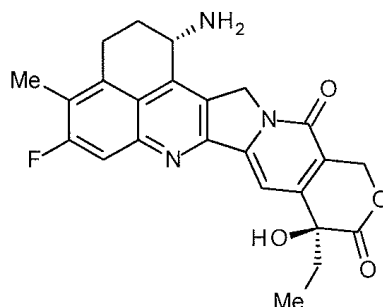


P-12117
RESUMEN MODIFICADO
19 de Diciembre de 2016

RESUMEN DE LA INVENCION

5 La presente invención se relaciona con un conjugado anticuerpo-fármaco caracterizado porque un compuesto antitumoral representado por la fórmula



10

es conjugado a un anticuerpo anti-TROP2 en la forma de estructura fármaco-ligador seleccionada del siguiente grupo:

-(succinimid-3-il-N)-CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂-C(=O)-GGFG-NH-CH₂-O-CH₂-C(=O)-(NH-DX),

-(succinimid-3-il-N)-CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂-C(=O)-GGFG-NH-CH₂CH₂-O-CH₂-C(=O)-(NH-DX), o

-(succinimid-3-il-N)-CH₂CH₂-C(=O)-NH-CH₂CH₂-O-CH₂CH₂-O-CH₂CH₂-C(=O)-GGFG-NH-CH₂CH₂CH₂-C(=O)-(NH-DX),

en donde, dicha estructura fármaco-ligador está conectada al anticuerpo anti-TROP2 por un enlace tioéter que es fomado en una porción de enlado disulfuro presente en una porción de bisagra del anticuerpo anti-TROP2.

Además, el anticuerpo anti-TROP2 comprende una región variable de cadena pesada con CDR1, CDR2 y CDR3 que consisten en las secuencias de aminoácidos SEQ ID NO: 23, 24 y 25, respectivamente; y una región variable de cadena ligera con CDR1, CDR2 y CDR3 que consisten en las secuencias de aminoácidos SEQ ID NO: 26, 27 y 28, respectivamente. Asimismo, se describe un fármaco antitumoral y/o anticanceroso, así como una composición farmacéutica que comprende dicho conjugado anticuerpo-fármaco.

Adicionalmente, la presente invención se relaciona con un método para preparar el mencionado conjugado anticuerpo-fármaco.