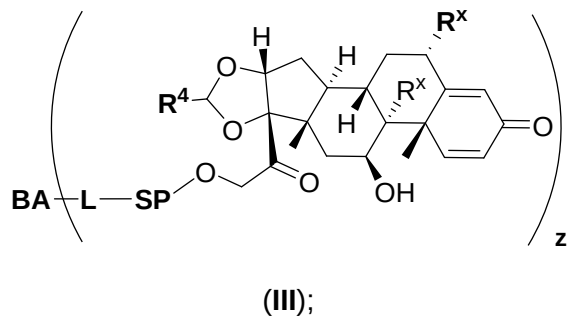


REIVINDICACIONES

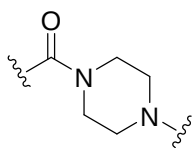
1. Un compuesto de la fórmula (III):



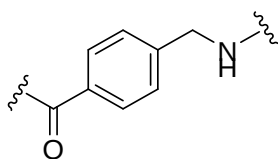
o una sal, solvato, estereoisómero o derivado farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde:

R⁴ es alquilo, arilo, arilalquilo o un heterocicloalquilo que contiene N;

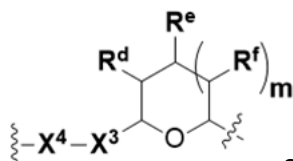
ambos **R^x** son hidrógeno; y **SP** es -C(O)-C₁-C₁₀-alquileno-C(O)-, -C(O)-N(C₁-C₆alquil)-C₁-C₁₀-alquileno-**X¹**-, en donde **X¹** está unido a **L** en la Fórmula (III), -C(O)-N(H)-(C₁-C₁₀-alquileno)-S-, en donde S está unido a **L** en la Fórmula (III), -C(O)-N(alquilo de C₁₋₆)-(C₁-C₁₀-alquileno)-S-, en donde S está unido a **L** en la fórmula (III),



en donde el punto de unión en el lado derecho (es decir, en N) es a **L** en la fórmula (III), -CH₂-NH -, en donde N está unido a **L** en la Fórmula (III),

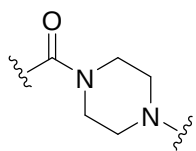


en donde N está unido a **L** en la Fórmula (III), -(C₁-C₁₀-alquileno)-NR⁵⁰C(O)-(C₁-C₁₀-alquileno)-NR^{50a}-, en donde NR^{50a} está unido a **L** en la Fórmula (III), -C(O)-(C₁-C₁₀-alquileno)-NR⁵⁰C(O)-(C₁-C₁₀-alquileno)-NR^{50a}-, en donde NR^{50a} está unido a **L** en la Fórmula (III) y en donde cada alquileno de C₁-C₁₀ está independientemente opcionalmente sustituido con uno o más hidroxilo, -C(O)-N(**R⁵**)-C₁-C₁₀-alquileno-C(O)NH-**X²**-, en donde **X²** está unido a **L** en la Fórmula (III), o

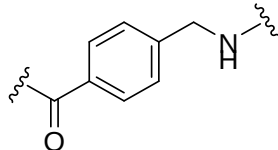


en donde **X⁴** está unido a **L** en la Fórmula (III); o

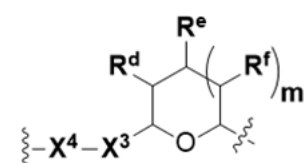
ambos **R^x** son fluoro; y **SP** es -C(O)-C₁-C₁₀-alquileo-C(O)-, -C(O)-N(C₁-₆alquil)-C₁-C₁₀-alquileo-**X^{1b}**-, en donde **X^{1b}** está unido a **L** en la Fórmula (III), -C(O)-N(H)-(C₁-C₁₀-alquileo)-**X^{1b}**-, en donde **X^{1b}** está unido a **L** en la Fórmula (III),



en donde el punto de unión en el lado derecho (es decir, en N) es a **L** en la Fórmula (III), -CH₂-NH-, en donde N está unido a **L** en la Fórmula (III),



en donde N está unido a **L** en la Fórmula (III), -(C₁-C₁₀-alquileo)-NR⁵⁰C(O)-(C₁-C₁₀-alquileo)-NR^{50a}-, en donde NR^{50a} está unido a **L** en la Fórmula (III), -C(O)-(C₁-C₁₀-alquileo)-NR⁵⁰C(O)-(C₁-C₁₀-alquileo)-NR^{50a}-, en donde NR^{50a} está unido a **L** en la Fórmula (III) y en donde cada alquileo de C₁-C₁₀ está independientemente opcionalmente sustituido con uno o más hidroxil, -C(O)-N(**R⁵**)-(C₁-C₁₀-alquileo)-C(O)NH-**X²**-, en donde **X²** está unido a **L** en la Fórmula (III), o



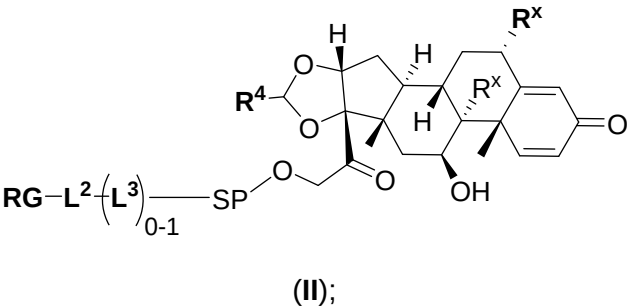
en donde **X⁴** está unido a **L** en la Fórmula (III); y

- X¹** es -N(alquilo de C₁₋₆)-;
- X^{1b}** es -S-, -NH- o -N(alquilo de C₁₋₆)-;
- X²** es -NH-;
- X³** es -CH₂-, **X³** es -CH₂-O-(alquileo de C₁-C₁₀)-C(O), en donde el C(O) está unido a **X⁴**, o **X³** es -CO)-;
- X⁴** es -O-;
- R⁵** es H, -OH, -OCH₃ o alquilo de C₁₋₆;
- R⁵⁰** y **R^{50a}** son independientemente hidrógeno o alquilo de C₁-C₆;
- R^d**, **R^e** y **R^f** son independientemente -H, -OH, hidroxialquilo, alcóxicarbonilo, -C(O)OH o CH₂OR^g, en donde cada **R^g** es independientemente -CH₂C(O)OH o -CH₂C(O)O(alquilo); y
- m** es 0 o 1;
- z** es un número entero seleccionado de 1 a 30, inclusive;

L es un enlazador; y

BA es un agente de unión.

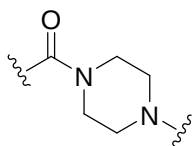
2. Un compuesto de la fórmula (II):



o una sal, solvato, estereoisómero o derivado farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde:

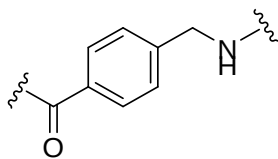
R⁴ es alquilo, arilo, arilalquilo o un heterocicloalquilo que contiene N;

ambos **R^x** son hidrógeno; **SP** es -C(O)-C₁-C₁₀-alquilenos-C(O)-, -C(O)-N(C₁₋₆alquil)-C₁-C₁₀-alquilenos-**X¹**-, en donde **X¹** está unido a (**L³**)₀₋₁ en la Fórmula (II), -C(O)-N(H)-(C₁-C₁₀-alquilenos)-S-, en donde S está unido a (**L³**)₀₋₁ en la Fórmula (II), -C(O)-N(alquilo de C₁₋₆)-(alquilenos de C₁-C₁₀)-S-, en donde S está unido a (**L³**)₀₋₁ en la Fórmula (II),



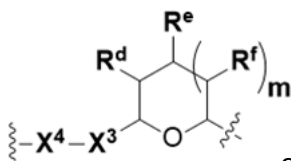
en donde el punto de unión en el lado derecho (es decir, en N) es a (**L³**)₀₋₁

en la Fórmula (II), -CH₂-NH-, en donde N está unido a (**L³**)₀₋₁ en la Fórmula (II),



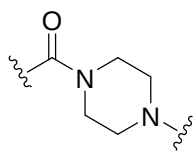
en donde N está unido a (**L³**)₀₋₁ en la Fórmula (II), -(C₁-C₁₀-alquilenos)-

NR⁵⁰C(O)-(C₁-C₁₀-alquilenos)-NR^{50a}-, en donde NR^{50a} está unido a (**L³**)₀₋₁ en la Fórmula (II), -C(O)-(C₁-C₁₀-alquilenos)-NR⁵⁰C(O)-(C₁-C₁₀-alquilenos)-NR^{50a}-, en donde NR^{50a} está unido a (**L³**)₀₋₁ en la Fórmula (II) y en donde cada alquilenos de C₁-C₁₀ es independientemente opcionalmente sustituido con uno o más hidroxilo, -C(O)-N(**R⁵**)-C₁-C₁₀-alquilenos-C(O)NH-**X²**-, en donde **X²** está unido a (**L³**)₀₋₁ en la Fórmula (II), o

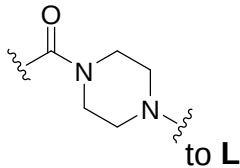


en donde **X⁴** está unido a **L³** en la Fórmula (II); o

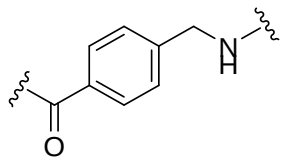
ambos **R^x** son fluoro; **SP** es -C(O)-C₁-C₁₀-alquileo-C(O)-, -C(O)-N(C₁-₆alquil)-C₁-C₁₀-alquileo-**X^{1b}**-, en donde **X^{1b}** está unido a (**L³**)₀₋₁ en la Fórmula (II), -C(O)-N(H)-(C₁-C₁₀-alquileo)-**X^{1b}**-, en donde **X^{1b}** está unido a (**L³**)₀₋₁ en la Fórmula (II),



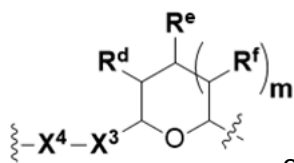
en donde el punto de unión en el lado derecho (es decir, en N) es a (**L³**)₀₋₁ en la Fórmula (II), -CH₂-NH-,



en donde N está unido a (**L³**)₀₋₁ en la Fórmula (II),



en donde N está unido a (**L³**)₀₋₁ en la Fórmula (II), -(C₁-C₁₀-alquileo)-**NR⁵⁰**C(O)-(C₁-C₁₀-alquileo)-**NR^{50a}**-, en donde **NR^{50a}** está unido a (**L³**)₀₋₁ en la Fórmula (II), -C(O)-(C₁-C₁₀-alquileo)-**NR⁵⁰**C(O)-(C₁-C₁₀-alquileo)-**NR^{50a}**-, en donde **NR^{50a}** está unido a (**L³**)₀₋₁ en la Fórmula (II) y en donde cada alquileo de C₁-C₁₀ está independientemente opcionalmente sustituido con uno o más hidroxil, -C(O)-N(**R⁵**)-(C₁-C₁₀-alquileo)-C(O)NH-**X²**-, en donde **X²** está unido a (**L³**)₀₋₁ en la Fórmula (II), o



en donde **X⁴** está unido a (**L³**)₀₋₁ en la Fórmula (II); y

- X¹** es -N(alquilo de C₁₋₆)-;
- X^{1b}** es -S-, -NH- o -N(alquilo de C₁₋₆)-;
- X²** es -NH-;
- X³** es -CH₂-, **X³** es -CH₂-O-(alquileo de C₁-C₁₀)-C(O), en donde el C(O) está unido a **X⁴**, o **X³** es -CO)-;
- X⁴** es -O-;
- R⁵** es H, -OH, -OCH₃ o alquilo de C₁₋₆;
- R⁵⁰** y **R^{50a}** son independientemente hidrógeno o alquilo de C₁-C₆;
- R^d**, **R^e** y **R^f** son independientemente -H, -OH, hidroxialquilo, alcoxycarbonilo, -C(O)OH o CH₂OR⁹, en donde cada **R⁹** es independientemente -CH₂C(O)OH o -

CH₂C(O)O(alquilo); y

m es 0 o 1;

RG es un grupo reactivo;

L² es enlazador de conexión; y

L³, cuando está presente, es un enlazador auto-inmolativo.

3. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o 2, en donde **R⁴** es alquilo lineal o ramificado.

4. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o 2, en donde **R⁴** es arilo.

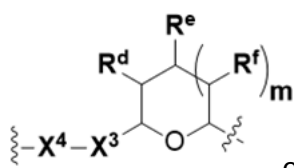
5. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o 2, en donde **R⁴** es arilalquilo.

6. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o 2, en donde **R⁴** es heterocicloalquilo que contiene N.

7. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-6, en donde **R⁴** está en la configuración R.

8. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-7, en donde

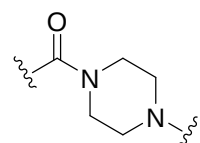
ambos **R^x** son hidrógeno; y **SP** es -C(O)-C₁-C₁₀-alquilenos-C(O)-, -C(O)-N(C₁₋₆alquil)-C₁-C₁₀-alquilenos-**X¹**-, en donde **X¹** está unido a **L** en la Fórmula (III) o (**L³**)₀₋₁ en la Fórmula (II), -C(O)-N(H)-(C₁-C₁₀-alquilenos)-S-, en donde S está unido a **L** en la Fórmula (III) o (**L³**)₀₋₁ en la Fórmula (II), -C(O)-N(C₁₋₆alquil)-(C₁-C₁₀-alquilenos)-S-, en donde S está unido a **L** en la Fórmula (III) o (**L³**)₀₋₁ en la Fórmula (II), -(C₁-C₁₀-alquilenos)-NR⁵⁰C(O)-(C₁-C₁₀-alquilenos)-NR^{50a}-, en donde NR^{50a} está unido a **L** en la Fórmula (III) o (**L³**)₀₋₁ en la Fórmula (II), -C(O)-(C₁-C₁₀-alquilenos)-NR⁵⁰C(O)-(C₁-C₁₀-alquilenos)-NR^{50a}-, en donde NR^{50a} está unido a **L** en la Fórmula (III) o (**L³**)₀₋₁ en la Fórmula (II) y en donde cada alquilenos de C₁-C₁₀ está independientemente opcionalmente sustituido con uno o más hidroxilo, -C(O)-N(**R⁵**)-C₁-C₁₀-alquilenos-C(O)NH-**X²** -, en donde **X²** está unido a **L** en la Fórmula (III) o (**L³**)₀₋₁ en la Fórmula (II), o



en donde **X⁴** está unido a **L** en la Fórmula (III) o (**L³**)₀₋₁ en la Fórmula

(II); o

ambos R^x son fluoro; y SP es $-C(O)-N(\text{alquilo de } C_{1-6})-C_1-C_{10}\text{-alquileno-}X^{1b}$, en donde X^{1b} está unido a L en la Fórmula (III) o $(L^3)_{0-1}$ en la Fórmula (II), $-C(O)-N(H)-(C_1-C_{10}\text{-alquileno-})X^{1b}$, en donde X^{1b} está unido a L en la Fórmula (III) o $(L^3)_{0-1}$ en la Fórmula (II),



en donde el punto de unión en el lado derecho (es decir, en N) es a L en Fórmula (III) o $(L^3)_{0-1}$ en Fórmula (II), $-(C_1-C_{10}\text{-alquileno-})NR^{50}C(O)-(C_1-C_{10}\text{-alquileno-})NR^{50a}$, en donde NR^{50a} está unido a L en la Fórmula (III) o $(L^3)_{0-1}$ en la Fórmula (II), $-C(O)-(C_1-C_{10}\text{-alquileno-})NR^{50}C(O)-(C_1-C_{10}\text{-alquileno-})NR^{50a}$, en donde NR^{50a} está unido a L en la Fórmula (III) o $(L^3)_{0-1}$ en la Fórmula (II) y en donde cada alquileno de C_1-C_{10} está independientemente opcionalmente sustituido con uno o más hidroxilo, o $-C(O)-N(R^5)-(C_1-C_{10}\text{-alquileno-})C(O)NH-X^2$, en donde X^2 está unido a L en la Fórmula (III) o $(L^3)_{0-1}$ en la Fórmula (II).

9. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8, en donde SP es $-C(O)-C_1-C_{10}\text{-alquileno-}C(O)-$.

10. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-9, en donde SP es $-C(O)-C_2-C_5\text{-alquileno-}C(O)-$.

11. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-10, en donde SP es $-C(O)-CH_2CH_2-C(O)-$.

12. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8, en donde SP es $-C(O)-N(R^5)-C_1-C_{10}\text{-alquileno-}C(O)NH-X^2$.

13. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8 y 12, en donde SP es $-C(O)-N(R^5)-C_1-C_5\text{-alquileno-}C(O)NH-NH-$.

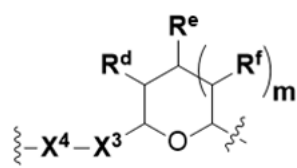
14. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8, 12 y 13, en donde SP es $-C(O)-N(R^5)-CH_2-C(O)NH-NH-$.

15. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8 y 12-14, en donde R^5 es H o alquilo de C_{1-6} .

16. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8 y 12-15, en donde R^5 es H o $-CH_3$.

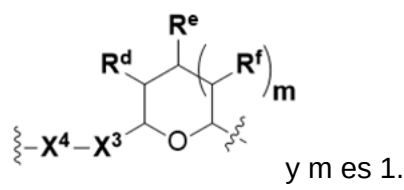
17. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8,

en donde **SP** es



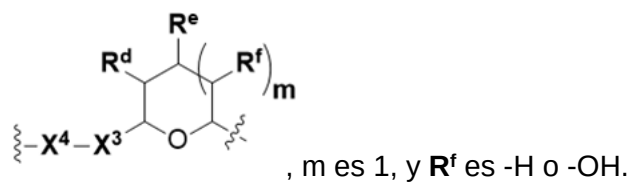
18. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8,

en donde **SP** es



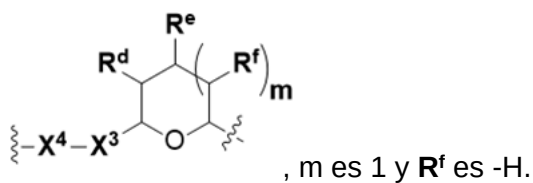
19. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8,

en donde **SP** es

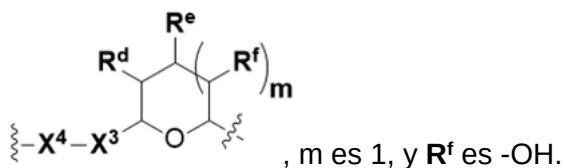


20. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8,

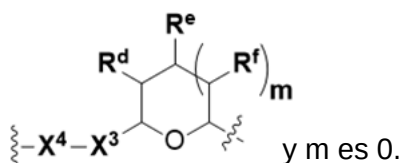
en donde **SP** es



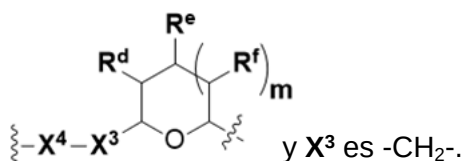
21. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8, en donde **SP** es



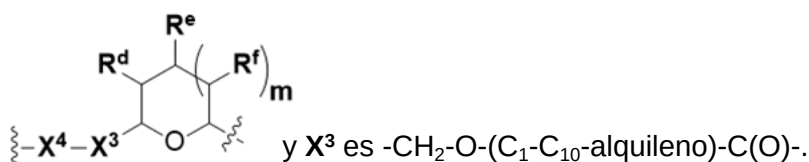
22. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8, en donde **SP** es



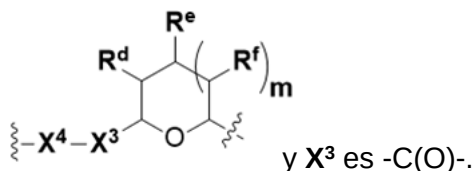
23. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8 y 17-22, en donde **SP** es



24. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8 y 17-22, en donde **SP** es



25. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8 y 17-22, en donde **SP** es



26. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8 y 17-25, en donde R^d y R^e son independientemente -H u -OH.

27. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8

y 17-25, en donde **R^d** y **R^e** son -H.

28. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8 y 17-25, en donde **R^d** y **R^e** son -OH.

29. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 1-8, en donde **SP** es -(C₁-C₁₀-alquileo)-**NR⁵⁰**C(O)-(C₁-C₁₀-alquileo)-**NR^{50a}**-.

30. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 1-8, en donde **SP** es -(alquileo lineal de C₁-C₃)-**NR⁵⁰**C(O)-(alquileo lineal de C₁-C₃)-**NR^{50a}**-.

31. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8, en donde **SP** es -C(O)-(C₁-C₁₀-alquileo)-**NR⁵⁰**C(O)-(C₁-C₁₀-alquileo)-**NR^{50a}**- y en donde cada alquileo de C₁-C₁₀ está independientemente opcionalmente sustituido con uno o más hidroxí.

32. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8, en donde **SP** es -(alquileo de C₁-C₆ ramificado)-**NR⁵⁰**C(O)-(hidroxialquileo de C₁-C₆)-**NR^{50a}**-.

33. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8 y 29-32, en donde **R⁵⁰** y **R^{50a}** son independientemente hidrógeno o metilo.

34. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8 y 29-32, en donde **R⁵⁰** y **R^{50a}** son cada uno hidrógeno.

35. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8 y 29-32, en donde **R⁵⁰** y **R^{50a}** son cada uno metilo.

36. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-35, en donde ambos **R^x** son hidrógeno.

37. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8, en donde ambos **R^x** son hidrógeno y **SP** es -C(O)-N(H)-(alquileo de C₁-C₁₀)-S- o -C(O)-N(alquilo de C₁₋₆)-(alquileo de C₁-C₁₀)-S-.

38. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8, en donde ambos **R^x** son hidrógeno y **SP** es -C(O)-N(alquilo de C₁₋₃)-C₁-C₁₀-alquileo-**X¹**-.

39. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8 y 38, en donde ambos **R^x** son hidrógeno y **SP** es -C(O)-N(alquilo de C₁₋₃)-C₂-C₅-alquileo-**X¹**-.

40. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8,

38 y 39, en donde ambos **R^x** son hidrógeno y **SP** es -C(O)-N(alquilo de C₁₋₃)-CH₂CH₂-**X^{1a}**.

41. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8, 38 y 39, en donde ambos **R^x** son hidrógeno y **SP** es -C(O)-N(CH₃)-C₂-C₅-alquilenos-N(CH₃)-.

42. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8 y 38-41 donde ambos **R^x** son hidrógeno y **SP** es -C(O)-N(CH₃)-CH₂CH₂-N(CH₃)-.

43. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-35, en donde ambos **R^x** son fluoro.

44. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8, en donde ambos **R^x** son fluoro y **SP** es -C(O)-N(H)-(C₁-C₁₀-alquilenos)-**X^{1b}**- o -C(O)-N(alquilo de C₁₋₆)-(alquilenos de C₁-C₁₀)-**X^{1b}**-.

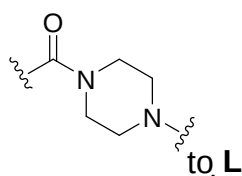
45. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 44, en donde **SP** es -C(O)-N(H)-(alquilenos de C₁-C₆)-**X^{1b}**- o -C(O)-N(alquilo de C₁₋₆)-(C₁-C₆-alquilenos)-**X^{1b}**-.

46. El compuesto de conformidad con la reivindicación 44 o 45, en donde **X^{1b}** es S.

47. El compuesto de conformidad con la reivindicación 44 o 45, en donde **X^{1b}** es NH o N(alquilo de C₁₋₆).

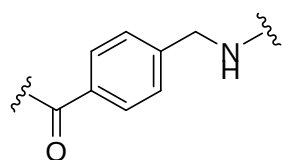
48. El compuesto de conformidad con la reivindicación 44 o 45, en donde **X^{1b}** es NH o N(CH₃).

49. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8, en donde ambos **R^x** son fluoro y **SP** es



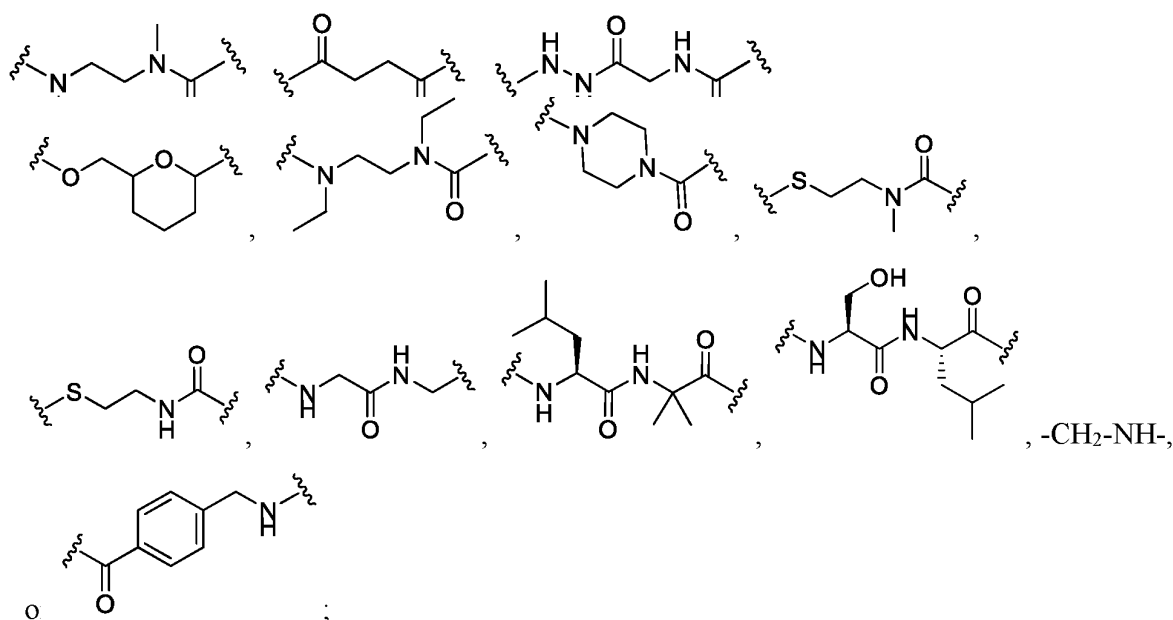
50. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-7, en donde **SP** es -CH₂-NH-.

51. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-7, en donde **SP** es



52. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-7, en donde ambos **R^x** son hidrógeno o ambos **R^x** son fluoro y **SP** es

o ambos **R^x** son fluoro y **SP** es



0 y en donde el punto de fijación del lado izquierdo en las estructuras anteriores está unido a **L** o (**L³**)₀₋₁.

53. El compuesto de la Fórmula (III) de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 y 3-52, en donde **z** se selecciona de 1-10, inclusive.

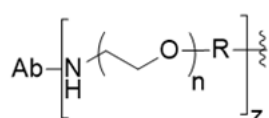
54. El compuesto de la fórmula (III) de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 y 3-53, en donde **z** se selecciona de 2-4, inclusive.

55. El compuesto de la fórmula (III) de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 y 3-54, en donde **z** es 4.

56. El compuesto de la Fórmula (III) de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 y 3-54, en donde **z** es 2.

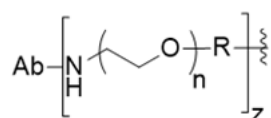
57. El compuesto de la fórmula (III) de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 y 3-56, en donde **BA** comprende un anticuerpo o un fragmento de anticuerpo.

58. El compuesto de la fórmula (III) de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 y 3-57, en donde **BA** comprende un anticuerpo que tiene la siguiente estructura



en donde Ab es un anticuerpo monoclonal, anticuerpo policlonal, fragmento de anticuerpo o anticuerpo biespecífico; R es alquileo de C₂₋₄, n es un número entero seleccionado de 1 a 10, inclusive, y z es un número entero seleccionado de 1-10, inclusive.

59. El compuesto de la fórmula (III) de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 y 3-59, en donde **BA** comprende un anticuerpo que tiene la siguiente estructura



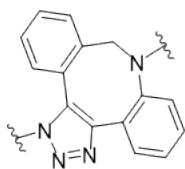
en donde Ab es un anticuerpo monoclonal, anticuerpo policlonal, fragmento de anticuerpo o anticuerpo biespecífico; R es alquileo de C₂₋₄; y n es un número entero seleccionado de 2 a 4, inclusive.

60. El compuesto de la fórmula (III) de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 y 3-59, en donde **BA** comprende MSR1.

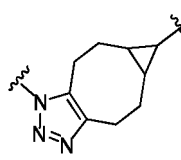
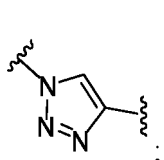
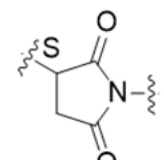
61. El compuesto de la fórmula (III) de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 y 3-60, en donde **L** es -**L**¹-**L**²-(**L**³)₀₋₁-, en donde **L**¹ está unido a **BA** y **L**³ está unido a **SP**; y en donde **L**¹ es un residuo del grupo reactivo; **L**² es enlazador de conexión; y **L**³, cuando está presente, es un enlazador auto-inmolativo.

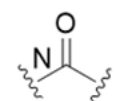
62. El compuesto de la fórmula (III) de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 y 3-61, en donde **L** es -**L**¹-**L**²-**L**³-.

63. El compuesto de la fórmula (III) de conformidad con la reivindicación 61 o 62 donde **L**¹ se selecciona de

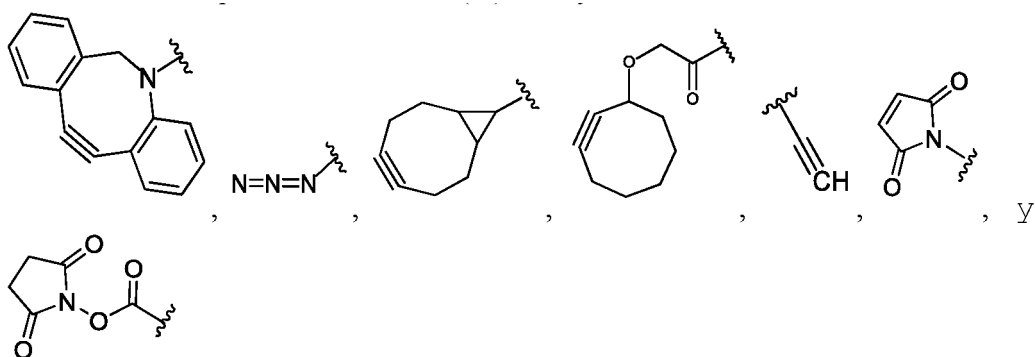


o un regioisómero o mezcla de isómeros de los mismos;

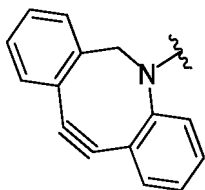



 un esteroisómero o mezcla de estereoisómeros de los mismos, en donde S se refiere al átomo de S en un residuo de cisteína a través del cual el residuo del grupo reactivo está unido a **BA**; y


 en donde N se refiere al átomo de N en un residuo de lisina a través del cual el residuo del grupo reactivo se une a **BA**.

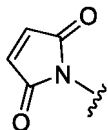
64. El compuesto de la Fórmula (II) de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 2-52, en donde **RG** se selecciona de



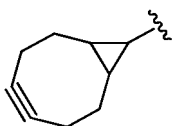
65. El compuesto de la fórmula (II) de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 2-52, en donde **RG** es



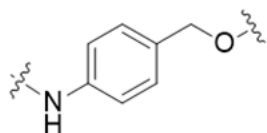
66. El compuesto de la fórmula (II) de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 2-52, en donde **RG** es



67. El compuesto de la fórmula (II) de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 2-52, en donde **RG** es

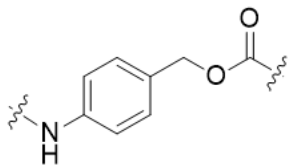


68. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-67, en donde para el compuesto de la Fórmula (III) **L** es $-\text{L}^1-\text{L}^2-\text{L}^3$ ₀₋₁; y en donde **L**³ en el compuesto de la Fórmula (II) o (III) es



en donde el grupo NH está unido a L^2 , cuando **SP** es $-C(O)-C_1-C_{10}$ -alquileno- $C(O)-$; o

L^3 en el compuesto de la Fórmula (II) o (III) es



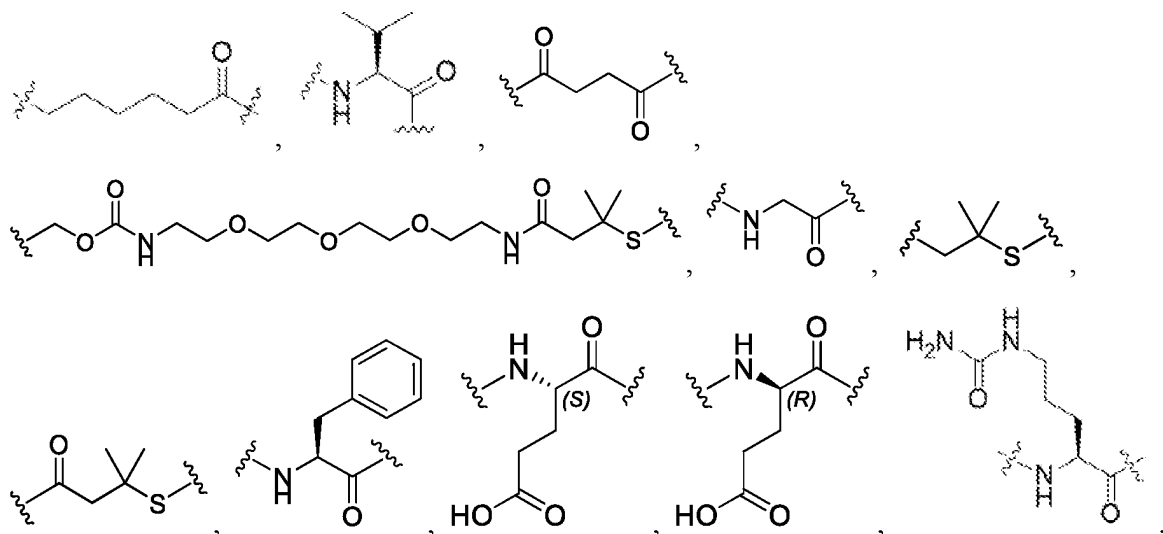
en donde el grupo NH está unido a L^2 , cuando **SP** es $-C(O)-N(C_1-C_{10}-alquilo)-C_1-C_{10}-alquileno-X^{1b}$ -, $-C(O)-N(alquilo\ de\ C_{1-3})-C_1-C_{10}-alquileno-X^{1b}$ -, en donde X^{1b} es $-NH-$ o $-N(alquilo\ de\ C_{1-6})-$, $-C(O)-N(H)-(C_1-C_{10}-alquileno)-X^{1b}$ -, en donde X^{1b} es $-NH-$ o $-N(alquilo\ de\ C_{1-6})-$,

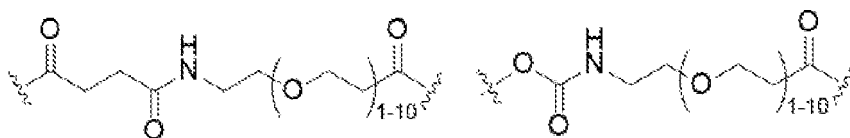
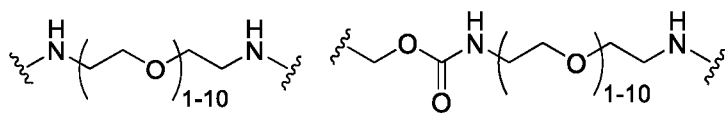
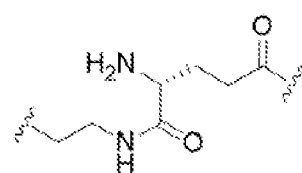
$-C(O)-N(C_1-C_{10}-alquilo)-C_1-C_{10}-alquileno-X^{1b}$ -, en donde X^{1b} es $-NH-$ o $-N(alquilo\ de\ C_{1-6})-$, $-C(O)-N(H)-(C_1-C_{10}-alquileno)-X^{1b}$ -, en donde X^{1b} es $-NH-$ o $-N(alquilo\ de\ C_{1-6})-$, $-C(O)-N(R^5)-C_1-C_{10}-alquileno-C(O)NH-X^2$ -, o

L^3 en el compuesto de la Fórmula (II) o (III) no está presente.

69. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-68, en donde para el compuesto de la Fórmula (III) **L** es $-L^1-L^2-L^3$;₀₋₁; y en donde L^2 en el compuesto de la Fórmula (II) o (III) comprende **PEG**, un residuo de dipéptido, un tripéptido, un tetrapéptido, un pentapéptido, $-C(O)CH_2CH_2C(O)-$, **CD** o $-CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2C(O)-$, o cualquier combinación de los mismos.

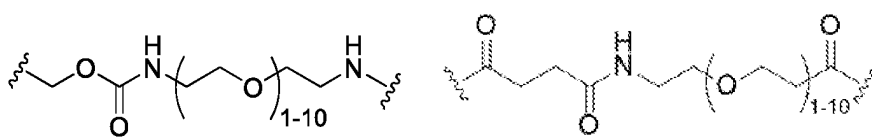
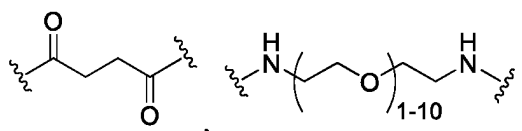
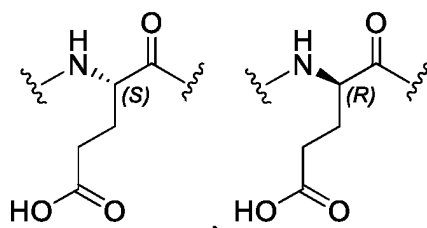
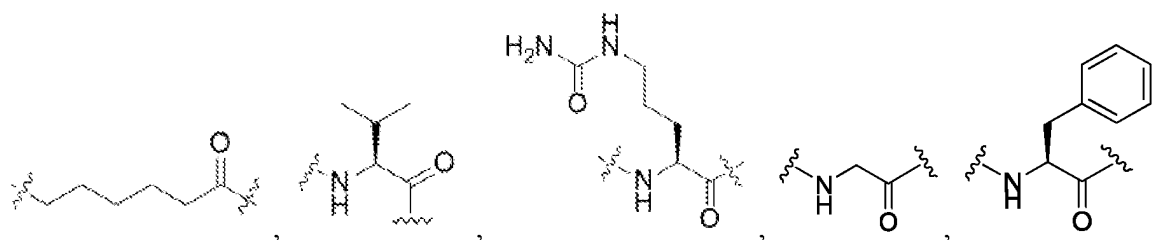
70. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-68, en donde para el compuesto de la Fórmula (III) **L** es $-L^1-L^2-L^3$;₀₋₁; y en donde L^2 en el compuesto de la Fórmula (II) o (III) comprende





, o residuo de ciclodextrina (**CD**); o cualquier combinación de los mismos.

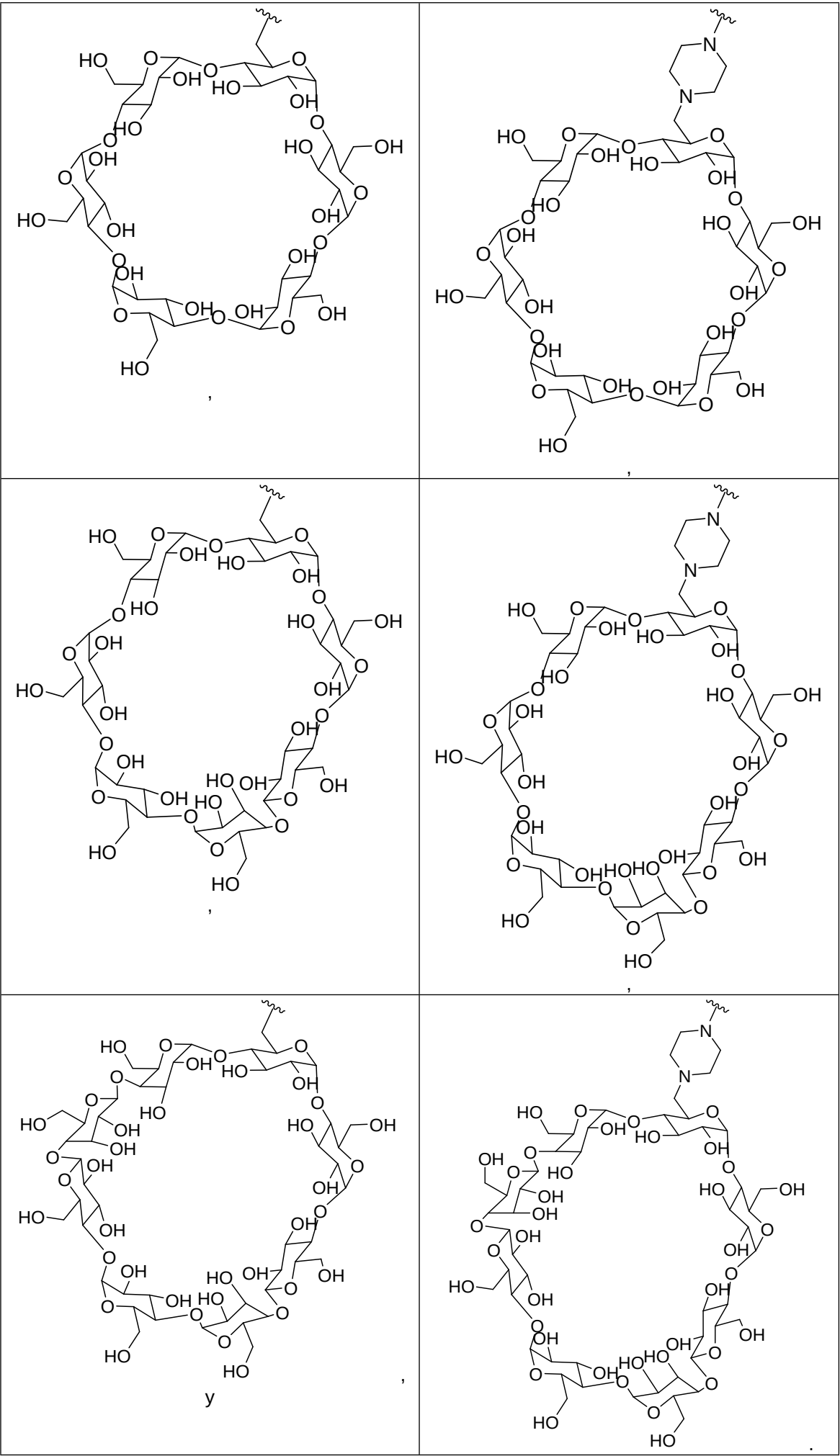
71. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-68, en donde para el compuesto de la Fórmula (III) **L** es -**L**¹-**L**²-**L**³)₀₋₁-; y en donde **L**² en el compuesto de la Fórmula (II) o (III) comprende



o **CD**, o cualquier

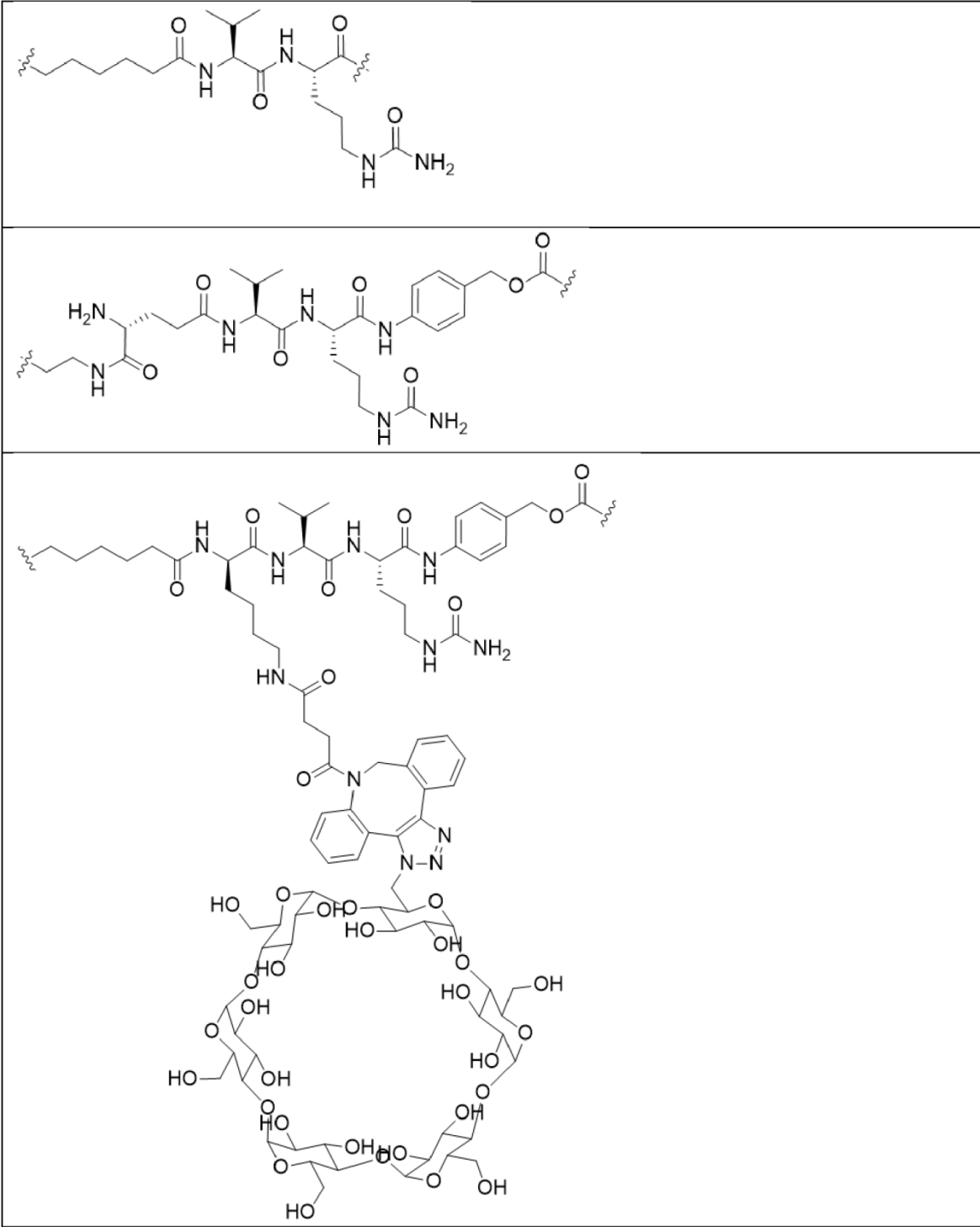
combinación de los mismos.

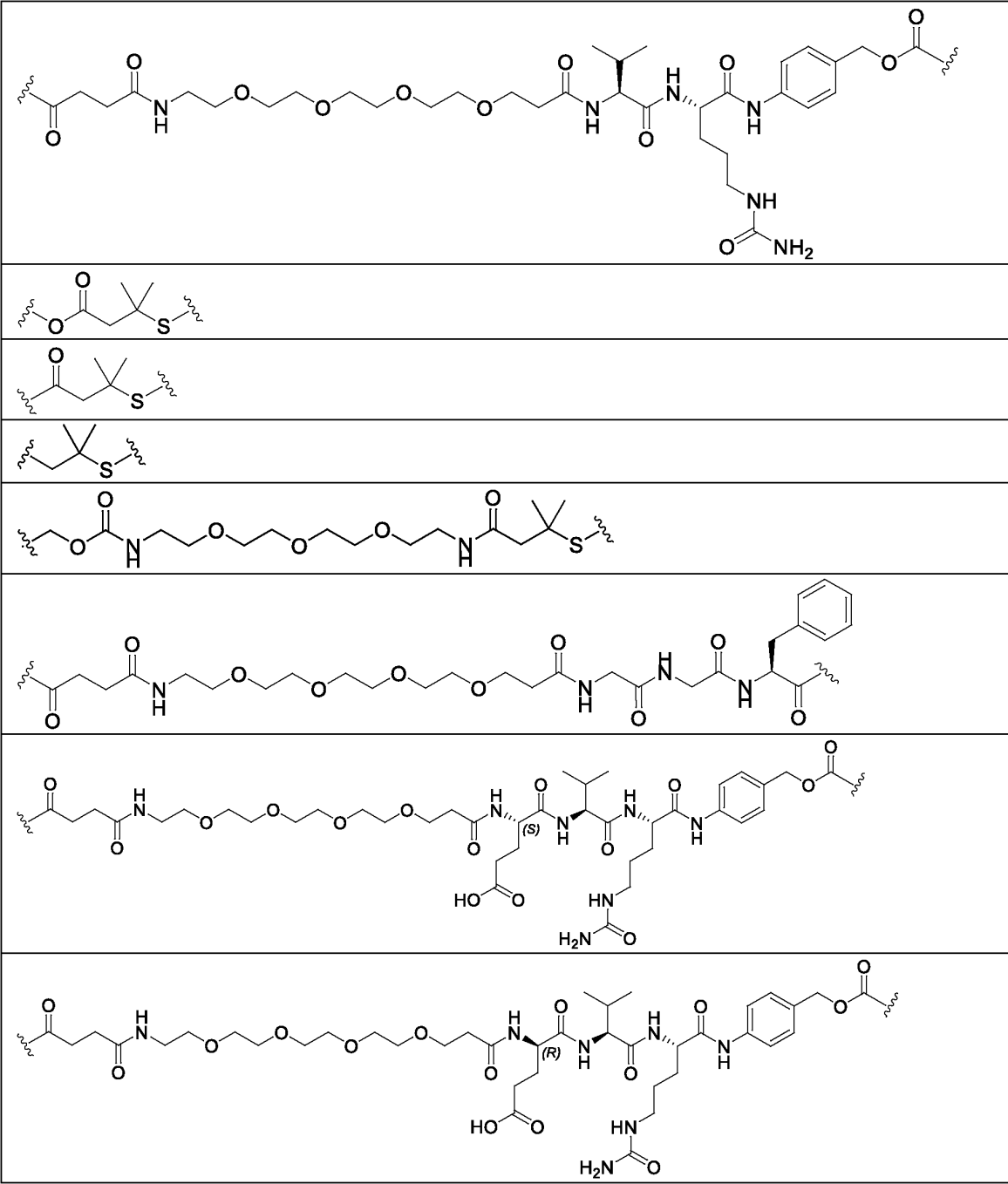
72. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 69-71, en donde **CD** se selecciona del grupo que consiste en

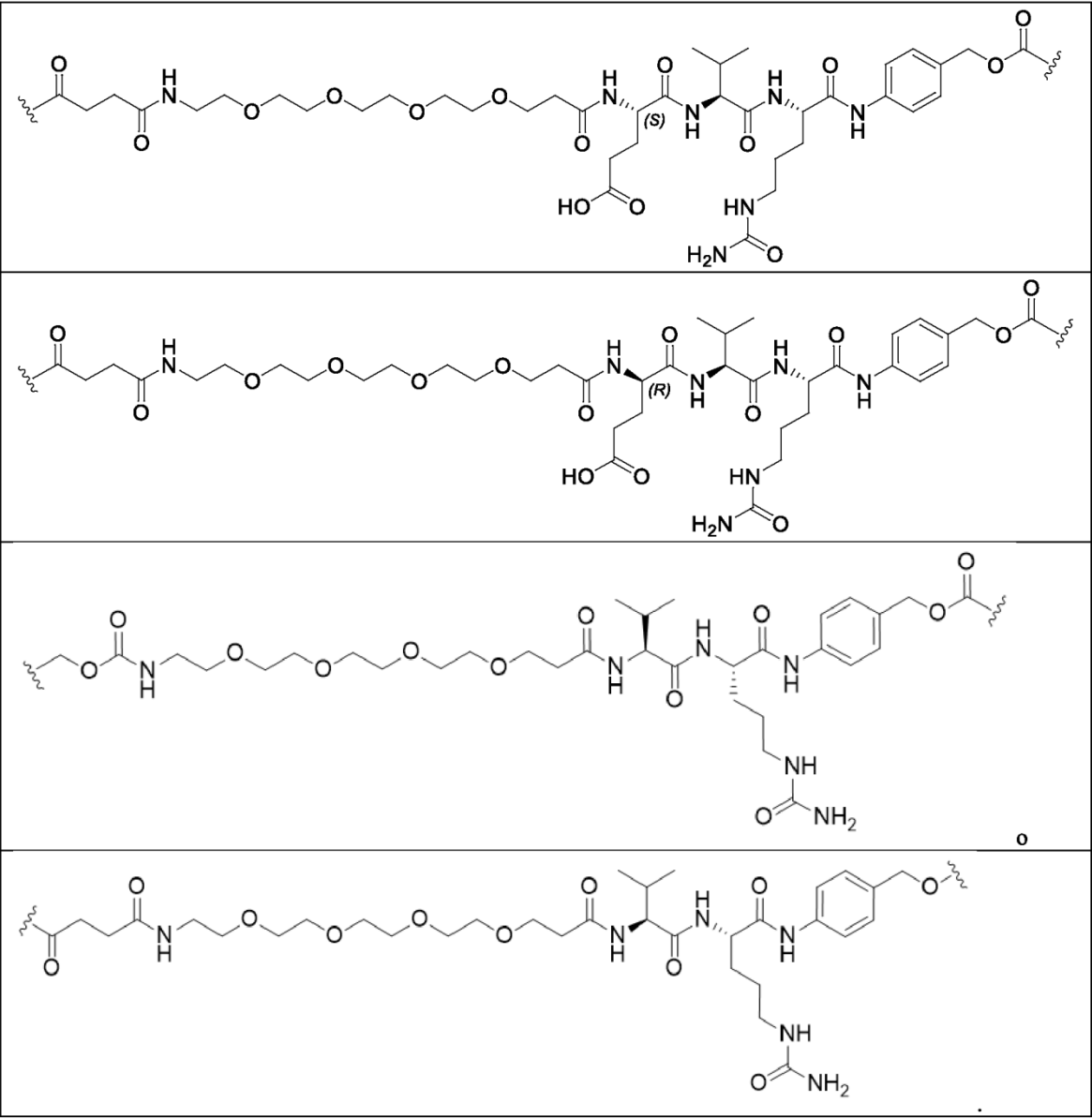


73. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-

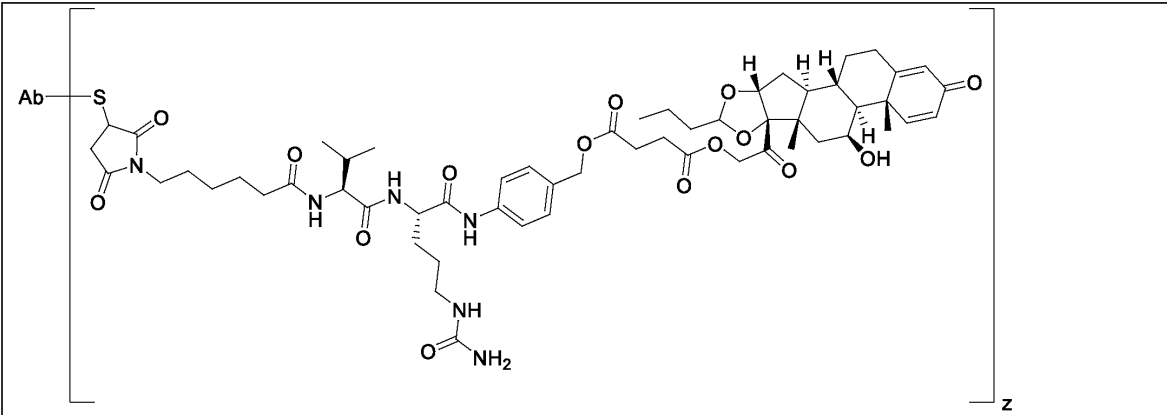
67, en donde para el compuesto de la Fórmula (III) L es $-L^1-L^2-L^3)_{0-1-}$; y en donde $-L^2-(L^3)_{0-1-}$ en el compuesto de la Fórmula (II) o (III) comprenden



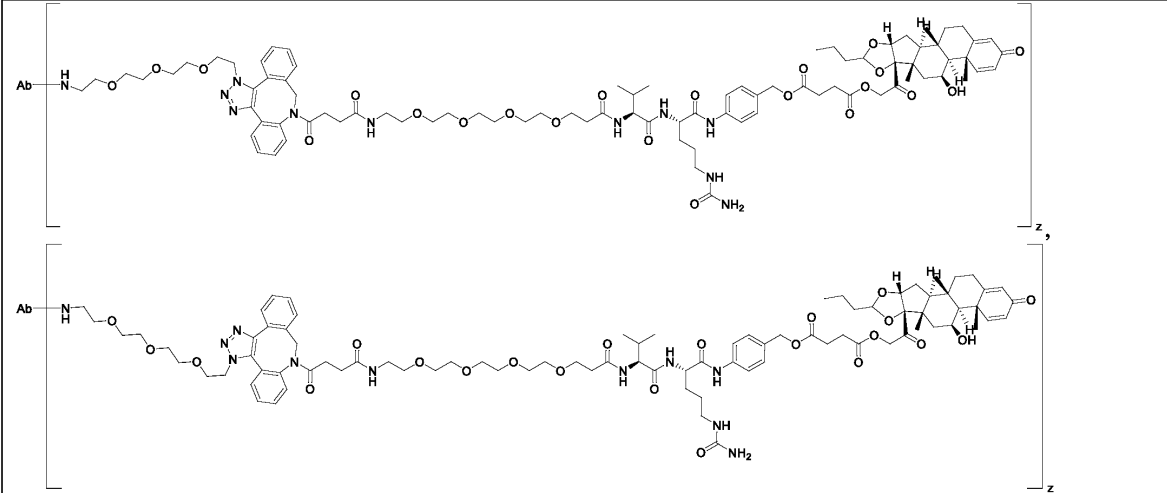




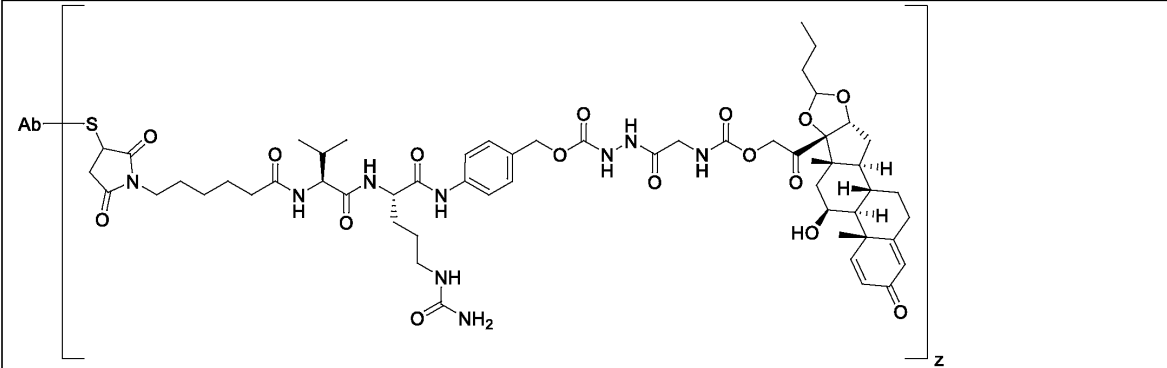
74. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, en donde el compuesto es:



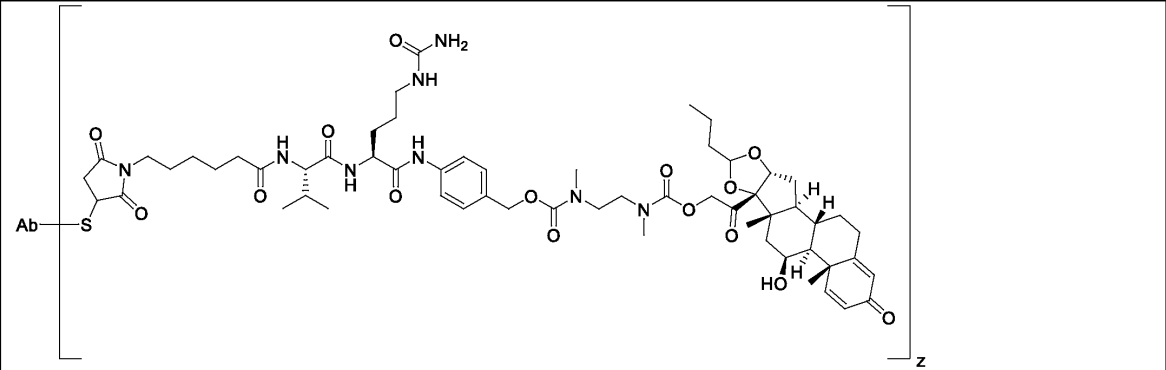
o un estereoisómero o mezcla de estereoisómeros del mismo;



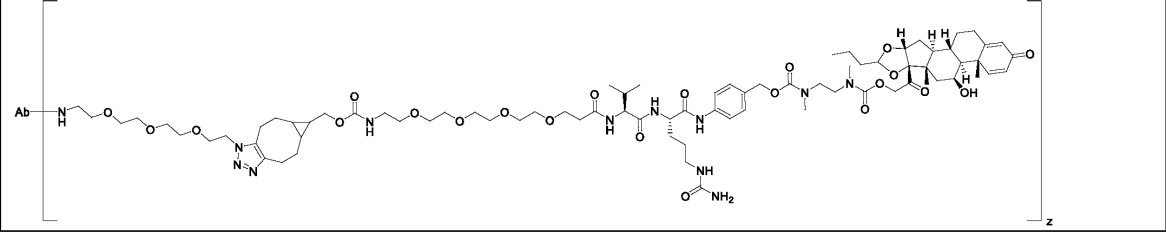
o una mezcla de los mismos;

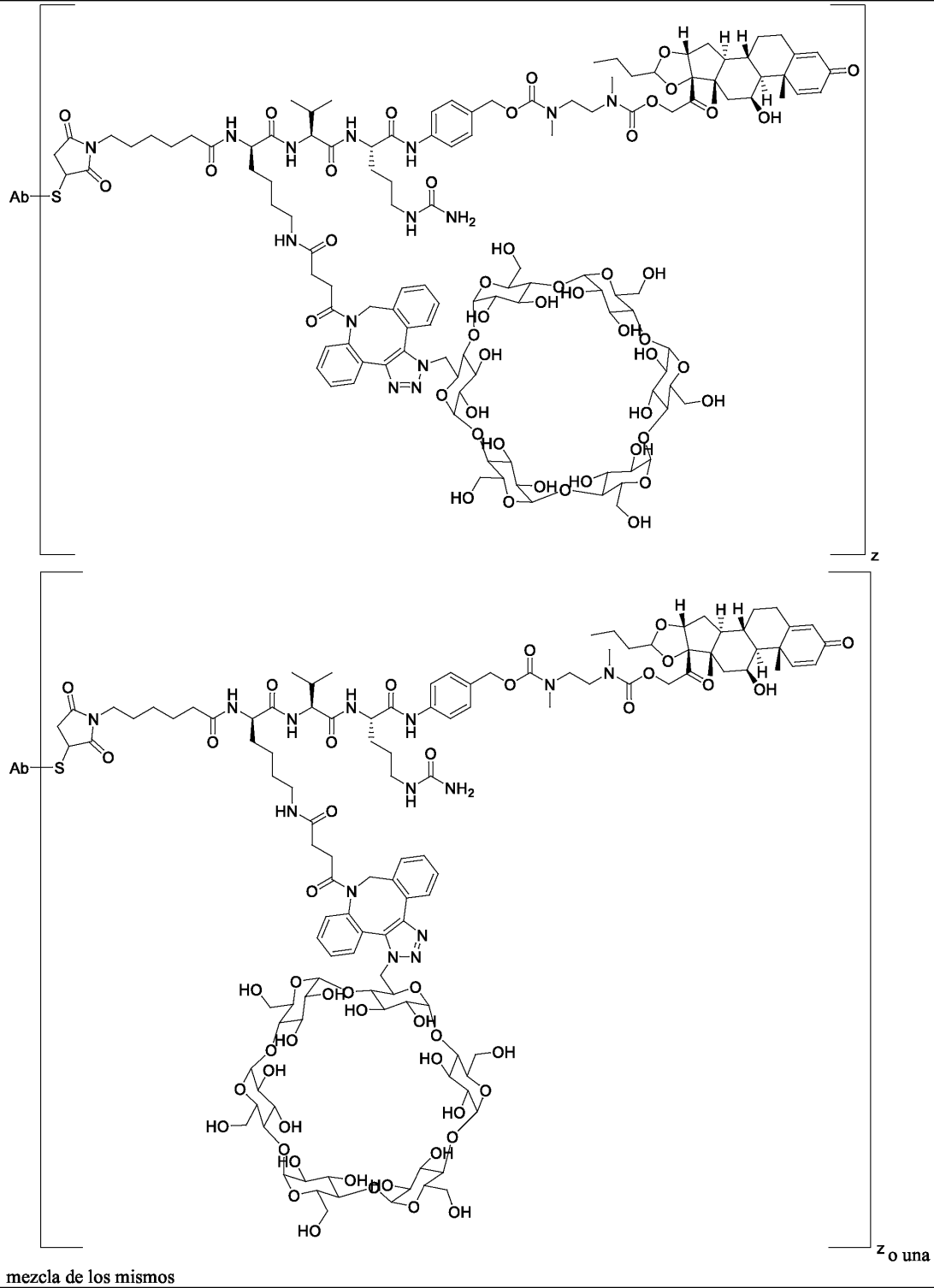


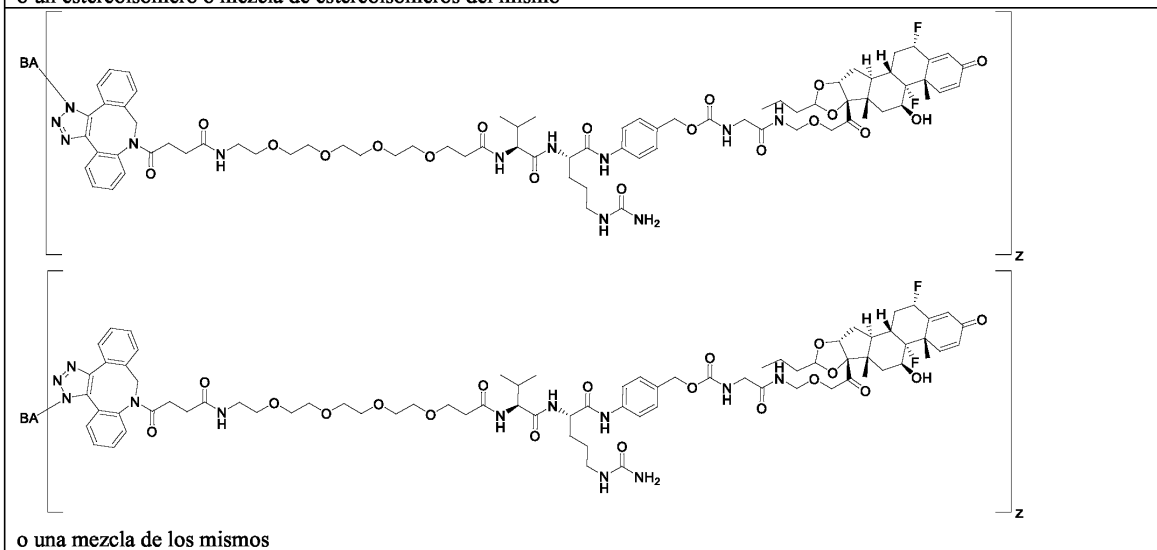
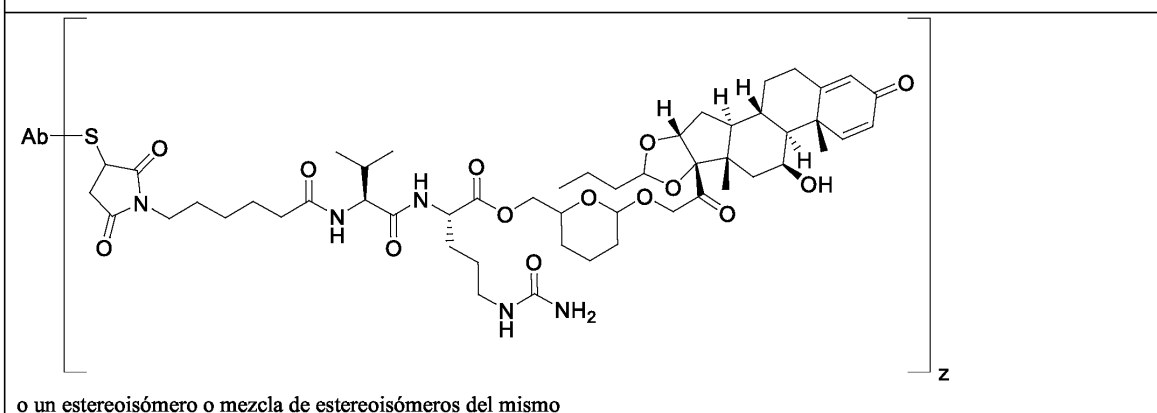
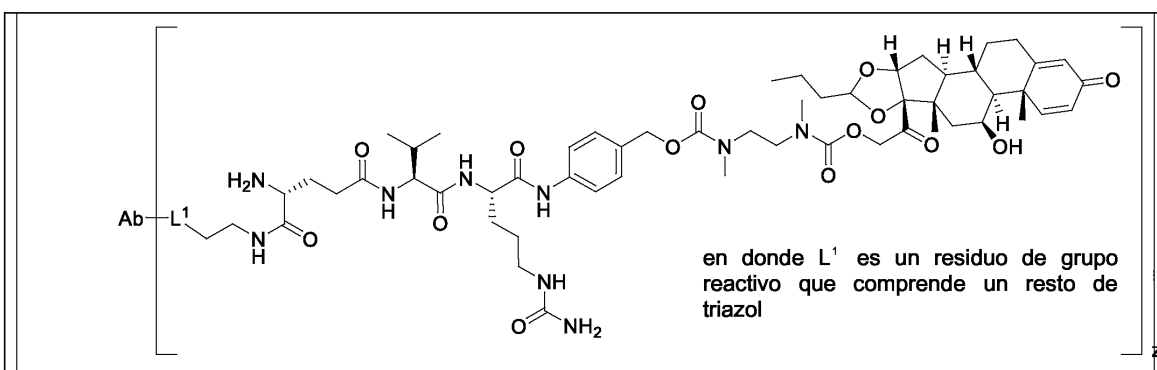
o un estereoisómero o mezcla de estereoisómeros del mismo;

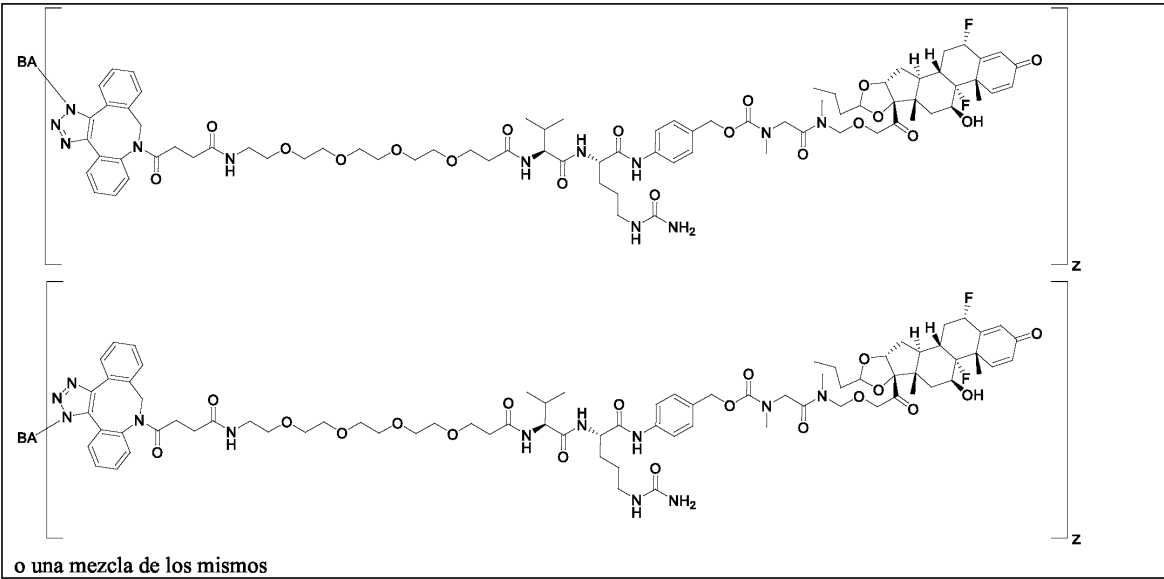


o un estereoisómero o mezcla de estereoisómeros del mismo;

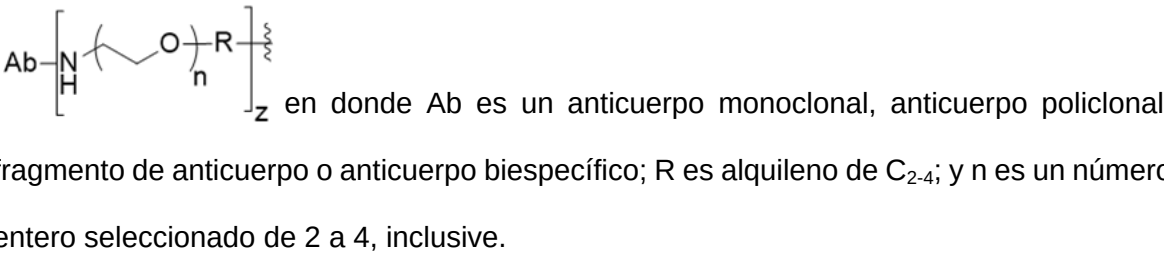






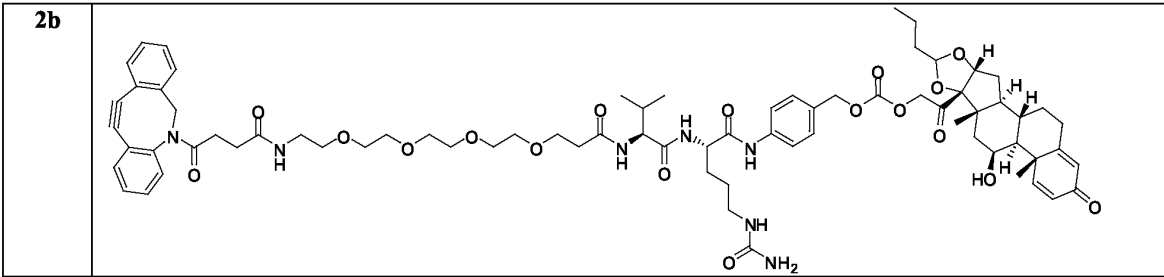


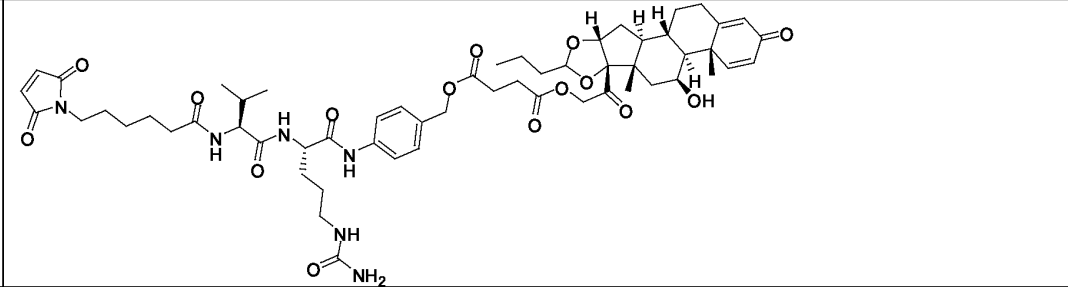
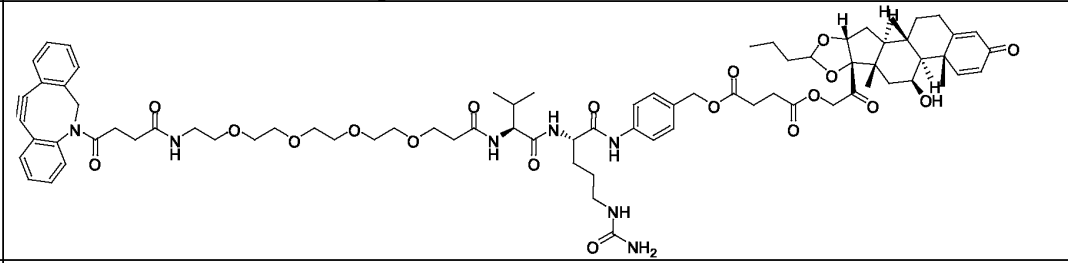
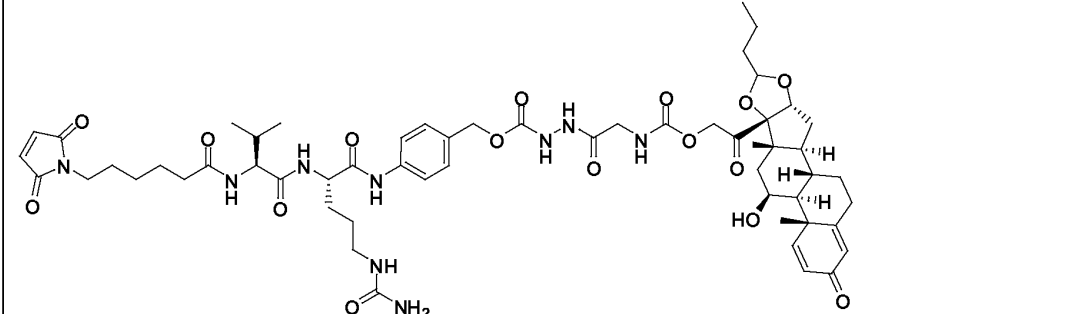
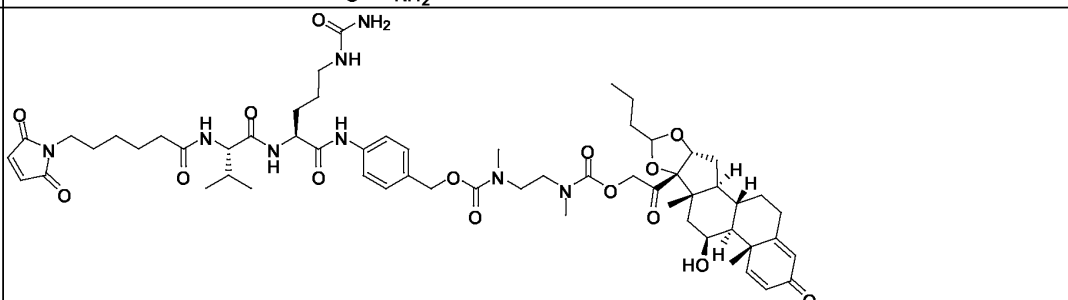
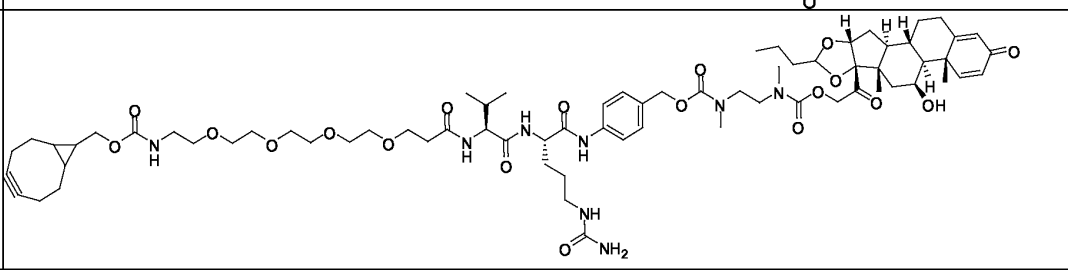
en donde **BA** comprende un anticuerpo que tiene la siguiente estructura

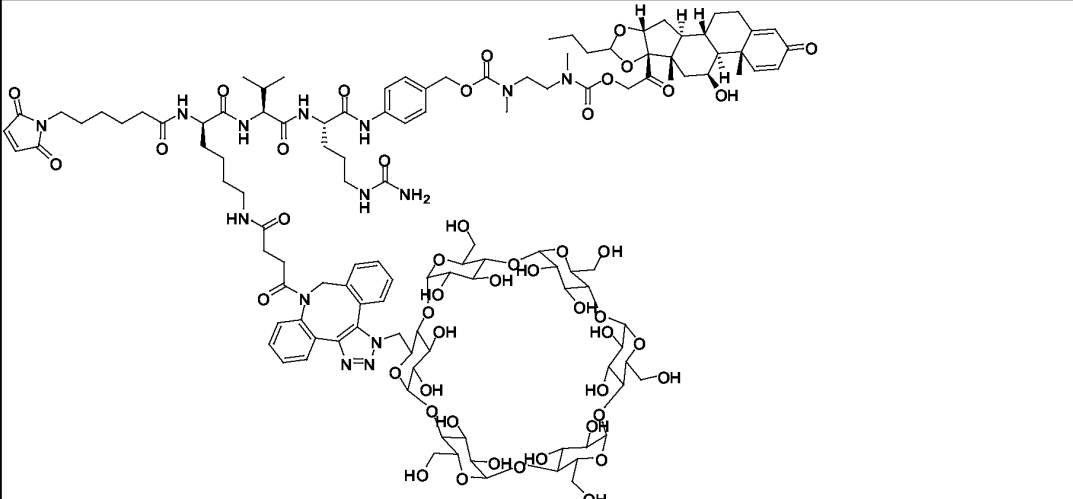
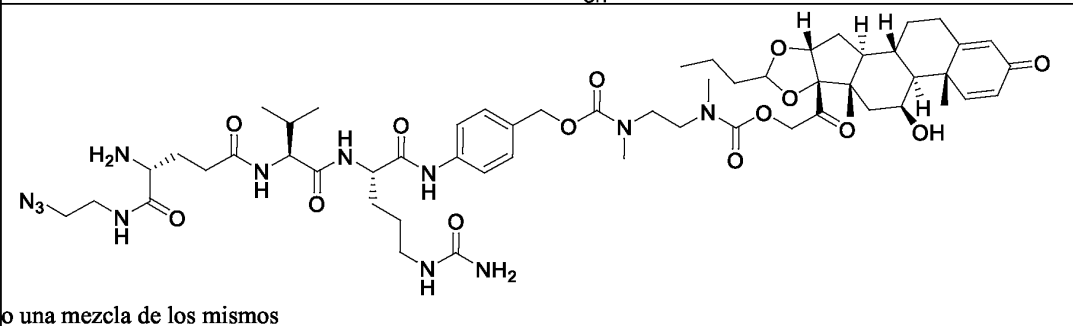
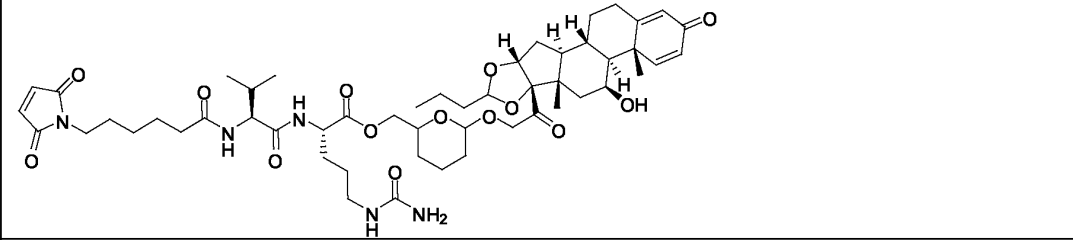
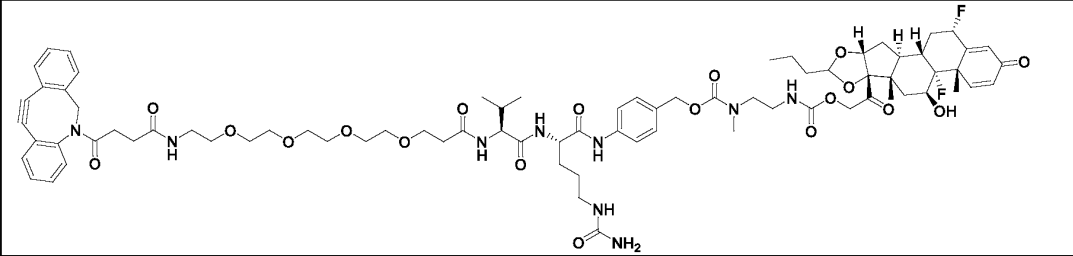


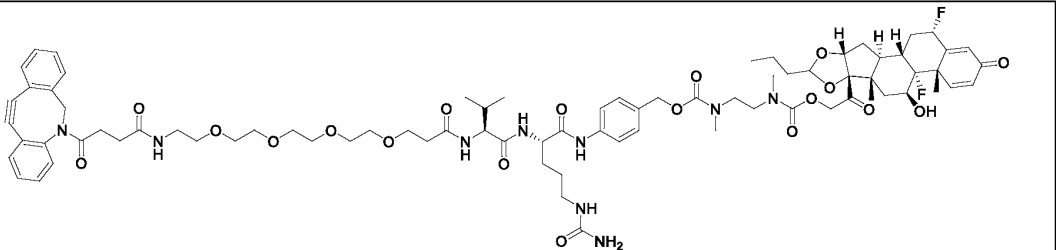
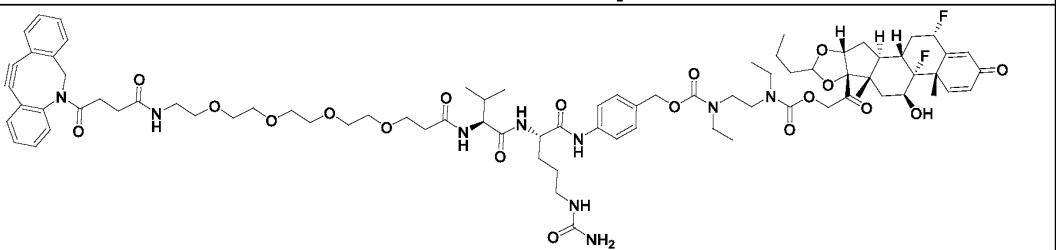
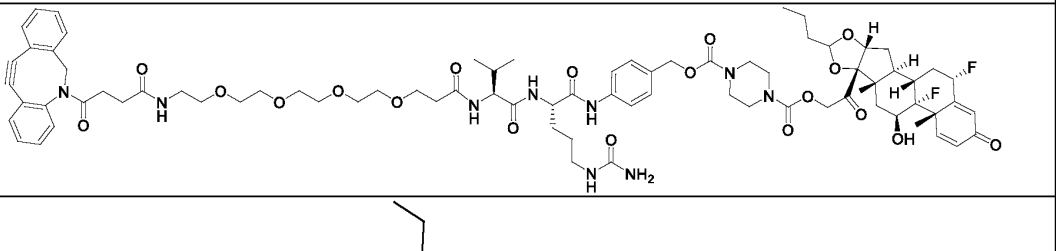
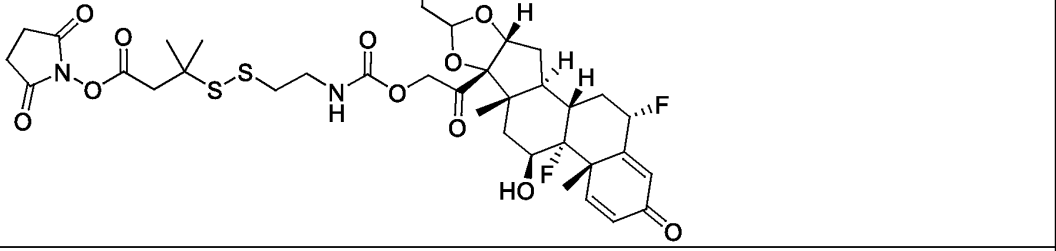
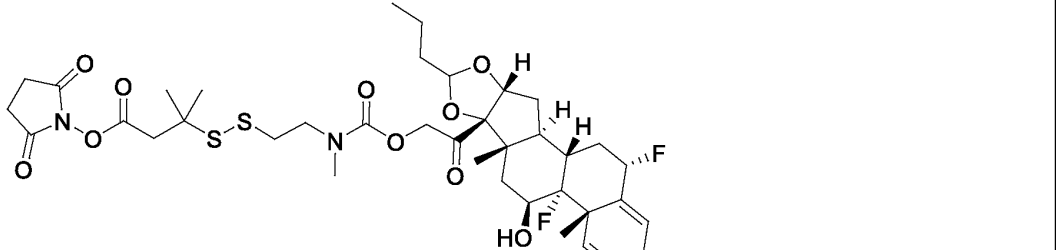
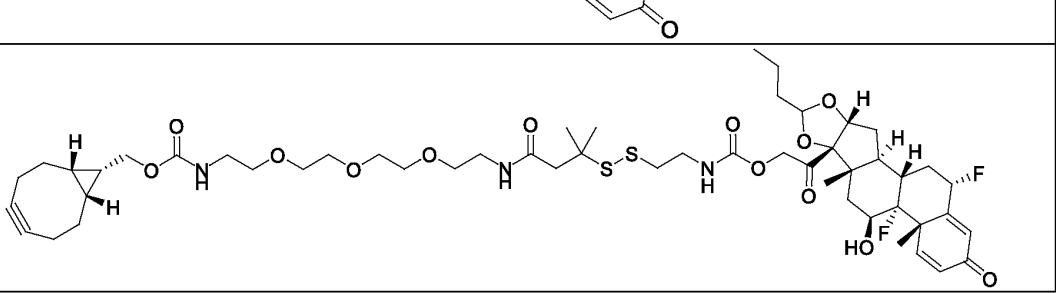
75. El compuesto de conformidad con la reivindicación 74, en donde Ab es MSR1.

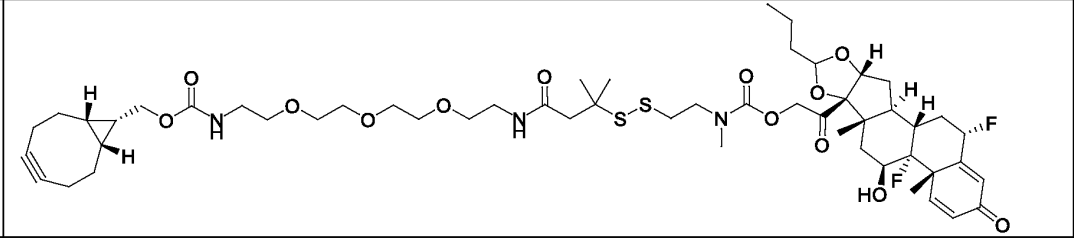
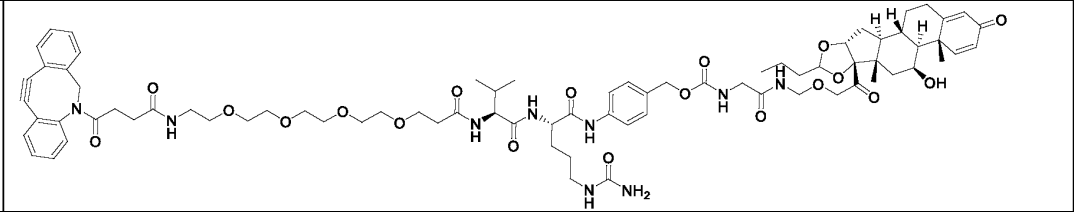
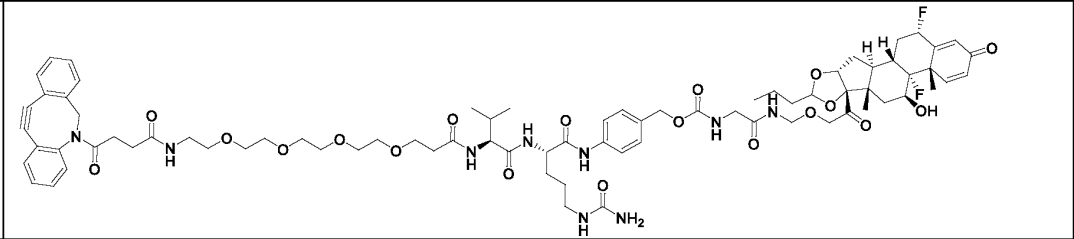
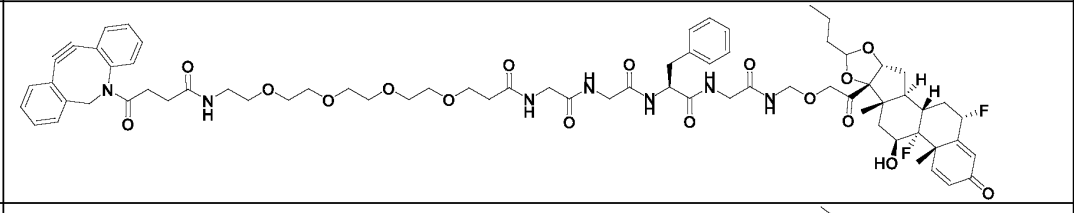
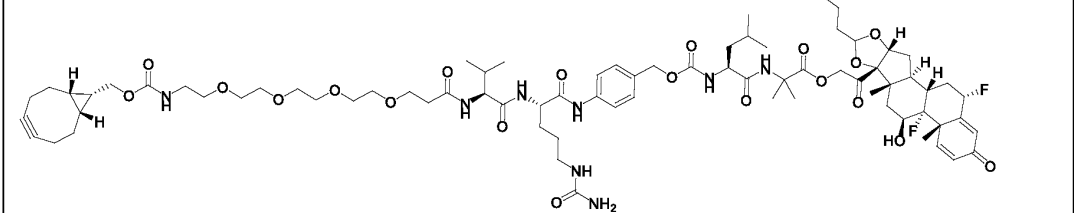
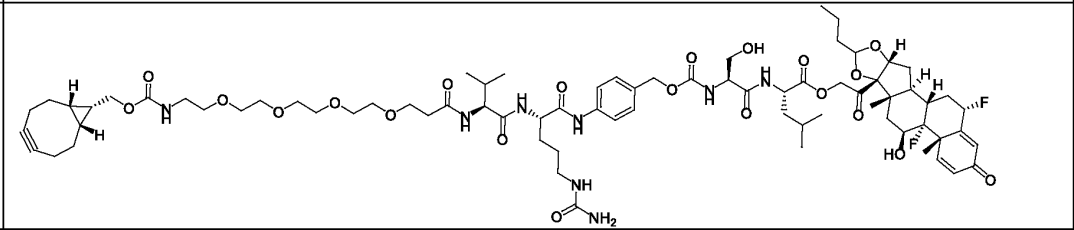
76. Un compuesto seleccionado de:

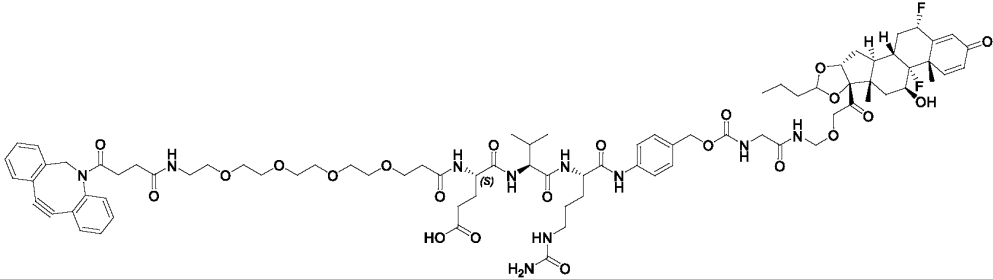
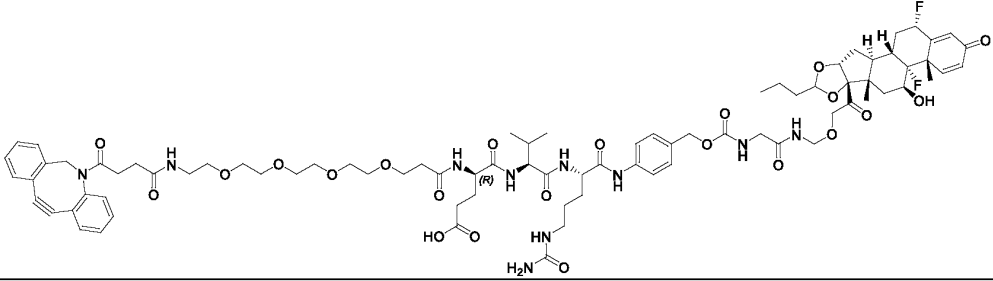
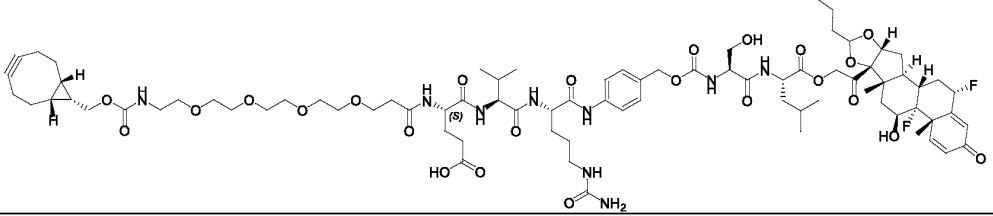
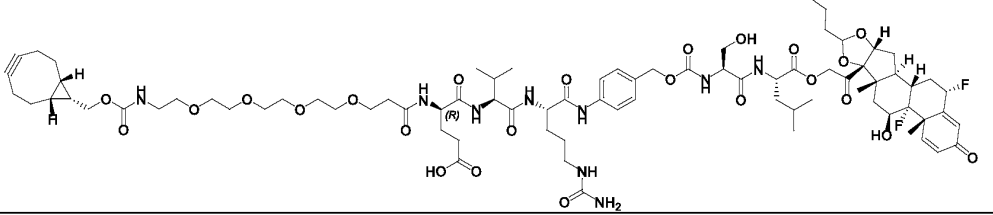
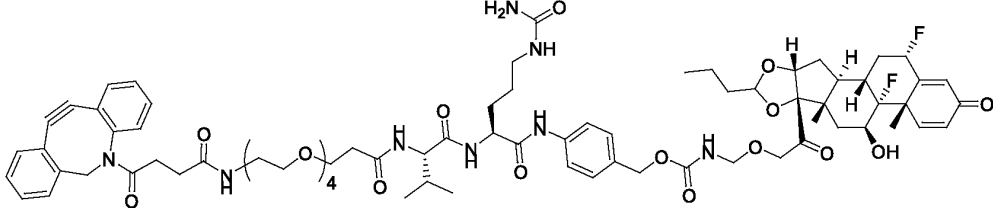
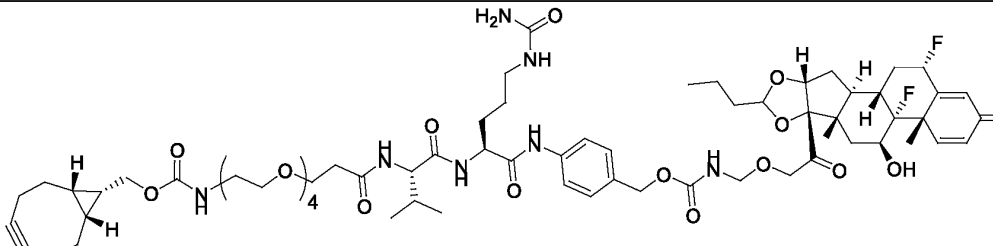


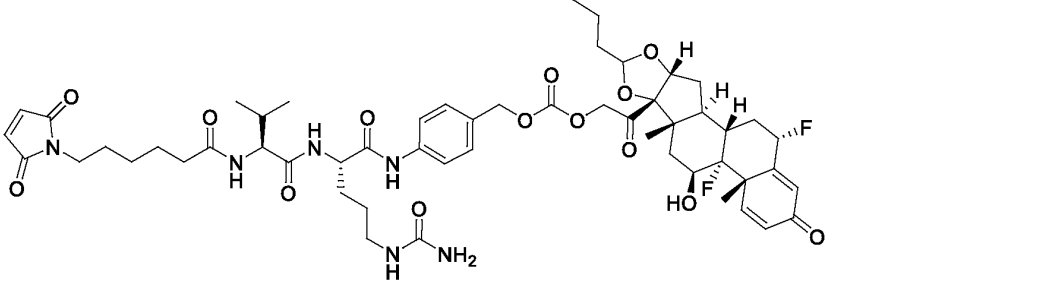
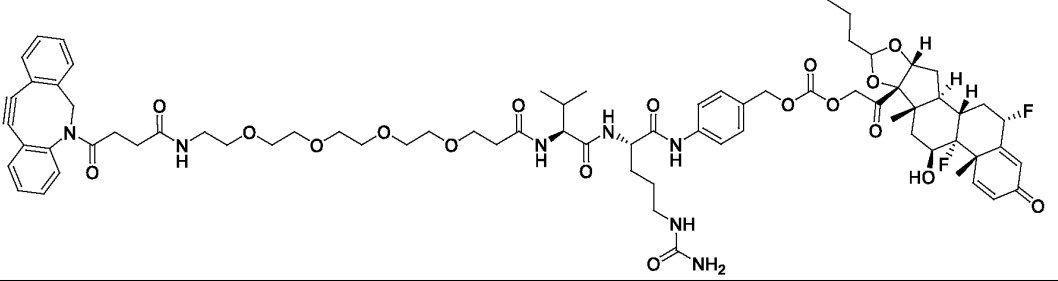
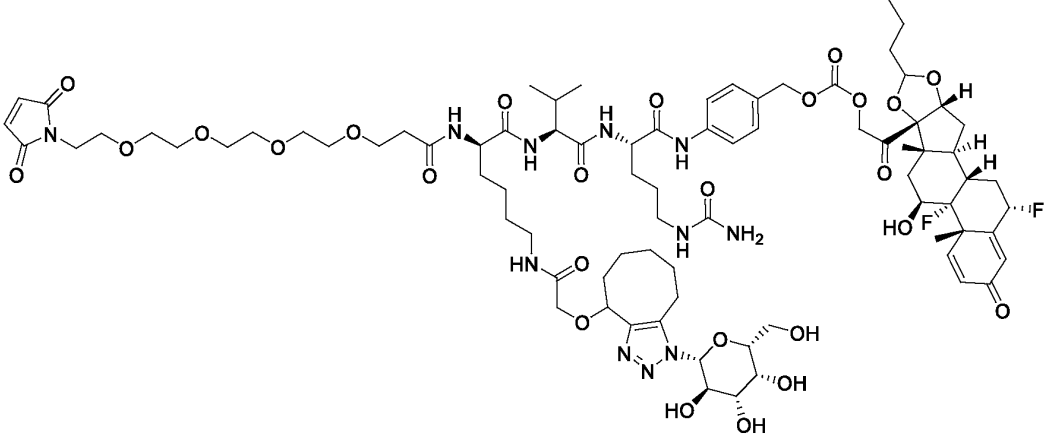
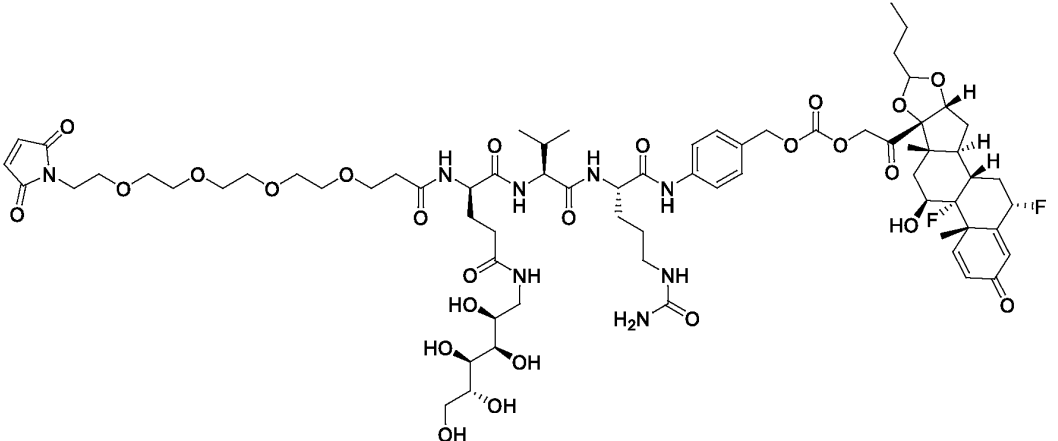
2f	
2g	
2j	
2k	
2l	

2m	 Chemical structure of compound 2m, featuring a complex molecule with a pyridine ring, a long chain of amide and ester linkages, a central triazole ring, and a large, complex polycyclic system on the right side.
2n	 Chemical structure of compound 2n, featuring a complex molecule with a pyridine ring, a long chain of amide and ester linkages, and a large, complex polycyclic system on the right side. o una mezcla de los mismos
2q	 Chemical structure of compound 2q, featuring a complex molecule with a pyridine ring, a long chain of amide and ester linkages, and a large, complex polycyclic system on the right side.
LP1	 Chemical structure of compound LP1, featuring a complex molecule with a pyridine ring, a long chain of amide and ester linkages, and a large, complex polycyclic system on the right side.

LP2	
LP3	
LP4	
LP5	
LP6	
LP7	

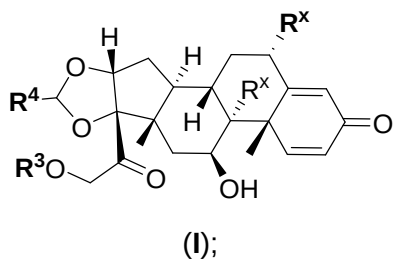
LP8	
LP9	
LP10	
LP11	
LP12	
LP13	

LP18	
LP19	
LP20	
LP21	
LP22	
LP23	

LP24	 Chemical structure of LP24, a complex molecule featuring a fluorinated steroid core, a benzamide linker, a chiral amide, and a succinimide moiety.
LP25	 Chemical structure of LP25, a complex molecule featuring a fluorinated steroid core, a benzamide linker, a chiral amide, and a succinimide moiety, with a long polyether chain.
LP26	 Chemical structure of LP26, a complex molecule featuring a fluorinated steroid core, a benzamide linker, a chiral amide, and a succinimide moiety, with a long polyether chain and a sugar moiety.
LP27	 Chemical structure of LP27, a complex molecule featuring a fluorinated steroid core, a benzamide linker, a chiral amide, and a succinimide moiety, with a long polyether chain and a sugar moiety.

LP28	
LP29	
LP30	
LP31	

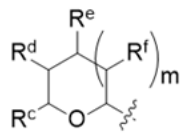
77. Un compuesto de acuerdo con la fórmula (I):



o una sal, solvato, estereoisómero o derivado farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde:

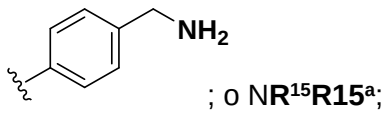
R⁴ es alquilo, arilo, arilalquilo o un heterocicloalquilo que contiene N;
a) ambos **R^x** son hidrógeno; y

R³ es -C(O)**R^z**; -(C₁-C₁₀-alquileno)-NR⁵⁰C(O)-(C₁-C₁₀-alquileno)-NR^{50a}R^{50b}; -CH₂NH₂; o



R^z es -C₄₋₁₀-alquileno-C(O)OH; -(C₁-C₁₀-alquileno)-NR⁵⁰C(O)-(C₁-C₁₀-alquileno)-NR^{50a}R^{50b} en donde cada alquileno de C₁-C₁₀ está independientemente

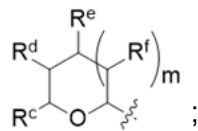
opcionalmente sustituido con uno o más hidroxilo;



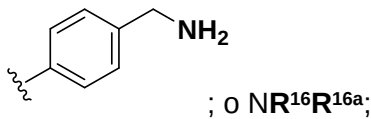
R^{15} es H o alquilo de $\text{C}_1\text{-C}_6$ y R^{15a} es $-(\text{alquileo de } \text{C}_1\text{-C}_{10})\text{-SH}$ o $-(\text{alquileo de } \text{C}_{1-6})\text{-C(O)NHNH}_2$;

b) ambos R^x son fluoro; y

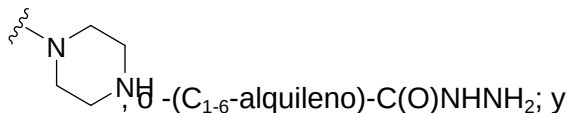
R^3 es $-\text{C(O)R}^Z$; $-(\text{C}_1\text{-C}_{10}\text{-alquileo})\text{-NR}^{50}\text{C(O)}\text{-(C}_1\text{-C}_{10}\text{-alquileo)}\text{-NR}^{50a}\text{R}^{50b}$; $-\text{CH}_2\text{NH}_2$; o



R^Z es $-\text{C}_{4-10}\text{-alquileo-C(O)OH}$; $-(\text{C}_1\text{-C}_{10}\text{-alquileo})\text{-NR}^{50}\text{C(O)}\text{-(C}_1\text{-C}_{10}\text{-alquileo)}\text{-NR}^{50a}\text{R}^{50b}$ en donde cada alquileo de $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ está independientemente opcionalmente sustituido con uno o más hidroxilo;



R^{16} es H o alquilo de $\text{C}_1\text{-C}_6$ y R^{16a} es $-(\text{alquileo de } \text{C}_1\text{-C}_{10})\text{-SH}$, $-(\text{alquileo de } \text{C}_1\text{-C}_{10})\text{-NH}_2$, $-(\text{alquileo de } \text{C}_1\text{-C}_{10})\text{-NH(alquilo de } \text{C}_{1-6})$,



cada R^{50} , R^{50a} y R^{50b} son independientemente hidrógeno o alquilo de $\text{C}_1\text{-C}_6$;

uno de R^c , R^d , R^e y R^f es CH_2OR^g y los demás son independientemente $-\text{H}$, $-\text{OH}$, hidroxialquilo, $-\text{C(O)OH}$ o CH_2OR^g , en donde cada R^g es independientemente $-(\text{C}_{1-6}\text{-alquileo})\text{-C(O)OH}$ o $-(\text{C}_{1-6}\text{-alquileo})\text{-C(O)O(alquilo)}$; o uno de R^c , R^d , R^e y R^f es hidroxialquilo y los demás son $-\text{H}$; y

m es 0 o 1.

78. El compuesto de conformidad con la reivindicación 77, en donde R^4 es alquilo.

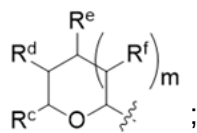
79. El compuesto de conformidad con la reivindicación 77 o 78, en donde R^4 está en la configuración R.

80. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 77-

79, en donde

a) ambos R^x son hidrógeno; y

R^3 es $-C(O)R^Z$; $-(C_1-C_{10}\text{-alquileo})-NR^{50}C(O)-(C_1-C_{10}\text{-alquileo})-NR^{50a}R^{50b}$; o

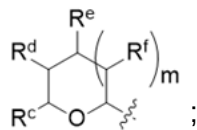


R^Z es $-C_{4-10}\text{-alquileo}-C(O)OH$; $-(C_1-C_{10}\text{-alquileo})-NR^{50}C(O)-(C_1-C_{10}\text{-alquileo})-NR^{50a}R^{50b}$ en donde cada alquileo de C_1-C_{10} está independientemente opcionalmente sustituido con uno o más hidroxilo; o $NR^{15}R^{15a}$;

R^{15} es H o alquilo de C_1-C_6 y R^{15a} es $-(\text{alquileo de } C_1-C_{10})-SH$ o $-(\text{alquileo de } C_{1-6})-C(O)NHNH_2$;

b) ambos R^x son fluoro; y

R^3 es $-C(O)R^Z$; $-(C_1-C_{10}\text{-alquileo})-NR^{50}C(O)-(C_1-C_{10}\text{-alquileo})-NR^{50a}R^{50b}$; o

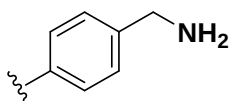


R^Z es $-C_{4-10}\text{-alquileo}-C(O)OH$; $-(C_1-C_{10}\text{-alquileo})-NR^{50}C(O)-(C_1-C_{10}\text{-alquileo})-NR^{50a}R^{50b}$ en donde cada alquileo de C_1-C_{10} está independientemente opcionalmente sustituido con uno o más hidroxilo; o $NR^{16}R^{16a}$;

R^{16} es H o alquilo de C_1-C_6 y R^{16a} es $-(\text{alquileo de } C_1-C_{10})-SH$, $-(\text{alquileo de } C_1-C_{10})-NH_2$, $-(\text{alquileo de } C_1-C_{10})-NH(\text{alquilo de } C_{1-6})$,



81. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 77-79, en donde R^3 es $-C(O)R^Z$ y R^Z es



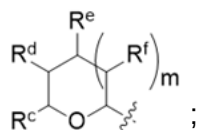
, o $-\text{CH}_2\text{NH}_2$.

82. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 77-80, en donde R^3 es $-\text{C}(\text{O})\text{R}^z$.

83. El compuesto de conformidad con la reivindicación 82, en donde R^z es $-\text{C}_{4-10}\text{-alquileo}-\text{C}(\text{O})\text{OH}$.

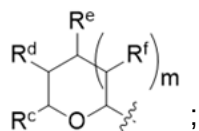
84. El compuesto de conformidad con la reivindicación 82, en donde R^z es $-(\text{alquileo de } \text{C}_1\text{-C}_{10})-\text{NR}^{50}\text{C}(\text{O})-(\text{alquileo de } \text{C}_1\text{-C}_{10})-\text{NR}^{50a}\text{R}^{50b}$ en donde cada alquileo de $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ está independientemente opcionalmente sustituido con uno o más hidroxí.

85. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 77-80, en donde R^3 es



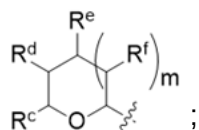
en donde m es 1.

86. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 77-80, en donde R^3 es



, m es 1, y uno de R^c , R^d , R^e y R^f es CH_2OR^g y los demás son independientemente $-\text{H}$, $-\text{OH}$ o hidroxialquilo.

87. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 77-80, en donde R^3 es



, m es 1, y uno de **R^c**, **R^d**, **R^e** y **R^f** es hidroxialquilo y los demás son -H.

88. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 77-80, en donde **R³** es -(C₁-C₁₀-alquilenos)-NR⁵⁰C(O)-(C₁-C₁₀-alquilenos)-NR^{50a}R^{50b}.

89. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 77-88, en donde ambos **R^x** son hidrógeno.

90. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 77-88, en donde ambos **R^x** son fluoro.

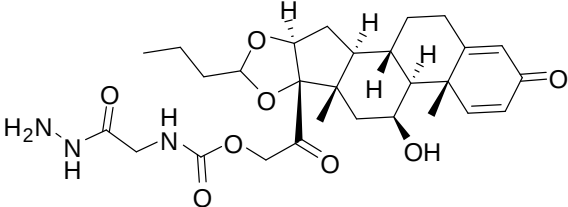
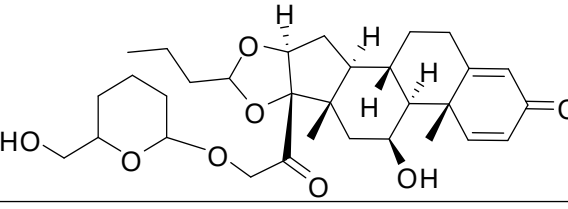
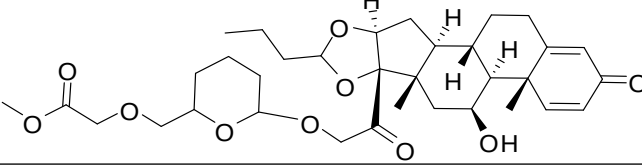
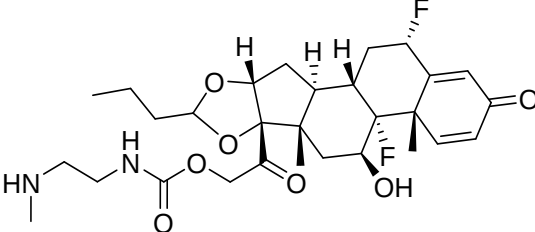
91. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 77-80, en donde ambos **R^x** son hidrógeno, **R³** es -C(O)**R^Z** y **R^Z** es NR¹⁵R^{15a}.

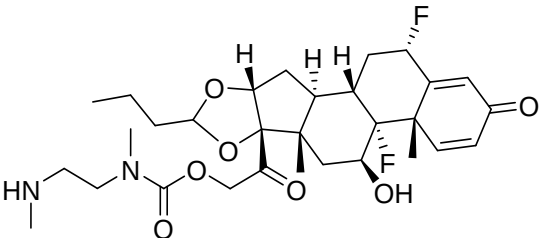
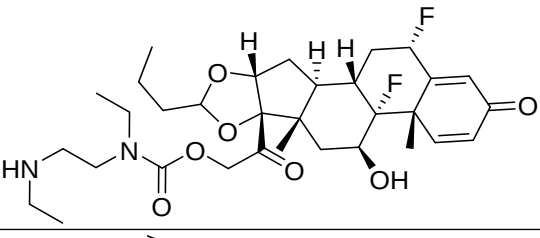
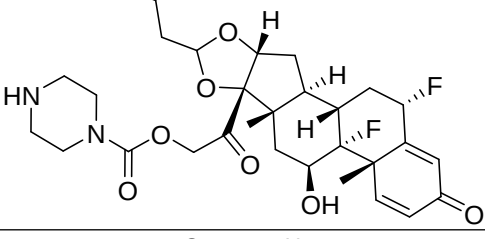
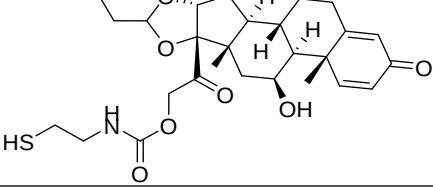
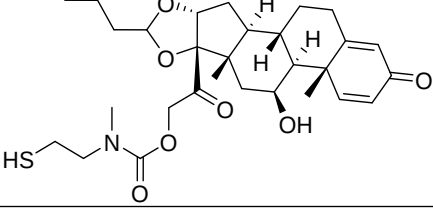
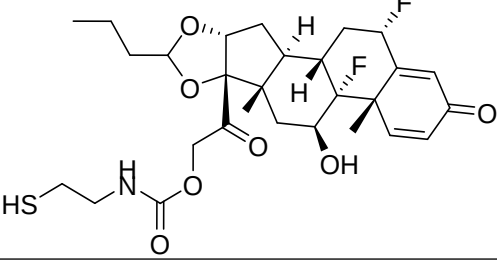
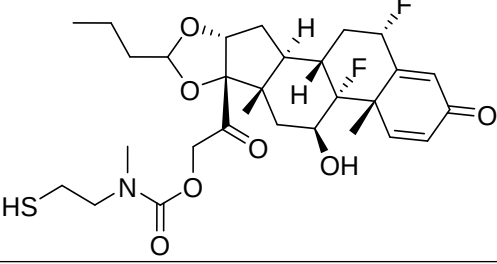
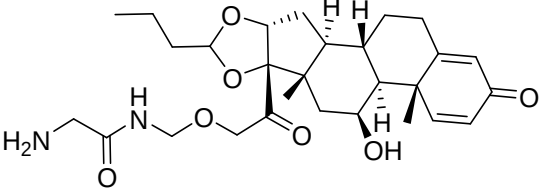
92. El compuesto de conformidad con la reivindicación 91, en donde **R¹⁵** es H.

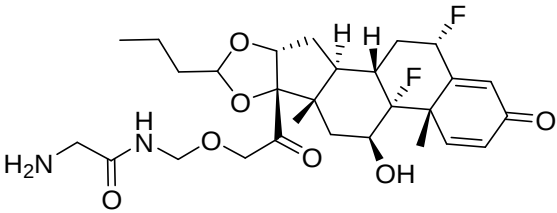
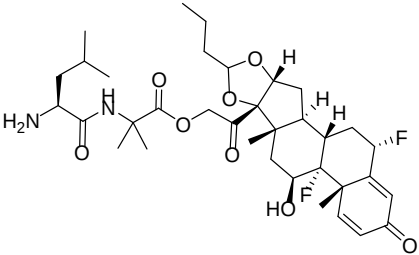
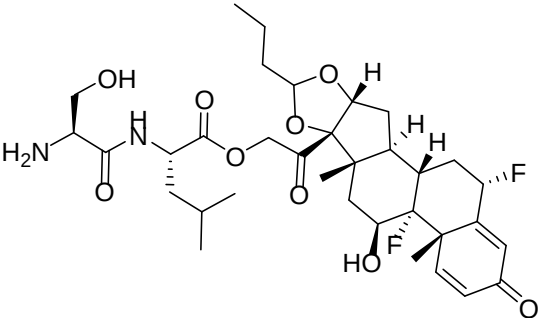
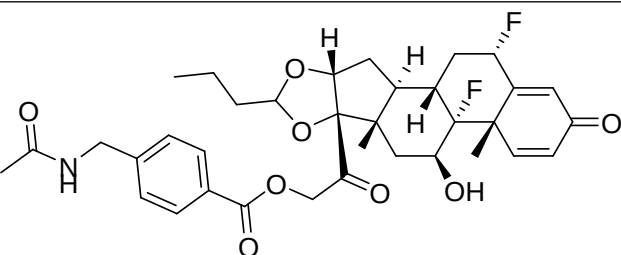
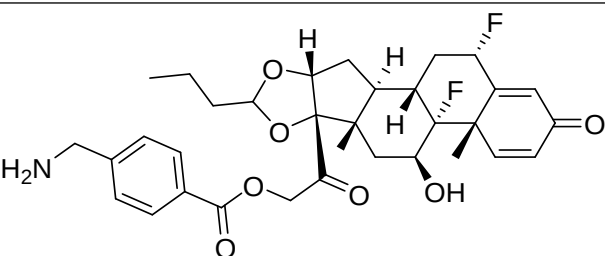
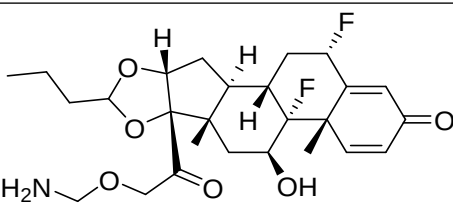
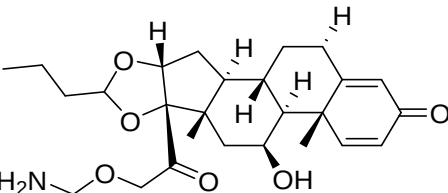
93. El compuesto de las reivindicaciones 77-80, en donde ambos **R^x** son fluoro, **R³** es -C(O)**R^Z** y **R^Z** es NR¹⁶R^{16a}.

94. El compuesto de conformidad con la reivindicación 93, en donde **R¹⁶** es H.

95. Un compuesto seleccionado de:

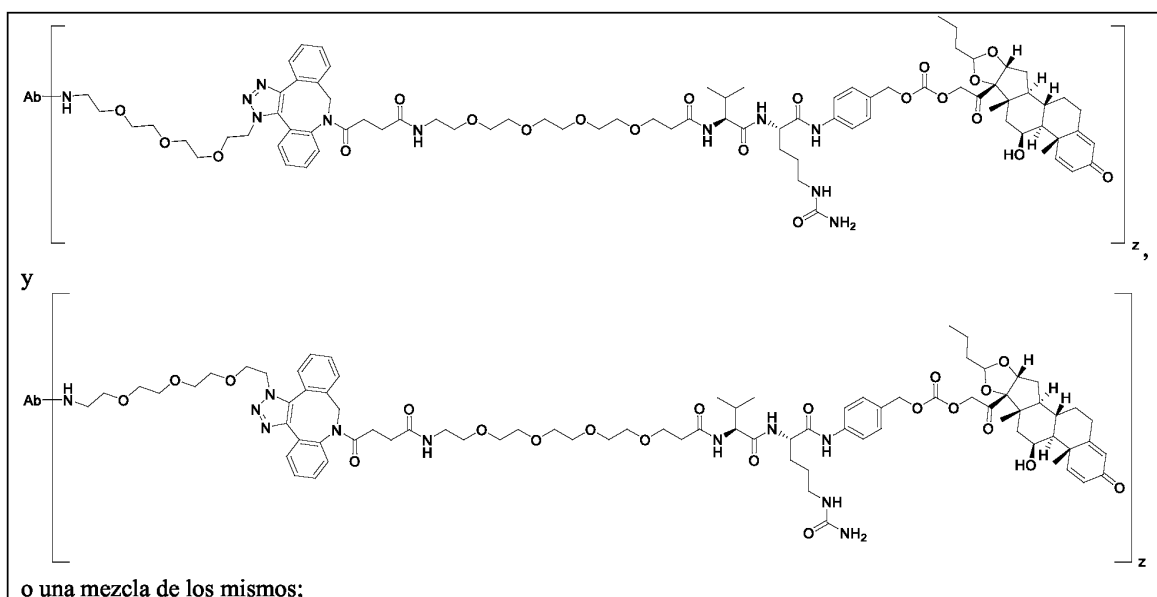
1e	
1g	
1h	
101a	

101b	
101c	
101d	
102c	
102d	
102e	
102f	
103a	

103b	
104a	
104b	
105a	
105b	
106a	
107a	

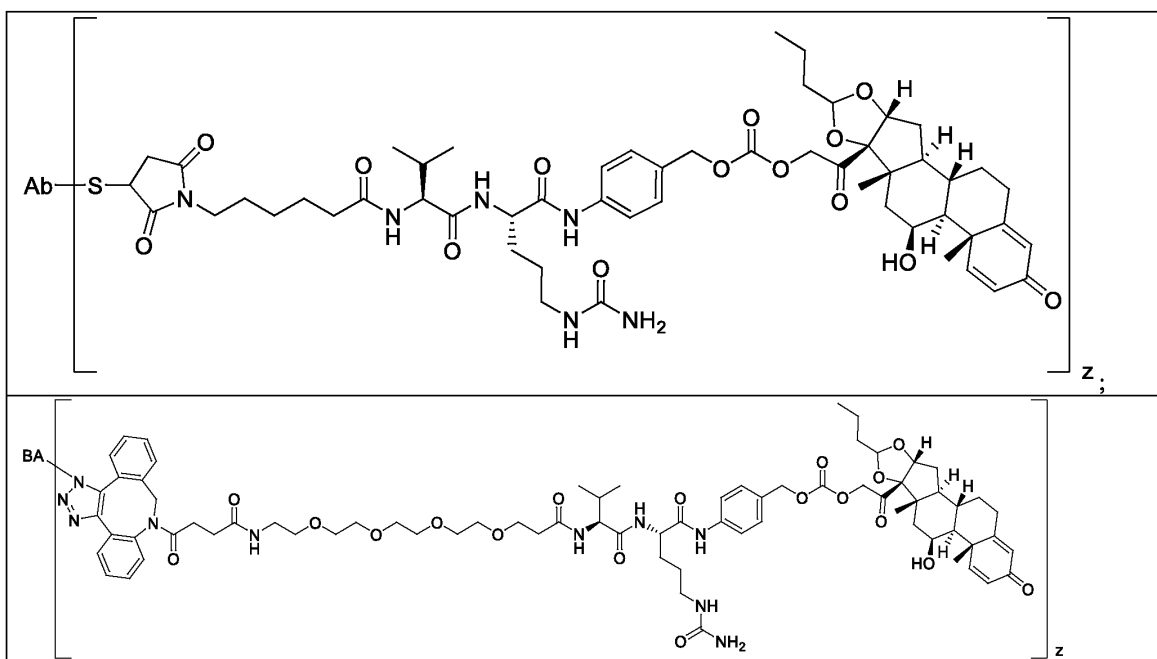
o una sal, solvato o estereoisómero farmacéuticamente aceptable del mismo.

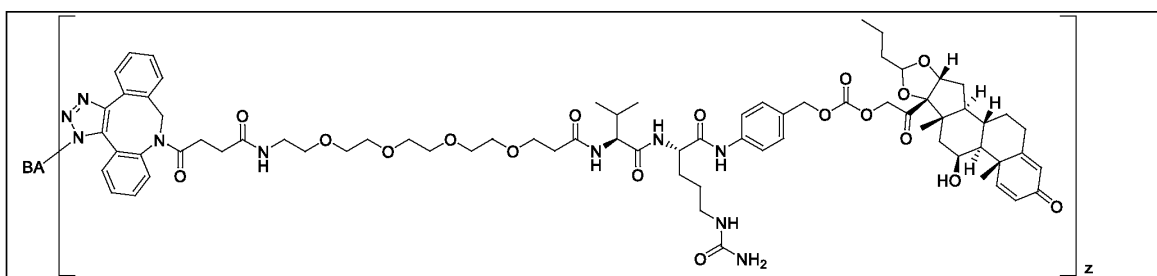
96. Un compuesto que se selecciona de



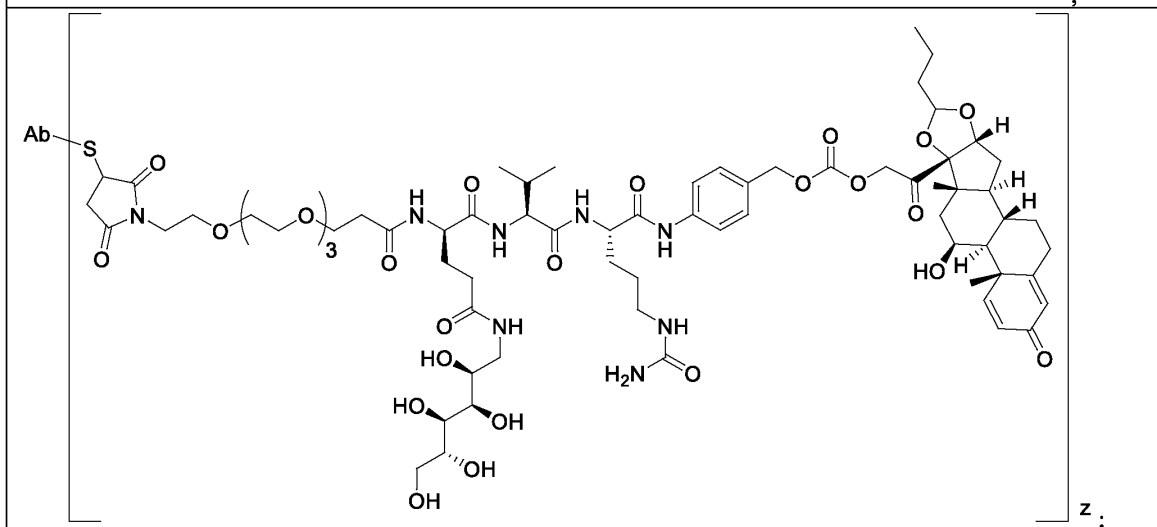
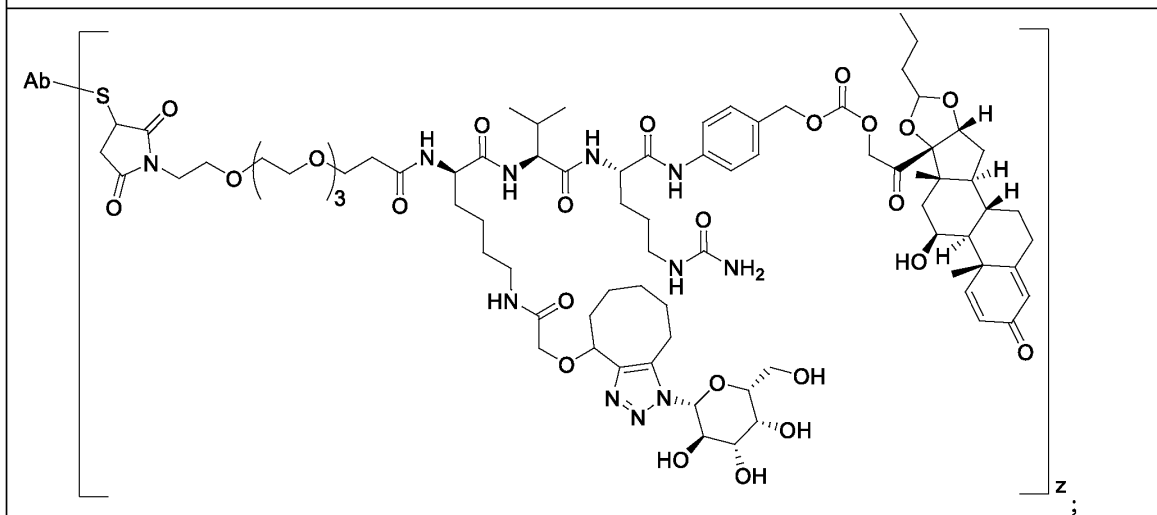
en donde Ab es un anticuerpo monoclonal, anticuerpo policlonal, fragmento de anticuerpo o anticuerpo biespecífico; o una sal, solvato o estereoisómero farmacéuticamente aceptable del mismo.

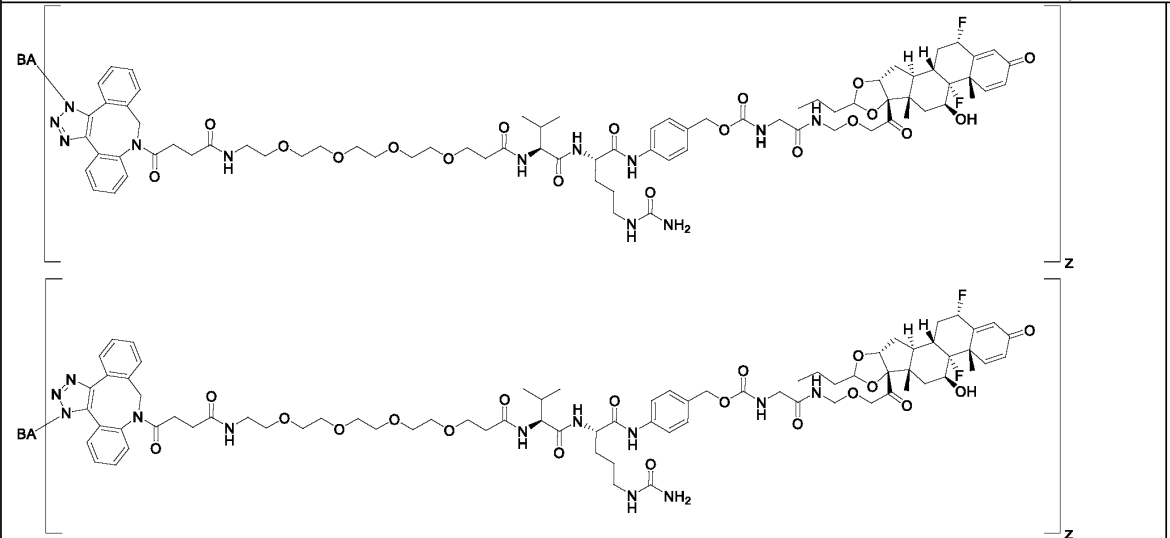
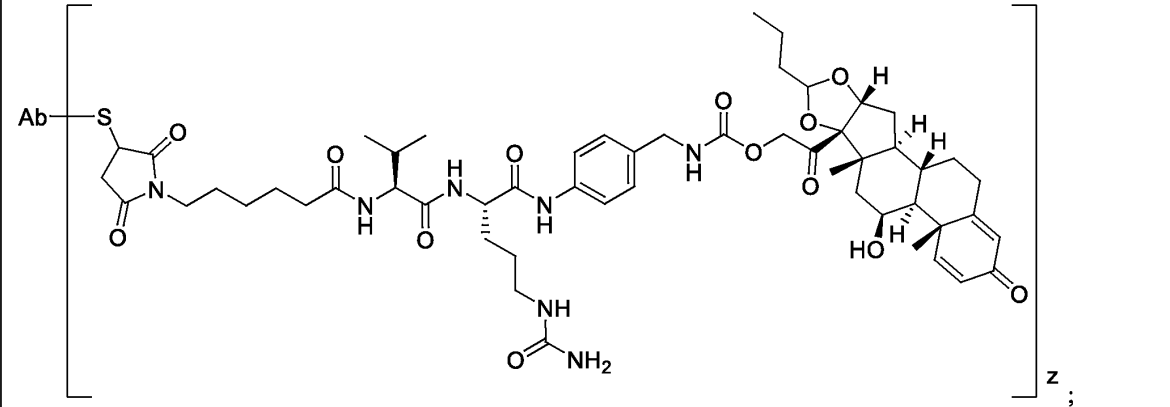
97. Un compuesto de acuerdo con una de las siguientes fórmulas:



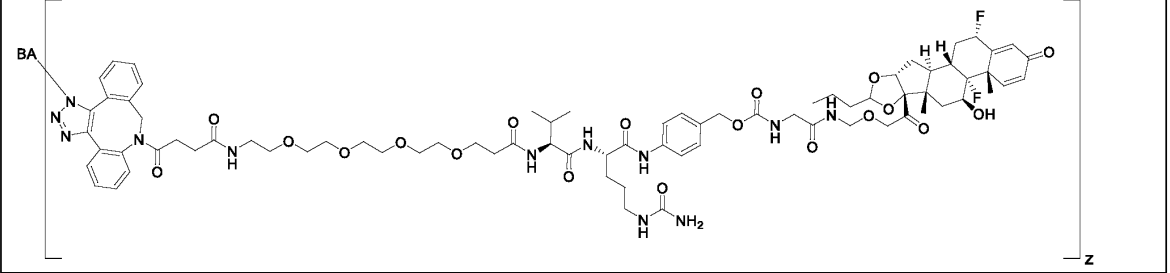


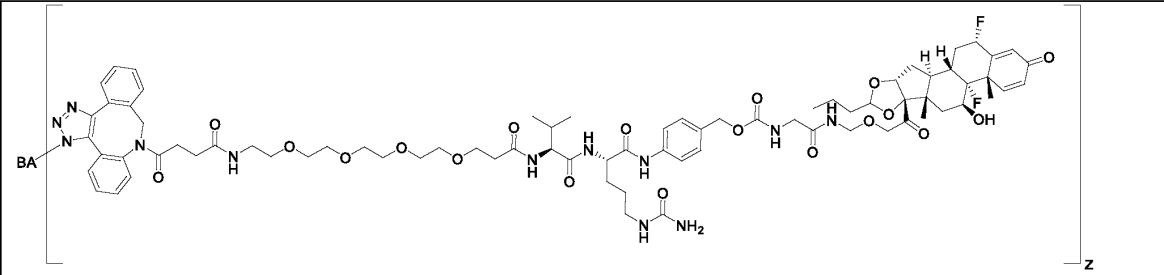
o una mezcla de los mismos;



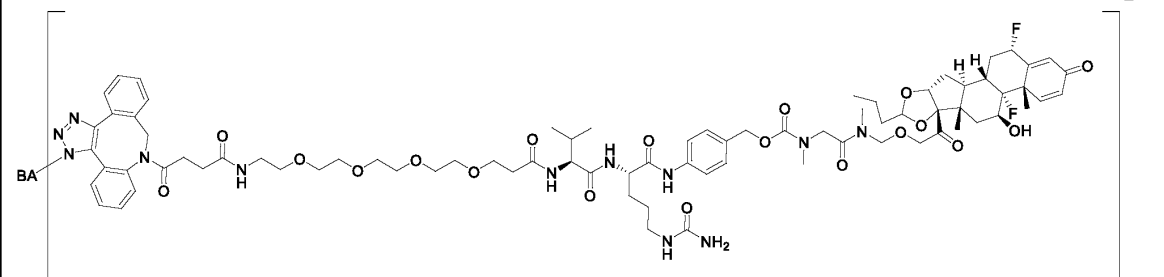
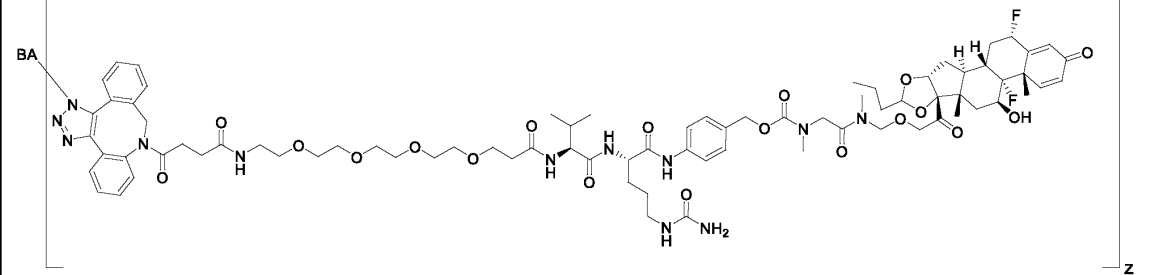


o una mezcla de los mismos;

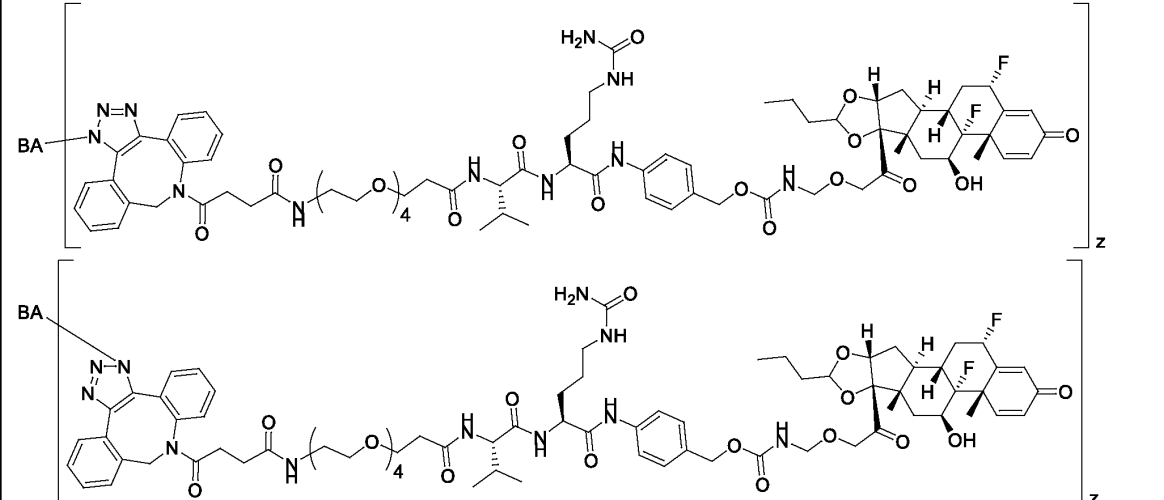




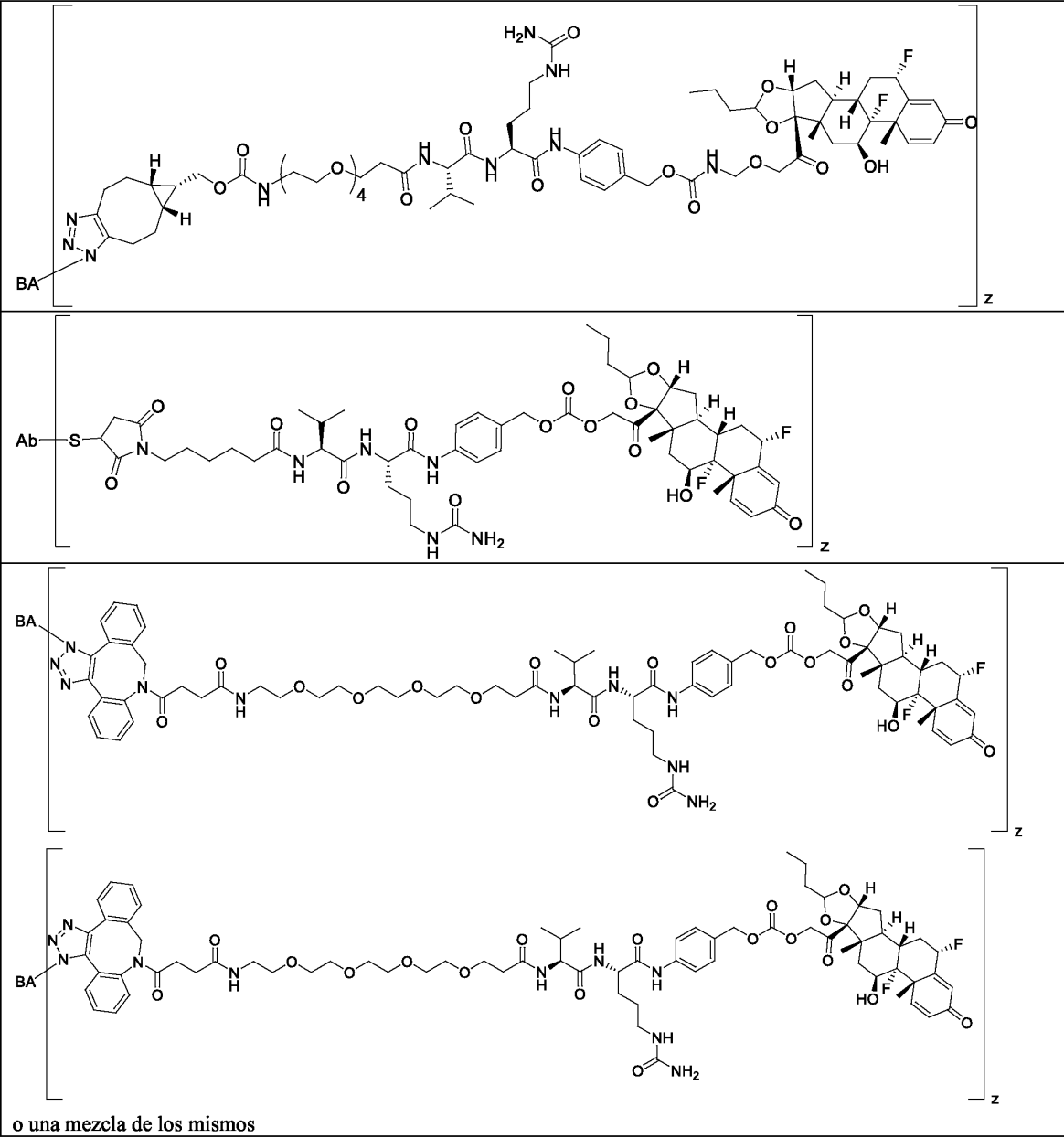
o una mezcla de los mismos



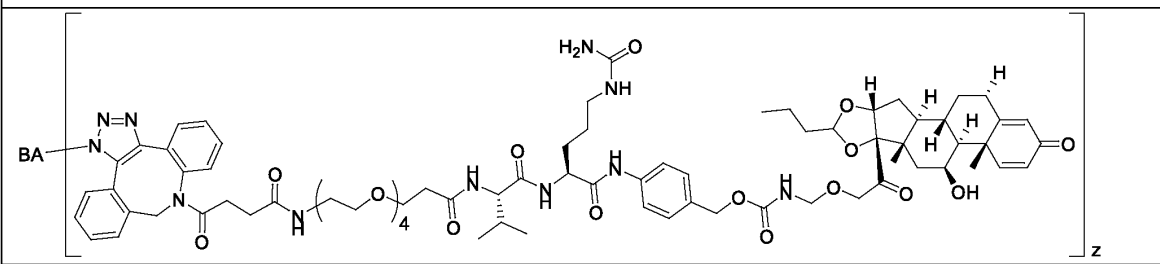
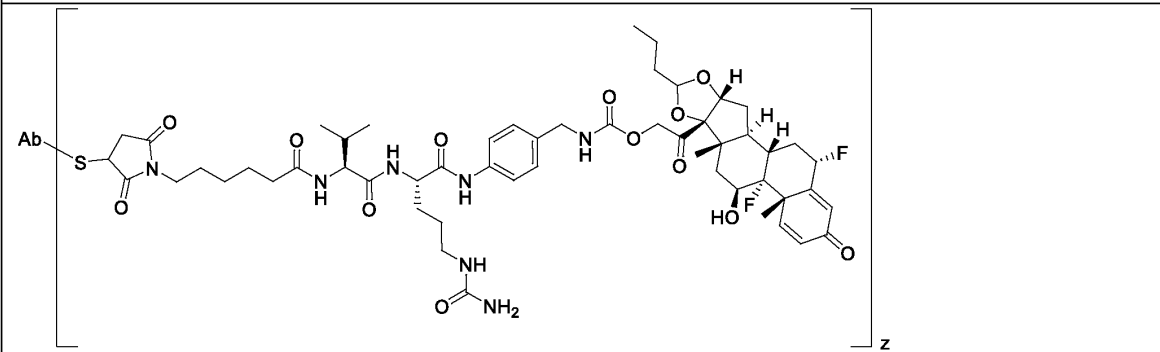
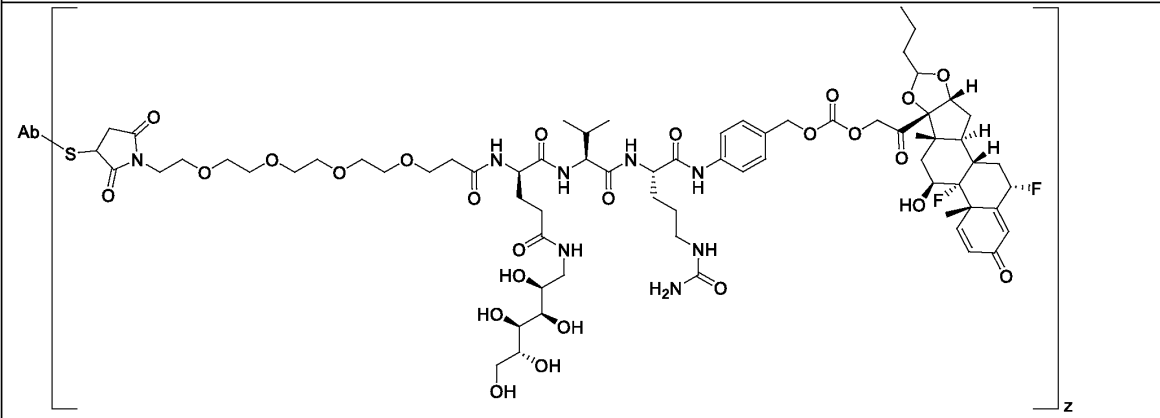
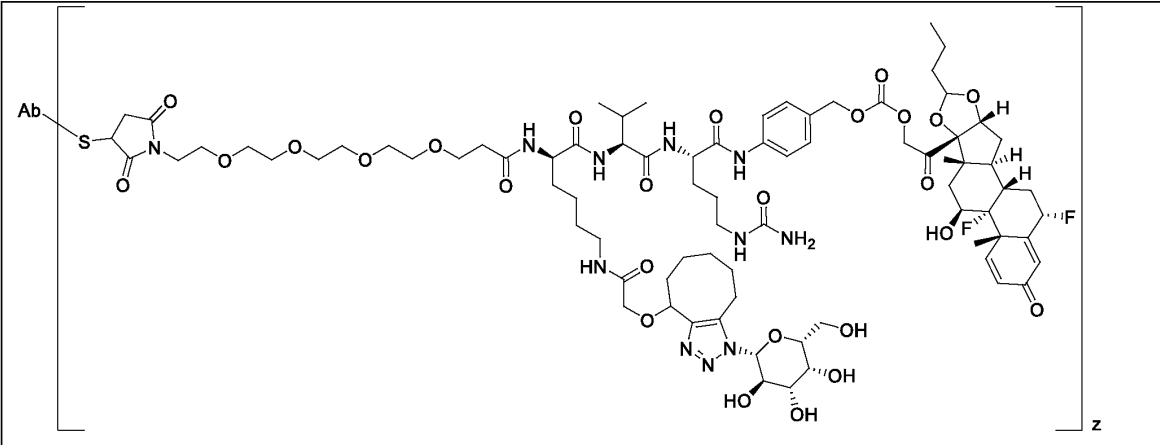
o una mezcla de los mismos

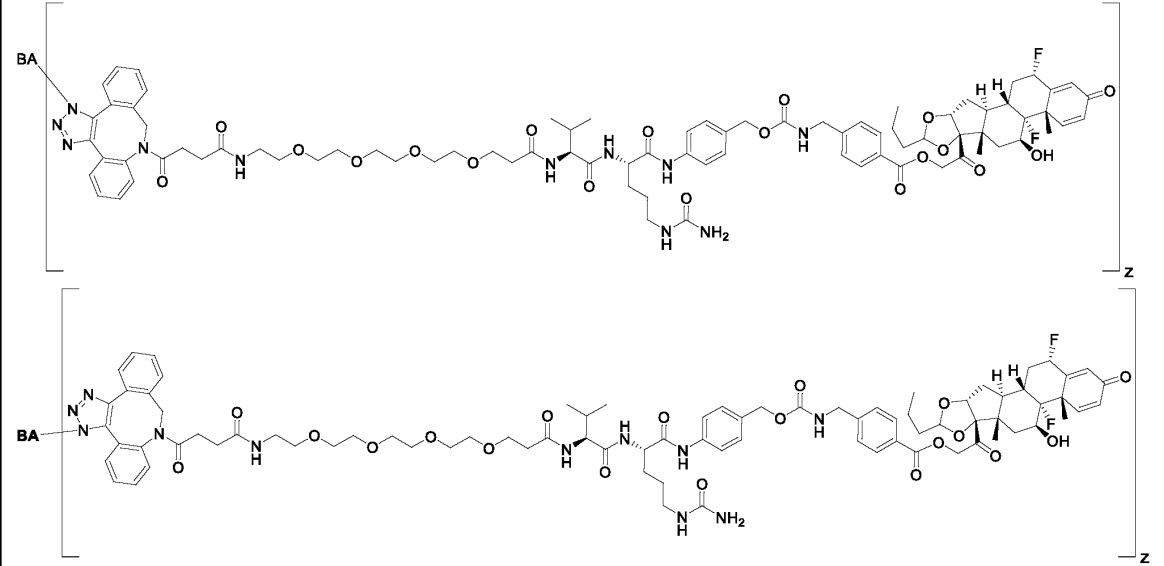
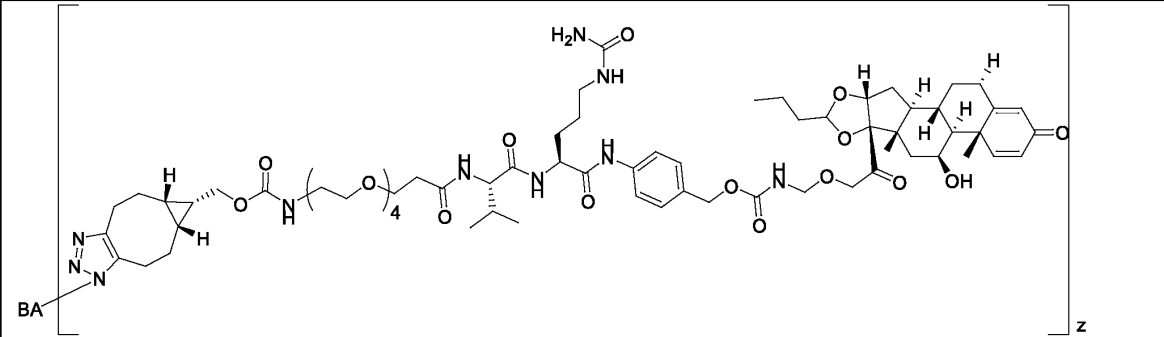
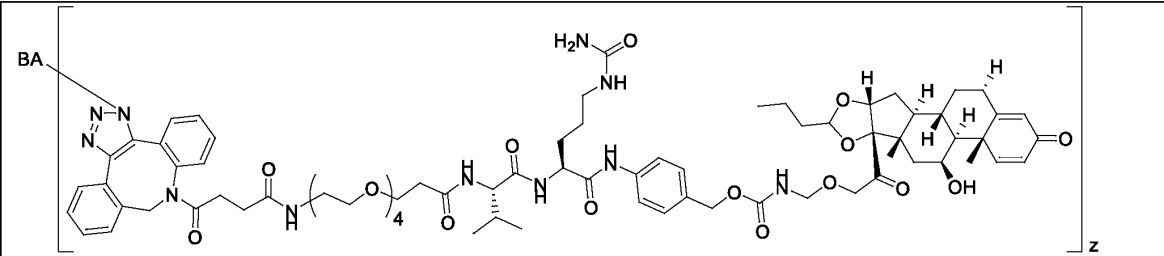


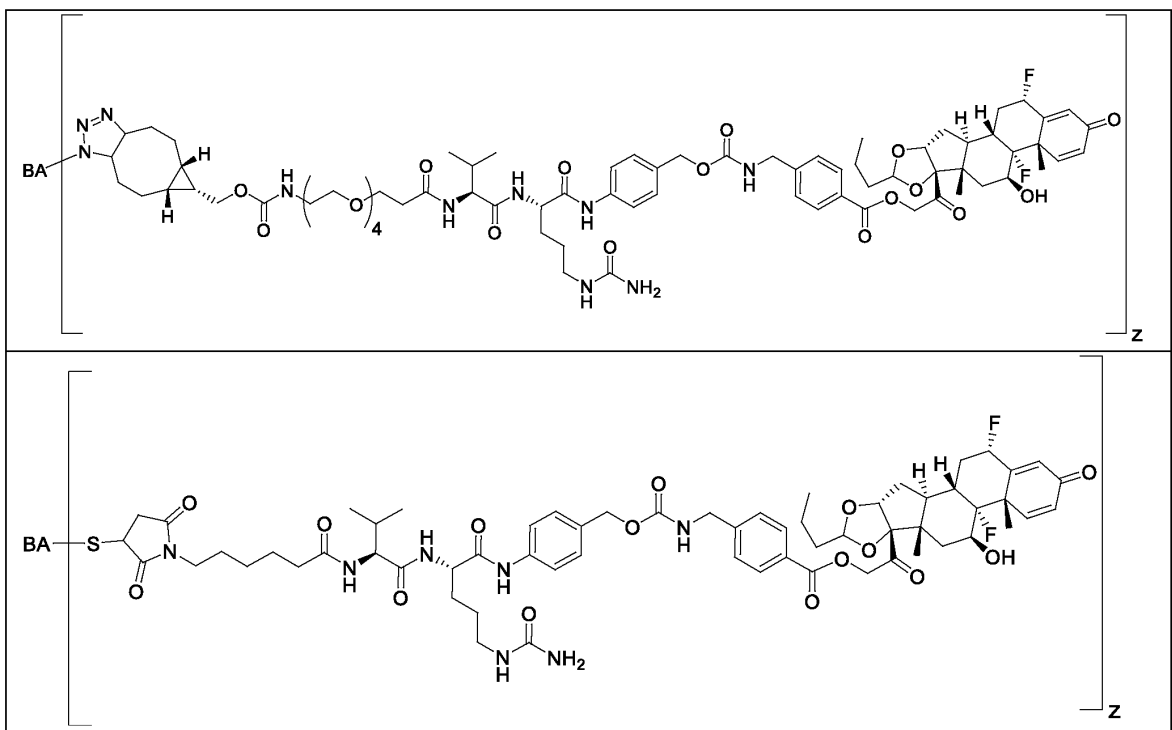
o una mezcla de los mismos



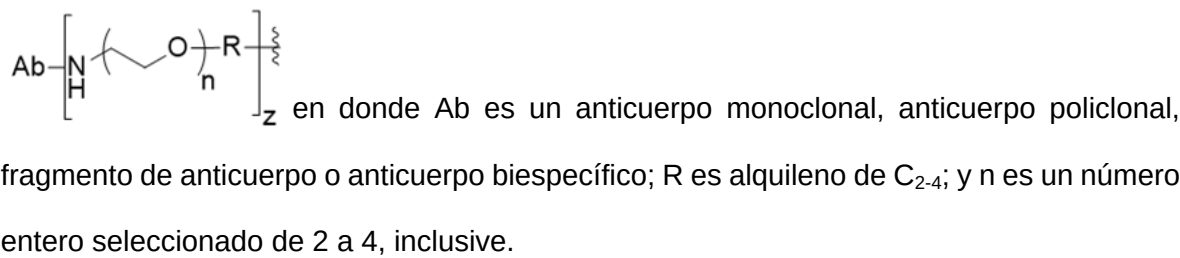
o una mezcla de los mismos







en donde **BA** comprende un anticuerpo que tiene la siguiente estructura



98. El compuesto de conformidad con la reivindicación 94 o 95, en donde Ab es MSR1.

99. Un método para tratar una enfermedad, trastorno o afección asociada con la señalización del receptor de glucocorticoides que comprende administrar a un paciente que tenga dicha enfermedad, trastorno o afección una cantidad terapéuticamente efectiva del compuesto de la Fórmula (III) de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 63 y 68-75, o el compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 96-98.

100. El método de conformidad con la reivindicación 99, en donde la enfermedad, trastorno o afección es una enfermedad, trastorno o afección inflamatoria.

101. El método de conformidad con la reivindicación 99 o 100, en donde se reducen los efectos secundarios asociados con la administración de la carga útil de esteroides no conjugada de dicho compuesto.