

Supporting information

Table 2. Dose-Response HIV Integrase Inhibition Data for 75 Analogs of **2**

Entry	R ₁	R ₂	R ₃	IC ₅₀ (μ M)
1	1	1	1	0.05
2	1	1	2	0.07
3	1	1	3	0.74
4	1	1	4	0.10
5	1	1	5	0.19
6	1	2	2	0.06
7	1	2	3	0.16
8	1	2	5	0.22
9	1	3	1	0.05
10	1	3	3	0.04
11	1	3	4	0.07
12	1	3	5	> 10
13	1	4	1	0.08
14	1	4	2	0.06
15	1	4	3	0.09
16	1	4	4	0.09
17	1	4	5	> 10
18	1	5	3	1.99
19	1	5	4	1.55
20	1	5	5	1.26

Entry	R ₁	R ₂	R ₃	IC ₅₀ (μ M)
21	2	1	1	> 10
22	2	1	2	1.00
23	2	1	3	> 10
24	2	1	4	> 10
25	2	1	5	3.16
26	2	2	1	0.42
27	2	2	2	1.00
28	2	2	3	1.57
29	2	2	4	2.46
30	2	2	5	1.84
31	2	3	1	0.40
32	2	3	2	0.67
33	2	3	3	0.62
34	2	3	5	0.42
35	2	4	2	0.33
36	2	4	3	1.38
37	2	4	4	2.51
38	2	4	5	1.09
39	2	5	1	> 10
40	2	5	2	> 10
41	2	5	5	16.19
42	3	1	1	2.03
43	3	1	3	> 10
44	3	1	4	2.05

Entry	R ₁	R ₂	R ₃	IC ₅₀ (μ M)
45	3	1	5	2.30
46	3	2	2	0.71
47	3	2	3	1.54
48	3	2	4	2.05
49	3	2	5	1.66
50	3	3	1	> 10
51	3	3	2	0.76
52	3	4	1	0.39
53	3	4	3	1.28
54	3	4	4	0.92
55	3	4	5	0.94
56	3	5	1	> 10
57	3	5	3	> 10
58	3	5	5	> 10
59	4	1	1	0.93
60	4	1	2	0.45
61	4	1	3	0.93
62	4	1	4	0.90
63	4	2	2	0.25
64	4	2	4	0.74
65	4	2	5	0.66
66	4	3	1	0.17
67	4	3	2	0.35
68	4	3	4	2.79

Entry	R ₁	R ₂	R ₃	IC ₅₀ (μ M)
69	4	4	1	0.13
70	4	4	2	> 10
71	4	4	3	0.21
72	4	4	5	0.22
73	4	5	1	> 10
74	4	5	4	3.32
75	4	5	5	> 10