. Bunone, P. A. Briand, R. J. Mikisek, D. Picard, **1996**, *EMBO J.*, 15, 2174 - 2183.
- [40] S. Kato, H. Endoh, Y. Masuhiro, T. Kitamoto, S. Uchiyama, H. Sasaki, S. Masushige, Y. Gotoh, E. Nishida, H. Kawashima, D. Metzger, P. Chambon, **1995**, *Science*, 270, 1491 - 1494.
- [41] G. B. Tremblay, A. Tremblay, F. Labrie, V. Giguere, **1999**, *Mol. Cell. Biol.*, 19, 1919 - 1927.
- [42] A. Tremblay, G. B. Tremblay, F. Labrie, V. Giguere, **1999**, *Mol. Cell. Biol.*, 3, 513 - 519.
- [43] E. M. McInerney, B. S. Katzenellenbogen, **1996**, *J. Bio. Chem.*, 271, 24172 - 24178.
- [44] M. T. Tzukerman, A. Esty, D. Santiso-Mere, P. Daniellian, M. G. Parker, R. B. Stein, J. W. Pike, D. P. McDonnell, **1994**, *Mol. Endocrinol.*, 8, 21 - 30.
- [45] M. Ruff, M. Gangloff, J. M. Wurtz, D. Moras, **2000**, *Breast Cancer Res.*, 2, 353 - 359.
- [46] S. Green, P. Chambon, **1988**, *Trends Genet.*, 4, 309 - 314.
- [47] M. Beato, **1989**, *Cell*, 56, 335 - 344.
- [48] R. M. Evans, **1988**, *Science*, 240, 889 - 895.
- [49] B. F. Luisi, W. X. Xu, Z. Otwinowski, L. P. Freedman, K. R. Yamamoto, P. B. Sigler, **1991**, *Nature*, 352, 497 - 505.
- [50] L. P. Freedman, **1997**, *Endocr. Rev.*, 13, 129 - 145.
- [51] M. J. Tasi, B. W. O'Malley, **1994**, *Annu. Rev. Biochem.*, 63, 451 - 486.
- [52] S. Mader, V. Kumar, H. de Verneuil, P. Chambon, **1989**, *Nature*, 338, 271 - 274.
- [53] S. Green, P. Chambon, **1991**, *Nature*, 325, 75 - 78.
- [54] K. Umesono, R. M. Evans, **1989**, *Cell*, 57, 1139 - 1146.
- [55] T. A. Jackson, J. K. Richer, D. L. Bain, G. S. Takimoto, L. Tung, K. B. Horwitz, **1997**, *Mol. Endocrinol.*, 11, 693 - 705.
- [56] J. D. Norris, D. Fan, S. A. Kerner, D. P. McDonnell, **1997**, *Mol. Endocrinol.*, 11, 747 - 754.
- [57] V. C. Jordan, J. MacGregor Schafer, A. S. Levenson, H. Liu, K. M. Pease, L. A. Simons, J. W. Zapf, **2001**, *Cancer Res.*, 61, 6619 - 6623.
- [58] H. Gronemeyer, **1991**, *Annu. Rev. Genet.*, 25, 89 - 123.
- [59] M. G. Pargner, N. Arbuckle, S. Dauvois, P. Daniellian, R. White, **1993**, *Ann. N. Y. Acad. Sci.*, 684, 119 - 126.
- [60] M. Berry, D. Metzger, P. Chambon, **1990**, *EMBO J.*, 9, 2811 - 2818.

- [61] W. L. Kraus, E. M. McInerney, B. S. Katzenellenbogen, **1995**, Proc. Natl. Acad. Sci. USA, 92, 12314 - 12318.
- [62] R. K. Hansen, S. A. W. Fuqua, **1999**, Breast Cancer: Molecular Genetics, Pathogenesis and Therapeutics, Humana Press, A. M. Bowcock, Ed., Totowa, New Jersey, 1 - 6.
- [63] I. Joab, C. Radanyi, J. M. Renoir, T. Bouchou, M. G. Catelli, N. Binart, J. Mester, E. E. Baulieu, **1984**, Nature, 308, 850 - 853.
- [64] J. M. Renoir, T. Bouchou, E. E. Baulieu, **1986**, Biochemistry, 25, 6405 - 6413.
- [65] E. R. Sanchez, S. Meshinchi, M. J. Schlesinger, W. B. Pratt, **1987**, Mol. Endocrinol., 1, 908 - 912.
- [66] A. Guichon-Mantel, K. Delabre, P. Leskop, E. Milgrom, **1996**, J. Steroid Mol. Biol., 56, 1 - 6.
- [67] P. LeGoff, M. M. Montano, D. J. Schodin, B. S. Katzenellenbogen, **1994**, J. Biol. Chem., 269, 4458 - 4466.
- [68] R. R. Denton, N. J. Koszewski, A. C. Notides, **1992**, J. Biol. Chem., 267, 7263 - 7268.
- [69] B. S. Katzenellenbogen, M.M. Montano, K. Ekena, M.E. Herman, E. M. McInerney, **1997**, Breast Cancer Res. Treat., 44, 23 - 38.
- [70] J. Greenblatt, **1991**, Cell, 66, 1067 - 1070.
- [71] S. Buratowski, **1994**, Cell, 77, 1 - 3.
- [72] S. Lee, S. Hahn, **1995**, Nature, 376, 609 - 612.
- [73] N. H. Ing, J. M. Beekman, S. Y. Tsai, M. J. Tsai, B. W. O'Malley, **1992**, J. Biol. Chem., 267, 17617 - 17623.
- [74] K. B. Horwitz, T. A. Jackson, T. L. Bain, J. K. Richer, G. S. Takimoto, L. Tung, **1996**, Mol. Endocrinol., 10, 1167 - 1177.
- [75] P. Pace, J. Tayler, S. Suntharalingam, R. C. Coombes, S. Ali, **1997**, J. Biol. Chem., 272, 25832 - 25838.
- [76] K. Paech, P. Webb, G. G. Kuiper, S. Nilsson, J. Å. Gustafsson, P. J. Kushner, T. S. Scanlan, **1997**, Science, 277, 1508 - 1510.
- [77] P. Webb, G. N. Lopez, R. M. Uht, P. J. Kushner, **1995**, Mol. Endocrinol., 9, 443 - 456.
- [78] P. Webb, P. Nguyen, C. Valentine, G. N. Lopez, G. R. Kwok, E. McInerney, B. S. Katzenellenbogen, E. Enmark, J. Å. Gustafsson, S. Nilsson, P. J. Kushner, **1999**, Mol. Endocrinol., 13, 1672 - 1685.
- [79] B. Saville, M. Wormke, F. Wang, T. Nguyen, E. Enmark, G. Kuiper, J. Å. Gustafsson, S. Safe, **2000**, J. Biol. Chem., 275, 5379 - 5387.
- [80] C. M. Klinge, **2000**, Steroids, 65, 227 - 251.
- [81] C. K. Glass, D. W. Rose, M. G. Rosenfeld, **1996**, Curr. Opin. Cell Biol., 9, 222 - 232.
- [82] K. Struhl, **1998**, Genes Dev., 12, 599 - 606.
- [83] R. Sternglanz, **1996**, Trends Biochem. Sci., 21, 357 - 358.
- [84] E. Pennisi, **1997**, Science, 275, 155 - 157.
- [85] E. Korzus, J. Torchia, D. W. Rose, L. Xu, R. Kurokawa, E. M. McInerney, T. M. Mullen, C. K. Glass, M. G. Rosenfeld, **1998**, Science, 279, 703 - 707.
- [86] T. Tsukiyama, C. Wu, **1997**, Curr. Opin. Gen. Dev., 7, 182 - 191.
- [87] L. Wang, C. Mizzen, C. Ying, **1997**, Mol. Cell. Biol., 17, 519 - 527.

- [88] X. F. Ding, C. M. Anderson, H. Ma, H. Hong, R. M. Uht, J. Kushner, R. Stallcup, **1998**, *Mol. Endocrinol.*, 12, 302 - 313.
- [89] A. M. Brzozowski, A. C. W. Pike, Z. Dauter, R. W. Hubbard, T. Bonn, O. Engström, L. Öhman, G. L. Greene, J. Å. Gustafsson, M. Carlquist, **1997**, *Nature*, 389, 753 - 758.
- [90] W. Bourguet, M. Ruff, P. Chambon, H. Gronemeyer, D. Moras, **1995**, *Nature*, 375, 377 - 382.
- [91] J. P. Renaud, N. Rochel, M. Ruff, V. Vivat, P. Chambon, H. Gronemeyer, D. Moras, **1995**, *Nature*, 378, 681 - 689.
- [92] R. L. Wagner, J. W. Apriletti, M. E. McGrath, B. L. West, J. D. Baxter, R. J. Fletterick, **1995**, *Nature*, 378, 690 - 697.
- [93] A. K. Shiau, D. Barstad, P. M. Loria, L. Cheng, P. J. Kushner, D. A. Agard, G. L. Greene, **1998**, *Cell*, 95, 927 - 937.
- [94] S. M. Cowley, M. G. Parker, **1999**, *J. Steroid Biochem. Mol. Biol.*, 69, 165 - 175.
- [95] A. J. Hörlein, A. M. Naar, T. Heinzel, J. Torchia, B. Gloss, R. Kurokawa, **1995**, *Nature*, 377, 397 - 404.
- [96] A. C. W. Pike, M. Brzozowski, J. Walton, R. E. Hubbard, A. G. Thorsell, Y. L. Li, J. Å. Gustafsson, M. Carquist, **2001**, *Structure*, 9, 145 - 153.
- [97] D. M. Ignar-Trowbrige, C. T. Teng, K. A. Ross, M. G. Parker, K. S. Korach, J. A. McLachlan, **1993**, *Mol. Endocrinol.*, 7, 992 - 998.
- [98] C. L. Smith, O. M. Conneely, B. W. O'Malley, **1994**, *Steroid Receptors in Health and Disease*, ed. V. K. Moudgil, Brinkhauser, Bosten, Basel, Berlin, 333.
- [99] R. Clarke, N. Brunner, E. W. Thompson, P. Glanz, D. Katz, R. B. Dickson, M. E. Lippman, **1989**, *J. Endocrinol.*, 122, 331 - 340.
- [100] R. F. Power, J. P. Lydon, O. M. Conneely, B. W. O'Malley, **1991**, *Science*, 252, 1546 - 1548.
- [101] R. F. Power, S. K. Mani, J. Codina, O. M. Conneely, B. W. O'Malley, **1991**, *Science*, 254, 1636 - 1639.
- [102] D. M. Ignar-Trowbrige, K. G. Nelson, M. C. Bidwell, S. W. Curtis, T. F. Washburn, **1992**, *Proc. Natl. Acad. Sci. USA*, 89, 4658 - 4662.
- [103] G. G. J. M. Kuiper, K. Carlsson, E. Grandien, E. Enmark, S. Haggblad, S. Nilsson, J. Å. Gustafsson, **1997**, *Endocrinology*, 138, 863 - 870.
- [104] S. Mäkelä, H. Savolainen, E. Aavik, M. Myllärniemi, L. Strauss, E. Taskinen, J. Å. Gustafsson, P. Häyry, **1999**, *Proc. Natl. Acad. Sci. USA*, 96, 7077 - 7082,
- [105] M. J. Meyer, J. Sun, K. E. Carlson, B. S. Katzenellenbogen, J. A. Katzenellenbogen, **1999**, *J. Med. Chem.*, 42, 2456 - 2468.
- [106] A. K. Shiau, D. Barstad, J. T. Radek, M. Meyer, K. W. Nettles, B. S. Katzenellenbogen, J. A. Katzenellenbogen, D. A. Agard, G. L. Greene, **2002**, *Nature Struct. Biol.*, 9, 359 - 364.
- [107] S. R. Stauffer, C. J. Coletta, R. Tedesco, G. Nishiguchi, K. Carlson, J. Sun, B. S. Katzenellenbogen, J. A. Katzenellenbogen, **2000**, *J. Med. Chem.*, 43, 4934 - 4947.
- [108] Y. R. Huang, J. A. Katzenellenbogen, **2000**, *Organic Letters*, 2, 2833 - 2836.
- [109] D. S. Mortensen, A. L. Rodriguez, K. E. Carlson, J. Sun, B. S. Katzenellenbogen, J. A. Katzenellenbogen, **2001**, *J. Med. Chem.*, 44, 3838 - 3848.

- [110] J. Sun, Y. R. Hunag, W. R. Harrington, S. Sheng, J. A. Katzenellenbogen, B. S. Katzenellenbogen, **2002**, *Endocrinology*, 143, 941 - 947.
- [111] S. R. Stauffer, Y. R. Huang, Z. D. Aron, C. J. Coletta, J. Sun, B. S. Katzenellenbogen, J. A. Katzenellenbogen, **2001**, *Bioorganic & Medicinal Chemistry*, 9, 151 - 161.
- [112] D. S. Mortensen, A. L. Rodriguez, J. Sun, B. S. Katzenellenbogen, J. A. Katzenellenbogen, **2001**, *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters*, 11, 2521 - 2524.
- [113] A. S. Levenson, J. Schafer MacGregor Schafer, D. J. Bentrem, K. M. Pease, V. C. Jordan, **2001**, *J. Steroid Biochem. Mol. Biol.*, 76, 61 - 70.
- [114] P. J. Kushner, D. A. Agard, G. L. Greene, T. S. Scanlan, A. K. Shiau, R. M. Uht, P. Webb, **2000**, *J. Steroid Biochem. Mol. Biol.*, 74, 311 - 317.
- [115] L. Nagy, J. W. R. Schwabe, **1999**, *Genes Dev.*, 13, 3209 - 3216.
- [116] S. E. Fawell, R. White, S. Hoare, M. Sydenham, M. G. Parker, **1990**, *Proc. Natl. Acad. Sci. USA*, 87, 6883 - 6887.
- [117] J. Sun, M. J. Meyer, B. E. Fink, R. Rajendran, J. A. Katzenellenbogen, B. S. Katzenellenbogen, **1999**, *Endocrinology*, 140, 800 - 804.
- [118] A. C. W. Pike, A. M. Brzozowski, R. E. Hubbard, T. Bonn, A. G. Thorsell, O. Engström, J. Ljunggren, J. Å. Gustafsson, M. Carlquist, **1999**, *EMBO J.*, 18, 4608 - 4618.
- [119] W. L. Smith, D. L. DeWitt, **1996**, *Advances in Immunology*, F. J. Dixon, Ed, Academic Press, Orlando FL, 62, 167 - 215.
- [120] D. Voet, J. G. Voet, **1990**, *Biochemie*, VCH, Weinheim.
- [121] D. L. Simmons, D. B. Levy, Y. Yannoni, R. L. Erikson, **1989**, *Proc. Natl. Acad. Sci. USA*, 86, 1178 - 1182.
- [122] D. A. Kujubu, B. S. Fletcher, B. C. Varnum, R. W. Lin, H. R. Herschman, **1991**, *J. Biol. Chem.*, 266, 12866 - 12872.
- [123] G. E. Evett, W. Xie, J. G. Chipman, D. L. Robertson, D. L. Simmons, **1993**, *Arch. Biochem. Biophys.*, 306, 169 - 177.
- [124] D. L. DeWitt, E. A. Meade, **1993**, *Arch. Biochem. Biophys.*, 306, 94 - 102.
- [125] D. A. Kujubu, S. T. Reddy, B. S. Fletcher, H. R. Herschman, **1993**, *J. Biol. Chem.*, 268, 5425 - 5430.
- [126] J. Han, H. Sadowski, D. A. Young, I. G. Macara, **1990**, *Proc. Natl. Acad. Sci. USA*, 87, 3373 - 3377.
- [127] G. M. O'Sullivan, F. H. Chilton, E. M. Huggins Jr., C. E. McCall, **1992**, *J. Biol. Chem.*, 267, 14547 - 14550.
- [128] J. Sirois, D. L. Simmons, J. Richards, **1992**, *J. Biol. Chem.*, 267, 11586 - 11592.
- [129] K. Yamagata, K. I. Andreasson, W. E. Kaufmann, C. A. Barnes, P. F. Worley, **1993**, *Neuron*, 11, 371 - 386.
- [130] D. L. Simmons, W. Xie, J. G. Chipman, G. E. Evett, **1991**, *Prostaglandins, Leukotrienes, Lipoxins and PAF*, J. M. Bailey, Ed., Plenum Press, New York, 67 - 68.
- [131] R. W. Walenga, M. Kester, E. Coroneos, S. Butcher, R. Swivedi, C. Statt, **1996**, *Prostaglandins*, 52, 341 - 359.

- [132] R. C. Harris, J. A. McKanna, Y. Akai, H. R. Jacobson, R. N. Dubois, M. D. Breyer, **1994**, *J. Clin. Invest.*, 94, 2504 - 2510.
- [133] T. Hla, T. Maciag, **1991**, *J. Biol. Chem.*, 266, 24059 - 24063.
- [134] J. M. Samet, M. B. Fasano, A. N. Fonteh, F. H. Chiton, **1995**, *J. Biol. Chem.*, 270, 8044 - 8049.
- [135] S. A. Kraemer, S. A. Meade, D. L. DeWitt, **1992**, *Arch. Biochem. Biophys.*, 293, 391 - 400.
- [136] J. Y. Fu, J. L. Masferrer, K. Seibert, A. Raz, P. Needleman, **1990**, *J. Biol. Chem.*, 265, 16737 - 16740.
- [137] M. G. O'Sullivan, E. M. Huggins, E. A. Meade, D. L. DeWitt, C. E. McCall, **1992**, *Biochem. Biophys. Res. Comm.*, 187, 1123 - 1127.
- [138] S. H. Lee, E. Soyoola, P. Chanmugam, S. Hart, W. Sun, H. Zhong, S. Liou, D. Simmons, D. Hwang, **1992**, *J. Biol. Chem.*, 267, 25934 - 25938.
- [139] R. P. Ryseck, C. Raynoschek, H. Macdonald- Bravo, K. Dorfman, M. G. Mattei, R. Bravo, **1992**, *Cell Growth Differ.*, 3, 443 - 450.
- [140] Y. Hamasaki, J. Kitzler, R. Hardman, P. Nettlesheim, T. E. Eling, **1993**, *Arch. Biochem. Biophys.*, 304, 226 - 234.
- [141] R. N. DuBois, J. Awad, J. Morrow, L. J. Roberts, P. R. Bishop, **1994**, *J. Clin. Invest.*, 93, 493 - 498.
- [142] J. Riese, T. Hoff, A. Nordhoff, D. L. DeWitt, K. Resch, V. Kaefer, **1994**, *J. Leuko. Bio.*, 55, 476 - 482.
- [143] D. W. Coyne, M. Nickols, W. Bertrand, A. R. Morrison, **1992**, *Am. J. Physiol.*, 263, F97 - F102.
- [144] Y. Geng, F. Blanco, M. Cornelisson, M. Lotz, **1995**, *J. Immunol.*, 155, 769 - 801.
- [145] D. A. Jones, D. P. Carlton, T. M. McIntyre, G. A. Zimmerman, S. M. Prescott, **1993**, *J. Biol. Chem.*, 268, 9049 - 9054.
- [146] H. Inoue, C. Yokoyama, S. Hara, Y. Tone, T. Tanabe, **1995**, *J. Biol. Chem.*, 270, 24965 - 24971.
- [147] K. Yamamoto, T. Arakawa, N. Ueda, S. Yamamoto, **1995**, *J. Biol. Chem.*, 270, 31315 - 31320.
- [148] J. K. Morris, J. S. Richards, **1996**, *J. Biol. Chem.*, 271, 16633 - 16643.
- [149] W. Xie, H. R. Herschman, **1995**, *J. Biol. Chem.*, 270, 27622 - 27628.
- [150] D. Picot, P. J. Loll, R. M. Garavito, **1994**, *Nature*, 367, 243 - 249.
- [151] J. C. Otto, W. L. Smith, **1996**, *J. Biol. Chem.*, 271, 9906 - 9910.
- [152] R. G. Kurumbail, A. M. Stevens, J. K. Gierse, J. McDonald, R. A. Stegeman, J. Y. Pak, D. Gildehaus, J. M. Miyashiro, T. D. Penning, K. Seibert, P. C. Isakson, W. C. Stallings, **1996**, *Nature*, 384, 644 - 648.
- [153] W. L. Smith, R. M. Garavito, D. L. DeWitt, **1996**, *J. Biol. Chem.*, 271, 33157 - 33160.
- [154] J. C. Otto, W. L. Smith, **1994**, *J. Biol. Chem.*, 269, 19868 - 19875.
- [155] R. J. Kulmacz, R. B. Pendleton, W. E. Lands, **1994**, *J. Biol. Chem.*, 269, 5527 - 5536.
- [156] J. Barnett, J. Chow, D. Ives, M. Chiou, R. Mackenzie, E. Osen, B. Nguyen, S. Tsing, C. Bach, J. Freire, H. Chan, E. Sigal, C. Ramesha, **1994**, *Biochem. Biophys. Acta*, 1209, 130 - 139
- [157] O. Laneuville, D. K. Breuer, D. L. DeWitt, T. Hla, C. D. Funk, W. L. Smith, **1994**, *J. Pharmacol. Exp. Ther.*, 271, 927 - 934.

- [158] J. H. Capdevila, J. D. Morrow, Y. Y. Belosludtsev, D. R. Beauchamp, R. N. DuBois, J. R. Falck, **1995**, *Biochemistry*, 34, 3325 - 3337.
- [159] R. J. Kulmacz, L. H. Wang, **1995**, *J. Biol. Chem.*, 270, 24019 - 24023.
- [160] L. M. Landino, B. C. Crews, M. D. Timmons, J. D. Morrow, L. J. Marnett, **1996**, *Proc. Natl. Acad. Sci. USA*, 93, 15069 - 15074.
- [161] O. Laneuville, D. K. Breuer, N. Xu, Z. H. Huang, D. A. Gage, J. T. Watson, M. Lagarde, D. L. DeWitt, W. L. Smith, **1995**, *J. Biol. Chem.*, 270, 19330 - 19336.
- [162] A. Tsai, R. J. Kulmacz, G. Palmer, **1995**, *J. Biol. Chem.*, 270, 10503 - 10508.
- [163] A. M. Lambeir, C. M. Markey, H. B. Dunford, L. J. Marnett, **1985**, *J. Biol. Chem.*, 260, 14894 - 14896.
- [164] R. Dietz, W. Nastainczyk, H. H. Ruf, **1988**, *Eur. J. Biochem.*, 171, 321 - 328.
- [165] R. Karthein, R. Dietz, W. Nastainczyk, H. H. Ruf, **1988**, *Eur. J. Biochem.*, 171, 313 - 320.
- [166] J. A. DeGray, G. Lassmann, J. F. Curtis, T. A. Kennedy, L. J. Marnett, T. E. Eling, R. P. Mason, **1992**, *J. Biol. Chem.*, 267, 23583 - 23588.
- [167] A. L. Tsai, G. Palmer, R. J. Kulmacz, **1992**, *J. Biol. Chem.*, 267, 17753 - 17759.
- [168] A. L. Tsai, L. C. Hsi, R. J. Kulmacz, W. L. Smith, **1994**, *J. Biol. Chem.*, 269, 5085 - 5091.
- [169] T. Shimokawa, R. J. Kulmacz, D. L. DeWitt, W. L. Smith, **1990**, *J. Biol. Chem.*, 265, 20073 - 20076.
- [170] D. L. DeWitt, E. A. El-Harith, S. A. Kraemer, M. J. Andrews, E. F. Yao, R. L. Armstrong, W. L. Smith, **1990**, *J. Biol. Chem.*, 265, 5192 - 5198.
- [171] J. K. Gierse, J. J. McDonald, S. D. Hauser, S. H. Rangwala, C. M. Koboldt, K. Seibert, **1996**, *J. Biol. Chem.*, 271, 15810 - 15814.
- [172] N. Futaki, S. Takahashi, M. Yokoyama, I. Arai, S. Higuchi, S. Otomo, **1994**, *Prostaglandins*, 47, 55 - 59.
- [173] D. K. Bhattacharyya, M. Lecomte, C. J. Rieke, R. M. Garavito, W. L. Smith, **1996**, *J. Biol. Chem.*, 271, 2179 - 2184.
- [174] J. A. Mancini, D. Riendeau, J. P. Falguyret, P. J. Vickers, G. P. O'Neill, **1995**, *J. Biol. Chem.*, 270, 29372 - 29377.
- [175] A. Guo, L. H. Wang, K. H. Ruan, R. J. Kulmacz, **1996**, *J. Biol. Chem.*, 271, 19134 - 19140.
- [176] L. M. Marnett, **2000**, *Current Opinion in Chemical Biology*, 4, 545 - 552.
- [177] J. A. Mancini, D. Riendeau, J. P. Falguyret, P. J. Vickers, G. P. O'Neill, **1995**, *J. Biol. Chem.*, 270, 29372 - 29377.
- [178] P. J. Loll, D. Picot, R. M. Garavito, **1995**, *Nat. Struct. Biol.*, 2, 637 - 643.
- [179] M. Lecomte, O. Laneuville, C. Ji, D. L. DeWitt, W. L. Smith, **1994**, *J. Biol. Chem.*, 269, 13207 - 13215.
- [180] T. Shimokawa, W. L. Smith, **1992**, *J. Biol. Chem.*, 267, 12387 - 12392.
- [181] L. P. Wennogle, H. Liang, J. C. Quintavalla, B. R. Bowen, J. Wasvary, D. B. Miller, A. Allentoff, W. Boyer, M. Kelly, P. Marshall, **1995**, *FEBS Lett.*, 371, 315 - 320.
- [182] A.S. Kalgutkar, B. C. Crews, S. W. Rowlinson, C. Garner, K. Seibert, L. J. Marnett, **1998**, *Science*, 280, 1268 - 1270.
- [183] L. H. Rome, W. E. M. Lands, **1975**, *Proc. Natl. Acad. Sci. USA*, 72, 4863 - 4865.

- [184] H. C. Ondine, S. On-Yee, D. C. Swinney, **1996**, *J. Biol. Chem.*, 271, 3538 - 3554.
- [185] T. J. Carty, A. Marfat, **1996**, *Emerging Drugs: The Prospect for Improved Medicines*, W. C. Bowman, J. D. Fitzgerald, J. B. Taylor, Eds., Ashley Publications Ltd., London, 391 - 411.
- [186] K. Seibert, Y. Zhang, K. Leahy, S. Hauser, J. Masferrer, W. Perkins, L. Lee, P. Isakson, **1994**, *Proc. Natl. Acad. Sci. USA*, 91, 12013 - 12017.
- [187] C. C. Chan, S. Boyce, C. Brideau, A. W. Ford-Hutchinson, R. Gordon, D. Guay, R. G. Hill, C. S. Li, J. Mancini, M. Penneton, P. Prasit, R. Rasori, D. Riendeau, P. Roy, P. Tagari, P. Vickers, E. Wong, I. W. Rodger, **1995**, *J. Pharmacol. Exp. Ther.*, 274, 1531 - 1537.
- [188] R. A. Copeland, J. M. Williams, J. Giannaras, S. Nurnberg, M. Covington, D. Pinto, S. Pick, J. M. Trzaskos, **1994**, *Proc. Natl. Acad. Sci. USA*, 91, 11202 - 11206.
- [189] S. W. Rowlinson, J. R. Kiefer, J. J. Prusakiewicz, J. L. Pawlitz, K. R. Kozak, A. S. Kalgutkar, W. C. Stallings, R. G. Kurumbail, L. J. Marnett, **2003**, *J. Biol. Chem.*, 278, 45763 - 45769.
- [190] T. D. Penning, J. J. Talley, S. R. Bertenshaw, J. S. Carter, P. W. Collins, S. Docter, M. J. Graneto, L. F. Lee, J. W. Malecha, J. M. Miyashiro, R. S. Rogers, D. J. Rogier, S. S. Yu, G. D. Anderson, E. G. Burton, J. N. Cogburn, S. A. Gregory, C. M. Koboldt, W. E. Perkins, K. Seibert, A. W. Veenhuizen, Y. Y. Zhang, P. C. Isakson, **1997**, *J. Med. Chem.*, 40, 1347 - 1365.
- [191] I. K. Khanna, R. M. Weier, Y. Yu, X. D. Xu, F. J. Koszyk, P. W. Collins, C. M. Koboldt, A. W. Veenhuizen, W. E. Perkins, J. J. Casler, J. L. Masferrer, Y. Y. Zhang, S. A. Gregory, K. Seibert, P. C. Isakson, **1997**, *J. Med. Chem.*, 40, 1634 - 1647.
- [192] C. Almansa, J. Alfón, A. F. de Arriba, F. L. Cavalcanti, I. Escamilla, L. A. Gómez, A. Miralles, R. Soliva, J. Bartroli, E. Carceller, M. Merlos, J. Garca-Rafanell, **2003**, *J. Med. Chem.*, 46, 3463 - 3475.
- [193] C. Almansa, G. Gonzalez, **2001**, Patent, EP 1270559.
- [194] G. Dannhardt, L. Hahn, **2002**, Patent, DE 10114775.
- [195] C. A. Lanzo, J. M. Beechem, J. Talley, L. J. Marnett, **1998**, *Biochemistry*, 37, 217 - 226.
- [196] A. S. Kalgutkar, B. C. Crews, L. J. Marnett, **1996**, *Biochemistry*, 35, 9076 - 9082.
- [197] A. S. Kalgutkar, A. B. Marnett, B. C. Crews, R. P. Remmel, L. J. Marnett, **2000**, *J. Med. Chem.*, 43, 280 - 2870.
- [198] Y. Okumura, Y. Murata, T. Mano, **2001**, Patent, US 6310079.
- [199] I. K. Khanna, Y. Yu, R. M. Huff, R. M. Weier, X. Xu, F. J. Koszyk, P. W. Collins, J. N. Cogburn, P. C. Isakson, C. M. Koboldt, J. L. Masferrer, W. E. Perkins, K. Seibert, A. W. Veenhuizen, J. Yuan, D. C. Yang, Y. Y. Zhang, **2000**, *J. Med. Chem.*, 43, 3168 - 3185.
- [200] J. L. Adams, P. W. Shedrake, T. F. Gallagher, R. Garigipati, **1997**, Patent, EP 1227091.
- [201] Y. Ito, H. Kato, S. Yasuda, N. Ogawa, T. Suzuki, S. Sakurai, **1994**, Patent, JP 06228106.
- [202] J. L. Adams, T. F. Gallagher, J. Sisko, I. K. Osifo, J. C. Boehm, **2001**, Patent, EP 1314728.
- [203] C. Almansa, G. Gonzalez, **2000**, Patent, EP 1122243.
- [204] I. K. Khanna, R. M. Weier, P. W. Collins, U. Yu, X. Xu, R. A. Partis, F. J. Koszyk, R. M. Huff, **1997**, Patent, EP 880504.
- [205] J. L. Adams, T. F. Gallagher, J. Sisko, Z. Q. Peng, I. K. Osifo, J. C. Boehm, **1996**, Patent, EP 831830.

- [206] H. Hashimoto, K. Imamura, J. Haruta, K. Wakitani, **2002**, *J. Med. Chem.*, **45**, 1511 - 1517.
- [207] D. Hwang, D. Scollard, J. Byrne, E. Levine, **1998**, *J. Natl. Cancer Inst.*, **90**, 455 - 460.
- [208] M. P. Schrey, K. V. Patel, **1995**, *Br. J. Cancer*, **72**, 1412 - 1419.
- [209] C. Sotiriou, M. Lacroix, L. Lagneaux, G. Berchem, J. J. Body, **1999**, *Anticancer Research*, **19**, 2997 - 3006.
- [210] J. A. Sánchez-Alcázar, D. A. Bradbury, L. Pang, A. J. Knox, **2003**, *Lung Cancer*, **40**, 33 - 44.
- [211] H. G. Yu, J. A. Huang, Y. N. Yang, H. Huang, H. S. Luo, J. P. Yu, J. J. Meier, H. Schrader, A. Bastian, W. E. Schmidt, F. Schmitz, **2002**, *Eur. J. Clin. Invest.*, **32**, 838 - 846.
- [212] F. M. Giardiello, G. J. A. Offerhaus, R. N. DuBois, **1995**, *Eur. J. Cancer*, **31**^o, Nos, 7/8, 1071 - 1076.
- [213] M. K. Jones, H. Wang, B. M. Peskar, E. Levin, R. M. Itani, I. J. Sarfeh, A. S. Tarnawski, **1999**, *Nature Medicine*, **5**, 1418 - 1423.
- [214] C. J. Grubbs, R. A. Lubet, A. T. Koki, K. M. Leahy, J. L. Masferrer, V. E. Steele, G. J. Kelloff, D. L. Hill, K. Seibert, **2000**, *Cancer Res.*, **60**, 5599 - 5606.
- [215] W. J. Wechter, D. D. Leipold, E. D. Murray Jr., D. Quiggle, J. D. McCracken, R. S. Barrios, N. M. Greenberg, **2000**, *Cancer Res.*, **60**, 2203 - 2208.
- [216] R. Keilitz, Dissertation, **1999**, Freie Universität Berlin.
- [217] B. E. Fink, D. S. Mortensen, S. R. Stauffer, Z. D. Aron, J. A. Katzenellenbogen, **1999**, *Chem. Biol.*, **6**, 205 - 219.
- [218] M. A. Laurent, **1937**, *Ann.*, **21**, 130 - 134.
- [219] I. Lifschitz, J. G. Bos, **1940**, *Rec. Trav. Chim.*, **59**, 173.
- [220] O. F. Williams, J. C. Bailar, Jr, **1959**, *J. Am. Chem. Soc.*, **81**, 4464 - 4469.
- [221] K. Saigo, N. Kubota, S. Takebayashi, M. Hasegawa, **1986**, *Bull. Chem. Soc. Jpn.*, **59**, 931 - 932.
- [222] E. J. Corey, F. N. M. Kühnle, **1997**, *Tetrahedron Lett.*, **38**, 8631 - 8634.
- [223] B. Karaman, Š. Zupanc, K. Jakopčić, **1973**, *Croatica Chemica Acta*, **45**, 519 - 522.
- [224] T. Takajo, S. Kambe, K. Saito, **1977**, *Synthesis*, 647 - 649.
- [225] T. Takajo, S. Kambe, **1981**, *Synthesis*, 151 - 153.
- [226] T. Takajo, S. Kambe, **1982**, *Synthesis*, 655 - 657.
- [227] T. Takajo, S. Kambe, **1984**, *Synthesis*, 256 - 259.
- [228] T. Takajo, S. Kambe, **1984**, *Synthesis*, 259 - 262.
- [229] T. Takajo, S. Kambe, **1985**, *Synthesis*, 92 - 95.
- [230] G. I. Feutrill, R. N. Mirringtion, **1970**, *Tetrahedron Lett.* 1327 - 1328.
- [231] N. Kong, E. A. Lui, B. T. Vu, Patent, WO 2003051359, **2003**.
- [232] N. Kong, E. A. Lui, B. T. Vu, Patent, WO 2003051360, **2003**.
- [233] C. Dauwe, J. Buddrus, **1995**, *Synthesis*, 171 - 172.
- [234] J. M. Mitchell, N. S. Finney, **2000**, *Tetraherdron Lett.*, **41**, 8431 - 8434.
- [235] T. Morimoto, K. Tachibana, K. Achiwa, **1997**, *Sylett*, 783 - 785.
- [236] C. A. Busacca, D. Grossbach, R. C. So, E. M. O'Brien, E. M. Spinelli, **2003**, *Organic letters*, **5**, 595 - 598.

- [237] R. R. Tidwell, J. D. Geratz, O. Dann, G. Volz, D. Zeh, H. Loewe, **1978**, *J. Med. Chem.*, 21, 613 - 623.
- [238] R. Oi, K. B. Sharpless, **1991**, *Tetrahedron Lett.*, 32, 999 - 1002.
- [239] R. Gust, Dissertation, **1987**, Universität Regensburg.
- [240] F. Vögtle, E. Goldschmitt, **1974**, *Angew. Chem.*, 86, 520 - 521.
- [241] F. Vögtle, E. Goldschmitt, **1976**, *Chem. Ber.*, 109, 1 - 40.
- [242] F. R. Japp, S. C. Hooker, **1884**, *Chem. Ber.*, 17, 2402 - 2411.
- [243] M. B. Erman, J. W. Snow, M. J. Williams, **2000**, *Tetrahedron Lett.*, 41, 6749 - 6752.
- [244] E. Vowinkel, B. Bartel, **1974**, *Chem. Ber.*, 107, 1221 - 1227.
- [245] E. C. Wang, G. J. Lin, **1998**, *Tetrahedron Lett.*, 39, 4047 - 4050.
- [246] P. Capdevielle, A. Lavigne, M. Maumy, **1989**, *Synthesis*, 451 - 452.
- [247] W. Jianxun, C. Hao, Z. Zhigang, Patent, CN 1190093, **1998**.
- [248] H. G. O. Becker, W. Berger, G. Domschke, E. Fanghänel, J. Faust, M. Fischer, F. Gentz, K. Gewalt, R. Gluch, R. Mayer, K. Müller, D. Pavel, H. Schmidt, K. Schollberg, K. Schwetlick, E. Seiler, **1993**, *Organikum, Johann Ambrosius Barth Leipzig, Kapitel D.5 und D7*.
- [249] L. Weintraub, S. R. Oles, N. Kalish, **1976**, *J. Org. Chem.*, 41, 3769.
- [250] F. L. Benton, T. E. Dielon, **1942**, *J. Am. Chem. Soc.*, 64, 1128.
- [251] H. Brederbeck, R. Gompfer, H. G. v. Schuh, G. Theilig, **1959**, *Angew. Chem.*, 71 (24), 753 - 774.
- [252] J. G. Lombardino, E. H. Weisman, **1974**, *J. Med. Chem.*, 17, 1182 - 1188.
- [253] V. H. Schubert, G. Giesemann, P. Steffen, J. Bleichert, **1962**, *J. Prakt. Chem.*, 18, 192 - 202.
- [254] J. F. Hayes, M. B. Mitchell, C. Wicks, **1994**, *Heterocycles*, 38, 575 - 585.
- [255] C. Zhang, E. J. Moran, T. F. Woiwode, K. M. Short, A. M. M. Mjalli, **1996**, *Tetrahedron Lett.*, 37, 751 - 754.
- [256] S. Sarshar, D. Siev, A. M. M. Mjalli, **1996**, *Tetrahedron Lett.*, 37, 835 - 837.
- [257] F. Kunckell, **1901**, *Ber. Dtsch. Chem. Ges.*, 34, 637 - 642.
- [258] S. T. Mahadik, S.V. Sunthakar, **1975**, *Indian J. Chem.*, 13, 1369 - 1370.
- [259] M. I. Korotkikh, A. V. Kisel'ov, T. M. Pekhtereva, O. P. Shvaika, **2001**, *Ukrainski Khimicheskii Zhurnal (Russian Edition)*, 67(11 -12), 97 -103.
- [260] K. Bunge, R. Huisgen, R. Raab, H. J. Sturm, **1972**, *Chem. Ber.*, 105, 1307 - 1323.
- [261] B. Krieg, L. Brandt, B. Carl, G. Manecke, **1967**, *Chem. Ber.*, 100, 4042 - 4049.
- [262] P. E. Bender, D. T. Hill, P. H. Offen, K. Razgaitis, P. Lavanchy, O. D. Stringer, B. M. Sutton, D. E. Griswold, M. J. DiMartino, D. T. Walz, I. Lantos, C. B. Ladd, **1985**, *J. Med. Chem.*, 28, 1169 - 1177.
- [263] I. Lantos, P.E. Bender, K. A. Razgaitis, B. M. Sutton, M. J. DiMartino, D. E. Griswold, D. T. Walz, **1984**, *J. Med. Chem.*, 27, 72 - 75.
- [264] J. F. Callahan, J. L. Burgess, J. A. Fornwald, L. M. Gaster, J. D. Harling, F. P. Harrington, J. Heer, C. Kwon, R. Lehr, A. Mathur, B. A. Olson, J. Weinstock, N. J. Laping, **2002**, *J. Med. Chem.*, 45, 999 -1001.
- [265] N. Seko, K. Yoshino, K. Yokota, G. Tsukamoto, **1991**, *Chem. Pharm. Bull.*, 39, 651 - 657.

- [266] A. Thurkauf, A. Hutchison, J. Peterson, L. Cornfield, R. Meade, K. Huston, K. Harris, P.C. Ross, K. Gerber, T. V. Ramabhadran, **1995**, *J. Med. Chem.*, **38**, 2251 - 2255.
- [267] J. Liebscher, K. Feist, **1988**, *J. Prak. Chem.*, **330**, 175 - 181.
- [268] T. L. Little, S. E. Webber, **1994**, *J. Org. Chem.*, **59**, 7299 - 7305.
- [269] S. C. Shilcrat, M. K. Mokhallalati, J. M. D. Fortunak, L. N. Pridgen, **1997**, *J. Med. Chem.*, **62**, 8449 - 8454.
- [270] A. Pinner, **1877**, *Ber.*, **10**, 1889 - 1897.
- [271] P. Oxley, M. W. Partridge, W. F. Short, **1947**, *J. Chem. Soc.*, 1110 - 1116.
- [272] H. P. Rosinger, Tunstall, J. T. Hackmann, Patent, US 3189649, **1965**.
- [273] B. Singh, J. C. Collins, **1971**, *Chem. Commun.*, 498 - 499.
- [274] F. C. Copper, M. W. Partridge, **1953**, *J. Med. Chem.*, 255.
- [275] B. Daoust, J. Lessard, **1995**, *Can. J. Chem.*, **73**, 362 - 374.
- [276] J. A. Gautier, M. Miocque, C. Fauran, A. Y. Le Cloarec, Patent, US 3632593, **1972**.
- [277] J. A. Gautier, M. Miocque, C. Fauran, A. Y. Le Cloarec, **1970**, *Bull. Soc. Chim. Fr.*, **1**, 200 - 207.
- [278] M. Ōkubo, M. Tanaka, Y. Murata, N. Tsurusaki, Y. Omote, Y. Ikubo, K. Matsuo, **1991**, *Chemistry Letters*, **11**, 1965 - 1968.
- [279] W. Szczepankiewicz, J. Suwiński, R. Bujok, **2000**, *Tetrahedron*, **56**, 9343 - 9349.
- [280] G. Hafelinger, F. K. H. Kuske, **1991**, *The Chemistry of Amidines and Imidates Vol. 2*, S. Patai, Ed., John Wiley & Sons, New York, Chapters 1.
- [281] K. Surma, M. Jaskólski, Z. Kosturkiewicz, J. Oszczapowicz, **1988**, *Acta Crystallogr.*, **C44**, 1031.
- [282] I. Buśko-Oszczapowicz, J. Oszczapowicz, **1991**, *The Chemistry of Amidines and Imidates Vol. 2*, S. Patai, Ed., John Wiley & Sons, New York, Chapters 12
- [283] E. Müller, Ed., **1957**, *Houben-Weyl, Methoden der org. Chemie, Stickstoffverbindungen II*, **11(1)**, 463.
- [284] E. Fontaine, D. Gully, P. Roger, C. Wermuth, Patent, WO 9815543, **1998**.
- [285] M. Hesse, H. Meier, B. Zeeh, **1995**, *Spektroskopische Methoden in der organischen Chemie*, Georg Thieme Stuttgart, Kapitel 3.
- [286] C.-H. Park, R. S. Givens, **1997**, *J. Am. Chem. Soc.*, **119**, 2453 - 2463.
- [287] G. D. Meakins, S. R. R. Musk. C. A. Robertson, L. S. Woodhouse, **1989**, *J. Chem. Soc., Perkin Trans. I*, 643 - 648.
- [288] C. Paulmier, F. Outurquin, **1988**, *Tetrahedron Lett.*, **29**, 5893 - 5896.
- [289] R. J. P. Corriu, J. J. E. Moreau, M. Pataud-Sat, **1990**, *J. Org. Chem.*, **55**, 2878 - 2884.
- [290] R. Rangarajan, E. J. Eisenbaum, **1985**, *J. Org. Chem.*, **50**, 2435 - 2438.
- [291] P. K. Martin, H. R. Matthews, H. Rapoport, G. Thyagarajan, **1968**, *J. Org. Chem.*, **33**, 3758 - 3761.
- [292] B. Fernández, I. Perillo, S. Lamdan, **1973**, *J. C. S. Perkin II*, 1371 - 1374.
- [293] R. Gust, R. Keilitz, K. Schmidt, **2001**, *J. Med. Chem.*, **44**, 1963 - 1970.
- [294] R. Gust, R. Keilitz, K. Schmidt, M. v. Rauch, **2002**, *Arch. Pharm. Pharm. Med. Chem.*, **10**, 463 - 471.

- [295] G. S. Pointdexter, D. A. Owens, P. L. Dolan, E. Woo, **1992**, *J. Org. Chem.*, 57, 6257 - 6265.
- [296] T. Meyer, Diplomarbeit, **1992**, Universität Regensburg.
- [297] F. Hafner, Dissertation, **1998**, Universität Regensburg.
- [298] K. H. Hofmann, **1981**, *Biologie in unserer Zeit*, 11, 97 - 106.
- [299] R. J. de Wet, K. V. Wood, M. DeLuca, D. R. Hershey, S. Subramani, **1987**, *Mol. Cell. Biol.*, 7, 725 - 737.
- [300] M.M. Bradford, **1976**, *Anal. Biochem.*, 72, 248 - 254.
- [301] EORTC – Breast Cancer Cooperative Group, **1973**, *Eur. J. Cancer*, 9, 379 - 381.
- [302] S. G. Korenman, **1968**, *J. Clin. Endocrinol. Metab.*, 28, 127 - 130.
- [303] H. Maass, B. Engel, G. Trams, **1975**, *J. Steroid Biochem.*, 6, 743 - 749.
- [304] R. J. Gillies, N. Didier, M. Denton, **1986**, *Anal. Biochem.*, 159, 109 - 113.
- [305] W. Kueng, E. Silber, U. Eppenberger, **1989**, *Anal. Biochem.*, 182, 16 - 19.
- [306] T. Spruß, G. Bernhardt, E. Schikaneder, H. Schönenberger, **1991**, *J. Cancer Res. Clin. Oncol.*, 117, 435 - 443.
- [307] H. D. Soule, J. Vasquez, A. Long, S. Albert, M. Brennan, **1973**, *J. Natl. Cancer Inst.*, 51, 1409 - 1416.
- [308] S. C. Brooks, E. R. Locke, H. D. Soule, **1973**, *J. Biol. Chem.*, 248, 6251 - 6253.
- [309] K. B. Horwitz, D. T. Zava, A. K. Thilager, E. M. Jensen, W. L. Mc Guire, **1978**, *Cancer Res.*, 38, 2434 - 2437.
- [310] K. B. Horwitz, M. E. Kostloff, W. L. Mc Guire, **1975**, *Steroids*, 26, 785 - 788.
- [311] L. W. Engel, N. A. Young, **1978**, *Cancer Res.*, 38, 4327 - 4339.
- [312] M. v. Rauch, Dissertation, **2003**, Freie Universität Berlin.
- [313] O. S. Frankfurt, A. Krishan, **2001**, *J. Immunol. Methods*, 153, 133 - 143.
- [314] S. B. Su, Y. Motoo, J. L. Iovanna, P. Berthézène, M. J. Xie, H. Mouri, K. Ohtsubo, F. Matsubara, N. Sawabu, **2001**, *Clinical Cancer Research*, 7, 1320 - 1324.
- [315] K. Buttke, H. Baumgärtel, H.-J. Niclas, M. Schneider, **1997**, *J. prakt. Chem.*, 339, 721 - 728.
- [316] B. R. Henke, T. G. Consler, N. Go, R. L. Hale, D. R. Hohman, S. A. Jones, A. T. Lu, L. B. Moore, J. T. Moore, L. A. Orband-Miller, R. G. Robinett, J. Shearin, P. K. Spearing, E. L. Stewart, P. S. Turnbull, S. L. Weaver, S. P. Williams, G. B. Wisely, M. H. Lambert, **2002**, *J. Med. Chem.*, 45, 5492 - 5505.
- [317] S. R. Stauffer, Y. Huang, C. J. Coletta, R. Tedesco, J. A. Katzenellenbogen, **2001**, *Bioorganic & Medicinal Chemistry*, 9, 141 - 150.
- [318] E. S. Mull, V. J. Sattigeri, A. L. Rodriguez, J. A. Katzenellenbogen, **2001**, *Bioorganic & Medicinal Chemistry*, 10, 1381 - 1398.
- [319] G. M. Anstead, K. E. Carlson, J. A. Katzenellenbogen, **1997**, *Steroids*, 62, 268 - 303.
- [320] E. v. Angerer, J. Strohmeier, **1987**, *J. Med. Chem.*, 30, 131 - 136.
- [321] M. R. Schneider, E. v. Angerer, W. Hohn, F. Sinowatz, **1987**, *Eur. J. Cancer Clin. Oncol.*, 23, 1005 - 1015.
- [322] Y. Nishino, M. R. Schneider, H. Michna, E. v. Angerer, **1991**, *J. Endocrinol.*, 130, 409 - 414.

- [323] C. P. Miller, M. D. Collini, B. D. Tran, H. A. Harris, Y. P. Kharode, J. T. Marzolf, R. A. Moran, R. A. Henderson, R. H. Bender, R. J. Unwalla, L. M. Greenberger, J. P. Yardley, M. A. Abou-Gharbia, C. R. Lyttle, B. S. Komm, **2001**, *J. Med. Chem.*, *44*, 1654 - 1657.
- [324] T. A. Grese, M. D. Adrian, D. L. Phillips, P. K. Shetler, L. L. Short, A. L. Glasebrook, H. U. Bryant, **2001**, *J. Med. Chem.*, *44*, 2857 - 2860.
- [325] S. Gauthier, B. Caron, J. Cloutier, Y. L. Dory, A. Favre, D. Larouche, J. Mailhot, C. Ouellet, A. Schwerdtfeger, G. Leblanc, C. Martel, J. Simard, Y. Merand, A. Belanger, C. Labrie, F. Labrie, **1997**, *J. Med. Chem.*, *40*, 2117 - 2122.
- [326] G. M. Anstead, S. R. Wilson, J. A. Katzenellenbogen, **1989**, *J. Med. Chem.*, *32*, 2163 - 2171.
- [327] G. M. Anstead, C. S. Peterson, K. G. Pinney, S. R. Wilson, J. A. Katzenellenbogen, **1990**, *J. Med. Chem.*, *33*, 2726 - 2734.
- [328] G. M. Anstead, R. J. Altenbach, S. R. Wilson, J. A. Katzenellenbogen, **1988**, *J. Med. Chem.*, *31*, 1316 - 1326.
- [329] R. D. Bindal, J. A. Katzenellenbogen, **1986**, *Photochem. Photobiol.*, *43*, 121 - 126.
- [330] P. M. Kekenos – Huskey, I. Muegge, R. Gust, W. E. Knapp, *Bioorg. Med. Chem.*, In Vorbereitung.
- [331] N. Watanabe, A. Ikeno, H. Minato, H. Nakagawa, C. Kohayakawa, J. Tsuji, **2003**, *J. Med. Chem.*, *46*, 3961 - 3964.
- [332] R. L. Rosati, P. Da Silva Jardine, K. O. Cameron, D. D. Thompson, H. Z. Ke, S. M. Toler, T. A. Brown, L. C. Pan, C. F. Ebbinghaus, A. R. Reinhold, N. C. Elliott, B. N. Newhouse, C. M. Tjoa, P. M. Sweetnam, M. J. Cole, M. W. Arriola, J. W. Gauthier, D. T. Crawford, D. F. Nickerson, C. M. Pirie, H. Qi, H. A. Simmons, G. T. Tkalcovic, **1998**, *J. Med. Chem.*, *41*, 2928 - 2931.
- [333] H. Z. Ke, V. M. Paralkar, W. A. Grasser, D. T. Crawford, H. Qi, H. A. Simmons, C. M. Pirie, K. L. Chidsey-Frink, T. A. Owen, S. L. Smock, H. K. Chen, W. S. Jee, K. O. Cameron, R. L. Rosati, T. A. Brown, P. Da Silva-Jardine, D. D. Thompson, **1998**, *Endocrinology*, *139*, 2068 - 2076.
- [334] H. Z. Ke, H. Qi, D. T. Crawford, K. L. Chidsey-Frink, H. A. Simmons, D. D. Thompson, **2000**, *Endocrinology*, *141*, 1338 - 1344.
- [335] L. A. Cohen, B. Pittman, C. X. Wang, C. Aliaga, L. Yu, J. D. Moyer, **2001**, *Cancer Res.*, *61*, 8683 - 8688.
- [336] G. W. Duncan, S. C. Lyster, J. J. Clark, D. Lednicer, **1963**, *Proc. Soc. Exp. Biol. Med.*, *112*, 439 - 442.
- [337] G. S. Greenwald, **1965**, *Fertil. Steril.*, *16*, 185 - 194.
- [338] V.C. Jordan, **2003**, *J. Med. Chem.*, *46*, 884 - 908.
- [339] V.C. Jordan, **2003**, *J. Med. Chem.*, *46*, 1082 - 1111.
- [340] E. v. Angerer, J. Prekajac, J. Strohmeier, **1984**, *J. Med. Chem.*, *27*, 1439 - 1447.
- [341] E. v. Angerer, N. Knebel, M. Kager, B. Ganss, **1990**, *J. Med. Chem.*, *33*, 2635 - 2640.
- [342] C. P. Miller, M. D. Collini, B. D. Tran, H. A. Harris, Y. P. Kharode, J. T. Marzolf, R. A. Moran, R. A. Henderson, R. H. W. Bender, R. J. Unwalla, L. M. Greenberger, J. P. Yardley, M. A. Abou-Gharbia, C. R. Lyttle, B. S. Komm, **2001**, *J. Med. Chem.*, *44*, 1654 - 1657.
- [343] A. P. Sharma, A. Saeed, S. Durani, R. S. Kapil, **1990**, *J. Med. Chem.*, *33*, 3222 - 3229.

- [344] B. Barlaam, S. Dock, J. Folmer, Patent, WO 02/46168.
- [345] S. D. Koulocheri, S. A. Haroutounian, **2001**, Eur. J. Org. Chem., 1732 - 1729.
- [346] X. H. Liu, D. P. Rose, **1996**, Cancer Res., 56, 5125 - 5127.
- [347] F. J. Giles, H. M. Kantarjian, B. N. Bekele, J. E. Cortes, S. Faderl, D. A. Thomas, T. Manshouri, A. Rogers, M. J. Keating, M. Talpaz, S. O'Brien, M. Albitar, **2002**, Br. J. Haematol., 119, 38 - 45.
- [348] A. L. Hsu, T. T. Ching, D. S. Wang, X. Song, V. M. Rangnekar, C. S. Chen, **2000**, J. Biol. Chem., 275, 11397 - 11403.
- [349] C. T. Hsueh, C. F. Chiu, D. P. Kelsen, G. K. Schwartz, **2000**, Cancer Chemother. Pharmacol., 45, 389 - 396.
- [350] X. H. Jiang, S. K. Lam, M. C. M. Lin, S. H. Jiang, H. F. Kung, E. D. Slosberg, J. W. Soh, I. B. Weinstein, B. C. Y. Wong, **2002**, Oncogene, 21, 6113 - 6122.
- [351] R. F. Souza, K. Shewmake, D. G. Beer, B. Cryer, S. J. Spechler, **2000**, Cancer Res., 60, 5767 - 5772.
- [352] E. M. Connolly, J. H. Harney, T. O'Grady, D. Foley, G. Roche-Nagle, E. Kay, D. J. Bouchier-Hayes, **2002**, Br. J. Cancer, 87, 231 - 237.
- [353] X. H. Jiang, S. K. Lam, M. C. M. Lin, S. H. Jiang, H. F. Kung, E. D. Slosberg, J. W. Soh, I. B. Weinstein, B. C. Y. Wong, **2002**, Oncogene, 21, 6113 - 6122.
- [354] R. E. Harris, S. Kasbari, W. B. Farrar, **1999**, Oncology Reports, 6, 71 - 73.
- [355] R. E. Harris, R. T. Chlebowski, R. D. Jackson, D. J. Frid, J. L. Ascenseo, G. Anderson, A. Loar, R. J. Rodabough, E. White, A. McTiernan, **2003**, Cancer Res., 63, 6096 - 6101.
- [356] T. A. Chan, P. J. Morin, B. Vogelstein, K. W. Kinzler, **1998**, Proc. Natl. Acad. Sci. USA, 95, 681 - 686.
- [357] Y. Huang, Q. He, M. J. Hillman, R. Rong, M. S. Sheikh, **2001**, Cancer Res., 61, 6918 - 6924.
- [358] T. L. Poulos, **1987**, Adv. Inorg. Biochem., 7, 1.
- [359] J. H. Dawson, **1988**, Science, 240, 433 - 439.
- [360] T. L. Poulos, **1996**, J. Biol. Inorg. Chem., 1, 356 - 359.
- [361] S. A. Seibold, J. F. Cerda, A. M. Mulichak, I. Song, R. M. Garavito, T. Arakawa, W. L. Smith, G. T. Babcock, **2000**, Biochemistry, 39, 6616 - 6624.
- [362] A. Cavalli, M. Recanatini, **2002**, J. Med. Chem., 45, 251 - 254.
- [363] S. M. Decatur, S. G. Boxer, **1995**, Biochemistry, 34, 2122 - 2129.
- [364] M. P. Roach, S. Ozaki, Y. Watanabe, **2000**, Biochemistry, 39, 1446 - 14554.
- [365] K. Liu, J. Williams, H. R. Lee, M. M. Fitzgerald, G. M. Jensen, D. B. Goodin, A. E. McDermott, **1998**, J. Am. Chem. Soc., 120, 10199 - 10202.
- [366] L. Banci, I. Bertini, G. Liu, J. Lu, T. Reddig, W. Tang, Y. Wu, Y. Yao, D. Zhu, **2001**, J. Biol. Inorg. Chem., 6, 628 - 637.
- [367] L. M. Landino, B. C. Crews, J. K. Gierse, S. D. Hauser, L. J. Maenett, **1997**, J. Biol. Chem., 272, 21565 - 21574.
- [368] F. Hafner, E. Holler, E. von Angerer, **1996**, J. Steroid. Biochem. Mol. Biol., 58, 385 - 393.
- [369] E., von Angerer, J. Prekajac, J. Strohmeier, **1984**, J. Med. Chem., 27, 1439 - 1447.
- [370] P. J. Skehan, J. Thomas, S. J. Friedman, **1986**, Cell Bio. Chem. Toxicol., 2, 357 - 368.