1. Para-amino-benzilo jungtuko junginys, kurio formulė (I):

kur:

• R1 reiškia hidroksilo grupę arba halogeno atomą;

• R2 reiškia -S(O)2(OH) grupę, -S(O)2(O-M+) grupę, linijinę arba šakotą -(C1-C4)alkil-S(O)2(OH) grupę, linijinę arba šakotą -(C1-C4)alkil-S(O)2(O-M+) grupę, linijinę arba šakotą -halogen(C1-C4)alkil-S(O)2(OH) grupę arba linijinę arba šakotą -halogen(C1-C4)alkil-S(O)2(O-M+) grupę;

• A1 reiškia -C(O)-CH(R3)-NH- grupę;

• A2 reiškia -C(O)-CH(R4)-NH- grupę,

grupę,

grupę, arba

grupę;

• R3 ir R4 nepriklausomai vienas nuo kito reiškia aminorūgšties šoninę grandinę;

• X reiškia vandenilio atomą, hidroksilo grupę arba blokuojančią grupę;

• M+ reiškia farmaciniu požiūriu priimtiną vienvalentį katijoną.

2. Para-amino-benzilo jungtuko junginys pagal 1 punktą, kur, kur R1 reiškia hidroksilo grupę, bromo atomą, chloro atomą arba jodo atomą.

3. Para-amino-benzilo jungtuko junginys pagal 1 punktą, kur, kur R2 reiškia -S(O)2(OH) grupę, -S(O)2(O-M+) grupę, -CH2-S(O)2(OH) grupę, -CH2-S(O)2(O-M+) grupę, -CH2-CH2-S(O)2(OH) grupę, -CH2-CH2-S(O)2(O-M+) grupę, -CH2-CH2-CH2-S(O)2(OH) grupę arba -CH2-CH2-CH2-S(O)2(O-M+) grupę.

4. Para-amino-benzilo jungtuko junginys pagal 1 punktą, kur, kur A1 reiškia -C(O)-CH(R3)-NH- grupę, kurioje R3 reiškia -(CH2)3-NH-CO-NH2 grupę arba metilo grupę.

5. Para-amino-benzilo jungtuko junginys pagal 1 punktą, kur A2 reiškia -C(O)-CH(R4)-NH- grupę, kurioje R4 reiškia izopropilo grupę;

grupę,

grupę arba

grupę.

6. Para-amino-benzilo jungtuko junginys pagal 1 punktą, kur A1 reiškia -C(O)-CH(R3)-NH- grupę, ir A2 reiškia -C(O)-CH(R4)-NH- grupę, kurioje R3 ir R4 nepriklausomai vienas nuo kito reiškia aminorūgšties šoninę grandinę.

7. Para-amino-benzilo jungtuko junginys pagal 1 punktą, kuris yra:

- natrio 5-[[(2S)-2-[[(2S)-2-(9H-fluoren-9-ilmetoksikarbonilamino)-3-metil-butanoil]amino]-5-ureido-pentanoil]amino]-2-(hidroksimetil)benzensulfonatas;

- natrio 5-[[(2S)-2-[[(2S)-2-(9H-fluoren-9-ilmetoksikarbonilamino)-3-metil-butanoil]amino]propanoil]amino]-2-(hidroksimetil)benzensulfonatas;

- 5-[[(2S)-2-[[(2S)-2-(9H-fluoren-9-ilmetoksikarbonilamino)-3-metil-butanoil]amino]propanoil]amino]-2-(hidroksimetil)benzensulfonrūgštis;

- natrio [5-[[(2S)-2-[[(2S)-2-(9H-fluoren-9-ilmetoksikarbonilamino)-3-metil-butanoil]amino]-5-ureido-pentanoil]amino]-2-(hidroksimetil)fenil]metansulfonatas;

- 2-(chlormetil)-5-[[(2S)-2-[[(2S)-2-(9H-fluoren-9-ilmetoksikarbonilamino)-3-metil-butanoil]amino]-5-ureido-pentanoil]amino]benzensulfonrūgštis;

- 2-(chlormetil)-5-[[(2S)-2-[[(2S)-2-(9H-fluoren-9-ilmetoksikarbonilamino)-3-metil-butanoil]amino]propanoil]amino] benzensulfonrūgštis;

- 5-[[(2S)-2-[[(2S)-2-(9H-fluoren-9-ilmetoksikarbonilamino)-3-metil-butanoil]amino]-5-ureido-pentanoil]amino]-2-(jodmetil) benzensulfonrūgštis;

- natrio *N*-{[(9*H*-fluoren-9-il)metoksi]karbonil} -L-valil-*N*5-karbamoil-*N*-[4-(hidroksimetil)-3-(2-sulfonatoetil)fenil]-L-ornitinamidas;

- *N*-{[(9*H*-fluoren-9-il)metoksi]karbonil} -L-valil-*N*5-karbamoil-*N*-[4-(hidroksimetil)-3-(3-sulfopropil)fenil]-L-ornitinamidas.

8. Para-amino-benzilo jungtuko junginys, kurio formulė (I), pagal bet kurį iš 1 - 7 punktų, skirtas naudoti antikūno ir vaisto konjugato gamyboje.

9. Jungtuko ir vaisto junginys, kurio formulė (II):

kur:

• D reiškia vaisto fragmentą;

• T yra jungtis, -O-C(O)-N(CH3)-CH2-CH2-N(CH3)-C(O)-\*, -O-\*, -NR5-\*, -NR5-C(O)-\* arba -O-C(O)-\*, kur \* nurodo prijungimo prie D tašką;

• R2 reiškia -S(O)2(OH) grupę, -S(O)2(O-M+) grupę, linijinę arba šakotą -(C1-C4)alkil-S(O)2(OH) grupę, linijinę arba šakotą -(C1-C4)alkil-S(O)2(O-M+) grupę, linijinę arba šakotą -halogen(C1-C4)alkil-S(O)2(OH) grupę arba linijinę arba šakotą -halogen(C1-C4)alkil-S(O)2(O-M+) grupę;

• A1 reiškia -C(O)-CH(R3)-NH- grupę;

• A2 reiškia -C(O)-CH(R4)-NH- grupę

grupę,

grupę arba

grupę;

• R3 ir R4, nepriklausomai vienas nuo kito reiškia aminorūgšties šoninę grandinę;

• R5 reiškia vandenilio atomą arba (C1-C4)alkilo grupę;

• Z’ reiškia tarpiklio elemento pirmtaką;

• M+ reiškia farmaciniu požiūriu priimtiną vienvalentį katijoną.

10. Jungtuko ir vaisto junginys pagal 9 punktą, kur R2 reiškia -S(O)2(OH) grupę, -S(O)2(O-M+) grupę, -CH2-S(O)2(OH) grupę, -CH2-S(O)2(O-M+) grupę, -CH2-CH2-S(O)2(OH) grupę, -CH2-CH2-S(O)2(O-M+) grupę, -CH2-CH2-CH2-S(O)2(OH) grupę arba -CH2-CH2-CH2-S(O)2(O-M+) grupę.

11. Jungtuko ir vaisto junginys pagal 9 punktą, kur A1 reiškia -C(O)-CH(R3)-NH- grupę, kurioje R3 reiškia -(CH2)3-NH-CO-NH2 grupę arba metilo grupę.

12. Jungtuko ir vaisto junginys pagal 9 punktą, kur A2 reiškia -C(O)-CH(R4)-NH- grupę, kurioje R4 reiškia izopropilo grupę;

grupę,

grupę arba

grupę.

13. Jungtuko ir vaisto junginys pagal 9 punktą, kur T reiškia jungtį arba -O-C(O)-\*, kur \* nurodo prijungimo prie D tašką.

14. Jungtuko ir vaisto junginys pagal 9 punktą, kur Z’ reiškia grupę parinktą iš:

arba

kur banguota linija žymi kovalentinio prisijungimo vietą prie N galo arba A2 grupės karbonilo grupės.

15. Jungtuko ir vaisto junginys pagal 9 punktą, kuris yra:

ir

kur R2 ir D yra tokie, kaip apibrėžta 9 punkte.

16. Jungtuko ir vaisto junginys pagal 9 punktą, kuris yra:

- natrio 5-[[(2S)-2-[[(2S)-2-[3-[2-(2,5-dioksopirol-1-il)etoksi]propanoilamino]-3-metil-butanoil]amino]-5-ureido-pentanoil]amino]-2-[[[(1S)-1-[[(1S)-1-[[(1S,2R)-4-[(2S)-2-[(1R,2R)-3-[[(1R,2S)-2-hidroksi-1-metil-2-fenil-etil]amino]-1-metoksi-2-metil-3-okso-propil]pirolidin-1-il]-2-metoksi-1-[(1S)-1-metilpropil]-4-okso-butil]-metil-karbamoil]-2-metil-propil] karbamoil]-2-metil-propil]-metil-karbamoil]oksimetil]benzensulfonatas;

- natrio 5-[[(2S)-2-[[(2S)-2-[6-(2,5-dioksopirol-1-il)heksanoilamino]-3-metil-butanoil]amino]-5-ureido-pentanoil]amino]-2-[[[(1S)-1-[[(1S)-1-[[(1S,2R)-4-[(2S)-2-[(1R,2R)-3-[[(1R,2S)-2-hidroksi-1-metil-2-feniletil]amino]-1-metoksi-2-metil-3-okso-propil]pirolidin-1-il]-2-metoksi-1-[(1S)-1-metilpropil]-4-oksobutil]-metil-karbamoil]-2-metil-propil]karbamoil]-2-metil-propil]-metil-karbamoil]oksimetil]benzensulfonatas;

- natrio 5-[[(2S)-2-[[(2S)-2-[[2-[2-[2-(2azidoetoksi)etoksi]etoksi]acetil]amino]-3-metil-butanoil]amino]-5-ureido-pentanoil]amino]-2-[[[(1S)-1-[[(1S)-1-[[(1S,2R)-4-[(2S)-2-[(1R,2R)-3-[[(1R,2S)-2-hidroksi-1-metil-2-fenil-etil]amino]-1-metoksi-2-metil-3-okso-propil]pirolidin-1-il]-2-metoksi-1-[(1S)-1-metilpropil]-4-okso-butil]-metil-karbamoil]-2-metil-propil] karbamoil]-2-metil-propil]-metil-karbamoil]oksimetil]benzensulfonatas;

- 5-[[(2S)-2-[[1-[2-[2-(2,5-dioksopirol-1-il)etoksi]etilkarbamoil] ciklobutankarbonil]amino]-5-ureido-pentanoil]amino]-2-[[[(1S)-1-[[(1S)-1-[[(1S,2R)-4-[(2S)-2-[(1R,2R)-3-[[(1R,2S)-2-hidroksi-1-metil-2-feniletil]amino]-1-metoksi-2-metil-3-okso-propil]pirolidin-1-il]-2-metoksi-1-[(1S)-1-metilpropil]-4-oksobutil]-metil-karbamoil]-2-metil-propil] karbamoil]-2-metil-propil]-metil-karbamoil]oksimetil]benzensulfonrūgštis;

- natrio 5-[[(2S)-2-[[(2S)-2-[3-[2-(2,5-dioksopirol-1-il)etoksi]propanoilamino]-3-metil-butanoil]amino]propanoil]amino]-2-[[[(1S)-1-[[(1S)-1-[[(1S,2R)-4-[(2S)-2-[(1R,2R)-3-[[(1R,2S)-2-hidroksi-1-metil-2-feniletil]amino]-1-metoksi-2-metil-3-okso-propil]pirolidin-1-il]-2-metoksi-1-[(1S)-1-metilpropil]-4-oksobutil]-metil-karbamoil]-2-metil-propil]karbamoil]-2-metil-propil]-metilkarbamoil]oksimetil]benzensulfonatas;

- 5-[[(2S)-2-[[(2S)-2-[3-[2-(2,5-dioksopirol-1-il)etoksi]propanoilamino]-3-metil-butanoil]amino]propanoil]amino]-2-[[[(1S)-1-[[(1S)-1-[[(S,2R)-4-[(2S)-2-[(1R,2R)-3-[[(1R,2S)-2-hidroksi-1-metil-2-feniletil]amino]-1-metoksi-2-metil-3-okso-propil]pirolidin-1-il]-2-metoksi-1-[(1S)-1-metilpropil]-4-oksobutil]-metil-karbamoil]-2-metil-propil]karbamoil]-2-metil-propil]-metilkarbamoil]oksimetil]benzensulfonrūgštis;

- 5-[[(2S)-2-[[3-[2-[2-(2,5-dioksopirol-1-il)etoksi]etilkarbamoil]oksetan-3-karbonil]amino]-5-ureido-pentanoil]amino]-2-[[[(1S)-1-[[(1S)-1-[[(1S,2R)-4-[(2S)-2-[(1R,2R)-3-[[(1R,2S)-2-hidroksi-1-metil-2-feniletil]amino]-1-metoksi-2-metil-3-okso-propil]pirolidin-1-il]-2-metoksi-1-[(1S)-1-metilpropil]-4-oksobutil]-metil-karbamoil]-2-metil-propil]karbamoil]-2-metil-propil]-metil-karbamoil]oksimetil]benzensulfonrūgštis;

- [5-[[(2S)-2-[[(2S)-2-[3-[2-(2,5-dioksopirol-1-il)etoksi]propanoilamino]-3-metil-butanoil]amino]-5-ureidopentanoil]amino]-2-[[[(1S)-1-[[(1S)-1-[[(1S,2R)-4-[(2S)-2-[(1R,2R)-3-[[(1R,2S)-2-hidroksi-1-metil-2-feniletil]amino]-1-metoksi-2-metil-3-okso-propil]pirolidin-1-il]-2-metoksi-1-[(1S)-1-metilpropil]-4-oksobutil]-metil-karbamoil]-2-metilpropil]karbamoil]-2-metil-propil]-metilkarbamoil]oksimetil]fenil]metansulfonrūgštis;

- [4-[[(2S)-2-[[(2S)-2-[3-[2-(2,5-dioksopirol-1-il)etoksi]propanoilamino]-3-metil-butanoil]amino]-5-ureido-pentanoil]amino]-2-sulfo-fenil]metil-[(1S)-1-[[(1S)-1-[[(1S,2R)-4-[(2S)-2-[(1R,2R)-3-[[(1R,2S)-2-hidroksi-1-metil-2-fenil-etil]amino]-1-metoksi-2-metil-3-okso-propil]pirolidin-1-il]-2-metoksi-1-[(1S)-1-metilpropil]-4-okso-butil]-metil-karbamoil]-2-metil-propil]karbamoil]-2-metil-propil]-dimetil-amonio 2,2,2-trifluoracetatas;

- *N*-({[4-({*N*-[6-(2,5-diokso-2,5-dihidro-1H-pirol-1-il)heksanoil]-L-valil-L-alanil}amino)-2-sulfofenil]metoksi}karbonil)-*N*-metil-L-valil-*N*-[(3*R*,4*S*,5*S*)-1-{(2S)-2-[(1*R*,2*R*)-3-{[(1*S*,2*R*)-1-hidroksi-1-fenilpropan-2-il]amino}-1-metoksi-2-metil-3-oksopropil]pirolidin-1-il}-3-metoksi-5-metil-1-oksoheptan-4-il]-N-metil-L-valinamidas;

- *N*-[6-(2,5-diokso-2,5-dihidro-1H-pirol-1-il)heksanoil]-L-valil-*N*5-karbamoil-*N*-(4-{[({[(4*S*)-4,11-dietil-9-hidroksi-3,14-diokso-3,4,12,14-tetrahidro-1*H*-pyrano[3’,4’:6,7]indolizino[1,2-b]chinolin-4-il]oksi}karbonil)oksi]metil}-3-sulfofenil)-L-ornitinamidas;

- (1*S*,3*S*)-3,5,12-trihidroksi-3-(hidroksiacetil)-10-metoksi-6,11-diokso-1,2,3,4,6,11-heksahidrotetracen-1-il-2,3,6-trideoksi-3-[({[4-({*N*-[6-(2,5-diokso-2,5-dihidro-1H-pirol-1-il)heksanoil]-L-valil-*N*5-karbamoil-L-ornitil}amino)-2-sulfofenil]metoksi}karbonil)amino]-α-L-*likso*-heksopiranozidas;

- *N*-{3-[2-(2,5-diokso-2,5-dihidro-1*H*-pirol-1-il)etoksi]propanoil}-L-valil-N-{4-[(5*S*,8*S*,11*S*,12*R*)-11-[(2*S*)-butan-2-il]-12-(2-{(2*S*)-2-[(1*R*,2*R*)-3-{[(1*S*,2*R*)-1-hidroksi-1-fenilpropan-2-il]amino} -1 -metoksi-2-metil-3 -oksopropil]pirolidin-1-il}-2-oksoetil)-4,10-dimetil-3,6,9-triokso-5,8-di(propan-2-il)-2,13-dioksa-4,7,10-triazatetradekan-1-il]-3-(2-sulfoetil)fenil}-*N*5-karbamoil-L-ornitinamidas;

- 5-[[(2S)-2-[[(2S)-2-[6-(3,4-dibrom-2,5-diokso-pirol-1-il)heksanoilamino]-3-metil-butanoil]amino]-5-ureidopentanoil]amino]-2-[[[(1S)-1-[[(1S)-1-[[(1S,2R)-4-[(2S)-2-[(1R,2R)-3-[[(1R,2S)-2-hidroksi-1-metil-2-feniletil]amino]-1-metoksi-2-metil-3-okso-propil]pirolidin-1-il]-2-metoksi-1-[(1S)-1-metilpropil]-4-oksobutil]-metil-karbamoil]-2-metilpropil]karbamoil]-2-metil-propil]-metilkarbamoil]oksimetil]benzenesulfonrūgštis.

17. Antikūno ir vaisto konjugatas, kurio formulė (III):

kur

• Ab reiškia antikūną arba antigeną surišantį jo fragmentą;

• D yra vaisto fragmentas;

• T yra jungtis, -O-C(O)-N(CH3)-CH2-CH2-N(CH3)-C(O)-\*, -O-\*, -NR5-\*, -NR5-C(O)-\* arba -O-C(O)-\*, kur \* nurodo prijungimo prie D tašką;

• Z reiškia tarpiklio elementą;

• A1 reiškia -C(O)-CH(R3)-NH- grupę;

• A2 reiškia -C(O)-CH(R4)-NH- grupę,

grupę,

grupę arba

grupę;

• R2 reiškia -S(O)2(OH) grupę, -S(O)2(O-M+) grupę, linijinę arba šakotą -(C1-C4)alkil-S(O)2(OH) grupę, linijinę arba šakotą -(C1-C4)alkil-S(O)2(O-M+) grupę, linijinę arba šakotą -halogen(C1-C4)alkil-S(O)2(OH) grupę arba linijinę arba šakotą -halogen(C1-C4)alkil-S(O)2(O-M+) grupę;

• R3 ir R4, nepriklausomai vienas nuo kito reiškia aminorūgšties šoninę grandinę;

• R5 reiškia (C1-C4)alkilo grupę;

• M+ reiškia farmaciniu požiūriu priimtiną vienvalentį katijoną; ir

• p yra sveikas skaičius nuo 1 iki 8.

18. Antikūno ir vaisto konjugatas pagal 17 punktą, kur T yra jungtis arba -O-C(O)-\*, kur \* nurodo prijungimo prie D tašką.

19. Antikūno ir vaisto konjugatas pagal 17 punktą, kur R2 reiškia -S(O)2(OH) grupę, -S(O)2(O-M+) grupę, -CH2-S(O)2(OH) grupę, -CH2-S(O)2(O-M+) grupę, -CH2-CH2-S(O)2(OH) grupę, -CH2-CH2-S(O)2(O-M+) grupę, -CH2-CH2-CH2-S(O)2(OH) grupę arba -CH2-CH2-CH2-S(O)2(O-M+) grupę.

20. Antikūno ir vaisto konjugatas pagal 17 punktą, kur A1 reiškia -C(O)-CH(R3)-NH- grupę, kurioje R3 reiškia -(CH2)3-NH-CO-NH2 grupę arba metilo grupę.

21. Antikūno ir vaisto konjugatas pagal 17 punktą, kur A2 reiškia -C(O)-CH(R4)-NH- grupę, kurioje R4 reiškia izopropilo grupę;

grupę,

grupę arba

grupę.

22. Antikūno ir vaisto konjugatas pagal 17 punktą, kur minėtas antikūno ir vaisto konjugatas yra suformuotas iš jungtuko ir vaisto junginio, kurio formulė (II), parinkto iš:

ir

kur R2 ir D yra tokie, kaip apibrėžta 17 punkte.

23. Antikūno ir vaisto konjugatas pagal 17 punktą, kur minėtas antikūno ir vaisto konjugatas apima formulę, parinktą iš:

ir

,

kur banguota linija žymi kovalentinio prijungimo vietą prie antikūno arba antigeną surišančio jo fragmento, ir D ir R2 yra tokie, kaip apibrėžta 17 punkte.

24. Farmacinė kompozicija, apimanti antikūno ir vaisto konjugatą pagal bet kurį iš 17 - 23 punktų ir farmacinį nešiklį.

25. Antikūno ir vaisto konjugatas pagal bet kurį iš 17 – 23 punktų, skirtas naudoti taikant gydymą žinduoliui, kuriam tai reikalinga.