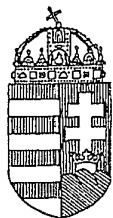


(19) Országkód:

HU



MAGYAR  
KÖZTÁRSASÁG

ORSZÁGOS  
TALÁLMÁNYI  
HIVATAL

# SZABADALMI LEÍRÁS

(11) Lajstromszám:

204 513 B

(21) A bejelentés száma: 1213/88  
(22) A bejelentés napja: 1988. 03. 15.  
(30) Elsőbbségi adatok:  
061 937/871987. 03. 17. JP  
179 797/871987. 07. 17. JP  
247 601/871987. 09. 30. JP  
005 449/881988. 01. 13. JP

(51) Int. Cl.<sup>5</sup>

C 07 D 231/20

C 07 D 401/10

C 07 D 403/10

A 01 N 43/56

A 01 N 43/34

(40) A közzététel napja: 1988. 09. 28.

(45) A megadás meghirdetésének dátuma a Szabadalmi  
Közlönyben: 1992. 01. 28. SZKV 92/01

(72) Feltalálók:

Baba, Masatoshi, Wako-shi, Saitama-ken (JP)  
Kakuta, Takuya, Funabashi-shi, Chiba-ken (JP)  
Tanaka, Norio, Funabashi-shi, Chiba-ken (JP)  
Oya, Eiichi, Narashino-shi, Chiba-ken (JP)  
Ikai, Takashi, Tokió (JP)  
Nawamaki, Tsutomu, Yono-shi, Saitama-ken (JP)  
Watanabe, Shigeomi, Omiya-shi, Saitama-ken (JP)

(73) Szabadalmaz:

Nissan Chemical Industries Ltd., Tokió (JP)

(54) Eljárás pirazolszármazékok előállítására és ezeket a vegyületeket  
tartalmazó herbicid készítmények

(57) KIVONAT

A találmány tárgya eljárás új (I) általános képletű  
pirazolszármazékok előállítására és e vegyületeket tar-  
talmazó herbicid készítmények. Az (I) általános kép-  
letben

A jelentése 1–3 szénatomos alkilcsoport;

B jelentése hidrogén, 1–3 szénatomos alkil- vagy  
2–4 szénatomos alkoxi-alkil-csoport;

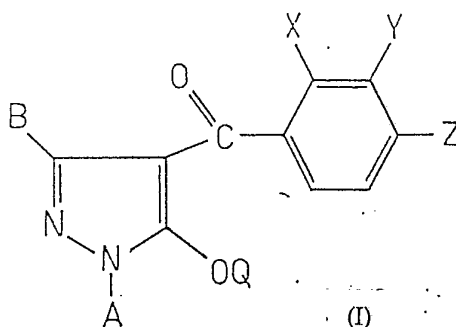
X jelentése halogénatom, 1–4 szénatomos alkil-  
vagy 1–4 szénatomos alkoxycsoport;

Y jelentése karboxil-, (1–6 szénatomos alkoxi)-kar-  
bonil-, (1–4 szénatomos halogén-alkoxi)-karbonil-,  
(2–6 szénatomos alkoxi-alkoxi)-karbonil-, (3–6  
szénatomos cikloalkil)-oxi-karbonil-, di(1–4 szén-  
atomos alkil)-amino-karbonil-, ciano-(1–4 szén-  
atomos alkil)-, hidroxi-(1–4 szénatomos alkil)-,  
(1–6 szénatomos alkoxi)-(1–4 szénatomos alkil)-,  
(1–6 szénatomos halogén-alkoxi)-(1–4 szénato-  
mos alkil)-, 3–8 szénatomos (alkoxi-alkoxi-alkil),  
(3–6 szénatomos alkinil)-oxi-(1–4 szénatomos al-  
kil)-, (1–4 szénatomos alkil)-tio-(1–4 szénatomos  
alkil)-, (1–4 szénatomos alkil)-szulfinil-(1–4 szén-  
atomos alkil), (1–4 szénatomos alkil)-szulfonil-

(1–4 szénatomos alkil), (1–4 szénatomos alkoxi)-  
vinil-csoport, (2–4 szénatomos alkanoil-oxi-(1–4  
szénatomos alkil)- vagy  $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{CH}_2)_{n'}$  csoport,  
és ez utóbbiban  $n' = 4, 5$  vagy  $6$ );

Z jelentése halogénatom, 1–3 szénatomos alkil-tio-  
vagy 1–3 szénatomos alkil-szulfonil-csoport;

Q jelentése hidrogénatom, fenil-(1–4 szénatomos al-  
kil)- vagy tozilcsoport.



HU 204 513 B

A találmány tárgya eljárás új 4-benzol-pirazolszármazékok előállítására, továbbá a találmány tárgya e vegyületek legalább egyikét hatóanyagként tartalmazó, szelektív herbicid hatást kifejtő új készítmény, amely különösen felszíni alkalmazásban hatékony herbicid.

Hosszú évek óta folyó kiterjedt kutatási és fejlesztési tevékenység eredményeként már különböző herbicid hatóanyagokat fejlesztettek ki, s ezek hozzájárultak ahhoz, hogy csökkentsék a munkaráfordítást a gyomnövények elnyomásában, illetve javítsák a mezőgazdasági és kertészeti növénytermesztés termelékenységét.

Ám még mindig szükség van a technika állásához képest jobb herbicid tulajdonságokat mutató, újabb herbicid hatóanyagok kifejlesztésére. Különösen kívánatos egy olyan újabb mezőgazdasági és kertészeti herbicid szer kifejlesztése, amely kis adagok alkalmazásával szelektív módon nyomja el a gyomnövényeket úgy, hogy a haszonnövényt nem károsítja. Ezt az összetett követelményt ugyanis a hagyományos herbicidek még nem elégítik ki maradéktalanul.

Az eddigi irodalomban már leírtak bizonyos herbicid hatású 4-benzoil-pirazol-származékokat; ilyen típusú vegyületeket ismertetnek például az 59-181 259, 60-41 667 és 62-53 970 számú közzétett japán szabadalmi leírások, és már gyakorlati alkalmazásra kerültek rizsföldeken a hasonló típusú 5-(benzil-oxi)-4-(2,4-diklór-benzoil)-1,3-dimetil-pirazol (nemzetközi szabad elnevezése pirazolát; 50-126 830 számú közzétett japán szabadalmi leírás), valamint a 4-(2,4-diklór-benzoil)-1,3-dimetil-5-(fenacil-oxi)-pirazol (szabad elnevezése pirazoxifen; 54-41 872 számú közzétett japán szabadalmi leírás). Ez utóbbiak rizsföldi herbicideként jó hatásúak, felszíni herbicidekként azonban nem váltak be, mert a felszíni gyomokkal szemben gyenge hatásúnak bizonyultak. Hasonlóképpen nem bizonyultak kielégítő hatásúaknak a másik három idézett korábbi japán szabadalmi leírásban leírt ilyen típusú vegyületek sem. Így továbbra is fennállt olyan új 4-benzoil-pirazol-származékok kifejlesztésének szükségessége, amelyek nemcsak a rizsföldi alkalmazásban hatásosak, hanem jó hatással alkalmazhatók felszíni herbicidekként is.

A találmány tehát a fenti követelményeket kielégítő új (I) általános képletű pirazolszármazékok előállítására, és az e vegyületeket hatóanyagként tartalmazó herbicid készítményekre irányul; az (I) általános képletben

A jelentése 1-3 szénatomos alkilcsoport;

B jelentése hidrogénatom, 1-3 szénatomos alkil-vagy 2-4 szénatomos alkoxi-alkil-csoport;

X jelentése halogénatom, 1-4 szénatomos alkil-vagy 1-4 szénatomos alkoxics csoport,

Y jelentése karboxilcsoport,

(1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport,

(1-4 szénatomos halogén-alkoxi)-karbonil-csoport,

(2-6 szénatomos alkoxi-alkoxi)-karbonil-csoport,

(3-6 szénatomos cikloalkil)-oxi-karbonil-csoport,

di (1-4 szénatomos alkil)-amino-karbonil-csoport,

ciano-(1-4 szénatomos alkil)-csoport,

hidroxil-(1-4 szénatomos alkil)-csoport,

(1-6 szénatomos alkoxi)-(1-4 szénatomos alkil)-csoport,

(1-6 szénatomos halogén-alkoxi)-(1-4 szénatomos)-alkil-csoport, 3-8 szénatomos (alkoxi-alkoxi-alkil)-csoport,

(3-6 szénatomos alkinil)-oxi-(1-4 szénatomos alkil)-csoport,

(1-4 szénatomos alkil)-tio-(1-4 szénatomos alkil)-csoport,

10 (1-4 szénatomos alkil)-szulfonil-(1-4 szénatomos alkil)-csoport,

(1-4 szénatomos alkil)-szulfonil-(1-4 szénatomos alkil)-csoport,

(1-4 szénatomos alkoxi)-vinil-csoport,

15 (2-4 szénatomos alkanoil)-oxi-(1-4 szénatomos alkil)-csoport vagy  $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{CH}_2)_n$  képletű csoport, amelyben  $n$  értéke 4, 5 vagy 6;

Z jelentése halogénatom, 1-3 szénatomos alkil-tio-vagy 1-3 szénatomos alkil-szulfonil-csoport;

20 Q jelentése hidrogénatom, fenil-(1-4 szénatomos alkil)- vagy tozilcsoport.

Az (I) általános képletű vegyületeket a találmány értelmében oly módon állítjuk elő, hogy

25 a) Q helyén hidrogénatomot tartalmazó (I) általános képletű, vagyis a szűkebb körű (I') általános képletnek megfelelő vegyületek – ahol A, B, X, Y, és Z jelentése egyezik a tárgyi körben megadottal – előállítására valamely (II) általános képletű vegyületet – ahol X, Y és Z jelentése egyezik a fent megadottal – egy (III) általános képletű 5-hidroxi-pirazol-származékkal vagy (III') általános képletű 4,5-dihidro-5-pirazolon-származékkal – ahol A és B jelentése egyezik a tárgyi körben megadottal – reagáltatunk; vagy

35 b) Q helyén hidrogénatomot tartalmazó (I) általános képletű, vagyis a szűkebb körű (I') általános képletnek megfelelő vegyületek – ahol A, B, X, Y és Z jelentése egyezik a tárgyi körben megadottal – előállítására valamely (II') általános képletű benzoil-klorid-származékokat – ahol X, Y és Z jelentése egyezik a fent megadottal – egy (III) általános képletű 5-hidroxi-pirazol-származékkal – ahol A és B jelentése egyezik a tárgyi körben megadottal – reagáltatunk és a keletkezett (IV) általános képletű 5-(benzoi-oxi)-pirazol-származékokat – ahol A, B, X, Y és Z jelentése egyezik a fent megadottal – átrendezési reakciónak vetjük alá; vagy

40 c) Q helyén hidrogénatomot és Y helyén  $\text{L}-\text{S}(\text{O})_n-\text{R}$  általános képletű csoportot – ahol L jelentése 1-4 szénatomos egyenes vagy elágazó szénláncú alkilcsoport, R jelentése 1-4 szénatomos alkilcsoport,  $n = 1$  vagy 2 – tartalmazó (I) általános képletű vagyis a szűkebb körű (Ib') általános képletnek megfelelő vegyületek – ahol A, B, X és Z jelentése egyezik a tárgyi körben megadottal, L, R és  $n$  jelentése pedig egyező a fent megadottal – előállítására valamely (Ia') általános képletű vegyületet – ahol A, B, L, R, X, és Z a fenti jelentésűek – oxidálunk; vagy

50 d) Q helyén hidrogénatomot és Y helyén  $-\text{L}'-\text{OH}$  általános képletű vegyületet – ahol L' jelentése 1-4 szénatomos alkilcsoport,  $n = 1$  vagy 2 – tartalmazó (I) általános képletű vagyis a szűkebb körű (Ib') általános képletnek megfelelő vegyületek – ahol A, B, X és Z jelentése egyezik a tárgyi körben megadottal, L, R és  $n$  jelentése pedig egyező a fent megadottal – előállítására valamely (Ia') általános képletű vegyületet – ahol A, B, L, R, X, és Z a fenti jelentésűek – oxidálunk; vagy

60 d) Q helyén hidrogénatomot és Y helyén  $-\text{L}'-\text{OH}$  általános képletű vegyületet – ahol L' jelentése 1-4 szénatomos alkilcsoport,  $n = 1$  vagy 2 – tartalmazó (I) általános képletű vagyis a szűkebb körű (Ib') általános képletnek megfelelő vegyületek – ahol A, B, X és Z jelentése egyezik a tárgyi körben megadottal, L, R és  $n$  jelentése pedig egyező a fent megadottal – előállítására valamely (Ia') általános képletű vegyületet – ahol A, B, L, R, X, és Z a fenti jelentésűek – oxidálunk; vagy

lános képletű csoportot – ahol L' jelentése egyezik L fent megadott jelentésével – tartalmazó (I) általános képletű, vagyis a szűkebb körű (Id') általános képletnek megfelelő vegyületek – ahol A, B, X, Z és L' jelentése egyezik a fent megadottal – előállítási 5 sára valamely (Ic') általános képletű 5-hidroxi-4-{3-[ω-(alkil-karbonil-oxi)-alkil]-benzoi}-pirazol-származékot – ahol A, B, X, Z és L' jelentése egyezik a fent megadottal, R<sup>1</sup> jelentése egyezik R fent megadott jelentésével – dezacilezünk; vagy 10

e) Q helyén egy Q' szubsztituens és Y helyén egy Y' szubsztituens – ahol Q' jelentése hidrogénatom kivételével egyezik Q tárgyi körben megadott jelentésével és Y' jelentése karboxilcsoport és hidrox- 15 oxi-(1–4 szénatomos alkil)-csoport kivételével egyezik Y tárgyi körben megadott jelentésével – tartalmazó (I) általános képletű, vagyis a szűkebb körű (I'') általános képletnek megfelelő vegyületek – ahol A, B, X és Z jelentése egyezik a tárgyi 20 körben megadottal – előállítására valamely (Ie') általános képletű 5-hidroxi-4-benzoi-pirazolszármazékot – ahol A, B, X, Q, Y' és Z jelentése egyezik a fent megadottal – egy (V) általános képletű vegyülettel – ahol E jelentése halogénatom, Q' jelentése egyezik a fent megadottal – reagáltatunk; 25 és kívánt esetben egy kapott (I) általános képletű vegyületet annak valamely sójává alakítunk át.

A találmány tárgya továbbá egy vagy több (I) általános képletű pirazolszármazékot vagy sóját hatóanyagként, továbbá mezőgazdasági szerben szokásosan alkalmazott hordozót vagy hígítót tartalmazó, szelektív herbicid hatást kifejező új készítmény.

A találmány szerinti herbicid készítmények hatóanyagként 0,01–95 tömeg% mennyiségben tartalmaznak valamely (I) általános képletű pirazolszármazékot – ahol A, B, X, Y, Z és Q jelentése egyezik a fent megadottal – szilárd vagy folyékony hordozó, előnyösen kaolin, illetőleg valamely aromás szénhidrogén, továbbá adott esetben felületaktív anyag és/vagy egyéb szokásos adalék mellett.

A találmány szerinti új herbicid készítmény igen

előnyösen alkalmazható gyomnövények elleni szelektív védelemre oly módon, hogy a védendő kultúrnövény-ültetvényeket közvetlenül vagy közvetve – tehát talajkezelés, talajba ágyazás vagy levélkezelés útján – a találmány szerinti, hatóanyagként a fenti meghatározásnak megfelelő (IV) általános képletű 4-benzoi-pirazol-származékot a megfelelő adalékanyagok kíséretében tartalmazó herbicid készítménnyel kezeljük. Erre a kezelésre – a kezelendő terület nagyságára számítva – hektáronként 0,01–10 kg mennyiségű hatóanyagot tartalmazó készítményt alkalmazunk.

Az (I) általános képletű vegyületek szerkezeti felépítéséhez hasonló herbicid hatású benzoi-pirazol-származékokat ismertettek már az 59–181 259, 60–41 667 és 62–53 970 számú közzétett japán szabadalmi leírások is, az ott leírt vegyületekben azonban a benzoi-csoport szubsztituensei egészen más kombinációkban fordulnak elő, mint a mi találmányunk szerinti új vegyületekben, sőt a 62–53 970 sz. japán szabadalmi leírásban leírt vegyületekben a benzoi-csoport gyűrűje egyáltalán nem hordoz szubsztituenseket. Különösen a találmány szerinti új vegyületek lehetséges Y szubsztituensei különböznek teljesen az idézett leírásokban szereplő vegyületek megfelelő szubsztituenseitől. Emellett a találmány szerinti (I) általános képletű vegyületek herbicid hatásossága is többszörösen felülmúlja az idézett japán szabadalmi leírásban ismertett vegyületekét. Ennek szemléltetésére összehasonlító kísérleteket végeztünk a jelen találmány szerinti 35. és 52. számú vegyület (3. táblázat) és az 59–181 259 számú japán szabadalmi leírásban jó hatásúnak mondott néhány vegyület között. Az eredményeket az alábbi A) táblázatban foglaltuk össze, ahol az egyes alkalmazott vegyületeknek a megadott koncentrációban mutatott hatását 5-től 1-ig terjedő skálával jelöltük, ahol 5 a táblázat 35 fejrésében említett gyomnövény teljes elhalását, 1 a már észrevehető károsító hatást, a közbülső számok az arányosan növekvő hatékonyságot jelzik; ezekből kitűnik, hogy a találmány szerinti vegyületek azonos körülmények között körülbelül tízszer kisebb adagban fejtenek ki ugyanolyan hatást, mint az ismert vegyületek. 40

A). táblázat

| Vegyület sz.                                                 | Echinochl<br>150g/ha | crus galli<br>75g/ha | Scirpus<br>150g/ha | juncoides<br>75g/ha | Sagittaria<br>150g/ha | pygmaeag/ha<br>75 g/ha |
|--------------------------------------------------------------|----------------------|----------------------|--------------------|---------------------|-----------------------|------------------------|
| A jelen találmány szerinti vegyületek                        |                      |                      |                    |                     |                       |                        |
| 35                                                           | 5                    | 5                    | 5                  | 5                   | 5                     | 5                      |
| 52                                                           | 5                    | 5                    | 5                  | 5                   | 5                     | 5                      |
| Az 59–181259 sz. japán szabadalmi leírás szerinti vegyületek |                      |                      |                    |                     |                       |                        |
| 20                                                           | 5                    | 4                    | 4                  | 3                   | 4                     | 3                      |
| 46                                                           | 5                    | 4                    | 4                  | 4                   | 4                     | 4                      |
| 50                                                           | 5                    | 5                    | 5                  | 4                   | 5                     | 4                      |
| 63                                                           | 5                    | 4                    | 5                  | 4                   | 5                     | 4                      |
| 66                                                           | 5                    | 5                    | 5                  | 5                   | 5                     | 5                      |
| 68                                                           | 5                    | 5                    | 5                  | 4                   | 5                     | 4                      |
| 73                                                           | 5                    | 4                    | 5                  | 4                   | 4                     | 4                      |

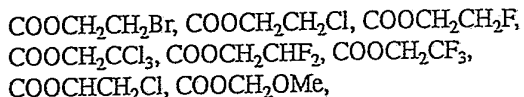
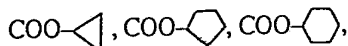
A találmányt a továbbiakban az előnyös kiviteli alakok leírásával ismertetjük részletesebben. A találmány szerint előállítható előnyös vegyületeknél az (I) általános képletben a vegyületek szubsztituenseit reprezentáló A, B, X, Y, Z és Q szimbólumok jelentése (rövidítések: Me – metil, Et – etil, Pr – propil, Bu – butil, Am – pentil, Ac – acetyl, n – normál, i – izo, s – szek, t – terc):

A: Me, Et, n-Pr, i-Pr

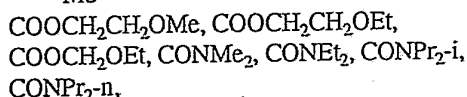
B: H, Me, Et, n-Pr, i-Pr, CH<sub>2</sub>OMe

X: Me, Et, n-Pr, i-Pr, n-Bu, i-Bu, s-Bu, t-Bu, OMe, OEt, OPr-n, OPr-i, OBU-n, OBU-i, OBU-s, OBU-t, F, Cl, Br, I

Y: CH<sub>2</sub>OH, CH<sub>2</sub>OMe, CH<sub>2</sub>OEt, CH<sub>2</sub>OPr-n, CH<sub>2</sub>OPr-i, CH<sub>2</sub>OBu-n, CH<sub>2</sub>OBu-i, CH<sub>2</sub>OBu-s, CH<sub>2</sub>OBu-t, CH<sub>2</sub>OAm-n, CH<sub>2</sub>OAm-i, CH<sub>2</sub>OAm-t, CH<sub>2</sub>OC<sub>6</sub>H<sub>13</sub>-n, CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>C≡CH, CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>MeC≡CH, CH<sub>2</sub>OCMe<sub>2</sub>C≡CH, CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F, CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl, CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>Cl<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Br, CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OMe, CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OEt, CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OPr-i, CH<sub>2</sub>CN, CH<sub>2</sub>SMe, CH<sub>2</sub>SEt, CH<sub>2</sub>SPr-n, CH<sub>2</sub>SPr-i, CH<sub>2</sub>SBu-t, CH<sub>2</sub>SOMe, CH<sub>2</sub>SOEt, CH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>Me, CH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>Et, CH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>Pr-n, CH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>Pr-i, CH<sub>2</sub>OAc, CH<sub>2</sub>OCOEt, CH<sub>2</sub>OCOPr-i, CHMeOH, CHMeOMe, CHMeOEt, CHMeOPr-n, CHMeOPr-i, CHMeOBu-n, CHMeOBu-i, CHMeOBu-s, CHMeOBu-t, CHMeOCH<sub>2</sub>C≡CH, CHMeOCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, CHMeOCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl, CHMeOCH<sub>2</sub>Cl<sub>3</sub>, CHMeOCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Br, CHMeOCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OMe, CHMeOCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Et, CHMeCN, CHMeSMe, CHMeSEt, CHMeSPr-n, CHMeSPr-i, CHMeSOMe, CHMeSOEt, CHMeSO<sub>2</sub>Me, CHMeSO<sub>2</sub>Et, CHMeSO<sub>2</sub>Pr-i, CHMeOAc, CHMeOCOEt, CMe<sub>2</sub>OH, CMe<sub>2</sub>OMe, CMe<sub>2</sub>OEt, CMeOPr-n, CMeOPr-i, CMe<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>C≡CH, CMe<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl, CMe<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OMe, CMe<sub>2</sub>CN, CMe<sub>2</sub>SMe, CMe<sub>2</sub>SEt, CMe<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>Me, CMe<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>Et, CMe<sub>2</sub>OAc, CH=CHOMe, CH=CHOEt, CH=CHOPr-i, COOH, COOMe, COOEt, COOPr-n, COOPr-i, COOBu-n, COOBu-s, COOBu-i, COOBu-t, COOAm-i,



Me



Z F, Cl, Br, I, SMe, SO<sub>2</sub>Me

Q: H, CH<sub>2</sub>Ph, CHMePh, CHEtPh, SO<sub>2</sub>Ph-Me-4

Ha Q jelentése hidrogénatom, akkor a célvegyület könnyen képezhet sót fémmel vagy szerves bázissal.

Ilyen fém lehet pl. nátrium, kálium, kalcium, lítium, bárium, magnézium, vas, réz, nikkel vagy mangán.

A szerves bázis pedig lehet pl. metil-amin, dimetil-amin, trimetil-amin, etil-amin, dietil-amin, trietil-amin,

n-propil-amin, di(n-propil)-amin, i-propil-amin, di(i-propil)-amin, n-butil-amin, i-butil-amin, szek-butil-amin, terc-butil-amin, piperidin, pirrolidin, morfolin, piridin, N,N-dimetil-anilin vagy kolin.

5 Hatékonyabb szerek kifejlesztése céljából vizsgálva különféle szerves vegyületeket, azt találtuk, hogy a találmány szerint előállítható új (I) általános képletű pirazolszármazékok kiemelkedő herbicid hatást fejtenek ki keskenylevelű gyomnövényekkel (pl. pázsítfű, illetve sásfélékkel) és széleslevelű gyomnövényekkel szemben és nincs számottevő fitotoxikus hatásuk a vizsgált haszonnövények ellen, amilyen a tengeri (Zea mays), cirok (Sorghum bicolor), búza (Triticum spp.) és árpa (Hordeum vulgare). Ez a felismerés képezi a jelen találmány alapját.

15 A jelen találmány szerint előállítható új vegyületek erős herbicid hatásukat egyaránt kifejtik talajkezelés, talajba való beágyazás és levélkezelés esetében. Ugyanakkor ezen kezelési módok bármelyikének gyakorlati alkalmazásakor sem lép fel fitotoxikus hatás az előbb felsorolt haszonnövények ellen. A jelen találmány szerint előállítható új vegyületek tehát kiemelkedően szelektív hatásúak és a fent említett haszonnövények termesztésekor kiemelkedően hatékony szereként használhatók.

30 A találmány szerint előállítható új vegyületek herbicid hatása erős az olyan gyomnövényekkel szemben, amilyen a Setaria viridis (zöld muharfélé), Echinochloa crus-galli (kakaslábűfélé), Amaranthus lividus (disznóparéjfélé), Polygonum longisetum (keserűűfélé), Xanthium strumarium (szerbtövisfélé), Abutilon theophrasti (selyemmályvafélé) és Cyperus esculentus (kákafele), amelyek a tengeri, illetve a cirok termesztésekor fejlődnek. A pázsítfűfélékkel és a Cyperus esculentussal szemben különösen erős és szinte egyedülálló a herbicid hatásuk. A technika állása szerint a tengeri és a cirok termesztésekor triazin típusú herbicidként az ún. atrazint, illetve cianazint, sav-anilid típusú herbicidként az ún. alaklort, illetve metolaklort alkalmazták. A pázsítfűfélékkel szemben azonban igen gyenge az atrazin és a cianazin hatása, amelyek széleslevelű gyomnövények ellen nagyon hatékonyak, míg az alaklór és a metolaklór hatása a pázsítfűfélékkel szemben nagy és a széleslevelű gyomnövények ellen nagyon csekély és mindezen szerek különösen gyenge hatásúak a Cyperus esculentus ellen. Egyetlen ilyen herbicid alkalmazásával így nagyon nehéz mindezen gyomnövényfajták gyökeres kiirtása.

50 Kiterjedt kutatásaink eredményeként arra a felismerésre jutottunk, hogy ezzel szemben a találmány szerint előállítható (I) általános képletű vegyületek a gyomnövények széles tartományában alkalmazhatók kiemelkedő herbicid hatással, mégpedig úgy, hogy a haszonnövényekkel, pl. a tengerivel, cirokkal, búzával és árpával szemben nem fejtenek ki fitotoxikus hatást.

60 Különös további előny, hogy az (I) általános képletű új vegyületek körében olyan vegyület is van, amely jó szelektivitást mutat a rizs és az Echinochloa crus-galli között, további ilyen vegyületek pedig jól szelektálnak a gyomnövények és a következő haszonnövények kö-

zött; *Gossypium* spp. (gyapot), *Beta vulgaris* (cukorrépa), illetve *Glycine max* (szójabab).

Eddig is ismeretes volt, hogy egyes 4-benzoil-pirazolszármazékok kiváló herbicid hatást fejtenek ki, pl. a pirazolát triviális nevű vegyület a kereskedelmi forgalomban kapható és széleskörűen alkalmazzák a gyakorlatban. De az ismert ilyen herbicid hatóanyagok alkalmazhatósága a rizsföldekre korlátozott és felföldi alkalmazáskor hatásuk nagyon csekély. Ugyanakkor a kiterjedt kutatások eredményeként általunk talált új, (I) általános képletű vegyületek, amelyek szerkezete a szubsztituensek alkalmas megválasztásával széleskörűen variálható, amint azt az előbb már bemutattuk, nagyon erős herbicid hatást fejtenek ki felföldi alkalmazáskor, legyen az akár talajmenti, talajba beágyazásos vagy levélkezelés. Különösen jó a hatékonyság a pázsitfűféle gyomnövényekkel és a *Cyperus esculentus* szal szemben.

A találmány szerint az (I) általános képletű új pirazolszármazékokat könnyen állíthatjuk elő például az 1., 2., és 3. folyamatábrákon bemutatott szintézisek valamelyikének alkalmazásával.

E folyamatábrák képleteiben A, B, X, Y és Z jelentése az (I) általános képlethez már megadott, E jelentése halogénatom, metánszulfonil-oxi-csoport vagy p-toluolszulfonil-oxi-csoport, Q' és Y' jelentése az előzőekben megadott. Az 1. folyamatábrán mutatott (III) általános képletű kiindulási anyag (III') általános képletű tautomerje is alkalmazható. Az 1. folyamatábrán mutatott DCC szimbólum jelentése N,N'-diciklohexilkarbodiimid.

Az 1. folyamatábra szerint a kívánt céltermékek megfelelő szubsztituensekkel rendelkező 5-hidroxi-pirazolt inert oldószerben, továbbá DCC és egy bázis jelenlétében reagáltatjuk a megfelelő benzoészárszármazékkal. Az (I) általános képlet körébe tartozó (I') általános képletű (Q = H) 4-benzoil-5-hidroxi-pirazolt kapunk. A DCC-t a benzoészárszármazék és a pirazolszármazék egy móljára számított 1,0–1,5 mólnyi mennyiségben alkalmazzuk. Bármilyen oldószert alkalmazhatunk, amely a reakció szempontjából semleges, de különösen előnyös, ha terc-butil-alkoholt, terc-pentil-alkoholt vagy izopropil-alkoholt alkalmazunk. Tulajdonképpen a reakció akkor is végbemegy, ha nincs külön bázis jelen a reakcióelegyben, de általában annak jelenléte javítja a kitermelést. A bázis megválasztása sem kritikus, előnyösen kálium-karbonátot vagy nátrium-karbonátot alkalmazhatunk. A reakcióhőmérséklet terjedhet szobahőmérséklettől az oldószer forráspontjáig, előnyösen a hőmérséklet az 50–100 °C tartományon belüli. A reakcióidő általában fél óra és húsz óra közötti.

A 2. folyamatábra szerint a kívánt reakciótermékek megfelelő szubsztituensekkel rendelkező benzoil-klorid-származékokat a megfelelő 5-hidroxi-pirazol-származékkal reagáltatjuk, majd a kapott benzoil-észtert átrendezéssel konvertáljuk a kívánt (I') általános képletű 4-benzoil-vegyületté.

A benzoil-észterezést inert oldószerben végezhetjük, amely lehet aromás szénhidrogén, zsírsavészter, halo-

génezett szénhidrogén, zsírsavészter, halogénezett szénhidrogén, éter, acetonitril, halogénezett szénhidrogén, éter, acetonitril, dimetil-szulfoxid (DMSO) vagy N,N'-dimetil-formamid (DMF), vagy lehet egy kétfázisú rendszer, amely tartalmaz ilyen oldószert és vizet, vagy lehet ilyen oldószerek elegye; s jelen van egy alkalmas dehidro-halogénező szer, amely lehet szerves bázis, pl. nátrium-hidroxid, kálium-hidroxid vagy nátrium-hidrogén-karbonát, vagy egy szerves bázis, pl. piridin vagy trietil-amin. Az észterezés szobahőmérséklet és 100 °C közötti hőmérsékleten végezhető, időtartama tíz perc és öt óra közötti.

Az átrendezési reakcióhoz alkalmazhatunk Lewis-savat, pl. vízmentes alumínium-kloridot vagy bázist. A bázis pl. lehet kálium-karbonát, kalcium-hidroxid vagy nátrium-karbonát. A Lewis-sav vagy a bázis molaránya lehet 1 és 10 közötti.

Oldószer tulajdonképpen nem szükséges; néha előnyös lehet – a reakcióképesség, illetve a kitermelés javítása szempontjából – olyan oldószer alkalmazása, amelynek megfelelő a forráspontja. Ilyenkor pl. előnyös lehet dioxán vagy diglim alkalmazása.

A reakcióhőmérséklet általában 50 és 150 °C közötti, a reakcióidő általában tízenöt perc és tíz óra közötti.

A 3. folyamatábra szerint a megfelelő (I') általános képletű 4-benzoil-5-hidroxi-pirazol-származékokat reagáltatjuk a kívánt Q-szubsztituens (Q = Q'H) E-Q' (V) általános képletű halogenidjével, metánszulfonsav-észterével vagy p-toluolszulfonsav-észterével; így az ennek megfelelő (I) általános képletű célterméket kapjuk.

A reakcióban előnyösen dehidro-halogénező szert alkalmazunk 1–3 közötti molarányban. Ilyen szer lehet egy szerves bázis, pl. nátrium-hidroxid, kálium-hidroxid, nátrium-karbonát, nátrium-hidrogén-karbonát vagy kálium-karbonát, vagy egy szerves bázis, pl. piridin vagy trietil-amin.

Az oldószer megválasztása nem kritikus, amíg az a reakcióra nézve inert; így az oldószerek széles köréből választhatunk, közöttük aromás szénhidrogének, zsírsavészterek, halogénezett szénhidrogének, éterek, ketonok, alifás szénhidrogének, acetonitril, DMSO vagy DMF.

A reakcióhőmérséklet szobahőmérséklet és az oldószer forráspontja között választható. A reakcióidő általában harminc perc és harminc óra közötti.

A találmány szerinti eljárásban kiindulási anyagként alkalmazandó benzoészárszármazékok előállításához alkalmasan kombinálhatunk önmagában ismert különböző szintéziseket. Olyan vegyületeket pl., amelyeknél a benzolgyűrű Z-szubsztituense  $-S(O)_nCH_3$  általános képletű csoport, az 5., 6., illetve 7. folyamatábra szerint állíthatunk elő.

Az e folyamatábrákon szereplő képletekben X és Y jelentése a már megadott és Hal jelentése halogénatom.

A továbbiakban a benzoészárszármazék kiindulási anyagok előállítását az E1.–E14. példák segítségével magyarázzuk részletesebben; természetesen a találmány szerinti eljáráshoz nem csak az E1.–E14. példákban leírt konkrét módon előállított kiindulási anyagokat alkalmazhatunk.

*EI. példa*

4-Metánszulfonil-3-(metoxi-metil)-2-metil-benzoesav és 3-(metoxi-metil)-2-metil-4-(metil-tio)-benzoesav előállítása

(A) 2-Metil-3-nitro-benzil-alkohol előállítása

39,0 g (0,2 mól) metil-2-metil-3-nitro-benzoátot feloldottunk 600 ml terc-butanolban és hozzáadtunk 19,0 g nátrium-[tetrahidrido-borát]-ot. Az elegyet visszafolyatós hűtő alkalmazásával forraltuk és eközben egy óra alatt 150 ml metanolt csepegtettünk hozzá, majd további egy órán át folytattuk a forralást a reakció teljes lezajlását biztosítva. A reakcióelegyet ezután lehűlni hagytuk, vizet adtunk hozzá, majd csökkentett nyomáson kidesztilláltuk az oldószert. A maradékhoz vizet és kloroformot adtunk, a szerves fázist elkülönítettük és vízmentes nátrium-szulfáton szárítottuk.

Az oldószert kidesztilláltuk; így a cím szerinti vegyületből 30,7 g-ot kaptunk.

(B) (2-Metil-3-nitro-benzil)-metil-éter előállítása

Az előző lépésben kapott 2-metil-3-nitro-benzil-alkoholból 30,1 g-ot (0,18 mól) feloldottunk 200 ml benzolban és az oldathoz – egymást követően – hozzáadtunk 0,2 g tetra(n-butil)-ammónium-bromidot és 50 t%-os koncentrációval vízben oldott 20,1 g nátrium-hidroxidot. Ezután szobahőmérsékleten 27,2 g dimetil-szulfátot csepegtettünk az elegyhez, amelyet keverés közben három órán át reagáltattunk. Ezután vizet adtunk a reakcióoldathoz, a szerves fázist elkülönítettük és mostuk előbb vízzel, majd 2 t%-nyi hidrogén-kloridot tartalmazó vizes oldattal, ismét vízzel, végül nátrium-klorid telített vizes oldattal. Ezután kidesztilláltuk az oldószert; így olajos anyag alakjában kaptunk 30,9 g-ot a cím szerinti vegyületből.

(C) 3-(Metoxi-metil)-2-metil-anilin előállítása

Az előző lépés szerint előállított 30,7 g (0,17 mól) (2-metil-3-nitro-benzil)-metil-éterhez 200 ml metanolt adtunk. Amikor a vegyület a metanolban feloldódott, fokozatosan hozzáadtunk előbb 92 ml tömény hidrogén-kloridot, majd 30,4 g vasport, az utóbbi adagolása közben ügyelve arra, hogy a reakció-hőmérséklet ne emelkedjen 60 °C fölé, s az így kapott elegyet további egy órán át reagáltattuk.

Ezután 300 ml vizet adtunk a reakcióoldathoz, majd nátrium-hidroxidot mindaddig, amíg a pH 8 fölé nem emelkedett. Az így kapott zagyhoz kloroformot adtunk és az elegyet alaposan kevertük, majd kiszűrtük a szilárd részeket és a szűrletből elkülönítettünk egy szerves fázist. Ezt a szerves fázist mostuk előbb vízzel, majd nátrium-klorid telített vizes oldattal és vízmentes nátrium-szulfáton szárítottuk. Az oldószert csökkentett nyomáson kidesztilláltuk; így a cím szerinti vegyületből 23,1 g-ot kaptunk olajos anyag alakjában.

(D) 3-(Metoxi-metil)-2-metil-4-tiociano-anilin előállítása

22,6 g (0,15 mól) 3-(metoxi-metil)-2-metil-anilint feloldottunk 300 ml metanolban, majd hozzáadtunk 36,5 g nátrium-tiocianátot és azt egyenletesen feloldottuk. Az oldatot 0 °C-ra hűtöttük, s úgy csepegtettünk hozzá 25,2 g brómot tartalmazó nátrium-bromid telített metanolos oldatából 100 ml-t, hogy eközben a reakció-

hőmérséklet ne emelkedjen 5 °C fölé. A csepegtetés befejezése után az elegyet úgy reagáltattuk, hogy 5 °C-ot meg nem haladó hőmérsékleten kevertük egy órán át, majd szobahőmérsékleten kevertük egy további 5 órán át. Ezután a reakcióoldatot egy liter vízbe öntöttük, nátrium-karbonát 5 t%-os vizes oldatával semlegesítettük, majd kloroformot adtunk hozzá és az olajos anyagot extraháltuk. A kloroformos fázist mostuk előbb vízzel, majd nátrium-klorid telített vizes oldatával és vízmentes nátrium-szulfáton szárítottuk. Ezután csökkentett nyomáson kidesztilláltuk az oldószert; így a cím szerinti termékéből 29,6 g-ot kaptunk.

(E) 3-(Metoxi-metil)-2-metil-4-(metil-tio)-anilin előállítása

29,1 g (0,14 mól) 3-(metoxi-metil)-2-metil-4-tiociano-anilint feloldottunk 200 ml etanolban és szobahőmérsékleten hozzákevertünk 33,6 g nátrium-szulfid-nonahidráttal tartalmazó 100 ml vizes oldatot. Az így kapott elegyhez csepegtettünk 21,9 g metil-jodidot és az elegyet szobahőmérsékleten három órán át reagáltattuk. A reakció lezajlása után az oldószert csökkentett nyomáson kidesztilláltuk, a maradékhoz vizet és kloroformot adtunk. Ezután a szerves fázist elkülönítettük és ezután mostuk előbb vízzel, azután nátrium-klorid telített vizes oldattal, majd a terméket vízmentes nátrium-szulfáton szárítottuk. Az oldószert csökkentett nyomáson kidesztilláltuk; így a cím szerinti termékéből 25,6 g-ot kaptunk olajos anyag alakjában.

(F) [3'-Jód-2'-metil-6'-(metil-tio)-benzil]-metil-éter előállítása

25,6 g (0,13 mól) 3-(metoxi-metil)-2-metil-4-(metil-tio)-anilinhoz adtunk 100 ml vizet és 33 ml tömény hidrogén-kloridot, hogy az anilint annak hidrogén-kloridjává alakítsuk. A kapott oldatot 0 °C-ra hűtöttük, s úgy csepegtettünk hozzá 9,3 g nátrium-nitrítet tartalmazó 30 ml vizes oldatot, hogy eközben a reakció hőmérséklet ne emelkedjen 5 °C fölé. A csepegtetés befejezése után további harmincperces keveréssel biztosítottuk a diazotálás lezajlását. 33 g kálium-jodidot tartalmazó 100 ml vizes oldatot 70 °C-ra melegítettünk, fokozatosan hozzáadtuk a diazóniumsó vizes oldatát és hagytuk elbomlani. A reakcióoldatot további egy órán át kevertettük 70 °C hőmérsékleten, majd lehűlni hagytuk. Az olajos komponenst benzollal extraháltuk. A benzolos fázist mostuk, előbb vízzel, azután nátrium-hidrogén-szulfid telített vizes oldattal, ismét vízzel, végül nátrium-klorid telített vizes oldattal, majd csökkentett nyomáson kidesztilláltuk az oldószert és a maradékot oszlopkromatográfiásan tisztítottuk (eluens: benzol); így 30,0 g-ot kaptunk a cím szerinti termékéből, amelynek olvadáspontja 56,0 és 59,0 °C közötti volt.

(G) 3-(Metoxi-metil)-2-metil-4-(metil-tio)-benzoesav előállítása

27,7 g (0,09 mól) [3'-jód-2'-metil-6'-(metil-tio)-benzil]-metil-étert feloldottunk 100 ml vízmentes tetrahidrofuranban (THF) és az elegyhez -70 °C hőmérsékleten hozzácsepegtettünk n-butil-lítium n-hexános oldatából (1,5 M) 63 ml-t. A csepegtetés befejezése után az elegyet ezen a hőmérsékleten kevertük tizenöt per-

cig, majd alaposan átáramoltattuk vízmentes szén-dioxid gázzal, amíg a reakcióoldatban a hőfejlődés meg nem szűnt. A reakció lezajlása után az oldat hőmérsékletét újra engedték szobahőmérsékletre melegedni és folyadékkelkülönítés céljából hozzáadtunk vizet és di-

(H) 4-Metánszulfonil-3-(metoxi-metil)-2-metil-benzo-sav előállítása

11,3 g (0,05 mól) 3-(metoxi-metil)-2-metil-4-(metil-tio)-benzoesavhoz adtunk 120 ml ecetsavat és hidrogén-peroxid 35 t%-os vizes oldatából 120 ml-t, majd az elegyet egy órán át reagáltattuk 80 °C hőmérsékleten. A reakcióelegyet lehűtöttük, majd jeges vízbe öntöttük, a kicsapott kristályokat kiszűrtük, vízzel mostuk, majd szárítottuk; így 12,3 g-ot kaptunk a cím szerinti termékből, amelynek olvadáspontja 129,0–131,0 °C volt.

#### E2. példa

3-(Metoxi-karbonil)-2-metil-4-(metil-tio)-benzoesav és 4-metán-szulfonil-3-(metoxi-karbonil)-2-metil-benzoesav előállítása

(A) Metil-3-amino-2-metil-benzoát előállítása

40 g metil-2-metil-3-nitro-benzoátot feloldottunk 120 ml metanolban és hozzáadtunk 157 g tömény hidrogén-kloridot. Ezután fokozatosan hozzáadtunk 36,8 g vasport úgy, hogy az elegyet 60 °C-ot meg nem haladó hőmérsékleten tartottuk. Az elegyet szobahőmérsékleten négy órán át kevertettük, majd 1 liter jeges vízbe öntöttük. Az oldatot nátrium-karbonáttal semlegesítettük és kloroformmal extraháltuk (miután kiszűrtük a nem oldódó részeket). Az extraktumot nátrium-klorid telített vizes oldatával mostuk és vízmentes nátrium-szulfáton szárítottuk. Ezután kidesztilláltuk az oldószert; így a cím szerinti termékből 27,8 g-ot kaptunk olajos anyag alakjában.

(B) Metil-3-amino-2-metil-6-tiociano-benzoát előállítása

27,7 g metil-3-amino-2-metil-benzoátot, 41,5 g nátrium-tiocianátot és 250 ml metanolt tartalmazó oldatot 0 °C-ot meg nem haladó hőmérsékleten tartva, ahhoz nátrium-bromiddal telített metanolos oldatból – 28,1 g brómot tartalmazó – 100 ml-t csepegtettünk. Az elegyet szobahőmérsékleten három órán át kevertettük, majd 1 liter jeges vízbe öntöttük. Az oldatot nátrium-karbonáttal semlegesítettük, majd kloroformmal extraháltuk. Az extraktumot nátrium-klorid telített vizes oldatával mostuk és vízmentes nátrium-szulfáton szárítottuk, majd az oldószert kidesztilláltuk; így a cím szerinti termékből 34,0 g-ot kaptunk olajos anyag alakjában.

(C) Metil-3-amino-2-metil-6-(metil-tio)-benzoát előállítása

39,5 g nátrium-szulfid-nonahidrátot és 110 ml vizet tartalmazó oldathoz csepegtettünk egy oldatot,

amely 32,9 g metil-3-amino-2-metil-6-tiociano-benzoátot és 300 ml etanolt tartalmazott. Az elegyet szobahőmérsékleten másfél órán át kevertettük, majd hozzácsepegtettünk jeges hűtés közben 24,0 g metil-jodidot. Az elegyet szobahőmérsékleten további két órán át kevertettük, majd csökkentett nyomáson bepároltuk. Nátrium-klorid telített vizes oldatát adtuk a maradékhoz, majd az elegyet kloroformmal extraháltuk. Az extraktumot vízmentes nátrium-szulfáton szárítottuk, majd az oldószert kidesztilláltuk; így a cím szerinti vegyületből 30,1 g-ot kaptunk olajos anyag alakjában.

(D) Metil-3-jód-2-metil-6-(metil-tio)-benzoát előállítása

28 g metil-3-amino-2-metil-6-(metil-tio)-benzoátot 150 ml tömény hidrogén-kloridban szobahőmérsékleten két órán át kevertettünk, hogy a vegyületet annak hidrogén-kloridjává alakítsuk. Ezután 0 °C-ot meg nem haladó hőmérsékleten tartva az elegyet, hozzácsepegtettünk egy 11,9 g nátrium-nitritet és 20 ml vizet tartalmazó oldatot. Az így kapott diazóniumsó oldatot hozzácsepegtettük egy oldathoz, amely 28,4 g kálium-jodidot és 90 ml vizet tartalmazott, eközben az oldat hőmérsékletét 80 °C-on tartottuk. A csepegtetés befejezése után az elegyet 80 °C hőmérsékleten tízenöt percen át kevertettük, majd engedték lehűlni. Víz hozzáadása után az elegyet kloroformmal extraháltuk. Az extraktumot előbb nátrium-hidrogén-szulfid vizes oldatával, majd vízzel mostuk és vízmentes nátrium-szulfáton szárítottuk. Az oldószert kidesztilláltuk; így a cím szerinti vegyületből 40 g-nyi nyers-terméket kaptunk, amelyet szilikagéles oszlopkromatográfiával tisztítottunk, eluensként benzolt alkalmazva; a tisztított termék olajos anyag volt, mennyisége 36,0 g.

(E) 3-(Metoxi-karbonil)-2-metil-4-(metil-tio)-benzoesav előállítása

20,0 g metil-3-jód-2-metil-6-(metil-tio)-benzoátot és 70 ml vízmentes THF-et tartalmazó oldatot nitrogén atmoszférában –60 °C-ot meg nem haladó hőmérsékleten tartottunk és hozzácsepegtettünk 42 ml-nyi 1,5 M n-butil-lítium n-hexános oldatát. Tízenöt perc eltelte után erőteljesen átfúvattunk az elegyen szén-dioxid gázt, közben a hőmérsékletet –50 °C-ot meg nem haladó értéken tartva. A szén-dioxid gázt nitrogénnel kiöblítettük, majd az elegyhez csepegtettünk 12,7 g diizopropil-amint és mindaddig kevertettük, amíg az elegy szobahőmérsékletűvé nem vált. Ezután csökkentett nyomáson bepároltuk az elegyet, a maradékhoz vizet adtunk és azt kloroformmal mostuk. A vizes oldatot tömény hidrogén-kloriddal savanyítottuk, majd kloroformmal extraháltuk. Az extraktumot vízmentes nátrium-szulfáton szárítottuk, majd az oldószert abból kidesztilláltuk; így 7,5 g-nyit kaptunk a cím szerinti termékből, amelynek olvadáspontja 178–178,5 °C volt.

(F) 4-Metánszulfonil-3-(metoxi-karbonil)-2-metil-benzoesav előállítása

5,0 g 3-(metoxi-karbonil)-2-metil-4-(metil-tio)-benzoesavat, 25 ml ecetsavat és 35 t%-os koncentrációra

hígított hidrogén-peroxidból 25 ml-t tartalmazó oldatot 80 °C hőmérsékleten három órán át kevertettük, majd lehűtöttük. Ezután az elegyet jeges vízbe öntöttük és kloroformmal extraháltuk. Az extraktumot vízmentes nátrium-szulfáton szárítottuk, majd kidesztilláltuk az oldószert; így 5,1 g-nyit kaptunk a cím szerinti termék-ből, amelynek olvadáspontja 151–152 °C volt.

### E3. példa

2-Klór-3-(etil-tio-metil)-4-metánszulfonil-benzoe-sav előállítása

(A) Metil-3-(bróm-metil)-2-klór-4-metánszulfonil-benzoát előállítása

12,1 g metil-2-klór-4-metánszulfonil-3-metil-benzo-átot feloldottunk 250 ml tetraklór-metánban és az olda-tot visszafolyatós hűtő alkalmazásával, keverés közben forraltuk, majd fokozatosan hozzáadtunk harminc perc alatt 7,5 g brómot és 1 g benzoil-peroxidot, majd to-vábbi négy órán át forraltuk az oldatot visszafolyatós hűtő alkalmazásával. Az oldatot lehűtöttük, 200 ml kloroformot adtunk hozzá és az elegyet 5 t% nátrium-hidrogén-szulfidot tartalmazó vizes oldattal mostuk. A szerves fázist elkülönítettük és vízmentes nátrium-szulfáton szárítottuk. Az oldószert csökkentett nyomáson kidesztilláltuk, így nyersterméket kaptunk. Ezt etil-éterrel mostuk; 13,2 g-ot kaptunk a cím szerinti ter-mékből kristályok alakjában, amelyek olvadáspontja 77–78 °C volt.

(B) Metil-2-klór-3-(etil-tio-metil)-4-metánszulfonil-benzoát előállítása

100 ml THF-hez adtunk 1,3 g etán-tiól és 1,5 g káli-um-karbonátot, majd 4,4 g metil-3-(bróm-metil)-2-klór-4-metán-szulfonil-benzoátot és az elegyet szoba-hőmérsékleten kevertettük egy napon át, majd további egy órán át kevertettük 50 és 60 °C közötti hőmérsék-leten. Az elegyet lehűtöttük, kloroformot adtunk hozzá, majd kálium-karbonát hígított vizes oldatával mostuk. A kloroformos fázist elkülönítettük és szárítottuk, majd kidesztilláltuk az oldószert; így olajos anyag alakjában 4,1 g-ot kaptunk a cím szerinti termékből.

(C) 2-Klór-3-(etil-tio-metil)-4-metánszulfonil-ben-zoesav előállítása

Nátrium-hidroxid 10 t%-os vizes oldatából 50 ml-t és 150 ml metanolt tartalmazó oldatelegyehez 3,9 g me-til-2-klór-3-(etil-tio-metil)-4-metánszulfonil-benzoátot adtunk és az elegyet szobahőmérsékleten harminc per-cen át kevertettük, majd csökkentett nyomáson kidesz-tilláltuk a metanolt és a maradékhoz savas kicsapátás céljából hígított hidrogén-kloridot adtunk. Az elegyet etil-acetáttal extraháltuk, az extraktumot szárítottuk, majd az oldószert kidesztilláltuk; így 3,5 g-nyit kap-tunk a cím szerinti termékből, amelynek olvadáspontja 172–174 °C volt.

### E4. példa

2-Klór-4-metánszulfonil-3-(metoxi-metil)-benzoe-sav előállítása

(A) Metil-2-klór-4-metánszulfonil-3-(metoxi-metil)-benzoát előállítása

Az E3. példa (A) lépésében leírt módon előállított

12,0 g metil-3-(bróm-metil)-2-klór-4-metánszulfonil-benzoátot és 100 ml metanolt tartalmazó oldathoz ad-tunk 1,7 g nátrium-metoxidot tartalmazó 50 ml meta-nolos oldatot és az elegyet éjszakán át szobahőmér-sékleten kevertettük, majd az oldószert csökkentett nyomáson kidesztilláltuk és a maradékhoz hígított hidrogén-kloridot adtunk. Az elegyet kloroformmal extraháltuk, az extraktumot vízzel mostuk és vízmen-tes nátrium-szulfáton szárítottuk. Az oldószert kidesz-tillálása után a cím szerinti vegyületből 9,5 g nyers-terméket kaptunk, amelyet szilikagéles oszlopkroma-tográfiával tisztítottunk, eluensként benzolt alkal-mazva; így olajos anyagként 7,5 g-nyi tisztított ter-méket kaptunk.

(B) 2-Klór-4-metánszulfonil-3-(metoxi-metil)-ben-zoesav előállítása

3,0 g metil-2-klór-4-metánszulfonil-3-(metoxi-metil)-benzoátot és 20 ml metanolt tartalmazó oldathoz olyan oldatot adtunk, amely 0,57 g nátrium-hidroxidot (93%) és 2 ml vizet tartalmazott. Az elegyet harminc percen át szobahőmérsékleten kevertettük, majd hozzáadtunk 10 ml vizet és az elegyet csökkentett nyomáson bepárol-tuk. Ezután hozzáadtunk hígított hidrogén-kloridot, az elegyet kloroformmal extraháltuk és az extraktumot víz-mentes nátrium-szulfáton szárítottuk. Az oldószert ki-desztilláltuk; így 2,6 g-nyit kaptunk a cím szerinti ter-mékből, amelynek olvadáspontja 137–141 °C volt.

### E5. példa

2-Klór-4-metánszulfonil-3-(metoxi-metil)-benzoe-sav előállítása (Alternatív módszer az E4. példához) Az E1. példában leírt módon is előállítottuk a cím szerinti terméket (olvadáspont: 137–141 °C); a köz-ütermékek:

- 35 (A): 2-Klór-3-nitro-benzil-alkohol (olajos anyag)
- (B): (2'-Klór-3'-nitro-benzil)-metil-éter (olajos anyag)
- (C): 2-Klór-3-(metoxi-metil)-anilin (olajos anyag)
- (D): 2-Klór-3-(metoxi-metil)-4-tiociano-anilin (ol-vadáspont: 90–96 °C)
- 40 (E): 2-Klór-3-(metoxi-metil)-4-(metil-tio)-anilin (olajos anyag)
- (F): [2'-Klór-3'-jód-6'-(metil-tio)-benzil]-metil-éter (olvadáspont: 53–56 °C)

### E6. példa

2-Klór-4-metánszulfonil-3-(metoxi-karbonil)-ben-zoesav előállítása

Ezt a terméket az E2. példában leírt módon állítot-tuk elő, olvadáspontja 160–162 °C; a közütermé-kek:

- (A): Metil-3-amino-2-klór-benzoát (olajos anyag)
- (B): Metil-3-amino-2-klór-6-tiociano-benzoát (ol-vadáspont: 80–83 °C)
- 55 (C): Metil-3-amino-2-klór-6-(metil-tio)-benzoát (ol-vadáspont: 70–72 °C)
- (D): Metil-2-klór-3-jód-6-(metil-tio)-benzoát (ola-jos anyag)
- (E): 2-Klór-3-(metoxi-karbonil)-4-(metil-tio)-benzoesav (olvadáspont: 176–179 °C).
- 60

*E7. példa*

4-Metánszulfonil-3-[(2-metoxi-etil)-oxi-karbonil]-2-metil-benzoészav előállítás

Ezt a terméket az E2. példában leírt módon állítottuk elő, olvadáspontja 118–121 °C; a közütermékek:

- (A): (2-Metoxi-etil)-3-amino-2-metil-benzoát (olajos anyag)  
 (B): 2-(Metoxi-etil)-3-amino-2-metil-6-tiociano-benzoát (olvadáspont: 79–81 °C)  
 (C): 2-(Metoxi-etil)-3-amino-2-metil-6-metil-tiobenzoát (olajos anyag)  
 (D): 2-(Metoxi-etil)-3-jód-2-metil-6-(metil-tio)-benzoát (olajos anyag)  
 (E): 3-[(2-Metoxi-etil)-oxi-karbonil]-2-metil-4-(metil-tio)-benzoészav (olvadáspont: 90–93 °C).

*E8. példa*

2-Metil-4-(metil-tio)-3-(n-propoxi-karbonil)-benzoészav és 4-metánszulfonil-2-metil-3-(n-propoxi-karbonil)-benzoészav előállítás

(A) Metil-3-bróm-2-metil-6-(metil-tio)-benzoát előállítás

48 t%-os koncentrációban hidrogén-bromidot tartalmazó 150 ml oldathoz adtunk 16,1 g-ot az E2. példa (C) lépése szerint előállított vegyületből és az elegyet keverve, a vegyületet annak hidrogén-bromidjává alakítottuk. Ezután 0 °C-ot meg nem haladó hőmérsékleten tartva az oldatot, hozzácsepegtettünk egy oldatot, amely 7,2 g nátrium-nitritet és 20 ml vizet tartalmazott. Így diazóniumsót kaptunk az oldatban, amelyet hozzácsepegtettünk egy oldathoz, amely 6,0 g réz (I)-bromidot és (48 t%-os koncentrációban) 7,7 g hidrogén-bromidot tartalmazott, eközben visszafolyató hűtő alkalmazásával forraltuk az oldatot. Ezután a forralást visszafolyató hűtő alkalmazásával egy órán át folytattuk, majd az elegyet engedjük lehűlni, jeges vizet adtunk hozzá és kloroformmal extraháltuk. Az extraktumot nátrium-hidrogén-szulfid vizes oldatával, majd vízzel mostuk és vízmentes nátrium-szulfáton szárítottuk, majd az oldószert kidesztilláltuk; így a cím szerinti nyerstermékből 19,2 g-ot kaptunk. Ezt szilikagéles oszlopkromatográfiával tisztítottuk, eluensként benzolt alkalmazva; így a tisztított termékből 17,1 g-ot kaptunk olajos anyag alakjában.

(B) 3-Bróm-2-metil-6-(metil-tio)-benzoészav előállítás

17,0 g metil-3-bróm-2-metil-6-(metil-tio)-benzoátot tartalmazó 100 ml etanolos oldathoz adtunk 16 g-ot nátrium-hidroxid 50 t%-os vizes oldatából és az elegyet visszafolyató hűtő alkalmazásával három órán át forraltuk. A reakcióelegyet csökkentett nyomáson bepároltuk, vizet adtunk a maradékhoz és az elegyet kloroformmal mostuk. A vizes fázist tömény hidrogén-klorid hozzáadásával savanyítottuk és kloroformmal extraháltuk. Az extraktumot vízmentes nátrium-szulfáton szárítottuk, majd kidesztilláltuk az oldószert; így 15,9 g-ot kaptunk a cím szerinti termékből, amelynek olvadáspontja 98–103 °C volt.

(C) n-Propil-3-bróm-2-metil-6-(metil-tio)-benzoát előállítás

15,8 g 3-bróm-2-metil-6-(metil-tio)-benzoészavhoz tionil-kloridot adtunk és az elegyet visszafolyató hűtő alkalmazásával négy órán át forraltuk. A tionil-kloridot kidesztilláltuk és a maradékhoz 70 ml n-propanolt adtunk jeges hűtés hőzben, majd hozzácsepegtettünk 7,3 g piridint és 20 ml n-propanolt tartalmazó oldatot. Az elegyet éjszakán át szobahőmérsékleten kevertettük, majd csökkentett nyomáson bepároltuk, hozzáadtunk etil-acetátot és az elegyet mostuk előbb nátrium-karbonát 5 t%-os vizes oldatával, majd hidrogén-klorid 10 t%-os oldatával, végül vízzel és vízmentes nátrium-szulfáton szárítottuk. Az oldószert csökkentett nyomáson kidesztilláltuk; így a cím szerinti nyerstermékből 18 g-ot kaptunk, amelyet szilikagéles oszlopkromatográfiával tisztítottunk, eluensként benzolt alkalmazva; így a tisztított termékből 16,6 g-ot kaptunk olajos anyagként.

(D) 3-Bróm-2-metil-6-(metil-tio)-benzoészav előállítás

Az E2. példa (E) lépése szerint jártunk el, a termék olvadáspontja 138–142 °C volt.

(E) 3-Bróm-6-metánszulfonil-2-metil-benzoészav előállítás

Az E2. példa (F) lépése szerint jártunk el, a termék olvadáspontja 142–146 °C volt.

*E9. példa*

2-Klór-3-(izopropoxi-karbonil)-4-metánszulfonil-benzoészav előállítás

Az E8. példa (B)–(E) lépései szerint jártunk el; a kiindulási anyag az E6. példa (D) lépésében kapott vegyület, a termék olvadáspontja 146–148 °C volt. A négylépéses szintézis közütermékei:

- (A): 2-Klór-3-jód-6-(metil-tio)-benzoészav (olvadáspont: 155–159 °C)  
 (B): Izopropil-2-klór-3-jód-6-(metil-tio)-benzoát (olajos anyag)  
 (C): 2-Klór-3-(izopropoxi-karbonil)-4-(metil-tio)-benzoészav (olvadáspont: 114–118 °C).

*E10. példa*

3-(1-Metoxi-etil)-2-metil-4-(metil-tio)-benzoészav és 4-metánszulfonil-3-(1-metoxi-etil)-2-metil-benzoészav előállítás

(A) 2'-Metil-3'-nitro-acetofenon előállítás

5,4 g fém-magnéziumhoz száraz nitrogénáramban csepegtettünk 5 ml tiszta etanolt és 0,5 ml tetraklórmetánt, majd visszafolyató hűtő alkalmazásával végzett forralás közben hozzáadtunk 130 ml vízmentes dietil-étert, ezután – olyan ütemben, hogy a visszafolyató hűtő alatti forrást fenntartsuk – hozzácsepegtettünk egy oldatot, amely tartalmazott 25 ml dietil-étert, 35,2 g dietil-malonátot és 20 ml etanolt. A csepegtetés befejezése után a refluxálást három órán át folytattuk, így dietil-etoxi-magnézium-malonátot kaptunk oldatban, amelyhez – visszafolyató hűtő alkalmazásával való forralás közben – húsz perc alatt hozzácsepegtettünk 150 ml dietil-éteres oldatot, amely tartalmazott – 2-me-

til-3-nitro-benzoésav és tionil-klorid alkalmazásával előállított – 40,0 g 2-metil-3-nitro-benzoésav-kloridot; további két órán át reagáltattuk az elegyet, azt lehűtöttük és hidrolízis céljából hozzáadtunk hígított kénsavat. A dietil-éteres fázist előbb vízzel, majd nátrium-klorid telített vizes oldatával mostuk és az oldószert csökkentett nyomáson kidesztilláltuk, majd a maradékot szárítottuk; így nyertermékként dietil-2-(2-metil-3-nitro-benzoil)-malonátot kaptunk. A nyertermékhez adtunk egy elegyet, amely 7,5 ml tömény kénsavat, 60 ml ecetsavat és 40 ml vizet tartalmazott és az elegyet visszafolyató hűtő alkalmazásával hat órán át forraltuk. Ezután az elegy pH-ját nátrium-hidroxid 20 t%-os vizes oldatával 10-re állítottuk. A kloroformos komponenst kloroformmal extraháltuk, a kloroformos fázist előbb vízzel, majd nátrium-klorid vizes oldatával mostuk és az oldószert csökkentett nyomáson kidesztilláltuk; így 34,0 g-ot (kitermelés: 95%) kaptunk a cím szerinti termékből, amelynek olvadáspontja 53,0–54,0 °C.

(B) 1-Metil-2'-metil-3'-nitro-benzil-alkohol előállítása

0,5 g nátrium-hidroxidot tartalmazó 50 ml metanolos oldathoz adtunk 0 °C hőmérsékleten 0,9 g nátrium-[tetrahidrido-borát]-ot, majd hozzácepegettünk 14,3 g 2'-metil-3'-nitro-acetofenont tartalmazó 100 ml metanolos oldatot. Ezután az elegy hőmérsékletét visszaengedtük szobahőmérsékletre és egy órán át reagáltattuk, majd a reakcióelegyet vízbe öntöttük és benzollal extraháltuk. Ezután szokásos módon kezelve az extraktumot, 14,3 g-ot (kitermelés: 99%) kaptunk a cím szerinti termékből olajos anyag alakjában.

Ezt követően az E1. példa (A)–(G) lépéseiben leírt módon hajtottuk végre e szintézis (C)–(I) lépéseit; a lépésenkénti reakciótermékek:

- (C): (1-Metil-2'-metil-3'-nitro-benzil)-metil-éter (olajos anyag)
- (D): (1-Metil-3'-amino-2'-metil-benzil)-metil-éter (olajos anyag)
- (E): (1-Metil-3'-amino-2'-metil-6'-tiociano-benzil)-metil-éter (szilárd)
- (F): [1-Metil-3'-amino-2'-metil-6'-(metil-tio)-benzil]-metil-éter (olajos anyag)
- (G): [1-Metil-3'-jód-2'-metil-6'-(metil-tio)-benzil]-metil-éter (olajos anyag)
- (H): 3-(1-Metoxi-etil)-2-metil-4-(metil-tio)-benzoésav (olajos anyag)
- (I): 4-Metánszulfonil-3-(1-metoxi-etil)-2-metil-benzoésav (olvadáspont: 106–109 °C).

#### E11. példa

2,4-Diklór-3-(metoxi-karbonil)-benzoésav előállítása

(A) 2,4-Diklór-3-nitro-benzoésav előállítása

25 ml füstölő salétromsavat és 20 ml kénsavat tartalmazó oldathoz fokozatosan hozzáadtunk 25 g 2,4-diklór-benzoésavat. A hőfejlődés befejeződése után a reakcióelegyet jeges vízbe öntöttük. A kivált szilárd terméket vízzel mostuk és szárítottuk; így a cím szerinti termékből 23,0 g-ot kaptunk.

(B) Metil-2,4-diklór-3-nitro-benzoát előállítása

23,0 g 2,4-diklór-3-nitro-benzoésav és 150 ml tionil-klorid elegyét visszafolyató hűtő alkalmazásával hat órán át forraltuk, majd a tionil-kloridot kidesztilláltuk; így nyertermékként 2,4-diklór-3-nitro-benzoil-kloridot kaptunk. 200 ml metanolt adtunk a nyers vegyülethez és visszafolyató hűtő alkalmazásával forraltuk az elegyet. Ezután kidesztilláltuk a metanolt és etil-acetátot adtunk a maradékhoz. Az így kapott etil-acetátos oldatot mostuk előbb nátrium-hidroxid 5 t%-os vizes oldatával, majd hígított hidrogén-kloriddal, végül vízzel. A terméket szárítottuk, az oldószert kidesztilláltuk; így 21,8 g-ot kaptunk a cím szerinti termékből, amelynek olvadáspontja 72–74 °C volt.

A továbbiakban az E1. példában leírt módon jártunk el és (C), illetve (D) köztermékeket, valamint az (E) lépésben a cím szerinti terméket kaptuk.

(C): Metil-3-amino-2,4-diklór-benzoát (olajos anyag)

(D): Metil-2,4-diklór-3-jód-benzoát (olajos anyag)

(E): 2,4-Diklór-3-(metoxi-karbonil)-benzoésav (olvadáspont: 183–185 °C).

#### E12. példa

2-Klór-3-(ciano-metil)-4-metánszulfonil-benzoésav előállítása

(A) Metil-2-klór-3-(ciano-metil)-4-metánszulfonil-benzoát előállítása

0,4 g 18-korona-6-étert és 1,9 g kálium-cianidot tartalmazó 50 ml acetonitriles oldathoz adtunk 5,0 g metil-3-(bróm-metil)-2-klór-4-metánszulfonil-benzoátot és az elegyet szobahőmérsékleten hetvenkét órán át kevertettük. A szilárd anyagot kiszűrtük, a szűrlethez vizet adtunk és az elegyet kloroformmal extraháltuk. Az extraktumot vízzel mostuk, szárítottuk, majd az oldószert kidesztilláltuk és a kapott nyerterméket szilikagél oszlopkromatográfiával tisztítottuk, eluensként kloroformot alkalmazva; így 4,1 g-ot kaptunk a cím szerinti termékből, amelynek olvadáspontja 151–155 °C volt.

(B) 2-Klór-3-(ciano-metil)-4-metánszulfonil-benzoésav előállítása

4,0 g metil-2-klór-3-(ciano-metil)-4-metánszulfonil-benzoát és 50 ml metanol elegyéhez fokozatosan adtunk 5 ml vizes oldatot, amely 0,72 g nátrium-hidroxidot (93%) tartalmazott és az elegyet szobahőmérsékleten tizenöt percig kevertettük, majd a reakcióelegyet hígított hidrogén-kloriddal semlegesítettük, a metanolt csökkentett nyomáson kidesztilláltuk és a bepárolt oldatot kloroformmal extraháltuk. Az extraktumot vízzel mostuk és szárítottuk, majd a kloroformot kidesztilláltuk; így 0,9 g-ot kaptunk a cím szerinti termékből, amelynek olvadáspontja 169–172 °C volt.

#### E13. példa

3-(Acetoxi-metil)-2-klór-4-metánszulfonil-benzoésav előállítása

(A) Metil-3-(acetoxi-metil)-2-klór-4-metánszulfonil-benzoát előállítása

5,0 g metil-3-(bróm-metil)-2-klór-4-metánszulfonil-

benzoátot és 1,2 g nátrium-acetátot tartalmazó 50 ml DMF-es oldatot két órán át kevertettünk 100 °C hőmérsékleten, majd az elegyet lehűtöttük, jeges vízbe öntöttük és kloroformmal extraháltuk. Az extraktumot vízzel mostuk és szárítottuk, majd az oldószert kidesztilláltuk; így 4,2 g-ot kaptunk a cím szerinti termékből, amelynek olvadáspontja 165–168 °C volt.

(B) 2-Klór-3-(hidroxi-metil)-4-metánszulfonil-benzoésav előállítása

3,9 g metil-3-(acetoxi-metil)-2-klór-4-metánszulfonil-benzoát és 100 ml metanol elegyéhez adtunk 1,3 g nátrium-hidroxidot (93%) tartalmazó 6 ml vizes oldatot és az elegyet szobahőmérsékleten harminc percig kevertettük, majd hozzáadtunk 50 ml vizet és csökkentett nyomáson kidesztilláltuk a metanolt. Ezután a reakcióelegyet hidrogén-klorid hozzáadásával savanyítottuk és kloroformmal extraháltuk. Az extraktumot szárazra pároltuk; így 1,3 g-ot kaptunk a cím szerinti termékből, amelynek olvadáspontja 240–245 °C volt.

(C) 3-(Acetoxi-metil)-2-klór-4-metánszulfonil-benzoésav előállítása

1,3 g 2-klór-3-(hidroxi-metil)-4-metánszulfonil-ben-

zoésav és 30 ml ecetsavanhidrid elegyét visszafolyatós hűtő alkalmazásával három órán át forraltuk, majd csökkentett nyomáson bepároltuk a reakcióelegyet. Ezután 50 ml vizet adtunk a reakcióelegyhez, amelyet egy órán át melegítettünk. A kivált szilárd terméket kiszűrtük, vízzel mostuk és szárítottuk; így a cím szerinti termékből 1,35 g-ot kaptunk, amelynek olvadáspontja 219–223 °C volt.

E14. példa

2,4-Diklór-3-(metoxi-metil)-benzoésav előállítása

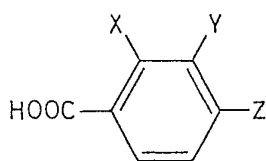
Az E3. példa (A) lépése és az E4. példa szerint jártunk el, a kapott termék olvadáspontja 130–136 °C volt. A kapott közti-termékek:

(A): Metil-3-(bróm-metil)-2,4-diklór-benzoát (olvadáspont: 55–58 °C).

(B): Metil-2,4-diklór-3-(metoxi-metil)-benzoát (olajos anyag).

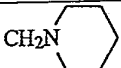
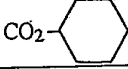
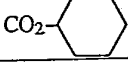
Az eddig ismertetett E1.–E14. példák valamelyike szerint előállított benzoésavszármazékok fizikai állapotát tartalmazzák az 1. és 2. táblázatok (beleértve a példákban konkrétan szereplő vegyületeket is).

1. táblázat



(II)

| X  | Y                                                    | Z                  | Olvadáspont (°C) |
|----|------------------------------------------------------|--------------------|------------------|
| Me | CH <sub>2</sub> OMe                                  | SMe                | 192–194          |
| Me | CH <sub>2</sub> OMe                                  | SO <sub>2</sub> Me | 129–131          |
| Me | CH <sub>2</sub> OMe                                  | SMe                | 178–178,5        |
| Me | CH <sub>2</sub> OMe                                  | SO <sub>2</sub> Me | 151–152          |
| Me | CH <sub>2</sub> OEt                                  | SMe                | 172–175          |
| Me | CH <sub>2</sub> OEt                                  | SO <sub>2</sub> Me | 160–621          |
| Cl | CH <sub>2</sub> Me                                   | Cl                 | 183–185          |
| Me | CHMeOMe                                              | SMe                | Olajos anyag     |
| Me | CHMeOMe                                              | SO <sub>2</sub> Me | 106–109          |
| Me | CO <sub>2</sub> Pr-i                                 | SMe                | 151–153          |
| Me | CO <sub>2</sub> Pr-i                                 | SO <sub>2</sub> Me | 153–155          |
| Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                  | SO <sub>2</sub> Me | 137–141          |
| Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | SMe                | 134–138          |
| Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | SO <sub>2</sub> Me | 159–161          |
| Me | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe  | SMe                | 90–93            |
| Me | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe  | SO <sub>2</sub> Me | 118–121          |
| Cl | CH <sub>2</sub> SEt                                  | SO <sub>2</sub> Me | 172–174          |
| Me | CO <sub>2</sub> Et                                   | SMe                | 114–120          |
| Me | CO <sub>2</sub> Et                                   | SO <sub>2</sub> Me | 119,7–127,9      |
| Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | SO <sub>2</sub> Me | 93–95            |

| X   | Y                                                                                 | Z                  | Olvaspont (°C) |
|-----|-----------------------------------------------------------------------------------|--------------------|----------------|
| Cl  |  | SO <sub>2</sub> Me | Olajos anyag   |
| Me  |  | SMe                | 169~172        |
| Mem |  | SO <sub>2</sub> Me | 129~134        |
| Me  | CO <sub>2</sub> Pr-n                                                              | SMe                | 138~142        |
| Me  | CO <sub>2</sub> Pr-n                                                              | SO <sub>2</sub> Me | 142~146        |
| Cl  | CH <sub>2</sub> OH                                                                | SO <sub>2</sub> Me | 240~245        |
| Cl  | CO <sub>2</sub> ME                                                                | SMe                | 176~179        |
| Cl  | CO <sub>2</sub> Me                                                                | SO <sub>2</sub> Me | 160~162        |
| Cl  | CO <sub>2</sub> Pr-i                                                              | SMe                | 114~118        |
| Cl  | CO <sub>2</sub> Pr-i                                                              | SO <sub>2</sub> Me | 146~148        |
| OMe | CO <sub>2</sub> Me                                                                | SMe                | 107~109        |
| OMe | CO <sub>2</sub> Me                                                                | SO <sub>2</sub> Me | 113~119        |
| Me  | CH <sub>2</sub> OMe                                                               | SMe                | Olajos anyag   |
| Me  | CH <sub>2</sub> OMe                                                               | SO <sub>2</sub> Me | Olajos anyag   |
| Me  | CH <sub>2</sub> OMe                                                               | SMe                | Olajos anyag   |
| Me  | CH <sub>2</sub> OMe                                                               | SO <sub>2</sub> Me | Olajos anyag   |
| Cl  | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C=CH                                             | SO <sub>2</sub> Me | 166~169        |
| Cl  | CH <sub>2</sub> OAm-n                                                             | SO <sub>2</sub> Me | Olajos anyag   |
| Me  | CO <sub>2</sub> Am-i                                                              | SMe                | 98~105         |
| Me  | CO <sub>2</sub> Am-i                                                              | SO <sub>2</sub> Me | 107~113        |
| Cl  | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                  | SO <sub>2</sub> Me | 155~157        |
| OMe | CH <sub>2</sub> OMe                                                               | SMe                | 157~161        |
| OMe | CH <sub>2</sub> OMe                                                               | SO <sub>2</sub> Me | Olajos anyag   |
| Me  | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl                                | SMe                | 138~144        |
| Me  | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl                                | SO <sub>2</sub> Me | 121~126        |
| Cl  | CH <sub>2</sub> CN                                                                | SO <sub>2</sub> Me | 169~172        |
| Cl  | CH <sub>2</sub> OAc                                                               | SO <sub>2</sub> Me | 219~223        |
| Cl  | CH <sub>2</sub> OMe                                                               | Cl                 | 130~136        |
| Cl  | CO <sub>2</sub> Et                                                                | SO <sub>2</sub> Me | 156~159        |
| Cl  | CH=CHOMe<br>(transz)                                                              | SO <sub>2</sub> Me | 146~149        |
| Cl  | CON(Et) <sub>2</sub>                                                              | SO <sub>2</sub> Me | 196~201        |

2. táblázat

| X  | Y                   | Z                  | <sup>1</sup> H-NMR (δ, ppm) (oldószer)                                                                                                                       |
|----|---------------------|--------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| Me | CH <sub>2</sub> OMe | SO <sub>2</sub> Me | 1,19 (3H, t), 1,63 (3H, d), 2,78 (3H, s), 3,18 (3H, s), 3,35 (2H, q), 5,63 (1H, q), 7,81 (2H, A-B q), 10,20 (1H, s) [CDCl <sub>3</sub> ]                     |
| Me | CH <sub>2</sub> OMe | SMe                | 1,00 (3H, t), 1,67~2,26 (2H, m), 2,46 (3H, s), 2,69 (3H, s), 3,21 (3H, s), 4,91 (1H, d-d), 7,48 (2H, A-B q), 10,2 (1H, s) [CDCl <sub>3</sub> ]               |
| Me | CH <sub>2</sub> OMe | SO <sub>2</sub> Me | 1,04 (3H, t), 1,60~2,20 (2H, m), 2,66 (3H, s), 3,23 (6H, s), 5,26 (1H, d-d), 7,79 (2H, A-B q), 9,0 (1H, széles s) [CDCl <sub>3</sub> + DMSO-D <sub>6</sub> ] |
| Me | CH <sub>2</sub> OMe | SO <sub>2</sub> Me | 3,04 (3H, s), 3,24 (3H, s), 3,71 (3H, s), 4,71 (2H, s), 7,71 (2H, s), 8,88 (1H, széles s) [CDCl <sub>3</sub> + DMSO-D <sub>6</sub> ]                         |

A táblázatokban szereplő benzoésavakat klórozószerek, pl. foszfor-pentaklorid, tionil-klorid vagy szulfonyl-klorid alkalmazásával könnyen átalakíthatjuk a megfelelő benzoil-klorid-származékká. Ezeket a benzoésavakat, illetve benzoil-kloridokat alkalmazva kiindulási anyagként, könnyen előállíthatjuk a találmány szerint az (I) általános képletű céltermékeket az 1–4. folyamatábrákban mutatott szintézisekkel összhangban.

A továbbiakban a találmányt az 1–11. példák megadásával ismertetjük részletesebben; természetesen a találmány nem korlátozódik ezekre a példákra.

#### 1. példa

1-Etil-5-hidroxi-4-[4-metánszulfonil-3-(metoxi-metil)-2-metil-benzoil]-pirazol előállítás

30 ml t-pentanolban feloldottuk 1,12 g (0,01 mól) 1-etil-5-hidroxi-pirazolt, majd sorrendben egymás után az elegyhez adtunk 2,59 g (0,01 mól) 4-metánszulfonil-3-(metoxi-metil)-2-metil-benzoésavat, 2,06 g (0,01 mól) N,N'-diciklohexil-karbodiimidet és 0,69 g (0,005 mól) vízmentes kálium-karbonátot. Az elegyet kevertettük 80 és 90 °C közötti hőmérsékleten nyolc órán át, majd a reakció lezajlása után csökkentett nyomáson kidesztilláltuk a t-pentanol és 30 ml vizet adtunk a maradékhoz az oldódó komponensek feloldása céljából. A nem oldódó részeket kiszűrtük, az így kapott vizes oldatot kloroformmal mostuk, majd tömény hidrogén-klorid hozzáadásával a pH-t 1 alá állítottuk. A kivált olajos komponenst kloroformmal extraháltuk, az oldószert csökkentett nyomáson kidesztilláltuk, a maradékot pedig szilikagéles oszlopkromatográfiával tisztítottuk eluensként etil-acetát és etanol 9:1 arányú elegyét alkalmazva; így 2,3 g-ot (kitermelés: 66%) kaptunk a céltermékből, amelynek olvadáspontja 116–118 °C volt.

#### 2. példa

1-Etil-5-hidroxi-4-[4-metánszulfonil-3-(metoxi-karbonil)-2-metil-benzoil]-pirazol előállítás

1,12 g (0,01 mól) 1-etil-5-hidroxi-pirazolt feloldottunk 30 ml t-pentanolban és egymást követően hozzáadtunk 2,72 (0,01 mól) 4-metánszulfonil-3-(metoxi-karbonil)-2-metil-benzoésavat, 2,27 g (0,011 mól) N,N'-diciklohexil-karbodiimidet és 0,76 g (0,0055 mól) vízmentes kálium-karbonátot, majd az elegyet 80 °C hőmérsékleten keverés közben hat órán át reagáltattuk. A reakció lezajlása után csökkentett nyomáson kidesztilláltuk a t-pentanol és a maradékhoz vizet adtunk az oldható komponensek feloldása céljából. A nem oldódó részeket kiszűrtük, s az így kapott vizes oldatot kétszer mostuk kloroformmal, majd tömény hidrogén-klorid hozzáadásával a pH-t 1 alá állítottuk. A kivált olajos komponenst kloroformmal extraháltuk. A kloroformos fázist mostuk előbb vízzel, majd nátrium-klorid telített vizes oldatával és vízmentes nátrium-szulfáton szárítottuk. Ezután csökkentett nyomáson kidesztilláltuk az oldószert és az így kapott maradékot víz és etanol elegyből átkristályosítottuk; így 2,26 g-ot (kitermelés: 62%) kaptunk a céltermékből, amelynek olvadáspontja 150–152 °C volt.

#### 3. példa

5-Hidroxi-[3-(izopropoxi-karbonil)-4-metánszulfonil-2-metil-benzoil]-1-metil-pirazol előállítása

Az 1. példa szerint jártunk el azzal az eltéréssel, hogy 1,12 g 1-etil-5-hidroxi-pirazol helyett 0,98 g 5-hidroxi-1-metil-pirazolt és 2,72 g 4-metánszulfonil-3-(metoxi-karbonil)-2-metil-benzoésav helyett 3,00 g 3-(izopropoxi-karbonil)-4-metánszulfonil-2-metil-benzoésavat alkalmaztunk; így 1,71 g-ot (kitermelés: 45%) kaptunk a céltermékből, amelynek olvadáspontja 192–194 °C volt.

#### 4. példa

4-[2-Klór-3-(etil-tio-metil)-4-metánszulfonil-benzoil]-1-etil-5-hidroxi-pirazol előállítása

3 g 2-klór-3-(etil-tio-metil)-4-metánszulfonil-benzoésavat, 0,72 g kálium-karbonátot, 50 ml t-pentanol, 1,95 g N,N'-diciklohexil-karbodiimidet és 1-etil-5-pirazolon 25 t%-os t-pentanolos oldatából 4,5 g-ot összekevertünk és az elegyet –70 és 80 °C közötti hőmérsékleten hevítve – négy órán át kevertettük, ezután lehűtöttük és csökkentett nyomáson bepároltuk. A maradékhoz 200 ml vizet adtunk, a nem oldódó részeket kiszűrtük, a szűrletet kloroformmal mostuk, majd hidrogén-kloridot adtunk a vizes fázishoz és az elegyet kloroformmal extraháltuk. Az extraktumot szárítottuk, az oldószert kidesztilláltuk; így a célterméket nyerstermékként kaptuk. A nyers-terméket etanolból átkristályosítottuk; így 1,88 g tisztított terméket kaptunk, amelynek olvadáspontja 142–145 °C volt.

#### 5. példa

4-[2-Klór-3-(etánszulfonil-metil)-4-metánszulfonil-benzoil]-1-etil-5-hidroxi-pirazol előállítása

A 4. példa szerint előállított vegyületből 0,5 g-ot szobahőmérsékleten feloldottunk egy oldatban, amely 30 ml triklór-metánt és 30 ml THF-et tartalmazott, majd jégfürdőben való hűtés közben hozzáadtunk 2,2 ekvivalensnyi m-klór-perbenzoésavat. Az elegy hőmérsékletét fokozatosan engedték visszamelegedni szobahőmérsékletre és egy napon át kevertettük, majd kidesztilláltuk az oldószert és a keletkezett kristályokat kiszűrtük és etil-éterrel mostuk; így 2,2 g-ot kaptunk a céltermékből, amelynek olvadáspontja 133–135 °C volt.

#### 6. példa

4-(2-Klór-3-etánszulfonil-4-metánszulfonil-benzoil)-1-etil-5-hidroxi-pirazol előállítása

A 4. példa szerint előállított vegyületből 0,45 g-ot feloldottunk 30 ml dioxánban, majd hozzáadtunk 0,21 g nátrium-bromit-trihidrátot. Az elegyet szobahőmérsékleten harminc percen át kevertettük, ezután vizet adtunk hozzá, az elegyet kloroformmal extraháltuk és szárítottuk, s az oldószert kidesztillálása után nyers-terméket kaptunk. A nyers-terméket oszlopkromatográfián tisztítottuk, eluensként kloroformot és etanol elegyét alkalmazva; így 0,2 g-ot kaptunk a céltermékből, amely olajos anyag volt.

## 7. példa

4-[2,4-Diklór-3-(metoxi-karbonil)-benzoi]-1-etil-5-hidroxi-pirazol előállítás

A 2. példa szerint jártunk el, a céltermék olvadáspontja 167–170 °C volt.

## 8. példa

5-[Benzil-oxi]-4-(2,4-diklór-3-(metoxi-karbonil)-benzoi)-1-etil-pirazol előállítás

A 7. példa szerint előállított vegyületből 0,3 g-ot és 0,1 g trietil-amint feloldottunk 13 ml benzolban, 0,15 g bezilbromidot adtunk hozzá, majd az így kapott oldatot harminc percen át szobahőmérsékleten, majd három órán át 50 °C hőmérsékleten kevertettük. Ezután a nem oldódó részeket kiszűrtük, s a szűrletet csökkentett nyomáson bepároltuk. A maradékot szilikagéles oszlopkromatográfiával tisztítottuk, eluensként benzol és etil-acetát elegyét alkalmazva; így 0,15 g-ot kaptunk a céltermékből olajos anyag alakjában.

## 9. példa

5-Hidroxi-4-[4-metánszulfonil-3-(metoxi-metil)-2-metil-benzoi]-3-(metoxi-metil)-1-metil-pirazol előállítás

(A) 5-[4-Metánszulfonil-3-(metoxi-metil)-2-metil-benzoi-oxi]-3-(metoxi-metil)-1-metil-pirazol előállítás

8 ml vizes oldathoz, amely 0,5 g (85%) kálium-hidroxidot és 12 ml kloroformot tartalmazott 1,9 g 5-hidrox-3-(metoxi-metil)-1-metil-pirazolt adtunk, majd 4-metánszulfonil-3-(metoxi-metil)-2-metil-benzoi-kloridot adtunk az így kapott elegyhez, amelyet szobahőmérsékleten három órán át kevertettünk. A reakcióelegyet kloroformmal extraháltuk, a kloroformos oldatot vízzel mostuk és szárítottuk, így gyakorlatilag a mennyiségi arálynak megfelelő mennyiségű cím szerinti közterméket kaptunk olajos anyagként.

(B) 5-Hidroxi-4-[4-metánszulfonil-3-(metoxi-metil)-2-metil-benzoi]-3-(metoxi-metil)-1-metil-pirazol előállítás

Az (A) lépésben kapott köztermékből 3,0 g-ot, 2,7 g kálium-karbonátot és 8 ml dioxánt tartalmazó elegyet 120 °C hőmérsékleten három és fél órán át

kevertettünk, majd hozzáadtunk 20 ml vizet és az elegyet hagytuk lehűlni. A reakcióoldatot kloroformmal mostuk, hidrogén-kloriddal savanyítottuk, majd kloroformmal extraháltuk. Az extraktumot vízzel mostuk és szárítottuk. 1,8 g nyersterméket kaptunk, amelyet etanolból átkristályosítottunk; így 1,2 g célterméket kaptunk, amelynek olvadáspontja 100–104 °C volt.

## 10. példa

4-[3-(Acetoxi-metil)-2-klór-4-metánszulfonil-benzoi]-1-etil-5-hidroxi-pirazol előállítás

A 2. példa szerint jártunk el, a termék olvadáspontja 140–144 °C volt.

## 11. példa

4-[2-Klór-3-(hidrox-metil)-4-metánszulfonil-benzoi]-1-etil-5-hidroxi-pirazol előállítás

A 10. példa szerint előállított vegyületből 0,3 g-ot tartalmazó 30 ml metanolos oldathoz 5 ml vizes oldatot adtunk, amely 0,1 g (93%) nátrium-hidroxidot tartalmazott és az elegyet szobahőmérsékleten két órán át kevertettük, majd a metanolt csökkentett nyomáson kidesztilláltuk és a maradékhoz hidrogén-kloridot adtunk. A kivált terméket kiszűrtük, így 0,2 g-ot kaptunk a céltermékből, amelynek olvadáspontja 70–76 °C volt.

## 12. példa

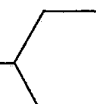
4-[2-Klór-4-metánszulfonil-3-(metoxi-karbonil-benzoi)-1-etil-5-hidroxi-pirazol-nátriumsó előállítás

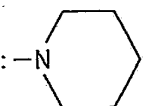
0,42 g nátrium-hidroxid (95%-os) 10 ml vízzel készített oldathoz 3,87 g 4-[2-klór-4-metánszulfonil-3-(metoxi-karbonil-benzoi)-1-etil-5-hidroxi-pirazot adtunk, majd az elegyet szobahőmérsékleten 1 óra hosszán kevertettük. Ezután a vizet csökkentett nyomáson ledesztilláltuk; maradékként 4,1 g cím szerinti vegyületet kaptunk.

Az 1–12. példákban leírt módon állíthatók elő egyebek között az 8225. táblázatban felsorolt (I) általános képletű vegyületek; 1–69. sorszámmal adjuk közülük 69 vegyület azonosító adatait a 3–4. táblázatokban (a konkrét példák termékeiét is). Az 5. táblázatban alkalmazott egyes szimbólumok jelentése a következő:

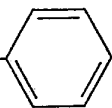
Ms:  $-\text{SO}_2\text{CH}_3$ ,

Y4: ,

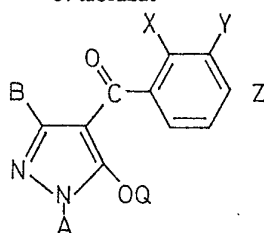
Y6: ,

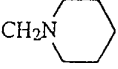
Y14: ,

Q1:  $-\text{CH}_2-$  ,

Q3:  $-\text{SO}_2-$    $-\text{CH}_3$

3. táblázat



| Vegyület száma | A    | B | X  | Y                                                                                                     | Z                  | Q                  | Olvadáspont (°C) |
|----------------|------|---|----|-------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------|--------------------|------------------|
| 1              | Me   | H | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                                                                   | SO <sub>2</sub> Me | H                  | Olajos anyag     |
| 2              | Me   | H | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                                                                   | SO <sub>2</sub> Me | CH <sub>2</sub> Ph | Olajos anyag     |
| 3              | Et   | H | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                                                                   | SO <sub>2</sub> Me | H                  | 116~118          |
| 4              | i-Pr | H | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                                                                   | SO <sub>2</sub> Me | H                  | Olajos anyag     |
| 5              | Me   | H | Me | CO <sub>2</sub> H                                                                                     | SO <sub>2</sub> Me | H                  | 274~274,5        |
| 6              | Me   | H | Me | CO <sub>2</sub> Me                                                                                    | SO <sub>2</sub> Me | H                  | 119~201          |
| 7              | Et   | H | Me | CO <sub>2</sub> Me                                                                                    | SO <sub>2</sub> Me | H                  | 150~152          |
| 8              | Me   | H | Me | CO <sub>2</sub> Et                                                                                    | SO <sub>2</sub> Me | H                  | 174~174,5        |
| 9              | Et   | H | Me | CO <sub>2</sub> Me                                                                                    | SO <sub>2</sub> Me | H                  | 78~81            |
| 10             | Me   | H | Me | CO <sub>2</sub> Pr-i                                                                                  | SO <sub>2</sub> Me | H                  | 192~194          |
| 11             | Et   | H | Me | CO <sub>2</sub> Pr-i                                                                                  | SO <sub>2</sub> Me | H                  | 125~128          |
| 12             | Me   | H | Cl | CO <sub>2</sub> Me                                                                                    | Cl                 | H                  | 123~126          |
| 13             | Me   | H | Cl | CO <sub>2</sub> Me                                                                                    | Cl                 | p-Ts               | Olajos anyag     |
| 14             | Me   | H | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                                                                   | SO <sub>2</sub> Me | H                  | 178~179          |
| 15             | Et   | H | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                                                                   | SO <sub>2</sub> Me | H                  | Olajos anyag     |
| 16             | i-Pr | H | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                                                                   | SO <sub>2</sub> Me | H                  | Olajos anyag     |
| 17             | H    | H | H  | CH <sub>2</sub> OEt                                                                                   | SO <sub>2</sub> Me | H                  | Olajos anyag     |
| 18             | Me   | H | Me | CHMeOMe                                                                                               | SO <sub>2</sub> Me | H                  | 238~240          |
| 19             | Et   | H | Me | CHMeOMe                                                                                               | SO <sub>2</sub> Me | H                  | 138~141          |
| 20             | Me   | H | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                                                                   | SO <sub>2</sub> Me | H                  | 189~190          |
| 21             | Et   | H | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                                                                   | SO <sub>2</sub> Me | H                  | 151~154          |
| 22             | i-Pr | H | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                                                                   | SO <sub>2</sub> Me | H                  | 142~144          |
| 23             | Et   | H | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                                                                                 | SO <sub>2</sub> Me | H                  | 125~127          |
| 24             | Me   | H | Me | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                   | SO <sub>2</sub> Me | H                  | 114~117          |
| 25             | Et   | H | Me | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                   | SO <sub>2</sub> Me | H                  | 122~124          |
| 26             | Me   | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                  | SO <sub>2</sub> Me | H                  | 157~161          |
| 27             | Et   | H | Cl | CH <sub>2</sub> SEt                                                                                   | SO <sub>2</sub> Me | H                  | 142~145          |
| 28             | Et   | H | Cl | CH <sub>2</sub> SOEt                                                                                  | SO <sub>2</sub> Me | H                  | Olajos anyag     |
| 29             | Et   | H | Cl | CH <sub>2</sub> SOEt                                                                                  | SO <sub>2</sub> Me | H                  | 133~135          |
| 30             | Et   | H | Me | CO <sub>2</sub> Pr-n                                                                                  | SO <sub>2</sub> Me | H                  | Olajos anyag     |
| 31             | Me   | H | Cl | CH <sub>2</sub> N  | SO <sub>2</sub> Me | H                  | Olajos anyag     |
| 32             | Me   | H | Me | CO <sub>2</sub>    | SO <sub>2</sub> Me | H                  | 220~222          |
| 33             | Et   | H | Me | CO <sub>2</sub>    | SO <sub>2</sub> Me | H                  | 179~183          |
| 34             | Me   | H | Cl | CO <sub>2</sub> Me                                                                                    | SO <sub>2</sub> Me | H                  | 183~185          |

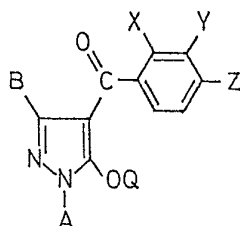
| Vegyület száma | A    | B                   | X   | Y                                                  | Z                  | Q                      | Olvadáspont (°C) |
|----------------|------|---------------------|-----|----------------------------------------------------|--------------------|------------------------|------------------|
| 35             | Et   | H                   | Cl  | CO <sub>2</sub> Me                                 | SO <sub>2</sub> Me | H                      | 174–176          |
| 36             | Pr-i | H                   | Cl  | CO <sub>2</sub> Me                                 | SO <sub>2</sub> Me | H                      | 138–140          |
| 37             | Et   | NH                  | Cl  | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH              | SO <sub>2</sub> Me | H                      | 161–164          |
| 38             | Me   | H                   | Cl  | CH <sub>2</sub> OAm-n                              | SO <sub>2</sub> Me | H                      | Olajos anyag     |
| 39             | Et   | H                   | Me  | CH <sub>2</sub> OMe                                | SO <sub>2</sub> Me | K <sup>+</sup>         | 180–190          |
| 40             | Et   | H                   | Me  | CH <sub>2</sub> OMe                                | SO <sub>2</sub> Me | Na <sup>+</sup>        | 210–216          |
| 41             | Et   | H                   | Me  | CH <sub>2</sub> OMe                                | SO <sub>2</sub> Me | NH <sub>3</sub> + Pr-i | 95–102           |
| 42             | Me   | H                   | OMe | CH <sub>2</sub> OMe                                | SO <sub>2</sub> Me | H                      | 195–198          |
| 43             | Me   | H                   | Cl  | CO <sub>2</sub> Pr-i                               | SO <sub>2</sub> Me | H                      | 117–119          |
| 44             | Et   | H                   | Cl  | CO <sub>2</sub> Pr-i                               | SO <sub>2</sub> Me | H                      | 141–143          |
| 45             | Me   | H                   | Cl  | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>   | SO <sub>2</sub> Me | H                      | 167–170          |
| 46             | Et   | H                   | Me  | CH <sub>2</sub> OMe                                | SO <sub>2</sub> Me | 1/2 Ca <sup>2+</sup>   | 232–242          |
| 47             | Pr-i | H                   | Me  | CO <sub>2</sub> Me                                 | SO <sub>2</sub> Me | H                      | 116–121          |
| 48             | Me   | H                   | OMe | CH <sub>2</sub> OMe                                | SO <sub>2</sub> Me | H                      | 154–157          |
| 49             | Et   | H                   | Me  | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | SO <sub>2</sub> Me | H                      | 149–152          |
| 50             | Et   | H                   | OMe | CO <sub>2</sub> Me                                 | SO <sub>2</sub> Me | H                      | 172–175          |
| 51             | Et   | H                   | Cl  | CO <sub>2</sub> Me                                 | Cl                 | H                      | 167–170          |
| 52             | Et   | H                   | Cl  | CO <sub>2</sub> Me                                 | Cl                 | CH <sub>2</sub> -Ph    | Olajos anyag     |
| 53             | Pr-i | H                   | Cl  | CO <sub>2</sub> MeCl                               | Cl                 | H                      | 144–151          |
| 54             | Pr-i | H                   | Cl  | CO <sub>2</sub> Me                                 | Cl                 | CH <sub>2</sub> -Ph    | 104–110          |
| 55             | Me   | CH <sub>2</sub> OMe | Me  | CH <sub>2</sub> OMe                                | SO <sub>2</sub> Me | H                      | 100–104          |
| 56             | Et   | H                   | Cl  | CH <sub>2</sub> CN                                 | SO <sub>2</sub> Me | H                      | 235–239          |
| 57             | Et   | H                   | Cl  | CH <sub>2</sub> OAc                                | SO <sub>2</sub> Me | H                      | 140–144          |
| 58             | Et   | H                   | Cl  | CH <sub>2</sub> OH                                 | SO <sub>2</sub> Me | H                      | 70–76            |
| 59             | Et   | H                   | Me  | CO <sub>2</sub> Me                                 | SMe                | H                      | 142–146          |
| 60             | Et   | H                   | Cl  | CH <sub>2</sub> OMe                                | Cl                 | H                      | 102–104          |
| 61             | Et   | H                   | Cl  | CO <sub>2</sub> Et                                 | SO <sub>2</sub> Me | H                      | 100–104          |
| 62             | Et   | H                   | Me  | CH <sub>2</sub> OMe                                | SMe                | H                      | Olajos anyag     |
| 63             | Me   | H                   | Cl  | CH <sub>2</sub> OMe                                | Cl                 | H                      | 141–144          |
| 64             | Et   | H                   | Cl  | CH=CHOMe<br>(transz)                               | SO <sub>2</sub> Me | H                      | 165–171          |
| 65             | Pr-i | H                   | Cl  | CO <sub>2</sub> Et                                 | SO <sub>2</sub> Me | H                      | 123–126          |
| 66             | Et   | H                   | OMe | CH <sub>2</sub> OMe                                | SO <sub>2</sub> Me | H                      | Olajos anyag     |
| 67             | Et   | H                   | Me  | CHMeOEt                                            | SO <sub>2</sub> Me | H                      | Olajos anyag     |
| 68             | Et   | H                   | Me  | CH <sub>2</sub> OMe                                | SO <sub>2</sub> Me | H                      | Olajos anyag     |
| 69             | Et   | H                   | Cl  | CON(Et) <sub>2</sub>                               | SO <sub>2</sub> Me | H                      | 94–97            |

4. táblázat

| Vegyület száma | <sup>1</sup> H-NMR (δ ppm) [oldószer]                                                                                                              |
|----------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 1              | 2,47 (3H, s), 3,22 (3H, s), 3,50 (3H, s), 3,69 (3H, s), 4,96 (2H, s), 7,30 (1H, s), 7,78 (2H, A–B q), 10,9 (1H) [CDCl <sub>3</sub> ]               |
| 2              | 2,41 (3H, s), 3,17 (3H, s), 3,50 (3H, s), 4,94 (2H, s), 5,53 (2H, s), 7,30–8,12 (8H, m) [CDCl <sub>3</sub> ]                                       |
| 3              | 1,44 (3H, t), 2,48 (3H, s), 3,23 (3H, s), 3,51 (3H, s), 4,07 (2H, q), 4,98 (2H, s), 7,36 (1H, s), 7,82 (2H, A–B q) [CDCl <sub>3</sub> ]            |
| 4              | 1,48 (6H, d), 2,47 (3H, s), 3,19 (3H, s), 3,48 (3H, s), 4,53 (1H, m), 4,92 (2H, s), 7,18 (1H, s), 7,69 (2H, A–B q), 9,57 (1H) [CDCl <sub>3</sub> ] |

| Vegyület száma | <sup>1</sup> H-NMR (δ ppm) [oldószer]                                                                                                                                               |
|----------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 13             | 2,43 (3H, s), 3,78 (3H, s), 3,94 (3H, s), 7,24–7,81 (7H, m) [CDCl <sub>3</sub> ]                                                                                                    |
| 15             | 1,07 (3H, t), 2,27 (3H, s), 3,01 (3H, s), 3,30–3,65 (5H, m), 4,77 (2H, s), 6,99 (1H, s), 7,48 (2H, A–B q), 8,22 (1H, s) [CDCl <sub>3</sub> ]                                        |
| 28             | 1,45 (3H, t), 3,04 (2H, q), 4,05 (2H, q), 4,91 (2H, q), 7,29 (1H, s), 7,70 (1H, s), 7,85 (2H, q) [CDCl <sub>3</sub> ]                                                               |
| 30             | 0,91–2,03 (8H, m), 2,41 (3H, s), 3,20 (3H, s), 3,91–4,47 (4H, m), 7,36–8,08 (4H, m) [CDCl <sub>3</sub> ]                                                                            |
| 31             | 0,90–2,17 (6H, m), 2,17–3,10 (4H, m), 3,37 (3H, s), 3,49 (3H, s), 4,31 (2H, széles s), 5,31 (1H, széles s), 7,21 (1H, s), 7,22–800 (2H, m) [CDCl <sub>3</sub> ]                     |
| 16             | 1,26 (3H, t), 1,49 (3H, d), 2,49 (3H, s), 3,24 (3H, s), 3,69 (2H, q), 4,59 (1H, m), 5,00 (2H, s), 7,28–8,14 (4H, m) [CDCl <sub>3</sub> ]                                            |
| 17             | 1,27 (3H, t), 1,67 (3H, s), 2,42 (3H, s), 3,23 (3H, s), 3,63 (3H, s), 3,68 (2H, q), 5,02 (2H, s), 7,7 (1H, s), 7,75 (2H, A–B q) [CDCl <sub>3</sub> ]                                |
| 52             | 1,14 (3H, t), 3,80 (2H, q), 3,88 (3H, s), 5,45 (2H, s), 7,15–7,47 (8H, m) [CDCl <sub>3</sub> ]                                                                                      |
| 62             | 1,45 (3H, t), 2,49 (6H, széles s), 3,44 (3H, s), 4,03 (2H, q), 4,66 (2H, s), 7,29 (2H, q), 7,39 (1H, s)                                                                             |
| 66             | 1,47 (3H, t), 3,29 (3H, s), 3,51 (3H, s), 3,82 (3H, s), 4,09 (2H, q), 5,00 (2H, s), 7,50 (1H, s), 7,84 (2H, A–B q), 7,96 (1H, s) [CDCl <sub>3</sub> ]                               |
| 67             | 1,07–1,67 (9H, m), 2,59 (3H, s), 3,17 (3H, s), 3,42 (2H, t), 3,96 (2H, t), 5,61 (1H, q), 7,27 (1H, s), 7,61 (2H, A–B q), 9,66 (1H, széles s) [CDCl <sub>3</sub> ]                   |
| 68             | 1,09 (3H, t), 1,5 (3H, t), 2,55 (3H, s), 3,16 (3H, s), 3,27 (3H, s), 3,70–4,20 (4H, m), 5,13–5,36 (1H, m), 7,14 (1H, s), 7,60 (2H, A–B q), 9,46 (1H, széles s) [CDCl <sub>3</sub> ] |

5. táblázat



| A  | B  | X  | Y                                    | Z   | Q  |
|----|----|----|--------------------------------------|-----|----|
| Me | H  | Cl | COOMe                                | MeS | H  |
| Me | H  | Cl | COOMe                                | Ms  | H  |
| Me | H  | Cl | COOMe                                | Ms  | Q1 |
| Me | H  | Cl | COOMe                                | Ms  | Q3 |
| Me | Me | Cl | COOMe                                | Ms  | H  |
| Me | H  | Cl | COOEt                                | MeS | H  |
| Me | H  | Cl | COOEt                                | Ms  | H  |
| Me | H  | Cl | COOEt                                | Ms  | Q1 |
| Me | Me | Cl | COOEt                                | Ms  | H  |
| Me | H  | Cl | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | MeS | H  |
| Me | H  | Cl | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | Ms  | H  |
| Me | H  | Cl | COOMe                                | Cl  | H  |
| Me | H  | Cl | COOMe                                | Cl  | Q1 |
| Me | H  | Cl | COOMe                                | Cl  | Q3 |
| Me | H  | Cl | COOEt                                | Cl  | H  |
| Me | H  | Cl | COOEt                                | Cl  | Q1 |

| A  | B  | X  | Y                                                                   | Z   | Q  |
|----|----|----|---------------------------------------------------------------------|-----|----|
| Me | H  | Cl | COOEt                                                               | Cl  | Q3 |
| Me | H  | Cl | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                | Cl  | H  |
| Me | H  | Cl | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                | Cl  | Q1 |
| Me | H  | Cl | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                | Cl  | Q3 |
| Me | H  | Cl | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                  | MeS | H  |
| Me | H  | Cl | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                  | Ms  | H  |
| Me | H  | Cl | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                  | Ms  | Q1 |
| Me | Me | Cl | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                  | Ms  | H  |
| Me | H  | Cl | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                  | Cl  | H  |
| Me | H  | Cl | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                  | Cl  | Q1 |
| Me | H  | Cl | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                  | Cl  | Q3 |
| Me | H  | Cl | COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                                    | Ms  | H  |
| Me | H  | Cl | COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                                    | Cl  | H  |
| Me | H  | Cl | COOCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | Ms  | H  |
| Me | H  | Cl | COOCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | Cl  | H  |
| Me | H  | Cl | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Ms  | H  |
| Me | H  | Cl | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl  | H  |
| Me | H  | Cl | COOC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                                 | Ms  | H  |
| Me | H  | Cl | COOC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                                 | Cl  | H  |
| Me | H  | Cl | CONEt <sub>2</sub>                                                  | Ms  | H  |
| Me | H  | Cl | CONEt <sub>2</sub>                                                  | Cl  | H  |
| Me | H  | Cl | CON [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub>               | Ms  | H  |
| Me | H  | Cl | CON [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub>               | Cl  | H  |
| Me | H  | Me | COOMe                                                               | MeS | H  |
| Me | H  | Me | COOMe                                                               | Ms  | H  |
| Me | H  | Me | COOMe                                                               | Ms  | Q1 |
| Me | H  | Me | COOMe                                                               | Ms  | Q3 |
| Me | Me | Me | COOMe                                                               | Ms  | H  |
| Me | H  | Me | COOEt                                                               | MeS | H  |
| Me | H  | Me | COOEt                                                               | Ms  | H  |
| Me | H  | Me | COOEt                                                               | Ms  | Q1 |
| Me | Me | Me | COOEt                                                               | Ms  | H  |
| Me | H  | Me | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                | MeS | H  |
| Me | Me | Me | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                | Ms  | H  |
| Me | H  | Me | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                | Ms  | H  |
| Me | H  | Me | COOMe                                                               | Cl  | H  |
| Me | H  | Me | COOMe                                                               | Cl  | Q1 |
| Me | H  | Me | COOMe                                                               | Cl  | Q3 |
| Me | H  | Me | COOEt                                                               | Cl  | H  |
| Me | H  | Me | COOEt                                                               | Cl  | Q1 |
| Me | H  | Me | COOEt                                                               | Cl  | Q3 |
| Me | H  | Me | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                | Cl  | H  |
| Me | H  | Me | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                | Cl  | Q1 |
| Me | H  | Me | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                | Cl  | Q3 |
| Me | H  | Me | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                  | MeS | H  |

| A  | B  | X   | Y                                                     | Z   | Q  |
|----|----|-----|-------------------------------------------------------|-----|----|
| Me | H  | Me  | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms  | H  |
| Me | H  | Me  | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms  | Q1 |
| Me | Me | Me  | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms  | H  |
| Me | H  | Me  | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl  | H  |
| Me | H  | Me  | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl  | Q1 |
| Me | H  | Me  | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl  | Q3 |
| Me | H  | Me  | COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                      | Ms  | H  |
| Me | H  | Me  | COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                      | Cl  | H  |
| Me | H  | Me  | COOCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | Ms  | H  |
| Me | H  | Me  | COOCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | Cl  | H  |
| Me | H  | Me  | COOCH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Ms  | H  |
| Me | H  | Me  | COOCH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl  | H  |
| Me | H  | Me  | COOC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                   | Ms  | H  |
| Me | H  | Me  | COOC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                   | Cl  | H  |
| Me | H  | Me  | CONEt <sub>2</sub>                                    | Ms  | H  |
| Me | H  | Me  | CONEt <sub>2</sub>                                    | Cl  | H  |
| Me | H  | Me  | CON [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> | Ms  | H  |
| Me | H  | Me  | CON [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> | Cl  | H  |
| Me | H  | OMe | COOMe                                                 | MeS | H  |
| Me | H  | OMe | COOMe                                                 | Ms  | H  |
| Me | H  | OMe | COOMe                                                 | Ms  | Q1 |
| Me | H  | OMe | COOMe                                                 | Ms  | Q3 |
| Me | Me | OMe | COOMe                                                 | Ms  | H  |
| Me | H  | OMe | COOEt                                                 | MeS | H  |
| Me | H  | OMe | COOEt                                                 | Ms  | H  |
| Me | H  | OMe | COOEt                                                 | Ms  | Q1 |
| Me | Me | OMe | COOEt                                                 | Ms  | H  |
| Me | H  | OMe | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | MeS | H  |
| Me | H  | OMe | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Ms  | H  |
| Me | Me | OMe | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Ms  | H  |
| Me | H  | OMe | COOMe                                                 | Cl  | H  |
| Me | H  | OMe | COOMe                                                 | Cl  | Q1 |
| Me | H  | OMe | COOMe                                                 | Cl  | Q3 |
| Me | H  | OMe | COOEt                                                 | Cl  | H  |
| Me | H  | OMe | COOEt                                                 | Cl  | Q1 |
| Me | H  | OMe | COOEt                                                 | Cl  | Q3 |
| Me | H  | OMe | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Cl  | H  |
| Me | H  | OMe | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Cl  | Q1 |
| Me | H  | OMe | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Cl  | Q3 |
| Me | H  | OMe | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | MeS | H  |
| Me | H  | OMe | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms  | H  |
| Me | H  | OMe | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms  | Q1 |
| Me | Me | OMe | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms  | H  |
| Me | H  | OMe | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl  | H  |
| Me | H  | OMe | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl  | Q1 |

| A  | B | X                                  | Y                                                     | Z   | Q              |
|----|---|------------------------------------|-------------------------------------------------------|-----|----------------|
| Me | H | OMe                                | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl  | Q <sup>3</sup> |
| Me | H | OMe                                | COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                      | Ms  | H              |
| Me | H | OMe                                | COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                      | Cl  | H              |
| Me | H | OMe                                | COOCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | Ms  | H              |
| Me | H | OMe                                | COOCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | Cl  | H              |
| Me | H | OMe                                | COOCH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Ms  | H              |
| Me | H | OMe                                | COOCH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl  | H              |
| Me | H | OMe                                | COOC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                   | Ms  | H              |
| Me | H | OMe                                | COOC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                   | Cl  | H              |
| Me | H | OMe                                | CONEt <sub>2</sub>                                    | Ms  | H              |
| Me | H | OMe                                | CONEt <sub>2</sub>                                    | Cl  | H              |
| Me | H | OMe                                | CON [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> | Ms  | H              |
| Me | H | OMe                                | CON [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> | Cl  | H              |
| Me | H | Br                                 | COOMe                                                 | Ms  | H              |
| Me | H | Br                                 | COOMe                                                 | Cl  | H              |
| Me | H | Br                                 | COOEt                                                 | Ms  | H              |
| Me | H | Br                                 | COOEt                                                 | Cl  | H              |
| Me | H | Br                                 | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Ms  | H              |
| Me | H | Br                                 | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Cl  | H              |
| Me | H | Br                                 | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms  | H              |
| Me | H | Br                                 | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl  | H              |
| Me | H | Br                                 | CONEt <sub>2</sub>                                    | Ms  | H              |
| Me | H | Br                                 | CON [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> | Ms  | H              |
| Me | H | OEt                                | COOMe                                                 | Ms  | H              |
| Me | H | OEt                                | COOMe                                                 | Cl  | H              |
| Me | H | OEt                                | COOEt                                                 | Ms  | H              |
| Me | H | OEt                                | COOEt                                                 | Cl  | H              |
| Me | H | OEt                                | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Ms  | H              |
| Me | H | OEt                                | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Cl  | H              |
| Me | H | OEt                                | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms  | H              |
| Me | H | OEt                                | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl  | H              |
| Me | H | OEt                                | CONEt <sub>2</sub>                                    | Ms  | H              |
| Me | H | OEt                                | CON [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> | Ms  | H              |
| Me | H | OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | COOMe                                                 | Ms  | H              |
| Me | H | OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | COOMe                                                 | Cl  | H              |
| Me | H | OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | COOEt                                                 | Ms  | H              |
| Me | H | OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | COOEt                                                 | Cl  | H              |
| Me | H | OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Ms  | H              |
| Me | H | OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Cl  | H              |
| Me | H | OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms  | H              |
| Me | H | OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl  | H              |
| Me | H | OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CONEt <sub>2</sub>                                    | Ms  | H              |
| Me | H | OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CON [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> | Ms  | H              |
| Et | H | Cl                                 | COOMe                                                 | MeS | H              |
| Et | H | Cl                                 | COOMe                                                 | Ms  | H              |

| A  | B  | X  | Y                                                     | Z   | Q  |
|----|----|----|-------------------------------------------------------|-----|----|
| Et | H  | Cl | COOMe                                                 | Ms  | Q1 |
| Et | H  | Cl | COOMe                                                 | Ms  | Q3 |
| Et | Me | Cl | COOMe                                                 | Ms  | H  |
| Et | H  | Cl | COOEt                                                 | MeS | H  |
| Et | H  | Cl | COOEt                                                 | Ms  | H  |
| Et | H  | Cl | COOEt                                                 | Ms  | Q1 |
| Et | Me | Cl | COOEt                                                 | Ms  | H  |
| Et | H  | Cl | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | MeS | H  |
| Et | H  | Cl | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Ms  | H  |
| Et | Me | Cl | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Ms  | H  |
| Et | H  | Cl | COOMe                                                 | Cl  | H  |
| Et | H  | Cl | COOMe                                                 | Cl  | Q1 |
| Et | H  | Cl | COOMe                                                 | Cl  | Q3 |
| Et | H  | Cl | COOEt                                                 | Cl  | H  |
| Et | H  | Cl | COOEt                                                 | Cl  | Q1 |
| Et | H  | Cl | COOEt                                                 | Cl  | Q3 |
| Et | H  | Cl | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Cl  | H  |
| Et | H  | Cl | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Cl  | Q1 |
| Et | H  | Cl | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Cl  | Q3 |
| Et | H  | Cl | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | MeS | H  |
| Et | H  | Cl | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms  | H  |
| Et | H  | Cl | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms  | Q1 |
| Et | Me | Cl | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms  | H  |
| Et | H  | Cl | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl  | H  |
| Et | H  | Cl | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl  | Q1 |
| Et | H  | Cl | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl  | Q3 |
| Et | H  | Cl | COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                      | Ms  | H  |
| Et | H  | Cl | COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                      | Cl  | H  |
| Et | H  | Cl | COOCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | Ms  | H  |
| Et | H  | Cl | COOCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | Cl  | H  |
| Et | H  | Cl | COOCH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Ms  | H  |
| Et | H  | Cl | COOCH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl  | H  |
| Et | H  | Cl | COOC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                   | Ms  | H  |
| Et | H  | Cl | COOC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                   | Cl  | H  |
| Et | H  | Cl | CONEt <sub>2</sub>                                    | Ms  | H  |
| Et | H  | Cl | CONEt <sub>2</sub>                                    | Cl  | H  |
| Et | H  | Cl | CON [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> | Ms  | H  |
| Et | H  | Cl | CON [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> | Cl  | H  |
| Et | H  | Me | COOMe                                                 | MeS | H  |
| Et | H  | Me | COOMe                                                 | Ms  | H  |
| Et | H  | Me | COOMe                                                 | Ms  | Q1 |
| Et | H  | Me | COOMe                                                 | Ms  | Q3 |
| Et | Me | Me | COOMe                                                 | Ms  | H  |
| Et | H  | Me | COOEt                                                 | MeS | H  |
| Et | H  | Me | COOEt                                                 | Ms  | H  |

| A  | B  | X   | Y                                                     | Z   | Q  |
|----|----|-----|-------------------------------------------------------|-----|----|
| Et | H  | Me  | COOEt                                                 | Ms  | Q1 |
| Et | Me | Me  | COOEt                                                 | Ms  | H  |
| Et | H  | Me  | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | MeS | H  |
| Et | H  | Me  | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Ms  | H  |
| Et | Me | Me  | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Ms  | H  |
| Et | H  | Me  | COOMe                                                 | Cl  | H  |
| Et | H  | Me  | COOMe                                                 | Cl  | Q1 |
| Et | H  | Me  | COOMe                                                 | Cl  | Q3 |
| Et | H  | Me  | COOEt                                                 | Cl  | H  |
| Et | H  | Me  | COOEt                                                 | Cl  | Q1 |
| Et | H  | Me  | COOEt                                                 | Cl  | Q3 |
| Et | H  | Me  | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Cl  | H  |
| Et | H  | Me  | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Cl  | Q1 |
| Et | H  | Me  | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Cl  | Q3 |
| Et | H  | Me  | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | MeS | H  |
| Et | H  | Me  | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms  | H  |
| Et | H  | Me  | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms  | Q1 |
| Et | Me | Me  | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms  | H  |
| Et | H  | Me  | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl  | H  |
| Et | H  | Me  | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl  | Q1 |
| Et | H  | Me  | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl  | Q3 |
| Et | H  | Me  | COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                      | Ms  | H  |
| Et | H  | Me  | COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                      | Cl  | H  |
| Et | H  | Me  | COOCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | Ms  | H  |
| Et | H  | Me  | COOCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | Cl  | H  |
| Et | H  | Me  | COOCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | Ms  | H  |
| Et | H  | Me  | COOCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | Cl  | H  |
| Et | H  | Me  | COOC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                   | Ms  | H  |
| Et | H  | Me  | COOC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                   | Cl  | H  |
| Et | H  | Me  | CONEt <sub>2</sub>                                    | Ms  | H  |
| Et | H  | Me  | CONEt <sub>2</sub>                                    | Cl  | H  |
| Et | H  | Me  | CON [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> | Ms  | H  |
| Et | H  | Me  | CON [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> | Cl  | H  |
| Et | H  | OMe | COOMe                                                 | MeS | H  |
| Et | H  | OMe | COOMe                                                 | Ms  | H  |
| Et | H  | OMe | COOMe                                                 | Ms  | Q1 |
| Et | H  | OMe | COOMe                                                 | Ms  | Q3 |
| Et | Me | OMe | COOMe                                                 | Ms  | H  |
| Et | H  | OMe | COOEt                                                 | MeS | H  |
| Et | H  | OMe | COOEt                                                 | Ms  | H  |
| Et | H  | OMe | COOEt                                                 | Ms  | Q1 |
| Et | Me | OMe | COOEt                                                 | Ms  | H  |
| Et | H  | OMe | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | MeS | H  |
| Et | H  | OMe | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Ms  | H  |
| Et | Me | OMe | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Ms  | H  |

| A  | B  | X   | Y                                                     | Z     | Q  |
|----|----|-----|-------------------------------------------------------|-------|----|
| Et | H  | OMe | COOMe                                                 | Cl    | H  |
| Et | H  | OMe | COOMe                                                 | Cl    | Q1 |
| Et | H  | OMe | COOMe                                                 | Cl    | Q3 |
| Et | H  | OMe | COOEt                                                 | Cl    | H  |
| Et | H  | OMe | COOEt                                                 | Cl    | Q1 |
| Et | H  | OMe | COOEt                                                 | Cl    | Q3 |
| Et | H  | OMe | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Cl    | H  |
| Et | H  | OMe | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Cl    | Q1 |
| Et | H  | OMe | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Cl    | Q3 |
| Et | H  | OMe | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | MeS H |    |
| Et | H  | OMe | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms    | Q1 |
| Et | Me | OMe | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms    | H  |
| Et | H  | OMe | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl    | H  |
| Et | H  | OMe | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl    | Q1 |
| Et | H  | OMe | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl    | Q3 |
| Et | H  | OMe | COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                      | Ms    | H  |
| Et | H  | OMe | COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                      | Cl    | H  |
| Et | H  | OMe | COOCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | Ms    | H  |
| Et | H  | OMe | COOCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | Cl    | H  |
| Et | H  | OMe | COOCH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Ms    | H  |
| Et | H  | OMe | COOCH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl    | H  |
| Et | H  | OMe | COOC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                   | Ms    | H  |
| Et | H  | OMe | COOC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                   | Cl    | H  |
| Et | H  | OMe | CONEt <sub>2</sub>                                    | Ms    | H  |
| Et | H  | OMe | CONEt <sub>2</sub>                                    | Cl    | H  |
| Et | H  | OMe | CON [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> | Ms    | H  |
| Et | H  | OMe | CON [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> | Cl    | H  |
| Et | H  | Br  | COOMe                                                 | Ms    | H  |
| Et | H  | Br  | COOMe                                                 | Cl    | H  |
| Et | H  | Br  | COOEt                                                 | Ms    | H  |
| Et | H  | Br  | COOEt                                                 | Cl    | H  |
| Et | H  | Br  | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Ms    | H  |
| Et | H  | Br  | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Cl    | H  |
| Et | H  | Br  | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms    | H  |
| Et | H  | Br  | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl    | H  |
| Et | H  | Br  | CONEt <sub>2</sub>                                    | Ms    | H  |
| Et | H  | Br  | CON [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> | Ms    | H  |
| Et | H  | OEt | COOMe                                                 | Ms    | H  |
| Et | H  | OEt | COOMe                                                 | Cl    | H  |
| Et | H  | OEt | COOEt                                                 | Ms    | H  |
| Et | H  | OEt | COOEt                                                 | Cl    | H  |
| Et | H  | OEt | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Ms    | H  |
| Et | H  | OEt | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms    | H  |
| Et | H  | OEt | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl    | H  |
| Et | H  | OEt | CONEt <sub>2</sub>                                    | Ms    | H  |

| A    | B  | X                                  | Y                                                     | Z    | Q  |
|------|----|------------------------------------|-------------------------------------------------------|------|----|
| Et   | H  | OEt                                | CON [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> | Ms   | H  |
| Et   | H  | OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | COOMe                                                 | Ms   | H  |
| Et   | H  | OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | COOMe                                                 | Cl   | H  |
| Et   | H  | OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | COOEt                                                 | Ms   | H  |
| Et   | H  | OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | COOEt                                                 | Cl   | H  |
| Et   | H  | OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Ms   | H  |
| Et   | H  | OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Cl   | H  |
| Et   | H  | OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms   | H  |
| Et   | H  | OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl   | H  |
| Et   | H  | OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CONEt <sub>2</sub>                                    | Ms   | H  |
| Et   | H  | OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CON [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> | Ms   | H  |
| i-Pr | H  | Cl                                 | COOMe                                                 | MeS  | H  |
| i-Pr | H  | Cl                                 | COOMe                                                 | MeSO | H  |
| i-Pr | H  | Cl                                 | COOMe                                                 | Ms   | H  |
| i-Pr | H  | Cl                                 | COOMe                                                 | Ms   | Q1 |
| i-Pr | H  | Cl                                 | COOMe                                                 | Ms   | Q3 |
| i-Pr | Me | Cl                                 | COOMe                                                 | Ms   | H  |
| i-Pr | H  | Cl                                 | COOEt                                                 | MeS  | H  |
| i-Pr | H  | Cl                                 | COOEt                                                 | Ms   | H  |
| i-Pr | H  | Cl                                 | COOEt                                                 | Ms   | Q1 |
| i-Pr | Me | Cl                                 | COOEt                                                 | Ms   | H  |
| i-Pr | H  | Cl                                 | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | MeS  | H  |
| i-Pr | H  | Cl                                 | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Ms   | H  |
| i-Pr | Me | Cl                                 | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Ms   | H  |
| i-Pr | H  | Cl                                 | COOMe                                                 | Cl   | H  |
| i-Pr | H  | Cl                                 | COOMe                                                 | Cl   | Q1 |
| i-Pr | H  | Cl                                 | COOMe                                                 | Cl   | Q3 |
| i-Pr | H  | Cl                                 | COOEt                                                 | Cl   | H  |
| i-Pr | H  | Cl                                 | COOEt                                                 | Cl   | Q1 |
| i-Pr | H  | Cl                                 | COOEt                                                 | Cl   | Q3 |
| i-Pr | H  | Cl                                 | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Cl   | H  |
| i-Pr | H  | Cl                                 | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Cl   | Q1 |
| i-Pr | H  | Cl                                 | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Cl   | Q3 |
| i-Pr | H  | Cl                                 | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | MeS  | H  |
| i-Pr | H  | Cl                                 | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms   | H  |
| i-Pr | H  | Cl                                 | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms   | Q1 |
| i-Pr | Me | Cl                                 | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms   | H  |
| i-Pr | H  | Cl                                 | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl   | H  |
| i-Pr | H  | Cl                                 | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl   | Q1 |
| i-Pr | H  | Cl                                 | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl   | Q3 |
| i-Pr | H  | Cl                                 | COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                      | Ms   | H  |
| i-Pr | H  | Cl                                 | COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                      | Cl   | H  |
| i-Pr | H  | Cl                                 | COOCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | Ms   | H  |
| i-Pr | H  | Cl                                 | COOCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | Cl   | H  |
| i-Pr | H  | Cl                                 | COOCH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Ms   | H  |

| A    | B  | X  | Y                                                     | Z   | Q  |
|------|----|----|-------------------------------------------------------|-----|----|
| i-Pr | H  | Cl | COOCH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl  | H  |
| i-Pr | H  | Cl | COOC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                   | Ms  | H  |
| i-Pr | H  | Cl | COOC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                   | Cl  | H  |
| i-Pr | H  | Cl | CONEt <sub>2</sub>                                    | Ms  | H  |
| i-Pr | H  | Cl | CONEt <sub>2</sub>                                    | Cl  | H  |
| i-Pr | H  | Cl | CON [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> | Ms  | H  |
| i-Pr | H  | Cl | CON [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> | Cl  | H  |
| i-Pr | H  | Me | COOMe                                                 | MeS | H  |
| i-Pr | H  | Me | COOMe                                                 | Ms  | H  |
| i-Pr | H  | Me | COOMe                                                 | Ms  | Q1 |
| i-Pr | H  | Me | COOMe                                                 | Ms  | Q3 |
| i-Pr | Me | Me | COOMe                                                 | Ms  | H  |
| i-Pr | H  | Me | COOEt                                                 | MeS | H  |
| i-Pr | H  | Me | COOEt                                                 | Ms  | H  |
| i-Pr | H  | Me | COOEt                                                 | Ms  | Q1 |
| i-Pr | Me | Me | COOEt                                                 | Ms  | H  |
| i-Pr | H  | Me | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | MeS | H  |
| i-Pr | H  | Me | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Ms  | H  |
| i-Pr | Me | Me | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Ms  | H  |
| i-Pr | H  | Me | COOMe                                                 | Cl  | H  |
| i-Pr | H  | Me | COOMe                                                 | Cl  | Q1 |
| i-Pr | H  | Me | COOMe                                                 | Cl  | Q3 |
| i-Pr | H  | Me | COOEt                                                 | Cl  | H  |
| i-Pr | H  | Me | COOEt                                                 | Cl  | Q1 |
| i-Pr | H  | Me | COOEt                                                 | Cl  | Q3 |
| i-Pr | H  | Me | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Cl  | H  |
| i-Pr | H  | Me | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Cl  | Q1 |
| i-Pr | H  | Me | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Cl  | Q3 |
| i-Pr | H  | Me | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | MeS | H  |
| i-Pr | H  | Me | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms  | H  |
| i-Pr | H  | Me | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms  | Q1 |
| i-Pr | Me | Me | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms  | H  |
| i-Pr | H  | Me | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl  | H  |
| i-Pr | H  | Me | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl  | Q1 |
| i-Pr | H  | Me | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl  | Q3 |
| i-Pr | H  | Me | COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                      | Ms  | H  |
| i-Pr | H  | Me | COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                      | Cl  | H  |
| i-Pr | H  | Me | COOCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | Ms  | H  |
| i-Pr | H  | Me | COOCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | Cl  | H  |
| i-Pr | H  | Me | COOCH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>  | Ms  | H  |
| i-Pr | H  | Me | COOCH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>  | Cl  | H  |
| i-Pr | H  | Me | COOC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                   | Ms  | H  |
| i-Pr | H  | Me | COOC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                   | Cl  | H  |
| i-Pr | H  | Me | CONEt <sub>2</sub>                                    | Ms  | H  |
| i-Pr | H  | Me | CONEt <sub>2</sub>                                    | Cl  | H  |

| A    | B  | X   | Y                                                     | Z   | Q  |
|------|----|-----|-------------------------------------------------------|-----|----|
| i-Pr | H  | Me  | CON [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> | Ms  | H  |
| i-Pr | H  | Me  | CON [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> | Cl  | H  |
| i-Pr | H  | OMe | COOMe                                                 | MeS | H  |
| i-Pr | H  | OMe | COOMe                                                 | Ms  | H  |
| i-Pr | H  | OMe | COOMe                                                 | Ms  | Q1 |
| i-Pr | H  | OMe | COOMe                                                 | Ms  | Q3 |
| i-Pr | Me | OMe | COOMe                                                 | Ms  | H  |
| i-Pr | H  | OMe | COOEt                                                 | MeS | H  |
| i-Pr | H  | OMe | COOEt                                                 | Ms  | H  |
| i-Pr | H  | OMe | COOEt                                                 | Ms  | Q1 |
| i-Pr | Me | OMe | COOEt                                                 | Ms  | H  |
| i-Pr | H  | OMe | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | MeS | H  |
| i-Pr | H  | OMe | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Ms  | H  |
| i-Pr | Me | OMe | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Ms  | H  |
| i-Pr | H  | OMe | COOMe                                                 | Cl  | H  |
| i-Pr | H  | OMe | COOMe                                                 | Cl  | Q1 |
| i-Pr | H  | OMe | COOMe                                                 | Cl  | Q3 |
| i-Pr | H  | OMe | COOEt                                                 | Cl  | H  |
| i-Pr | H  | OMe | COOEt                                                 | Cl  | Q1 |
| i-Pr | H  | OMe | COOEt                                                 | Cl  | Q3 |
| i-Pr | H  | OMe | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Cl  | H  |
| i-Pr | H  | OMe | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Cl  | Q1 |
| i-Pr | H  | OMe | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Cl  | Q3 |
| i-Pr | H  | OMe | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | MeS | H  |
| i-Pr | H  | OMe | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms  | H  |
| i-Pr | H  | OMe | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms  | Q1 |
| i-Pr | Me | OMe | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms  | H  |
| i-Pr | H  | OMe | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl  | H  |
| i-Pr | H  | OMe | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl  | Q1 |
| i-Pr | H  | OMe | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl  | Q3 |
| i-Pr | H  | OMe | COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                      | Ms  | H  |
| i-Pr | H  | OMe | COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                      | Cl  | H  |
| i-Pr | H  | OMe | COOCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | Ms  | H  |
| i-Pr | H  | OMe | COOCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | Cl  | H  |
| i-Pr | H  | OMe | COOCH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Ms  | H  |
| i-Pr | H  | OMe | COOCH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl  | H  |
| i-Pr | H  | OMe | COOC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                   | Ms  | H  |
| i-Pr | H  | OMe | COOC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                   | Cl  | H  |
| i-Pr | H  | OMe | CONEt <sub>2</sub>                                    | Ms  | H  |
| i-Pr | H  | OMe | CONEt <sub>2</sub>                                    | Cl  | H  |
| i-Pr | H  | OMe | CON [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> | Ms  | H  |
| i-Pr | H  | OMe | CON [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> | Cl  | H  |
| i-Pr | H  | Br  | COOMe                                                 | Ms  | H  |
| i-Pr | H  | Br  | COOMe                                                 | Cl  | H  |
| i-Pr | H  | Br  | COOEt                                                 | Ms  | H  |

| A    | B | X                                  | Y                                                     | Z  | Q |
|------|---|------------------------------------|-------------------------------------------------------|----|---|
| i-Pr | H | Br                                 | COOEt                                                 | Cl | H |
| i-Pr | H | Br                                 | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Ms | H |
| i-Pr | H | Br                                 | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Cl | H |
| i-Pr | H | Br                                 | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms | H |
| i-Pr | H | Br                                 | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl | H |
| i-Pr | H | Br                                 | CONEt <sub>2</sub>                                    | Ms | H |
| i-Pr | H | Br                                 | CON [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> | Ms | H |
| i-Pr | H | OEt                                | COOMe                                                 | Ms | H |
| i-Pr | H | OEt                                | COOMe                                                 | Cl | H |
| i-Pr | H | OEt                                | COOEt                                                 | Ms | H |
| i-Pr | H | OEt                                | COOEt                                                 | Cl | H |
| i-Pr | H | OEt                                | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Ms | H |
| i-Pr | H | OEt                                | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Cl | H |
| i-Pr | H | OEt                                | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms | H |
| i-Pr | H | OEt                                | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl | H |
| i-Pr | H | OEt                                | CONEt <sub>2</sub>                                    | Ms | H |
| i-Pr | H | OEt                                | CON [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> | Ms | H |
| i-Pr | H | OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | COOMe                                                 | Ms | H |
| i-Pr | H | OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | COOMe                                                 | Cl | H |
| i-Pr | H | OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | COOEt                                                 | Ms | H |
| i-Pr | H | OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | COOEt                                                 | Cl | H |
| i-Pr | H | OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Ms | H |
| i-Pr | H | OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Cl | H |
| i-Pr | H | OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Ms | H |
| i-Pr | H | OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | Cl | H |
| i-Pr | H | OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CONEt <sub>2</sub>                                    | Ms | H |
| i-Pr | H | OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CON [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> | Ms | H |
| Me   | H | Et                                 | COOMe                                                 | Ms | H |
| Me   | H | Et                                 | COOEt                                                 | Ms | H |
| Me   | H | Et                                 | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Ms | H |
| Me   | H | Et                                 | CONMe <sub>2</sub>                                    | Ms | H |
| Me   | H | Et                                 | CONEt <sub>2</sub>                                    | Ms | H |
| Me   | H | Et                                 | COOC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>                      | Ms | H |
| Me   | H | i-Pr                               | COOMe                                                 | Ms | H |
| Me   | H | i-Pr                               | COOEt                                                 | Ms | H |
| Me   | H | i-Pr                               | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Ms | H |
| Me   | H | i-Pr                               | CONMe <sub>2</sub>                                    | Ms | H |
| Me   | H | i-Pr                               | CONEt <sub>2</sub>                                    | Ms | H |
| Me   | H | i-Pr                               | COOC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>                      | Ms | H |
| Me   | H | n-Pr                               | COOMe                                                 | Ms | H |
| Me   | H | n-Pr                               | COOEt                                                 | Ms | H |
| Me   | H | n-Pr                               | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | Ms | H |
| Me   | H | n-Pr                               | CONMe <sub>2</sub>                                    | Ms | H |
| Me   | H | n-Pr                               | CONEt <sub>2</sub>                                    | Ms | H |
| Me   | H | n-Pr                               | COOC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>                      | Ms | H |

| A    | B | X    | Y                                    | Z  | Q |
|------|---|------|--------------------------------------|----|---|
| Me   | H | I    | COOMe                                | Ms | H |
| Me   | H | I    | COOEt                                | Ms | H |
| Me   | H | I    | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | Ms | H |
| Me   | H | I    | CONMe <sub>2</sub>                   | Ms | H |
| Me   | H | I    | CONEt <sub>2</sub>                   | Ms | H |
| Me   | H | I    | COOC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>     | Ms | H |
| Et   | H | Et   | COOMe                                | Ms | H |
| Et   | H | Et   | COOEt                                | Ms | H |
| Et   | H | Et   | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | Ms | H |
| Et   | H | Et   | CONMe <sub>2</sub>                   | Ms | H |
| Et   | H | Et   | CONEt <sub>2</sub>                   | Ms | H |
| Et   | H | Et   | COOC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>     | Ms | H |
| Et   | H | i-Pr | COOMe                                | Ms | H |
| Et   | H | i-Pr | COOEt                                | Ms | H |
| Et   | H | i-Pr | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | Ms | H |
| Et   | H | i-Pr | CONMe <sub>2</sub>                   | Ms | H |
| Et   | H | i-Pr | CONEt <sub>2</sub>                   | Ms | H |
| Et   | H | i-Pr | COOC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>     | Ms | H |
| Et   | H | n-Pr | COOMe                                | Ms | H |
| Et   | H | n-Pr | COOEt                                | Ms | H |
| Et   | H | n-Pr | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | Ms | H |
| Et   | H | n-Pr | CONMe <sub>2</sub>                   | Ms | H |
| Et   | H | n-Pr | CONEt <sub>2</sub>                   | Ms | H |
| Et   | H | n-Pr | COOC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>     | Ms | H |
| Et   | H | I    | COOMe                                | Ms | H |
| Et   | H | I    | COOEt                                | Ms | H |
| Et   | H | I    | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | Ms | H |
| Et   | H | I    | CONMe <sub>2</sub>                   | Ms | H |
| Et   | H | I    | CONEt <sub>2</sub>                   | Ms | H |
| Et   | H | I    | COOC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>     | Ms | H |
| i-Pr | H | Et   | COOMe                                | Ms | H |
| i-Pr | H | Et   | COOEt                                | Ms | H |
| i-Pr | H | Et   | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | Ms | H |
| i-Pr | H | Et   | CONMe <sub>2</sub>                   | Ms | H |
| i-Pr | H | Et   | CONEt <sub>2</sub>                   | Ms | H |
| i-Pr | H | Et   | COOC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>     | Ms | H |
| i-Pr | H | i-Pr | COOMe                                | Ms | H |
| i-Pr | H | i-Pr | COOEt                                | Ms | H |
| i-Pr | H | i-Pr | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | Ms | H |
| i-Pr | H | i-Pr | CONMe <sub>2</sub>                   | Ms | H |
| i-Pr | H | i-Pr | CONEt <sub>2</sub>                   | Ms | H |
| i-Pr | H | i-Pr | COOC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>     | Ms | H |
| i-Pr | H | n-Pr | COOMe                                | Ms | H |
| i-Pr | H | n-Pr | COOEt                                | Ms | H |
| i-Pr | H | n-Pr | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | Ms | H |

| A    | B | X    | Y                                                   | Z   | Q |
|------|---|------|-----------------------------------------------------|-----|---|
| i-Pr | H | n-Pr | CONMe <sub>2</sub>                                  | Ms  | H |
| i-Pr | H | n-Pr | CONEt <sub>2</sub>                                  | Ms  | H |
| i-Pr | H | n-Pr | COOC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>                    | Ms  | H |
| i-Pr | H | I    | COOMe                                               | Ms  | H |
| i-Pr | H | I    | COOEt                                               | Ms  | H |
| i-Pr | H | I    | COOCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | Ms  | H |
| i-Pr | H | I    | CONMe <sub>2</sub>                                  | Ms  | H |
| i-Pr | H | I    | CONEt <sub>2</sub>                                  | Ms  | H |
| i-Pr | H | I    | COOC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>                    | Ms  | H |
| Me   | H | Me   | COOH                                                | Ms  | H |
| Me   | H | Cl   | COOH                                                | Ms  | H |
| Et   | H | Me   | COOH                                                | Ms  | H |
| Et   | H | Cl   | COOH                                                | Ms  | H |
| i-Pr | H | Me   | COOH                                                | Ms  | H |
| i-Pr | H | Cl   | COOH                                                | Ms  | H |
| Me   | H | Me   | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl               | Ms  | H |
| Me   | H | Me   | COOCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub>                  | Ms  | H |
| Me   | H | Me   | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> | Ms  | H |
| Me   | H | Cl   | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl               | Ms  | H |
| Me   | H | Cl   | COOCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub>                  | Ms  | H |
| Me   | H | OMe  | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl               | Ms  | H |
| Me   | H | OMe  | COOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                  | Ms  | H |
| Me   | H | OMe  | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> | Ms  | H |
| Et   | H | Me   | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl               | Ms  | H |
| Et   | H | Me   | COOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                  | Ms  | H |
| Et   | H | Me   | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> | Ms  | H |
| Et   | H | Cl   | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl               | Ms  | H |
| Et   | H | Cl   | COOCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub>                  | Ms  | H |
| Et   | H | Cl   | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> | Ms  | H |
| Et   | H | OMe  | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl               | Ms  | H |
| Et   | H | OMe  | COOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                  | Ms  | H |
| Et   | H | OMe  | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> | Ms  | H |
| i-Pr | H | Me   | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl               | Ms  | H |
| i-Pr | H | Me   | COOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                  | Ms  | H |
| i-Pr | H | Me   | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> | Ms  | H |
| i-Pr | H | Cl   | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl               | Ms  | H |
| i-Pr | H | Cl   | COOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                  | Ms  | H |
| i-Pr | H | Cl   | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> | MS  | H |
| i-Pr | H | OMe  | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> l                | Ms  | H |
| i-Pr | H | OMe  | COOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                  | Ms  | H |
| i-Pr | H | OMe  | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> | Ms  | H |
| Me   | H | Me   | CH <sub>2</sub> OH                                  | Ms  | H |
| Me   | H | Me   | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | H |
| Me   | H | Me   | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Cl  | H |
| Me   | H | Me   | CH <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | H |

| A  | B | X  | Y                                                   | Z   | Q  |
|----|---|----|-----------------------------------------------------|-----|----|
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | Q1 |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | Q1 |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | Q3 |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | Q3 |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | H  |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Cl  | H  |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | H  |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | Q1 |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | Q1 |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | Q3 |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | Q3 |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | H  |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Cl  | H  |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | MeS | H  |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | Q1 |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | Q3 |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OPr-n                               | Ms  | H  |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OPr-n                               | Cl  | H  |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OPr-n                               | MeS | H  |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C=CH               | Ms  | H  |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C=CH               | Cl  | H  |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C=CH               | MeS | H  |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | Ms  | H  |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | Cl  | H  |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | MeS | H  |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Br | Ms  | H  |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OAm-n                               | Ms  | H  |
| Me | H | Me | CHMeOH                                              | Ms  | H  |
| Me | H | Me | CHMeOMe                                             | Ms  | H  |
| Me | H | Me | CHMeOMe                                             | Cl  | H  |
| Me | H | Me | CHMeOMe                                             | MeS | H  |
| Me | H | Me | CHMeOMe                                             | Ms  | Q1 |
| Me | H | Me | CHMeOMe                                             | Ms  | Q3 |
| Me | H | Me | CHMeOEt                                             | Ms  | H  |
| Me | H | Me | CHMeOEt                                             | Cl  | H  |
| Me | H | Me | CHMeOEt                                             | MeS | H  |
| Me | H | Me | CHMeOEt                                             | Ms  | Q1 |
| Me | H | Me | CHMeOEt                                             | Ms  | Q3 |
| Me | H | Me | CHMeOPr-i                                           | Ms  | H  |
| Me | H | Me | CHMeOPr-i                                           | Cl  | H  |
| Me | H | Me | CHMeOPr-i                                           | MeS | H  |
| Me | H | Me | CHMeOPr-n                                           | Ms  | H  |
| Me | H | Me | CHMeOCH <sub>2</sub> C=CH                           | Ms  | H  |
| Me | H | Me | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl             | Ms  | H  |
| Me | H | Me | CMe <sub>2</sub> OH                                 | Ms  | H  |

| A  | B | X  | Y                                                    | Z   | Q |
|----|---|----|------------------------------------------------------|-----|---|
| Me | H | Me | CMe <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | H |
| Me | H | Me | CMe <sub>2</sub> OMe                                 | Cl  | H |
| Me | H | Me | CMe <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | H |
| Me | H | Me | CMe <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | H |
| Me | H | Me | CMe <sub>2</sub> OEt                                 | Cl  | H |
| Me | H | Me | CMe <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | H |
| Me | H | Me | CMe <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Ms  | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Cl  | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | MeS | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Ms  | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Cl  | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | MeS | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i                | Ms  | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i                | Cl  | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i                | MeS | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH                   | Ms  | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Ms  | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Cl  | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | MeS | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Ms  | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i                | Ms  | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms  | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Cl  | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | MeS | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt | Ms  | H |
| Me | H | Me | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe             | Ms  | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> -Y14                                 | Ms  | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> CN                                   | Ms  | H |
| Me | H | Me | CHMeCN                                               | Ms  | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Ms  | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Cl  | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> SMe                                  | MeS | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Ms  | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Cl  | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> SEt                                  | MeS | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> SOMe                                 | Ms  | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> SOEt                                 | Ms  | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Ms  | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Cl  | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | MeS | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Ms  | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Cl  | H |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | MeS | H |
| Me | H | Me | CHMeSMe                                              | Ms  | H |

| A  | B | X  | Y                                                   | Z   | Q  |
|----|---|----|-----------------------------------------------------|-----|----|
| Me | H | Me | CHMeSEt                                             | Ms  | H  |
| Me | H | Me | CHMeSO <sub>2</sub> Me                              | Ms  | H  |
| Me | H | Me | CHMeSO <sub>2</sub> Et                              | Ms  | H  |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OCOMe                               | Ms  | H  |
| Me | H | Me | CH <sub>2</sub> OCOEt                               | Ms  | H  |
| Me | H | Me | CHMeOCOMe                                           | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OH                                  | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Cl  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | Q1 |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | Q1 |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | Q3 |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | Q3 |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Cl  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | Q1 |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | Q1 |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | Q3 |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | Q3 |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Cl  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | MeS | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | Q1 |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | Q3 |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OPr-n                               | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OPr-n                               | Cl  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OPr-n                               | MeS | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH               | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH               | Cl  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH               | MeS | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | Cl  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | MeS | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Br | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> OAm-n                               | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CHMeOH                                              | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CHMeOMe                                             | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CHMeOMe                                             | Cl  | H  |
| Et | H | Me | CHMeOMe                                             | MeS | H  |
| Et | H | Me | CHMeOMe                                             | Ms  | Q1 |
| Et | H | Me | CHMeOMe                                             | Ms  | Q3 |
| Et | H | Me | CHMeOEt                                             | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CHMeOEt                                             | Cl  | H  |

| A  | B | X  | Y                                        | Z   | Q  |
|----|---|----|------------------------------------------|-----|----|
| Et | H | Me | CHMeOEt                                  | MeS | H  |
| Et | H | Me | CHMeOEt                                  | Ms  | Q1 |
| Et | H | Me | CHMeOEt                                  | Ms  | Q3 |
| Et | H | Me | CHMeOPr-i                                | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CHMeOPr-i                                | Cl  | H  |
| Et | H | Me | CHMeOPr-i                                | MeS | H  |
| Et | H | Me | CHMeOPr-n                                | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CHMeOCH <sub>2</sub> C≡CH                | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl  | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CMe <sub>2</sub> OH                      | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CMe <sub>2</sub> OMe                     | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CMe <sub>2</sub> OMe                     | Cl  | H  |
| Et | H | Me | CMe <sub>2</sub> OMe                     | MeS | H  |
| Et | H | Me | CMe <sub>2</sub> OEt                     | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CMe <sub>2</sub> OEt                     | Cl  | H  |
| Et | H | Me | CMe <sub>2</sub> OEt                     | MeS | H  |
| Et | H | Me | CMe <sub>2</sub> OPr-i                   | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe      | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe      | Cl  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe      | MeS | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt      | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt      | Cl  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt      | MeS | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i    | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i    | Cl  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i    | MeS | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH       | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe      | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe      | Cl  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe      | MeS | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt      | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> -Y14                     | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> CN                       | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CHMeCN                                   | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> SMe                      | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> SMe                      | Cl  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> SMe                      | MeS | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> SEt                      | Ms  | H  |
| Et | H | Me | CH <sub>2</sub> SEt                      | Cl  | H  |

| A    | B | X  | Y                                                   | Z   | Q  |
|------|---|----|-----------------------------------------------------|-----|----|
| Et   | H | Me | CH <sub>2</sub> SEt                                 | MeS | H  |
| Et   | H | Me | CH <sub>2</sub> SOMe                                | Ms  | H  |
| Et   | H | Me | CH <sub>2</sub> SOEt                                | Ms  | H  |
| Et   | H | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                  | Ms  | H  |
| Et   | H | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                  | Cl  | H  |
| Et   | H | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                  | MeS | H  |
| Et   | H | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                  | Ms  | H  |
| Et   | H | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                  | Cl  | H  |
| Et   | H | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                  | MeS | H  |
| Et   | H | Me | CHMeSMe                                             | Ms  | H  |
| Et   | H | Me | CHMeSEt                                             | Ms  | H  |
| Et   | H | Me | CHMeSO <sub>2</sub> Me                              | Ms  | H  |
| Et   | H | Me | CHMeSO <sub>2</sub> Et                              | Ms  | H  |
| Et   | H | Me | CH <sub>2</sub> OCOMe                               | Ms  | H  |
| Et   | H | Me | CH <sub>2</sub> OCOEt                               | Ms  | H  |
| Et   | H | Me | CHMeOCOMe                                           | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OH                                  | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Cl  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | Q1 |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | Q1 |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | Q3 |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | Q3 |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Cl  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | Q1 |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | Q1 |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | Q3 |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | Q3 |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Cl  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | MeS | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | Q1 |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | Q3 |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OPr-n                               | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OPr-n                               | Cl  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OPr-n                               | MeS | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH               | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH               | Cl  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH               | MeS | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | Cl  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | MeS | H  |

| A    | B | X  | Y                                                    | Z   | Q  |
|------|---|----|------------------------------------------------------|-----|----|
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Br  | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> Am-n)Am-n           | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CHMeOH                                               | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CHMeOMe                                              | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CHMeOMe                                              | Cl  | H  |
| Pr-i | H | Me | CHMeOMe                                              | MeS | H  |
| Pr-i | H | Me | CHMeOMe                                              | Ms  | Q1 |
| Pr-i | H | Me | CHMeOMe                                              | Ms  | Q3 |
| Pr-i | H | Me | CHMeOEt                                              | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CHMeOEt                                              | Cl  | H  |
| Pr-i | H | Me | CHMeOEt                                              | MeS | H  |
| Pr-i | H | Me | CHMeOEt                                              | Ms  | Q1 |
| Pr-i | H | Me | CHMeOEt                                              | Ms  | Q3 |
| Pr-i | H | Me | CHMeOPr-i                                            | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CHMeOPr-i                                            | Cl  | H  |
| Pr-i | H | Me | CHMeOPr-i                                            | MeS | H  |
| Pr-i | H | Me | CHMeOPr-n                                            | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CHMeOCH <sub>2</sub> C≡CH                            | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl              | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CMe <sub>2</sub> OH                                  | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CMe <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CMe <sub>2</sub> OMe                                 | Cl  | H  |
| Pr-i | H | Me | CMe <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | H  |
| Pr-i | H | Me | CMe <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CMe <sub>2</sub> OEt                                 | Cl  | H  |
| Pr-i | H | Me | CMe <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | H  |
| Pr-i | H | Me | CMe <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Cl  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | MeS | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Cl  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | MeS | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i                | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i                | Cl  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i                | MeS | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH                   | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Cl  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | MeS | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i                | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Cl  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | MeS | H  |

| A    | B | X  | Y                                                    | Z   | Q  |
|------|---|----|------------------------------------------------------|-----|----|
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe             | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> -Y14                                 | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> CN                                   | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CHMeCN                                               | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Cl  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> SMe                                  | MeS | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Cl  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> SEt                                  | MeS | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> SOMe                                 | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> SOEt                                 | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Cl  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | MeS | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Cl  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | MeS | H  |
| Pr-i | H | Me | CHMeSMe                                              | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CHMeSEt                                              | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CHMeSO <sub>2</sub> Me                               | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CHMeSO <sub>2</sub> Et                               | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OCOMe                                | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CH <sub>2</sub> OCOEt                                | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Me | CHMeOCOMe                                            | Ms  | H  |
| Me   | H | Cl | CH <sub>2</sub> OC                                   | Ms  | H  |
| Me   | H | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | H  |
| Me   | H | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Cl  | H  |
| Me   | H | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                  | MeS | H  |
| Me   | H | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | Q1 |
| Me   | H | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                  | MeS | Q1 |
| Me   | H | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | Q3 |
| Me   | H | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                  | MeS | Q3 |
| Me   | H | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | H  |
| Me   | H | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Cl  | H  |
| Me   | H | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                  | MeS | H  |
| Me   | H | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | Q1 |
| Me   | H | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                  | MeS | Q1 |
| Me   | H | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | Q3 |
| Me   | H | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                  | MeS | Q3 |
| Me   | H | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | Ms  | H  |
| Me   | H | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | Cl  | H  |
| Me   | H | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | MeS | H  |
| Me   | H | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | Ms  | Q1 |

| A  | B | X  | Y                                                   | Z   | Q  |
|----|---|----|-----------------------------------------------------|-----|----|
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | Q3 |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-n                               | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-n                               | Cl  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-n                               | MeS | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH               | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH               | Cl  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH               | MeS | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | Cl  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | MeS | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Br | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> OAm-n                               | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CHMeOH                                              | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CHMeOMe                                             | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CHMeOMe                                             | Cl  | H  |
| Me | H | Cl | CHMeOMe                                             | MeS | H  |
| Me | H | Cl | CHMeOMe                                             | Ms  | Q1 |
| Me | H | Cl | CHMeOMe                                             | Ms  | Q3 |
| Me | H | Cl | CHMeOEt                                             | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CHMeOEt                                             | Cl  | H  |
| Me | H | Cl | CHMeOEt                                             | MeS | H  |
| Me | H | Cl | CHMeOEt                                             | Ms  | Q1 |
| Me | H | Cl | CHMeOEt                                             | Ms  | Q3 |
| Me | H | Cl | CHMeOPr-i                                           | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CHMeOPr-i                                           | Cl  | H  |
| Me | H | Cl | CHMeOPr-i                                           | MeS | H  |
| Me | H | Cl | CHMeOPr-n                                           | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CHMeOCH <sub>2</sub> C≡CH                           | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl             | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CMe <sub>2</sub> OH                                 | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CMe <sub>2</sub> OMe                                | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CMe <sub>2</sub> OMe                                | Cl  | H  |
| Me | H | Cl | CMe <sub>2</sub> OMe                                | MeS | H  |
| Me | H | Cl | CMe <sub>2</sub> OEt                                | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CMe <sub>2</sub> OEt                                | Cl  | H  |
| Me | H | Cl | CMe <sub>2</sub> OEt                                | MeS | H  |
| Me | H | Cl | CMe <sub>2</sub> OPr-i                              | Cl  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                 | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                 | Cl  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                 | MeS | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                 | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                 | Cl  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                 | MeS | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i               | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i               | Cl  | H  |

| A  | B | X  | Y                                                    | Z   | Q  |
|----|---|----|------------------------------------------------------|-----|----|
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i                | MeS | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> EtOH                                 | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Cl  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                  | MeS | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Cl  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | MeS | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe             | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> -Y14                                 | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> CN                                   | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CHMeCN                                               | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Cl  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> SMe                                  | MeS | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Cl  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> SEt                                  | MeS | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> SOMe                                 | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> SOEt                                 | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Cl  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | MeS | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Cl  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | MeS | H  |
| Me | H | Cl | CHMeSMe                                              | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CHMeSEt                                              | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CHMeSO <sub>2</sub> Me                               | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CHMeSO <sub>2</sub> Et                               | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCOMe                                | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCOEt                                | Ms  | H  |
| Me | H | Cl | CHMeOCOMe                                            | Ms  | H  |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OH                                   | Ms  | H  |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | H  |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Cl  | H  |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                  | MeS | H  |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | Q1 |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                  | MeS | Q1 |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | Q3 |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                  | MeS | Q3 |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | H  |

| A  | B | X  | Y                                                   | Z   | Q  |
|----|---|----|-----------------------------------------------------|-----|----|
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Cl  | H  |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | H  |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | Q1 |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | Q1 |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | Q3 |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | Q3 |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | H  |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Cl  | H  |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | MeS | H  |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | Q1 |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | Q3 |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-n                               | Ms  | H  |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-n                               | Cl  | H  |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-n                               | MeS | H  |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH               | Ms  | H  |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH               | Cl  | H  |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH               | MeS | H  |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | Ms  | H  |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | Cl  | H  |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | MeS | H  |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Br | Ms  | H  |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OAm-n                               | Ms  | H  |
| Et | H | Cl | CHMeOH                                              | Ms  | H  |
| Et | H | Cl | CHMeOMe                                             | Ms  | H  |
| Et | H | Cl | CHMeOMe                                             | Cl  | H  |
| Et | H | Cl | CHMeOMe                                             | MeS | H  |
| Et | H | Cl | CHMeOMe                                             | Ms  | Q1 |
| Et | H | Cl | CHMeOMe                                             | Ms  | Q3 |
| Et | H | Cl | CHMeOEt                                             | Ms  | H  |
| Et | H | Cl | CHMeOEt                                             | Cl  | H  |
| Et | H | Cl | CHMeOEt                                             | MeS | H  |
| Et | H | Cl | CHMeOEt                                             | Ms  | Q1 |
| Et | H | Cl | CHMeOEt                                             | Ms  | Q3 |
| Et | H | Cl | CHMeOPr-i                                           | Ms  | H  |
| Et | H | Cl | CHMeOPr-i                                           | Cl  | H  |
| Et | H | Cl | CHMeOPr-i                                           | MeS | H  |
| Et | H | Cl | CHMeOPr-n                                           | Ms  | H  |
| Et | H | Cl | CHMeOCH <sub>2</sub> C≡CH                           | Ms  | H  |
| Et | H | Cl | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl             | Ms  | H  |
| Et | H | Cl | CME <sub>2</sub> OH                                 | Ms  | H  |
| Et | H | Cl | CME <sub>2</sub> OMe                                | Ms  | H  |
| Et | H | Cl | CME <sub>2</sub> OMe                                | Cl  | H  |
| Et | H | Cl | CME <sub>2</sub> OMe                                | MeS | H  |
| Et | H | Cl | CME <sub>2</sub> OEt                                | Ms  | H  |
| Et | H | Cl | CME <sub>2</sub> OEt                                | Cl  | H  |

| A  | B | X  | Y                                                    | Z   | Q |
|----|---|----|------------------------------------------------------|-----|---|
| Et | H | Cl | CME <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | H |
| Et | H | Cl | CME <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Ms  | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Cl  | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | MeS | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Ms  | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Cl  | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | MeS | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i                | Ms  | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i                | Cl  | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i                | MeS | H |
| Et | H | Cl | CHEtOH                                               | Ms  | H |
| Et | H | Cl | CHEtOMe                                              | Cl  | H |
| Et | H | Cl | CHEtOMe                                              | MS  | H |
| Et | H | Cl | CHEtOMe                                              | MeS | H |
| Et | H | Cl | CHEtOEt                                              | Ms  | H |
| Et | H | Cl | CHEtOPr-i                                            | Ms  | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms  | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Cl  | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | MeS | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt | Ms  | H |
| Et | H | Cl | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe             | Ms  | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> -Y14                                 | Ms  | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> CN                                   | Ms  | H |
| Et | H | Cl | CHMeCN                                               | Ms  | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Ms  | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Cl  | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> SMe                                  | MeS | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Ms  | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Cl  | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> SEt                                  | MeS | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> SOMe                                 | Ms  | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> SOMe                                 | Ms  | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Ms  | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Cl  | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | MeS | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Ms  | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Cl  | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | MeS | H |
| Et | H | Cl | CHMeSMe                                              | Ms  | H |
| Et | H | Cl | CHMeSEt                                              | Ms  | H |
| Et | H | Cl | CHMeSO <sub>2</sub> Me                               | Ms  | H |
| Et | H | Cl | CHMeSO <sub>2</sub> Et                               | Ms  | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCOMe                                | Ms  | H |
| Et | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCOEt                                | Ms  | H |

| A    | B | X  | Y                                                   | Z   | Q  |
|------|---|----|-----------------------------------------------------|-----|----|
| Et   | H | Cl | CHMeOCOMe                                           | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OH                                  | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Cl  | H  |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | H  |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | Q1 |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | Q1 |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | Q3 |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | Q3 |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Cl  | H  |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | H  |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | Q1 |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | Q1 |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | Q3 |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | Q3 |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Cl  | H  |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | MeS | H  |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | Q1 |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | Q3 |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-n                               | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-n                               | Cl  | H  |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-n                               | MeS | H  |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH               | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH               | Cl  | H  |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH               | MeS | H  |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | Cl  | H  |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | MeS | H  |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Br | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OAm-n                               | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Cl | CHMeOH                                              | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Cl | CHMeOMe                                             | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Cl | CHMeOMe                                             | Cl  | H  |
| Pr-i | H | Cl | CHMeOMe                                             | MeS | H  |
| Pr-i | H | Cl | CHMeOMe                                             | Ms  | Q1 |
| Pr-i | H | Cl | CHMeOMe                                             | Ms  | Q3 |
| Pr-i | H | Cl | CHMeOEt                                             | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Cl | CHMeOEt                                             | Cl  | H  |
| Pr-i | H | Cl | CHMeOEt                                             | MeS | H  |
| Pr-i | H | Cl | CHMeOEt                                             | Ms  | Q1 |
| Pr-i | H | Cl | CHMeOEt                                             | Ms  | Q3 |
| Pr-i | H | Cl | CHMeOPr-i                                           | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Cl | CHMeOPr-i                                           | Cl  | H  |

| A    | B | X  | Y                                                    | Z   | Q |
|------|---|----|------------------------------------------------------|-----|---|
| Pr-i | H | Cl | CHMeOPr-i                                            | MeS | H |
| Pr-i | H | Cl | CHMeOPr-n                                            | Ms  | H |
| Pr-i | H | Cl | CHMeOCH <sub>2</sub> C≡CH                            | Ms  | H |
| Pr-i | H | Cl | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl              | Ms  | H |
| Pr-i | H | Cl | CMe <sub>2</sub> OH                                  | Ms  | H |
| Pr-i | H | Cl | CMe <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | H |
| Pr-i | H | Cl | CMe <sub>2</sub> OMe                                 | Cl  | H |
| Pr-i | H | Cl | CMe <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | H |
| Pr-i | H | Cl | CMe <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | H |
| Pr-i | H | Cl | CMe <sub>2</sub> OEt                                 | Cl  | H |
| Pr-i | H | Cl | CMe <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | H |
| Pr-i | H | Cl | CMe <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Ms  | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Cl  | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | MeS | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Ms  | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Cl  | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | MeS | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i                | Ms  | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i                | Cl  | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i                | MeS | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH                   | Ms  | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Ms  | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Cl  | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | MeS | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Ms  | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i                | Ms  | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms  | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Cl  | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | MeS | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt | Ms  | H |
| Pr-i | H | Cl | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe             | Ms  | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> -Y14                                 | Ms  | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> CN                                   | Ms  | H |
| Pr-i | H | Cl | CHMeCN                                               | Ms  | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Ms  | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Cl  | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> SMe                                  | MeS | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Ms  | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Cl  | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> SEt                                  | MeS | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> SOMe                                 | Ms  | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> SOEt                                 | Ms  | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Ms  | H |
| Pr-i | H | Cl | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Cl  | H |

| A    | B | X   | Y                                                   | Z   | Q  |
|------|---|-----|-----------------------------------------------------|-----|----|
| Pr-i | H | Cl  | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                  | MeS | H  |
| Pr-i | H | Cl  | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                  | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Cl  | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                  | Cl  | H  |
| Pr-i | H | Cl  | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                  | MeS | H  |
| Pr-i | H | Cl  | CHMeSMe                                             | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Cl  | CHMeSEt                                             | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Cl  | CHMeSO <sub>2</sub> Me                              | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Cl  | CHMeSO <sub>2</sub> Et                              | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Cl  | CH <sub>2</sub> OCOMe                               | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Cl  | CH <sub>2</sub> OCOEt                               | Ms  | H  |
| Pr-i | H | Cl  | CHMeOCOMe                                           | Ms  | H  |
| Me   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OH                                  | Ms  | H  |
| Me   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | H  |
| Me   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Cl  | H  |
| Me   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | H  |
| Me   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | Q1 |
| Me   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | Q1 |
| Me   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | Q3 |
| Me   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | Q3 |
| Me   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | H  |
| Me   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Cl  | H  |
| Me   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | H  |
| Me   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | Q1 |
| Me   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | Q1 |
| Me   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | Q3 |
| Me   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | Q3 |
| Me   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | H  |
| Me   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Cl  | H  |
| Me   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | MeS | H  |
| Me   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | Q1 |
| Me   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | Q3 |
| Me   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-n                               | Ms  | H  |
| Me   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-n                               | Cl  | H  |
| Me   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-n                               | MeS | H  |
| Me   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH               | Ms  | H  |
| Me   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH               | Cl  | H  |
| Me   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH               | MeS | H  |
| Me   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | Ms  | H  |
| Me   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | Cl  | H  |
| Me   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | MeS | H  |
| Me   | H | MeO | CHMeOH                                              | Ms  | H  |
| Me   | H | MeO | CHMeOMe                                             | Ms  | H  |
| Me   | H | MeO | CHMeOMe                                             | Cl  | H  |
| Me   | H | MeO | CHMeOMe                                             | MeS | H  |
| Me   | H | MeO | CHMeOMe                                             | Ms  | Q1 |

| A  | B | X   | Y                                                    | Z   | Q  |
|----|---|-----|------------------------------------------------------|-----|----|
| Me | H | MeO | CHMeOMe                                              | Ms  | Q3 |
| Me | H | MeO | CHMeOEt                                              | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CHMeOEt                                              | Cl  | H  |
| Me | H | MeO | CHMeOEt                                              | MeS | H  |
| Me | H | MeO | CHMeOEt                                              | Ms  | Q1 |
| Me | H | MeO | CHMeOEt                                              | Ms  | Q3 |
| Me | H | MeO | CHMeOPr-i                                            | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CHMeOPr-i                                            | Cl  | H  |
| Me | H | MeO | CHMeOPr-i                                            | MeS | H  |
| Me | H | MeO | CHMeOPr-N                                            | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CHMeOCH <sub>2</sub> C≡CH                            | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl              | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CMe <sub>2</sub> OH                                  | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CMe <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CMe <sub>2</sub> OMe                                 | Cl  | H  |
| Me | H | MeO | CMe <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | H  |
| Me | H | MeO | CMe <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CMe <sub>2</sub> OEt                                 | Cl  | H  |
| Me | H | MeO | CMe <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | H  |
| Me | H | MeO | CMe <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Cl  | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | MeS | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Cl  | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | MeS | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i                | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i                | Cl  | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i                | MeS | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH                   | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Cl  | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | MeS | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i                | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Cl  | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | MeS | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe             | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> -Y14                                 | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> CN                                   | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CHMeCN                                               | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Cl  | H  |

| A  | B | X   | Y                                     | Z   | Q  |
|----|---|-----|---------------------------------------|-----|----|
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> SMe                   | MeS | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> SEt                   | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> SEt                   | Cl  | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> SEt                   | MeS | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> SOMe                  | Cl  | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> SOEt                  | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me    | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me    | Cl  | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me    | MeS | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et    | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et    | Cl  | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et    | MeS | H  |
| Me | H | MeO | CHMeSMe                               | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CHMeSEt                               | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CHMeSO <sub>2</sub> Me                | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CHMeSO <sub>2</sub> Et                | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> OCOMe                 | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CH <sub>2</sub> OCOEt                 | Ms  | H  |
| Me | H | MeO | CHMeOCOMe                             | Ms  | H  |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OH                    | Ms  | H  |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                   | Ms  | H  |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                   | Cl  | H  |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                   | MeS | H  |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                   | Ms  | Q1 |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                   | MeS | Q1 |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                   | Ms  | Q3 |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                   | MeS | Q3 |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OEi                   | Ms  | H  |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OEi                   | Cl  | H  |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OEi                   | MeS | H  |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OEi                   | Ms  | Q1 |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OEi                   | MeS | Q1 |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OEi                   | Ms  | Q3 |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OEi                   | MeS | Q3 |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i                 | Ms  | H  |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i                 | Cl  | H  |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i                 | MeS | H  |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i                 | Ms  | Q1 |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i                 | Ms  | Q3 |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-n                 | Ms  | H  |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-n                 | Cl  | H  |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-n                 | MeS | H  |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH | Ms  | H  |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH | Cl  | H  |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH | MeS | H  |

| A  | B | X   | Y                                                    | Z   | Q  |
|----|---|-----|------------------------------------------------------|-----|----|
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl  | Ms  | H  |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl  | Cl  | H  |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl  | MeS | H  |
| Et | H | MeO | CHMeOH                                               | Ms  | H  |
| Et | H | MeO | CHMeOMe                                              | Ms  | H  |
| Et | H | MeO | CHMeOMe                                              | Cl  | H  |
| Et | H | MeO | CHMeOMe                                              | MeS | H  |
| Et | H | MeO | CHMeOMe                                              | Ms  | Q1 |
| Et | H | MeO | CHMeOMe                                              | Ms  | Q3 |
| Et | H | MeO | CHMeOEt                                              | Ms  | H  |
| Et | H | MeO | CHMeOEt                                              | Cl  | H  |
| Et | H | MeO | CHMeOEt                                              | MeS | H  |
| Et | H | MeO | CHMeOEt                                              | Ms  | Q1 |
| Et | H | MeO | CHMeOEt                                              | Ms  | Q3 |
| Et | H | MeO | CHMeOPr-i                                            | Ms  | H  |
| Et | H | MeO | CHMeOPr-i                                            | Cl  | H  |
| Et | H | MeO | CHMeOPr-i                                            | MeS | H  |
| Et | H | MeO | CHMeOPr-n                                            | Ms  | H  |
| Et | H | MeO | CHMeOCH <sub>2</sub> C≡CH                            | Ms  | H  |
| Et | H | MeO | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCl             | Ms  | H  |
| Et | H | MeO | CMe <sub>2</sub> OH                                  | Ms  | H  |
| Et | H | MeO | CMe <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | H  |
| Et | H | MeO | CMe <sub>2</sub> OMe                                 | Cl  | H  |
| Et | H | MeO | CMe <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | H  |
| Et | H | MeO | CMe <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | H  |
| Et | H | MeO | CMe <sub>2</sub> OEt                                 | Cl  | H  |
| Et | H | MeO | CMe <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | H  |
| Et | H | MeO | CMe <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | H  |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Ms  | H  |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Cl  | H  |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | MeS | H  |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Ms  | H  |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Cl  | H  |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | MeS | H  |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i                | Ms  | H  |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i                | Cl  | H  |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i                | MeS | H  |
| Et | H | MeO | CHEtOH                                               | Ms  | H  |
| Et | H | MeO | CHEtOMe                                              | Ms  | H  |
| Et | H | MeO | CHEtOMe                                              | Cl  | H  |
| Et | H | MeO | CHEtOMe                                              | MeS | H  |
| Et | H | MeO | CHEtOEt                                              | Ms  | H  |
| Et | H | MeO | CHEtOPr-i                                            | Ms  | H  |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms  | H  |
| Et | H | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Cl  | H  |

| A    | B | X   | Y                                                    | Z   | Q  |
|------|---|-----|------------------------------------------------------|-----|----|
| Et   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | MeS | H  |
| Et   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt | Ms  | H  |
| Et   | H | MeO | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe             | Ms  | H  |
| Et   | H | MeO | CH <sub>2</sub> -Y14                                 | Ms  | H  |
| Et   | H | MeO | CH <sub>2</sub> CN                                   | Ms  | H  |
| Et   | H | MeO | CHMeCN                                               | Ms  | H  |
| Et   | H | MeO | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Ms  | H  |
| Et   | H | MeO | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Cl  | H  |
| Et   | H | MeO | CH <sub>2</sub> SMe                                  | MeS | H  |
| Et   | H | MeO | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Ms  | H  |
| Et   | H | MeO | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Cl  | H  |
| Et   | H | MeO | CH <sub>2</sub> SEt                                  | MeS | H  |
| Et   | H | MeO | CH <sub>2</sub> SOMe                                 | Ms  | H  |
| Et   | H | MeO | CH <sub>2</sub> SOEt                                 | Ms  | H  |
| Et   | H | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Ms  | H  |
| Et   | H | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Cl  | H  |
| Et   | H | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | MeS | H  |
| Et   | H | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Ms  | H  |
| Et   | H | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Cl  | H  |
| Et   | H | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | MeS | H  |
| Et   | H | MeO | CHMeSMe                                              | Ms  | H  |
| Et   | H | MeO | CHMeSEt                                              | Ms  | H  |
| Et   | H | MeO | CHMeSO <sub>2</sub> Me                               | Ms  | H  |
| Et   | H | MeO | CHMeSO <sub>2</sub> Et                               | Ms  | H  |
| Et   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OCOMe                                | Ms  | H  |
| Et   | H | MeO | CH <sub>2</sub> OCOEt                                | Ms  | H  |
| Et   | H | MeO | CHMeOCOMe                                            | Ms  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> OH                                   | Ms  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Cl  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                  | MeS | H  |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | Q1 |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                  | MeS | Q1 |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | Q3 |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                  | MeS | Q3 |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Cl  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                                  | MeS | H  |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | Q1 |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                                  | MeS | Q1 |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | Q3 |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                                  | MeS | Q3 |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | Ms  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | Cl  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | MeS | H  |

| A    | B | X   | Y                                                   | Z   | Q  |
|------|---|-----|-----------------------------------------------------|-----|----|
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | Q1 |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | Q3 |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-n                               | Ms  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-n                               | Cl  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-n                               | MeS | H  |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH               | Ms  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH               | Cl  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH               | MeS | H  |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | Ms  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | Cl  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | MeS | H  |
| Pr-i | H | MeO | CHMeOH                                              | Ms  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CHMeOMe                                             | Ms  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CHMeOMe                                             | Cl  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CHMeOMe                                             | MeS | H  |
| Pr-i | H | MeO | CHMeOMe                                             | Ms  | Q1 |
| Pr-i | H | MeO | CHMeOMe                                             | Ms  | Q3 |
| Pr-i | H | MeO | CHMeOEt                                             | Ms  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CHMeOEt                                             | Cl  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CHMeOEt                                             | MeS | H  |
| Pr-i | H | MeO | CHMeOEt                                             | Ms  | Q1 |
| Pr-i | H | MeO | CHMeOEt                                             | Ms  | Q3 |
| Pr-i | H | MeO | CHMeOPr-i                                           | Ms  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CHMeOPr-i                                           | Cl  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CHMeOPr-i                                           | MeS | H  |
| Pr-i | H | MeO | CHMeOPr-n                                           | Ms  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CHMeOCH <sub>2</sub> C≡CH                           | Ms  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl             | Ms  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CMe <sub>2</sub> OH                                 | Ms  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CMe <sub>2</sub> OMe                                | Ms  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CMe <sub>2</sub> OMe                                | Cl  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CMe <sub>2</sub> OMe                                | MeS | H  |
| Pr-i | H | MeO | CMe <sub>2</sub> OEt                                | Ms  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CMe <sub>2</sub> OEt                                | Cl  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CMe <sub>2</sub> OEt                                | MeS | H  |
| Pr-i | H | MeO | CMe <sub>2</sub> OPr-i                              | Ms  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                 | Ms  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                 | Cl  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                 | MeS | H  |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                 | Ms  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                 | Cl  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                 | MeS | H  |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i               | Ms  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i               | Cl  | H  |
| Pr-i | H | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i               | MeS | H  |

| A    | B  | X   | Y                                                                | Z   | Q  |
|------|----|-----|------------------------------------------------------------------|-----|----|
| Pr-i | H  | MeO | CH <sub>2</sub> EtOH                                             | Ms  | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                              | Ms  | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                              | Cl  | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                              | MeS | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CH <sub>2</sub> OE <sub>t</sub>                                  | Ms  | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i                                            | Ms  | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe             | Ms  | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe             | Cl  | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe             | MeS | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OE <sub>t</sub> | Ms  | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                         | Ms  | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CH <sub>2</sub> -Y14                                             | Ms  | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CH <sub>2</sub> CN                                               | Ms  | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CHMeCN                                                           | Ms  | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CH <sub>2</sub> SMe                                              | Ms  | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CH <sub>2</sub> SMe                                              | Cl  | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CH <sub>2</sub> SMe                                              | MeS | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CH <sub>2</sub> SE <sub>t</sub>                                  | Ms  | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CH <sub>2</sub> SE <sub>t</sub>                                  | Cl  | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CH <sub>2</sub> SE <sub>t</sub>                                  | MeS | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CH <sub>2</sub> SOMe                                             | Ms  | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CH <sub>2</sub> SOE <sub>t</sub>                                 | Ms  | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                               | Ms  | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                               | Cl  | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                               | MeS | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                               | Ms  | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                               | Cl  | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                               | MeS | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CHMeSMe                                                          | Ms  | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CHMeSE <sub>t</sub>                                              | Ms  | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CHMeSO <sub>2</sub> Me                                           | Ms  | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CHMeSO <sub>2</sub> Et                                           | Ms  | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CH <sub>2</sub> OCOMe                                            | Ms  | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CH <sub>2</sub> OCOEt                                            | Ms  | H  |
| Pr-i | H  | MeO | CHMeOCOMe                                                        | Ms  | H  |
| Me   | Me | Me  | CH <sub>2</sub> OH                                               | Ms  | H  |
| Me   | Me | Me  | CH <sub>2</sub> OMe                                              | Ms  | H  |
| Me   | Me | Me  | CH <sub>2</sub> OMe                                              | Cl  | H  |
| Me   | Me | Me  | CH <sub>2</sub> OMe                                              | MeS | H  |
| Me   | Me | Me  | CH <sub>2</sub> OMe                                              | Ms  | Q1 |
| Me   | Me | Me  | CH <sub>2</sub> OMe                                              | Cl  | Q1 |
| Me   | Me | Me  | CH <sub>2</sub> OMe                                              | MeS | Q1 |
| Me   | Me | Me  | CH <sub>2</sub> OMe                                              | Ms  | Q3 |
| Me   | Me | Me  | CH <sub>2</sub> OMe                                              | MeS | Q3 |
| Me   | Me | Me  | CH <sub>2</sub> OE <sub>t</sub>                                  | Ms  | H  |

| A  | B  | X  | Y                                                    | Z   | Q  |
|----|----|----|------------------------------------------------------|-----|----|
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Cl  | H  |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                  | MeS | H  |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | Q1 |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                  | MeS | Q1 |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | Q3 |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                  | MeS | Q3 |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | Cl  | H  |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | MeS | H  |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | Ms  | Q1 |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | Ms  | Q3 |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> OPr-n                                | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> =CH                 | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl  | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CHMeOH                                               | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CHMeOMe                                              | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CHMeOMe                                              | Cl  | H  |
| Me | Me | Me | CHMeOMe                                              | MeS | H  |
| Me | Me | Me | CHMeOMe                                              | Ms  | Q1 |
| Me | Me | Me | CHMeOMe                                              | Ms  | Q3 |
| Me | Me | Me | CHMeOEt                                              | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CHMeOEt                                              | Cl  | H  |
| Me | Me | Me | CHMeOEt                                              | MeS | H  |
| Me | Me | Me | CHMeOEt                                              | Ms  | Q1 |
| Me | Me | Me | CHMeOEt                                              | Ms  | Q3 |
| Me | Me | Me | CHMeOPr-i                                            | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CHMeOPr-i                                            | Cl  | H  |
| Me | Me | Me | CHMeOPr-i                                            | MeS | H  |
| Me | Me | Me | CHMeOPr-n                                            | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CHMeOCH <sub>2</sub> C=CH                            | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl              | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CME <sub>2</sub> OH                                  | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CME <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CME <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CME <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i                | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CHEtOH                                               | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CHEtOMe                                              | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CHEtOMe                                              | Cl  | H  |
| Me | Me | Me | CHEtOMe                                              | MeS | H  |
| Me | Me | Me | CHEtOEt                                              | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CHEtOPr-i                                            | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms  | H  |

| A  | B  | X  | Y                                                    | Z   | Q  |
|----|----|----|------------------------------------------------------|-----|----|
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Cl  | H  |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | MeS | H  |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe             | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> -Y14                                 | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> CN                                   | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CHMeCN                                               | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CHS <sub>2</sub> SMe                                 | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CHS <sub>2</sub> SMe                                 | Cl  | H  |
| Me | Me | Me | CHS <sub>2</sub> SMe                                 | MeS | H  |
| Me | Me | Me | CHS <sub>2</sub> SEt                                 | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CHS <sub>2</sub> SEt                                 | Cl  | H  |
| Me | Me | Me | CHS <sub>2</sub> SEt                                 | MeS | H  |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> SOMe                                 | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> SOEt                                 | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Cl  | H  |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | MeS | H  |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Cl  | H  |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | MeS | H  |
| Me | Me | Me | CHMeSMe                                              | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CHMeSEt                                              | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CHMeSO <sub>2</sub> Me                               | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CHMeSO <sub>2</sub> Et                               | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> OCOMe                                | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> OCOMEt                               | Ms  | H  |
| Me | Me | Me | CHMeOCOMe                                            | Ms  | H  |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> OH                                   | Ms  | H  |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | H  |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Cl  | H  |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                  | MeS | H  |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | Q1 |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Cl  | Q1 |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                  | MeS | Q1 |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | Q3 |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                  | MeS | Q3 |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | H  |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Cl  | H  |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                  | MeS | H  |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | Q1 |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                  | MeS | Q1 |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | Q3 |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                  | MeS | Q3 |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | Ms  | H  |

| A  | B  | X  | Y                                                    | Z   | Q  |
|----|----|----|------------------------------------------------------|-----|----|
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | Cl  | H  |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | MeS | H  |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | Ms  | Q1 |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | Ms  | Q3 |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> OPr-n                                | Ms  | H  |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH                | Ms  | H  |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl  | Ms  | H  |
| Et | Me | Me | CHMeOH                                               | Ms  | H  |
| Et | Me | Me | CHMeOMe                                              | Cl  | H  |
| Et | Me | Me | CHMeOMe                                              | Ms  | H  |
| Et | Me | Me | CHMeOMe                                              | MeS | H  |
| Et | Me | Me | CHMeOMe                                              | Ms  | Q1 |
| Et | Me | Me | CHMeOMe                                              | Ms  | Q3 |
| Et | Me | Me | CHMeOEt                                              | Ms  | H  |
| Et | Me | Me | CHMeOEt                                              | Cl  | H  |
| Et | Me | Me | CHMeOEt                                              | MeS | H  |
| Et | Me | Me | CHMeOEt                                              | Ms  | Q1 |
| Et | Me | Me | CHMeOEt                                              | Ms  | Q3 |
| Et | Me | Me | CHMeOPr-i                                            | Ms  | H  |
| Et | Me | Me | CHMeOPr-i                                            | Cl  | H  |
| Et | Me | Me | CHMeOPr-i                                            | MeS | H  |
| Et | Me | Me | CHMeOPr-n                                            | Ms  | H  |
| Et | Me | Me | CHMeOCH <sub>2</sub> C≡CH                            | Ms  | H  |
| Et | Me | Me | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl              | Ms  | H  |
| Et | Me | Me | CME <sub>2</sub> OH                                  | Ms  | H  |
| Et | Me | Me | CME <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | H  |
| Et | Me | Me | CME <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | H  |
| Et | Me | Me | CME <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | H  |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Ms  | H  |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Ms  | H  |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i                | Ms  | H  |
| Et | Me | Me | CHEtOH                                               | Ms  | H  |
| Et | Me | Me | CHEtOMe                                              | Ms  | H  |
| Et | Me | Me | CHEtOMe                                              | Cl  | H  |
| Et | Me | Me | CHEtOMe                                              | MeS | H  |
| Et | Me | Me | CHEtOEt                                              | Ms  | H  |
| Et | Me | Me | CHEtOPr-i                                            | Ms  | H  |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms  | H  |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Cl  | H  |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | MeS | H  |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt | Ms  | H  |
| Et | Me | Me | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe             | Ms  | H  |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> -Y14                                 | Ms  | H  |
| Et | Me | Me | CH <sub>2</sub> CN                                   | Ms  | H  |
| Et | Me | Me | CHMeCN                                               | Ms  | H  |

| A    | B  | X  | Y                                                   | Z   | Q  |
|------|----|----|-----------------------------------------------------|-----|----|
| Et   | Me | Me | CH <sub>2</sub> SMe                                 | Ms  | H  |
| Et   | Me | Me | CH <sub>2</sub> SMe                                 | Cl  | H  |
| Et   | Me | Me | CH <sub>2</sub> SMe                                 | MeS | H  |
| Et   | Me | Me | CH <sub>2</sub> SEt                                 | Ms  | H  |
| Et   | Me | Me | CH <sub>2</sub> SEt                                 | Cl  | H  |
| Et   | Me | Me | CH <sub>2</sub> SEt                                 | MeS | H  |
| Et   | Me | Me | CH <sub>2</sub> SOMe                                | Ms  | H  |
| Et   | Me | Me | CH <sub>2</sub> SOEt                                | Ms  | H  |
| Et   | Me | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                  | Ms  | H  |
| Et   | Me | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                  | Cl  | H  |
| Et   | Me | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                  | MeS | H  |
| Et   | Me | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                  | Ms  | H  |
| Et   | Me | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                  | Cl  | H  |
| Et   | Me | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                  | MeS | H  |
| Et   | Me | Me | CHMeSMe                                             | Ms  | H  |
| Et   | Me | Me | CHMeSEt                                             | Ms  | H  |
| Et   | Me | Me | CHMeSO <sub>2</sub> Me                              | Ms  | H  |
| Et   | Me | Me | CHMeSO <sub>2</sub> Et                              | Ms  | H  |
| Et   | Me | Me | CH <sub>2</sub> OCOMe                               | Ms  | H  |
| Et   | Me | Me | CH <sub>2</sub> OCOEt                               | Ms  | H  |
| Et   | Me | Me | CHMeOCOMe                                           | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> OH                                  | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | Q1 |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Cl  | Q1 |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | Q1 |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | Q3 |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | Q3 |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | Q1 |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | Q1 |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | Q3 |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | Q3 |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | MeS | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | Q1 |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | Q3 |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> OPr-n                               | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH               | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | Ms  | H  |

| A    | B  | X  | Y                                                   | Z   | Q  |
|------|----|----|-----------------------------------------------------|-----|----|
| Pr-i | Me | Me | CHMeOH                                              | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CHMeOMe                                             | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CHMeOMe                                             | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CHMeOMe                                             | MeS | H  |
| Pr-i | Me | Me | CHMeOMe                                             | Ms  | Q1 |
| Pr-i | Me | Me | CHMeOMe                                             | Ms  | Q3 |
| Pr-i | Me | Me | CHMeOEt                                             | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CHMeOEt                                             | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CHMeOEt                                             | MeS | H  |
| Pr-i | Me | Me | CHMeOEt                                             | Ms  | Q1 |
| Pr-i | Me | Me | CHMeOEt                                             | Ms  | Q3 |
| Pr-i | Me | Me | CHMeOPr-i                                           | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CHMeOPr-i                                           | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CHMeOPr-i                                           | MeS | H  |
| Pr-i | Me | Me | CHMeOPr-n                                           | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CHMeOCH <sub>2</sub> C≡CH                           | Ms  | H  |
| PR-i | Me | Me | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CL             | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CME <sub>2</sub> OH                                 | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CME <sub>2</sub> OMe                                | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CME <sub>2</sub> OEt                                | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CME <sub>2</sub> OPr-i                              | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                 | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                 | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i               | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH                  | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                 | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                 | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                 | MeS | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | MeS | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe            | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> -Y14                                | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> CN                                  | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CHMeCN                                              | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> SMe                                 | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> SMe                                 | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> SMe                                 | MeS | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> SEt                                 | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> SEt                                 | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> SEt                                 | MeS | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> SOMe                                | Ms  | H  |

| A    | B  | X  | Y                                                   | Z   | Q  |
|------|----|----|-----------------------------------------------------|-----|----|
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> SOEt                                | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                  | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                  | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                  | MeS | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                  | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                  | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                  | MeS | H  |
| Pr-i | Me | Me | CHMeSMe                                             | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CHMeSEt                                             | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CHMeSO <sub>2</sub> Me                              | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CHMeSO <sub>2</sub> Et                              | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> OCOMe                               | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> OCOEt                               | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Me | CHMeOCOMe                                           | Ms  | H  |
| Me   | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OH                                  | Ms  | H  |
| Me   | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | H  |
| Me   | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Cl  | H  |
| Me   | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | H  |
| Me   | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | Q1 |
| Me   | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Cl  | Q1 |
| Me   | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | Q1 |
| Me   | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | Q3 |
| Me   | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | Q3 |
| Me   | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | H  |
| Me   | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Cl  | H  |
| Me   | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | H  |
| Me   | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | Q1 |
| Me   | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | Q1 |
| Me   | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | Q3 |
| Me   | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | Q3 |
| Me   | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | H  |
| Me   | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Cl  | H  |
| Me   | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | MeS | H  |
| Me   | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | Q1 |
| Me   | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | Q3 |
| Me   | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-n                               | Ms  | H  |
| Me   | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH               | Ms  | H  |
| Me   | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | Ms  | H  |
| Me   | Me | Cl | CHMeOH                                              | Ms  | H  |
| Me   | Me | Cl | CHMeOMe                                             | Ms  | H  |
| Me   | Me | Cl | CHMeOMe                                             | Cl  | H  |
| Me   | Me | Cl | CHMeOMe                                             | MeS | H  |
| Me   | Me | Cl | CHMeOMe                                             | Ms  | Q1 |
| Me   | Me | Cl | CHMeOMe                                             | Ms  | Q3 |
| Me   | Me | Cl | CHMeOEt                                             | Ms  | H  |

| A  | B  | X  | Y                                                    | Z   | Q  |
|----|----|----|------------------------------------------------------|-----|----|
| Me | Me | Cl | CHMeOEt                                              | Cl  | H  |
| Me | Me | Cl | CHMeOEt                                              | MeS | H  |
| Me | Me | Cl | CHMeOEt                                              | Ms  | Q1 |
| Me | Me | Cl | CHMeOEt                                              | Ms  | Q3 |
| Me | Me | Cl | CHMeOEP <i>r</i> -i                                  | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CHMeOEP <i>r</i> -i                                  | Cl  | H  |
| Me | Me | Cl | CHMeOEP <i>r</i> -i                                  | MeS | H  |
| Me | Me | Cl | CHMeOEP <i>r</i> -n                                  | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CHMeOCH <sub>2</sub> C≡CH                            | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl              | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CME <sub>2</sub> OH                                  | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CME <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CME <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CME <sub>2</sub> OP <i>r</i> -i                      | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OP <i>r</i> -i       | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CH <i>Et</i> OH                                      | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CH <i>Et</i> OMe                                     | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CH <i>Et</i> OMe                                     | Cl  | H  |
| Me | Me | Cl | CH <i>Et</i> OMe                                     | MeS | H  |
| Me | Me | Cl | CH <i>Et</i> OEt                                     | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CH <i>Et</i> OP <i>r</i> -i                          | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Cl  | H  |
| Me | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | MeS | H  |
| Me | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe             | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CH <sub>2</sub> -Y14                                 | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CH <sub>2</sub> CN                                   | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CHMeCN                                               | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Cl  | H  |
| Me | Me | Cl | CH <sub>2</sub> SMe                                  | MeS | H  |
| Me | Me | Cl | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Cl  | H  |
| Me | Me | Cl | CH <sub>2</sub> SEt                                  | MeS | H  |
| Me | Me | Cl | CH <sub>2</sub> SOMe                                 | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CH <sub>2</sub> SOEt                                 | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Cl  | H  |
| Me | Me | Cl | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | MeS | H  |
| Me | Me | Cl | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Cl  | H  |
| Me | Me | Cl | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | MeS | H  |

| A  | B  | X  | Y                                                   | Z   | Q  |
|----|----|----|-----------------------------------------------------|-----|----|
| Me | Me | Cl | CHMeSMe                                             | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CHMeSEt                                             | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CHMeSO <sub>2</sub> Me                              | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CHMeSO <sub>2</sub> Et                              | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OCOMe                               | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OCOEt                               | Ms  | H  |
| Me | Me | Cl | CHMeOCOMe                                           | Ms  | H  |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OH                                  | Ms  | H  |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | H  |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Cl  | H  |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | H  |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | Q1 |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Cl  | Q1 |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | Q1 |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | Q3 |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | Q3 |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | H  |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Cl  | H  |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | H  |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | Q1 |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | Q1 |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | Q3 |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | Q3 |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | H  |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Cl  | H  |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | MeS | H  |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | Q1 |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | Q3 |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-n                               | Ms  | H  |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH               | Ms  | H  |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | Ms  | H  |
| Et | Me | Cl | CMeOH                                               | Ms  | H  |
| Et | Me | Cl | CMeOMe                                              | Ms  | H  |
| Et | Me | Cl | CMeOMe                                              | Cl  | H  |
| Et | Me | Cl | CMeOMe                                              | MeS | H  |
| Et | Me | Cl | CHMeOMe                                             | Ms  | Q1 |
| Et | Me | Cl | CHMeOMe                                             | Ms  | Q3 |
| Et | Me | Cl | CHMeOEt                                             | Ms  | H  |
| Et | Me | Cl | CHMeOEt                                             | Cl  | H  |
| Et | Me | Cl | CHMeOEt                                             | MeS | H  |
| Et | Me | Cl | CHMeOEt                                             | Ms  | Q1 |
| Et | Me | Cl | CHMeOEt                                             | Ms  | Q3 |
| Et | Me | Cl | CHMeOPr-i                                           | Ms  | H  |
| Et | Me | Cl | CHMeOPr-i                                           | Cl  | H  |
| Et | Me | Cl | CHMeOPr-i                                           | MeS | H  |

| A  | B  | X  | Y                                                    | Z   | Q |
|----|----|----|------------------------------------------------------|-----|---|
| Et | Me | Cl | CHMeOPr-n                                            | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CHMeOCH <sub>2</sub> C≡CH                            | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl              | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CMe <sub>2</sub> OH                                  | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CMe <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CMe <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CMe <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i                | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CHEtOH                                               | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CHEtOMe                                              | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CHEtOMe                                              | Cl  | H |
| Et | Me | Cl | CHEtOMe                                              | MeS | H |
| Et | Me | Cl | CHEtOEt                                              | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CHEtOPr-i                                            | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Cl  | H |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | MeS | H |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe             | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> -Y14                                 | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> CN                                   | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CHMeCN                                               | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Cl  | H |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> SMe                                  | MeS | H |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Cl  | H |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> SEt                                  | MeS | H |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> SOMe                                 | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> SOEt                                 | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Cl  | H |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | MeS | H |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Cl  | H |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | MeS | H |
| Et | Me | Cl | CHMeSMe                                              | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CHMeSEt                                              | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CHMeSO <sub>2</sub> Me                               | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CHMeSO <sub>2</sub> Et                               | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OCOMe                                | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OCOEt                                | Ms  | H |
| Et | Me | Cl | CHMeOCOMe                                            | Ms  | H |

| A    | B  | X  | Y                                                   | Z   | Q  |
|------|----|----|-----------------------------------------------------|-----|----|
| Pr-i | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OH                                  | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | H  |
| Pr-i | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | Q1 |
| Pr-i | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Cl  | Q1 |
| Pr-i | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | Q1 |
| Pr-i | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | Q3 |
| Pr-i | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | Q3 |
| Pr-i | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OE <sub>t</sub>                     | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OE <sub>t</sub>                     | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OE <sub>t</sub>                     | MeS | H  |
| Pr-i | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OE <sub>t</sub>                     | Ms  | Q1 |
| Pr-i | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OE <sub>t</sub>                     | MeS | Q1 |
| Pr-i | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OE <sub>t</sub>                     | Ms  | Q3 |
| Pr-i | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OE <sub>t</sub>                     | MeS | Q3 |
| Pr-i | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | MeS | H  |
| Pr-i | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | Q1 |
| Pr-i | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | Q3 |
| Pr-i | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OPr-n                               | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH               | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl | CHMeOH                                              | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl | CHMeOMe                                             | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl | CHMeOMe                                             | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | Cl | CHMeOMe                                             | MeS | H  |
| Pr-i | Me | Cl | CHMeOMe                                             | Ms  | Q1 |
| Pr-i | Me | Cl | CHMeOMe                                             | Ms  | Q3 |
| Pr-i | Me | Cl | CHMeOE <sub>t</sub>                                 | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl | CHMeOE <sub>t</sub>                                 | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | Cl | CHMeOE <sub>t</sub>                                 | MeS | H  |
| Pr-i | Me | Cl | CHMeOE <sub>t</sub>                                 | Ms  | Q1 |
| Pr-i | Me | Cl | CHMeOE <sub>t</sub>                                 | Ms  | Q3 |
| Pr-i | Me | Cl | CHMeOPr-i                                           | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl | CHMeOPr-i                                           | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | Cl | CHMeOPr-i                                           | MeS | H  |
| Pr-i | Me | Cl | CHMeOPr-n                                           | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl | CHMeOCH <sub>2</sub> C≡CH                           | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl             | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl | CMe <sub>2</sub> OH                                 | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl | CMe <sub>2</sub> OMe                                | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl | CMe <sub>2</sub> OE <sub>t</sub>                    | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl | CMe <sub>2</sub> OPr-i                              | Ms  | H  |

| A    | B  | X   | Y                                                    | Z   | Q  |
|------|----|-----|------------------------------------------------------|-----|----|
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i                | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> EtOH                                 | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> EtOMe                                | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> EtOMe                                | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> EtOMe                                | MeS | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> EtOEt                                | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> EtOPr-i                              | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | MeS | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe             | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> -Y14                                 | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> CN                                   | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CHMeCN                                               | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> SMe                                  | MeS | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> SEt                                  | MeS | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> SOMe                                 | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> SOEt                                 | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | MeS | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | MeS | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CHMeSMe                                              | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CHMeSEt                                              | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CHMeSO <sub>2</sub> Me                               | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CHMeSO <sub>2</sub> Et                               | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> OCOMe                                | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> OCOEt                                | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | Cl  | CHMeOCOMe                                            | Ms  | H  |
| Me   | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OH                                   | Ms  | H  |
| Me   | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | H  |
| Me   | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Cl  | H  |
| Me   | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                  | MeS | H  |
| Me   | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | Q1 |
| Me   | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Cl  | Q1 |
| Me   | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                  | MeS | Q1 |

| A  | B  | X   | Y                                                   | Z   | Q  |
|----|----|-----|-----------------------------------------------------|-----|----|
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | Q3 |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                 | MeS | Q3 |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Cl  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | Q1 |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | Q1 |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | Q3 |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                                 | MeS | Q3 |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Cl  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | MeS | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | Q1 |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | Q3 |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-n                               | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH               | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CHMeOH                                              | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CHMeOMe                                             | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CHMeOMe                                             | Cl  | H  |
| Me | Me | MeO | CHMeOMe                                             | MeS | H  |
| Me | Me | MeO | CHMeOMe                                             | Ms  | Q1 |
| Me | Me | MeO | CHMeOMe                                             | Ms  | Q3 |
| Me | Me | MeO | CHMeOEt                                             | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CHMeOEt                                             | Cl  | H  |
| Me | Me | MeO | CHMeOEt                                             | MeS | H  |
| Me | Me | MeO | CHMeOEt                                             | Ms  | Q1 |
| Me | Me | MeO | CHMeOEt                                             | Ms  | Q3 |
| Me | Me | MeO | CHMeOPr-i                                           | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CHMeOPr-i                                           | Cl  | H  |
| Me | Me | MeO | CHMeOPr-i                                           | MeS | H  |
| Me | Me | MeO | CHMeOPr-n                                           | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CHMeOCH <sub>2</sub> C≡CH                           | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl             | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CM <sub>2</sub> OH                                  | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CM <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CM <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CM <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                 | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                 | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i               | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH                  | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                 | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                 | Cl  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                 | MeS | H  |

| A  | B  | X   | Y                                                    | Z   | Q  |
|----|----|-----|------------------------------------------------------|-----|----|
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> EtOEt                                | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> EtOPr-i                              | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Cl  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | MeS | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe             | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> -Y14                                 | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> CN                                   | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CHMeCN                                               | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Cl  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SMe                                  | MeS | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Cl  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SEt                                  | MeS | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SOMe                                 | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SOEt                                 | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Cl  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | MeS | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Cl  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | MeS | H  |
| Me | Me | MeO | CHMeSMe                                              | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CHMeSEt                                              | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CHMeSO <sub>2</sub> Me                               | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CHMeSO <sub>2</sub> Et                               | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OCOMe                                | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OCOBt                                | Ms  | H  |
| Me | Me | MeO | CHMeOCOMe                                            | Ms  | H  |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OH                                   | Ms  | H  |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | H  |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Cl  | H  |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                  | MeS | H  |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | Q1 |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Cl  | Q1 |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                  | MeS | Q1 |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | Q3 |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                                  | MeS | Q3 |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | H  |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Cl  | H  |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                                  | MeS | H  |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | Q1 |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                                  | MeS | Q1 |

| A  | B  | X   | Y                                                    | Z   | Q  |
|----|----|-----|------------------------------------------------------|-----|----|
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | Q3 |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                                  | MeS | Q3 |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | Ms  | H  |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | Cl  | H  |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | MeS | H  |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | Ms  | Q1 |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | Ms  | Q3 |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-n                                | Ms  | H  |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH                | Ms  | H  |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl  | Ms  | H  |
| Et | Me | MeO | CHMeOH                                               | Ms  | H  |
| Et | Me | MeO | CHMeOMe                                              | Ms  | H  |
| Et | Me | MeO | CHMeOMe                                              | Cl  | H  |
| Et | Me | MeO | CHMeOMe                                              | MeS | H  |
| Et | Me | MeO | CHMeOMe                                              | Ms  | Q1 |
| Et | Me | MeO | CHMeOMe                                              | Ms  | Q3 |
| Et | Me | MeO | CHMeOEt                                              | Ms  | H  |
| Et | Me | MeO | CHMeOEt                                              | Cl  | H  |
| Et | Me | MeO | CHMeOEt                                              | MeS | H  |
| Et | Me | MeO | CHMeOEt                                              | Ms  | Q1 |
| Et | Me | MeO | CHMeOEt                                              | Ms  | Q3 |
| Et | Me | MeO | CHMeOPr-i                                            | Ms  | H  |
| Et | Me | MeO | CHMeOPr-i                                            | Cl  | H  |
| Et | Me | MeO | CHMeOPr-i                                            | MeS | H  |
| Et | Me | MeO | CHMeOPr-n                                            | Ms  | H  |
| Et | Me | MeO | CHMeOCH <sub>2</sub> C≡CH                            | Ms  | H  |
| Et | Me | MeO | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl              | Ms  | H  |
| Et | Me | MeO | CMe <sub>2</sub> OH                                  | Ms  | H  |
| Et | Me | MeO | CMe <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | H  |
| Et | Me | MeO | CMe <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | H  |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Ms  | H  |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Ms  | H  |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i                | Ms  | H  |
| Et | Me | MeO | CHEtOH                                               | Ms  | H  |
| Et | Me | MeO | CHEtOMe                                              | Ms  | H  |
| Et | Me | MeO | CHEtOMe                                              | Cl  | H  |
| Et | Me | MeO | CHEtOMe                                              | MeS | H  |
| Et | Me | MeO | CHEtOEt                                              | Ms  | H  |
| Et | Me | MeO | CHEtOPr-i                                            | Ms  | H  |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms  | H  |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Cl  | H  |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | MeS | H  |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt | Ms  | H  |
| Et | Me | MeO | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe             | Ms  | H  |
| Et | Me | MeO | CH <sub>2</sub> -Y14                                 | Ms  | H  |

| A    | B  | X   | Y                                  | Z   | Q  |
|------|----|-----|------------------------------------|-----|----|
| Et   | Me | MeO | CH <sub>2</sub> CN                 | Ms  | H  |
| Et   | Me | MeO | CHMeCN                             | Ms  | H  |
| Et   | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SMe                | Ms  | H  |
| Et   | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SMe                | Cl  | H  |
| Et   | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SMe                | MeS | H  |
| Et   | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SEt                | Ms  | H  |
| Et   | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SEt                | Cl  | H  |
| Et   | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SEt                | MeS | H  |
| Et   | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SOMe               | Ms  | H  |
| Et   | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SOEt               | Ms  | H  |
| Et   | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me | Ms  | H  |
| Et   | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me | Cl  | H  |
| Et   | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me | MeS | H  |
| Et   | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et | Ms  | H  |
| Et   | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et | Cl  | H  |
| Et   | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et | MeS | H  |
| Et   | Me | MeO | CHMeSMe                            | Ms  | H  |
| Et   | Me | MeO | CHMeSEt                            | Ms  | H  |
| Et   | Me | MeO | CHMeSO <sub>2</sub> Me             | Ms  | H  |
| Et   | Me | MeO | CHMeSO <sub>2</sub> Et             | Ms  | H  |
| Et   | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OCOMe              | Ms  | H  |
| Et   | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OCOEt              | Ms  | H  |
| Et   | Me | MeO | CHMeOCOMe                          | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OH                 | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                | MeS | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                | Ms  | Q1 |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                | Cl  | Q1 |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                | MeS | Q1 |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                | Ms  | Q3 |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OMe                | MeS | Q3 |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                | MeS | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                | Ms  | Q1 |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                | MeS | Q1 |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                | Ms  | Q3 |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OEt                | MeS | Q3 |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i              | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i              | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i              | MeS | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i              | Ms  | Q1 |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-i              | Ms  | Q3 |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OPr-n              | Ms  | H  |

| A    | B  | X   | Y                                                    | Z   | Q  |
|------|----|-----|------------------------------------------------------|-----|----|
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH                | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl  | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CHMeOH                                               | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CHMeOMe                                              | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CHMeOMe                                              | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CHMeOMe                                              | MeS | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CHMeOMe                                              | Ms  | Q1 |
| Pr-i | Me | MeO | CHMeOMe                                              | Ms  | Q3 |
| Pr-i | Me | MeO | CHMeOEt                                              | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CHMeOEt                                              | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CHMeOEt                                              | MeS | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CHMeOEt                                              | Ms  | Q1 |
| Pr-i | Me | MeO | CHMeOEt                                              | Ms  | Q3 |
| Pr-i | Me | MeO | CHMeOPr-i                                            | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CHMeOPr-i                                            | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CHMeOPr-i                                            | MeS | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CHMeOPr-n                                            | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CHMeOCH <sub>2</sub> C≡CH                            | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl              | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CMe <sub>2</sub> OH                                  | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CMe <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CMe <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CMe <sub>2</sub> OPr-i                               | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPr-i                | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH                   | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | MeS | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe             | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> -Y14                                 | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> CN                                   | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CHMeCN                                               | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Cl  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SMe                                  | MeS | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Ms  | H  |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Cl  | H  |

| A    | B  | X   | Y                                                    | Z   | Q |
|------|----|-----|------------------------------------------------------|-----|---|
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SEt                                  | MeS | H |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SOMe                                 | Ms  | H |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SOEt                                 | Ms  | H |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Ms  | H |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Cl  | H |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | MeS | H |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Ms  | H |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Cl  | H |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | MeS | H |
| Pr-i | Me | MeO | CHMeSMe                                              | Ms  | H |
| Pr-i | Me | MeO | CHMeSEt                                              | Ms  | H |
| Pr-i | Me | MeO | CHMeSO <sub>2</sub> Me                               | Ms  | H |
| Pr-i | Me | MeO | CHMeSO <sub>2</sub> Et                               | Ms  | H |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OCOMe                                | Ms  | H |
| Pr-i | Me | MeO | CH <sub>2</sub> OCOEt                                | Ms  | H |
| Pr-i | Me | Me  | OCHMeOCOMe                                           | Ms  | H |
| Me   | H  | Br  | CH <sub>2</sub> OH                                   | Ms  | H |
| Me   | H  | Br  | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | H |
| Me   | H  | Br  | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Cl  | H |
| Me   | H  | Br  | CH <sub>2</sub> OMe                                  | MeS | H |
| Me   | H  | Br  | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | H |
| Me   | H  | Br  | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Cl  | H |
| Me   | H  | Br  | CH <sub>2</sub> OEt                                  | MeS | H |
| Me   | H  | Br  | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | Ms  | H |
| Me   | H  | Br  | CH <sub>2</sub> OPr-n                                | Ms  | H |
| Me   | H  | Br  | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH                | Ms  | H |
| Me   | H  | Br  | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl  | Ms  | H |
| Me   | H  | Br  | CHMeOH                                               | Ms  | H |
| Me   | H  | Br  | CHMeOMe                                              | Ms  | H |
| Me   | H  | Br  | CHMeOMe                                              | Cl  | H |
| Me   | H  | Br  | CHMeOMe                                              | MeS | H |
| Me   | H  | Br  | CHMeOEt                                              | Ms  | H |
| Me   | H  | Br  | CHMeOCH <sub>2</sub> C≡CH                            | Ms  | H |
| Me   | H  | Br  | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl              | Ms  | H |
| Me   | H  | Br  | CMe <sub>2</sub> OH                                  | Ms  | H |
| Me   | H  | Br  | CMe <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | H |
| Me   | H  | Br  | CMe <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | H |
| Me   | H  | Br  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Ms  | H |
| Me   | H  | Br  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Ms  | H |
| Me   | H  | Br  | CH <sub>2</sub> EtOH                                 | Ms  | H |
| Me   | H  | Br  | CH <sub>2</sub> EtOMe                                | Ms  | H |
| Me   | H  | Br  | CH <sub>2</sub> EtOEt                                | Ms  | H |
| Me   | H  | Br  | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms  | H |
| Me   | H  | Br  | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe             | Ms  | H |
| Me   | H  | Br  | CH <sub>2</sub> CN                                   | Ms  | H |

| A  | B | X  | Y                                                    | Z   | Q |
|----|---|----|------------------------------------------------------|-----|---|
| Me | H | Br | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Ms  | H |
| Me | H | Br | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Ms  | H |
| Me | H | Br | CH <sub>2</sub> SOMe                                 | Ms  | H |
| Me | H | Br | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Ms  | H |
| Me | H | Br | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Ms  | H |
| Me | H | Br | CHMeSMe                                              | Ms  | H |
| Me | H | Br | CHMeSO <sub>2</sub> Me                               | Ms  | H |
| Me | H | Br | CH <sub>2</sub> OCOMe                                | Ms  | H |
| Me | H | Br | CHMeOCOMe                                            | Ms  | H |
| Et | H | Br | CH <sub>2</sub> OH                                   | Ms  | H |
| Et | H | Br | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | H |
| Et | H | Br | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Cl  | H |
| Et | H | Br | CH <sub>2</sub> OMe                                  | MeS | H |
| Et | H | Br | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | H |
| Et | H | Br | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Cl  | H |
| Et | H | Br | CH <sub>2</sub> OEt                                  | MeS | H |
| Et | H | Br | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | Ms  | H |
| Et | H | Br | CH <sub>2</sub> OPr-n                                | Ms  | H |
| Et | H | Br | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH                | Ms  | H |
| Et | H | Br | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl  | Ms  | H |
| Et | H | Br | CHMeOH                                               | Ms  | H |
| Et | H | Br | CHMeOMe                                              | Ms  | H |
| Et | H | Br | CHMeOMe                                              | Cl  | H |
| Et | H | Br | CHMeOMe                                              | MeS | H |
| Et | H | Br | CHMeOEt                                              | Ms  | H |
| Et | H | Br | CHMeOCH <sub>2</sub> C≡CH                            | Ms  | H |
| Et | H | Br | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl              | Ms  | H |
| Et | H | Br | CMe <sub>2</sub> OH                                  | Ms  | H |
| Et | H | Br | CMe <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | H |
| Et | H | Br | CMe <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | H |
| Et | H | Br | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Ms  | H |
| Et | H | Br | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Ms  | H |
| Et | H | Br | CHEtOH                                               | Ms  | H |
| Et | H | Br | CHEtOMe                                              | Ms  | H |
| Et | H | Br | CHEtOEt                                              | Ms  | H |
| Et | H | Br | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms  | H |
| Et | H | Br | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe             | Ms  | H |
| Et | H | Br | CH <sub>2</sub> CN                                   | Ms  | H |
| Et | H | Br | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Ms  | H |
| Et | H | Br | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Ms  | H |
| Et | H | Br | CH <sub>2</sub> SOMe                                 | Ms  | H |
| Et | H | Br | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Ms  | H |
| Et | H | Br | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Ms  | H |
| Et | H | Br | CHMeSMe                                              | Ms  | H |
| Et | H | Br | CHMeSO <sub>2</sub> Me                               | Ms  | H |

| A    | B | X  | Y                                                    | Z   | Q |
|------|---|----|------------------------------------------------------|-----|---|
| Et   | H | Br | CH <sub>2</sub> OCOMe                                | Ms  | H |
| Et   | H | Br | CHMeOMe                                              | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CH <sub>2</sub> OH                                   | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Cl  | H |
| Pr-i | H | Br | CH <sub>2</sub> OMe                                  | MeS | H |
| Pr-i | H | Br | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Cl  | H |
| Pr-i | H | Br | CH <sub>2</sub> OEt                                  | MeS | H |
| Pr-i | H | Br | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CH <sub>2</sub> OPr-n                                | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH                | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl  | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CHMeOH                                               | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CHMeOMe                                              | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CHMeOMe                                              | Cl  | H |
| Pr-i | H | Br | CHMeOMe                                              | MeS | H |
| Pr-i | H | Br | CHMeOEt                                              | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CHMeOCH <sub>2</sub> C≡CH                            | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl              | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CM <sub>2</sub> OH                                   | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CM <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CM <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CH <sub>2</sub> EtOH                                 | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CH <sub>2</sub> EtOMe                                | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CH <sub>2</sub> EtOEt                                | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe             | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CH <sub>2</sub> CN                                   | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CH <sub>2</sub> SOMe                                 | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CHMeSMe                                              | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CHMeSO <sub>2</sub> Me                               | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CH <sub>2</sub> OCOMe                                | Ms  | H |
| Pr-i | H | Br | CHMeOCOMe                                            | Ms  | H |
| Me   | H | I  | CH <sub>2</sub> OH                                   | Ms  | H |
| Me   | H | I  | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | H |
| Me   | H | I  | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Cl  | H |
| Me   | H | I  | CH <sub>2</sub> OMe                                  | MeS | H |
| Me   | H | I  | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | H |

| A  | B | X | Y                                                    | Z   | Q |
|----|---|---|------------------------------------------------------|-----|---|
| Me | H | I | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Cl  | H |
| Me | H | I | CH <sub>2</sub> OEt                                  | MeS | H |
| Me | H | I | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | Ms  | H |
| Me | H | I | CH <sub>2</sub> OPr-n                                | Ms  | H |
| Me | H | I | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH                | Ms  | H |
| Me | H | I | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl  | Ms  | H |
| Me | H | I | CHMeOH                                               | Ms  | H |
| Me | H | I | CHMeOMe                                              | Ms  | H |
| Me | H | I | CHMeOMe                                              | Cl  | H |
| Me | H | I | CHMeOMe                                              | MeS | H |
| Me | H | I | CHMeOEt                                              | Ms  | H |
| Me | H | I | CHMeOCH <sub>2</sub> C≡CH                            | Ms  | H |
| Me | H | I | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl              | Ms  | H |
| Me | H | I | CM <sub>2</sub> OH                                   | Ms  | H |
| Me | H | I | CM <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | H |
| Me | H | I | CM <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | H |
| Me | H | I | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Ms  | H |
| Me | H | I | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Ms  | H |
| Me | H | I | CH <sub>2</sub> EtOH                                 | Ms  | H |
| Me | H | I | CH <sub>2</sub> EtOMe                                | Ms  | H |
| Me | H | I | CH <sub>2</sub> EtOEt                                | Ms  | H |
| Me | H | I | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms  | H |
| Me | H | I | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe             | Ms  | H |
| Me | H | I | CH <sub>2</sub> CN                                   | Ms  | H |
| Me | H | I | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Ms  | H |
| Me | H | I | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Ms  | H |
| Me | H | I | CH <sub>2</sub> SOMe                                 | Ms  | H |
| Me | H | I | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Ms  | H |
| Me | H | I | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Ms  | H |
| Me | H | I | CHMeSMe                                              | Ms  | H |
| Me | H | I | CHMeSO <sub>2</sub> Me                               | Ms  | H |
| Me | H | I | CH <sub>2</sub> OCOMe                                | Ms  | H |
| Me | H | I | CHMeOCOMe                                            | Ms  | H |
| Et | H | I | CH <sub>2</sub> OH                                   | Ms  | H |
| Et | H | I | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | H |
| Et | H | I | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Cl  | H |
| Et | H | I | CH <sub>2</sub> OMe                                  | MeS | H |
| Et | H | I | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | H |
| Et | H | I | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Cl  | H |
| Et | H | I | CH <sub>2</sub> OEt                                  | MeS | H |
| Et | H | I | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | Ms  | H |
| Et | H | I | CH <sub>2</sub> OPr-n                                | Ms  | H |
| Et | H | I | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH                | Ms  | H |
| Et | H | I | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl  | Ms  | H |
| Et | H | I | CHMeOH                                               | Ms  | H |

| A    | B | X | Y                                                    | Z   | Q |
|------|---|---|------------------------------------------------------|-----|---|
| Et   | H | I | CHMeOMe                                              | Ms  | H |
| Et   | H | I | CHMeOMe                                              | Cl  | H |
| Et   | H | I | CHMeOMe                                              | MeS | H |
| Et   | H | I | CHMeOEt                                              | Ms  | H |
| Et   | H | I | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH                | Ms  | H |
| Et   | H | I | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl              | Ms  | H |
| Et   | H | I | CME <sub>2</sub> OH                                  | Ms  | H |
| Et   | H | I | CME <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | H |
| Et   | H | I | CME <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | H |
| Et   | H | I | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Ms  | H |
| Et   | H | I | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Ms  | H |
| Et   | H | I | CH <sub>2</sub> OH                                   | Ms  | H |
| Et   | H | I | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | H |
| Et   | H | I | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | H |
| Et   | H | I | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms  | H |
| Et   | H | I | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe             | Ms  | H |
| Et   | H | I | CH <sub>2</sub> CN                                   | Ms  | H |
| Et   | H | I | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Ms  | H |
| Et   | H | I | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Ms  | H |
| Et   | H | I | CH <sub>2</sub> SOMe                                 | Ms  | H |
| Et   | H | I | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Ms  | H |
| Et   | H | I | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Ms  | H |
| Et   | H | I | CHMeSMe                                              | Ms  | H |
| Et   | H | I | CHMeSO <sub>2</sub> Me                               | Ms  | H |
| Et   | H | I | CH <sub>2</sub> OCOMe                                | Ms  | H |
| Et   | H | I | CHMeOCOMe                                            | Ms  | H |
| Pr-i | H | I | CH <sub>2</sub> OH                                   | Ms  | H |
| Pr-i | H | I | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | H |
| Pr-i | H | I | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Cl  | H |
| Pr-i | H | I | CH <sub>2</sub> OMe                                  | MeS | H |
| Pr-i | H | I | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | H |
| Pr-i | H | I | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Cl  | H |
| Pr-i | H | I | CH <sub>2</sub> OEt                                  | MeS | H |
| Pr-i | H | I | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | Ms  | H |
| Pr-i | H | I | CH <sub>2</sub> OPr-n                                | Ms  | H |
| Pr-i | H | I | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH                | Ms  | H |
| Pr-i | H | I | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl  | Ms  | H |
| Pr-i | H | I | CHMeOH                                               | Ms  | H |
| Pr-i | H | I | CHMeOMe                                              | Ms  | H |
| Pr-i | H | I | CHMeOMe                                              | Cl  | H |
| Pr-i | H | I | CHMeOMe                                              | MeS | H |
| Pr-i | H | I | CHMeOEt                                              | Ms  | H |
| Pr-i | H | I | CHMeOCH <sub>2</sub> C≡CH                            | Ms  | H |
| Pr-i | H | I | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl              | Ms  | H |
| Pr-i | H | I | CME <sub>2</sub> OH                                  | Ms  | H |

| A    | B | X  | Y                                                    | Z   | Q |
|------|---|----|------------------------------------------------------|-----|---|
| Pr-i | H | I  | CME <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | H |
| Pr-i | H | I  | CME <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | H |
| Pr-i | H | I  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Ms  | H |
| Pr-i | H | I  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Ms  | H |
| Pr-i | H | I  | CHEtOH                                               | Ms  | H |
| Pr-i | H | I  | CHEtOMe                                              | Ms  | H |
| Pr-i | H | I  | CHEtOEt                                              | Ms  | H |
| Pr-i | H | I  | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms  | H |
| Pr-i | H | I  | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe             | Ms  | H |
| Pr-i | H | I  | CH <sub>2</sub> CN                                   | Ms  | H |
| Pr-i | H | I  | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Ms  | H |
| Pr-i | H | I  | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Ms  | H |
| Pr-i | H | I  | CH <sub>2</sub> SOMe                                 | Ms  | H |
| Pr-i | H | I  | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Ms  | H |
| Pr-i | H | I  | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Ms  | H |
| Pr-i | H | I  | CHMeSMe                                              | Ms  | H |
| Pr-i | H | I  | CHMeSO <sub>2</sub> Me                               | Ms  | H |
| Pr-i | H | I  | CH <sub>2</sub> OCOMe                                | Ms  | H |
| Pr-i | H | I  | CHMeOCOMe                                            | Ms  | H |
| Me   | H | Et | CH <sub>2</sub> OH                                   | Ms  | H |
| Me   | H | Et | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | H |
| Me   | H | Et | CH <sub>2</sub> OHMe                                 | Cl  | H |
| Me   | H | Et | CH <sub>2</sub> OHMe                                 | MeS | H |
| Me   | H | Et | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | H |
| Me   | H | Et | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Cl  | H |
| Me   | H | Et | CH <sub>2</sub> OEt                                  | MeS | H |
| Me   | H | Et | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | Ms  | H |
| Me   | H | Et | CH <sub>2</sub> OPr-n                                | Ms  | H |
| Me   | H | Et | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH                | Ms  | H |
| Me   | H | Et | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl  | Ms  | H |
| Me   | H | Et | CHMeOH                                               | Ms  | H |
| Me   | H | Et | CHMeOMe                                              | Ms  | H |
| Me   | H | Et | CHMeOMe                                              | Cl  | H |
| Me   | H | Et | CHMeOMe                                              | MeS | H |
| Me   | H | Et | CHMeOEt                                              | Ms  | H |
| Me   | H | Et | CHMeOCH <sub>2</sub> C≡CH                            | Ms  | H |
| Me   | H | Et | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl              | Ms  | H |
| Me   | H | Et | CMe <sub>2</sub> OH                                  | Ms  | H |
| Me   | H | Et | CMe <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | H |
| Me   | H | Et | CMe <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | H |
| Me   | H | Et | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Ms  | H |
| Me   | H | Et | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Ms  | H |
| Me   | H | Et | CHEtOH                                               | Ms  | H |
| Me   | H | Et | CHEtOMe                                              | Ms  | H |
| Me   | H | Et | CHEtOEt                                              | Ms  | H |

| A  | B | X  | Y                                                    | Z   | Q |
|----|---|----|------------------------------------------------------|-----|---|
| Me | H | Et | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms  | H |
| Me | H | Et | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe             | Ms  | H |
| Me | H | Et | CH <sub>2</sub> CN                                   | Ms  | H |
| Me | H | Et | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Ms  | H |
| Me | H | Et | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Ms  | H |
| Me | H | Et | CH <sub>2</sub> SOMe                                 | Ms  | H |
| Me | H | Et | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Ms  | H |
| Me | H | Et | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Ms  | H |
| Me | H | Et | CHMeSMe                                              | Ms  | H |
| Me | H | Et | CHMeSO <sub>2</sub> Me                               | Ms  | H |
| Me | H | Et | CH <sub>2</sub> OCOMe                                | Ms  | H |
| Me | H | Et | CHMeOCOMe                                            | Ms  | H |
| Et | H | Et | CH <sub>2</sub> OH                                   | Ms  | H |
| Et | H | Et | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | H |
| Et | H | Et | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Cl  | H |
| Et | H | Et | CH <sub>2</sub> OMe                                  | MeS | H |
| Et | H | Et | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | H |
| Et | H | Et | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Cl  | H |
| Et | H | Et | CH <sub>2</sub> OEt                                  | MeS | H |
| Et | H | Et | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | Ms  | H |
| Et | H | Et | CH <sub>2</sub> OPr-n                                | Ms  | H |
| Et | H | Et | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH                | Ms  | H |
| Et | H | Et | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl  | Ms  | H |
| Et | H | Et | CHMeOH                                               | Ms  | H |
| Et | H | Et | CHMeOMe                                              | Ms  | H |
| Et | H | Et | CHMeOMe                                              | Cl  | H |
| Et | H | Et | CHMeOMe                                              | MeS | H |
| Et | H | Et | CHMeOEt                                              | Ms  | H |
| Et | H | Et | CHMeOCH <sub>2</sub> C≡CH                            | Ms  | H |
| Et | H | Et | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl              | Ms  | H |
| Et | H | Et | CMe <sub>2</sub> OH                                  | Ms  | H |
| Et | H | Et | CMe <sub>2</sub> OMe                                 | Ms  | H |
| Et | H | Et | CMe <sub>2</sub> OEt                                 | Ms  | H |
| Et | H | Et | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Ms  | H |
| Et | H | Et | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Ms  | H |
| Et | H | Et | CHetOH                                               | Ms  | H |
| Et | H | Et | CHetOMe                                              | Ms  | H |
| Et | H | Et | CHetOEt                                              | Ms  | H |
| Et | H | Et | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms  | H |
| Et | H | Et | CHMeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe             | Ms  | H |
| Et | H | Et | CH <sub>2</sub> CN                                   | Ms  | H |
| Et | H | Et | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Ms  | H |
| Et | H | Et | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Ms  | H |
| Et | H | Et | CH <sub>2</sub> SOMe                                 | Ms  | H |
| Et | H | Et | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Ms  | H |

| A    | B  | X  | Y                                                    | Z   | Q |
|------|----|----|------------------------------------------------------|-----|---|
| Me   | Me | Et | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Ms  | H |
| Me   | Me | Et | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Ms  | H |
| Me   | Me | Et | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Ms  | H |
| Me   | Me | Et | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Ms  | H |
| Me   | Me | Et | CH <sub>2</sub> OCOMe                                | Ms  | H |
| Me   | Me | Et | CHMeOCOMe                                            | Ms  | H |
| Et   | Me | Et | CH <sub>2</sub> OH                                   | Ms  | H |
| Et   | Me | Et | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | H |
| Et   | Me | Et | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Cl  | H |
| Et   | Me | Et | CH <sub>2</sub> OMe                                  | MeS | H |
| Et   | Me | Et | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | H |
| Et   | Me | Et | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Cl  | H |
| Et   | Me | Et | CH <sub>2</sub> OEt                                  | MeS | H |
| Et   | Me | Et | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | Ms  | H |
| Et   | Me | Et | CH <sub>2</sub> OPr-n                                | Ms  | H |
| Et   | Me | Et | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH                | Ms  | H |
| Et   | Me | Et | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl  | Ms  | H |
| Et   | Me | Et | CHMeOH                                               | Ms  | H |
| Et   | Me | Et | CHMeOMe                                              | Ms  | H |
| Et   | Me | Et | CHMeOMe                                              | Cl  | H |
| Et   | Me | Et | CHMeOMe                                              | MeS | H |
| Et   | Me | Et | CHMeOEt                                              | Ms  | H |
| Et   | Me | Et | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Ms  | H |
| Et   | Me | Et | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Ms  | H |
| Et   | Me | Et | CH <sub>2</sub> EtOH                                 | Ms  | H |
| Et   | Me | Et | CH <sub>2</sub> EtOMe                                | Ms  | H |
| Et   | Me | Et | CH <sub>2</sub> EtOEt                                | Ms  | H |
| Et   | Me | Et | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms  | H |
| Et   | Me | Et | CH <sub>2</sub> CN                                   | Ms  | H |
| Et   | Me | Et | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Ms  | H |
| Et   | Me | Et | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Ms  | H |
| Et   | Me | Et | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Ms  | H |
| Et   | Me | Et | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Ms  | H |
| Et   | Me | Et | CH <sub>2</sub> OCOMe                                | Ms  | H |
| Et   | Me | Et | CHMeOCOMe                                            | Ms  | H |
| Pr-i | Me | Et | CH <sub>2</sub> OH                                   | Ms  | H |
| Pr-i | Me | Et | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | H |
| Pr-i | Me | Et | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Cl  | H |
| Pr-i | Me | Et | CH <sub>2</sub> OMe                                  | MeS | H |
| Pr-i | Me | Et | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | H |
| Pr-i | Me | Et | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Cl  | H |
| Pr-i | Me | Et | CH <sub>2</sub> OEt                                  | MeS | H |
| Pr-i | Me | Et | CH <sub>2</sub> OPr-i                                | Ms  | H |
| Pr-i | Me | Et | CH <sub>2</sub> OPr-n                                | Ms  | H |
| Pr-i | Me | Et | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> C≡CH                | Ms  | H |

| A    | B  | X  | Y                                                    | Z   | Q |
|------|----|----|------------------------------------------------------|-----|---|
| Pr-i | Me | Et | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl  | Ms  | H |
| Pr-i | Me | Et | CHMeOH                                               | Ms  | H |
| Pr-i | Me | Et | CHMeOMe                                              | Ms  | H |
| Pr-i | Me | Et | CHMeOMe                                              | Cl  | H |
| Pr-i | Me | Et | CHMeOMe                                              | MeS | H |
| Pr-i | Me | Et | CHMeOEt                                              | Ms  | H |
| Pr-i | Me | Et | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Ms  | H |
| Pr-i | Me | Et | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Ms  | H |
| Pr-i | Me | Et | CHEtOH                                               | Ms  | H |
| Pr-i | Me | Et | CHEtOMe                                              | Ms  | H |
| Pr-i | Me | Et | CHEtOEt                                              | Ms  | H |
| Pr-  | Me | Et | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms  | H |
| Pr-i | Me | Et | CH <sub>2</sub> CN                                   | Ms  | H |
| Pr-i | Me | Et | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Ms  | H |
| Pr-i | Me | Et | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Ms  | H |
| Pr-i | Me | Et | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Ms  | H |
| Pr-i | Me | Et | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et                   | Ms  | H |
| Pr-i | Me | Et | CH <sub>2</sub> OCOMe                                | Ms  | H |
| Pr-i | Me | Et | CHMeOCOMe                                            | Ms  | H |
| Me   | Et | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | H |
| Me   | Et | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | H |
| Me   | Et | Me | CHMeOMe                                              | Ms  | H |
| Me   | Et | Me | CHMeOEt                                              | Ms  | H |
| Me   | Et | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Ms  | H |
| Me   | Et | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Ms  | H |
| Me   | Et | Me | CHEtOMe                                              | Ms  | H |
| Me   | Et | Me | CHEtOEt                                              | Ms  | H |
| Me   | Et | Me | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Ms  | H |
| Me   | Et | Me | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Ms  | H |
| Me   | Et | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Ms  | H |
| Me   | Et | Me | CH <sub>2</sub> OCOMe                                | Ms  | H |
| Me   | Et | Me | CHMeOCOMe                                            | Ms  | H |
| Et   | Et | Me | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Ms  | H |
| Et   | Et | Me | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Ms  | H |
| Et   | Et | Me | CHMeOMe                                              | Ms  | H |
| Et   | Et | Me | CHMeOEt                                              | Ms  | H |
| Et   | Et | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Ms  | H |
| Et   | Et | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | Ms  | H |
| Et   | Et | Me | CHEtOMe                                              | Ms  | H |
| Et   | Et | Me | CHEtOEt                                              | Ms  | H |
| Et   | Et | Me | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Ms  | H |
| Et   | Et | Me | CH <sub>2</sub> SEt                                  | Ms  | H |
| Et   | Et | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me                   | Ms  | H |
| Et   | Et | Me | HCH <sub>2</sub> OCOMe                               | Ms  | H |
| Et   | Et | Me | CHMEOCOMe                                            | Ms  | H |

| A    | B  | X  | Y                                   | Z  | Q |
|------|----|----|-------------------------------------|----|---|
| Pr-i | Et | Me | CH <sub>2</sub> OMe                 | Ms | H |
| Pr-i | Et | Me | CH <sub>2</sub> OEt                 | Ms | H |
| Pr-i | Et | Me | CHMeOMe                             | Ms | H |
| Pr-i | Et | Me | CHMeOEt                             | Ms | H |
| Pr-i | Et | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | H |
| Pr-i | Et | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt | Ms | H |
| Pr-i | Et | Me | CH <sub>2</sub> EtOMe               | Ms | H |
| Pr-i | Et | Me | CH <sub>2</sub> EtOEt               | Ms | H |
| Pr-i | Et | Me | CH <sub>2</sub> SMe                 | Ms | H |
| Pr-i | Et | Me | CH <sub>2</sub> SEt                 | Ms | H |
| Pr-i | Et | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me  | Ms | H |
| Pr-i | Et | Me | CH <sub>2</sub> OCOMe               | Ms | H |
| Pr-i | Et | Me | CHMeOCOMe                           | Ms | H |
| Me   | Et | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                 | Ms | H |
| Me   | Et | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | Ms | H |
| Me   | Et | Cl | CHMeOMe                             | Ms | H |
| Me   | Et | Cl | CHMeOEt                             | Ms | H |
| Me   | Et | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | H |
| Me   | Et | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt | Ms | H |
| Me   | Et | Cl | CH <sub>2</sub> EtOMe               | Ms | H |
| Me   | Et | Cl | CH <sub>2</sub> EtOEt               | Ms | H |
| Me   | Et | Cl | CH <sub>2</sub> SMe                 | Ms | H |
| Me   | Et | Cl | CH <sub>2</sub> SEt                 | Ms | H |
| Me   | Et | Cl | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me  | Ms | H |
| Me   | Et | Cl | CH <sub>2</sub> OCOMe               | Ms | H |
| Me   | Et | Cl | CHMeOCOMe                           | Ms | H |
| Et   | Et | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                 | Ms | H |
| Et   | Et | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | Ms | H |
| Et   | Et | Cl | CHMeOMe                             | Ms | H |
| Et   | Et | Cl | CHMeOEt                             | Ms | H |
| Et   | Et | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | H |
| Et   | Et | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt | Ms | H |
| Et   | Et | Cl | CH <sub>2</sub> EtOMe               | Ms | H |
| Et   | Et | Cl | CH <sub>2</sub> EtOEt               | Ms | H |
| Et   | Et | Cl | CH <sub>2</sub> SMe                 | Ms | H |
| Et   | Et | Cl | CH <sub>2</sub> SEt                 | Ms | H |
| Et   | Et | Cl | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me  | Ms | H |
| Et   | Et | Cl | CH <sub>2</sub> OCOMe               | Ms | H |
| Et   | Et | Cl | CHMeOCOMe                           | Ms | H |
| Pr-i | Et | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                 | Ms | H |
| Pr-i | Et | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | Ms | H |
| Pr-i | Et | Cl | CH <sub>2</sub> OMe                 | Ms | H |
| Pr-i | Et | Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | Ms | H |
| Pr-i | Et | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | H |
| Pr-i | Et | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt | Ms | H |

| A    | B                   | X  | Y                                   | Z  | Q |
|------|---------------------|----|-------------------------------------|----|---|
| Pr-i | Et                  | Cl | CH <sub>3</sub> EtOMe               | Ms | H |
| Pr-i | Et                  | Cl | CH <sub>3</sub> EtOEt               | Ms | H |
| Pr-i | Et                  | Cl | CH <sub>2</sub> SMe                 | Ms | H |
| Pr-i | Et                  | Cl | CH <sub>2</sub> SEt                 | Ms | H |
| Pr-i | Et                  | Cl | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me  | Ms | H |
| Pr-i | Et                  | Cl | CH <sub>2</sub> OCOMe               | Ms | H |
| Pr-i | Et                  | Cl | CHMeOCOMe                           | Ms | H |
| Me   | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CH <sub>2</sub> OMe                 | Ms | H |
| Me   | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CH <sub>2</sub> OEt                 | Ms | H |
| Me   | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CHMeOMe                             | Ms | H |
| Me   | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CHMeOEt                             | Ms | H |
| Me   | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | H |
| Me   | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt | Ms | H |
| Me   | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CH <sub>3</sub> EtOMe               | Ms | H |
| Me   | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CH <sub>3</sub> EtOEt               | Ms | H |
| Me   | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CH <sub>2</sub> SMe                 | Ms | H |
| Me   | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CH <sub>2</sub> SEt                 | Ms | H |
| Me   | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me  | Ms | H |
| Me   | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CH <sub>2</sub> OCOMe               | Ms | H |
| Me   | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CHMeOCOMe                           | Ms | H |
| Et   | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CH <sub>2</sub> OMe                 | Ms | H |
| Et   | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CH <sub>2</sub> OEt                 | Ms | H |
| Et   | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CHMeOMe                             | Ms | H |
| Et   | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CHMeOEt                             | Ms | H |
| Et   | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | H |
| Et   | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt | Ms | H |
| Et   | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CH <sub>3</sub> EtOMe               | Ms | H |
| Et   | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CH <sub>3</sub> EtOEt               | Ms | H |
| Et   | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CH <sub>2</sub> SMe                 | Ms | H |
| Et   | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CH <sub>2</sub> SEt                 | Ms | H |
| Et   | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me  | Ms | H |
| Et   | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CH <sub>2</sub> OCOMe               | Ms | H |
| Et   | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CHMeOCOMe                           | Ms | H |
| Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CH <sub>2</sub> OMe                 | Ms | H |
| Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CH <sub>2</sub> OEt                 | Ms | H |
| Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CHMeOMe                             | Ms | H |
| Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CHMeOEt                             | Ms | H |
| Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | H |
| Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt | Ms | H |
| Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CH <sub>3</sub> EtOMe               | Ms | H |
| Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CH <sub>3</sub> EtOEt               | Ms | H |
| Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CH <sub>2</sub> SMe                 | Ms | H |
| Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CH <sub>2</sub> SEt                 | Ms | H |
| Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me  | Ms | H |
| Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe | Me | CH <sub>2</sub> OCOMe               | Ms | H |

| A    | B                   | X    | Y                                   | Z  | Q |
|------|---------------------|------|-------------------------------------|----|---|
| Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe | Me   | CHMeOCOMe                           | Ms | H |
| Me   | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CH <sub>2</sub> OMe                 | Ms | H |
| Me   | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CH <sub>2</sub> OEt                 | Ms | H |
| Me   | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CHMeOMe                             | Ms | H |
| Me   | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CHMeOEt                             | Ms | H |
| Me   | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | H |
| Me   | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt | Ms | H |
| Me   | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CHEtOMe                             | Ms | H |
| Me   | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CHEtOEt                             | Ms | H |
| Me   | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CH <sub>2</sub> SMe                 | Ms | H |
| Me   | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CH <sub>2</sub> SEt                 | Ms | H |
| Me   | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me  | Ms | H |
| Me   | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CH <sub>2</sub> OCOMe               | Ms | H |
| Me   | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CHMeOCOMe                           | Ms | H |
| Et   | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CH <sub>2</sub> OMe                 | Ms | H |
| Et   | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CH <sub>2</sub> OEt                 | Ms | H |
| Et   | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CHMeOMe                             | Ms | H |
| Et   | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CHMeOEt                             | Ms | H |
| Et   | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | H |
| Et   | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt | Ms | H |
| Et   | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CHEtOMe                             | Ms | H |
| Et   | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CHEtOEt                             | Ms | H |
| Et   | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CH <sub>2</sub> SMe                 | Ms | H |
| Et   | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CH <sub>2</sub> SEt                 | Ms | H |
| Et   | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me  | Ms | H |
| Et   | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CH <sub>2</sub> OCOMe               | Ms | H |
| Et   | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CHMeOCOMe                           | Ms | H |
| Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CH <sub>2</sub> OMe                 | Ms | H |
| Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CH <sub>2</sub> OEt                 | Ms | H |
| Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CHMeOMe                             | Ms | H |
| Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CHMeOEt                             | Ms | H |
| Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | H |
| Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt | Ms | H |
| Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CHEtOMe                             | Ms | H |
| Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CHEtOEt                             | Ms | H |
| Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CH <sub>2</sub> SMe                 | Ms | H |
| Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CH <sub>2</sub> SEt                 | Ms | H |
| Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me  | Ms | H |
| Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CH <sub>2</sub> OCOMe               | Ms | H |
| Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe | Cl   | CHMeOCOMe                           | Ms | H |
| Me   | H                   | Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe                 | Ms | H |
| Me   | H                   | Pr-i | CH <sub>2</sub> OEt                 | Ms | H |
| Me   | H                   | Pr-i | CHMeOMe                             | Ms | H |
| Me   | H                   | Pr-i | CHMeOEt                             | Ms | H |
| Me   | H                   | Pr-i | CHEtOMe                             | Ms | H |

| A    | B  | X    | Y                                  | Z  | Q |
|------|----|------|------------------------------------|----|---|
| Me   | H  | Pr-i | CH <sub>3</sub> EtOEt              | Ms | H |
| Me   | H  | Pr-i | CH <sub>2</sub> SMe                | Ms | H |
| Me   | H  | Pr-i | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me | Ms | H |
| Me   | H  | Pr-i | CH <sub>2</sub> OCOMe              | Ms | H |
| Me   | H  | Pr-i | CHMeOCOMe                          | Ms | H |
| Et   | H  | Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe                | Ms | H |
| Et   | H  | Pr-i | CH <sub>2</sub> OEt                | Ms | H |
| Et   | H  | Pr-i | CHMeOMe                            | Ms | H |
| Et   | H  | Pr-i | CHMeOEt                            | Ms | H |
| Et   | H  | Pr-i | CH <sub>3</sub> EtOMe              | Ms | H |
| Et   | H  | Pr-i | CH <sub>3</sub> EtOEt              | Ms | H |
| Et   | H  | Pr-i | CH <sub>2</sub> SMe                | Ms | H |
| Et   | H  | Pr-i | CH <sub>2</sub> SEt                | Ms | H |
| Et   | H  | Pr-i | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me | Ms | H |
| Et   | H  | Pr-i | CH <sub>2</sub> OCOMe              | Ms | H |
| Et   | H  | Pr-i | CHMeOCOMe                          | Ms | H |
| Pr-i | H  | Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe                | Ms | H |
| Pr-i | H  | Pr-i | CH <sub>2</sub> OEt                | Ms | H |
| Pr-i | H  | Pr-i | CHMeOMe                            | Ms | H |
| Pr-i | H  | Pr-i | CHMeOEt                            | Ms | H |
| Pr-i | H  | Pr-i | CH <sub>3</sub> EtOMe              | Ms | H |
| Pr-i | H  | Pr-i | CH <sub>3</sub> EtOEt              | Ms | H |
| Pr-i | H  | Pr-i | CH <sub>2</sub> SMe                | Ms | H |
| Pr-i | H  | Pr-i | CH <sub>2</sub> SEt                | Ms | H |
| Pr-i | H  | Pr-i | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me | Ms | H |
| Pr-i | H  | Pr-i | CH <sub>2</sub> OCOMe              | Ms | H |
| Pr-i | H  | Pr-i | CHMeOCOMe                          | Ms | H |
| Me   | Me | Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe                | Ms | H |
| Me   | Me | Pr-i | CH <sub>2</sub> OEt                | Ms | H |
| Me   | Me | Pr-i | CHMeOMe                            | Ms | H |
| Me   | Me | Pr-i | CHMeOEt                            | Ms | H |
| Me   | Me | Pr-i | CH <sub>2</sub> SMe                | Ms | H |
| Me   | Me | Pr-i | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me | Ms | H |
| Et   | Me | Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe                | Ms | H |
| Et   | Me | Pr-i | CH <sub>2</sub> OMEt               | Ms | H |
| Et   | Me | Pr-i | CHMeOMe                            | Ms | H |
| Et   | Me | Pr-i | CHMeOEt                            | Ms | H |
| Et   | Me | Pr-i | CH <sub>2</sub> SMe                | Ms | H |
| Et   | Me | Pr-i | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me | Ms | H |
| Pr-i | Me | Pr-i | CH <sub>2</sub> OMe                | Ms | H |
| Pr-i | Me | Pr-i | CH <sub>2</sub> OEt                | Ms | H |
| Pr-i | Me | Pr-i | CHMeOMe                            | Ms | H |
| Pr-i | Me | Pr-i | CHMeOEt                            | Ms | H |
| Pr-i | Me | Pr-i | CH <sub>2</sub> SMe                | Ms | H |
| Pr-i | Me | Pr-i | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me | Ms | H |

| A    | B  | X  | Y                   | Z  | Q |
|------|----|----|---------------------|----|---|
| Me   | H  | F  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | H |
| Me   | H  | F  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | H |
| Me   | H  | F  | CHMeOMe             | Ms | H |
| Et   | H  | F  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | H |
| Et   | H  | F  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | H |
| Et   | H  | F  | CHMeOMe             | Ms | H |
| Et   | H  | F  | CHMeOEt             | Ms | H |
| Pr-i | H  | F  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | H |
| Pr-i | H  | F  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | H |
| Pr-i | H  | F  | CHMeOMe             | Ms | H |
| Me   | Me | F  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | H |
| Me   | Me | F  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | H |
| Me   | Me | F  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | H |
| Et   | Me | F  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | H |
| Et   | Me | F  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | H |
| Et   | Me | F  | CHMeOMe             | Ms | H |
| Pr-i | Me | F  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | H |
| Pr-i | Me | F  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | H |
| Me   | H  | Me | CH <sub>2</sub> OMe | Br | H |
| Me   | H  | Me | CH <sub>2</sub> OEt | Br | H |
| Et   | H  | Me | CH <sub>2</sub> OMe | Br | H |
| Et   | H  | Me | CH <sub>2</sub> OEt | Br | H |
| Et   | H  | Me | CHMeOMe             | Br | H |
| Pr-i | H  | Me | CH <sub>2</sub> OMe | Br | H |
| Pr-i | H  | Me | CH <sub>2</sub> OEt | Br | H |
| Me   | H  | Cl | CH <sub>2</sub> OMe | Br | H |
| Me   | H  | Cl | CH <sub>2</sub> OEt | Br | H |
| Et   | H  | Cl | CH <sub>2</sub> OMe | Br | H |
| Et   | H  | Cl | CH <sub>2</sub> OEt | Br | H |
| Et   | H  | Cl | CHMeOMe             | Br | H |
| Pr-i | H  | Cl | CH <sub>2</sub> OMe | Br | H |
| Pr-i | H  | Cl | CH <sub>2</sub> OEt | Br | H |
| Me   | Me | Me | CH <sub>2</sub> OMe | Br | H |
| Et   | Me | Me | CH <sub>2</sub> OMe | Br | H |
| Et   | Me | Me | CH <sub>2</sub> OEt | Br | H |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> OMe | Br | H |
| Me   | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OMe | Br | H |
| Et   | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OMe | Br | H |
| Et   | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OEt | Br | H |
| Et   | Me | Cl | CHMeOMe             | Br | H |
| Pr-i | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OMe | Br | H |
| Me   | H  | Me | CH <sub>2</sub> OMe | I  | H |
| Me   | H  | Me | CH <sub>2</sub> OEt | I  | H |
| Et   | H  | Me | CH <sub>2</sub> OMe | I  | H |
| Et   | H  | Me | CH <sub>2</sub> OEt | I  | H |

| A    | B  | X  | Y                   | Z  | Q                                                                 |
|------|----|----|---------------------|----|-------------------------------------------------------------------|
| Et   | H  | Me | CHMeOMe             | I  | H                                                                 |
| Pr-i | H  | Me | CH <sub>2</sub> OMe | I  | H                                                                 |
| Pr-i | H  | Me | CH <sub>2</sub> OEt | I  | H                                                                 |
| Et   | H  | Cl | CH <sub>2</sub> OMe | I  | H                                                                 |
| Et   | H  | Cl | CH <sub>2</sub> OEt | I  | H                                                                 |
| Et   | H  | Cl | CH <sub>2</sub> OMe | I  | H                                                                 |
| Et   | H  | Cl | CH <sub>2</sub> OEt | I  | H                                                                 |
| Et   | H  | Cl | CHMeOMe             | I  | H                                                                 |
| Pr-i | H  | Cl | CH <sub>2</sub> OMe | I  | H                                                                 |
| Pr-i | H  | Cl | CH <sub>2</sub> OEt | I  | H                                                                 |
| Me   | Me | Me | CH <sub>2</sub> OMe | I  | H                                                                 |
| Et   | Me | Me | CH <sub>2</sub> OMe | I  | H                                                                 |
| Et   | Me | Me | CH <sub>2</sub> OEt | I  | H                                                                 |
| Pr-i | Me | Me | CH <sub>2</sub> OMe | I  | H                                                                 |
| Me   | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OMe | I  | H                                                                 |
| Et   | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OMe | I  | H                                                                 |
| Et   | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OEt | I  | H                                                                 |
| Et   | Me | Cl | CHMeOMe             | I  | H                                                                 |
| Pr-i | Me | Cl | CH <sub>2</sub> OMe | I  | H                                                                 |
| Me   | H  | Me | COOMe               | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Me   | H  | Me | COOMe               | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Me   | H  | Me | COOMe               | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | Me | COOMe               | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | Me | COOMe               | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Me   | H  | Me | COOMe               | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | Me | COOMe               | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Me   | H  | Me | COOMe               | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Et   | H  | Me | COOMe               | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | H  | Me | COOMe               | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Et   | H  | Me | COOMe               | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | Me | COOMe               | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | Me | COOMe               | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Et   | H  | Me | COOMe               | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>2</sub> Et                              |
| Et   | H  | Me | COOMe               | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Et   | H  | Me | COOMe               | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| i-Pr | H  | Me | COOMe               | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| i-Pr | H  | Me | COOMe               | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| i-Pr | H  | Me | COOMe               | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | Me | COOMe               | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | Me | COOMe               | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| i-Pr | H  | Me | COOMe               | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | H  | Me | COOMe               | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| i-Pr | H  | Me | COOMe               | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Me   | Me | Me | COOMe               | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | Me | Me | COOMe               | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |

| A    | B  | X   | Y     | Z  | Q                                                                 |
|------|----|-----|-------|----|-------------------------------------------------------------------|
| Et   | Me | Me  | COOMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | Me | Me  | COOMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | Cl  | COOMe | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Me   | H  | Cl  | COOMe | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Me   | H  | Cl  | COOMe | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | Cl  | COOMe | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | Cl  | COOMe | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Me   | H  | Cl  | COOMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | Cl  | COOMe | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Me   | H  | Cl  | COOMe | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Et   | H  | Cl  | COOMe | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | H  | Cl  | COOMe | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Et   | H  | Cl  | COOMe | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | Cl  | COOMe | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | Cl  | COOMe | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Et   | H  | Cl  | COOMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | H  | Cl  | COOMe | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Et   | H  | Cl  | COOMe | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| i-Pr | H  | Cl  | COOMe | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| i-Pr | H  | Cl  | COOMe | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| i-Pr | H  | Cl  | COOMe | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | Cl  | COOMe | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | Cl  | COOMe | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| i-Pr | H  | Cl  | COOMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | H  | Cl  | COOMe | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| i-Pr | H  | Cl  | COOMe | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Me   | Me | Cl  | COOMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | Me | Cl  | COOMe | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | Me | Cl  | COOMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | Me | Cl  | COOMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | OMe | COOMe | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Me   | H  | OMe | COOMe | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Me   | H  | OMe | COOMe | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | OMe | COOMe | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | OMe | COOMe | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Me   | H  | OMe | COOMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | OMe | COOMe | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Me   | H  | OMe | COOMe | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Et   | H  | OMe | COOMe | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | H  | OMe | COOMe | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Et   | H  | OMe | COOMe | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | OMe | COOMe | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | OMe | COOMe | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Et   | H  | OMe | COOMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | H  | OMe | COOMe | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |

| A    | B  | X   | Y     | Z  | Q                                                                 |
|------|----|-----|-------|----|-------------------------------------------------------------------|
| Et   | H  | OMe | COOMe | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| i-Pr | H  | OMe | COOMe | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| i-Pr | H  | OMe | COOMe | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| i-Pr | H  | OMe | COOMe | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | OMe | COOMe | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | OMe | COOMe | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| i-Pr | H  | OMe | COOMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | H  | OMe | COOMe | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| i-Pr | H  | OMe | COOMe | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Et   | Me | OMe | COOMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | Me  | COOEt | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Me   | H  | Me  | COOEt | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Me   | H  | Me  | COOEt | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | Me  | COOEt | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | Me  | COOEt | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Me   | H  | Me  | COOEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | Me  | COOEt | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Me   | H  | Me  | COOEt | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Et   | H  | Me  | COOEt | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | H  | Me  | COOEt | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Et   | H  | Me  | COOEt | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | Me  | COOEt | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | Me  | COOEt | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Et   | H  | Me  | COOEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | H  | Me  | COOEt | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Et   | H  | Me  | COOEt | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| i-Pr | H  | Me  | COOEt | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| i-Pr | H  | Me  | COOEt | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| i-Pr | H  | Me  | COOEt | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | Me  | COOEt | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | Me  | COOEt | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| i-Pr | H  | Me  | COOEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | H  | Me  | COOEt | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| i-Pr | H  | Me  | COOEt | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Me   | Me | Me  | COOEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | Me | Me  | COOEt | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | Me | Me  | COOEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | Me | Me  | COOEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | Cl  | COOEt | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Me   | H  | Cl  | COOEt | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Me   | H  | Cl  | COOEt | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | Cl  | COOEt | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | Cl  | COOEt | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Me   | H  | Cl  | COOEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | Cl  | COOEt | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |

| A    | B    | X   | Y     | Z  | Q                                                                 |
|------|------|-----|-------|----|-------------------------------------------------------------------|
| Me   | H    | Cl  | COOEt | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Et   | H    | Cl  | COOEt | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | H    | Cl  | COOEt | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Et   | H    | Cl  | COOEt | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H    | Cl  | COOEt | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H    | Cl  | COOEt | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Et   | H    | Cl  | COOEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | H    | Cl  | COOEt | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Et   | H    | Cl  | COOEt | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| i-Pr | H    | Cl  | COOEt | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| i-Pr | H    | Cl  | COOEt | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| i-Pr | H    | Cl  | COOEt | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H    | Cl  | COOEt | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H    | Cl  | COOEt | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| i-Pr | H    | Cl  | COOEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | H    | Cl  | COOEt | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| i-Pr | H    | Cl  | COOEt | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Me   | Me   | Cl  | COOEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | Me   | Cl  | COOEt | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | Me   | Cl  | COOEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | i-Pr | Cl  | COOEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H    | OMe | COOEt | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Me   | H    | OMe | COOEt | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Me   | H    | OMe | COOEt | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H    | OMe | COOEt | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H    | OMe | COOEt | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Me   | H    | OMe | COOEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H    | OMe | COOEt | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Me   | H    | OMe | COOEt | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Et   | H    | OMe | COOEt | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | H    | OMe | COOEt | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Et   | H    | OMe | COOEt | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H    | OMe | COOEt | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H    | OMe | COOEt | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Et   | H    | OMe | COOEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | H    | OMe | COOEt | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Et   | H    | OMe | COOEt | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| i-Pr | H    | OMe | COOEt | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| i-Pr | H    | OMe | COOEt | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| i-Pr | H    | OMe | COOEt | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H    | OMe | COOEt | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H    | OMe | COOEt | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| i-Pr | H    | OMe | COOEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | H    | OMe | COOEt | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| i-Pr | H    | OMe | COOEt | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |

| A    | B  | X   | Y       | Z  | Q                                                                 |
|------|----|-----|---------|----|-------------------------------------------------------------------|
| Et   | Me | OMe | COOEt   | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | Me  | COOPr-i | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Me   | H  | Me  | COOPr-i | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Me   | H  | Me  | COOPr-i | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | Me  | COOPr-i | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | Me  | COOPr-i | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Me   | H  | Me  | COOPr-i | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | Me  | COOPr-i | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Me   | H  | Me  | COOPr-i | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Et   | H  | Me  | COOPr-i | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | H  | Me  | COOPr-i | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Et   | H  | Me  | COOPr-i | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | Me  | COOPr-i | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | Me  | COOPr-i | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Et   | H  | Me  | COOPr-i | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | H  | Me  | COOPr-i | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Et   | H  | Me  | COOPr-i | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| i-Pr | H  | Me  | COOPr-i | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| i-Pr | H  | Me  | COOPr-i | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| i-Pr | H  | Me  | COOPr-i | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | Me  | COOPr-i | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | Me  | COOPr-i | Ms | EtN <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup> H <sub>3</sub>                   |
| i-Pr | H  | Me  | COOPr-i | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | H  | Me  | COOPr-i | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| i-Pr | H  | Me  | COOPr-i | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Me   | Me | Me  | COOPr-i | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | Me | Me  | COOPr-i | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | Me | Me  | COOPr-i | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | Me | Me  | COOPr-i | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | Cl  | COOPr-i | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Me   | H  | Cl  | COOPr-i | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Me   | H  | Cl  | COOPr-i | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | Cl  | COOPr-i | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | Cl  | COOPr-i | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Me   | H  | Cl  | COOPr-i | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | Cl  | COOPr-i | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Me   | H  | Cl  | COOPr-i | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Et   | H  | Cl  | COOPr-i | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | H  | Cl  | COOPr-i | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Et   | H  | Cl  | COOPr-i | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | Cl  | COOPr-i | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | Cl  | COOPr-i | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                     |
| Et   | H  | Cl  | COOPr-i | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | H  | Cl  | COOPr-i | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Et   | H  | Cl  | COOPr-i | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |

| A    | B  | X   | Y                                      | Z  | Q                                                                 |
|------|----|-----|----------------------------------------|----|-------------------------------------------------------------------|
| i-Pr | H  | Cl  | COOPr-i                                | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| i-Pr | H  | Cl  | COOPr-i                                | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| i-Pr | H  | Cl  | COOPr-i                                | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | Cl  | COOPr-i                                | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | Cl  | COOPr-i                                | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                     |
| i-Pr | H  | Cl  | COOPr-i                                | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | H  | Cl  | COOPr-i                                | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| i-Pr | H  | Cl  | COOPr-i                                | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Me   | Me | Cl  | COOPr-i                                | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | Me | Cl  | COOPr-i                                | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | Me | Cl  | COOPr-i                                | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | Me | Cl  | COOPr-i                                | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | OMe | COOPr-i                                | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Me   | H  | OMe | COOPr-i                                | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Me   | H  | OMe | COOPr-i                                | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | OMe | COOPr-i                                | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | OMe | COOPr-i                                | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Me   | H  | OMe | COOPr-i                                | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | OMe | COOPr-i                                | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Me   | H  | OMe | COOPr-i                                | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Et   | H  | OMe | COOPr-i                                | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | H  | OMe | COOPr-i                                | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Et   | H  | OMe | COOPr-i                                | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | OMe | COOPr-i                                | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | OMe | COOPr-i                                | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Et   | H  | OMe | COOPr-i                                | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | H  | OMe | COOPr-i                                | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Et   | H  | OMe | COOPr-i                                | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| i-Pr | H  | OMe | COOPr-i                                | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| i-Pr | H  | OMe | COOPr-i                                | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| i-Pr | H  | OMe | COOPr-i                                | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | OMe | COOPr-i                                | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | OMe | COOPr-i                                | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| i-Pr | H  | OMe | COOPr-i                                | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | H  | OMe | COOPr-i                                | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| i-Pr | H  | OMe | COOPr-i                                | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Et   | Me | OMe | COOPr-i                                | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | Me  | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Me   | H  | Me  | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Me   | H  | Me  | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | Me  | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | Me  | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Me   | H  | Me  | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | Me  | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Me   | H  | Me  | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |

| A       | B  | X                                      | Y                                      | Z                                 | Q                                                                 |
|---------|----|----------------------------------------|----------------------------------------|-----------------------------------|-------------------------------------------------------------------|
| Et      | H  | Me                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et      | H  | Me                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | K <sup>+</sup>                                                    |
| Et      | H  | Me                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et      | H  | Me                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et      | H  | Me                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Et      | H  | Me                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et      | H  | Me                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Et      | H  | Me                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| i-Pr    | H  | Me                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | Na <sup>+</sup>                                                   |
| i-Pr    | H  | Me                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | K <sup>+</sup>                                                    |
| i-Pr    | H  | Me                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr    | H  | Me                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr    | H  | Me                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| i-Pr    | H  | Me                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr    | H  | Me                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| i-Pr    | H  | Me                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Me      | Me | Me                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et      | Me | Me                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et      | Me | Me                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr Me | Me | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                     | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub> |                                                                   |
| Me      | H  | Cl                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Me      | H  | Cl                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | K <sup>+</sup>                                                    |
| Me      | H  | Cl                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me      | H  | Cl                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me      | H  | Cl                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Me      | H  | Cl                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me      | H  | Cl                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Me      | H  | Cl                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Et      | H  | Cl                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et      | H  | Cl                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | K <sup>+</sup>                                                    |
| Et      | H  | Cl                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et      | H  | Cl                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et      | H  | Cl                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Et      | H  | Cl                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et      | H  | Cl                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Et      | H  | Cl                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| i-Pr    | H  | Cl                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | Na <sup>+</sup>                                                   |
| i-Pr    | H  | Cl                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | K <sup>+</sup>                                                    |
| i-Pr    | H  | Cl                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr    | H  | Cl                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr    | H  | Cl                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| i-Pr    | H  | Cl                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr    | H  | Cl                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| i-Pr    | H  | Cl                                     | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms                                | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |

| A    | B  | X   | Y                                      | Z  | Q                                                                 |
|------|----|-----|----------------------------------------|----|-------------------------------------------------------------------|
| Me   | Me | Cl  | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | Me | Cl  | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | Me | Cl  | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | Me | Cl  | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | OMe | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Me   | H  | OMe | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Me   | H  | OMe | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | OMe | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | OMe | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Me   | H  | OMe | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | OMe | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Me   | H  | OMe | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Et   | H  | OMe | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | H  | OMe | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Et   | H  | OMe | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | OMe | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | OMe | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Et   | H  | OMe | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | H  | OMe | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Et   | H  | OMe | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| i-Pr | H  | OMe | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| i-Pr | H  | OMe | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| i-Pr | H  | OMe | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | OMe | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | OMe | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| i-Pr | H  | OMe | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | H  | OMe | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| i-Pr | H  | OMe | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Et   | Me | OMe | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OMe                    | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Me   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OMe                    | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Me   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OMe                    | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OMe                    | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OMe                    | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Me   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OMe                    | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OMe                    | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Me   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OMe                    | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Et   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OMe                    | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OMe                    | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Et   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OMe                    | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OMe                    | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OMe                    | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Et   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OMe                    | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OMe                    | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |

| A    | B  | X   | Y                   | Z  | Q                                                                 |
|------|----|-----|---------------------|----|-------------------------------------------------------------------|
| Et   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| i-Pr | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| i-Pr | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| i-Pr | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| i-Pr | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| i-Pr | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Me   | Me | Me  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | Me | Me  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | Me | Me  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | Me | Me  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Me   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Me   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Me   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Me   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Et   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Et   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Et   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Et   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| i-Pr | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| i-Pr | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| i-Pr | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| i-Pr | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| i-Pr | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Me   | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Me   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Me   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Me   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |

| A    | B  | X   | Y                   | Z  | Q                                                                 |
|------|----|-----|---------------------|----|-------------------------------------------------------------------|
| Me   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Me   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Et   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Et   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Et   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Et   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| i-Pr | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| i-Pr | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| i-Pr | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| i-Pr | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| i-Pr | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Et   | Me | OCl | CH <sub>2</sub> OMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Me   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Me   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Me   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Me   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Et   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Et   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Et   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Et   | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| i-Pr | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| i-Pr | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| i-Pr | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| i-Pr | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| i-Pr | H  | Me  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Me   | Me | Me  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | Me | Me  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | Me | Me  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | Me | Me  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |

| A    | B  | X   | Y                   | Z  | Q                                                                 |
|------|----|-----|---------------------|----|-------------------------------------------------------------------|
| Me   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Me   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Me   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Me   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Me   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Et   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Et   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Et   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Et   | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| i-Pr | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| i-Pr | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| i-Pr | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| i-Pr | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| i-Pr | H  | Cl  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Me   | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | Me | Cl  | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Me   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Me   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Me   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Me   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Et   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Et   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Et   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Et   | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| i-Pr | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| i-Pr | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| i-Pr | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |

| A    | B  | X   | Y                   | Z  | Q                                                                 |
|------|----|-----|---------------------|----|-------------------------------------------------------------------|
| i-Pr | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| i-Pr | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| i-Pr | H  | OMe | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Et   | Me | OMe | CH <sub>2</sub> OEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> CH <sub>3</sub>                                |
| Me   | H  | Me  | CHMeOMe             | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Me   | H  | Me  | CHMeOMe             | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Me   | H  | Me  | CHMeOMe             | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | Me  | CHMeOMe             | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | Me  | CHMeOMe             | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Me   | H  | Me  | CHMeOMe             | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | Me  | CHMeOMe             | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Me   | H  | Me  | CHMeOMe             | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Et   | H  | Me  | CHMeOMe             | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | H  | Me  | CHMeOMe             | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Et   | H  | Me  | CHMeOMe             | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | Me  | CHMeOMe             | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | Me  | CHMeOMe             | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Et   | H  | Me  | CHMeOMe             | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | H  | Me  | CHMeOMe             | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Et   | H  | Me  | CHMeOMe             | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| i-Pr | H  | Me  | CHMeOMe             | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| i-Pr | H  | Me  | CHMeOMe             | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| i-Pr | H  | Me  | CHMeOMe             | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | Me  | CHMeOMe             | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | Me  | CHMeOMe             | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| i-Pr | H  | Me  | CHMeOMe             | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | H  | Me  | CHMeOMe             | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| i-Pr | H  | Me  | CHMeOMe             | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Me   | Me | Me  | CHMeOMe             | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | Me | Me  | CHMeOMe             | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | Me | Me  | CHMeOMe             | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | Me | Me  | CHMeOMe             | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | Cl  | CHMeOMe             | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Me   | H  | Cl  | CHMeOMe             | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Me   | H  | Cl  | CHMeOMe             | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | Cl  | CHMeOMe             | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | Cl  | CHMeOMe             | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Me   | H  | Cl  | CHMeOMe             | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | Cl  | CHMeOMe             | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Me   | H  | Cl  | CHMeOMe             | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Et   | H  | Cl  | CHMeOMe             | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | H  | Cl  | CHMeOMe             | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Et   | H  | Cl  | CHMeOMe             | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | Cl  | CHMeOMe             | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | Cl  | CHMeOMe             | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |

| A    | B  | X   | Y       | Z  | Q                                                                 |
|------|----|-----|---------|----|-------------------------------------------------------------------|
| Et   | H  | Cl  | CHMeOMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | H  | Cl  | CHMeOMe | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Et   | H  | Cl  | CHMeOMe | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| i-Pr | H  | Cl  | CHMeOMe | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| i-Pr | H  | Cl  | CHMeOMe | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| i-Pr | H  | Cl  | CHMeOMe | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | Cl  | CHMeOMe | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | Cl  | CHMeOMe | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| i-Pr | H  | Cl  | CHMeOMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | H  | Cl  | CHMeOMe | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| i-Pr | H  | Cl  | CHMeOMe | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Me   | Me | Cl  | CHMeOMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | Me | Cl  | CHMeOMe | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | Me | Cl  | CHMeOMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | Me | Cl  | CHMeOMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | OMe | CHMeOMe | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Me   | H  | OMe | CHMeOMe | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Me   | H  | OMe | CHMeOMe | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | OMe | CHMeOMe | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | OMe | CHMeOMe | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Me   | H  | OMe | CHMeOMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | OMe | CHMeOMe | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Me   | H  | OMe | CHMeOMe | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Et   | H  | OMe | CHMeOMe | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | H  | OMe | CHMeOMe | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Et   | H  | OMe | CHMeOMe | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | OMe | CHMeOMe | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | OMe | CHMeOMe | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Et   | H  | OMe | CHMeOMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | H  | OMe | CHMeOMe | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Et   | H  | OMe | CHMeOMe | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| i-Pr | H  | OMe | CHMeOMe | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| i-Pr | H  | OMe | CHMeOMe | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| i-Pr | H  | OMe | CHMeOMe | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | OMe | CHMeOMe | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | OMe | CHMeOMe | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| i-Pr | H  | OMe | CHMeOMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | H  | OMe | CHMeOMe | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| i-Pr | H  | OMe | CHMeOMe | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Et   | Me | OMe | CHMeOMe | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | Me  | CHMeOEt | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Me   | H  | Me  | CHMeOEt | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Me   | H  | Me  | CHMeOEt | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | Me  | CHMeOEt | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | Me  | CHMeOEt | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Me   | H  | Me  | CHMeOEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | Me  | CHMeOEt | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |

| A    | B  | X  | Y       | Z  | Q                                                                 |
|------|----|----|---------|----|-------------------------------------------------------------------|
| Me   | H  | Me | CHMeOEt | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Et   | H  | Me | CHMeOEt | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | H  | Me | CHMeOEt | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Et   | H  | Me | CHMeOEt | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | Me | CHMeOEt | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | Me | CHMeOEt | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Et   | H  | Me | CHMeOEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | H  | Me | CHMeOEt | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Et   | H  | Me | CHMeOEt | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| i-Pr | H  | Me | CHMeOEt | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| i-Pr | H  | Me | CHMeOEt | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| i-Pr | H  | Me | CHMeOEt | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | Me | CHMeOEt | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | Me | CHMeOEt | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| i-Pr | H  | Me | CHMeOEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | H  | Me | CHMeOEt | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| i-Pr | H  | Me | CHMeOEt | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Me   | Me | Me | CHMeOEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | Me | Me | CHMeOEt | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | Me | Me | CHMeOEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | Me | Me | CHMeOEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | Cl | CHMeOEt | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Me   | H  | Cl | CHMeOEt | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Me   | H  | Cl | CHMeOEt | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | Cl | CHMeOEt | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | Cl | CHMeOEt | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Me   | H  | Cl | CHMeOEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | Cl | CHMeOEt | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Me   | H  | Cl | CHMeOEt | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Et   | H  | Cl | CHMeOEt | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | H  | Cl | CHMeOEt | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Et   | H  | Cl | CHMeOEt | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | Cl | CHMeOEt | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | Cl | CHMeOEt | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Et   | H  | Cl | CHMeOEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | H  | Cl | CHMeOEt | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Et   | H  | Cl | CHMeOEt | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| i-Pr | H  | Cl | CHMeOEt | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| i-Pr | H  | Cl | CHMeOEt | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| i-Pr | H  | Cl | CHMeOEt | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | Cl | CHMeOEt | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | Cl | CHMeOEt | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| i-Pr | H  | Cl | CHMeOEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | H  | Cl | CHMeOEt | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| i-Pr | H  | Cl | CHMeOEt | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Me   | Me | Cl | CHMeOEt | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | Me | Cl | CHMeOEt | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |

| A    | B  | X   | Y          | Z  | Q                                                                 |
|------|----|-----|------------|----|-------------------------------------------------------------------|
| Et   | Me | Cl  | CHMeOEt    | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | Me | Cl  | CHMeOEt    | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | OMe | CHMeOEt    | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Me   | H  | OMe | CHMeOEt    | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Me   | H  | OMe | CHMeOEt    | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | OMe | CHMeOEt    | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Me   | H  | OMe | CHMeOEt    | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Me   | H  | OMe | CHMeOEt    | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | OMe | CHMeOEt    | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Me   | H  | OMe | CHMeOEt    | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Et   | H  | OMe | CHMeOEt    | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| Et   | H  | OMe | CHMeOEt    | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| Et   | H  | OMe | CHMeOEt    | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | OMe | CHMeOEt    | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| Et   | H  | OMe | CHMeOEt    | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| Et   | H  | OMe | CHMeOEt    | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Et   | H  | OMe | CHMeOEt    | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| Et   | H  | OMe | CHMeOEt    | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| i-Pr | H  | OMe | CHMeOEt    | Ms | Na <sup>+</sup>                                                   |
| i-Pr | H  | OMe | CHMeOEt    | Ms | K <sup>+</sup>                                                    |
| i-Pr | H  | OMe | CHMeOEt    | Ms | Ca <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | OMe | CHMeOEt    | Ms | Mg <sub>1/2</sub> <sup>2+</sup>                                   |
| i-Pr | H  | OMe | CHMeOEt    | Ms | EtN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                   |
| i-Pr | H  | OMe | CHMeOEt    | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| i-Pr | H  | OMe | CHMeOEt    | Ms | Et <sub>2</sub> N <sup>+</sup> H <sub>2</sub>                     |
| i-Pr | H  | OMe | CHMeOEt    | Ms | Me <sub>3</sub> N <sup>+</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH |
| Et   | Me | OMe | CHMeOEt    | Ms | i-PrN <sup>+</sup> H <sub>3</sub>                                 |
| Me   | H  | Me  | CH=CHOMe   | Ms | H                                                                 |
| Et   | H  | Me  | CH=CHOMe   | Ms | H                                                                 |
| i-Pr | H  | Me  | CH=CHOMe   | Ms | H                                                                 |
| Me   | H  | Me  | CH=CHOEt   | Ms | H                                                                 |
| Et   | H  | Me  | CH=CHOEt   | Ms | H                                                                 |
| i-Pr | H  | Me  | CH=CHOEt   | Ms | H                                                                 |
| Me   | H  | Me  | CH=CHOPr-i | Ms | H                                                                 |
| Et   | H  | Me  | CH=CHOPr-i | Ms | H                                                                 |
| i-Pr | H  | Me  | CH=CHOPr-i | Ms | H                                                                 |
| Me   | H  | Cl  | CH=CHOMe   | Ms | H                                                                 |
| Et   | H  | Cl  | CH=CHOMe   | Ms | H                                                                 |
| i-Pr | H  | Cl  | CH=CHOMe   | Ms | H                                                                 |
| Me   | H  | Cl  | CH=CHOEt   | Ms | H                                                                 |
| Et   | H  | Cl  | CH=CHOEt   | Ms | H                                                                 |
| i-Pr | H  | Me  | CH=CHOEt   | Ms | H                                                                 |
| Me   | H  | Cl  | CH=CHOPr-i | Ms | H                                                                 |
| Et   | H  | Cl  | CH=CHOPr-i | Ms | H                                                                 |
| i-Pr | H  | Cl  | CH=CHOPr-i | Ms | H                                                                 |

Az (I) általános képletű új pirazolszármazékokat mezőgazdasági vagy kertészeti növényvédő hatóanyagként általában úgy alkalmazzuk, hogy azt megfelelő hordozóval és adott esetben egyéb adalékkal kikészítjük. Szilárd hordozóként alkalmazható egyebek között agyag, talkum, bentonit vagy diatóma-föld; folyékony hordozóként alkalmazható egyebek között víz, továbbá alkoholok, pl. metanol vagy etanol, aromás szénhidrogének, pl. benzol, toluol vagy xilol; klórozott szénhidrogének; éterek; ketonok; észterek, pl. etil-acetát; vagy valamely sav-amid, pl. DMF. Szükség szerint hozzáadható emulgeáló, diszpergáló, szuszpendáló, behatolást, illetve eloszlást javító, továbbá stabilizáló szer, s így optimális módon formáljuk a készítményt folyékony készítménnyé, emulziókoncentrátummá, nedvesíthető porrá, porózószerré, granulátummá vagy folyósítható készítménnyé.

Szükség szerint kombinálhatjuk a találmány szerint előállítható új hatóanyagot herbicid, inszekticid, baktericid, növényi növekedést szabályozó vagy szinergetikus hatású más szerekkel, akár a kikészítés során, akár az alkalmazás során.

A találmány szerint előállítható (I) általános képletű új hatóanyaggal kombinálható pl. a Farm Chemicals Handbook 73. kiadásában (1987) említett valamely vegyület, közülük előnyösen atrazin, cianazin, alaklór, metolaklór, EPTC, 2,4-D, butilát, dikamba, bromoxinil vagy tridifán.

Ugyancsak előnyös lehet a találmány szerint előállítható új hatóanyaggal kombinálni az US-4 668 277 I.sz. szabadalmi leírásban ismertetett N-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-amino-karbonil]-3-klór-4-metoxi-karbonil-1-metil-pirazol-5-szulfonamid szerkezetű hatóanyagokat.

Az adagolás függ az alkalmazás helyétől, időszakától és módjától, a haszonnövény fajtájától, stb. Általában a hatóanyagot hektáronként 0,001 és 10 kg közötti adagokban alkalmazzuk.

A továbbiakban a találmány szerint előállítható (I) általános képletű hatóanyagot tartalmazó – találmány szerinti – herbicid készítményekre adunk kikészítési példákat, amelyekre a találmány nem korlátozódik. A példákban a „rész” tömegrészt jelent; a hatóanyagként alkalmazott vegyületet a 3. táblázatbeli sorszámmal azonosítjuk. A kereskedelmi nevükkel említett adalékok a következők:

Zeeklite PFP: A Zeeklite Industries Co. Ltd. által gyártott kaolin-típusú agyag.

Carplex: A Shionogi Pharmaceutical Co., Ltd. által gyártott koaguláció-gátló készítmény, amely felületaktív szer és finom szilícium-dioxid por elegye.

Sorpol 5039: A Toho Chemical Co., Ltd. által gyártott készítmény, amely nemionos és anionos felületaktív szer elegye.

Sorpol 2680: A Toho Chemical Co., Ltd. által gyártott készítmény, amely nemionos és anionos felületaktív szer elegye.

Sorpol W-150: A Toho Chemical Co., Ltd. által gyártott nemionos felületaktív szer.

Agrizole B-710: A Kao Corporation által gyártott nemionos felületaktív szer.

Runox 1000C: A Toho Chemical Co., Ltd. által gyártott anionos felületaktív szer.

1% Rodopol water: A Rhone-Poulenc által gyártott sűrítőszer.

Nippol: A Nissan Chemical Industries, Ltd. által gyártott nemionos felületaktív szer.

#### 1. kikészítési példa (nedvesíthető por)

|                 |         |
|-----------------|---------|
| 3. sz. vegyület | 60 rész |
| Zeeklite PFP    | 33 rész |
| Sorpol 5039     | 5 rész  |
| Carplex         | 2 rész  |

A komponenseket egyenletesen porítjuk és összekeverjük, így nedvesíthető port kapunk.

#### 2. kikészítési példa (nedvesíthető por)

|                 |         |
|-----------------|---------|
| 7. sz. vegyület | 60 rész |
| Zeeklite PFP    | 33 rész |
| Sorpol 5039     | 5 rész  |
| Carplex         | 2 rész  |

#### 3. kikészítési példa (nedvesíthető por)

|                  |         |
|------------------|---------|
| 15. sz. vegyület | 60 rész |
| Zeeklite PFP     | 33 rész |
| Sorpol 5039      | 5 rész  |
| Carplex          | 2 rész  |

#### 4. kikészítési példa (nedvesíthető por)

|                  |         |
|------------------|---------|
| 21. sz. vegyület | 60 rész |
| Zeeklite PFP     | 33 rész |
| Sorpol 5039      | 5 rész  |
| Carplex          | 2 rész  |

#### 5. kikészítési példa (nedvesíthető por)

|                  |         |
|------------------|---------|
| 25. sz. vegyület | 60 rész |
| Zeeklite PFP     | 33 rész |
| Sorpol 5039      | 5 rész  |
| Carplex          | 2 rész  |

#### 6. kikészítési példa (nedvesíthető por)

|                  |         |
|------------------|---------|
| 35. sz. vegyület | 60 rész |
| Zeeklite PFP     | 33 rész |
| Sorpol 5039      | 5 rész  |
| Carplex          | 2 rész  |

#### 7. kikészítési példa (emulziókoncentrátum)

|                 |           |
|-----------------|-----------|
| 3. sz. vegyület | 1,5 rész  |
| Xilol           | 78,5 rész |
| DMF             | 15,0 rész |
| Sorpol 2680     | 5,0 rész  |

A komponenseket egyenletesen összekeverjük, így emulziókoncentrátumot kapunk.

#### 8. kikészítési példa (emulziókoncentrátum)

|                  |           |
|------------------|-----------|
| 11. sz. vegyület | 1,5 rész  |
| Xilol            | 78,5 rész |
| DMF              | 15,0 rész |
| Sorpol 2680      | 5,0 rész  |

#### 9. kikészítési példa (folyósítható készítmény)

|                  |           |
|------------------|-----------|
| 3. sz. vegyület  | 40,0 rész |
| Agrizole B-710   | 10,0 rész |
| Runox 1000C      | 0,5 rész  |
| 1% Rodopol water | 20,0 rész |
| Víz              | 29,5 rész |

A komponenseket egyenletesen összekeverjük folyósítható készítménnyé.

|                                                 |           |
|-------------------------------------------------|-----------|
| 10. kikészítési példa (folyósítható készítmény) |           |
| 10. sz. vegyület                                | 40,0 rész |
| Agризole B-710                                  | 10,0 rész |
| Runox 1000C                                     | 0,5 rész  |
| 1% Rodopol water                                | 20,0 rész |
| Víz                                             | 29,5 rész |

|                                              |         |
|----------------------------------------------|---------|
| 11. kikészítési példa (folyékony készítmény) |         |
| 39. sz. vegyület                             | 30 rész |
| Nippol                                       | 10 rész |
| Víz                                          | 60 rész |

A komponenseket egyenletesen összekeverjük folyékony készítménnyé.

|                                              |         |
|----------------------------------------------|---------|
| 12. kikészítési példa (folyékony készítmény) |         |
| 40. sz. vegyület                             | 30 rész |
| Nippol                                       | 10 rész |
| Víz                                          | 60 rész |

|                                              |         |
|----------------------------------------------|---------|
| 13. kikészítési példa (folyékony készítmény) |         |
| 46. sz. vegyület                             | 30 rész |
| Nippol                                       | 10 rész |
| Víz                                          | 60 rész |

|                                              |         |
|----------------------------------------------|---------|
| 14. kikészítési példa (folyékony készítmény) |         |
| 41. sz. vegyület                             | 10 rész |
| Sorpol W-150                                 | 10 rész |
| Víz                                          | 80 rész |

A komponenseket egyenletesen összekeverjük folyékony készítménnyé.

A fenti nedvesíthető porokat, emulziókoncentrátumokat, folyósítható vagy folyékony készítményeket az alkalmazáshoz vízzel hígítjuk 1:50 és 1:1000 közötti arányban és úgy alkalmazzuk, hogy a megfelelő hatóanyag hektáronkénti mennyisége 0,001 és 5 kg között legyen.

A találmány szerint előállítható új, (I) általános képletű vegyületek nemcsak mezőgazdasági vagy kerteseti művelés alatt álló területeken alkalmazhatók, amilyen pl. a felföldi termőterület, a rizsföld vagy a gyümölcsös, hanem mezőgazdaságilag nem hasznosított területeken is, pl. a gyomnövények elnyomására atlétikai pályák, illetve közterületek gyepesített részén, vasúti pályatesteket szegélyező területeken stb. Itt is az alkalmazás helye és időszaka, a haszonnövény típusa befolyásolja az adagolást, amely általában hektáronkénti 0,001 és 5 kg közötti.

Az (I) általános képletű új vegyületek herbicid hatékonyságát tesztpéldákkal szemléltetjük.

#### 1. teszt-példa: Talajkezelés herbicid hatékonysága

15 cm hosszú, 22 cm széles és 6 cm mély műanyag edényeket alkalmazzunk, amelyeket sterilizált dilúvium talajjal töltünk fel, majd abban elvetjük a következő növények magvait: *Echinochloa crus-galli*, *Setaria viridis*, *Eleusine indica*, *Digitaria adscendens*, *Panicum dichotomiflorum*, *Abutilon theophrasti*, *Amaranthus lividus*, *Polygonum longisetum* és *Zea mays*; ezenkívül elültetjük a *Cyperus esculentus* gumógyökereit. Ezután a felszínt lefedjük további 1,5 cm-es talajréteggel és a talaj felületére előírt felület menti hatóanyag-koncentrációt biztosító módon juttatunk a megfelelő hatóanyagmintával készített herbicid oldatot, egyenletes eloszlásban. Az oldatot úgy készítjük, hogy a megfelelő

nedvesíthető port, emulziókoncentrátumot, folyékony, illetve folyósítható készítményt vízzel hígítjuk és az így kapott oldatot kisméretű permetezőszerszámmal egyenletesen kiszórjuk a teljes felület mentén. A herbicid oldat alkalmazásától számított három hét eltelte után meghatározzuk a herbicid hatást az alábbi minősítő osztályozás alapján:

5: A növekedés elnyomása több mint 90%-os (szinte teljes pusztulás).

10 4: A növekedés elnyomása 70 és 90% közötti.

3: A növekedés elnyomása 40 és 70% közötti.

2: A növekedés elnyomása 20 és 40% közötti.

1: A növekedés elnyomása 5 és 20% közötti.

0: A növekedés elnyomása nem éri el az 5%-ot (szinte teljesen hatástalan).

A minősítő értékeket a következőképpen számítjuk ki:

A növekedés elnyomásának %-os aránya:  $(1 - T/N) \times 100$ , ahol

20 T: a hatóanyagmintával kezelt felületen kikelt gyomnövényzet tömege és

N: a nem kezelt (ellenőrző) felületen kikelt gyomnövényzet tömege

Az eredményeket a 6. táblázat mutatja, amelyben az alkalmazott vegyületeket a 3. táblázatbeli sorszámukkal azonosítjuk.

#### 2. teszt-példa: Levélkezelés herbicid hatékonysága

Ugyancsak 15 cm × 22 cm × 6 cm méretű műanyag edényeket alkalmazzunk, amelyeket feltöltünk sterilizált dilúvium talajjal. Az *Echinochloa crus-galli*, *Setaria viridis*, *Eleusine indica*, *Digitaria adscendens*, *Panicum dichotomiflorum*, *Xanthium strumarium*, *Abutilon theophrasti*, *Amaranthus lividus*, *Polygonum longisetum* és *Zea mays* magvait pontszerűen vetjük és elültetjük a *Cyperus esculentus* gumógyökereit. Ezután a felszínt további 1,5 cm-es talajréteggel lefedjük. Amikor a különböző gyomnövények, illetve a haszonnövény eléri a 2–3 leveles fejlettségi fokot, a hatóanyag előírt koncentrációját biztosító módon permetezzük a levélzetet egyenletesen a herbicid oldatokkal.

A herbicid oldatot úgy készítjük, hogy a – fent megadott kikészítési példák valamelyike szerinti – megfelelő nedvesíthető port, emulziókoncentrátumot, folyékony vagy folyósítható készítményt vízzel hígítjuk és az így kapott oldatot a gyom-, illetve haszonnövény levélzetének teljes felületére egyenletes eloszlásban juttatjuk kisméretű permetezővel. A herbicid oldat alkalmazásától számított két hét eltelte után értékeljük a herbicid hatást az egyes gyomnövényekkel szemben az 1. teszt-példában ismertetett minősítő osztályozás szerint, valamint a haszonnövényeknél tapasztalható fitotoxikus hatást ugyancsak az 1. teszt-példában adott minősítő osztályozás szerint. Az eredményeket a 7. táblázat mutatja, amelyben a hatóanyagokat ugyancsak a 3. táblázatban adott vegyületsorszámokkal azonosítjuk.

A 6. és a 7. táblázatban az adagokat g/l ár dimenzióban adjuk; az ellenőrzés céljából alkalmazott ismert hatóanyagok az EV(A) képletű Atrazine és az EV(B) képletű Alachlor; a növények rövidítései:

EC: Echinochloa crus-galli (kakaslábűfűféle)  
 SE: Setaria viridis (zöld muharféle)  
 EL: Eleusine indica (aszályűfűféle)  
 DI: Digitaria adscendens (ujjasmuhar)  
 PA: Panicum dichotomiflorum (kölesféle)  
 AB: Abutilon theophrasti (selyemmályvaféle)

AM: Amaranthus lividus (disznóparéjféle)  
 PO: Polygonum longisetum (keserűűfűféle)  
 XA: Xanthium strumarium (szerbtővisféle)  
 CY: Cyperus esculentus (kákaféle)  
 ZE: Zea mays (tengeri).

6. táblázat

| Vegyület száma | Adag | EC | Se | EL | DI | PA | AB | AM | PO | CY | ZE |
|----------------|------|----|----|----|----|----|----|----|----|----|----|
| 1              | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 2              | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 3              | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 4              | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 6              | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 7              | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 8              | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 9              | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 10             | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 11             | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 12             | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 13             | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 14             | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 15             | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 16             | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 17             | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |

| Vegyület száma | Adag          | EC          | Se          | EL          | DI          | PA          | AB          | AM          | PO          | CY          | ZE          |
|----------------|---------------|-------------|-------------|-------------|-------------|-------------|-------------|-------------|-------------|-------------|-------------|
| 18             | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 19             | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 20             | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 21             | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 22             | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 23             | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 24             | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 25             | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 26             | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 27             | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 28             | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 29             | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 30             | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 34             | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 35             | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 36             | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 37             | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 39             | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |

| Vegyület száma | Adag | EC | Se | EL | DI | PA | AB | AM | PO | CY | ZE |
|----------------|------|----|----|----|----|----|----|----|----|----|----|
| 40             | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 41             | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 42             | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 43             | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 44             | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 45             | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 46             | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 47             | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 48             | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 49             | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 50             | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 56             | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 58             | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 61             | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 63             | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 64             | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 65             | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 66             | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |

| Vegyület száma                  | Adag | EC | Se | EL | DI | PA | AB | AM | PO | CY | ZE |
|---------------------------------|------|----|----|----|----|----|----|----|----|----|----|
| 67                              | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                                 | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                                 | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 68                              | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                                 | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                                 | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| EV(A)<br>Atrazine, 4<br>8<br>16 | 3    | 1  | 3  | 3  | 1  | 4  | 5  | 5  | 0  | 0  |    |
|                                 | 4    | 2  | 4  | 4  | 2  | 5  | 5  | 5  | 0  | 0  |    |
|                                 | 8    | 3  | 5  | 5  | 3  | 5  | 5  | 5  | 1  | 1  |    |
|                                 | 16   |    |    |    |    |    |    |    |    |    |    |
| EV(B)<br>Alachlor               | 4    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 1  | 1  | 1  | 2  | 0  |
|                                 | 8    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 2  | 2  | 2  | 3  | 0  |
|                                 | 16   | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 3  | 3  | 3  | 4  | 1  |

7. táblázat

| Vegyület száma | Adag | EC | SE | EL | DI | PA | AB | AM | PO | XA | CY | ZE |
|----------------|------|----|----|----|----|----|----|----|----|----|----|----|
| 1              | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 2              | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 3              | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 4              | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 6              | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 7              | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 8              | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 9              | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 10             | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 11             | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 12             | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 13             | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |

| Vegyű-<br>let szá-<br>ma | Adag | EC | SE | EL | DI | PA | AB | AM | PO | XA | CY | ZE |
|--------------------------|------|----|----|----|----|----|----|----|----|----|----|----|
| 14                       | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 15                       | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 16                       | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 17                       | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 18                       | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 19                       | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 20                       | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 21                       | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 22                       | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 23                       | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 24                       | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 25                       | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 26                       | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 27                       | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 28                       | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 29                       | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 30                       | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 34                       | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                          | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |

| Vegyű<br>let szá-<br>ma | Adag          | EC          | SE          | EL          | DI          | PA          | AB          | AM          | PO          | XA          | CY          | ZE          |
|-------------------------|---------------|-------------|-------------|-------------|-------------|-------------|-------------|-------------|-------------|-------------|-------------|-------------|
| 35                      | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 36                      | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 37                      | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 39                      | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 40                      | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 41                      | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 42                      | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 43                      | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 44                      | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 45                      | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 46                      | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 47                      | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 48                      | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 49                      | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 50                      | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 56                      | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 58                      | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |
| 61                      | 0,5<br>1<br>2 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 5<br>5<br>5 | 0<br>0<br>0 |

| Vegyület száma    | Adag | EC | SE | EL | DI | PA | AB | AM | PO | XA | CY | ZE |
|-------------------|------|----|----|----|----|----|----|----|----|----|----|----|
| 63                | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                   | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                   | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 64                | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                   | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                   | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 65                | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                   | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                   | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 66                | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                   | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                   | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 67                | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                   | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                   | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| 68                | 0,5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                   | 1    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
|                   | 2    | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  |
| EV(A)<br>Atrazine | 4    | 3  | 1  | 2  | 3  | 0  | 3  | 5  | 5  | 4  | 0  | 0  |
|                   | 8    | 4  | 2  | 3  | 4  | 1  | 5  | 5  | 5  | 5  | 0  | 1  |
|                   | 16   | 5  | 3  | 4  | 5  | 2  | 5  | 5  | 5  | 5  | 1  | 2  |
| EV(B)<br>Alachlor | 4    | 4  | 3  | 3  | 4  | 3  | 0  | 2  | 2  | 0  | 1  | 0  |
|                   | 8    | 4  | 4  | 4  | 4  | 4  | 1  | 3  | 3  | 1  | 2  | 1  |
|                   | 16   | 5  | 5  | 5  | 5  | 5  | 2  | 4  | 4  | 2  | 3  | 2  |

## SZABADALMI IGÉNYPONTOK

1. Eljárás az (I) általános képletű pirazolszármazékok – ebben a képletben

A jelentése 1–3 szénatomos alkilcsoport;

B jelentése hidrogénatom, 1–3 szénatomos alkil- vagy 2–4 szénatomos alkoxi-alkil-csoport;

X jelentése halogénatom; 1–4 szénatomos alkil- vagy 1–4 szénatomos alkoxicsoprt;

Y jelentése karboxilcsoport,  
(1–6 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport,  
(1–4 szénatomos halogén-alkoxi)-karbonil-csoport,  
(2–6 szénatomos alkoxi-alkoxi)-karbonil-csoport,  
(3–6 szénatomos cikloalkil)-oxi-karbonil-csoport,  
di(1–4 szénatomos alkil)-amino-karbonil-csoport,  
ciano-(1–4 szénatomos alkil)-csoport,  
hidrox-(1–4 szénatomos alkil)-csoport,  
(1–6 szénatomos alkoxi)-(1–4 szénatomos alkil)-csoport,

(1–6 szénatomos halogén-alkoxi)-(1–4 szénatomos)-alkil-csoport,

3–8 szénatomos(alkoxi-alkoxi-alkil)-csoport,  
(3–6 szénatomos alkinil)-oxi-(1–4 szénatomos alkil)-csoport,

(1–4 szénatomos alkil)-tio-(1–4 szénatomos alkil)-csoport

(1–4 szénatomos alkil)-szulfinil-(1–4 szénatomos alkil)-csoport,

(1–4 szénatomos alkil)-szulfonil-(1–4 szénatomos alkil)-csoport,

(1–4 szénatomos alkoxi)-vinil-csoport,

(2–4 szénatomos alkanoil)-oxi-(1–4 szénatomos alkil)-csoport vagy

$(\text{CH}_2)_{n'}\text{N}-\text{CH}_2$ -csoport, ahol  $n' = 4, 5$  vagy  $6$ ;

35 Z jelentése halogénatom, 1–3 szénatomos alkil-tio- vagy 1–3 szénatomos alkil-szulfonil-csoport;

Q jelentése hidrogénatom, fenil-(1–4 szénatomos alkil)- vagy tozilcsoport-

és sóik előállítására, *azzal jellemezve, hogy*

40 a) Q helyén hidrogénatomot tartalmazó (I) általános képletű, vagyis a szűkebb körű (I') általános képletnek megfelelő vegyületek – ahol A, B, X, Y és Z jelentése egyezik a tárgyi körben megadottal – előállítására valamely (II) általános képletű vegyületet – ahol X, Y és Z jelentése egyezik a fent megadottal – egy (III) általános képletű 5-hidroxi-pirazol-származékkal vagy (III') általános képletű 4,5-dihidro-5-pirazolon-származékkal – ahol A és B jelentése egyezik a tárgyi körben megadottal – reagáltatunk; vagy

50 b) Q helyén hidrogénatomot tartalmazó (I) általános képletű, vagyis a szűkebb körű (I') általános képletnek megfelelő vegyületek – ahol A, B, X, Y és Z jelentése egyezik a tárgyi körben megadottal – előállítására valamely (II') általános képletű benzoil-klorid-származékot – ahol X, Y és Z jelentése egyezik a fent megadottal – egy (III) általános képletű 5-hidroxi-pirazol-származékkal – ahol A és B jelentése egyezik a tárgyi körben megadottal – reagáltatunk és a keletkezett (IV) általános képletű

- 5-(benzoil-oxi)-pirazol-származékot – ahol A, B, X, Y és Z jelentése egyezik a fent megadottal – átrendezési reakciónak vetjük alá, vagy
- c) Q helyén hidrogénatomot és Y helyén  $L-S(O)_n-R$  általános képletű csoportot – ahol L jelentése 1–4 szénatomos egyenes vagy elágazó szénláncú alkilcsoport, R jelentése 1–4 szénatomos alkilcsoport,  $n = 1$  vagy 2 – tartalmazó (I) általános képletű vagyis a szűkebb körű (Ib') általános képletnek megfelelő vegyületek – ahol A, B, X és Z jelentése egyezik a tárgyi körben megadottal, L, R és n jelentése pedig egyező a fent megadottal – előállítására valamely (Ia') általános képletű vegyületet – ahol A, B, L, R, X és Z a fenti jelentésűek – oxidálunk; vagy
- d) Q helyén hidrogénatomot és Y helyén  $L'-OH$  általános képletű általános képletű csoportot – ahol L' jelentése egyezik L fent megadott jelentésével – tartalmazó (I) általános képletű, vagyis a szűkebb körű (Id') általános képletnek megfelelő vegyületek – ahol A, B, X, Z és L' jelentése egyezik a fent megadottal – előállítására valamely (Ic') általános képletű 5-hidroxi-4-{3-[ $\omega$ -(alkil-karbonil-oxi)-alkil]-benzoil}-pirazol-származékot – ahol A, B, X, Z és L' jelentése egyezik a fent megadottal, R<sup>1</sup> jelentése egyezik R fent megadott jelentésével – dezacilezünk; vagy
- e) Q helyén egy Q' szubsztituenst és Y helyén egy Y' szubsztituenst – ahol Q' jelentése hidrogénatom kivételével egyezik Q tárgyi körben megadott jelentésével és Y' jelentése karboxilcsoport és hidroxil-(1–4 szénatomos alkil)-csoport kivételével egyezik Y tárgyi körben megadott jelentésével – tartalmazó (I) általános képletű, vagyis a szűkebb körű (I'') általános képletnek megfelelő vegyületek – ahol A, B, X és Z jelentése egyezik a tárgyi körben megadottal – előállítására valamely (Ie') általános képletű 5-hidroxi-4-benzoil-pirazol-származékot – ahol A, B, X, Q, Y' és Z jelentése egyezik a fent megadottal – egy (V) általános képletű vegyülettel – ahol E jelentése halogénatom, Q' jelentése egyezik a fent megadottal – reagáltatunk;
- és kívánt esetben egy kapott (I) általános képletű vegyületet annak valamely sójává alakítunk át. (Elsőbbség: 1988. 03. 15.)

2. Az 1. igénypont szerinti eljárás oly (I) általános képletű pirazolszármazékok előállítására, amelyek képletében

- A jelentése 1–3 szénatomos alkilcsoport,  
 B jelentése hidrogénatom,  
 X jelentése 1–3 szénatomos alkilcsoport,  
 Y jelentése (1–4 szénatomos alkil)-oxi-(1–4 szénatomos alkil)-csoport,  
 Z jelentése (1–3 szénatomos alkil)-szulfonil-csoport,  
 Q jelentése hidrogénatom  
 előállítására, *azzal jellemezve*, hogy megfelelően helyettesített kiindulási vegyületeket alkalmazunk. (Elsőbbség: 1987. 03. 17.)

3. Az 1. igénypont szerinti eljárás oly (I) általános

képletű pirazolszármazékok előállítására, amelyek képletében

- A jelentése 1–3 szénatomos alkilcsoport,  
 B jelentése hidrogénatom vagy 1–3 szénatomos alkilcsoport,  
 X jelentése 1–4 szénatomos alkilcsoport vagy halogénatom,  
 Y jelentése (1–6 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, (1–6 szénatomos alkil)-oxi-(1–4 szénatomos alkil)-csoport, (2–6 szénatomos alkoxi-alkoxi)-karbonil-csoport, (3–6 szénatomos alkinil)-oxi-(1–4 szénatomos alkil)-csoport, (1–4 szénatomos alkil)-tio-(1–4 szénatomos alkil)-csoport, (1–4 szénatomos alkil)-szulfinil-(1–4 szénatomos alkil)-csoport vagy  $-CH_2-N(CH_2)_{n'}$  csoport, ahol n' jelentése 4, 5 vagy 6,  
 Z jelentése (1–3 szénatomos alkil)-szulfonil-csoport vagy halogénatom,  
 Q jelentése hidrogénatom vagy fenil-(1–4 szénatomos alkil)-csoport,  
 és sóik előállítására, *azzal jellemezve*, hogy megfelelően helyettesített kiindulási vegyületeket alkalmazunk. (Elsőbbség: 1987. 09. 30.)

4. Az 1. igénypont szerinti eljárás oly (I) általános képletű pirazolszármazékok előállítására, amelyek képletében

- A jelentése 1–3 szénatomos alkilcsoport,  
 B jelentése hidrogénatom, 1–3 szénatomos alkilcsoport vagy 2–4 szénatomos alkoxi-alkil-csoport,  
 X jelentése 1–4 szénatomos alkilcsoport, 1–4 szénatomos alkoxicssoport vagy halogénatom,  
 Y jelentése karboxilcsoport, (1–6 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, (2–6 szénatomos alkoxi-alkoxi)-karbonil-csoport, (3–6 szénatomos cikloalkil)-oxi-karbonil-csoport, halogén-(1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, (1–4 szénatomos alkoxi)-(1–4 szénatomos alkil)-csoport, hidroxil-((1–4 szénatomos alkil)-csoport, (1–6 szénatomos halogén-alkoxi)-(1–4 szénatomos alkil)-csoport, metoxi-vinil-csoport, etoxi-vinil-csoport, izopropoxi-vinil-csoport, (2–4 szénatomos alkanolil)-oxi-(1–4 szénatomos alkil)-csoport, ciano-(1–4 szénatomos alkil)-csoport, (3–6 szénatomos alkinil)-oxi-(1–4 szénatomos alkil)-csoport vagy  $-CH_2-N(CH_2)_{n'}$  csoport, ahol n' jelentése 4, 5 vagy 6,  
 Z jelentése halogénatom vagy 1–3 szénatomos alkil-tio-csoport,  
 Q jelentése hidrogénatom, fenil-(1–4 szénatomos alkil)-csoport vagy p-toluolszulfonil-csoport,  
 és sóik előállítására, *azzal jellemezve*, hogy megfelelően helyettesített kiindulási vegyületeket alkalmazunk. (Elsőbbség: 1988. 01. 13.)

5. Az 1. igénypont szerinti eljárás 1-etil-5-hidroxi-4-[2-metil-3-(metoxi-metil)-4-metánszulfonil-benzoil]-pirazol előállítására, *azzal jellemezve*, hogy megfelelően helyettesített kiindulási vegyületeket alkalmazunk. (Elsőbbség: 1987. 03. 17.)

6. Az 1. igénypont szerinti eljárás 1-etil-5-hidroxi-4-[2-metil-3-(metoxi-karbonil)-4-metánszulfonil-benzoil]-pirazol vagy 1-metil-5-hidroxi-4-[2-metil-3-(izo-

propoxi-karbonil)-4-metánszulfonil-benzoil]-pirazol előállítására, *azzal jellemezve*, hogy megfelelően helyettesített kiindulási vegyületeket alkalmazunk. (Elsőbbség: 1987. 03. 17.)

7. Az 1. igénypont szerinti eljárás 1-etil-5-hidroxi-4-[2-klór-3-(etil-tio-metil)-4-metánszulfonil-benzoil]-pirazol vagy 1-etil-5-hidroxi-4-[2-klór-3-(etil-szulfonil-metil)-4-metánszulfonil-benzoil]-1-pirazol, vagy 1-etil-5-hidroxi-4-[2-klór-3-(etil-szulfonil-metil)-4-metánszulfonil-benzoil]-pirazol előállítására, *azzal jellemezve*, hogy megfelelően helyettesített kiindulási vegyületeket alkalmazunk. (Elsőbbség: 1987. 03. 17.)

8. Az 1. igénypont szerinti eljárás 1-etil-5-(benzil-oxi)-4-[2,4-diklór-3-(metoxi-karbonil)-benzoil]-pirazol vagy 1-etil-5-hidroxi-4-[2-klór-3-(acetoxi-metil)-4-metánszulfonil-benzoil]-pirazol vagy 1-etil-5-hidroxi-4-[2-klór-3-(hidroxi-metil)-4-metánszulfonil-benzoil]-pirazol előállítására, *azzal jellemezve*, hogy megfelelően helyettesített kiindulási vegyületeket alkalmazunk. (Elsőbbség: 1988. 01. 13.)

9. Herbicid készítmény, amely biológiailag aktív hatóanyagot, szilárd hordozót – előnyösen kaolint – és/vagy cseppfolyós vízóanyagot – előnyösen aromás szénhidrogént és/vagy savamidot – és adott esetben felületaktív anyagot – előnyösen nemionos és anionos felületaktív anyag elegyét – tartalmaz, *azzal jellemezve*, hogy hatóanyagként 0,01–95 tömeg% mennyiségben valamely az 1. igénypont szerinti eljárással előállítható (I) általános képletű pirazolszármazékot – ebben a képletben

A jelentése 1–3 szénatomos alkilcsoport;

B jelentése hidrogénatom, 1–3 szénatomos alkil- vagy 2–4 szénatomos alkoxi-alkil-csoport;

X jelentése halogénatom, 1–4 szénatomos alkil- vagy 1–4 szénatomos alkoxics csoport;

Y jelentése karboxil-, (1–6 szénatomos alkoxi)-karbonil-, (1–4 szénatomos halogén-alkoxi)-karbonil-, (2–6 szénatomos alkoxi-alkoxi)-karbonil-, (3–6 szénatomos cikloalkil)-oxi-karbonil-, di(1–4 szénatomos alkil)-amino-karbonil-, ciano-(1–4 szénatomos alkil)-, hidroxi-(1–4 szénatomos alkil)-, (1–6 szénatomos alkoxi)-(1–4 szénatomos alkil)-, (1–6 szénatomos halogén-alkoxi)-(1–4 szénatomos alkil)-, 3–8 szénatomos (alkoxi-alkoxi-alkil)-, (3–6 szénatomos alkinil)-oxi-(1–4 szénatomos alkil)-,

(1–4 szénatomos alkil)-tio-(1–4 szénatomos alkil)-, (1–4 szénatomos alkil)-szulfonil-(1–4 szénatomos alkil)-, (1–4 szénatomos alkil)-szulfonil-(1–4 szénatomos alkil), (1–4 szénatomos alkoxi)-vinil-csoport, (2–4 szénatomos alkanol-oxi-(1–4 szénatomos alkil)-vagy  $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{CH}_2)_{n'}$  csoport, és ez utóbbiban  $n' = 4, 5$  vagy 6;

Z jelentése halogénatom, 1–3 szénatomos alkil-tio- vagy 1–3 szénatomos alkil-szulfonil-csoport;

Q jelentése hidrogénatom, fenil-(1–4 szénatomos alkil)- vagy tozilcsoport-

vagy ennek valamely sóját tartalmazza. (Elsőbbség: 1988. 03. 15.)

10. A 9. igénypont szerinti herbicid készítmény, *azzal jellemezve*, hogy az hatóanyagként a 2. igénypont szerint előállítható (I) általános képletű pirazolszármazékot – ahol A, B, X, Y, Z és Q jelentése egyezik a 2. igénypontban megadottal – tartalmaz. (Elsőbbség: 1987. 03. 17.)

11. A 9. igénypont szerinti herbicid készítmény, *azzal jellemezve*, hogy az hatóanyagként a 3. igénypont szerint előállítható (I) általános képletű pirazolszármazékot – ahol A, B, X, Y, Z és Q jelentése egyezik a 3. igénypontban megadottal – tartalmaz. (Elsőbbség: 1987. 09. 30.)

12. A 9. igénypont szerinti herbicid készítmény, *azzal jellemezve*, hogy az hatóanyagként a 4. igénypont szerint előállítható (I) általános képletű pirazolszármazékot – ahol A, B, X, Y, Z és Q jelentése egyezik a 4. igénypontban megadottal – tartalmaz. (Elsőbbség: 1988. 01. 13.)

13. Az 1. igénypont szerinti eljárás olyan (I) általános képletű pirazolszármazékok előállítására, amelyek képletében

A jelentése 1–3 szénatomos alkilcsoport,

B jelentése hidrogénatom,

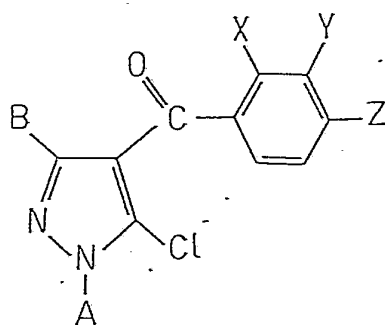
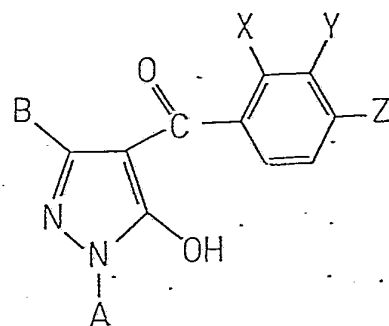
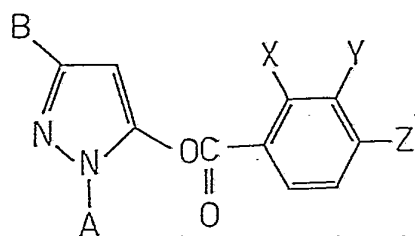
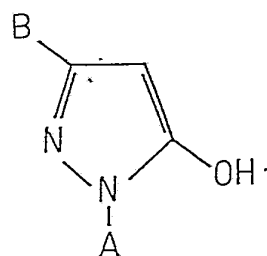
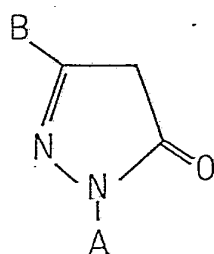
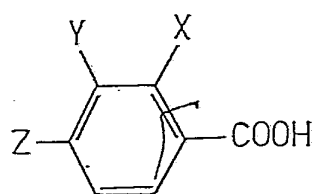
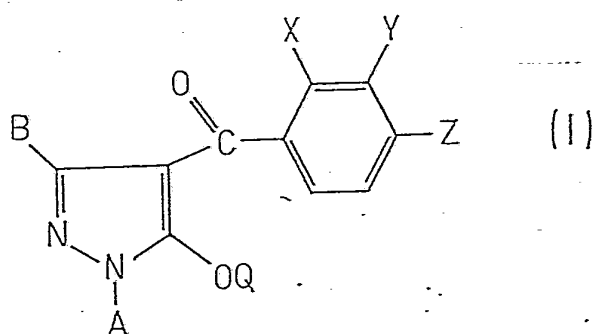
X jelentése 1–3 szénatomos alkilcsoport,

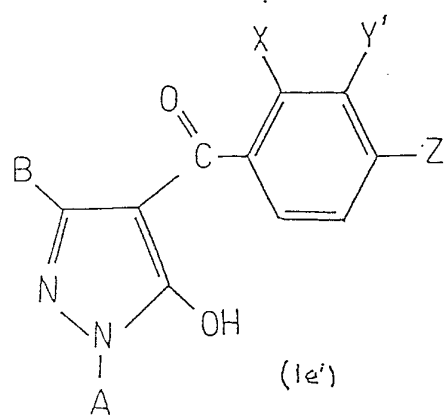
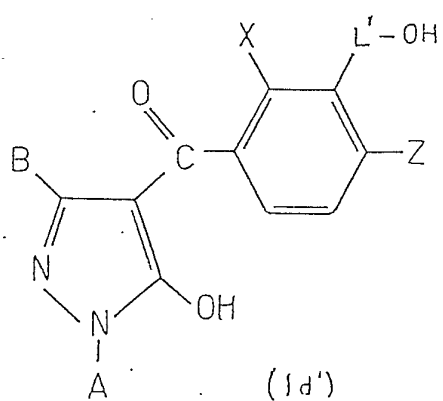
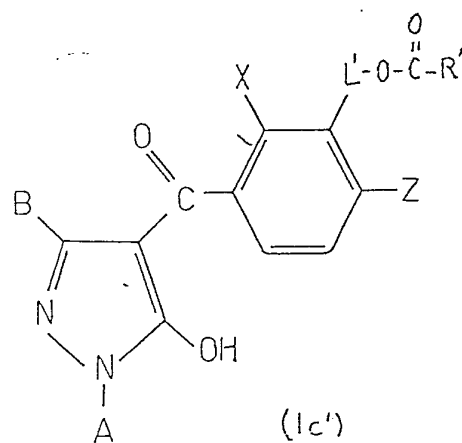
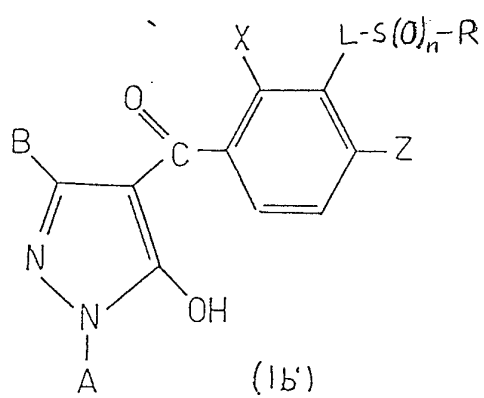
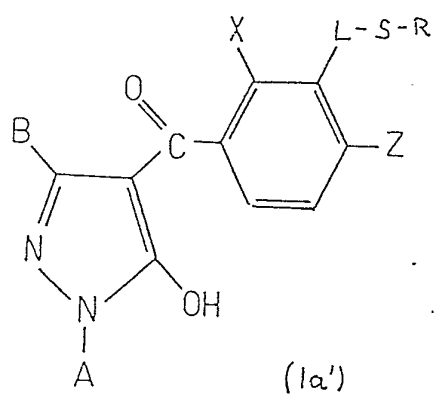
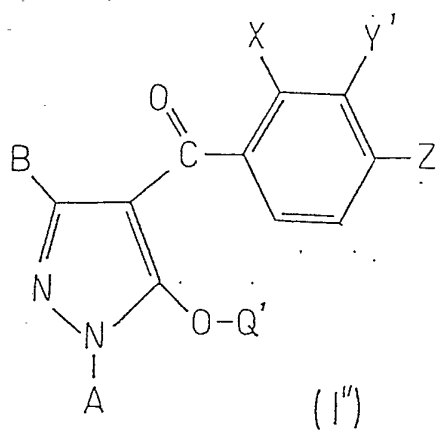
Y jelentése 2–6 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport,

Z jelentése (1–3 szénatomos alkil)-szulfonil-csoport, és

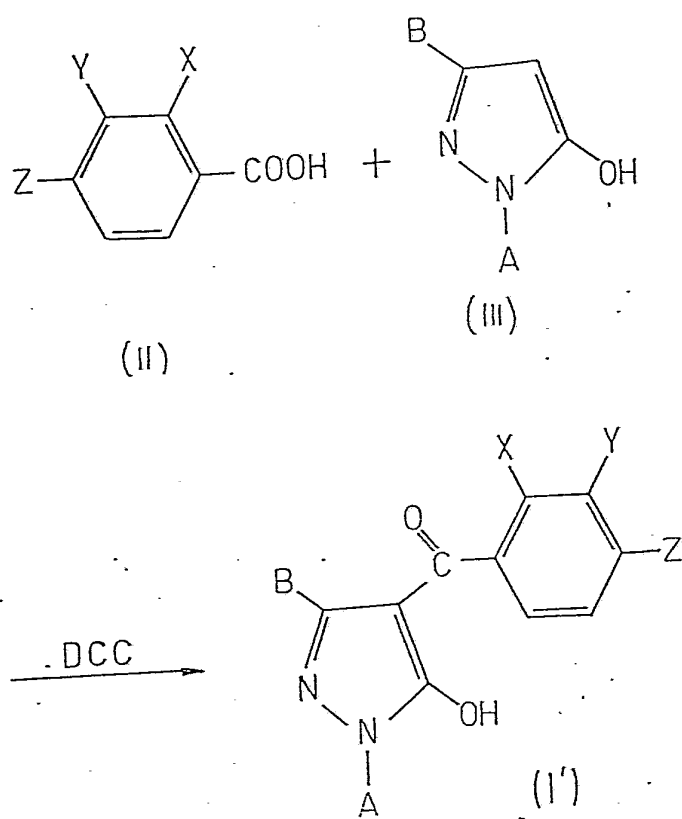
Q jelentése hidrogénatom,

*azzal jellemezve*, hogy megfelelően helyettesített kiindulási vegyületeket alkalmazunk. (Elsőbbség: 1987. 07. 17.)

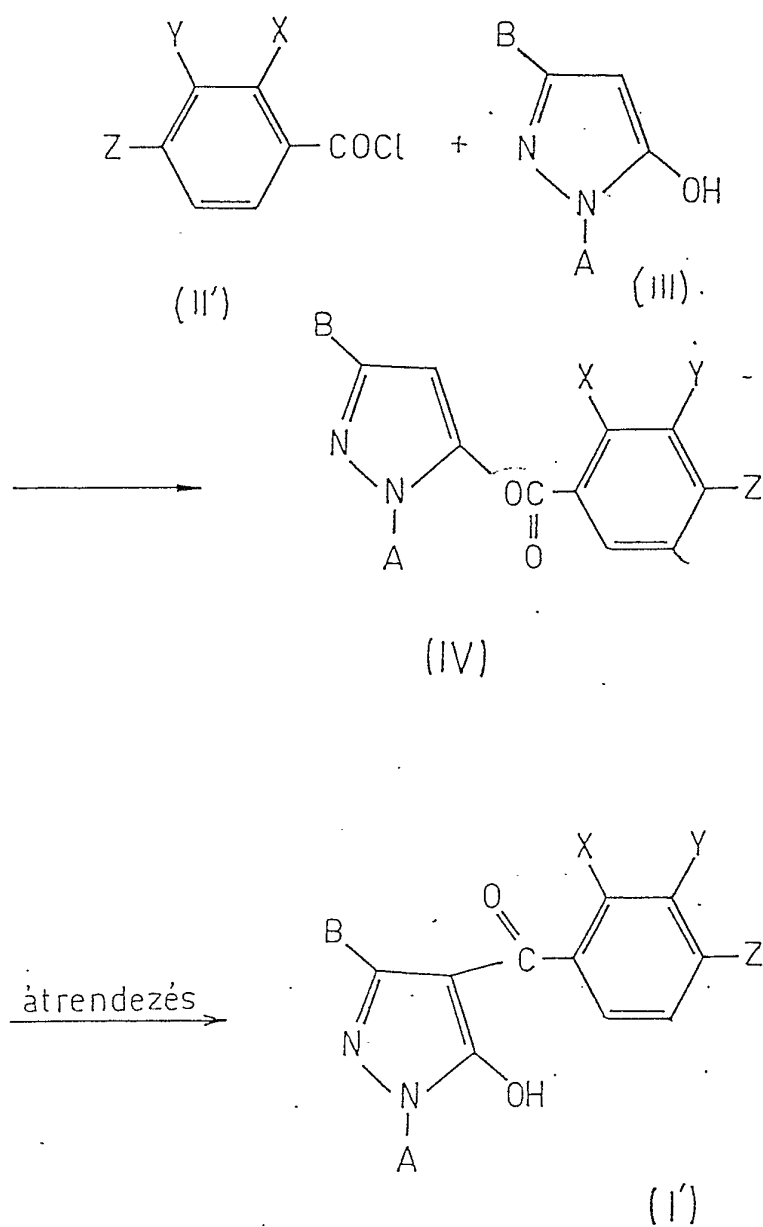




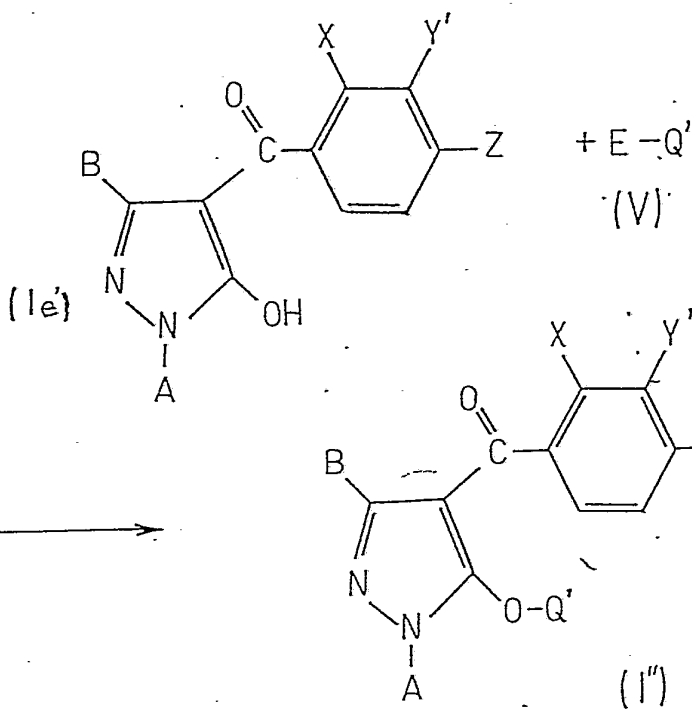
1. folyamatábra



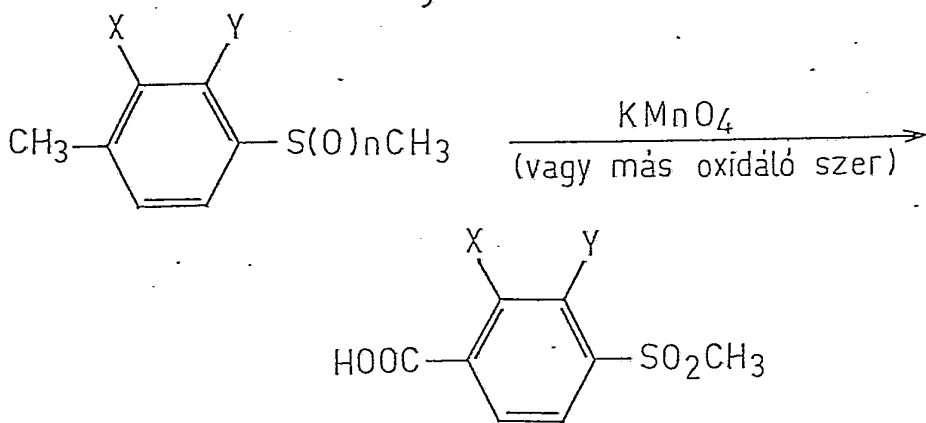
## 2. folymatábra



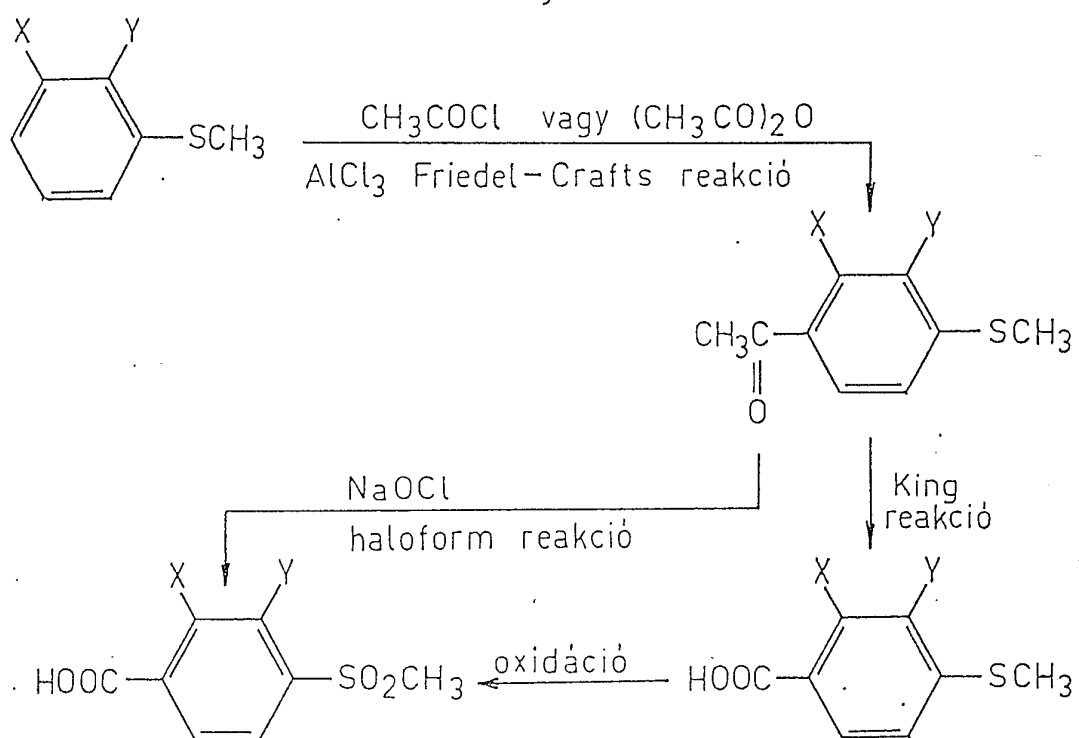
### 3. folyamatabra



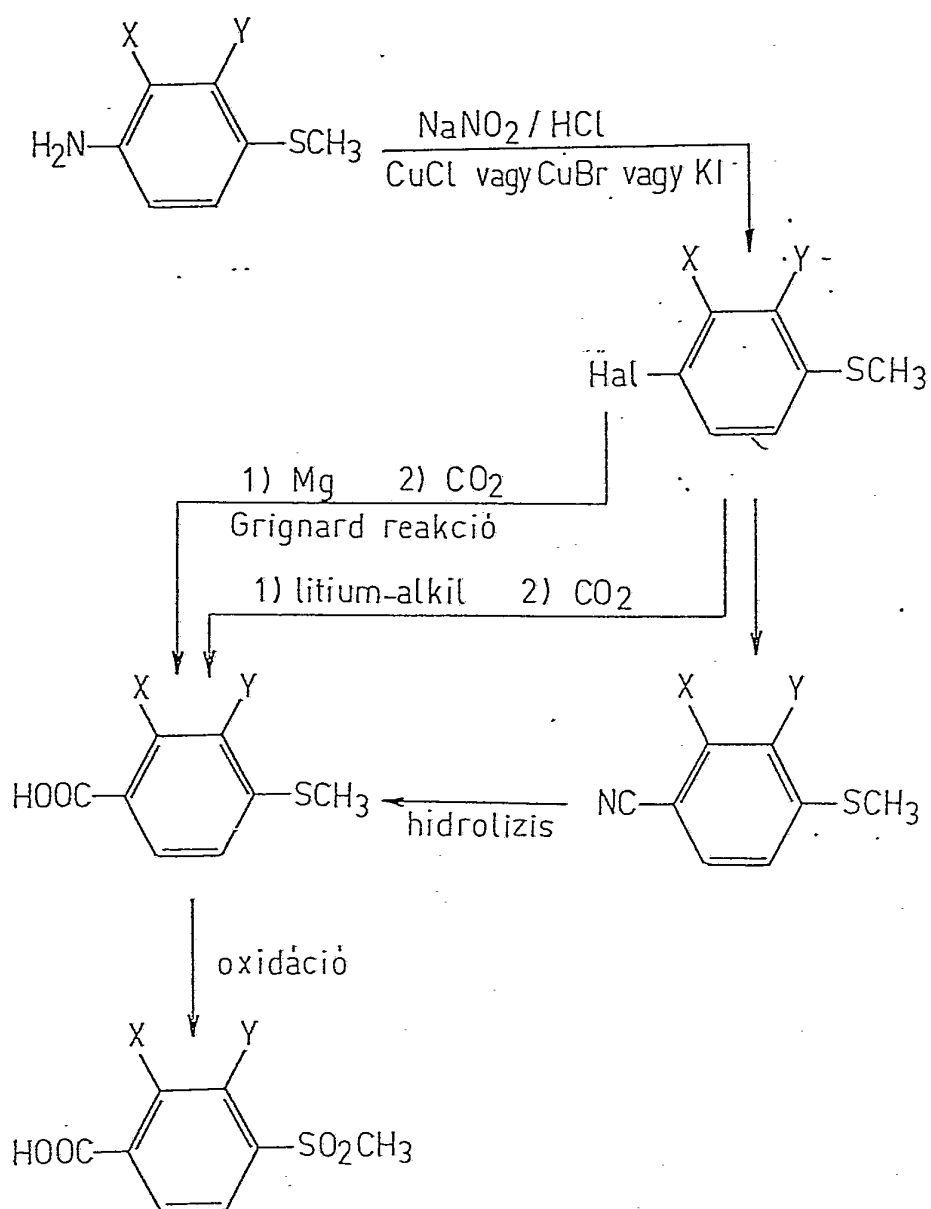
## 5. folyamatóbra

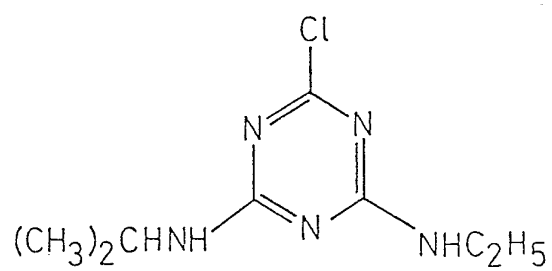


## 6. folyamatabra

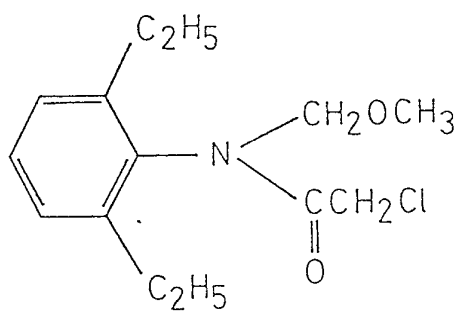


## 7. folyamatabra





EV(A)



EV(B)