

References

“I have never met a man so ignorant that I couldn't learn something from him.” - Galileo Galilei

7. References

7. References

- [1] James, P. T. *Clin. Dermatol.***2004**, 22, 276.
- [2] Kylin, E. *Zentralbl Inn Med.***1923**, 44, 105.
- [3] Vague, J. *Presse Med.***1947**, 53, 339.
- [4] Avogaro, P.; Crepaldi, G. *Diabetologia***1965**, 1, 137.
- [5] Reaven, G. M. *Diabetes***1988**, 37, 1595.
- [6] Kaplan, N. M. *Arch. Intern. Med.***1989**, 149, 1514.
- [7] Haffner, S. M.; Valdez, R. A.; Hazuda, H. P.; Mitchell, B. D.; morales, P. A.; Stern, M. P. *Diabetes***1992**, 41, 715.
- [8] Cavanaghan, M. K.; Ehrmann, D. A.; Polonsky, K. S. *J. Clin. Invest.***2000**, 160(3), 329.
- [9] Beatrice, A-T.; Amelie, P.; Maria, P.; Julia, M.; Jieping, D.; David, M.; Stephen, H.; Bernard, M.; Lawrence, R. *Protein Expres. Purif.***2010**, 69(1), 1.
- [10] Chehade, J.M.; Mooradian, A. D. *Drugs***2000**, 60, 95.
- [11] Burge, M. R.; Sood, V.; Sobhy, T. A.; Rassam, A. G.; Schade, D. S. *Diabetes Obes. Metab.***1999**, 1(4), 199.
- [12] Cannon, C. P. *Am. J. Cardiol.* **2008**, 102(12), 5L.
- [13] Cerasi, E.; Boitard, C.; Efendic, S.; Ferrannini, E.; Henquin, J. C.; Steiner, D. F. *Diabetes***2001**, 50(Suppl 1), S1.
- [14] Butler, A. E.; Janson, J.; Bonner-Weir, S.; Ritzel, R.; Rizza, R. A.; Butler, P. C. *Diabetes***2003**, 52(1), 102.
- [15] Thomas R Moore et al., "Diabetes Mellitus and Pregnancy" Med/2349 at eMedicine. Version, **2005**; Jan 27 update.
- [16] Donovan et al., "Drugs for gestational diabetes". Australian Prescriber (33): 141.
- [17] Jiang, G.; Zhang, B. B. *Am J Physiol Endocrinol Metab.***2003**, 284(4), E671.
- [18] Tompkins, C. V.; Brandenburg, D.; Jones, R. H.; Sönksen, P. H. *Diabetologia*, **1981**, 20, 94.
- [19] Bunck, M. C.; Diamant, M.; Corner, A.; Eliasson, B.; Malloy, J. L.; Shaginian, R. M.; Deng, W.; Kendall, D. M.; Taskinen, M.-R.; Smith, U.; Yki-Jarvinen, H.; Heine, R. J. *Diabetes Care***2009**, 32(5), 762.
- [20] Secher, A.; Jelsing, J.; Baquero, A. F.; Hecksher-Sørensen, J.; Cowley, M. A.; Dalbøge, L. S.; Hansen, G.; Grove, K. L.; Pyke, C.; Raun, K.; Schäffer, L.;

- Tang-Christensen, M.; Verma, S.; Witgen, B. M.; Vrang, N.; Knudsen, L. B. *J Clin Invest.* **2014**, *124*, 4473.
- [21] Salle, A.; Guilloteau, G.; Ryan, M.; Bouhanick, B.; Ritz, P. *Diabetes Medicine*, **2004**, *21(12)*, 1298-1303.
- [22] Ruschig, H.; Avmulle, W.; Korger, G.; Wagner, H.; Scholtz, J.; Bander, A. **US: 2976317**.
- [23] Rendell, M. *MedGenMed.* **2004**, *6(Suppl 3)*, 9.
- [24] Maechesini, G.; Bianchi, G.; Tomassetti, S.; Zoli, M.; Melchionda, N.; *The Lancet*, **2001**, *358*, 893.
- [25] Jiang, G.; Zhang, B. B. *Biochem Soc Trans.* **2005**, *33*, 358.
- [26] Benalla, W.; Bellahcen, S.; Bnouham, M. *Curr. Diabetes Rev.* **2010**, *6(4)*, 247.
- [27] Bahekar, R. H.; Lohray B. B.; Lohray V. B.; Jain, M.; Banerjee, K. M.; Patel P. R. *PCT Int. Appl.* **WO: 2008/062457**.
- [28] <http://www.businesswire.com/news/biospace/20101130007174/en/PhaseBio-Lunches-Clinical-Program-Test-Lead-Product>.
- [29] http://www.novonordisk.com/science/pipeline/rd_pipeline.asp.
- [30] Oxxon pipeline summary. <http://www.noxxon.com/downloads/FactSheet.pdf>.
- [31] Kim, D.; Wang, L.; Beconi, M.; Eiermann, G. J.; Fisher, M. H.; He, H.; Hickey, G. J.; Kowalchick, J. E.; Leiting, B.; Lyons, K.; Marsilio, F.; McCann, M. E.; Patel, R. A.; Petrov, A.; Scapin, G.; Patel, S. B.; Roy, R. S.; Wu, J. K.; Wyvratt, M. J.; Zhang, B. B.; Zhu, L.; Thornberry, N. A.; Weber, A. E. *J. Med. Chem.* **2005**, *48*, 141.
- [32] Villhauer, E. B.; Brinkman, J. A.; Naderi, G. B.; Burkey, B. F.; Dunning, B. E.; Prasad, K.; Mangold, B. L.; Russell, M. E.; Hughes, T. E. *J. Med. Chem.* **2003**, *46*, 2774.
- [33] Ristic, S.; Byiers, S.; Foley, J.; Holmes, D. *Diabetes Obes. Metab.* **2005**, *7*, 692.
- [34] Ahren, B.; Gomis, R.; Standl, E.; Mills, D.; Schweizer, A. *Diabetes Care* **2004**, *27*, 2874.
- [35] Erhardt, W.; Bergenheim, K.; Duprat-Lomon, I.; McEwan, P. *Clinical Drug Investigation* **2012**, *32(3)*, 189.
- [36] Augeri, D. J.; Robl, J. A.; Betebenner, D. A.; Magnin, D. R.; Khanna, A.; Robertson, J. G.; Wang, A.; Simpkins, L. M.; Taunk, P.; Huang, Q.; Han, S.-P.; Abboa-Offei, B.; Cap, M.; Xin, L.; Tao, L.; Tozzo, E.; Welzel, G. E.; Egan, D. M.; Marcinkeviciene, J.; Chang, S. Y.; Biller, S. A.; Kirby, M. S.; Parker, R. A.; Hamann, L. G. *J. Med. Chem.* **2005**, *48*, 5025.
- [37] AstraZeneca pipeline summary. AstraZeneca plc, Cheshire, UK, 2008.

- <http://www.astrazeneca.com/article/511390.aspx>.
- [38] Li, J.; Zhang, S.; Zhou, H.; Peng, J.; Feng, Y.; Hu, X. *Lett. Org. Chem.*, **2012**, 9(5), 347.
- [39] Eckhardt, M.; Langkopf, E.; Mark, M.; Tadayyon, M.; Thomas, L.; Nar, H.; Pfrengle, W.; Guth, B.; Lotz, R.; Sieger, P.; Fuchs, H.; Himmelsbach, F. *J. Med. Chem***2007**, 50, 6450.
- [40] Scherthner, G.; Barnett, A. H.; Emser, A.; Patel, S.; Troost, J.; Woerle, H.-J.; Eynatten, M.von. *Diabetes Obesity and Metabolism***2012**, 14(5), 470.
- [41] Feng, J.; Zhang, Z.; Wallace, M. B.; Stafford, J. A.; Kaldor, S. W.; Kassel, D. B.; Navre, M.; Shi, L.; Skene, R. J.; Asakawa, T.; Takeuchi, K.; Xu, R.; Webb, D. R.; Gwaltney, S. L. *J Med Chem***2007**, 50, 2297.
- [42] Kato, N.; Oka, M.; Murase, T.; Yoshida, M.; Sakairi, M.; Yamashita, S.; Yasuda, Y.; Yoshikawa, A.; Hayashi, Y.; Makino, M.; Takeda, M.; Mirenska, Y.; Kakigami, T. *Bioorg. Med. Chem.***2011**, 19(23), 7221.
- [43] Furuta, S.; Smart, C.; Hackett, A. et al. *Xenobiotica***2013**, 43, 432.
- [44] Kim, S. H.; Lee, S. H.; Yim, H, J. *Arch Pharm Res.***2013**, 36, 1185.
- [45] Rhee, E. J.; Lee, W. Y.; Min, K. W.; Shivane, V. K.; Sosale, A. R.; Jang, H. C.; Chung, C. H.; Nam-Goong, I. S.; Kim, J. A.; Kim, S. W.; Gemigliptin Study 006 Group. *Diabetes Obes Metab.***2013**, 15, 523.
- [46] Yoshida, T.; Akahoshi, F.; Sakashita, H.; Kitajima, H.; Nakamura, M.; Sonda, S.; Takeuchi, M.; Tanaka, Y.; Ueda, N.; Sekiguchi, S.; Ishige, T.; Shima, K.; Nabeno, M.; Abe, Y.; Anabuki, J.; Soejima, A. et al. *Bioorg. Med. Chem.***2012**, 20, 5705.
- [47] Fukuda-Tsuru, S.; Anabuki, J.; Abe, Y. et al. *Eur. J. Pharmacol.* **2012**, 696, 194.
- [48] Eto, T.; Inoue, S.; Kadowaki, T. *Diabetes Obes Metab.***2012**, 14, 1040.
- [49] Dhupad, U.; Aravat, V.; Navhat, S.; Thomas, A.; Kadam, S. **US: 2010/0173964**.
- [50] Ammirati, M. J.; Andrews, K. M.; Boyer, D. D.; Brodeur, A. M.; Danley, D. E.; Doran, S. D.; Hulin, B.; Liu, S. P.; McPherson, R. K.; Orena, S. J.; Parker, J. C.; Polivkova, J.; Qiu, X. Y.; Soglia, C. B.; Treadway, J. L.; VanVolkenburg, M. A.; Wilder, D. C.; Piotrowski, D. W. *Bioorg. Med. Chem. Lett.*, **2009**, 19, 1991.
- [51] Sharma, R.; Sun, H.; Piotrowski, D. W.; Ryder, T. F.; Doran, S. D.; Dai, H.; Prakash, C. *Drug Metab Dispos***2012**, 40, 2143.
- [52] Dai, H.; Johanson, S. L.; Terra, S. G.; Marbury, T. C.; Smith, W. B.; Alcorn, H.; Boyd, R. A.; Wang, R.; Nguyen, T. T. *Br. J. Clin. Pharmacol.***2011**, 72(1), 85.

- [53] <http://www.furiex.com/pipeline/discoverydevelopment-pipeline/syr-472/>
- [54] Sanford, D. G. et al: American Diabetes Association Chicago. **2007**, Abstract Number: 604-P
- [55] http://www.drugs.com/clinical_trials/arisaph-pharmaceuticals-announces-ada-potent-dpp-4-inhibitor-ari-2243-possesses-additional-4697.html
- [56] Biftu, T.; Sinha-Roy, R.; Chen, P.; Qian, X.; Feng, D.; Kuethe, J. T.; Cox, J.; Hicks, J.; Lyons, K.; He, H.; Salituro, G.; Tong, S.; Patel, S.; Doss, G.; Petrov, A.; Wu, J.; Sherrie Xu, S.; Sewall, C.; Zhang, X.; Zhang, B.; Thornberry, N. A.; Weber, A. E. *J. Med. Chem.***2014**, *57*, 3205.
- [57] Kim, H. J.; Kwak, W. Y.; Min, J. P.; Lee, J. Y.; Yoon, T. H.; Kim, A. D.; Shin, J. Y.; Kim, M. K.; Choi, S. H.; Kim, H. S.; Yang, E. K.; Cheong, Y. H.; Chae, Y. N.; Park, K. J.; Jang, J. M.; Choi, S. J.; Son, M. H.; Kim, S. H.; Yoo, M.; Lee, B. J. *Bioorg. Med. Chem. Lett.***2011**, *21(12)*, 3809.
- [58] Cho, J. M.; Jang, H. W.; Cheon, H.; Jeong, Y. T.; Kim, D.-H.; Lim, Y.-M.; Choi, S.-H.; Yang, E.-K.; Shin, C.-Y.; Son, M. H.; Kim, S. H.; Kim, H.-J.; Lee, M.-S. *Diabetes Res Clin Pract.***2011**, *91(1)*, 72.
- [59] Erion, M. D.; van Poelje, P. D.; Dang, Q.; Kasibhatla, S. R.; Potter, S. C.; Reddy, M. R.; Reddy, K. R.; Jiang, T.; Lipscomb, W. N. *Proc. Natl. Acad. Sci. U. S. A.***2005**, *102(22)*, 7970.
- [60] DiaMedica pipeline summary. <http://diamedica.com/sites/default/files/April-2001-Fact-Sheet.pdf>.
- [61] DiaMedica pipeline summary.<http://diamedica.com/technology/drug-pipeline>.
- [62] Li, J. J.; Hamann, L. G.; Runa, Z.; Copper, C. B.; Wu, S. C.; Simpkins, L. M.; Wang, H.; Nayeem, A.; Krystek, S. R. **US: 2011/0077395**.
- [63] Arbeeny, C. M.; *Obes. Res.***2004**, *12(8)*, 1191.
- [64] Courtney, R.; Stewart, P. M.; Toh, M.; Ndong, M. N.; Calle, R. A.; Hirshberg, B. *J. Clin. Endocrinol. Metab.***2008**, *93(2)*, 550.
- [65] Xu, Z.; Tice, C. M.; Zhao, W.; Cacatian, S.; Ye, Y. J.; Singh, S. B.; Lindblom, P.; McKeever, B. M.; Krosky, P. M.; Kruk, B. A.; Berbaum, J.; Harrison, R. K.; Johnson, J. A.; Bukhtiyarov, Y.; Panemangalore, R.; Scott, B. B.; Zhao, Y.; Bruno, J. G.; Togias, J.; Guo, J.; Carroll, P. J.; McGeehan, G. M.; Zhuang, L.; He, W.; Claremon, D. A. *J. Med. Chem.***2011**, *54(17)*, 6050.
- [66] Tiwari, A. *IDrugs.***2010**, *13(4)*, 266.
- [67] Harno, E.; White, A. *Trends Endocrinol. Metab.***2010**, *21(10)*, 619.
- [68] Scott, J. S.; Bowker, S. S.; Deschoolmeester, J.; Gerhardt, S.; Hargreaves, D.; Kilgour, E.; Lloyd, A.; Mayers, R. M.; McCoull, W.; Newcombe, N. J.; Oqq, D.; Packer, M. J.; Rees, A.; Revill, J.; Schofield, P.; Selmi, N.; Swales, J.

- G. Whittamore, P. R. *J. Med. Chem.***2012**, 55(12), 5951.
- [69] Veniant, M. M.; Hale, C.; Hungate, R. W.; Gahm, K.; Emery, M. G.; Jona, J.; Joseph, S.; Adams, J.; Hague, A.; Moniz, G.; Zhang, J.; Bartberger, M. D.; Li, V.; Syed, R.; Jordan, S.; Komorowski, R.; Chen, M. M.; Cupples, R.; Kim, K. W.; St Jean, D. J.; Jr. Johansson, L.; Henriksson, M. A.; Williams, M.; Vallgarda, J.; Fotsch, C.; Wang, M. *J. Med. Chem.***2010**, 53(11), 4481.
- [70] Mitsubishi Tanabe Pharma pipeline summary.http://www.mt-pharma.co.jp/e/ir/meeting/pdf/e_presen120131_K.pdf.
- [71] Meng, W.; Ellsworth, B. A.; Nirschl, A. A.; McCann, P. J.; Patel, M.; Girotra, R. N.; Wu, G.; Sher, P. M.; Morrison, E. P.; Biller, S. A.; Zahler, R.; Deshpande, P. P.; Pullockaran, A.; Hagan, D. L.; Morgan, N.; Taylor, J. R.; Obermeier, M. T.; Humphreys, W. G.; Khanna, A.; Discenza, L.; Roberston, J. G.; Wang, A.; Han, S.; Wetterau, J. R.; Janovitz, E. B.; Flint, O. P.; Whaley, J. M.; Washburn, W. N. *J. Med. Chem.***2008**, 51(5), 1145.
- [72] Weber, D.; Fiedler, T.; Filser, C.; Hamm, R.; Oplich, S.; Post, M.; Renner, S.; Wang, X.-J.; Wirth, T. *PCT Int. Appl.***WO: 2011/039108**.
- [73] Wolfram, E. *PCT Int. Appl.***WO: 2010/092124**.
- [74] Murakata, M.; Ikeda, T.; Kimura, N.; Kawase, A.; Nagase, M.; Yamamoto, K.; Takata, N.; Yoshizaki, S.; Takano, K. *PCT Int. Appl.***WO: 2009/154276**.
- [75] Dobbins, R. L.; O'Connor-Semmes, R.; Kapur, A.; Kapitza, C.; Golor, G.; Mikoshiba, I.; Tao, W.; Hussey, E. K. *Diabetes Obes. Metab.***2012**, 14(1), 15.
- [76] Green, J. T.; Wilkison, W. O. *PCT Int. Appl.***WO: 2012/006398**.
- [77] Patterson, D. E.; McClure, M. S.; Powers, J. D. Crawford, C. F.; Berry, M. B. *PCT Int. Appl.***WO: 2010/127067**.
- [78] Kasai, K.; Kobayashi, M.; Ozawa, T.; Nishimura, M.; Tashino, Y. **JP: 2011/201871**.
- [79] Kotobuki Pharmaceutical pipeline summary.
http://www.astellas.com/en/ir/library/pdf/2011_rd_en.pdf.
- [80] Yamamoto, K.; Uchida, S.; Kitano, K.; Fukuhara, N.; Okumura-Kitalima, L.; Gunji, E.; Kozakai, A.; Tomoike, H.; Kojima, N.; Asami, J.; Toyoda, H.; Arai, M.; Takahashi, T.; Takahashi, K. *Br. J. Pharmacol.***2011**, 164(1), 181.
- [81] Kakinuma, H.; Oi, T.; Hashimoto-Tsuchiya, Y.; Arai, M.; Kawakita, Y.; Fukasawa, Y.; Lida, I.; Hagima, N.; Takeuchi, H.; Chino, Y.; Asami, J.; Okumura-Kitajima, L.; Lo, F.; Yamamoto, D.; Miyata, N.; Takahashi, T.; Uchida, S.; Yamamoto, K. *J. Med. Chem.***2010**, 53(8), 3247.
- [82] Sirona Biochem pipeline summary.
<http://www.sironabiochem.com/products/pipeline/>; BIO 2011.

- [83] Theracos pipeline summary. <http://clinicaltrials.gov/ct2/show/NCT01029704>.
- [84] Kalgutkar, A. S.; Tugnait, M.; Zhu, T.; Kimoto, E.; Miao, Z.; Mascitti, V.; Yang, X.; Tan, B.; Walsky, R. L.; Chupka, J.; Feng, B.; Robinson, R. P. *Drug Metab. Dispos.***2011**, *39*(9), 1609.
- [85] Mascitti, V.; Maurer, T. S.; Robinson, R. P.; Bian, J.; Boustany-Kari, C. M.; Brandt, T.; Collman, B. M.; Kalgutkar, A. S.; Klenotic, M. K.; Leininger, M. T.; Lowe, A.; maguire, R. J.; Masterson, V. M.; Miao, Z.; mukaiyama, E.; Patel, J. D.; Pettersen, J. C.; Preville, C.; Samas, B.; She, L.; Sobol, Z.; Steppan, C. M.; Stevens, B. D.; Thuma, B. A.; Tugnait, M.; Zeng, D.; Zhu, T. *J. Med. Chem.***2011**, *54*(8), 2952.
- [86] Mascitti, V.; Preville, C. *Org. Lett.***2010**, *12*(13), 2940.
- [87] Theracos pipeline summary. <http://clinicaltrials.gov/show/NCT01377844>.
- [88] Daiichi Sankyo pipeline summary.
ClinicalTrials.gov, 2011, <http://clinicaltrials.gov/ct2/show/study/NCT00408434>.
- [89] Lu, X.-P.; Li, Z.; Liao, C.; Shi, L.; Liu, Z.; Ma, B.; Ning, Z.; Shan, S.; Deng, T. US: 2004/0142921.
- [90] Kim, J. W.; Kim, J. R.; Yi, S.; Shin, K. H.; Shin, H. S.; Yoon, S. H.; Cho, J. Y.; Kim, D. H.; Shin, S. G.; Jang, I. J.; Yu, K. S. *Clin. Ther.***2011**, *33*(11), 1819.
- [91] Lee, H. W.; Ahn, J. B.; Kang, S. W.; Ahn, S. K. Ha, D.-C. *Org. Process. Res. Dev.***2007**, *11*(2), 190.
- [92] Rikimaru, K.; Wakabayashi, T.; Abe, H.; Imoto, H.; Maekawa, T.; Ujikawa, O.; Murase, K.; Matsuo, T.; Matsumoto, M.; Nomura, C.; Tsuge, H.; Arimura, N.; Kawakami, K.; Sakamoto, J.; Funami, M.; Moi, C. D.; Snell, G. P.; Braqstad, K. A.; Sang, B. C.; Dougan, D. R.; Tanaka, T.; Katayama, N.; Horiguchi, Y.; Momose, Y. *Bioorg. Med. Chem.***2012**, *20*(2), 714.
- [93] Rikimaru, K.; Wakabayashi, T.; Abe, H.; Tawarashi, T.; Imoto, H.; Yonemori, J.; Hirose, H.; Murase, K.; Matsuo, T.; Matsumoto, M.; Nomura, C.; Tsuge, H.; Arimura, N.; Kawakami, K.; Sakamoto, J.; unami, M.; Mol, C. D.; Snell, G. P.; Braqstad, K. A.; Sang, B. C.; Dougan, D. R.; Tanaka, T.; Katayama, N.; Horiguchi, Y.; Momose, Y. *Bioorg. Med. Chem.***2012**, *20*(10), 3332.
- [94] Cho, S. Y.; Ahn, J. H.; Ha, J. D.; Kang, S. K.; Bake, J. Y.; Han, S. S.; Shin, E. Y.; Kim, S. S.; Kim, K. R.; Cheon, H. G.; Choi, J.-K. *Bull. Korean Chem. Soc.***2003**, *24*, 1455.
- [95] TransTech Pharma pipeline summary.(Company Web Pages, TransTech Pharma, 4 Dec 2001 & 10 May 2007).
- [96] Isis Pharmaceuticals pipeline summary.<http://www.isispharm.com/Pipeline/index.htm>.

- [97] Basu, S.; Prasad, U. V.; Barawkar, D. A.; De, S.; Palle, V. P.; Menon, S.; Patel, M.; Thorat, S.; Singh, U. P.; Das Sarma, K.; Waman, Y.; Niranjan, S.; Pathade, V.; Gaur, A.; Reddy, S.; Ansari, S. *Bioorg. Med. Chem. Lett.***2012**, 22(8), 2843.
- [98] McIntosh, C.; Demuth, H.; Pospisilik, J.; Pederson, R. *Regulatory Peptides***2005**, 128(2), 159.
- [99] Behme, M. T.; Dupre, J.; McDonald, T. J. *BMC Endocr. Disord.***2003**, 3(1), 3.
- [100] Dupre, J.; Behme, M. T.; Hramiak, I. M.; McFarlane, P.; Williamson, M. P.; Zabel, P.; McDonald, T. J. *Diabetes* **1995**, 44(6), 626.
- [101] Kenner, K. A.; Anyanwu, E.; Olefsky, J. M.; Kusari, J. *J. Biol. Chem.***1996**, 271, 19810.
- [102] Ahmad, F.; Li, P. M.; Meyerovitch, J.; Goldstein, B. J. *J. Biol. Chem.***1995**, 270, 20503.
- [103] Elehebly, M.; Payette, P.; Michaliszyn, E.; Cromlish, W.; Collins, S.; Loy, A. L.; Normandin, D.; Cheng, A.; Himms-Hagen, J.; Chan, C.-C.; Ramachandran, C.; Gresser, M. J.; Tremblay, M. L.; Kennedy, B. P.; *Science***1999**, 283, 1544.
- [104] Klamann, L. D.; Boss, O.; Peroni, O. D.; Kim, J. K.; Martino, J. L.; Zabolotny, J. M.; Moghal, N.; Lubkin, M.; Kim, Y. B.; Sharpe, A. H.; Stricker-Krongrad, A.; Shulman, G. I.; Neel, B. G.; Kahn, B. B. *Mol. Cell. Biol.***2000**, 20, 5479.
- [105] American Diabetes Association *Diabetes Care***2011**, 1, S11.
- [106] Alan, J. G. *Diabetes Care***2011**, 34(2), S279.
- [107] Mitra, S.; Sangle, G.; Tandon, R.; Sharma, S.; Roy, S.; Khanna, V.; Gupta, A.; Sattigeri, J.; Sharma, L.; Priyadarsiny, P.; Khattar, S. K.; Bora, R. S.; Saini, K. S.; Bansal, V. S. *Br. J. Pharmacol.***2007**, 150(4), 480.
- [108] Tannehill-Gregg, S. H.; Sanderson, T. P.; Minnema, D.; Voelker, R.; Ulland, B.; Cohen, S. M.; Arnold, L. L.; Schilling, B. E.; Waites, C. R.; Dominick, M. A. *Toxicol. Sci.***2007**, 98(1), 258.
- [109] Raquel, G.-S.; Felix, H.; Jose, J. L.; Jesus, A. *Front. Mol. Neurosci.***2011**, 4, 45.
- [110] Elchebly, M.; Payette, P.; Michaliszyn, E.. *Science* **1999**, 283, 1544.
- [111] Bjorge, J.D.; Pang, A.; Fujita, D. J.; *J. Biol. Chem.***2000**, 275, 41439.
- [112] Deacon, C. F.; Holst, J. J. *Int.J. Biochem. Cell Biol.***2006**, 38, 831.
- [113] Reimer, M. K.; Holst, J. J.; Ahren, B. *Eur. J. Endocrin.* **2002**, 146, 717.
- [114] Drucker, D. J. *Expert. Opin. Investig. Drugs.***2003**, 12(1), 87.
- [115] Deacon, C. F.; Ahren, B.; Holst, J. J. *Expert. Opin. Investig. Drugs.***2004**, 13(9), 1091.

- [116] Sebokova, E.; Christ, A. D.; Boehringer, M.; Mizrahi, J. *Curr. Top. Med. Chem.* **2007**, *7*, 547.
- [117] Augustyns, K.; Veken, P. V.; Senten, K.; Haemers. *Expert. Opin. Therp. Patents* **2003**, *13*(4), 499.
- [118] Conarello, S.; Li, Z.; Ronan, J. *Proc. Natl. Acad. Sci. U.S.A.* **2003**, *100*, 6825.
- [119] Holst, J. J. *Gastroenterology* **1994**, *107*, 1048.
- [120] Drucker, D. J. *Diabetes* **1998**, *47*, 159.
- [121] Deacon, C. F.; Holst, J. J.; Carr, R. D. *Drugs of Today* **1999**, *35*, 159.
- [122] Livingston, J. N.; Schoen, W. R. *Annu. Rep. Med. Chem.* **1999**, *34*, 189
- [123] Lambeir, A.; Durinx, C.; Scharpe, S.; De Meester, I. *Critical Reviews in Clinical Laboratory Sciences*, **2003**, *40*(3), 209.
- [124] Yaron, A.; Naider, F. *Critical Reviews in Biochemistry and Molecular Biology*, **1993**, *28*(1), 31.
- [125] Cunningham, D. F.; O'Connor, B. *Biochim. Biophys. Acta* **1997**, *1343*, 160.
- [126] Hartel, S.; Gossrau, R.; Hanski, C.; Reutter, W. *Histochemistry* **1988**, *89*, 151.
- [127] McCaughan, G. W.; Wickson, J. E.; Creswick, P. F.; Gorrell, M. D. *Hepatology* **1990**, *11*, 534.
- [128] Gorrell, M. D.; Wickson, J.; McCaughan, G.W. *Cell. Immunol.* **1991**, *134*, 205.
- [129] Bu"hling, F.; Kunz, D.; Reinhold, D.; Ulmer, A. J.; Ernst, M.; Flad, H. D.; Ansorge, S. *Nat. Immun.* **1994**, *13*, 270.
- [130] Iwaki-Egawa, S.; Watanabe, Y.; Kikuya, Y.; Fujimoto, Y. *J. Biochem.* **1998**, *124*, 428.
- [131] Kieffer, T. J.; McIntosh, C. H. S.; Pederson, T. A. *Endocrinology* **1995**, *136*, 3585.
- [132] Abbott, C. A. and Gorrell, M. D. *Langner, J. and Ansorge, S., eds.* **2002**, pp 171–195, Kluwer/Plenum, New York.
- [133] Rosenblum, J. S.; Kozarich, J. W. *Curr. Opin. Chem. Bio.* **2003**, *7*, 496.
- [134] Gorrell, M. D. *Clin. Sci.* **2005**, *108*, 277.
- [135] Abbott, C. A., McCaughan, G.W. and Gorrell, M. D. *FEBS Lett.* **1999**, *458*, 278.
- [136] Wang, X. M., Yao, T.W., Nadvi, N. A., Osborne, B., McCaughan, G.W. and Gorrell, M. D. *Front. Biosci.* **2008**, *13*, 3168.
- [137] Ajami, K.; Abbott, C. A.; McCaughan, G.W.; Gorrell, M. D. *Biochim. Biophys. Acta* **2004**, *1679*, 18.
- [138] Klener, P.; Lojda, Z.; Haber, J.; Kvasnicka, J. *Neoplasma*, **1987**, *34*, 581.
- [139] Bjelke, J. R.; Christensen, J.; Nielsen, P. F.; Branner, S.; Kanstrup, A. B.; Wagtmann, N.; Rasmussen, H. B. *Biochem. J.* **2006**, *396*, 391.

- [140] Ajami, K.; Pitman, M. R.; Wilson, C. H.; Park, J.; Menz, R. I.; Starr, A. E.; Cox, J. H.; Abbott, C. A.; Overall, C. M.; Gorrell, M. D. *FEBS Lett.* **2008**, 582, 819.
- [141] Green, B. D.; Flatt, P. R.; Bailey, C. J. *Expert Opin. Emerging Drugs* **2006**, 11, 525.
- [142] Rummey, C.; Metz, G. *Proteins* **2007**, 66, 160.
- [143] Park, J.; Knott, H. M.; Nadvi, N. A.; Collyer, C. A.; Wang, X. M.; Church, W. B.; Gorrell, M. D. *Open Enzyme Inhibition J.* **2008**, 1, 52.
- [144] Thoma, R.; Loffler, B.; Stihle, M.; Huber, W.; Ruf, A.; Hennig, M. *Structure*, **2003**, 11, 947.
- [145] "Entrez Gene: PREP prolyl endopeptidase"
- [146] Chen, T.; Ajami, K.; McCaughan, G. W.; Gai, W. P.; Gorrell, M. D.; Abbott, C. A. *Biochim. Biophys. Acta* **2006**, 1764, 33.
- [147] Leiting, B.; Pryor, K. D.; Wu, J. K.; Marsilio, F.; Patel, R. A.; Craik, C. S.; Ellman, J. A.; Cummings, R. T.; Thornberry, N. A. *Biochem. J.*, **2003**, 371, 525.
- [148] Holst, J. J. *Diabetologia* **2006**, 491, 253.
- [149] Baggio, L. L.; Drucker, D. J. *Gastroenterology* **2007**, 132, 2131.
- [150] Zhu, L.; Tamvakopoulos, C.; Xie, D.; Dragovic, J.; Shen, X.; Fenyk-Melody, J. E.; Schmidt, K.; Bagchi, A.; Griffin, P. R.; Thornberry, N. A.; Roy, R. S. *J. Biol. Chem.* **2003**, 278(25), 22418.
- [151] Flatt, P. R.; Bailey, C. J.; Green, B. D. *Frontiers in Bioscience*, **2008**, 13, 3648.
- [152] Maes, M. B.; Dubois, V.; Brandt, I.; Lambeir, A. M.; Van der Veken, P.; Augustyns, K.; Cheng, J. D.; Chen, X.; Scharpé, S.; De Meester, I. *J. Leukocyte Biol.* **2007**, 81, 1252.
- [153] Mentlein, R.; Gallwitz, B.; Schmidt, W. E. *Eur. J. Biochem.* **1993**, 214, 829.
- [154] Brubaker, P. L., Izzo, A., Hill, M. and Drucker, D. J. *Am. J. Physiol.* **1997**, 35, E1050.
- [155] Nausch, I.; Mentlein, R.; Heymann, E. *Biol. Chem. Hoppe Seyler*, **1990**, 371, 1113.
- [156] Lambeir, A. M.; Durinx, C.; Proost, P.; Van Damme, J.; Scharpé, S.; De Meester, I. *FEBS Lett.* **2001**, 507, 327.
- [157] Mentlein, R.; Dahms, P.; Grandt, D.; Kruger, R. *Regul. Pept.* **1993**, 49, 133.
- [158] Zhu, L.; Tamvakopoulos, C.; Xie, D. et al. *J. Biol. Chem.* **2003**, 278, 22418.
- [159] Mentlein, R. *Regul. Pept.* **1999**, 85, 9.
- [160] Sakurada, C.; Sakurada, S.; Hayashi, T.; Katsuyama, S.; Tan-No, K.; Sakurada, T. *Biochem. Pharmacol.* **2003**, 66, 653.

- [161] Zhang, X. Y.; De Meester, I.; Lambeir, A. M. et al. *J. Mass Spec.***1999**, *34*, 255.
- [162] Rasmussen, H. B.; Branner, S.; Wiberg, F. C.; Wagtmann, N. *Nat. Struct. Biol.***2003**, *10*, 19.
- [163] Oefner, C.; D'Arcy, A.; Mac Sweeney, A.; Pierau, S.; Gardiner, R.; Dale, G. E. *Acta Crystallogr. D, Biol. Crystallogr.***2003**, *59*, 1206.
- [164] Hiramatsu, H., Yamamoto, A., Kyono, K. et al. *Biol. Chem.***2004**, *385*, 561.
- [165] Thoma, R.; Loffler, B.; Stihle, M.; Huber, W.; Ruf, A.; Hennig, M. *Structure***2003**, *11*, 947.
- [166] Engel, M.; Hoffmann, T.; Wagner, L. et al. *Proc. Natl. Acad. Sci. U.S.A.***2003**, *100*, 5063.
- [167] Aertgeerts, K.; Ye, S.; Tennant, M. G. et al. *Protein Sci.***2004**, *13*, 412.
- [168] Weihofen, W. A.; Liu, J.; Reutter, W.; Saenger, W.; Fan, H. *J. Biol. Chem.***2004**, *41*, 43330.
- [169] Tanaka, T.; Camerini, D.; Seed, B.; Torimoto, Y.; Dang, N. H.; Kameoka, J.; Dahlberg, H. N.; Schlossman, S. F.; Morimoto, C. *J. Immunol.***1992**, *149*, 481.
- [170] Ollis, D. L.; Cheah, E.; Cygler, M.; Dijkstra, B.; Frolow, F.; Franken S. M.; Harel, M.; Remington, S. J.; Silman, I.; Schrag, J. *Protein Eng.***1992**, *5*, 197.
- [171] Ogata, S.; Misumi, Y.; Tsuji, E.; Takami, N.; Oda, K.; Ikehara, Y. *Biochemistry***1992**, *31*, 2582.
- [172] Rahfeld, J.; Schierhorn, M.; Hartrodt, B.; Neubert, K.; Heins J. *Biochim. Biophys. Acta***1991**, *1076*, 314.
- [173] Schechter, I.; Berger, A. *Biochem. Biophys. Res. Commun.***1968**, *32*, 898.
- [174] Brandt, W.; Ludwig, O.; Thondorf, I.; Barth, A. *Eur. J. Biochem.***1996**, *236*, 109.
- [175] Heins, J.; Welker, P.; Schonlein, C.; Born, I.; Hartrodt, B.; Neubert, K.; Tsuru, D.; Barth, A. *Biochim. Biophys. Acta***1988**, *954*, 161.
- [176] Yoshimoto, T.; Fischl, M.; Orłowski, R. C.; Walter, R. *J. Biol. Chem.***1978**, *253*, 3708.
- [177] Abbott, C. A.; McCaughan, G. W.; Gorrell, M. D. *FEBS Lett.***1999a**, *458*, 278.
- [178] http://www.ebi.ac.uk/thornton-srv/databases/cgi-bin/enzymes/GetPage.pl?ec_number=3.4.14.5
- [179] Ikehara, Y.; Ogata, S.; Misumi, Y. *Method Enzymol.* **1994**, *244*, 215.
- [180] Augustyns, K.; Van der Veken, P.; Haemers, A. *Expert Opin. Ther. Pat.* **2005**, *15*, 1387.
- [181] Hunziker, D.; Hennig, M.; Peters, J. U. *Curr. Top. Med. Chem.* **2005**, *5*, 1623.
- [182] Babine, R. E.; Bender, S. L. *Chem. Rev.***1997**, *97*, 1359.

- [183] Qiao, L.; Baumann, C. A.; Crysler, C. S.; Ninan, N. S.; Abad, M. C.; Spurlino, J. C.; DesJarlais, R. L.; Kervinen, J.; Neeper, M. P.; Bayoumy, S. S.; Williams, R.; Deckman, I. C.; Dasgupta, M.; Reed, R. L.; Huebert, N. D.; Tomczuk, B. E.; Moriarty, K. J. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2006**, *16*, 123.
- [184] Hughes, T. E.; Mone, M. D.; Russell, M. E.; Weldon, S. C.; Villhauer, E. B. *Biochemistry* **1999**, *38*, 11597.
- [185] Feng, J.; Gwaltney II, S. L.; Stafford, J. A.; Wallace, M.; Zhang, Z.; Kassel, D. B.; Manuel, M.; Xu, R.; Prasad, G. S.; Skene, R. J.; Ye, S.; Caster, C.; Navre, M.; Shi, L.; Kaldor, S.; Webb, D. R. Poster. *Advances in Structure-Based Drug Discovery*. Philadelphia, Pa, USA, **2005**.
- [186] Stockel-Maschek, A.; Stiebitz, B.; Born, I.; Faust, J.; Mogelin, W.; Neubert, K. *Adv. Exp. Med. Biol.* **2000**, *477*, 117.
- [187] Hulin, B.; Cabral, S.; Lopaze, M. G.; Van Volkenburg, M. A.; Andrews, K. M.; Parker, J. C. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2005**, *15*, 4770.
- [188] Peters, J.-U.; Weber, S.; Kritter, S.; Weiss, P.; Wallier, A.; Boehringer, M.; Hennig, M.; Kuhn, B.; Loeffler, B.-M. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2004**, *14*, 1491.
- [189] Xu, J.; Ok, H. O.; Gonzalez, E. J.; Colwell, L. F.; Habulihaz, B.; He, H.; Leiting, B.; Lyons, K. A.; Marsilio, F.; Patel, R. A.; Wu, J. K.; Thornberry, N. A.; Weber, A. E.; Parmee, E. R. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2004**, *14*, 4759.
- [190] Mattei, P.; Böhringer, M.; Fischer, H.; Gobbi, L.; Hennig, M.; Huwyler, J.; Kuhn, B.; Löffler, B.; Lübbers, T.; Narquizian, R.; Nielsen, J.; Wessel, H. P.; Wyss, P. Poster. *2nd Joint Italian-Swiss Meeting on Medicinal Chemistry*. Modena, Italy, **2005**.
- [191] Brockunier, L. L.; He, J.; Colwell, L. F.; Habulihaz, B.; He, H.; Leiting, B.; Lyons, K. A.; Marsilio, F.; Patel, R. A.; Teffera, Y.; Wu, J. K.; Thornberry, N. A.; Weber, A. E.; Parmee, E. R. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2004**, *14*, 4763.
- [192] Coppola, G. M.; Zhang, Y. L.; Schuster, H. F.; Russell, M. E.; Hughes, T. E. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2000**, *10*, 1555.
- [193] Holger Kuehne, Roche Basel, personal communication.
- [194] Yasuda, N.; Nagakura, T.; Yamazaki, K.; Yoshikawa, S.; Okada, T.; Ikuta, H.; Koyanagi, M. *Eur. Pat. Appl.* 1258480, **2002**.
- [195] Biftu, T.; Feng, D.; Qian, X.; Liang, G.-B.; Kieczkowski, G.; Eiermann, G.; He, H.; Leiting, B.; Lyons, K.; Petrov, A.; Sinha-Roy, R.; Zhang, B.; Scapin, G.; Patel, S.; Gao, Y.-D.; Singh, S.; Wu, J.; Zhang, X.; Thornberry, N. A.; Weber, A. E. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2007**, *17*, 49.

- [196] Deacon, C. F.; Johnsen, A. H.; Holst, J. J. *J Clin. Endocrinol. Metab.* **1995**, *80*, 952.
- [197] Nauck, M. A.; Wollschlager, D.; Werner, J.; Holst, J. J.; Orskov, C.; Creutzfeldt, W.; Willms, B.. *Diabetologia* **1996**, *39*, 1546.
- [198] Drucker, D. J. *Gastroenterology* **2002**, *122* (2), 531]
- [199] Juillerat-Jeanneret, L. *Curr. Chem. Biol.***2008**, *2*, 97
- [200] Lankas, G. R.; Barbara Leiting, B.; Roy, R. S.; Eiermann, G. J.; Maria, G.; Beconi, M. G.; Biftu, T.; Chan, C.- C.; Scott Edmondson, S.; Feeney, P.; He, H.; Ippolito, D. E.; Kim, D.; Lyons, K. A.; Ok, H. O.; Patel, R. A.; Petrov, A. N.; Pryor, K. A.; Qian, X.; Reigle, L.; Woods, A.; Wu, J. K.; Zaller, D.; Zhang, X.; Zhu, L.; Weber, A. E.; Thornberry, N. A. *Diabetes***2005**, *54*, 2988.
- [201] Burkey, B. F.; Hoffmann, P. K.; Hassiepen, U.; Trappe, J.; Juedes, M.; Foley, J. E. *Diabetes Obes. Metab.***2008**, *11*, 1057.
- [202] Larsen, J.; Hylleberg, B.; Ng, K.; Damsbo, P. *Diabetes Care***2001**, *24*, 1416.
- [203] Weber, A. E. *J. Med. Chem.* **2004**, *47*, 4135.
- [204] Havale, S. H.; Pal, M. *Bioorg. Med. Chem.***2009**, *17*, 1783.
- [205] Cahn, A.; Raz, I. *Expert Opin. Emerging Drugs***2013**, *18*, 245.
- [206] Juillerat-Jeanneret, L. *J Med Chem.***2014**, *57*, 2197.
- [207] Brigance, R. P.; Meng, W.; Fura, A.; Harrity, T.; Wang, A.; Zahler, R.; Kirby, M. S.; Hamann, L. G. *Bioorg. Med. Chem. Lett.***2010**, *20*, 4395.
- [208] Meng, W.; Brigance, R. P.; Chao, H. J.; Fura, A.; Harrity, T. et al. *J. Med. Chem.***2010**, *53*, 5620.
- [209] Cox, J. M.; Harper, B.; Mastracchio, A.; Leiting, B.; Sinha-Roy, R.; Patel, R. A.; Wu, J. K.; Lyons, K. A.; Huaibing He, Xu, S.; Zhu, B.; Thornberry, N. A.; Weber, A. E.; Edmondson, S. D. *Bioorg. Med. Chem. Lett.***2007**, *17*, 4579.
- [210] Edmondson, S. D.; Mastracchio, A.; Cox, J. M.; Eiermann, G. J.; He, H.; Lyons, K. A.; Patel, R. A.; Patel, S. B.; Petrov, A.; Scapin, G.; Wu, J. K.; Xu, S.; Zhu, B.; Thornberry, N. A.; Sinha-Roy, R.; Weber, A. E. *Bioorg. Med. Chem. Lett.***2009**, *19*, 4097.
- [211] Nordhoff, S.; Bulat, S.; Cerezo-Gálvez, S.; Hill, O.; Hoffmann-Enger, B.; López-Canet, M.; Rosenbaum, C.; Rummey, C.; Thiemann, M.; Matassa, V. G.; Edwards, P. J.; Feurer, A. *Bioorg. Med. Chem. Lett.***2009**, *19*, 6340.
- [212] Miyamoto, Y.; Banno, Y.; Yamashita, T.; Fujimoto, T. et al. *J Med Chem.***2011**, *54*, 831.
- [213] Hui Xie, H.; Zeng, L.; Zeng, S.; Lu, X.; Zhao, X.; Zhang, G.; Tu, Z.; Xu, H.; Yang, L.; Zhang, X.; Wang, S.; Hu, W. *Eur. J. Med. Chem.***2013**, *68*, 312.

- [214] Singh, S.; Sethi, S.; Khanna, V.; Benjamin, B.; Kant, R.; Sattigeri, J.; Bansal, V. S.; Bhatnagar, P. K.; Davis, J. A. *Eur. J. Pharmacol.* **2011**, *652*, 157.
- [215] Kato, N.; Oka, M.; Murase, T.; Yoshida, M.; Sakairi, M.; Yakufu, M.; Yamashita, S.; Yasuda, Y.; Yoshikawa, A.; Hayashi, Y.; Shirai, M.; Mizuno, Y.; Takeuchi, M.; Makino, M.; Takeda, M.; Kakigami, T. *Org. Med. Chem. Lett.* **2011**, *1*, 7.
- [216] Kim, H. J.; Kwak, W. Y.; Min, J. P.; Sung, S. Y.; Kim, H. D. et al. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2012**, *22*, 5545.
- [217] Nelson, N. R.; Nebert, D. W. "Cytochrome P450 (CYP) Gene Superfamily" 2011, DOI: 10.1002/9780470015902.a0005667.pub2
- [218] Guengerich, F. P.; Hosea, N. A.; Parikh, A.; Bell-Parikh, L. C.; Johnson, W. W.; Gillam, E.M.J.; Shimada, T. *Drug Metab Dispos.* **1998**, *26*, 1175.
- [219] Baldwin, S. J.; Clark, S. E.; Chenery, R. J. *Br J Clin Pharmacol.* **1999**, *55*, 53.
- [220] Niemi, M.; Backman, J. T.; Neuvonen, M.; Neuvonen, P. J. *Diabetologia*, **2003**, *46*, 347.
- [221] Tanaka, Y.; Niwa, S.; Nishioka, H.; Yamanaka, T.; Torizuka, M.; Yoshinaga, K.; Kobayashi, N.; Ikeda, Y.; Arai, H. *J. Med. Chem.* **1994**, *37*(13), 2071.
- [222] Li, J.; Wilk, E.; Wilk, S. *Arch. Biochem. Biophys.* **1995**, *323*(1), 148.
- [223] Ashworth, D. M.; Atrash, B.; Baker, G. R.; Baxter, A. J.; Jenkins, P. D. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **1996**, *6*, 1163.
- [224] Peters, J.-U. *Curr. Top. Med. Chem.*, **2007**, *7*, 579.
- [225] Parmee, E. R.; He, J.; Mastracchio, A.; Edmondson, S. D.; Colwell, L.; Eiermann, G.; Feeney, W. P.; Thornberry, N. A.; Weber, A. E. et al. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2004**, *14*, 43.
- [226] Sakashita, H.; Akahoshi, F.; Kitajima, H.; Tsutsumiuchi, R.; Hayashi, Y. *Bioorg. Med. Chem.* **2006**, *14*, 3662.
- [227] Fukushima, H.; Hiratate, A.; Takahashi, M.; Mikami, A.; Saito-Hori, M.; Munetomo, E.; Kitano, K.; Chonan, S.; Saito, H.; Suzuki, A.; Takaoka, Y.; Yamamoto, K. *Bioorg. Med. Chem.* **2008**, *16*, 4093.
- [228] Olson, G.L.; Bolin, D.R.; Bonner, M.P.; Bös, M. C.; Cook, M.; Fry, D.C.; Graves, B.J.; Hatada, M.; Hill, D. E.; Kahn, M.; Rusiecki, V.K.; Sarabu, R.; Sepinwall, J.; Vincent, G.P.; Voss, M.E. *J. Med. Chem.* **1993**, *36*, 3039.
- [229] Senten, K.; Van der Veken, P.; De Meester, I.; Lambeir, A. –M.; Scharpe´, S.; Haemers, A.; Augustyns, K. *J. Med. Chem.* **2003**, *46*, 5005.
- [230] Fukushima, H.; Hiratate, A.; Takahashi, M.; Mikami, A.; Saito-Hori, M.; Munetomo, E.; Kitano, K.; Saito, H.; Suzuki, A.; Takaoka, Y.; Yamamoto, K. *Bioorg. Med. Chem.* **2004**, *12*, 6053.

- [231] Nabeno, M.; Akahoshi, F.; Kishida, H.; Miyaguchi, I.; Tanaka, Y.; Ishii, S.; Kadowaki, T. *Biochem. Biophys. Res. Commun.* **2013**, *434*, 191.
- [232] Kang, N. S.; Ahn, J. H.; Kim, S. S.; Chae, C. H.; Yoo, S. E. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2007**, *17*, 3716.
- [233] Villhauer, E. B.; Brinkman, J. A.; Naderi, G. B.; Dunning, B. E.; Mangold, B. L.; Mone, M. D.; Russell, M. E.; Weldon, S. C.; Hughes, T. E. *J. Med. Chem.* **2002**, *45*, 2362.
- [234] Oefner, C.; D'Arcy, A.; Mac Sweeney, A.; Pierau, S.; Gardiner, R.; Dale, G. E. *Acta Crystallographica* **2003**, *D59*, 1206.
- [235] Halliday, R. C.; Jones, B. C.; Park, B. K.; Smith, D. A. *Eur. J. Drug Metab. Pharmacokin.* **1997**, *22*, 291.
- [236] Scapin, G.; Singh, S.; Feng, D.; Becker, J.; Doss, G.; Eiermann, G.; He, H.; Lyons, K.; Patel, S.; Petrov, A.; Sinha Roy, R.; Wu, J.; Zhang, X.; Thornberry, N. A.; Weber, A. E.; Biftu, T. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2007**, *17*, 3384.
- [237] Sheppard, R. C.; Atherton, E. *Solid Phase Peptide Synthesis- a practical approach*, I.R.L. Press publication, Oxford University Press.
- [238] Taber, D. F.; Berry, J. F.; Martin, T. J. *J. Org. Chem.*, **2008**, *73*, 9334.
- [239] Gawande, M, B.; Branco, P. S. *Green Chem.*, **2011**, *13*, 3355.
- [240] Carpino, L. A.; Han, G. Y. *J. Am. Chem. Soc.* **1970**, *92*, 5748.
- [241] Dener, J. M.; Fantauzzi, P. P.; Kshirsagar, T. A.; Kelly, D. E.; Wolfe, A. B. *OPRD* **2001**, *5*, 445.
- [242] Blackmon, D. L.; Watson, A. J.; Montrose, M. H. *Anal. Biochem.*, **1992**, *200*, 352.
- [243] Chen, D.; Wang, M. *Diabetes Obes. Metab.* **2005**, *7(4)*, 307.
- [244] Kim, J. G.; Baggio, L. L.; Bridon, D. P.; Castaigne, J. P.; Robitaille, M. F.; Jette, L.; Benquet, C.; Drucker, D. J. *Diabetes* **2003**, *52*, 751.
- [245] Friesner, R. A.; Murphy, R. B.; Repasky, M. P.; Frye, L. L.; Greenwood, J. R.; Halgren, T. A.; Sanschagrín, P. C.; Mainz, D. T. *J. Med. Chem.* **2006**, *49*, 6177.
- [246] *Schrodinger Suite 2010, Glide version 5.6, Prime version 2.2*; Schrodinger, LLC: New York, 2010.
- [247] Demange, L.; Menez, A.; Dugave, C. *Tetrahedron Lett.* **1998**, *39*, 1169.
- [248] Chorghade, M. S.; Mohapatra, D. K.; Sahoo, G.; Gurjar, M. K.; Mandlecha, M. V.; Bhoite, N.; Moghe, S.; Raines, R. T. *J. Fluorine Chem.* **2008**, *129*, 781.
- [249] Zhuang, W.; Zhao, X.; Zhao, G.; Guo, L.; Lian, Y.; Zhou, J.; Fang, D. *Bioorg. Med. Chem.* **2009**, *17*, 6540.

- [250] Carlos Cativiela, C.; Díaz-de-Villegas, M. D. *Tetrahedron Asymm.* **1998**, *9*, 3517.
- [251] Storcken, R. P. M.; Panella, L.; van Delft, F. L.; Kaptein, B.; Broxterman, Q. B.; Schoemaker, H. E.; Rutjes, F. P. J. T. *Advanced Synthesis & Catalysis* **2007**, *349*, 161.
- [252] Lu, T.; Lin, C. *J. Org. Chem.*, **2011**, *76* (6), 1621.
- [253] O'Donnell, M. J.; Wu, S. *Tetrahedron Asymm.* **1992**, *3*, 591.
- [254] Davis, F. A.; Lee, S.; Zhang, H.; Fanelli, D. L. *J. Org. Chem.* **2000**, *65*, 8704.
- [255] Xu, P.; Li, S.; Lu, T.; Wu, C.; Botao Fan, B.; Golfis, G. *J. Org. Chem.* **2006**, *71*, 4364.
- [256] Kapadia, S. R.; Spero, D. M.; Eriksson, M. *J. Org. Chem.* **2001**, *66*, 1903.
- [257] Royo, S.; Jimenez, A. I.; Cativiela, C. *Tetrahedron: Asymm.*, **2006**, *17*, 2393.
- [258] Sibi, M. P.; Deshpande, P. K.; La Loggia, A. J.; Christen, J. W. *Tetrahedron Lett.* **1995**, *36*, 8965.
- [259] Koskinen, A. M. P.; Hassila, H.; Myllymaki, V. T.; Rissanen, K. *Tetrahedron Lett.* **1995**, *36*(31), 5619.
- [260] Campbell, A. D.; Raynham, T. M.; Taylor, R. J. K. *Synthesis*, **1998**, 1707.
- [261] Haffner, C. D.; McDougald, D. L.; Randhawa, A. S.; Reister, S. M.; Lenhard, J. M. *PCT Int. Appl.* **WO2003/002531**, January 9, 2003.
- [262] Dierks, E. A.; Stams, K. R.; Lim, H. K.; Cornelius, G.; Zhang, H.; Ball, S. E. *Drug Metab. Dispos.* **2001**, *29*, 23.
- [263] Moos, W. H.; Gless, R. D.; Rapoport, H. *J. Org. Chem.* **1981**, *46*, 5064.
- [264] Klapars, A.; Xiaohua Huang, X.; Stephen L. Buchwald, S. L. *J. Am. Chem. Soc.* **2002**, *124*, 7421.
- [265] Cox, J. M.; Edmondson, S. D.; Harper, B.; Weber, A. E. *PCT Int. Appl.* **WO 039325**, 2006.
- [266] Biftu, T.; Chen, P.; Cox, J. M.; Weber, A. E. *PCT Int. Appl.* **WO 056708**, 2010.
- [267] Baxter, A. D.; Boyd, E. A.; Frank-Kamenetsky, M.; Jeffery, P.; Stephen, P.; Stibbard, J. H. A. **US 2005/0070578 A1**.
- [268] Shawali, A. S. *ARKIVOC*, **2010**, i, 33.
- [269] Guan, L. P.; Zhang, R. P.; Chang, Y.; Gan, X. X. *Asian J. Chem.*, **2013**, *25*(7), 3660.
- [270] Graceffa, R.; Kaller, M.; La, D.; Lopez, P.; Patel, V. F.; Zhong, W. *PCT Int. Appl.* **WO 2009064418 A1**, May 22, 2009.
- [271] Calderwood, D. J.; Bonafoux, D. F.; Burchat, A.; Ding, P.; Frank, K. E.; Hoemann, M. Z.; Mullen, K. D.; Davis, H. M. *PCT Int. Appl.* **WO 2009005675 A1**, Jan. 8, 2009.

- [272] C. Avellana, C.; Gomez-Parra, V.; Madronero, R. *J. Heterocyc. Chem.*, **1977**, 14(2), 325.
- [273] Suzuki, K.; Ohkuma, T.; Tsuchihashi, G. *J. Org. Chem.* **1987**, 52(13), 2929.
- [274] Shipps, G. W. Jr.; Rosner, K. E.; Popovici-Muller, J.; Deng, Y.; Wang, T.; Curran, P. J. *PCT Int. Appl.* **WO 2003101993 A1**, Dec 11, 2003.
- [275] Nam, N. L.; Grandberg, I. I.; Sorokin, V. I. *Chem. Heterocycl. Compd.* **2002**, 38, 1371.
- [276] Yin, G.; Gao, M.; She, N.; Hu, S.; Wu, A.; Pan, Y. *Synthesis* **2007**, 20, 3113.
- [277] Bailey, Patrick D.; Morgan, Keith M.; Smith, David I.; Vernon, John M. *Tetrahedron* **2003**, 59(18), 3369.
- [278] Shahane, S.; Louafi, F.; Moreau, J.; Hurvois, J. P.; Renaud, J. L.; van de Weghe, P.; Roisnel, T. *Eur. J. Org. Chem.*, **2008**, 27, 4622.
- [279] Baetta, R.; Corsini, A. *Drugs* **2011**, 71, 1441.
- [280] Scheen, A. J. *Expert Opin Pharmacother.* **2012**, 13, 81.
- [281] Inzucchi, S. E.; Bergenstal, R. M.; Buse, J. B. *Diabetes Care* **2012**, 35, 1364.
- [282] Villieras, J.; Rambaud, M.; Graff, M. *Tetrahedron Lett.*, **1985**, 26(1), 53.
- [283] Kuhnel, E.; Laffan, D. D. P.; Lloyd-Jones, G. C.; Martinez del Compo, T.; Shepperson, I. R.; Slaughter, J. L. *Angewt. Chem. Int. Ed.* **2007**, 46(37), 7075.
- [284] Gabriel, S. *Ber. Dtsch. Chem. Ges.* **1887**, 20, 2224.
- [285] Khan, M. N. *J. Org. Chem.* **1995**, 60, 4536.
- [286] Osby, J. O.; Martin, M. G.; Ganem, B. *Tetrahedron Lett.* **1984**, 25(20), 2093.
- [287] Yamaura, M.; Suzuki, T.; Hashimoto, H.; Yoshimura, J.; Okamoto, T.; Shin, C. *Bull. Chem. Soc. Jpn.*, **1985**, 58, 1413.
- [288] Jorgensen, W. L.; Maxwell, D. S.; Tirado-Rives, J. *J. Am. Chem. Soc.* **1996**, 118, 11225.
- [289] Friesner, R. A.; Banks, J. L.; Murphy, R. B.; Halgren, T. A.; Klicic, J. J.; Mainz, D. T.; Repasky, M. P.; Knoll, E. H.; Shelley, M.; Perry, J. K.; Shaw, D. E.; Francis, P.; Shenkin, P. S. *J. Med. Chem.* **2004**, 47, 1739.