1. Antikūno konjugatas, skirtas naudoti kaip vaistas, kur antikūno konjugatas yra gaunamas būdu, apimančiu modifikuoto antikūno reakciją su linkerio konjugatu, kur minėtas linkerio konjugatas apima (hetero)cikloalkinilo grupę ir vieną arba daugiau medžiagų, kurios yra aktyvios farmaciniu požiūriu, kur minėtas modifikuotas antikūnas yra antikūnas, apimantis GlcNAc-S(A)x pakaitą, kuriame GIcNAc yra N-acetilgliukozaminas, S(A)x yra cukraus darinys, apimantis x funkcinių grupių A, A yra azido grupė, ir x yra 1, 2, 3 arba 4, kur minėtas GlcNAc-S(A)x pakaitas yra surištas su antikūnu per minėto GlcNAc-S(A)x pakaito centrinio N-acetilgliukozamino C1 atomą, ir kur minėtas GIcNAc pasirinktinai yra fukozilintas, kur viena arba daugiau medžiagų, kurios yra aktyvios farmaciniu požiūriu, yra citotoksinai, ir kur antikūnas specifiškai rišasi su vėžio antigenu.

2. Antikūno konjugatas, skirtas naudoti vėžio gydymui, kur antikūno konjugatas yra toks, kaip apibrėžta 1 punkte, geriau, kur vėžys yra krūties vėžys.

3. Antikūno konjugatas, skirtas naudoti pagal 2 punktą, kur antikūno konjugatas turi įtakos naviko tūriui.

4. Antikūno konjugatas, skirtas naudoti pagal bet kurį ankstesnį punktą, kur būdas apima šias pakopas:

(i) antikūno, apimančio centrinį N-acetilgliukozamino (GlcNAc) pakaitą, kontaktavimą su junginiu, kurio formulė S(A)x-P, dalyvaujant katalizatoriui, kur minėtas centrinis N-acetilgliukozamino pakaitas pasirinktinai yra fukozilintas, kur minėtas katalizatorius apima mutantinį katalitinį domeną iš galaktoziltransferazės, kur S(A)x yra cukraus darinys, apimantis x funkcinių grupių A, kur A yra azido grupė, ir x yra 1, 2, 3 arba 4, kur P yra parinktas iš grupės, susidedančios iš uridino difosfato (UDP), guanozino difosfato (GDP) ir citidino difosfato (CDP), kad gautų modifikuotą antikūną, kur modifikuotas antikūnas apibrėžiamas kaip antikūnas, apimantis GlcNAc-S(A)x pakaitą, surištą su antikūnu per minėto GlcNAc-S(A)x pakaito centrinio N-acetilgliukozamino C1 atomą, ir kur minėtas modifikuotas antikūnas atitinka formulę (4):

kurioje S(A)x ir x yra tokie, kaip apibrėžta aukščiau; AB reiškia antikūną; GIcNAc yra N-acetilgliukozaminas; Fuc yra fukozė; b yra 0 arba 1; ir y yra nuo 1 iki 20; ir

(ii) minėto modifikuoto antikūno reakciją su linkerio konjugatu, kur minėtas linkerio konjugatas apima (hetero)cikloalkinilo grupę ir vieną arba daugiau citotoksinų.

5. Antikūno konjugatas, skirtas naudoti pagal 4 punktą, kur katalizatorius apima mutantinį katalitinį domeną iš galaktoziltransferazės, geriau, kur katalizatorius yra parinktas iš grupės, susidedančios iš GalT Y289L, GaIT Y289N ir GaIT Y289I arba parinktas iš grupės, susidedančios iš GalT Y289F, GalT Y289M, GaIT Y289V, GaIT Y289G, GaIT Y289I ir GaIT Y289A.

6. Antikūno konjugatas, skirtas naudoti pagal bet kurį ankstesnį punktą, kur (hetero)cikloalkinilo grupė yra (hetero)ciklooktinilo grupė.

7. Antikūno konjugatas, skirtas naudoti pagal bet kurį ankstesnį punktą, kur antikūno konjugatas atitinka formulę (20) arba (20b):

kuriose:

- L yra linkeris;

- D yra citotoksinas;

- r yra 1 - 20;

- R1 yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, halogeno, -OR5, -NOz, -CN, -S(O)2R5, C1-C24 alkilo grupių, C6-C24 (hetero)arilo grupių, C7-C24 alkil(hetero)arilo grupių ir C7-C24 (hetero)arilalkilo grupių, ir kur alkilo grupės, (hetero)arilo grupės, alkil(hetero)arilo grupės ir (hetero)arilalkilo grupės pasirinktinai yra pakeistos, kur du pakaitai R1 gali būti surišti tarpusavyje, kad sudarytų kondensuotą cikloalkilo arba kondensuotą (hetero)areno pakaitą, ir kur R5 yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, halogeno, C1-C24 alkilo grupių, C6-C24 (hetero)arilo grupių, C7-C24 alkil(hetero)arilo grupių ir C7-C24 (hetero)arilalkilo grupių;

- X yra C(R1)2, O, S arba NR2, kur R2 yra R1 arba L(D)r, ir kur L, D ir r yra tokie, kaip apibrėžta aukščiau;

- q yra 0 arba 1, su sąlyga, kad, jei q yra 0, tada X yra N-L(D)r;

- b yra 0 arba 1;

- p yra 0 arba 1;

- Q yra -N(H)C(O)CH2- arba -CH2-;

- x yra 1, 2, 3 arba 4;

- y yra 1 - 20;

- AB yra antikūnas;

- S yra cukrus arba cukraus darinys;

- GIcNAc yra N-acetilgliukozaminas; ir

- Fuc yra fukozė,

ir kur:

- formulėje (20),a yra 4, 5, 6 arba 7; ir

- formulėje (20b):

- a yra 0,1, 2, 3, 4, 5, 6 arba 7;

- a’ yra 0,1, 2, 3, 4, 5, 6 arba 7; ir

- a+a’ yra 4, 5, 6 arba 7,

geriau, kur formulėje (20)a yra 5, ir formulėje (20b)a+a’ yra 5.

8. Antikūno konjugatas, skirtas naudoti pagal 7 punktą, kur antikūno konjugatas turi formulę (15b), (21) arba (22):

kuriose:

- AB, GIcNAc, Fuc, L, D, S, Q, x, y, b, p, r, R1 ir yra tokie, kaip apibrėžta 7 punkte;

- Y yra O, S arba NR2, kur R2 yra toks, kaip apibrėžta 7 punkte;

- R3 yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, halogeno, C1-C24 alkilo grupių, C6-C24 (hetero)arilo grupių, C7-C24 alkil(hetero)arilo grupių ir C7-C24 (hetero)arilalkilo grupių;

- R4 yra parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, Y-L(D)r, -(CH2)n-Y-L(D)r, halogeno, C1-C24 alkilo grupių, C6-C24 (hetero)arilo grupių, C7-C24 alkil(hetero)arilo grupių ir C7-C24 (hetero)arilalkilo grupių, kai alkilo grupės pasirinktinai yra pertrauktos vienu arba daugiau heteroatomų, parinktų iš grupės, susidedančios iš O, N ir S, kur alkilo grupės, (hetero)arilo grupės, alkil(hetero)arilo grupės ir (hetero)arilalkilo grupės nepriklausomai yra pasirinktinai pakeistos; ir

- n yra 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 arba 10.

9. Antikūno konjugatas, skirtas naudoti pagal 7 arba 8 punktą, kur:

- y yra 1, 2, 3 arba 4, geriau, y yra 1 arba 2;

- x yra 1 arba 2, geriau, x yra 1; ir

- r yra 1, 2, 3 arba 4, geriau, r yra 1 arba 2,

dar geriau, kur x yra 1, y yra 1, ir r yra 1, arba x yra 1, y yra 2 ir r yra 1, arba x yra 2, y yra 2 ir r yra 1.

10. Antikūno konjugatas, skirtas naudoti pagal bet kurį ankstesnį punktą, kur medžiaga, kuri yra aktyvi farmaciniu požiūriu, yra citotoksinas, parinktas iš grupės, susidedančios iš kamptotecinų, doksorubicino, daunorubicino, taksanų, kalicheamicinų, duokarmicinų, maitanzinų, matanzinoidų, auristatinų ir pirolobenzodiazepinų, geriausia, iš maitanzino arba monometilo auristatino E (MMAE).

11. Antikūno konjugatas, skirtas naudoti pagal bet kurį ankstesnį punktą, kur antikūnas yra parinktas iš žmogaus antikūnų, humanizuotų antikūnų ir chimerinių antikūnų.

12. Antikūno konjugatas, skirtas naudoti pagal bet kurį ankstesnį punktą, kur antikūnas yra trastuzumabas, ir medžiaga, kuri yra aktyvi farmaciniu požiūriu, yra citotoksinas, parinktas iš maitanzinoido, auristatino E, auristatino F, duokarmicino arba pirolobenzodiazepino.

13. Antikūno konjugatas, skirtas naudoti pagal bet kurį ankstesnį punktą, kur linkeris yra atskeliamas, geriau, kur atskeliamas linkeris apima savaime suskylantį fragmentą, kurį atpalaiduoja biologinis trigeris, geriau, fermentinio skaidymo arba oksidacijos proceso metu.

14. Antikūno konjugatas, skirtas naudoti pagal bet kurį ankstesnį punktą, kur antikūno konjugatas yra vientisas vietos specifiškumo ir stecheometrijos požiūriu, kur konjugacija atliekama tik iš anksto nustatytoje vietoje ir esant iš anksto nustatytam vaisto-antikūno santykiui.

15. Antikūno konjugatas, skirtas naudoti pagal 14 punktą, kur DAR (vaisto-antikūno santykis) reikšmė yra 10 % ribose nuo jos teorinės reikšmės, geriau, kur DAR yra 2, 4 arba 8.