

- [41] Veber, D. F.; Freidinger, R. M. *Trends Neurosci.* **1985**, 392.
- [42] Hintermann, T.; Seebach, D. *Chimia* **1997**, 50, 244.
- [43] Hruby, V. J.; Al-Obeidi, F.; Kazmierski, W. *Biochem. J.* **1990**, 268, 249.
- [44] Freidinger, R. M.; Perlow, D. S.; Weber, D. F. *J. Org. Chem.* **1982**, 47, 104.
- [45] Feigel, M.; Lugert, G.; Heichert, C. *Liebigs Ann. Chem.* **1987**, 361.
- [46] Seebach, D.; Matthews, J. L. *Chem. Commun.* **1997**, 2015.
- [47] Appella, D. H.; Christianson, L. A.; Karle, I. L.; Powell, D. R.; Gellman, S. H. *J. Am. Chem. Soc.* **1996**, 118, 13071.
- [48] Hanessian, S.; Luo, X. H.; Schaum, R.; Michnick, S. *J. Am. Chem. Soc.* **1998**, 120, 8569.
- [49] Seebach, D.; Brenner, M.; Rueping, M.; Jaun, B. *Chem. Eur. J.* **2002**, 8, 573.
- [50] Szabo, L.; Smith, B. L.; McReynolds, K. D.; Parill, A. L.; Morris, E. R.; Gervay, J. *J. Org. Chem.* **1998**, 63, 1074.
- [51] Gervay, J. *J. Org. Chem.* **1998**, 63, 1074.
- [52] Hungerford, N. L.; Claridge, T. D. W.; Watterson, M. P.; Aplin, R. T.; Moreno, A.; Fleet, G. W. *J. J. Chem. Soc., Perkin Trans. I* **2000**, 3666.
- [53] Moreno, A.; Fleet, G. W. *J. J. Chem. Soc. Perkin Trans. I* **2000**, 3666.
- [54] Yang, D.; Qu, J.; Li, B.; Ng, F.-F.; Wang, X.-C.; Cheung, K.-K.; Wang, D.-P.; Wu, Y.-D. *J. Am. Chem. Soc.* **1999**, 121, 589.
- [55] Wu, Y.-D. *J. Am. Chem. Soc.* **1999**, 121, 589.
- [56] Zimmerman, S. C.; Corbin, P. S. *Struct. Bond.* **2000**, 96, 63.
- [57] Rzepecki, P.; Gallmeier, H.; Geib, N.; Cernovska, K.; König, B.; Schrader, T. *J. Org. Chem.* **2004**, 69, 5168.
- [58] Wisniewski, T.; Aucouturier, P.; Soto, C.; Frangione, B. *Amyloid: Int. J. Exp. Clin. Invest.* **1998**, 5, 212.
- [59] Carrell, R. W.; Lomas, D. A. *Lancet* **1997**, 350, 134.
- [60] You, S.-L.; Kelly, J. W. *J. Org. Chem.* **2003**, 68, 9506.
- [61] Borst, P. *Ann. Oncol.* **1999**, 10, 162.
- [62] Kaye, S. B. *Curr. Opin. Oncol.* **1998**, 10, S15.
- [63] Leith, C. *Curr. Opin. Oncol.* **1998**, 5, 287.
- [64] Lawrence, D. S.; Copper, J. E.; Smith, C. D. *J. Med. Chem.* **2001**, 44, 594.
- [65] Haberhauer, G. *Synlett* **2004**, 1003.
- [66] Review: Reissig, H.-U. *Top. Curr. Chem.* **1988**, 144, 73.
- [67] Review: Reissig, H.-U.; Zimmer, R. *Chem. Rev.* **2003**, 103, 1151.
- [68] Schnaubelt, J.; Zschiesche, R.; Reissig, H.-U.; Lindner, H. J.; Richter, J. *Liebigs Ann. Chem.* **1993**, 61.
- [69] Ullmann, A.; Gruner, M.; Reissig, H.-U. *Chem. Eur. J.* **1999**, 5, 187.
- [70] Schnaubelt, J.; Frey, B.; Reissig, H.-U. *Helv. Chim. Acta* **1999**, 82, 666.
- [71] Patra, P. K.; Reissig, H.-U. *Synlett* **2001**, 33.
- [72] Angert, H.; Czerwonka, R.; Reissig, H.-U. *Liebigs Ann. Chem.* **1996**, 259.
- [73] Khan, F. A.; Czerwonka, R.; Zimmer, R.; Reissig, H.-U. *Synlett* **1997**, 995.
- [74] Khan, F. A.; Czerwonka, R.; Reissig, H.-U. *Eur. J. Org. Chem.* **2000**, 3607.
- [75] House, H. O.; Czuba, L. J.; Gall, M.; Olmstead, H. D. *J. Org. Chem.* **1968**, 34, 2324.
- [76] Kunkel, E.; Reichelt, I.; Reissig, H.-U. *Liebigs Ann. Chem.* **1984**, 512.
- [77] Reichelt, I.; Reissig, H.-U. *Liebigs Ann. Chem.* **1984**, 531.
- [78] Hünig, S.; Wehner, G. *Synthesis* **1975**, 180.
- [79] Franz, R. *J. Fluorine Chem.* **1980**, 15, 423.
- [80] Rosendahl, F. K.; Ugi, I. *Ann. Chem.* **1963**, 65, 666.
- [81] Microreview: Zhu, J. *Eur. J. Org. Chem.* **2003**, 1133.
- [82] Mumm, O. *Ber. Dtsch. Chem. Ges.* **1910**, 43, 887.
- [83] Mumm, O.; Hesse, H.; Volquartz, H. *Ber. Dtsch. Chem. Ges.* **1915**, 48, 379.

- [84] Demharter, A.; Hörl, W.; Herdtweck, E.; Ugi, I. *Angew. Chem.* **1996**, *108*, 185; *Angew. Chem. Int. Ed. Engl.* **1996**, *35*, 173.
- [85] Park, S. J.; Keum, G.; Kang, S. B.; Koh, H. Y.; Kim, Y.; Lee, D. H. *Tetrahedron Lett.* **1998**, *39*, 7109.
- [86] Review: Caddick, S. *Tetrahedron* **1995**, *51*, 1043.
- [87] Lidström, P.; Tierney, J.; Wathey, B.; Westman, J. *Tetrahedron* **2001**, *57*, 9225.
- [88] Baghurst, D. R.; Mingos, M. P. *J. Chem. Soc. Chem. Commun.* **1992**, 674.
- [89] Corey, E. J.; Su, W.-G. *Tetrahedron Lett.* **1990**, *31*, 2089.
- [90] Groebke, K.; Weber, L.; Mehlin, F. *Synlett* **1998**, 661.
- [91] Scatton, B.; Claustre, Y.; Dennis, T.; Nishikawa, T. *J. Pharmacol. Exp. Ther.* **1986**, *237*, 659.
- [92] Depoortere, H.; Zivkovic, B.; Lloyd, K. G.; Sanger, D. J.; Perrault, G.; Langer, S. Z.; Bartholini, G. *J. Pharmacol. Exp. Ther.* **1986**, *237*, 649.
- [93] Arbillia, S.; Allen, J.; Wick, A.; Langer, S. Z. *Eur. J. Pharmacol.* **1986**, *130*, 257.
- [94] Maruyama, Y.; Anami, K.; Terasawa, M.; Goto, K.; Imayoshi, T.; Kadobe, Y.; Mizushima, Y. *Arzneimittel-Forsch.* **1978**, *28*, 2102.
- [95] Kaminski, J. J.; Wallmark, B.; Briving, C.; Andersson, B.-M. *J. Med. Chem.* **1991**, *34*, 533.
- [96] Sanfilipo, P.J.; Urbanski, M.; Press, J. B.; Dubinsky, B.; Moore, J. B. Jr *J. Med. Chem.* **1988**, *31*, 2221.
- [97] Rival, Y.; Grassy, G.; Michel, G. *Chem. Pharm. Bull.* **1992**, *40*, 1170.
- [98] Zimmer, R.; Braun, S. *unpublished results*, Freie Universitaet Berlin, **2001**.
- [99] Deyrup, J. A.; Vestling, M. M.; Hagan, W. V.; Yun, H. Y. *Tetrahedron* **1969**, *25*, 1467.
- [100] Jeffrey, G. A., *An Introduction to Hydrogen Bonding*, Oxford University Press, Oxford, U. K., **1997**.
- [101] Fleming, A. *J. Exp. Pathol.* **1929**, *10*, 226.
- [102] Hodgin, D. C. *Adv. Sci.* **1949**, *6*, 85.
- [103] Dugar, S.; Kirkup, M. P.; Clader, J. W.; Lin, S.-I.; Rizvi, R.; Snow, M. E.; Davis, H. R. Jr.; McCombie, S. W. *Bio. Med. Chem. Lett.* **1995**, *5*, 2947.
- [104] Napoletano, M.; Della Bella, D.; Fraire, C.; Grancini, G.; Masotto, C.; Ricciardi, S.; Zambon, C. *Bio. Med. Chem. Lett.* **1995**, *5*, 589.
- [105] European Patent EP 404737, **1990**.
- [106] Arai, N.; Shiomi, K.; Yamaguchi, Y.; Masuma, R.; Iwai, Y.; Turberg, A.; Koelbl, H.; Omura, S. *Chem. Pharm. Bull.* **2000**, *48*, 1442.
- [107] Houston, D. R.; Shiomi, K.; Arai, N.; Omura, S.; Peter, M. G.; Turberg, A.; Synstad, B.; Eijsink, V. C. H.; van Aalten, D. M. F. *Proc. Natl. Acad. Sci. U.S.A.* **2002**, *99*, 9127.
- [108] Pettit, G. R.; Kamano, Y.; Herald, C. L.; Dufresna, C.; Cerny, R. L.; Herald, D. L.; Schmidt, J. M.; Kizu, H. *J. Am. Chem. Soc.* **1989**, *111*, 5015.
- [109] Freidinger, R. M. *J. Med. Chem.* **2003**, *46*, 5553.
- [110] Betts, R. L.; Hammet, L. P. *J. Am. Chem. Soc.* **1937**, *59*, 1568.
- [111] De Fevand, R. J.; Strickler, P. D. *J. Org. Chem.* **1963**, *28*, 2915.
- [112] Beckwith, A. L. J., *The Chemistry of Amides*, Wiley-Interscience, New York, **1970**.
- [113] Hünig, S.; Schaller, R. *Angew. Chem.* **1982**, *94*, 1; *Angew. Chem. Int. Ed. Engl.* **1982**, *21*, 36.
- [114] Högberg, T.; Ström, P.; Ebner, M.; Rämsby, S. *J. Org. Chem.* **1987**, *52*, 2033.
- [115] Blackburn, C.; Guan, B. *Tetrahedron Lett.* **2000**, *41*, 1495.
- [116] Barluenga, J.; Fernandez-Rodriguez, M. A.; Aguilar, E.; Fernandez-Mari, F.; Salinas, A.; Olano, B. *Chem. Eur. J.* **2001**, *7*, 3533.
- [117] Angle, S. R.; Henry, R. M. *J. Org. Chem.* **1998**, *63*, 7490.

- [118] Ashby, E. C.; Goel, A. B. *J. Org. Chem.* **1981**, *46*, 3936.
- [119] Day, R. O.; Day, V. W.; Wheeler, D. M. S. *Helv. Chim. Acta* **1985**, *68*, 724.
- [120] Sakamoto, M.; Takahashi, M.; Fujita, T.; Watanabe, S.; Nishio, T.; Ikuo, I.; Aoyama, H. *J. Org. Chem.* **1997**, *62*, 6298.
- [121] *Organikum*, Wiley-VCH, Weinheim, New York, Chichester, Brisbane, Singapore, Toronto, **1999**.
- [122] Collier, P.N.; Campbell, A. D.; Patel, I.; Raynham, T. M.; Taylor, R. J. K. *J. Org. Chem.* **2002**, *67*, 1802.
- [123] Gillespie, R. J.; Lerpiniere, J.; Gaur, S.; Bamford, S. J.; Stratton, G. C.; Leonardi, S.; Weiss, S. M., WO 2002155083 2002-GB91, GB, **2002**.
- [124] Seto, C. T.; Mathias, J. P.; Whitesides, G. M. *J. Am. Chem. Soc.* **1993**, *115*, 1321.
- [125] Campagne, J.-M.; Coste, J.; Jouin, P. *J. Org. Chem.* **1995**, *60*, 5214.
- [126] Gewald, K.; Schinke, E.; Böttcher, H. *Chem. Ber.* **1966**, *99*, 94.
- [127] Press, J. B.; Pelkey, E. T., *Progress in Heterocyclic Chemistry*, Pergamon Press, New York, **1997**.
- [128] Iversen, L. F.; Anderson, H. S.; Branner, S.; Mortensen, S. B.; Peters, G. H.; Norris, K.; Olsen, O. H.; Jeppesen, C. B.; Lundt, B. F.; Ripka, W.; Moller, K. B.; Moller, N. P. *K. J. Biol. Chem.* **2000**, *275*, 10300.
- [129] Webb, T. R.; Melman, N.; Lvovskiy; Ji, X.; Jacobson, K. A. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2000**, *10*, 31.
- [130] Gütschow, M.; Neumann, U. *J. Med. Chem.* **1998**, *41*, 1729.
- [131] Gütschow, M.; Kuerschner, L.; Neumann, U.; Peitsch, M.; Loser, R.; Koglin, N.; Eger, K. *J. J. Med. Chem.* **1999**, *42*, 5437.
- [132] Koike, K.; Jia, Z.; Nikaido, T.; Liu, Y.; Zhao, Y.; Guo, D. *Org. Lett.* **1999**, *1*, 197.
- [133] Buchstaller, H.-P.; Siebert, C. D.; Lyssy, R. H.; Frank, I.; Duran, A.; Gottschlich, R.; Noe, C. R. *Monatschafte für Chemie* **2001**, *132*, 279.
- [134] Jarvest, R. L.; Piuto, I. L.; Ashman, S. M.; Dabrowski, C. E.; Fernandez, A. V.; Jennings, L. J.; Lavery, P.; Tew, D. G. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **1999**, *9*, 443.
- [135] McKibben, B. P.; Cartwright, C. H.; Castelhano, A. L. *Tetrahedron Lett.* **1999**, *40*, 5471.
- [136] Al-Omran, F.; Mohareb, R. M.; El-Khair, A. A. *J. Heterocyclic Chem.* **2002**, *39*, 877.
- [137] Miginau, E.; Kirsch, G. *Synthesis* **2002**, 1096.
- [138] Hoener, A. P. F.; Henkel, B.; Gauvin, J.-C. *Synlett* **2003**, 63.
- [139] Al-Hajmi, H. *Master Thesis*, Freie Universitaet Berlin, **2005**.
- [140] Sakitami, M.; Ohfune, Y. *J. Org. Chem.* **1990**, *55*, 870.
- [141] Thaisrivongs, S.; Watwnpaugh, K. D.; Howe, W. J.; Tomich, P. K.; Dolak, L. A.; Chong, K.-T.; Tomich, C.-S. C.; Tomasselli, A. G.; Turner, S. R.; Strohbach, J. W.; Mulichak, A. M.; Janakiraman, M. N.; Moon, J. B.; Lynn, J. C.; Horng, M. M.; Hinshaw, R. R.; Curry, K. A.; Rothrock, D. J. *J. Med. Chem.* **1995**, *38*, 3624.
- [142] Maji, S. K.; Banerjee, R.; Velmurugan, D.; Razak, A.; Fun, H. K.; Banerjee, A. *J. Org. Chem.* **2002**, *67*, 633.