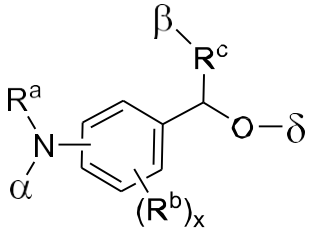
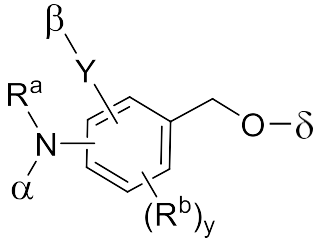
REIVINDICACIONES

1. Un compuesto conector, o un estereoisómero o sal del mismo, que comprende:

(a) una unidad conectora que tiene entre 1 y 4 sitios de unión para una unidad de fármaco y que tiene una de las siguientes estructuras (i) o (ii):



(i)



(ii) ;

(b) por lo menos un grupo polar que comprende una unidad Polímero, opcionalmente una unidad sacárido, opcionalmente una unidad carboxilo, y combinaciones de las mismas; y

(c) opcionalmente un grupo extensor que tiene un sitio de unión para un grupo de direccionamiento;

donde:

α— es un sitio de unión a un grupo enzimáticamente escindible;

β— es un sitio de unión al por lo menos un grupo polar;

δ— es H, un sitio de unión a por lo menos una de las unidades de fármaco, o un sitio de unión a un grupo conector unido a por lo menos una de las unidades de fármaco;

la unidad Polímero comprende una poliamida, un poliéter, o una combinación de los mismos, donde el poliéter comprende un grupo hidroxilo, un grupo polihidroxilo, un grupo sacárido, un grupo carboxilo, o combinaciones de los mismos;

cada R^a es independientemente H o C_1-C_6 alquilo;

cada R^b es independientemente halo, C_1-$_6$ alquilo, un sitio de unión a por lo menos una de las unidades de fármaco, o un sitio de unión a por lo menos uno de los grupos polares;

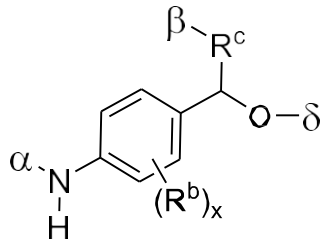
x es 0, 1, 2, 3, o 4;

y es 0, 1, 2, o 3;

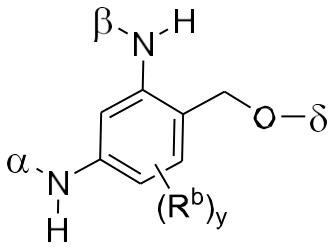
R^c es un enlace, -C(O)-, -S(O)-, -SO_2-, C_1-$_6$ alquileno, C_1-$_6$ alquinileno, triazolilo, o combinaciones de los mismos; y

Y es un enlace, -O-, -S-, -N(R^a)-, -C(O)-, -S(O)-, -SO_2-C_1-C_6 alquileno, C_1-C_6 alquenileno, C_1-C_6 alquinileno, un grupo que contiene triazolilo, o combinaciones de los mismos.

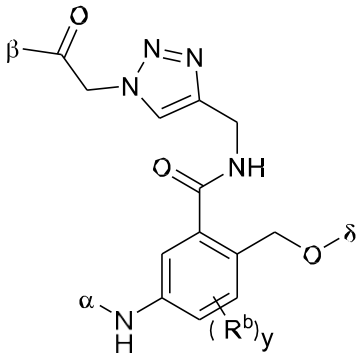
2. El compuesto conector de la reivindicación 1, donde la unidad conectora tiene una de las siguientes estructuras (i-a), (ii-a), o (iii-a):



(i-a)



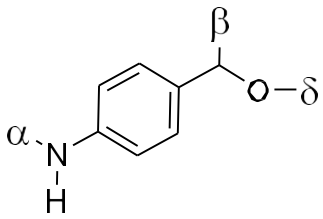
(ii-a) ,



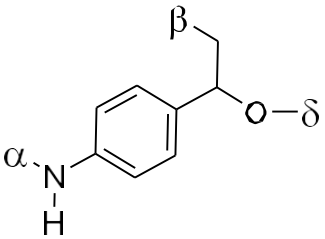
(iii-a),

o un estereoisómero o sal de las mismas.

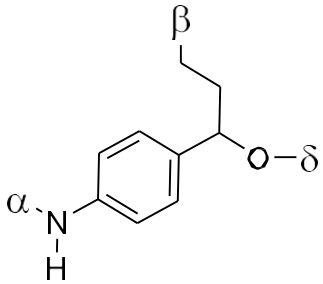
3. El compuesto conector de la reivindicación 1, donde la unidad conectora tiene una de las siguientes estructuras (i-b), (i-c), (i-d), (i-e), o (i-f):



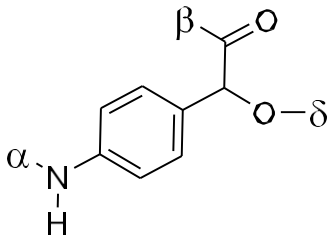
(i-b)



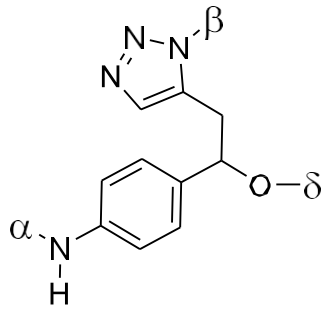
(i-c) ,



(i-d)



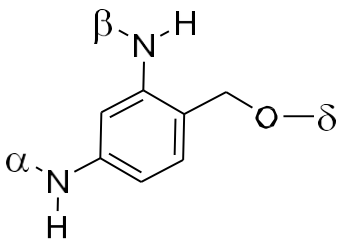
(i-e) ,



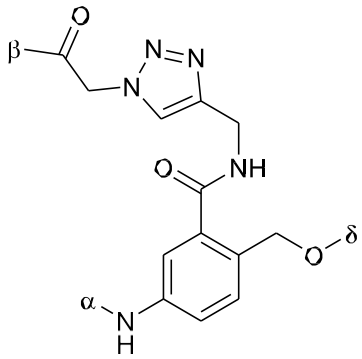
(i-f)

o un estereoisómero o sal de las mismas.

4. El compuesto conector de la reivindicación 1, donde la unidad conectora tiene la siguiente estructura (ii-b) o (iii-b):



(ii-b),



(iii-b),

o un estereoisómero o sal de las mismas.

5. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 1-4, donde el por lo menos un grupo polar comprende por lo menos una unidad sacárido que tiene la siguiente fórmula:

$$L3–N(CH_2 – (CH(XR))_k – X_1(X_2))_2 \qquad (X)$$

o un estereoisómero o sal de la misma, donde:

cada X se selecciona independientemente entre NH y O;

cada R se selecciona independientemente entre hidrógeno, acetilo, un monosacárido, un disacárido, y un polisacárido;

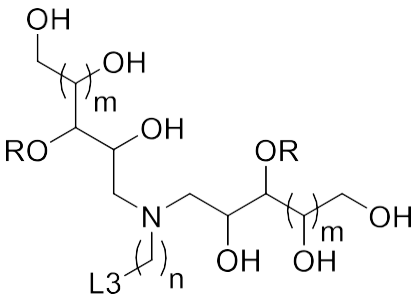
cada X_1 se selecciona independientemente entre CH_2 y C(O);

cada X_2 se selecciona independientemente entre H, OH y OR;

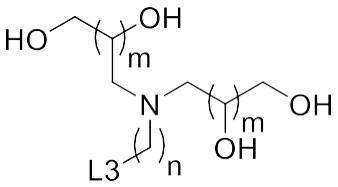
k es entre 1 y 10; y

L3 es un punto de unión al resto del grupo polar.

6. El compuesto conector cualquiera de las reivindicaciones 1-4, donde la por lo menos una unidad sacárido tiene una de las siguientes estructuras (XII) o (XIII):



(XII) o



(XIII) ,

o un estereoisómero o sal de las mismas, donde:

cada R se selecciona independientemente entre hidrógeno, un monosacárido, un disacárido y un polisacárido;

m es entre 1 y 8; y

n es entre 0 y 4.

7. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 1-6, que comprende un grupo polar que tiene una fórmula seleccionada entre:

(a) $\sim R^{20}\text{-}R^{21}\text{-}[O\text{-}CH_2\text{-}CH_2]_{n20}\text{-}R^{22}\text{-}NR^{24}R^{25}$ (XX)

o un estereoisómero o una sal de la misma, donde:

R^{20} es un grupo de unión al sitio R^b, o al grupo enzimáticamente escindible;

R^{21} y R^{22} son independientemente entre sí un enlace o C_1-C_3 alquileno;

R^{24} y R^{25} se seleccionan independientemente en cada caso entre H; grupo polihidroxilo; grupo polihidroxilo sustituido; grupo -C(O)-polihidroxilo; grupo -C(O)-polihidroxilo sustituido; C_1-C_8 alquilo sustituido; -C(O)-C_1-C_8 alquilo sustituido; un quelante; y -C(O)-R^{28}, donde R^{28} es una unidad sacárido de fórmula (XII) o (XIII), con la condición de que R^{24} y R^{25} no son ambos H; y

n20 es entre 2 y 26; o

(b) $\sim R^{20}\text{-}R^{21}\text{-}[O\text{-}CH_2\text{-}CH_2]_{n20}\text{-}R^{22}\text{-}NR^{24}R^{25}$ (XXI)

o un estereoisómero o sal de la misma, donde:

R^{20} es un grupo de unión al sitio R^b, o al grupo enzimáticamente escindible;

R^{21} y R^{22} son independientemente entre sí un enlace o C_1-C_3 alquileno;

uno de R^{24} y R^{25} se selecciona entre H; grupo polihidroxilo; grupo polihidroxilo sustituido; grupo -C(O)-polihidroxilo; grupo -C(O)-polihidroxilo sustituido; C_1-C_8

alquilo sustituido; -C(O)-C_1-C_8 alquilo sustituido; un quelante; y -C(O)-R^{28}, donde R^{28} es una unidad sacárido de fórmula (XII) o (XIII); y el otro de R^{24} y R^{25} es un polietilenglicol, que tiene opcionalmente entre 1 y 24 subunidades etilenglicol; y

n20 es entre 2 y 26; o

(c) $\sim R^{20}\text{-}[\text{-}R^{26}\text{-}[R^{29}\text{-}[O\text{-}CH_2\text{-}CH_2\text{-}]_{n20}R^{29}]_{n21}\text{-}R^{27}\text{-}NR^{24}R^{25}]_{n27}$ (XXII)

o un estereoisómero o sal de la misma, donde:

R^{20} es un grupo de unión al sitio R^b, o al grupo enzimáticamente escindible;

R^{26} y R^{27} se seleccionan en forma opcional e independiente entre un enlace, C_1-C_{12} alquileno, -NH-C_1-C_{12} alquileno, -C_1-C_{12} alquileno-NH-, -C_1-C_{12} alquileno-$N(CH_3)$-, -C(O)-C_1-C_{12} alquileno, -C_1-C_{12} alquileno-C(O)-, -NH-C_1-C_{12} alquileno-C(O)- y -C(O)-C_1-C_{12} alquileno-NH-;

uno de R^{24} y R^{25} se selecciona entre H; grupo polihidroxilo; grupo polihidroxilo sustituido; grupo -C(O)-polihidroxilo; grupo -C(O)-polihidroxilo sustituido; C_1-C_8 alquilo sustituido; -C(O)-C_1-C_8 alquilo sustituido; un quelante; y -C(O)-R^{28}, donde R^{28} es una unidad sacárido de fórmula (XII) o (XIII); y el otro de R^{24} y R^{25} se selecciona entre H; grupo polihidroxilo; grupo polihidroxilo sustituido; grupo -C(O)-polihidroxilo; grupo -C(O)-polihidroxilo sustituido, donde R^{28} es una unidad sacárido de fórmula (XII) o (XIII); y polietilenglicol, que tiene opcionalmente entre 1 y 24 subunidades etilenglicol, con la condición de que R^{24} y R^{25} no son ambos H;

cada R^{29} se selecciona en forma opcional e independiente entre -C(O)-, -NH-, -C(O)-C_1-C_6 alquileno-, -NH-C_1-C_6 alquileno-, -C_1-C_6 alquileno-NH-, -C_1-C_6 alquileno-C(O)-, -NH(CO)-C_1-C_6alquileno-, -$N(CH_3)$-(CO)-C_1-C_6alquileno-, -NH(CO)NH-, y triazol;

n20 es entre 2 y 26;

n21 es entre 1 y 4; y

n27 es entre 1 y 4, o

(d) $\sim R^{20}\text{-}R^{21}\text{-}[\text{-}C(R^{\alpha})H\text{-}C(O)\text{-}N(R^N)\text{-}]_{n20}\text{-}R^{22}\text{-}NR^{24}R^{25}$ (XXIII)

o un estereoisómero o sal de la misma, donde:

R^{20} es un grupo de unión al sitio R^b, o al grupo enzimáticamente escindible;

R^{21} es un enlace o C_1-C_3 alquileno, -C_1-C_3alquileno-$[O\text{-}CH_2\text{-}CH_2\text{-}]_{n20}$, -$[CH_2\text{-}CH_2\text{-}O]_{n20}$-$C_1$-$C_3$alquileno- o -$C_1$-$C_3$alquileno-$[O\text{-}CH_2\text{-}CH_2\text{-}]_{n20}$-C(O)-;

R^{22} es C_1-C_3 alquileno, -C_1-C_3alquileno-$[O\text{-}CH_2\text{-}CH_2\text{-}]_{n20}$, -$[CH_2\text{-}CH_2\text{-}O]_{n20}$-$C_1$-$C_3$alquileno- o -$C_1$-$C_3$alquileno-$[O\text{-}CH_2\text{-}CH_2\text{-}]_{n20}$-C(O)-;

cada R^{α} es independientemente H o -R^{22}-$NR^{24}R^{25}$;

cada R^N es independientemente H, C_1-C_6 alquilo o -R^{22}-$NR^{24}R^{25}$;

R^{24} y R^{25} se seleccionan independientemente en cada caso entre H; grupo polihidroxilo; grupo polihidroxilo sustituido; grupo -C(O)-polihidroxilo; grupo -C(O)-polihidroxilo sustituido; C_1-C_8 alquilo sustituido;-C(O)-C_1-C_8 alquilo sustituido; un quelante; y -C(O)-R^{28}, donde R^{28} es una unidad sacárido de fórmula (XII) o (XIII), con la condición de que R^{24} y R^{25} no son ambos H; y

cada n20 es independientemente entre 2 y 26, o

(e) ~R^{20}-R^{21}-[-C(R^{α})H-C(O)-N(R^{N})-]$_{n20}$-R^{22}-CO_2R^{26} (XXIV)

o un estereoisómero o sal de la misma, donde:

R^{20} es un grupo de unión al sitio R^b, o al grupo enzimáticamente escindible;

R^{21} y R^{22} son independientemente entre sí un enlace, C_1-C_3 alquileno, o -C_1-C_3alquileno[O-CH_2-CH_2-]$_{n20}$;

cada R^{α} es independientemente H o -R^{22}-$NR^{24}R^{25}$;

cada R^N es independientemente H, C_1-C_6 alquilo o -R^{22}-$NR^{24}R^{25}$;

R^{24} y R^{25} se seleccionan independientemente en cada caso entre H; grupo polihidroxilo; grupo polihidroxilo sustituido; grupo -C(O)-polihidroxilo; grupo -C(O)-polihidroxilo sustituido; C_1-C_8 alquilo sustituido; -C(O)-C_1-C_8 alquilo sustituido; un quelante; y -C(O)-R^{28}, donde R^{28} es una unidad sacárido de fórmula (XII) o (XIII), con la condición de que R^{24} y R^{25} no son ambos H;

R^{26} es H o C_1-C_4 alquilo; y

cada n20 es independientemente entre 2 y 26,

con la condición de que por lo menos un R^{α} o R^N es -R^{22}-$NR^{24}R^{25}$; o

(f) ~R^{20}-R^{21}-[C(R^{α})H-C(O)-N(R^{N})-]$_{n20}$-R^{22}-N-(R^{23}-$NR^{24}R^{25}$)$_2$ (XXV)

o un estereoisómero o sal de la misma, donde:

R^{20} es un grupo de unión al sitio R^b, o al grupo enzimáticamente escindible;

R^{21} y R^{22} son independientemente entre sí un enlace, C_1-C_3 alquileno, o -C_1-C_3alquileno-[O-CH_2-CH_2-]$_{n20}$;

cada R^{α} es independientemente H o -R^{22}-$NR^{24}R^{25}$;

cada R^N es independientemente H o C_1-C_6 alquilo;

cada R^{23} es independientemente C_1-C_6 alquileno;

R^{24} y R^{25} se seleccionan independientemente en cada caso entre H; grupo polihidroxilo; grupo polihidroxilo sustituido; grupo -C(O)-polihidroxilo; grupo -C(O)-polihidroxilo sustituido; C_1-C_8 alquilo sustituido; -C(O)-C_1-C_8 alquilo sustituido; un quelante; y -C(O)-R^{28}, donde R^{28} es una unidad sacárido de fórmula (XII) o (XIII), con la condición de que R^{24} y R^{25} no son ambos H; y

cada n20 es independientemente entre 2 y 26.

8. El compuesto conector de la reivindicación 7, donde R^{24} y R^{25} se seleccionan independientemente en cada caso entre H y un grupo polihidroxilo, con la condición de que R^{24} y R^{25} no son ambos H.

9. El compuesto conector de la reivindicación 7 u 8, donde el grupo polihidroxilo es un monosacárido lineal, opcionalmente seleccionado entre un sacárido C6 o C5, un sacárido ácido, y un sacárido amino.

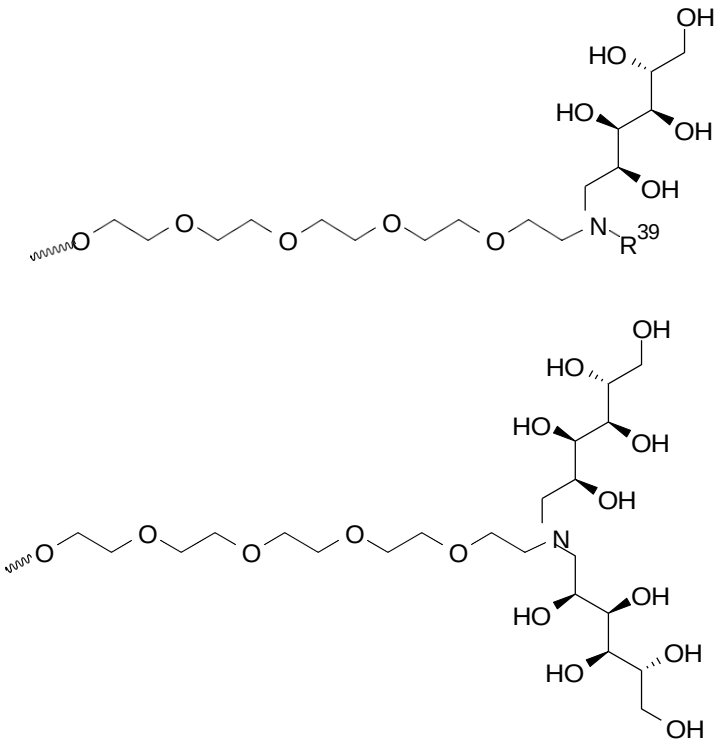
10. El compuesto conector de la reivindicación 9, donde:

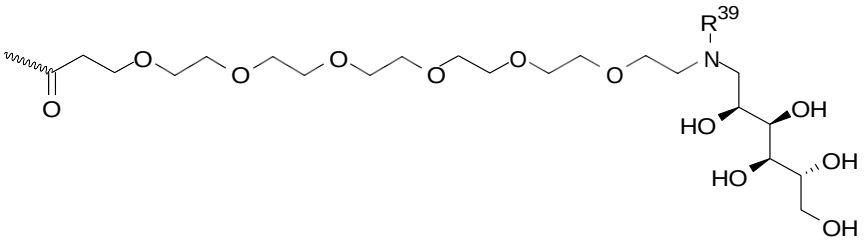
el sacárido C6 o C5 se selecciona entre glucosa, ribosa, galactosa, manosa, arabinosa, 2-desoxiglucosa, gliceraldehído, eritrosa, treosa, xilosa, lixosa, alosa, altrosa, gulosa, idosa, talosa, aldosa, y cetosa;

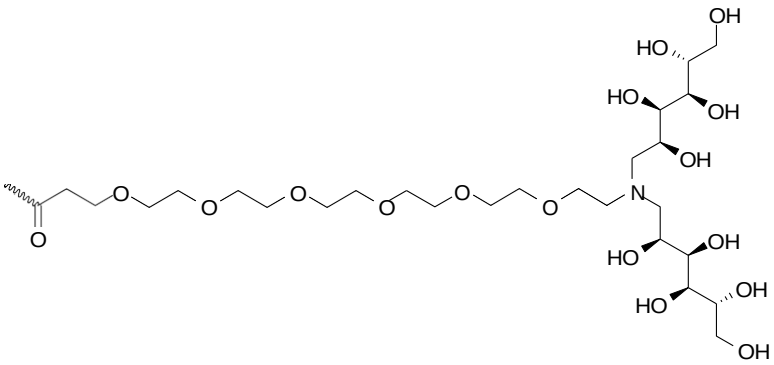
el sacárido ácido se selecciona entre ácido glucónico, ácido aldónico, ácido urónico, y ácido ulosónico; o

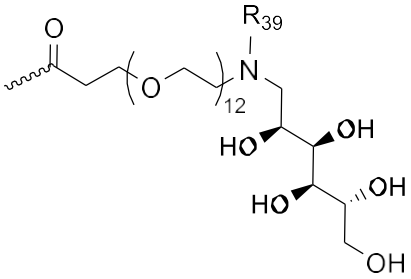
el sacárido amino se selecciona entre glucosamina, N-acetilglucosamina, galactosamina, y N-acetilgalactosamina.

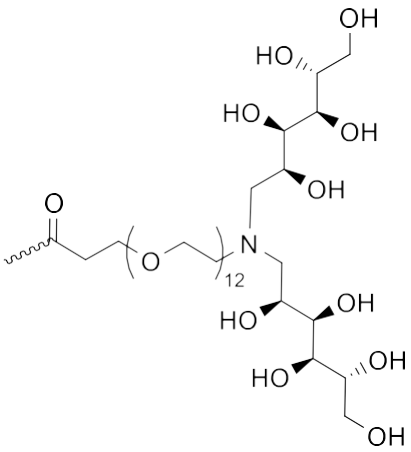
11. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones entre 7 y 10, que comprende un grupo polar seleccionado entre los siguientes, o un estereoisómero o sal de los mismos:

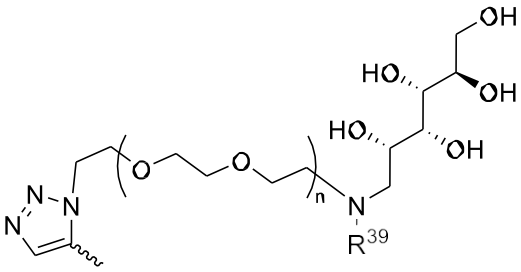


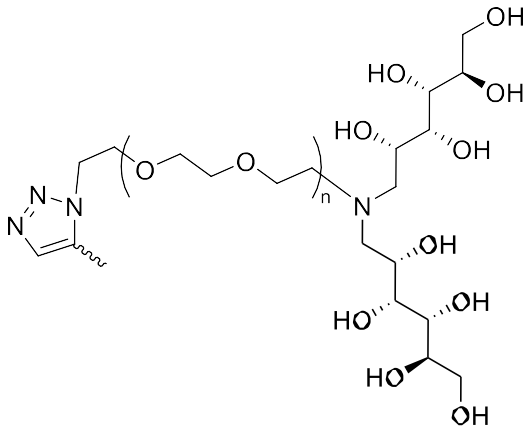


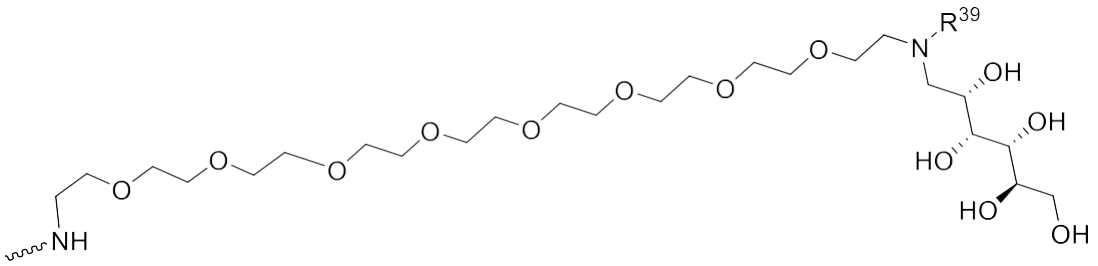


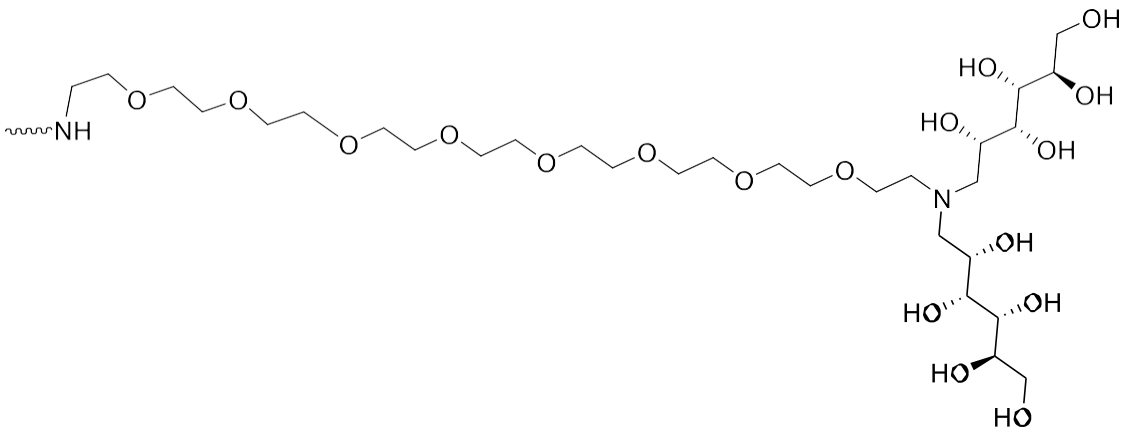


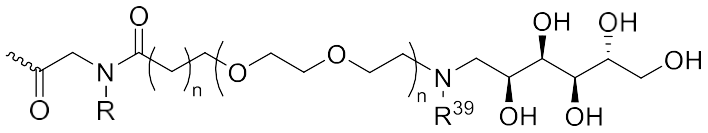


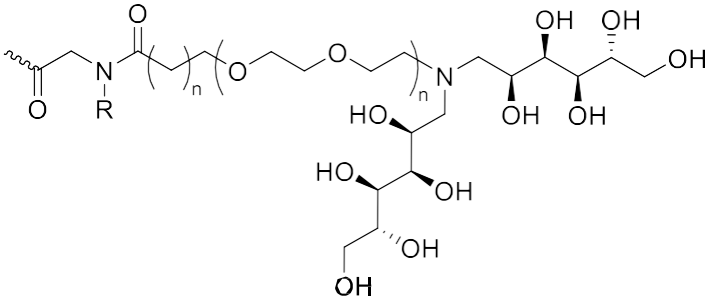


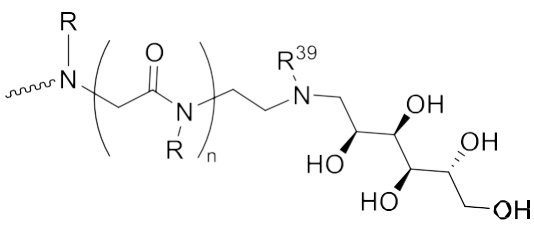


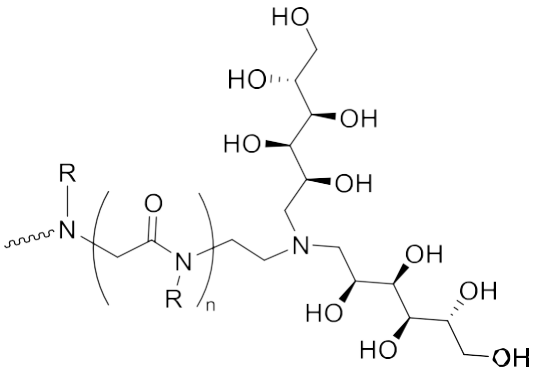


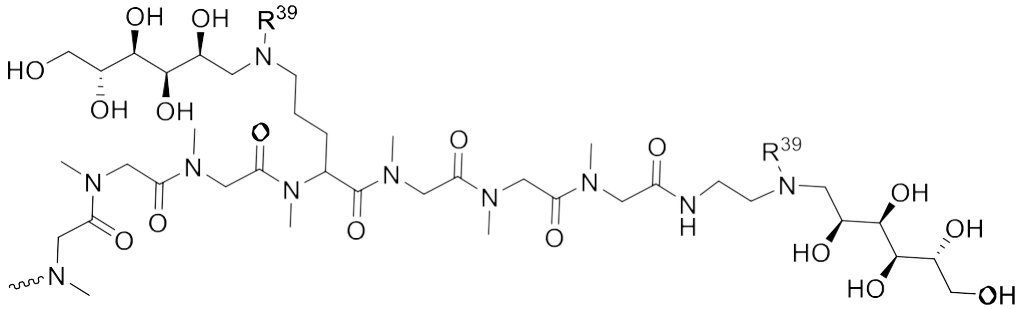


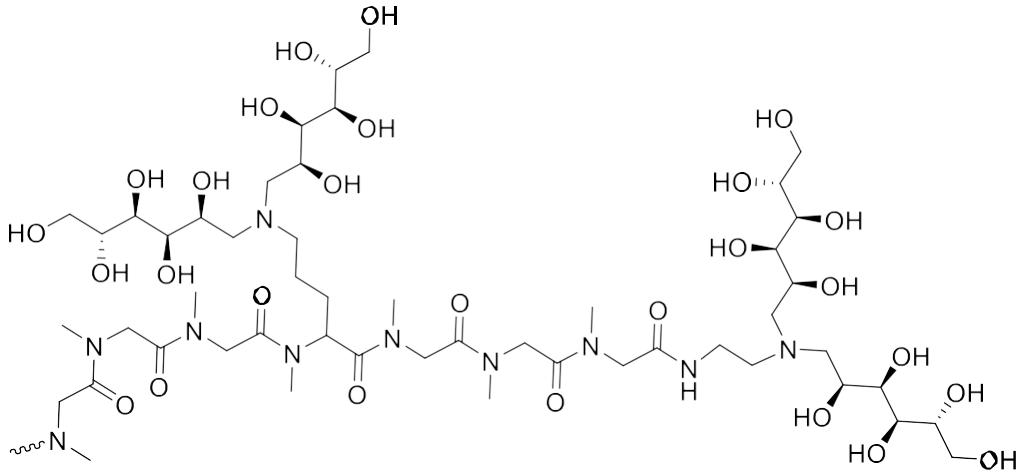


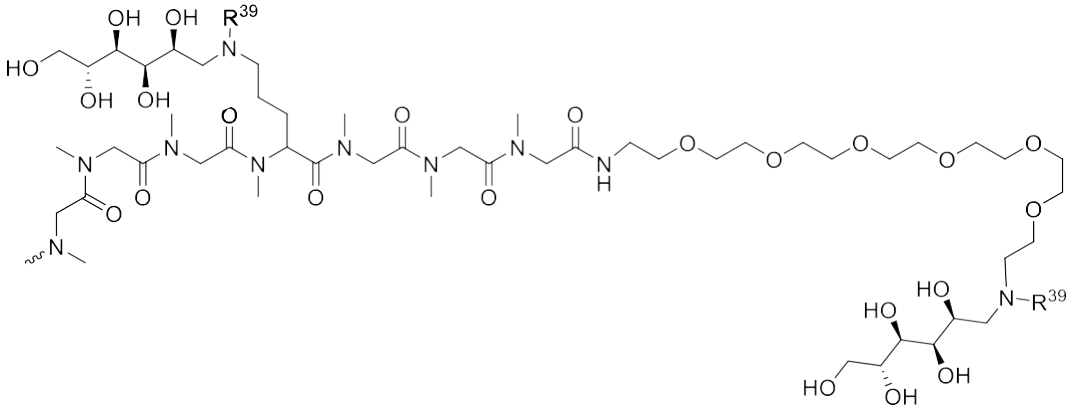


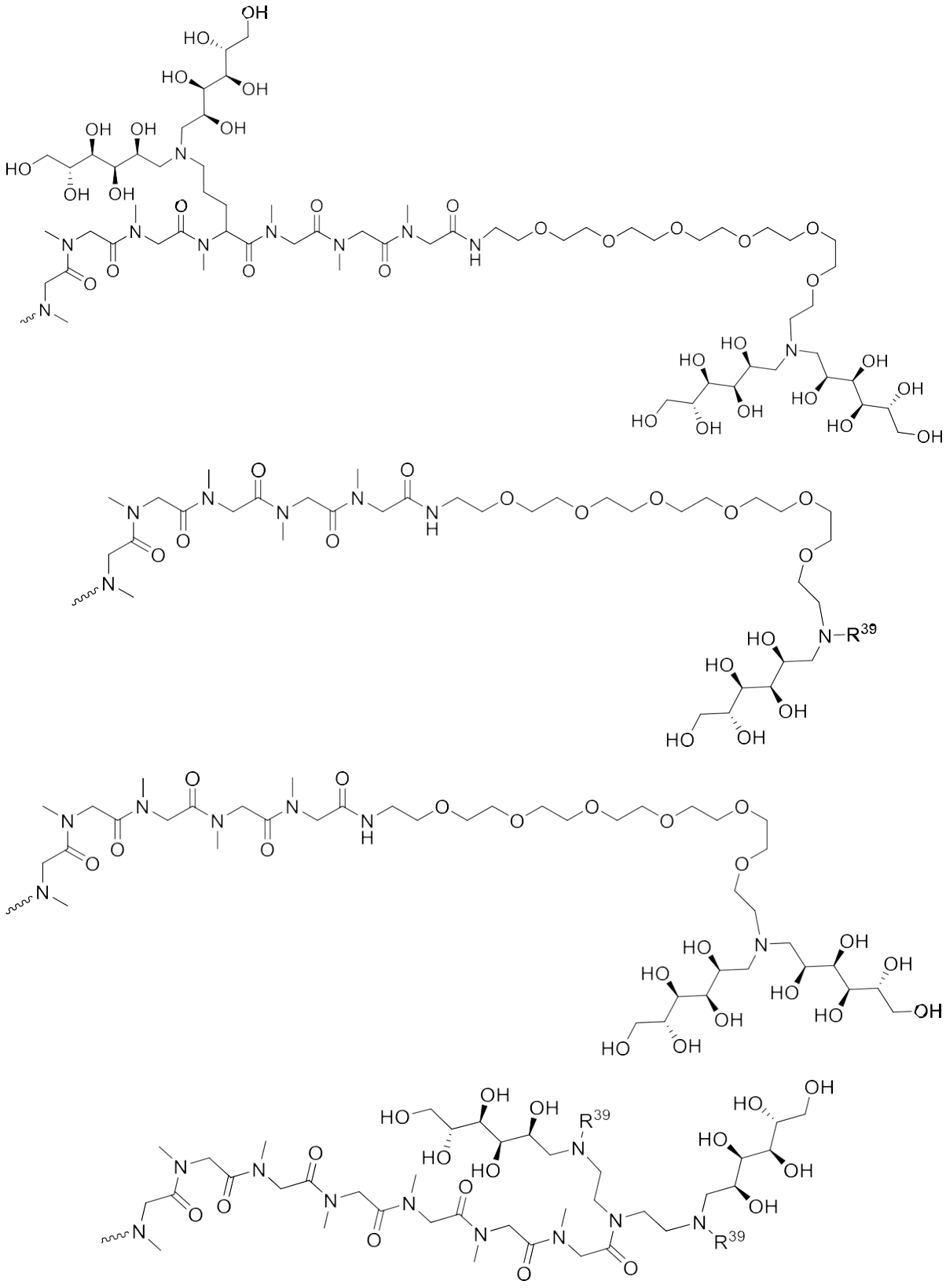


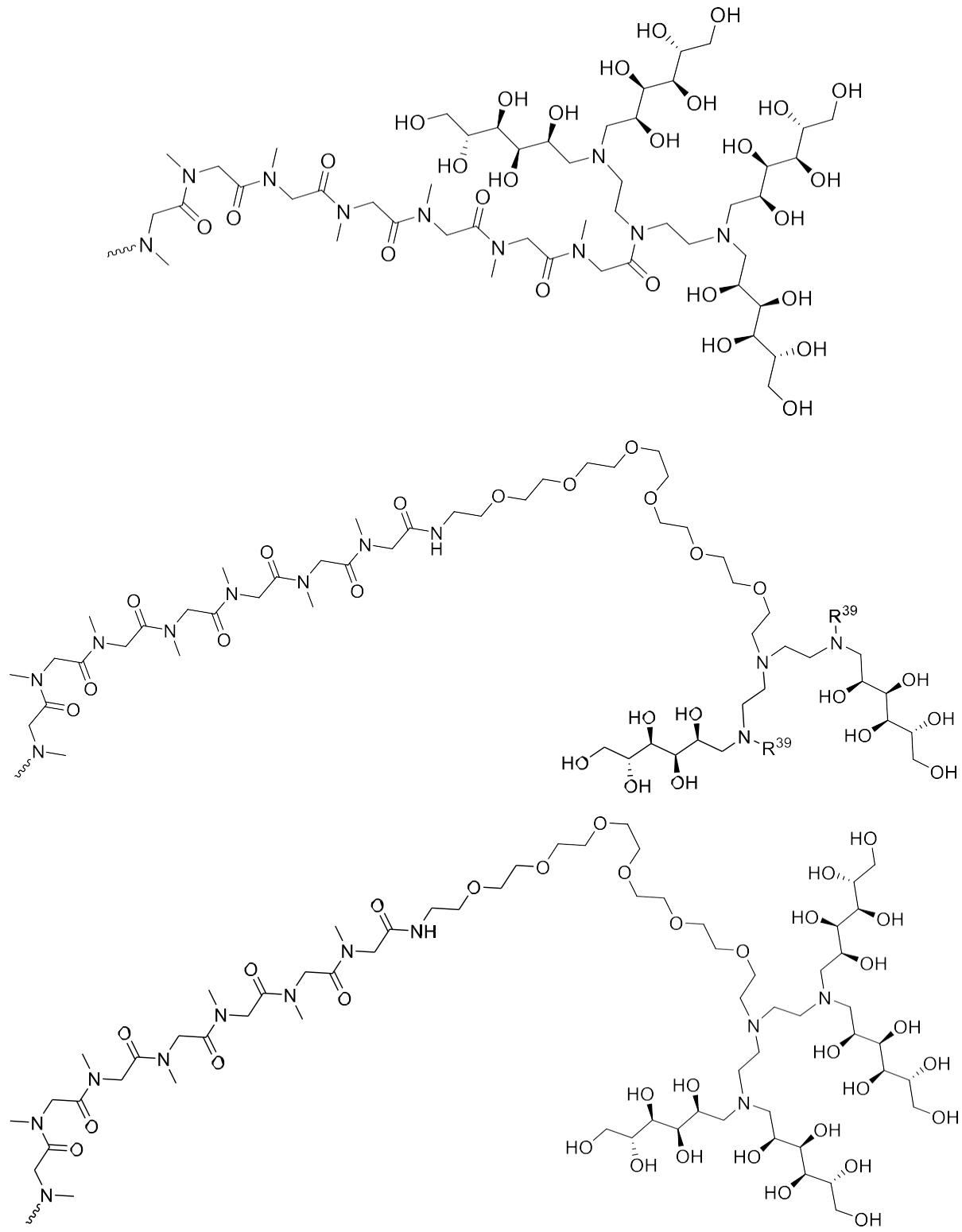


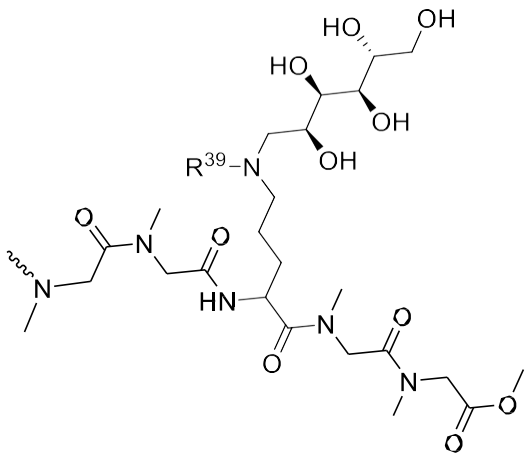


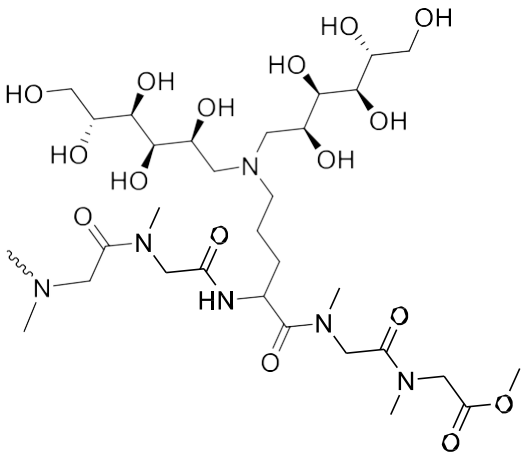


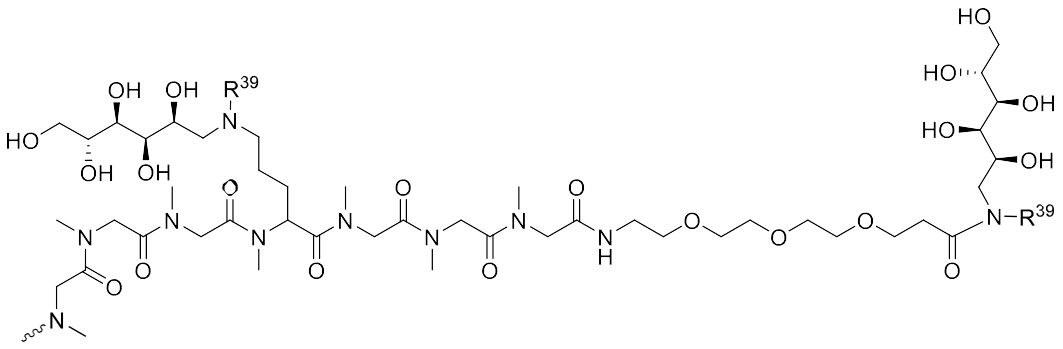


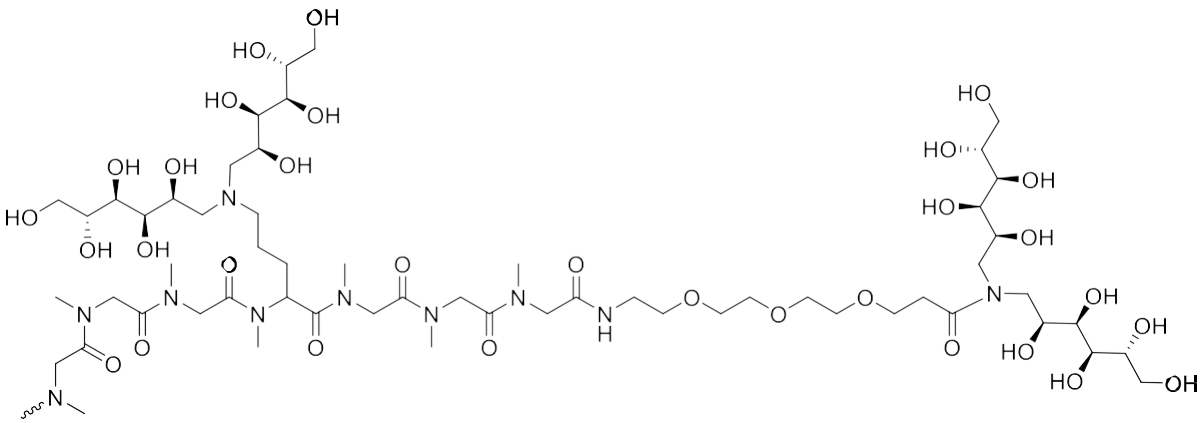


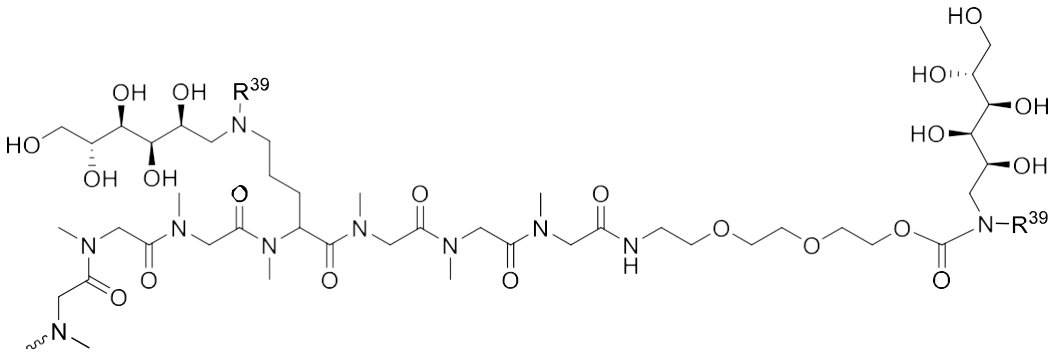


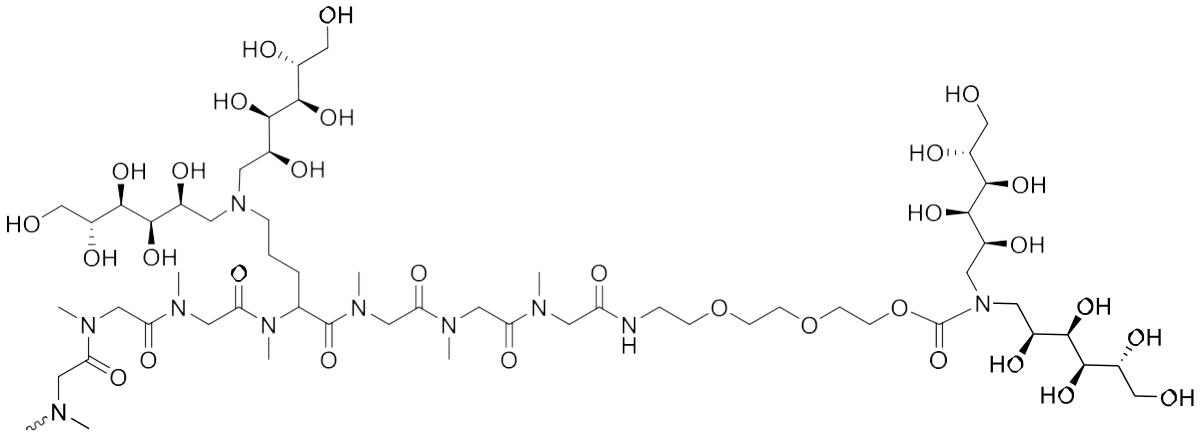


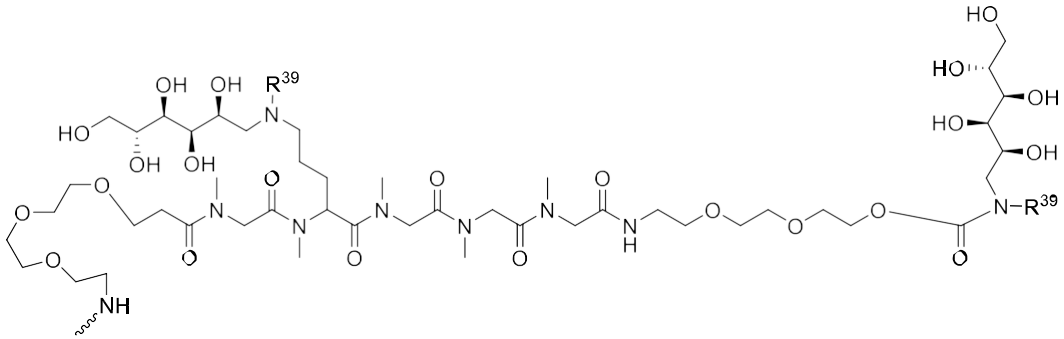


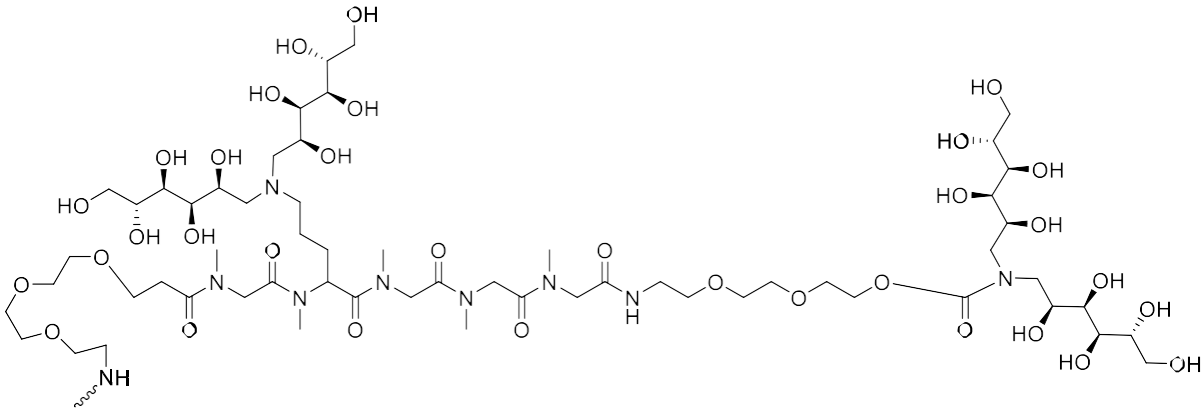


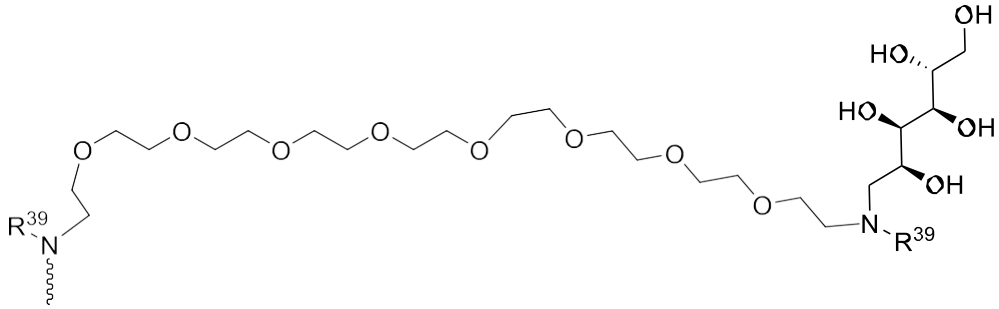


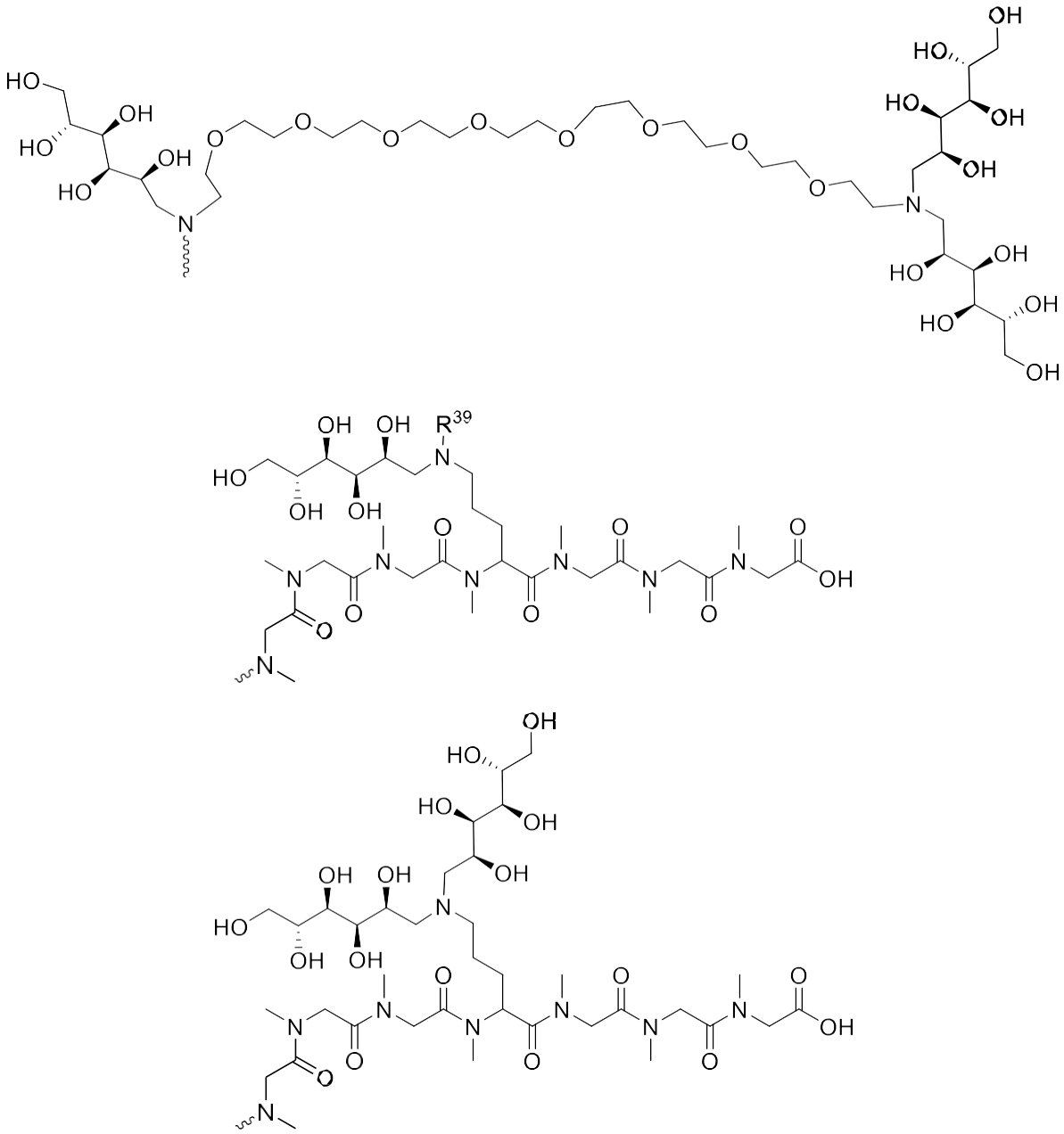








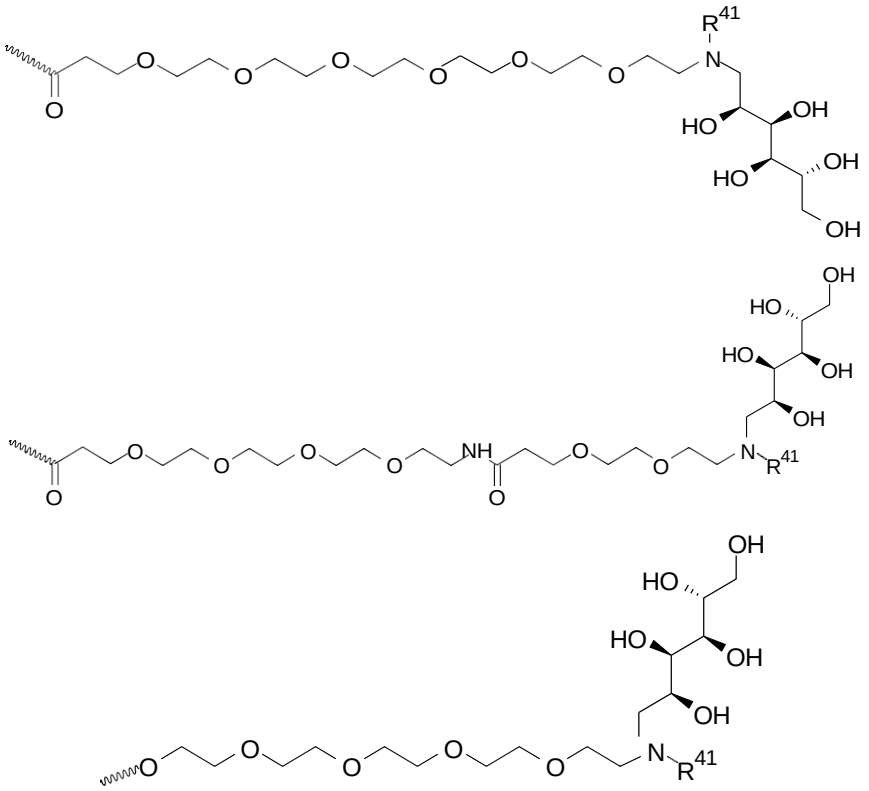




donde cada R es independientemente H o alquilo; cada R^{39} se selecciona independientemente entre H, un monosacárido lineal y polietilenglicol, que tiene opcionalmente entre 1 y 24 subunidades etilenglicol; cada n es independientemente 1-12; y la línea ondulada es un sitio de unión a R^b, o al grupo enzimáticamente escindible.

12. El compuesto conector de la reivindicación 7 u 8, donde uno de R^{24} y R^{25} es un monosacárido lineal y el otro es un monosacárido cíclico.

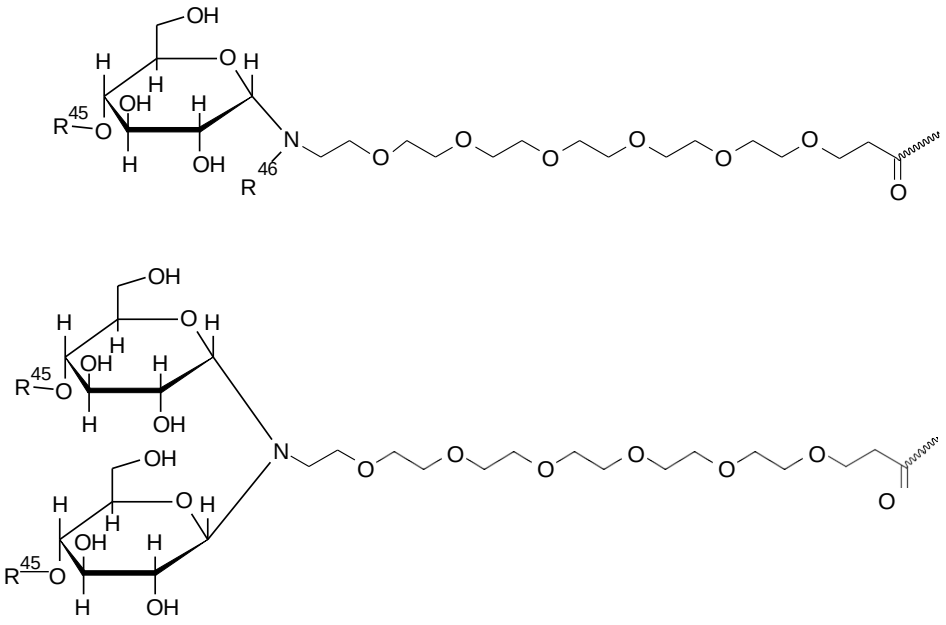
13. El compuesto conector de la reivindicación 12, que comprende un grupo polar seleccionado entre los siguientes, o un estereoisómero o sal de los mismos:

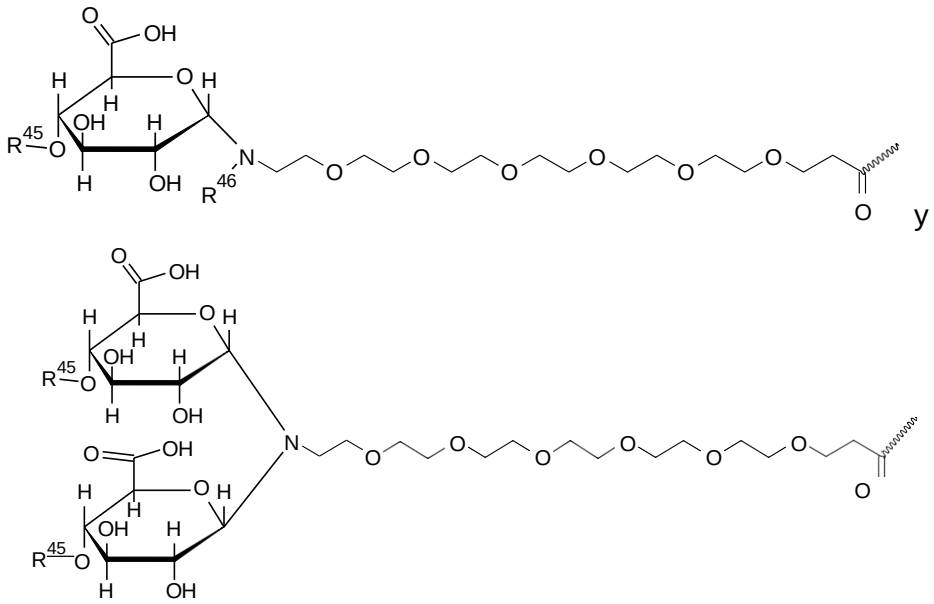


donde R^{41} es un monosacárido cíclico; y la línea ondulada es un sitio de unión a R^b, o al grupo enzimáticamente escindible.

14. El compuesto conector de la reivindicación 7, donde R^{24} y R^{25} son independientemente un polihidroxilo seleccionado entre un monosacárido cíclico, disacárido, y polisacárido.

15. El compuesto conector de la reivindicación 14, que comprende un grupo polar seleccionado entre los siguientes, o un estereoisómero o sal de los mismos:

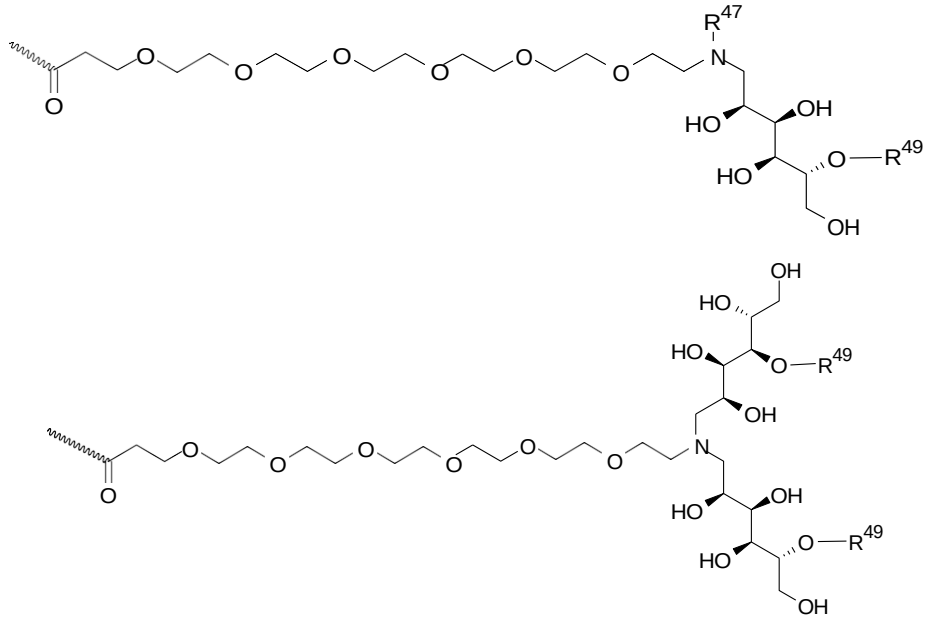


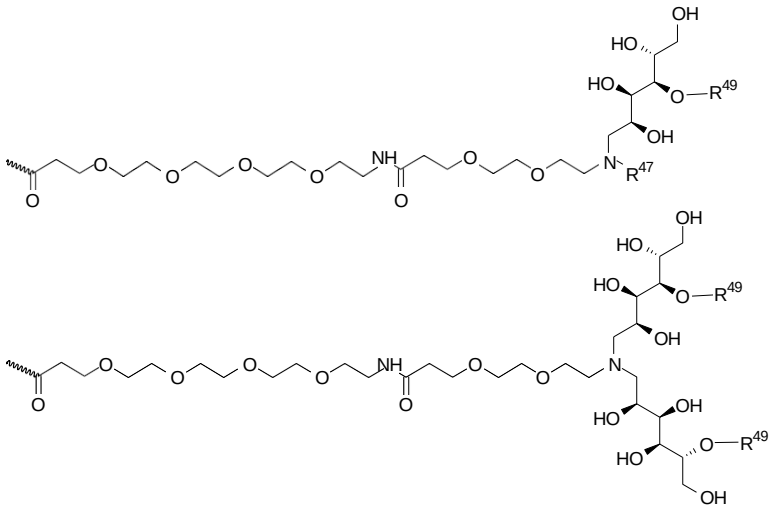


donde cada R^{45} se selecciona entre H y un monosacárido, un disacárido, o un polisacárido; y R^{46} se selecciona entre un monosacárido, disacárido, o polisacárido cíclico; y la línea ondulada es un sitio de unión a R^b, o al grupo enzimáticamente escindible.

16. El compuesto conector de la reivindicación 7, donde R^{24} y R^{25} se seleccionan independientemente entre un monosacárido lineal y un monosacárido lineal sustituido, donde el monosacárido lineal sustituido está sustituido con un monosacárido, un disacárido, o un polisacárido.

17. El compuesto conector de la reivindicación 16, que comprende un grupo polar seleccionado entre los siguientes, o un estereoisómero o sal de los mismos:

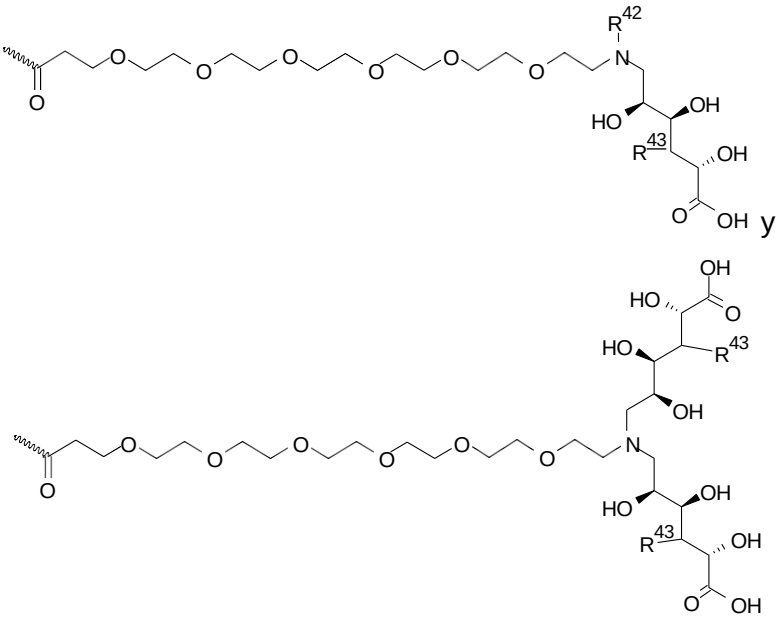




donde R^{47} es un monosacárido lineal; y cada R^{49} se selecciona entre un monosacárido, un disacárido, y un polisacárido; y la línea ondulada es un sitio de unión a R^b, o al grupo enzimáticamente escindible.

18. El compuesto conector de la reivindicación 7, donde R^{24} y R^{25} se seleccionan independientemente entre un monosacárido lineal y un monosacárido sustituido, donde el monosacárido lineal sustituido está sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados entre carboxilo, éster, y amida, y opcionalmente también está sustituido con un monosacárido, disacárido, o un polisacárido.

19. El compuesto conector de la reivindicación 18, que comprende un grupo polar seleccionado entre los siguientes, o un estereoisómero o sal de los mismos:

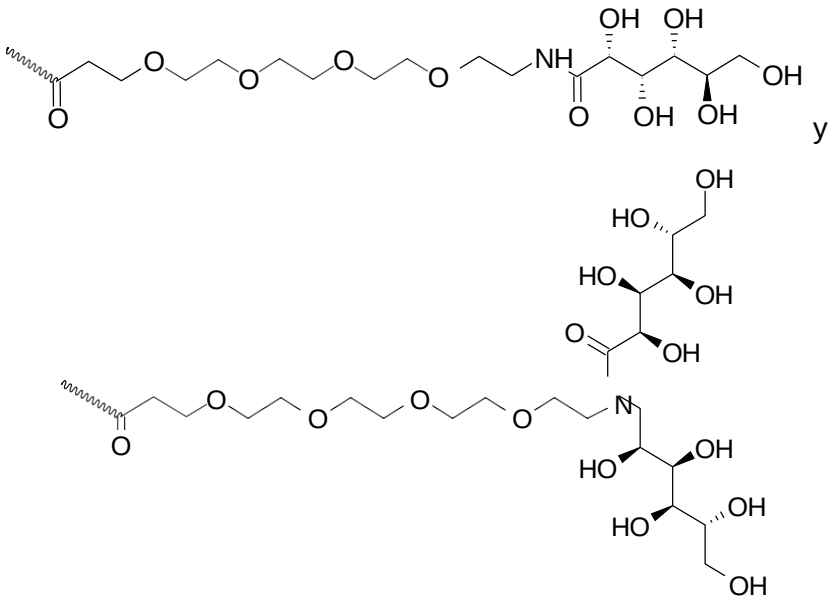


donde cada R^{42} se selecciona independientemente entre un monosacárido lineal y un monosacárido lineal sustituido; cada R^{43} se selecciona independientemente entre hidroxilo, carboxilo, éster, y amida; y la línea ondulada es un sitio de unión a R^b, o al grupo

enzimáticamente escindible.

20. El compuesto conector de la reivindicación 7, donde uno de R^{24} y R^{25} es un grupo -C(O)-polihidroxilo o grupo -C(O)-polihidroxilo sustituido, y el otro de R^{24} y R^{25} es un H, grupo -C(O)-polihidroxilo, grupo -C(O)-polihidroxilo sustituido, grupo polihidroxilo o grupo polihidroxilo sustituido; donde el grupo -C(O)-polihidroxilo sustituido y el grupo polihidroxilo están sustituidos con un monosacárido, un disacárido, un polisacárido, carboxilo, éster, o amida.

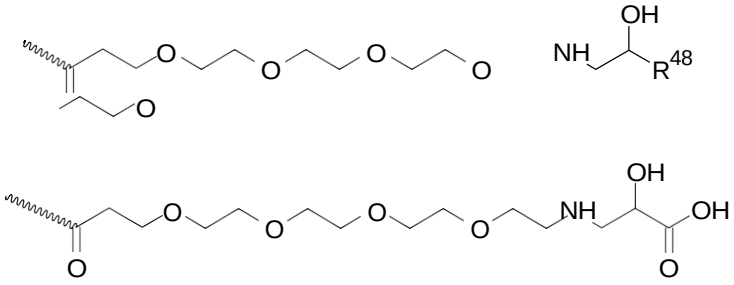
21. El compuesto conector de la reivindicación 18 o 20, que comprende un grupo polar seleccionado entre los siguientes, o un estereoisómero o sal de los mismos:

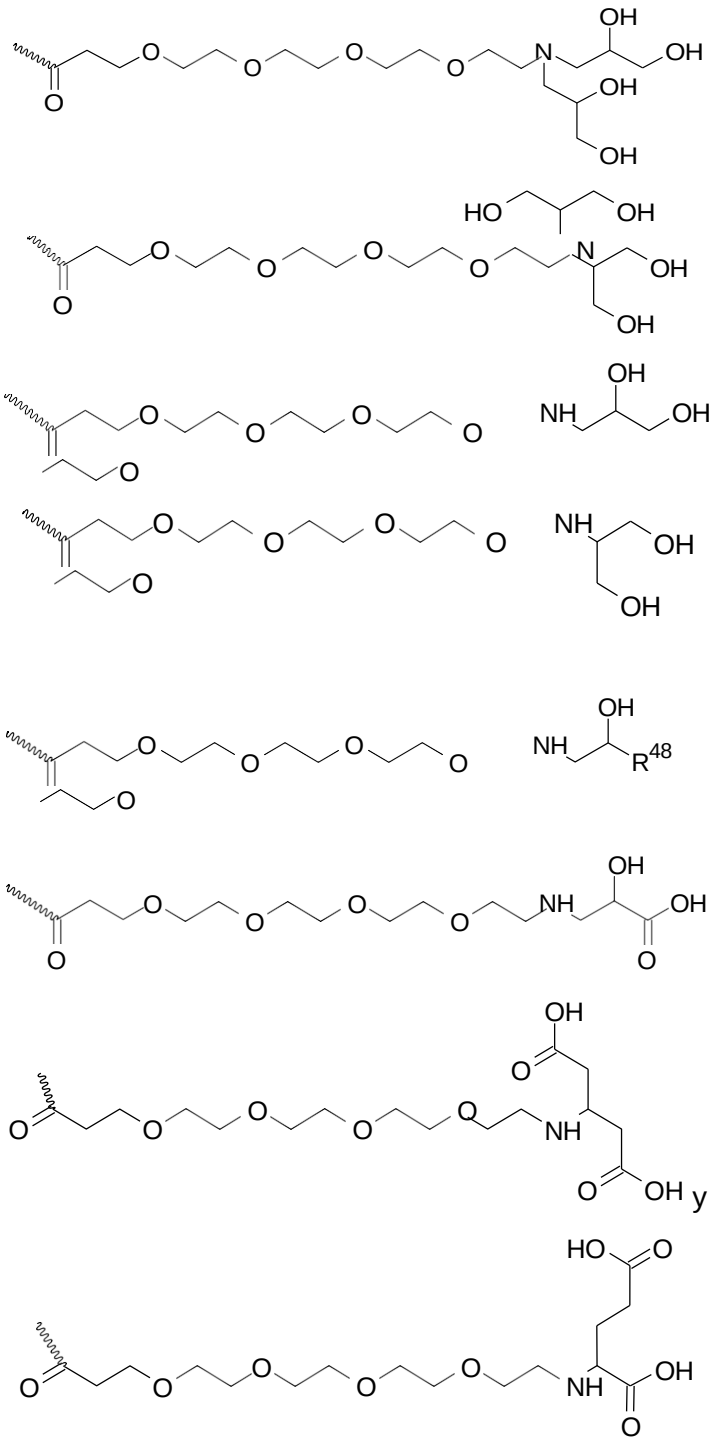


donde la línea ondulada es un sitio de unión a R^b, o al grupo enzimáticamente escindible.

22. El compuesto conector de la reivindicación 7, donde R^{24} y R^{25} son independientemente H o -C_1-C_8 alquilo sustituido, con la condición de que R^{24} y R^{25} no son ambos H; donde -C_1-C_8 alquilo sustituido está sustituido con hidroxilo y/o carboxilo.

23. El compuesto conector de la reivindicación 22, que comprende un grupo polar seleccionado entre los siguientes, o un estereoisómero o sal de los mismos:



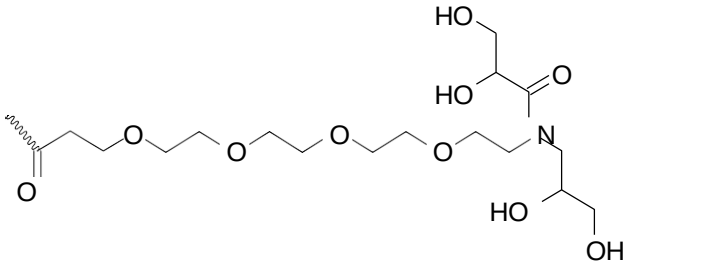


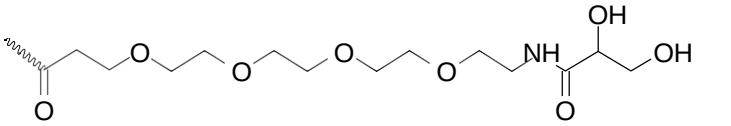
donde R^{48} se selecciona entre H, OH, CH_2OH, COOH, o -C_1-C_6 alquilo sustituido con hidroxilo o carboxilo; y la línea ondulada es un sitio de unión a R^b, o al grupo enzimáticamente escindible .

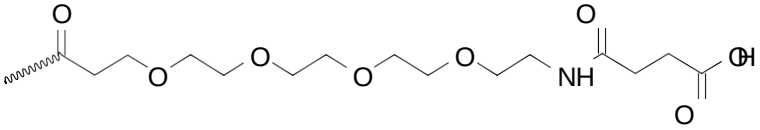
24. El compuesto conector de la reivindicación 7, donde uno de R^{24} y R^{25} es H o -C(O)-C_1-C_8 alquilo sustituido, y el otro de R^{24} y R^{25} es -C(O)-C_1-C_8 alquilo sustituido, o -C_1-C_8 alquilo sustituido, , donde -C(O)-C_1-C_8 alquilo sustituido y -C_1-C_8 alquilo sustituido, están sustituidos con hidroxilo y/o carboxilo.

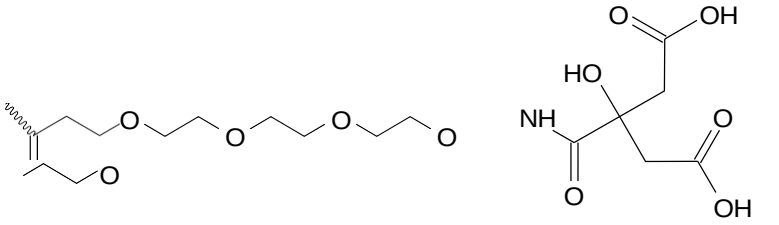
25. El compuesto conector de la reivindicación 24, que comprende un grupo polar

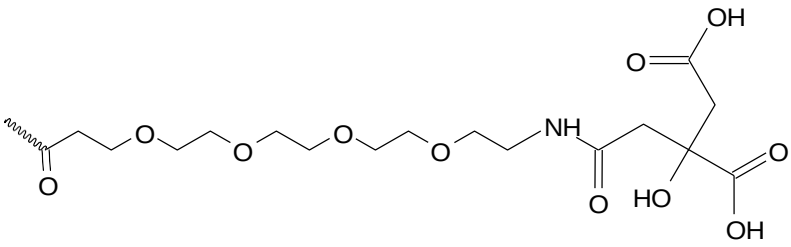
seleccionado entre los siguientes, o un estereoisómero o sal de los mismos:

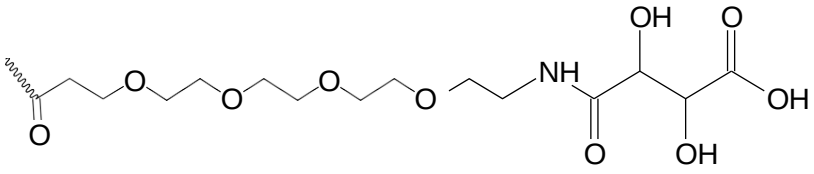


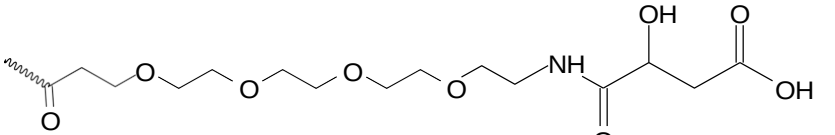


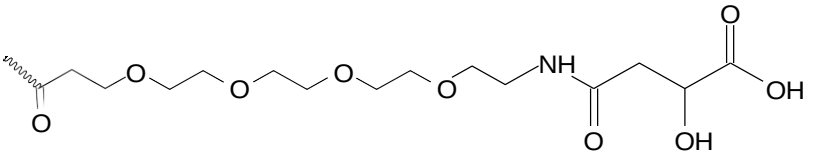




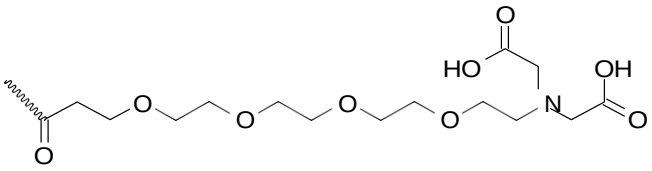








y

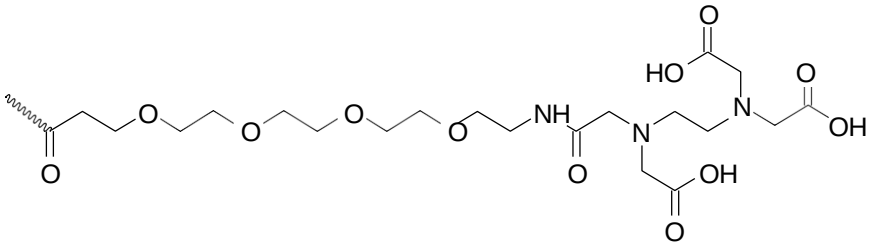


donde la línea ondulada es un sitio de unión a R^b, o al grupo enzimáticamente escindible.

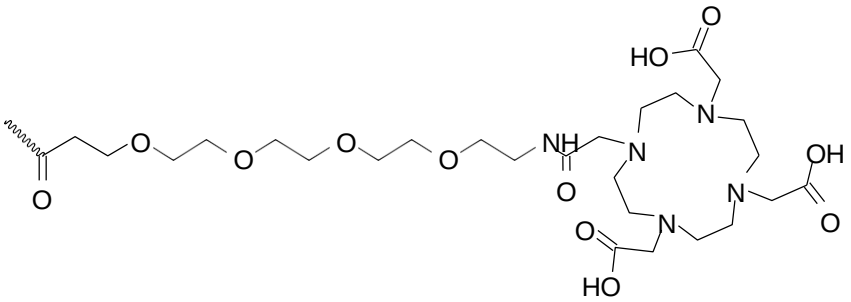
26. El compuesto conector de la reivindicación 7, donde R^{24} y R^{25} se seleccionan independientemente entre H y un quelante, donde el quelante opcionalmente está unido al nitrógeno de $-NR^{24}R^{25}$ por medio de un alquileno, arileno, carbociclo, heteroarileno, o heterocarbocilo; con la condición de que R^{24} y R^{25} no son ambos H.

27. El compuesto conector de la reivindicación 26, donde el quelante se selecciona entre ácido etilendiaminotetraacético (EDTA), ácido dietilentriaminopentaacético (DTPA), ácido trietilentetraminohexaacético (TTHA), bencil-DTPA, ácido 1,4,7,10-tetraazaciclododecano-N,N',N'',N'''-tetraacético (DOTA), bencil-DOTA, ácido 1,4,7-triazaciclononano-N,N',N''-triacético (NOTA), bencil-NOTA, ácido 1,4,8,11-tetraazaciclotetradecano-1,4,8,11-tetraacético (TETA) y N,N'-alquilo disustituido-piperazina.

28. El compuesto conector de la reivindicación 27, que comprende un grupo polar seleccionado entre los siguientes, o un estereoisómero o sal de los mismos:



y



donde la línea ondulada es un sitio de unión a R^b, o al grupo enzimáticamente escindible .

29. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 6 a 20, donde cada monosacárido se selecciona independientemente entre:

un sacárido C5 o C6 seleccionado entre glucosa, ribosa, galactosa, manosa, arabinosa, 2-desoxiglucosa, gliceraldehído, eritrosa, treosa, xilosa, lixosa, alosa, altrosa, gulosa, idosa, talosa, aldosa, y cetosa;

un sacárido ácido seleccionado entre ácido glucónico, ácido aldónico, ácido urónico y ácido ulosónico; o

un sacárido amino seleccionado entre glucosamina, N-acetilglucosamina, galactosamina, y N-acetilgalactosamina.

30. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 29, donde el sitio de unión β está formado por un grupo funcional de un compuesto precursor del grupo polar, donde dicho grupo funcional se selecciona entre halo, aldehído, carboxilo, amino, alquinilo, azido, hidroxilo, carbonilo, carbamato, tiol, urea, tiocarbamato, tiourea, sulfonamida, acilsulfonamida, alquilsulfonato, triazol, azadibenzociclooctino, hidrazina, carbonilalquilheteroarilo, y formas protegidas de los mismos.

31. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, que comprende un grupo polar que tiene una fórmula seleccionada entre las siguientes:

(a) $\sim R^{20}\text{-}R^{21}\text{-}[O\text{-}CH_2\text{-}CH_2]_{n20}\text{-}R^{22}\text{-}R^{30}$ (XXX)

o un estereoisómero o sal de la misma, donde:

R^{20} es un grupo de unión al sitio R^b, o al grupo enzimáticamente escindible;

R^{21} y R^{22} son independientemente entre sí un enlace o grupo C_1-C_3 alquileno;

R^{30} se selecciona entre un C_3-C_{10} carbociclo opcionalmente sustituido; tiourea; tiourea opcionalmente sustituida; urea; urea opcionalmente sustituida; sulfamida; alquilsulfamida; acilsulfamida, alquilsulfamida opcionalmente sustituida; acilsulfamida opcionalmente sustituida; sulfonamida; sulfonamida opcionalmente sustituida; guanidina, incluyendo alquilguanidina y arilguanidina; fosforamida; o fosforamida opcionalmente sustituida; o R^{30} se selecciona entre azido, alquinilo, alquinilo sustituido, -NH-C(O)-alquinilo, -NH-C(O)-alquinil-R^{65}; ciclooctino; -NH-ciclooctino, -NH-C(O)-ciclooctino, o -NH-$(ciclooctino)_2$; donde R^{65} se selecciona entre alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, alquinilo opcionalmente sustituido, carbociclo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heterocarbociclo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido; y

n20 es entre 2 y 26;

(b) $\sim R^{20}\text{-}R^{21}\text{-}[O\text{-}CH_2\text{-}CH_2]_{n20}\text{-}R^{22}\text{-}NH\text{-}C(O)\text{-}R^{31}$ (XXXI)

o un estereoisómero o sal de la misma, donde:

R^{20} es un grupo de unión al sitio R^b, o al grupo enzimáticamente escindible;

R^{21} y R^{22} son independientemente entre sí un enlace o grupo C_1-C_3 alquileno;

R^{31} es una cadena polietilenglicol ramificada, donde cada ramificación tiene entre 1 y 26 subunidades etilenglicol y donde cada ramificación tiene un R^{35} en su

extremo;

R^{35} es azido, alquinilo, alquinil-R^{65}, ciclooctino o ciclooctino-R^{65}, donde R^{65} se selecciona entre alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, alquinilo opcionalmente sustituido, carbociclo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heterocarbociclo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido; y

n20 es entre 2 y 26;

(c) $\sim R^{20}\text{-}R^{21}\text{-}[O\text{-}CH_2\text{-}CH_2]_{n20}\text{-}R^{22}\text{-}C(O)NH\text{-}R^{31}$ (XXXII)

o un estereoisómero o sal de la misma, donde:

R^{20} es un grupo de unión al sitio R^b, o al grupo enzimáticamente escindible;

R^{21} y R^{22} son independientemente entre sí un enlace o grupo C_1-C_3 alquileno;

R^{31} es una cadena polietilenglicol ramificada, donde independientemente cada ramificación tiene entre 1 y 26 subunidades etilenglicol y donde cada ramificación tiene un R^{35} en su extremo;

R^{35} es azido, alquinilo, alquinil-R^{65}, ciclooctino o ciclooctino-R^{65}, donde R^{65} se selecciona entre alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, alquinilo opcionalmente sustituido, carbociclo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heterocarbociclo opcionalmente sustituido y heteroarilo opcionalmente sustituido; y

n20 es entre 2 y 26;

(d) $\sim R^{20}\text{-}R^{21}\text{-}[O\text{-}CH_2\text{-}CH_2]_{n20}\text{-}R^{22}\text{-}C(O)NR^{31}\text{-}R^{22}\text{-}NR^{24}R^{25}$ (XXXIII)

o un estereoisómero o sal de la misma, donde:

R^{20} es un grupo de unión al sitio R^b, o al grupo enzimáticamente escindible;

R^{31} es H o R^{22}-$NR^{24}R^{25}$;

R^{21} y R^{22} son independientemente entre sí un enlace o grupo C_1-C_3 alquileno;

R^{24} y R^{25} se seleccionan independientemente en cada caso entre H; grupo polihidroxilo; grupo polihidroxilo sustituido; grupo -C(O)-polihidroxilo; grupo -C(O)-polihidroxilo sustituido, con la condición de que R^{24} y R^{25} no son ambos H; y

n20 es entre 2 y 26;

(e) $\sim R^{20}\text{-}R^{21}\text{-}[O\text{-}CH_2\text{-}CH_2]_{n20}\text{-}R^{22}\text{-}N(R^{33}\text{-}R^{31})_2$ (XXXIV)

o un estereoisómero o sal de la misma, donde:

R^{20} es un grupo de unión al sitio R^b, o al grupo enzimáticamente escindible;

R^{21} y R^{22} son independientemente entre sí un enlace o grupo C_1-C_3 alquileno;

R^{31} es una cadena polietilenglicol ramificada, donde cada ramificación tiene entre 1

y 26 subunidades etilenglicol y donde cada ramificación tiene un R^{35} en su extremo;

R^{33} es C_1-C_3 alquileno, C_1-C_3 alquileno-C(O), -C(O)-C_1-C_3 alquileno, o -C(O)-C_1-C_3 alquileno-C(O);

R^{35} es azido, alquinilo, alquinil-R^{65}, ciclooctino o ciclooctino-R^{65}, donde R^{65} se selecciona entre alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, alquinilo opcionalmente sustituido, carbociclo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heterocarbociclo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido; y

n20 es entre 2 y 26;

(f) $\sim R^{20}\text{-}(R^{21}\text{-}[CH_2\text{-}CH(OR^{34})\text{-}CH_2\text{-}O]_{n20}\text{-}R^{36})_{n25}$ (XXXV)

o un estereoisómero o sal de la misma, donde:

R^{20} es un grupo de unión al sitio R^b, o al grupo enzimáticamente escindible;

cada R^{21} es independientemente un enlace, -O- o grupo C_1-C_3 alquileno;

cada R^{34} es independientemente H, -$[CH_2$-CH(OH)-CH_2-$O]_{n20}$-R^{36}, -C(O)-$NR^{24}R^{25}$ o -C(O)N(R^N)-C_1-C_6alquileno-$NR^{24}R^{25}$;

R^N es H o C_1-C_4alquilo;

R^{24} y R^{25} se seleccionan independientemente en cada caso entre H; grupo polihidroxilo; o grupo polihidroxilo sustituido, con la condición de que R^{24} y R^{25} no son ambos H;

cada R^{36} es independientemente H, C_1-C_6alquileno-C(OH)H-$NR^{44}R^{45}$, C_1-C_6alquileno-C(OH)H-C_1-C_6alquileno-$NR^{44}R^{45}$, -C(O)-$NR^{24}R^{25}$, -C(O)N(R^N)-C_1-C_6alquileno-$NR^{24}R^{25}$, C_1-C_6alquileno-C(O)$NR^{24}R^{25}$ o C_1-C_6alquileno-CO_2R^{37};

cada R^{37} es independientemente H o C_1-C_6 alquilo;

R^{44} y R^{45} se seleccionan independientemente en cada caso entre H; grupo polihidroxilo; grupo polihidroxilo sustituido; grupo -C(O)-polihidroxilo; y grupo -C(O)-polihidroxilo sustituido, con la condición de que R^{44} y R^{45} no son ambos H;

cada n20 es independientemente entre 1 y 26; y

n25 es 1 o 2;

(g) $\sim R^{20}\text{-}R^{21}\text{-}[[CH_2\text{-}CH_2\text{-}O]_{n20}\text{-}R^{22}\text{-}[CH_2\text{-}[CH(OH)]_{n23}\text{-}CH_2\text{-}O]_{n21}]_{n22}\text{-}R^{23}\text{-}NR^{24}\text{-}R^{25}$ (XXXVI)

o un estereoisómero o sal de la misma, donde:

R^{20} es un grupo de unión al sitio R^b, o al grupo enzimáticamente escindible;

R^{21}, R^{22} y R^{23} son independientemente entre sí un enlace o grupo C_1-C_3 alquileno;

R^{24} y R^{25} se seleccionan independientemente en cada caso entre H; grupo polihidroxilo; grupo polihidroxilo sustituido; grupo -C(O)-polihidroxilo; y grupo -

C(O)-polihidroxilo sustituido, con la condición de que R^{24} y R^{25} no son ambos H;

cada n20 es independientemente entre 0 y 26, y cada n21 es independientemente entre 0 y 26, con la condición de que por lo menos uno de n20 o n21 es entre 2 y 26;

n22 es entre 1 y 5;

cada n23 es independientemente 1 o 2;

(h) $\sim R^{20}\text{-}(R^{21}\text{-}[O\text{-}CH_2\text{-}CH_2]_{n20}\text{-}R^{22}\text{-}N(R^N)\text{-}CO_2\text{-}[CH_2\text{-}CH(OR^{34})\text{-}CH_2\text{-}O]_{n21}\text{-}R^{36})_{n25}$ (XXXVII)

o un estereoisómero o sal de la misma, donde:

R^{20} es un grupo de unión al sitio R^b, o al grupo enzimáticamente escindible;

R^{21} y R^{22} son independientemente entre sí un enlace o grupo C_1-C_3 alquileno;

R^N es H o C_1-C_4alquilo;

R^{24} y R^{25} se seleccionan independientemente en cada caso entre H; grupo polihidroxilo; y grupo polihidroxilo sustituido, con la condición de que R^{24} y R^{25} no son ambos H;

cada R^{34} es independientemente H, $\text{-}[CH_2\text{-}CH(OH)\text{-}CH_2\text{-}O]_{n20}\text{-}R^{36}$ o $\text{-}C(O)N(R^N)\text{-}C_1\text{-}C_6$alquileno-$NR^{24}R^{25}$;

cada R^{36} es independientemente H, C_1-C_6alquileno-$C(OH)H\text{-}NR^{44}R^{45}$, C_1-C_6alquileno-$C(OH)H\text{-}C_1\text{-}C_6$alquileno-$NR^{44}R^{45}$, $\text{-}C(O)N(R^N)\text{-}C_1\text{-}C_6$alquileno-$NR^{24}R^{25}$, C_1-C_6alquileno-$C(O)NR^{24}R^{25}$ o C_1-C_6alquileno-CO_2R^{37};

cada R^{37} es independientemente H o C_1-C_6 alquilo;

R^{44} y R^{45} se seleccionan independientemente en cada caso entre H; grupo polihidroxilo; grupo polihidroxilo sustituido; grupo -C(O)-polihidroxilo; y grupo -C(O)-polihidroxilo sustituido; con la condición de que R^{44} y R^{45} no son ambos H;

n20 es entre 2 y 26;

n21 es entre 1 y 26; y

n25 es 1 o 2;

(i) $\sim R^{20}\text{-}(R^{21}\text{-}[N(R^N)\text{-}C(O)\text{-}[O\text{-}CH_2\text{-}CH(OH)\text{-}CH_2]_{n20}]_{n21}\text{-}R^{22}\text{-}NR^{24}R^{25})_{n25}$ (XXXVIII)

o un estereoisómero o una sal de la misma, donde:

R^{20} es un grupo de unión al sitio R^b, o al grupo enzimáticamente escindible;

R^{21} y R^{22} son independientemente entre sí un enlace o grupo C_1-C_3 alquileno;

R^N es H o C_1-C_4alquilo;

R^{24} y R^{25} se seleccionan independientemente en cada caso entre H; grupo polihidroxilo; y grupo polihidroxilo sustituido, con la condición de que R^{24} y R^{25} no son ambos H;

n20 es entre 2 y 26;

n21 es entre 1 y 4; y

n25 es 1, 2 o 3;

(j) $\sim R^{20}-(R^{21}-[C(R^{\alpha})H-C(O)-N(R^{N})]_{n20}-R^{22}-[CH_2-CH_2-O]_{n20}-NR^{24}R^{25})_{n25}$

(XXXIX)

o un estereoisómero o sal de la misma, donde:

R^{20} es un grupo de unión al sitio R^b, o al grupo enzimáticamente escindible;

R^{21} y R^{22} son independientemente entre sí un enlace, C_1-C_3 alquileno,-C_1-C_3alquileno-$[O-CH_2-CH_2-]_{n20}$, -$[CH_2-CH_2-O]_{n20}$-C_1-C_3alquileno- o -C_1-C_3alquileno-$[O-CH_2-CH_2-]_{n20}$-C(O)-;

cada R^{α} es independientemente H o -R^{22}-$NR^{24}R^{25}$;

cada R^N es independientemente H, C_1-C_6 alquilo o -R^{22}-$NR^{24}R^{25}$;

R^{24} y R^{25} se seleccionan independientemente en cada caso entre H; grupo polihidroxilo; grupo polihidroxilo sustituido; grupo -C(O)-polihidroxilo; grupo -C(O)-polihidroxilo sustituido; -C(O)-C_1-C_8 alquilo sustituido; un quelante; -C(O)-R^{28}, donde R^{28} es una unidad sacárido de fórmula (XII) o (XIII), con la condición de que R^{24} y R^{25} no son ambos H;

cada n20 es independientemente entre 0 y 26, con la condición de que por lo menos un n20 es entre 2 y 26; y

n25 es 1 o 2; o

(k) $\sim R^{20}-R^{21}-[C(R^{\alpha})H-C(O)-N(R^{N})]_{n20}-R^{22}-[CH_2-CH_2-O]_{n20}-NR^{24}R^{25}$

|

$R^{21}-[C(R^{\alpha})H-C(O)-N(R^{N})]_{n21}-R^{22}-[CH_2-CH_2-O]_{n21}-R^{23}-CO_2-R^{26}$

(XXXVX)

o un estereoisómero o sal de la misma, donde:

R^{20} es un grupo de unión al sitio R^b, o al grupo enzimáticamente escindible;

R^{21}, R^{22} y R^{23} son independientemente entre sí un enlace, C_1-C_3 alquileno, -C_1-C_3alquileno-$[O-CH_2-CH_2-]_{n20}$, -$[CH_2-CH_2-O]_{n20}$-C_1-C_3alquileno- o -C_1-C_3alquileno-$[O-CH_2-CH_2-]_{n20}$-C(O)-;

cada R^{α} es independientemente H o -R^{22}-$NR^{24}R^{25}$;

cada R^N es independientemente H, C_1-C_6 alquilo o -R^{22}-$NR^{24}R^{25}$;

R^{24} y R^{25} se seleccionan independientemente en cada caso entre H; grupo polihidroxilo; grupo polihidroxilo sustituido; grupo -C(O)-polihidroxilo; grupo -C(O)-polihidroxilo sustituido; -C(O)-C_1-C_8 alquilo sustituido; un quelante; y -C(O)-R^{28}, donde R^{28} es una unidad sacárido de fórmula (XII) o (XIII), con la condición de que R^{24} y R^{25} no son ambos H;

R^{26} es H o C_1-C_6 alquilo;

cada n20 es independientemente entre 0 y 26, con la condición de que por lo menos un n20 es entre 2 y 26; y

cada n21 es independientemente entre 0 y 26, con la condición de que por lo menos un n21 es entre 2 y 26.

32. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, que comprende un grupo polar que tiene una fórmula seleccionada entre las siguientes, o un estereoisómero o sal de las mismas:

$$\sim R^{20}\text{-}R^{21}\text{-}[O\text{-}CH_2\text{-}CH_2]_{n20}\text{-}R^{22}\text{-}NH\text{-}C(O)\text{-}R^{31} \quad \text{(XXXI)},$$

$$\sim R^{20}\text{-}R^{21}\text{-}[O\text{-}CH_2\text{-}CH_2]_{n20}\text{-}R^{22}\text{-}C(O)NH\text{-}R^{31} \quad \text{(XXXII), y}$$

$$\sim R^{20}\text{-}R^{21}\text{-}[O\text{-}CH_2\text{-}CH_2]_{n20}\text{-}R^{22}\text{-}N\text{-}(R^{33}\text{-}R^{31})_2 \quad \text{(XXXIII)};$$

donde:

R^{20} es un grupo de unión al sitio R^b, o al grupo enzimáticamente escindible;

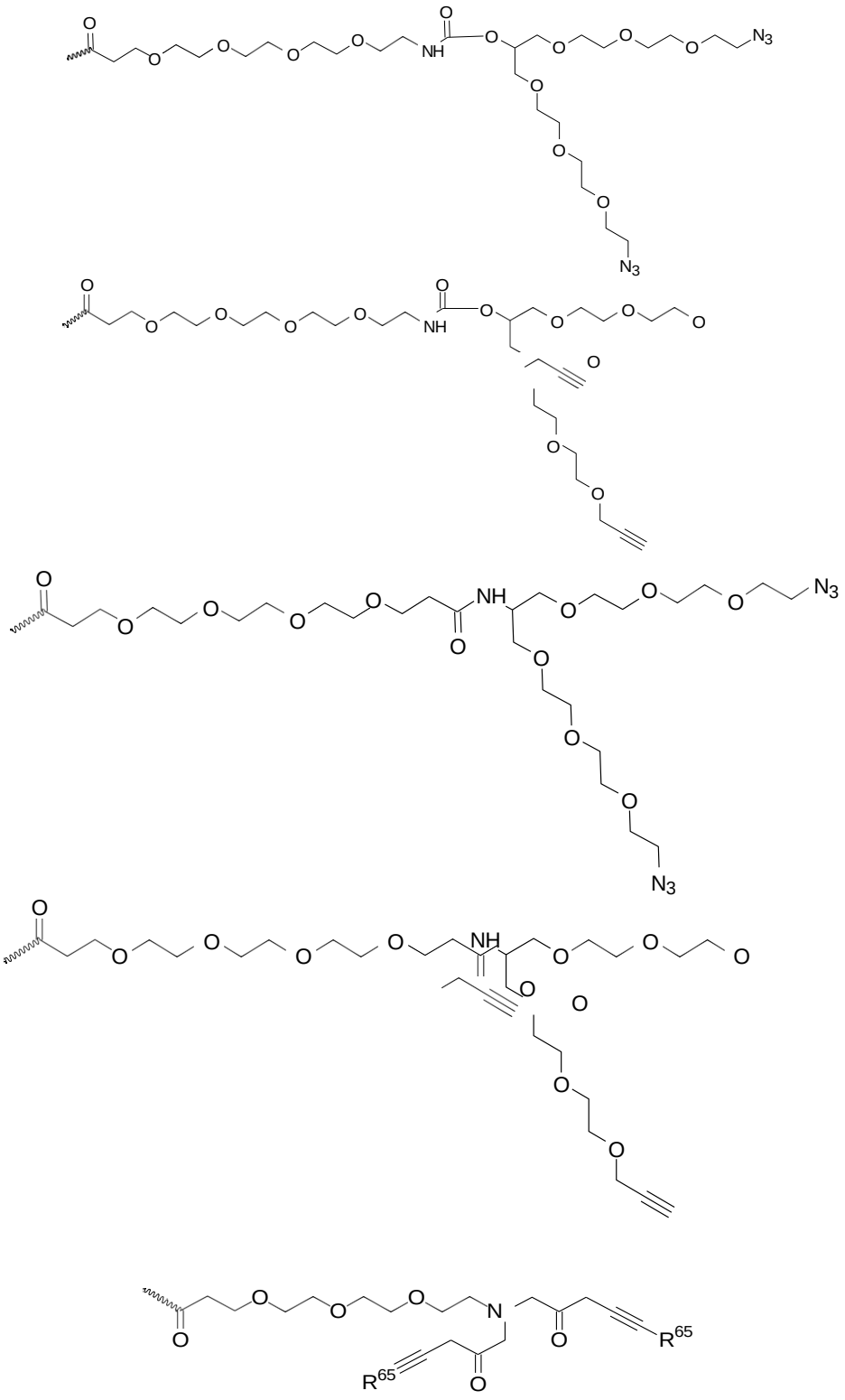
R^{21} y R^{22} son independientemente entre sí un enlace o grupo C_1-C_3 alquileno;

R^{31} es una cadena polietilenglicol ramificada, donde cada ramificación tiene entre 1 y 26 subunidades etilenglicol y donde cada ramificación tiene un R^{35} en su extremo;

R^{33} es C_1-C_3 alquileno, -C_1-C_3 alquileno-C(O), -C(O)-C_1-C_3 alquileno o -C(O)-C_1-C_3 alquileno-C(O);

R^{35} es azido, alquinilo, alquinil-R^{65}, ciclooctino o ciclooctino-R^{65}, donde R^{65} se selecciona entre alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, alquinilo opcionalmente sustituido, carbociclo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heterocarbociclo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido; la línea ondulada (~) indica un sitio de unión a R^{20}; y n20 es entre 2 y 26.

33. El compuesto conector de la reivindicación 31 o 32, que comprende un grupo polar formado por un grupo precursor seleccionado entre los siguientes:



donde R^{65} se selecciona entre alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, alquinilo opcionalmente sustituido, carbociclo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heterocarbociclo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido; y la línea ondulada es un sitio de unión a R^b, o al grupo enzimáticamente escindible.

34. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 31 a 33, donde el sitio de

unión a R^b, o al grupo enzimáticamente escindible está formado por un grupo funcional de un compuesto precursor del grupo polar, donde dicho grupo funcional se selecciona entre halo, aldehído, carboxilo, amino, alquinilo, azido, hidroxilo, carbonilo, carbamato, tiol, urea, tiocarbamato, tiourea, sulfonamida, acilsulfonamida, alquilsulfonato, triazol, azadibenzociclooctino, hidrazina, carbonilalquilheteroarilo, y formas protegidas de los mismos.

35. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 1-6, que comprende un grupo polar que tiene la fórmula:

$$\sim R^{20}\text{-}(R^{43}\text{-}R^{41}\text{-}[O\text{-}CH_2\text{-}CH_2]_{n40}\text{-}R^{42}\text{-}R^{43}\text{-}(NR^{44}R^{45})_{n41})_{n42} \qquad \text{(XL)}$$

o un estereoisómero o sal de la misma, donde:

R^{20} es un grupo de unión al sitio R^b, o al grupo enzimáticamente escindible;

R^{41} y R^{42} son independientemente entre sí un enlace o C_1-C_6 alquileno;

cada R^{43} se selecciona independientemente entre un enlace, C_1-C_{12} alquileno, -OC_1-C_{12} alquileno, -C(=O)-, -NR^a-C_1-C_{12} alquileno, -C_1-C_{12} alquileno-NR^a-, -C(O)-C_1-C_{12} alquileno, -C_1-C_{12} alquileno-C(O)-, -NR^a-C_1-C_{12} alquileno-C(O)-, -C(O)-C_1-C_{12} alquileno-NR^a-, -NR^a-C(O)-NR^a-, -NR^a-C(O)-, -NR^a-C(O)-C_1-C_{12} alquileno, -C(O)-NR^a-C_1-C_{12} alquileno, -heteroarileno, heteroaril-C_1-C_{12} alquileno, heteroaril-C_1-C_{12} alquileno-C(O)-, o -C(O)$NR^{46}R^{47}$, donde cada alquileno está opcionalmente sustituido con hidroxilo, SO_3H y/o oxo, R^a es H, C_1-C_6 alquilo, un grupo polihidroxilo, o un grupo polihidroxilo sustituido, y uno de R^{46} y R^{47} es H o C_1-C_{12} alquileno y el otro es C_1-C_{12} alquileno, donde uno de los C_1-C_2 alquilenos está unido a $NR^{44}R^{45}$ por medio del átomo de nitrógeno;

R^{44} y R^{45} son independientemente entre sí H, grupo polihidroxilo, grupo polihidroxilo sustituido, grupo -C(O)-polihidroxilo, o grupo -C(O)-polihidroxilo sustituido, donde los sustituyentes opcionales se seleccionan entre sulfato, fosfato, alquilsulfato, y alquilfosfato; n40 es entre 2 y 26, con la condición de que R^{44} y R^{45} no son ambos H;

n40 es entre 2 y 26;

n41 es entre 1 y 6; y

n42 es entre 1 y 6.

36. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 1-6, que comprende un grupo polar que tiene la fórmula:

$$\sim R^{20}\text{-}(R^{41}\text{-}[O\text{-}CH_2\text{-}CH_2]_{n40}\text{-}R^{42}\text{-}R^{43}\text{-}(NR^{44}R^{45})_{n41})_{n42} \qquad \text{(XLI)}$$

o un estereoisómero o sal de la misma, donde:

R^{20} es un grupo de unión al sitio R^b, o al grupo enzimáticamente escindible;

R^{41} y R^{42} son independientemente entre sí un enlace o C_1-C_6 alquileno;

R^{43} se selecciona entre un enlace, C_1-C_{12} alquileno, -OC_1-C_{12} alquileno, -C(=O)-, -NR^a-C_1-C_{12} alquileno, -C_1-C_{12} alquileno-NR^a-, -C(O)-C_1-C_{12} alquileno, -C_1-C_{12} alquileno-

C(O)-, -NR^a-C_1-C_{12} alquileno-C(O)-, -C(O)-C_1-C_{12} alquileno-NR^a-, -NR^a-C(O)-NR^a-, -NR^a-C(O)-, -NR^a-C(O)-C_1-C_{12} alquileno, C(O)-NR^a-C_1-C_{12} alquileno, -heteroarileno, heteroaril-C_1-C_{12} alquileno, heteroaril-C_1-C_{12} alquileno-C(O)-, y -C(O)$NR^{46}R^{47}$, donde cada alquileno está opcionalmente sustituido con hidroxilo, SO_3H y/o oxo, R^a es H, C_1-C_6 alquilo, un grupo polihidroxilo, o un grupo polihidroxilo sustituido y uno de R^{46} y R^{47} es H o C_1-C_{12} alquileno y el otro es C_1-C_{12} alquileno, donde uno de los C_1-C_2 alquilenos está unido a $NR^{44}R^{45}$ por medio del átomo de nitrógeno;

R^{44} y R^{45} son independientemente entre sí H, grupo polihidroxilo, grupo polihidroxilo sustituido, grupo -C(O)-polihidroxilo, o grupo -C(O)-polihidroxilo sustituido, donde los sustituyentes opcionales se seleccionan entre sulfato, fosfato, alquilsulfato, y alquilfosfato, con la condición de que R^{44} y R^{45} no son ambos H;

n40 es entre 1 y 26;

n41 es entre 1 y 6; y

n42 es entre 1 y 6.

37. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 1-6, que comprende un grupo polar que tiene la fórmula:

$$\sim R^{20}\text{-}(R^{41}\text{-}[O\text{-}CH_2\text{-}CH_2]_{n40}\text{-}R^{42}\text{-}R^{43}\text{-}(NR^{44}R^{45})_{n41})_{n42} \qquad \text{(XLII)}$$

o un estereoisómero o sal de la misma, donde:

R^{20} es un grupo de unión al sitio R^b, o al grupo enzimáticamente escindible;

R^{41} y R^{42} son independientemente entre sí un enlace o C_1-C_3 alquileno;

R^{43} se selecciona entre un enlace, C_1-C_6 alquileno, -OC_1-C_{12} alquileno, -C(=O)-, -NR^a -C_1-C_{12} alquileno, -C_1-C_6 alquileno-NR^a-, -C(O)-C_1-C_6 alquileno, -C_1-C_6 alquileno-C(O)-, -NR^a-C_1-C_6 alquileno-C(O)-, -C(O)-C_1-C_6 alquileno-NR^a-, -NR^a-C(O)-NR^a-, -NR^a-C(O)-, -NR^a-C(O)-C_1-C_6 alquileno, -C(O)-NR^a-C_1-C_{12} alquileno, -heteroarileno, heteroaril-C_1-C_6 alquileno, heteroaril-C_1-C_6 alquileno-C(O)-, y -C(O)$NR^{46}R^{47}$, donde cada alquileno está opcionalmente sustituido con hidroxilo, SO_3H, y/o oxo, R^a es H, C_1-C_6 alquilo, un grupo polihidroxilo, o un grupo polihidroxilo sustituido y uno de R^{46} y R^{47} es H o C_1-C_6 alquileno y el otro es C_1-C_{12} alquileno, donde uno de los C_1-C_2 alquilenos está unido a $NR^{44}R^{45}$ por medio del átomo de nitrógeno;

R^{44} y R^{45} son independientemente entre sí H, grupo polihidroxilo, grupo polihidroxilo sustituido, grupo -C(O)-polihidroxilo, o grupo -C(O)-polihidroxilo sustituido, donde los sustituyentes opcionales se seleccionan entre sulfato, fosfato, alquilsulfato, y alquilfosfato, con la condición de que R^{44} y R^{45} no son ambos H;

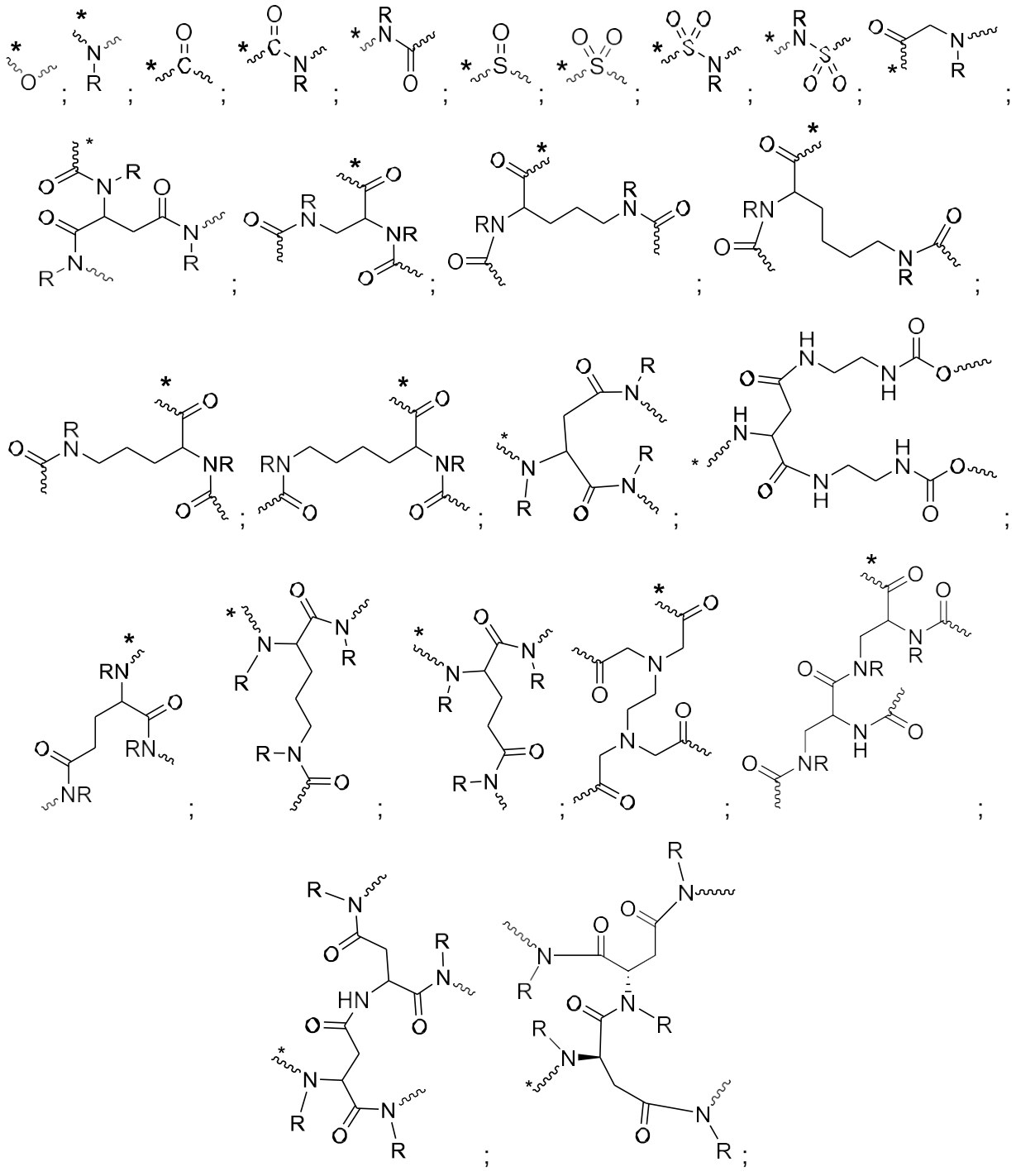
n40 es entre 1 y 16;

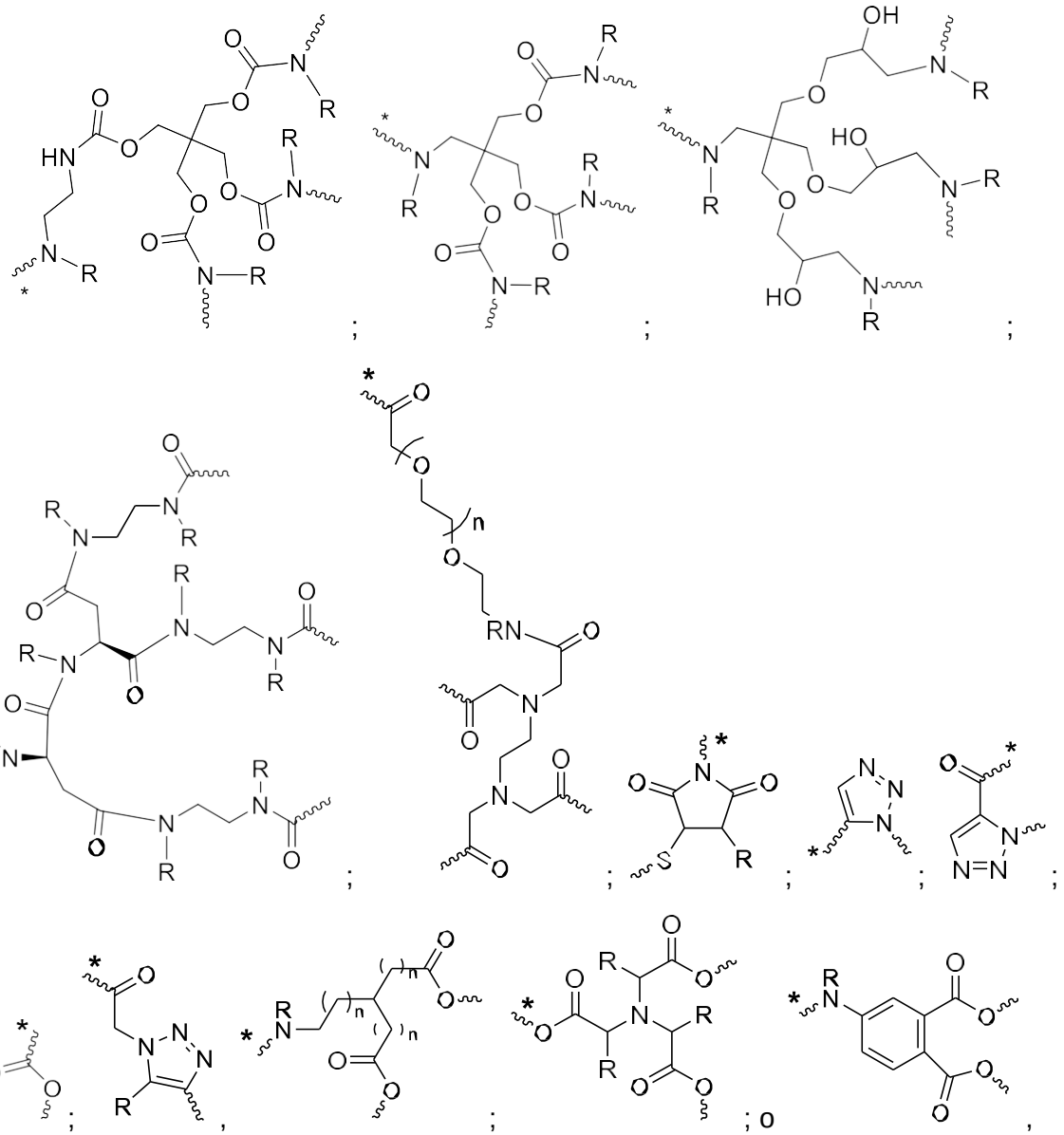
n41 es entre 1 y 4; y

n42 es entre 1 y 4.

38. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 7, 31, 32, y 35-37, donde R^{20} está formado por un grupo funcional de un compuesto precursor del grupo polar, donde dicho grupo funcional se selecciona entre halo, aldehído, carboxilo, amino, alquinilo, azido, hidroxilo, carbonilo, carbamato, tiol, urea, tiocarbamato, tiourea, sulfonamida, acilsulfonamida, alquilsulfonato, triazol, azadibenzociclooctino, hidrazina, carbonilalquilheteroarilo, o formas protegidas de los mismos.

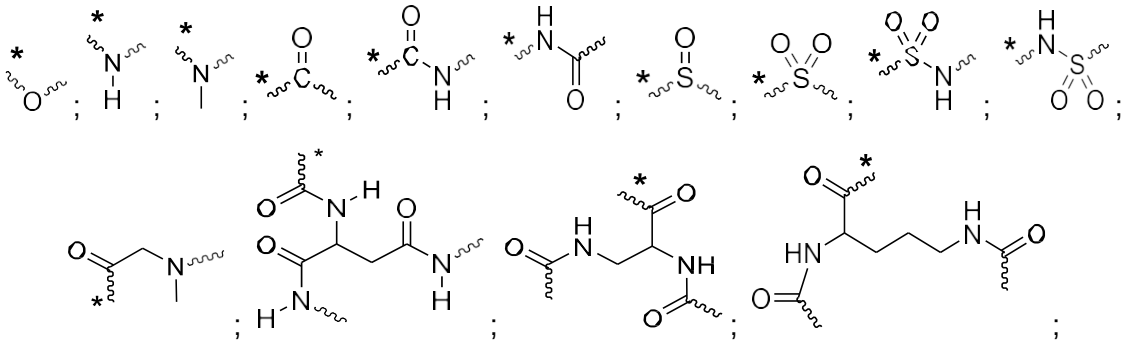
39. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 7, 31, 32, y 35-37, donde R^{20} comprende una de las siguientes estructuras:

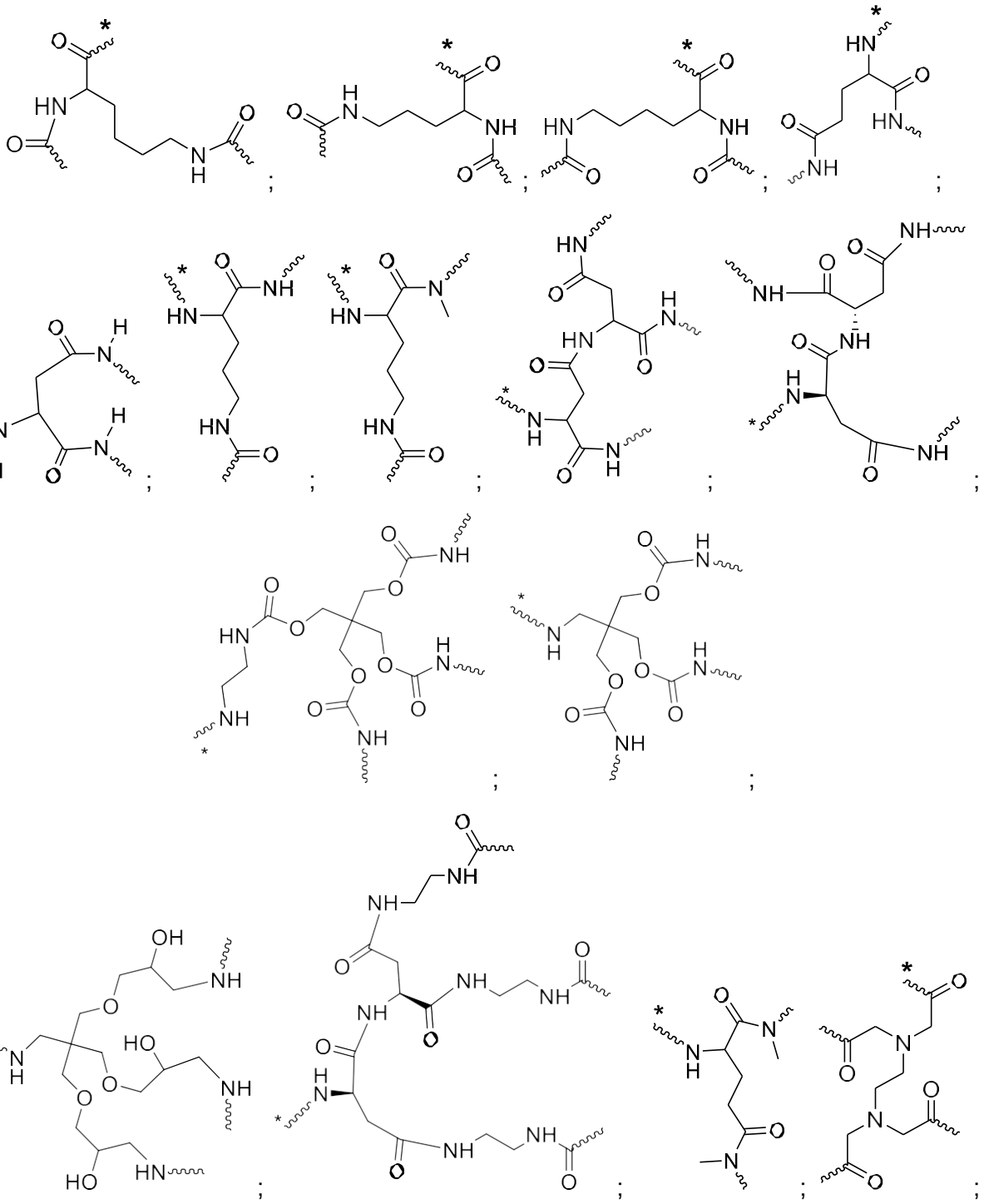


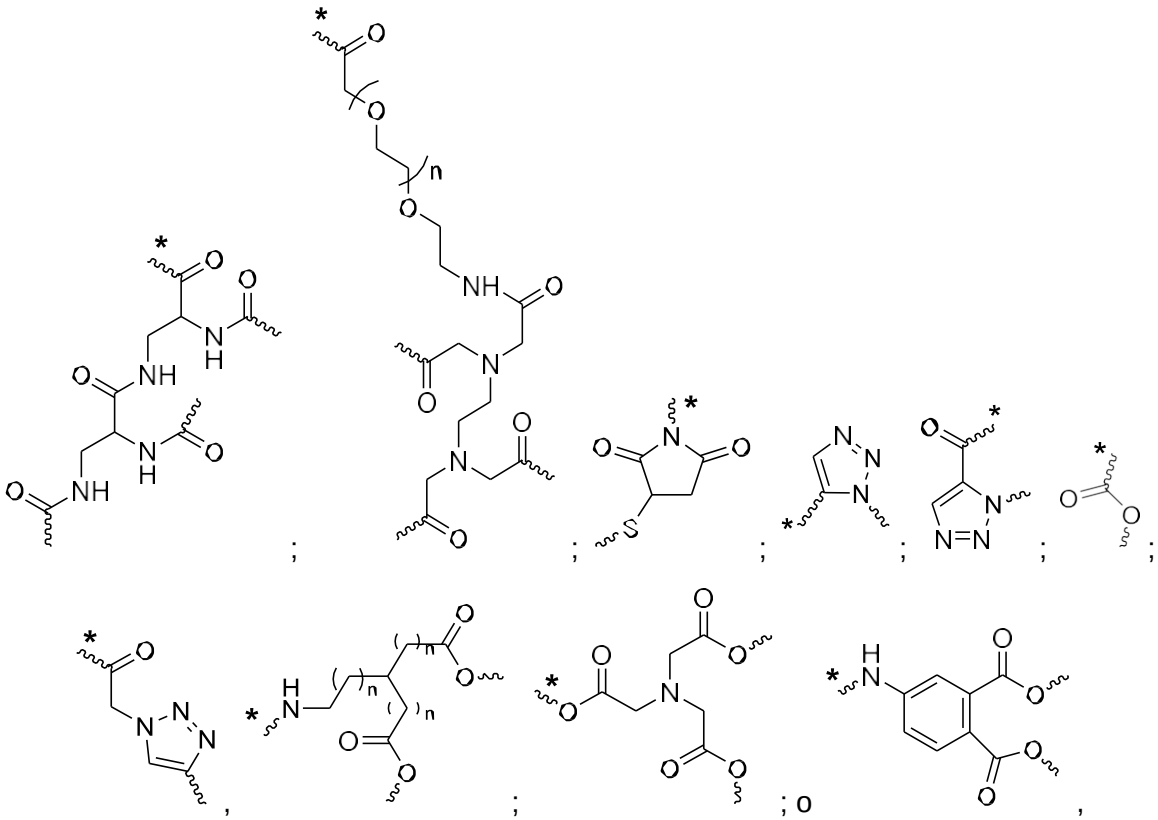


o un estereoisómero de las mismas, donde R es H, C_1-C_6 alquilo o grupo polihidroxilo, n es entre 0 y 12, (〰 *) indica un sitio de unión a R^b, o al grupo enzimáticamente escindible, y (〰) indica un sitio de unión a la porción restante del grupo polar.

40. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7, 31, 32, y 35-37, donde R^{20} tiene una de las siguientes estructuras:

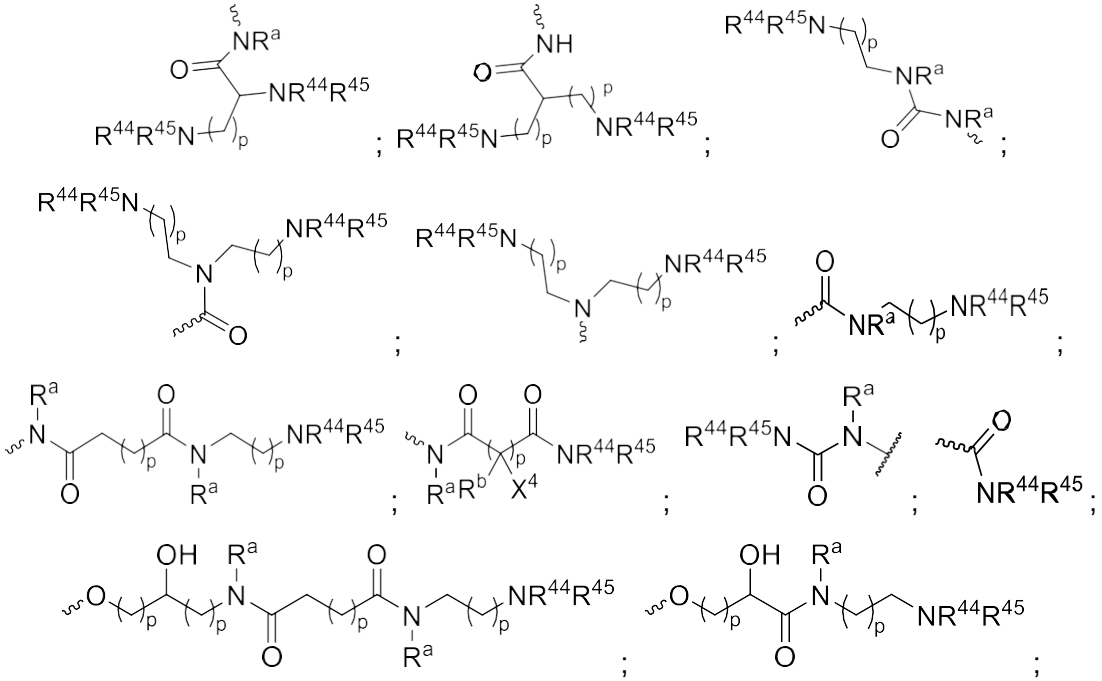


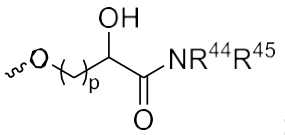
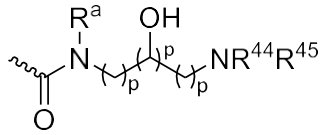
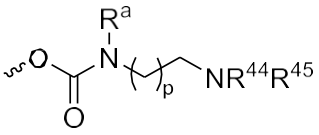
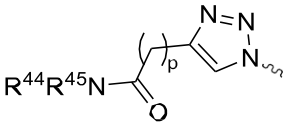




o un estereoisómero de las mismas, donde n = 0 a 12, (〰 *) indica un sitio de unión a R^b, o al grupo enzimáticamente escindible, y (〰) indica un sitio de unión a la porción restante del grupo polar.

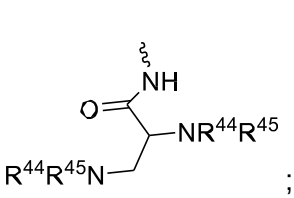
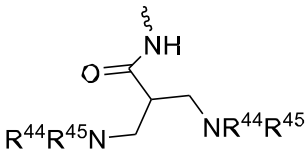
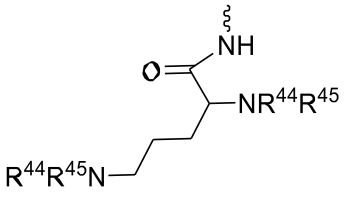
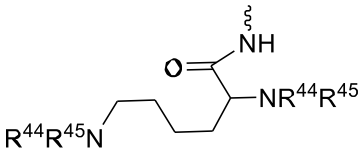
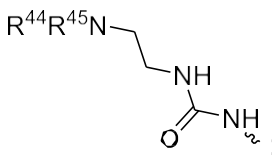
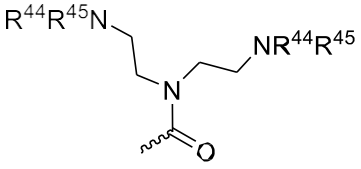
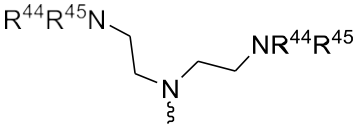
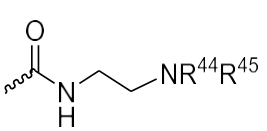
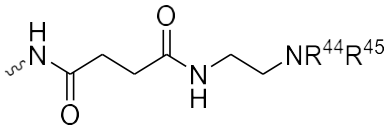
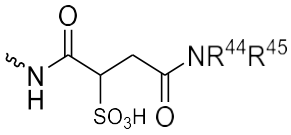
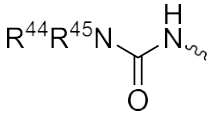
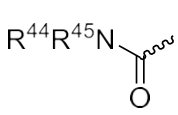
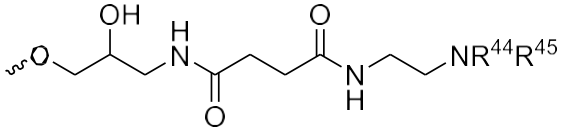
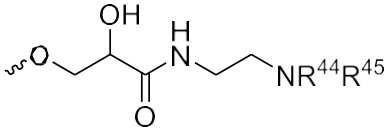
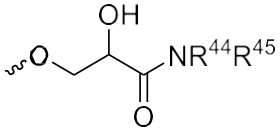
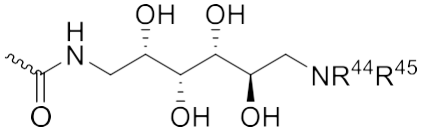
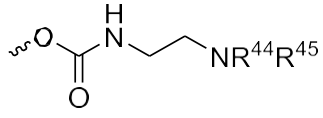
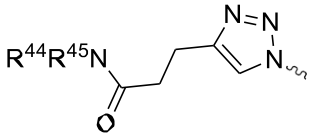
41. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 35-40, donde R^{43}-$(NR^{44}R^{45})_{n41}$ tiene una de las siguientes estructuras:




; 
; 
; o 
,

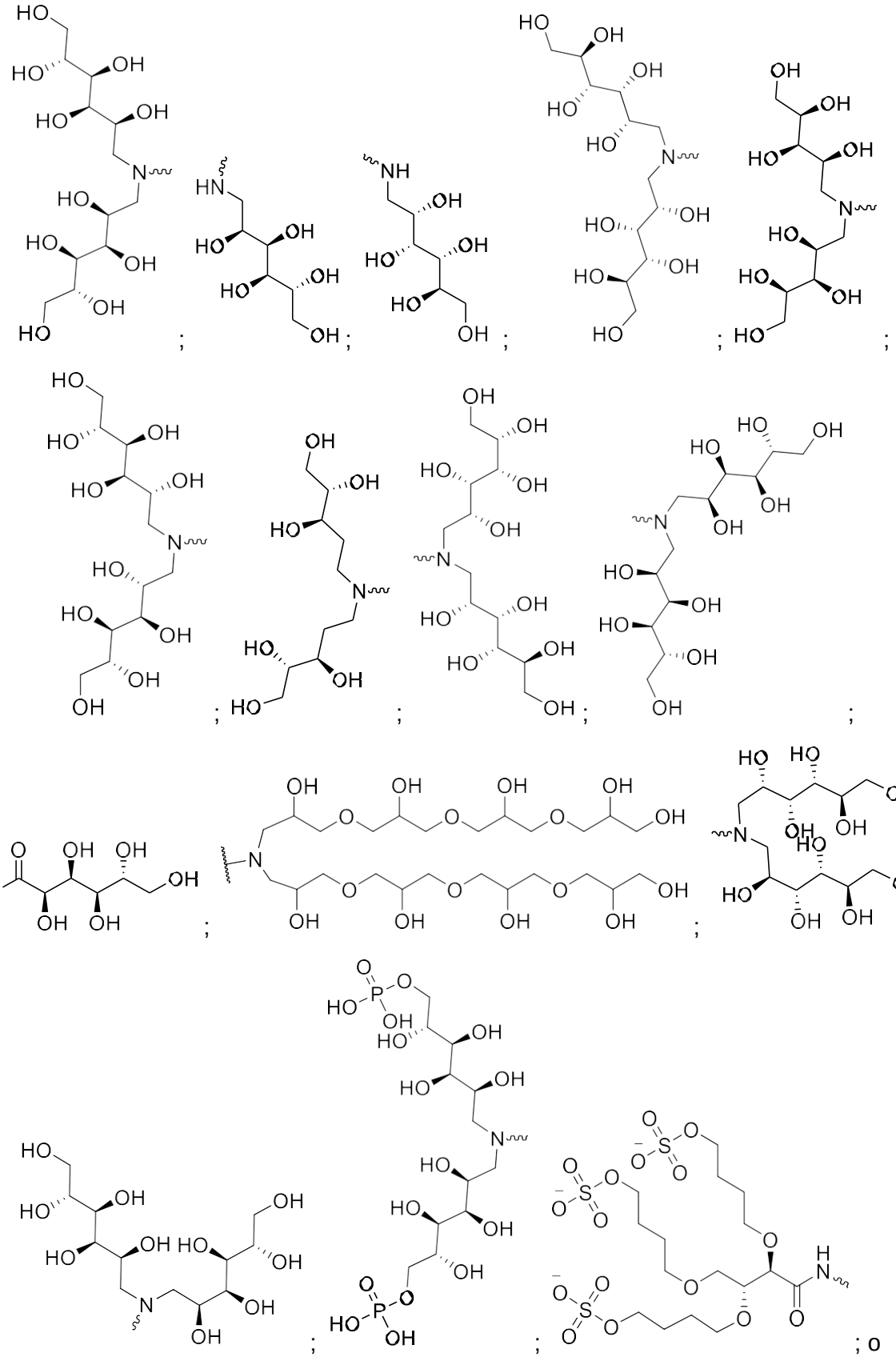
o un estereoisómero de las mismas, donde R^a es H, C_1-C_6 alquilo, un grupo polihidroxilo, o un grupo polihidroxilo sustituido; p es un entero entre 1 y 6, y (〰) indica el sitio de unión de R^{43} al resto del grupo polar.

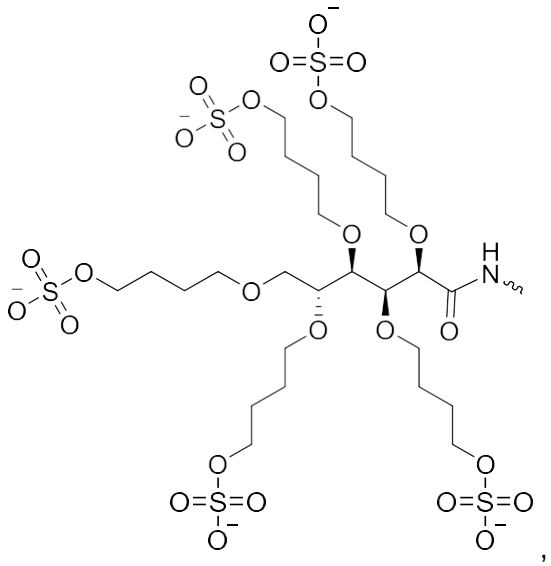
42. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 35-40, donde R^{43}-$(NR^{44}R^{45})_{n41}$ tiene una de las siguientes estructuras:


; 
; 
; 
; 
; 
; 
; 
; 
; 
; 
; 
; 
; 
; 
; 
; 
; o 
,

o un estereoisómero de las mismas, donde (〰) indica el sitio de unión de R^{43} al resto del grupo polar.

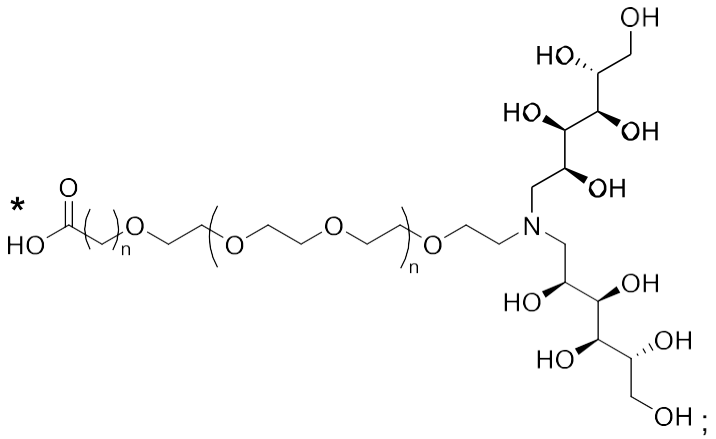
43. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 35-42, donde -$NR^{44}R^{45}$ tiene una de las siguientes estructuras:

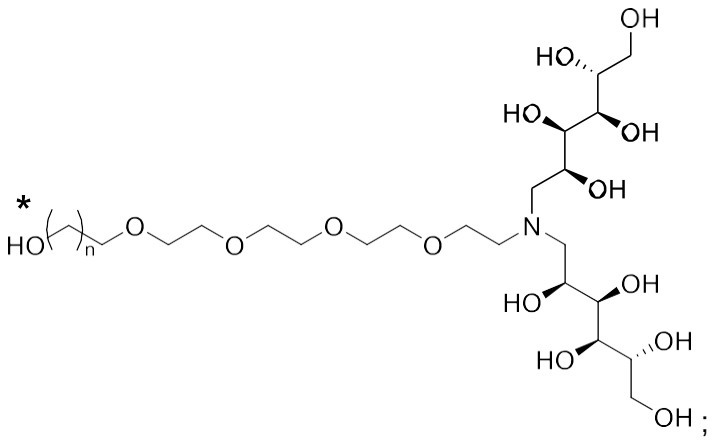


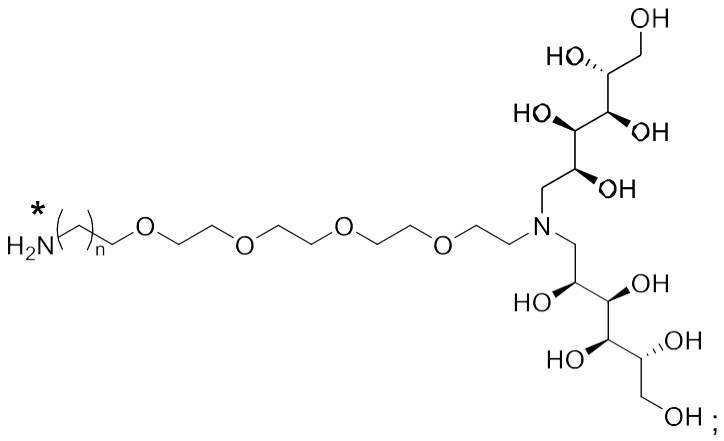


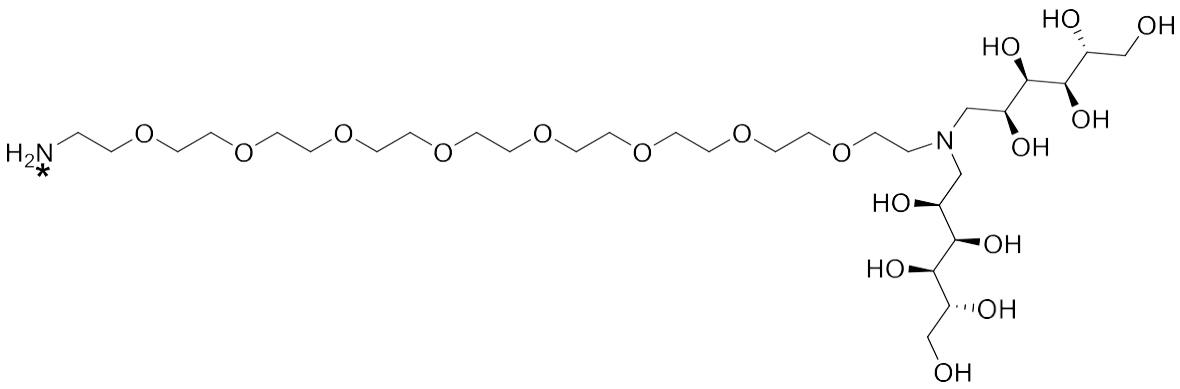
o un estereoisómero de las mismas, donde ( ) indica el sitio de unión de -$NR^{44}R^{45}$ al resto del grupo polar.

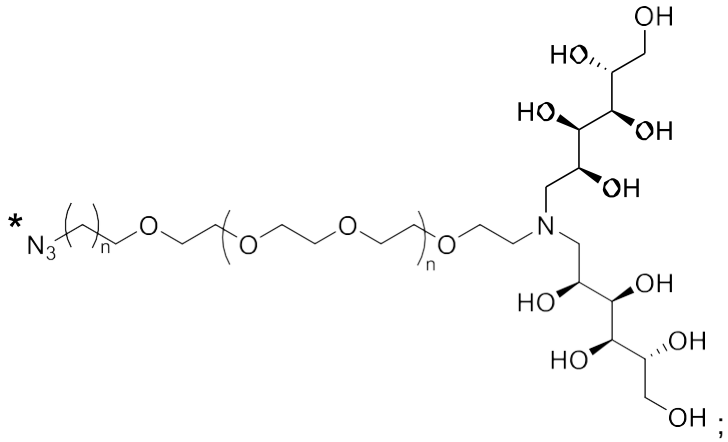
44. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 1-44, que comprende un grupo polar que tiene una de las siguientes estructuras antes de unirse a la unidad conectora:

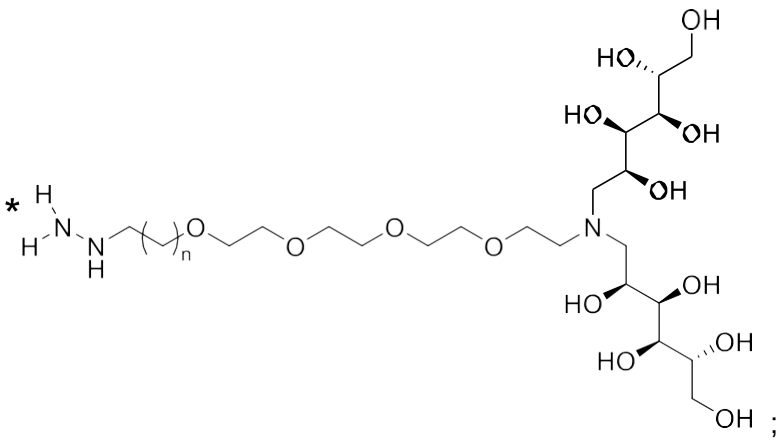


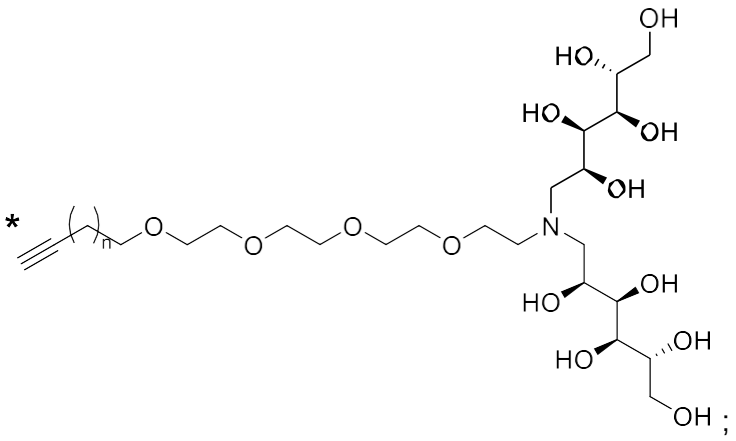


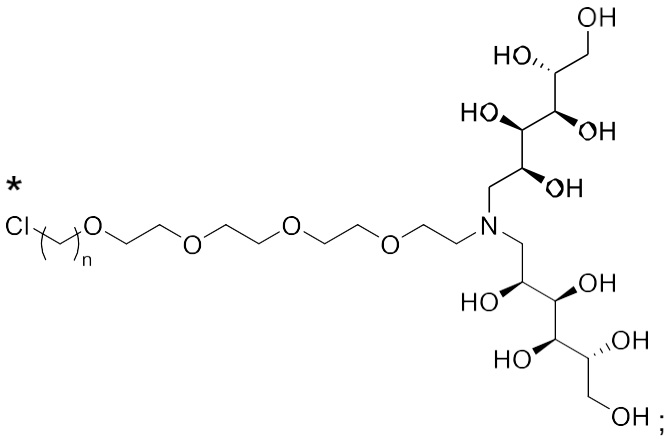


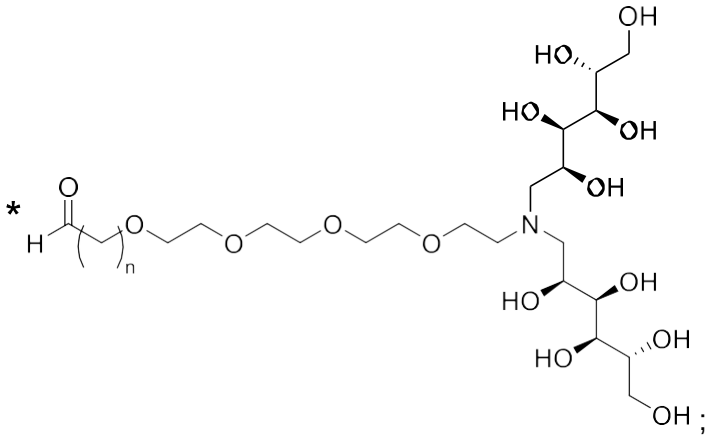


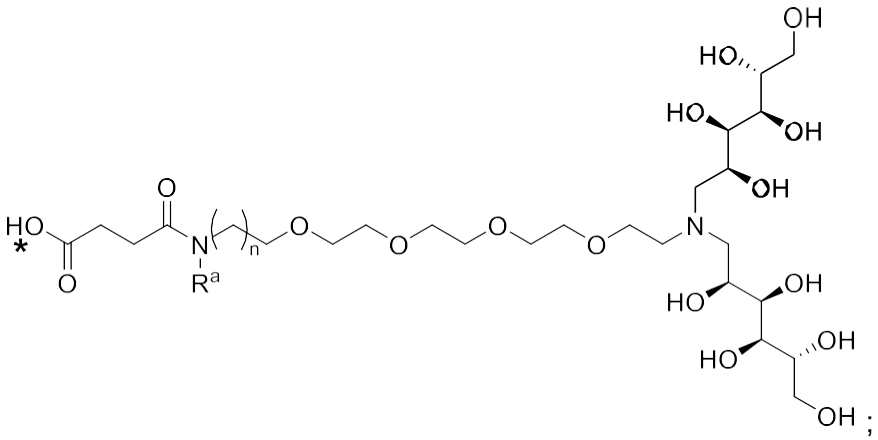


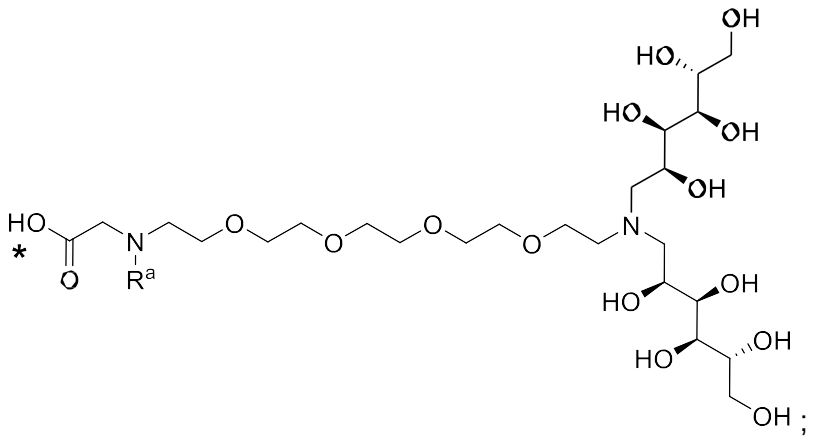




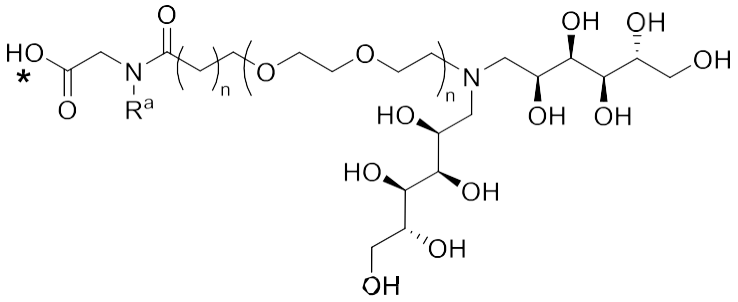




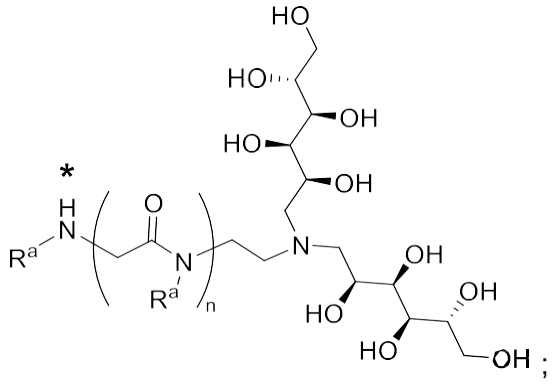




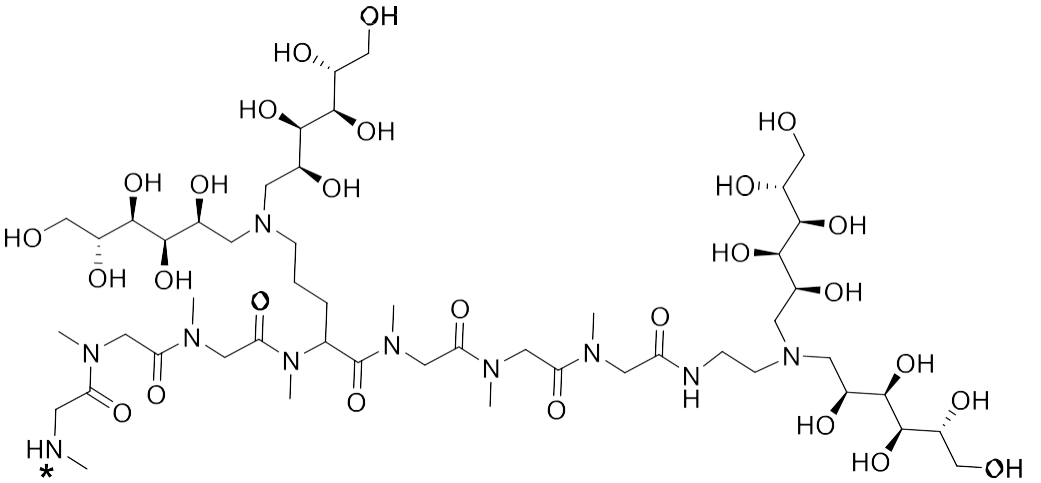
;



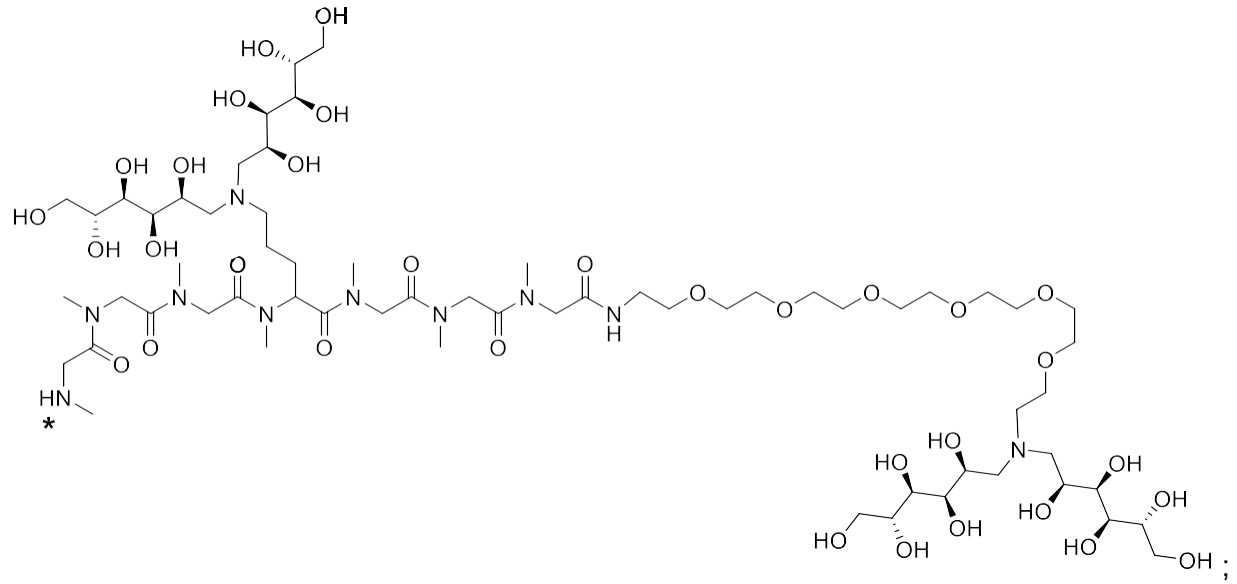
;



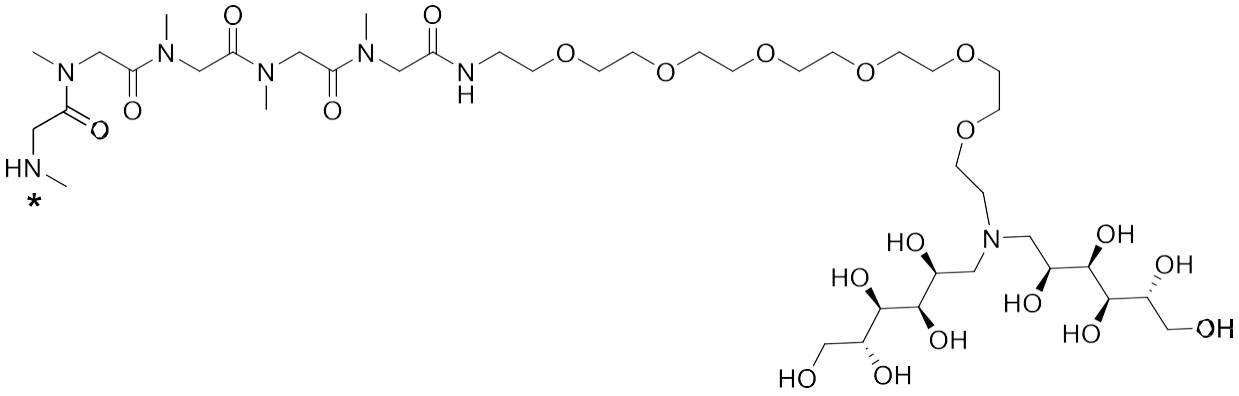
;



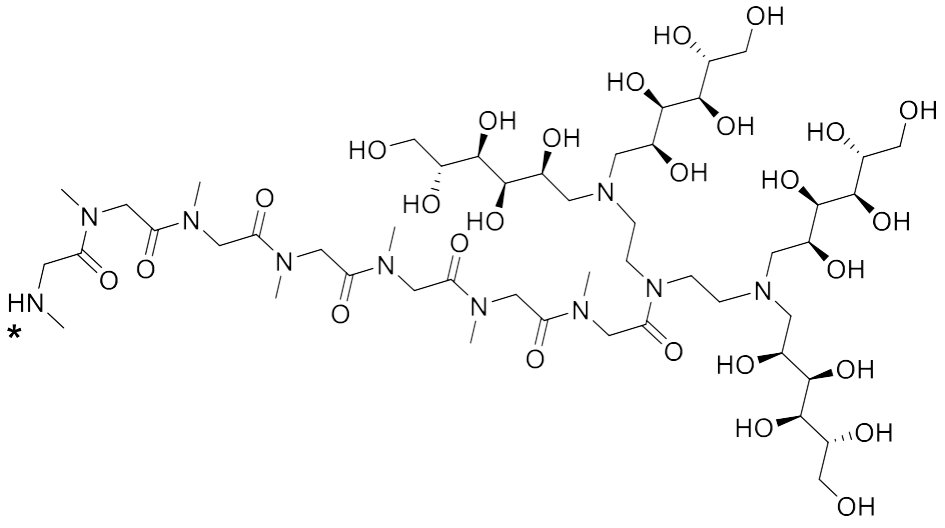
;



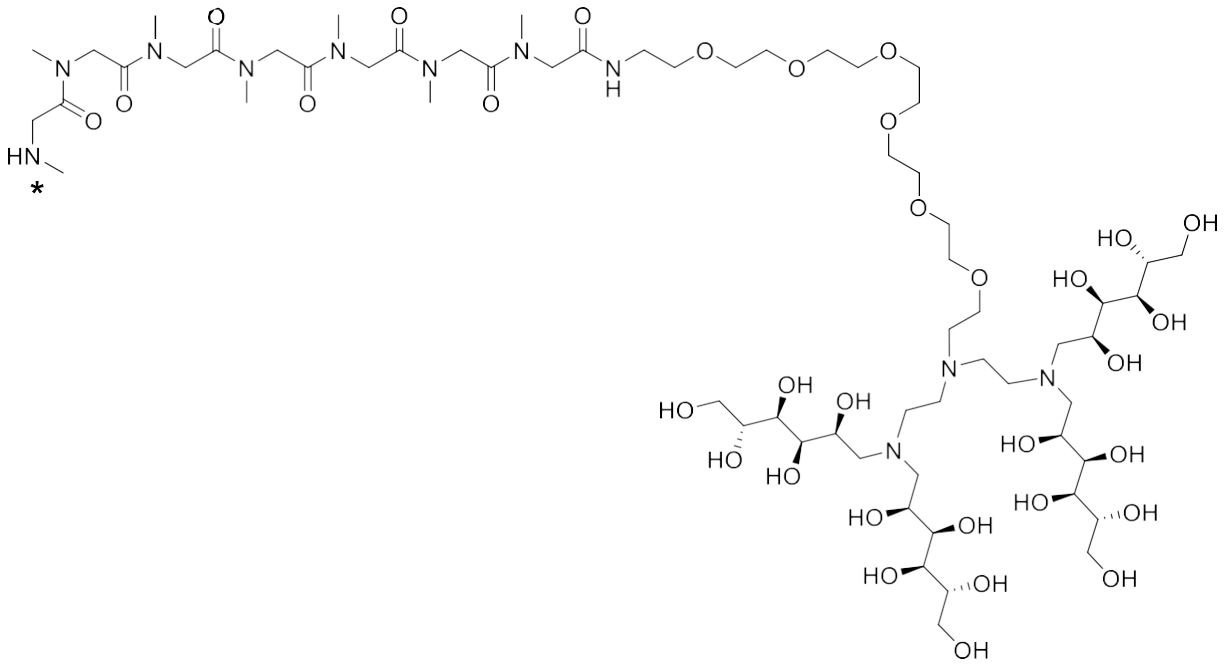
;



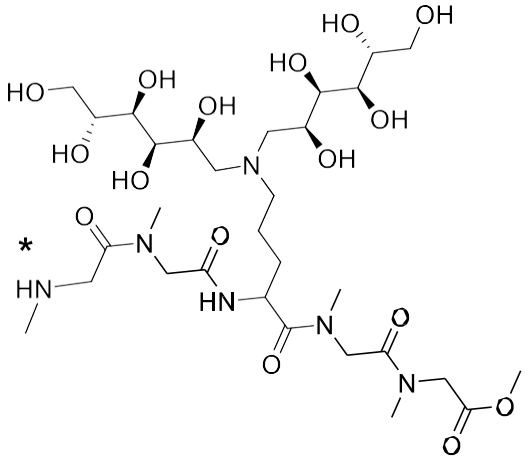
;



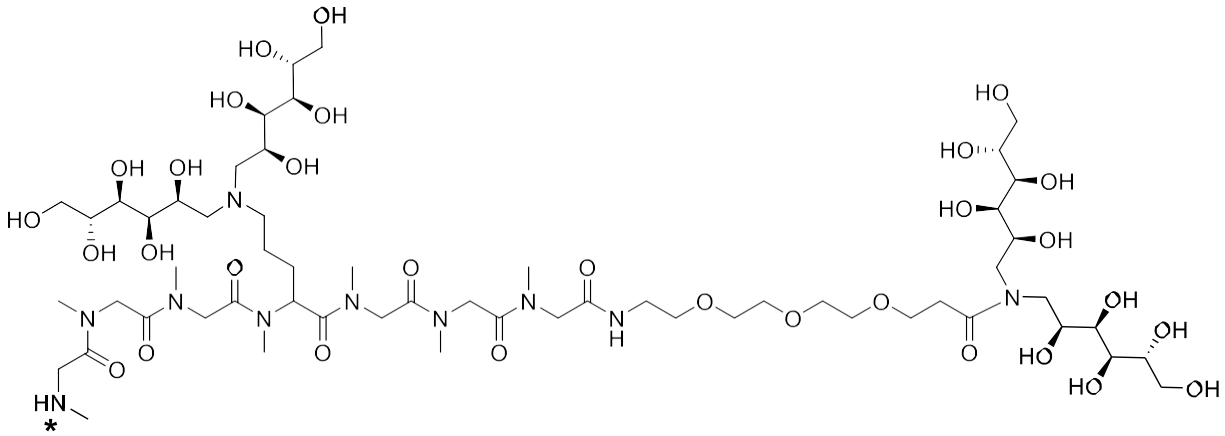
;



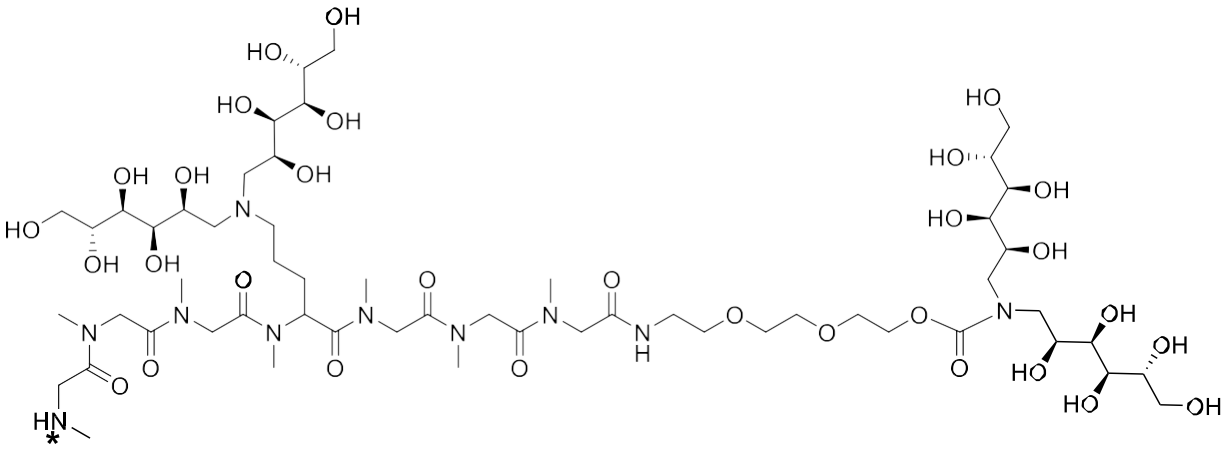
;



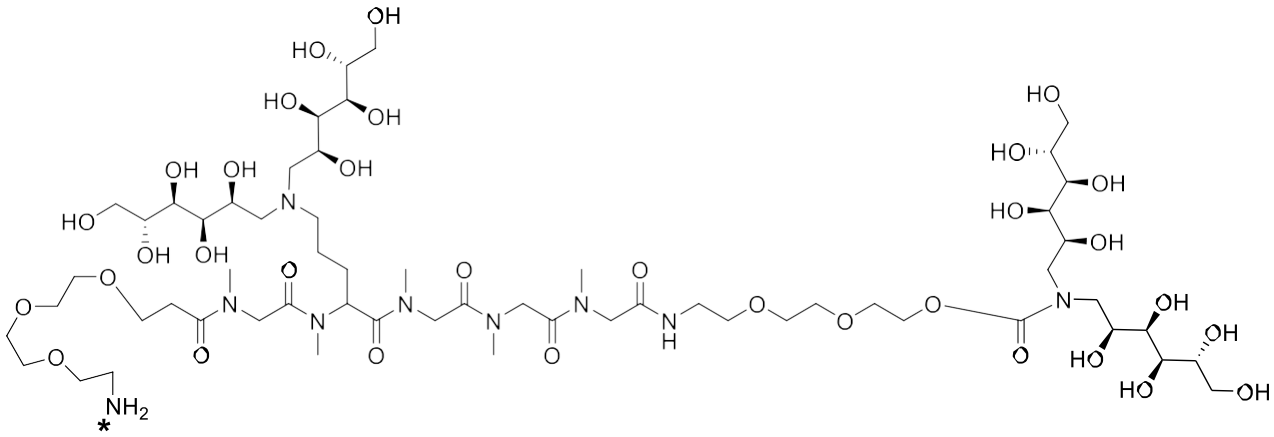
;



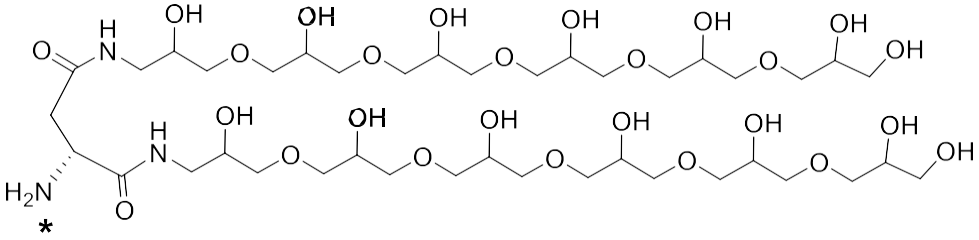
;

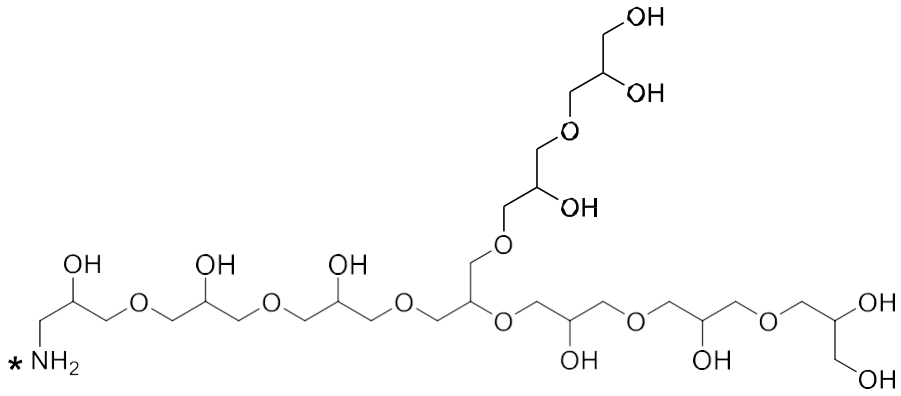


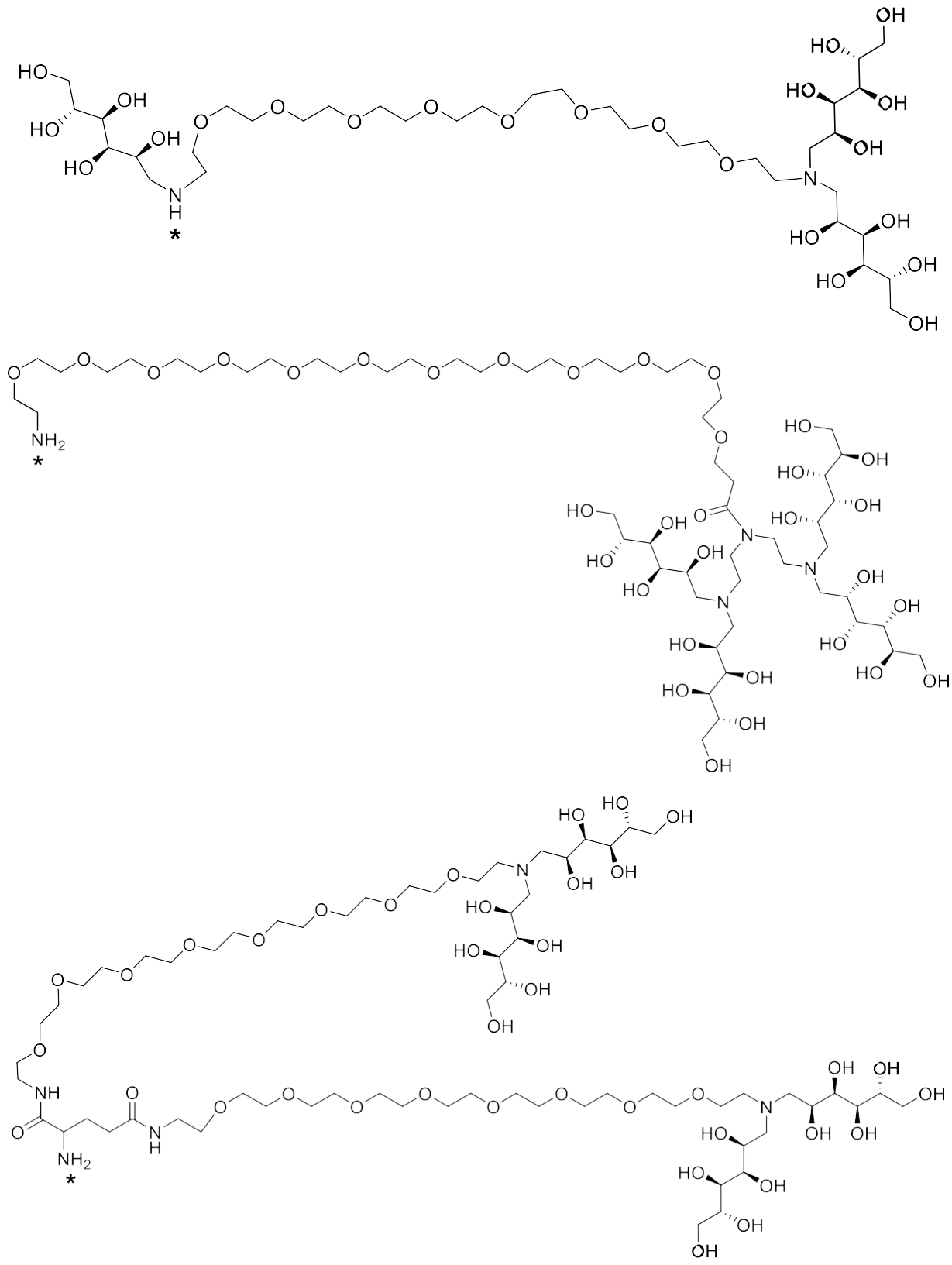
;

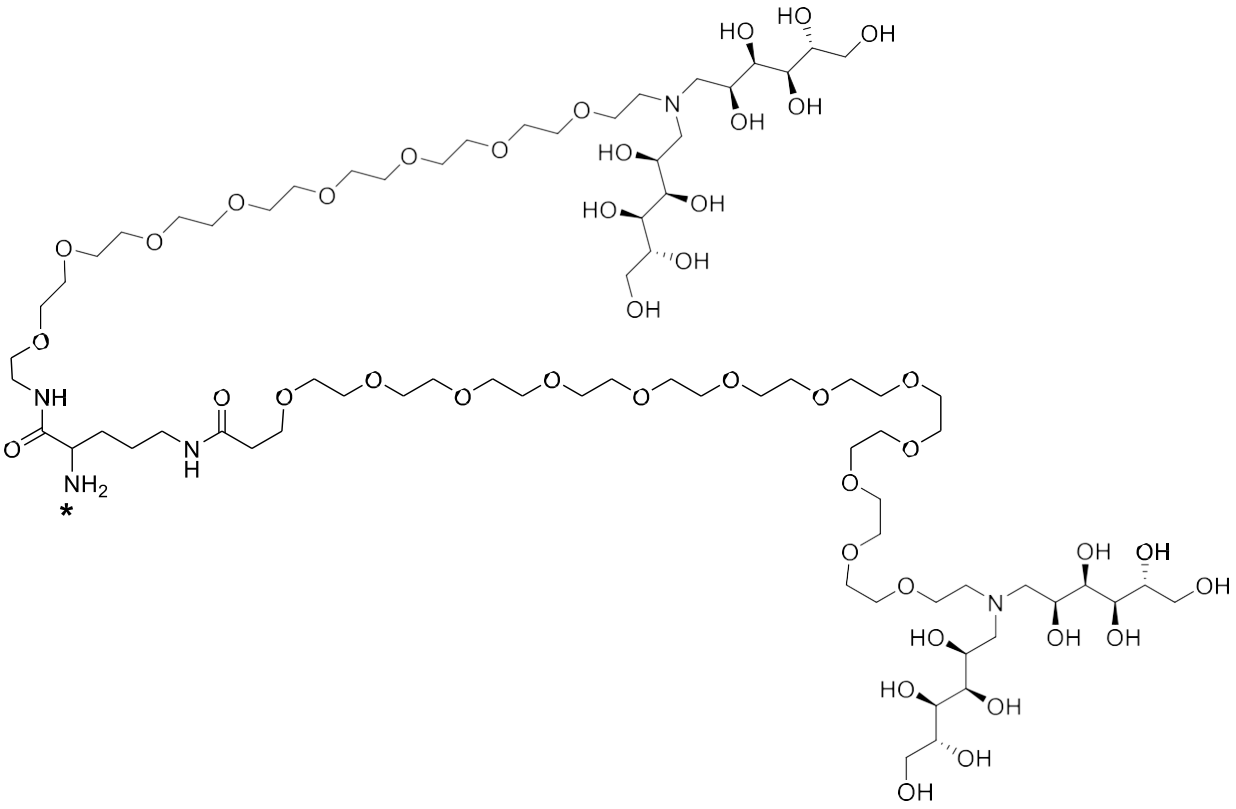


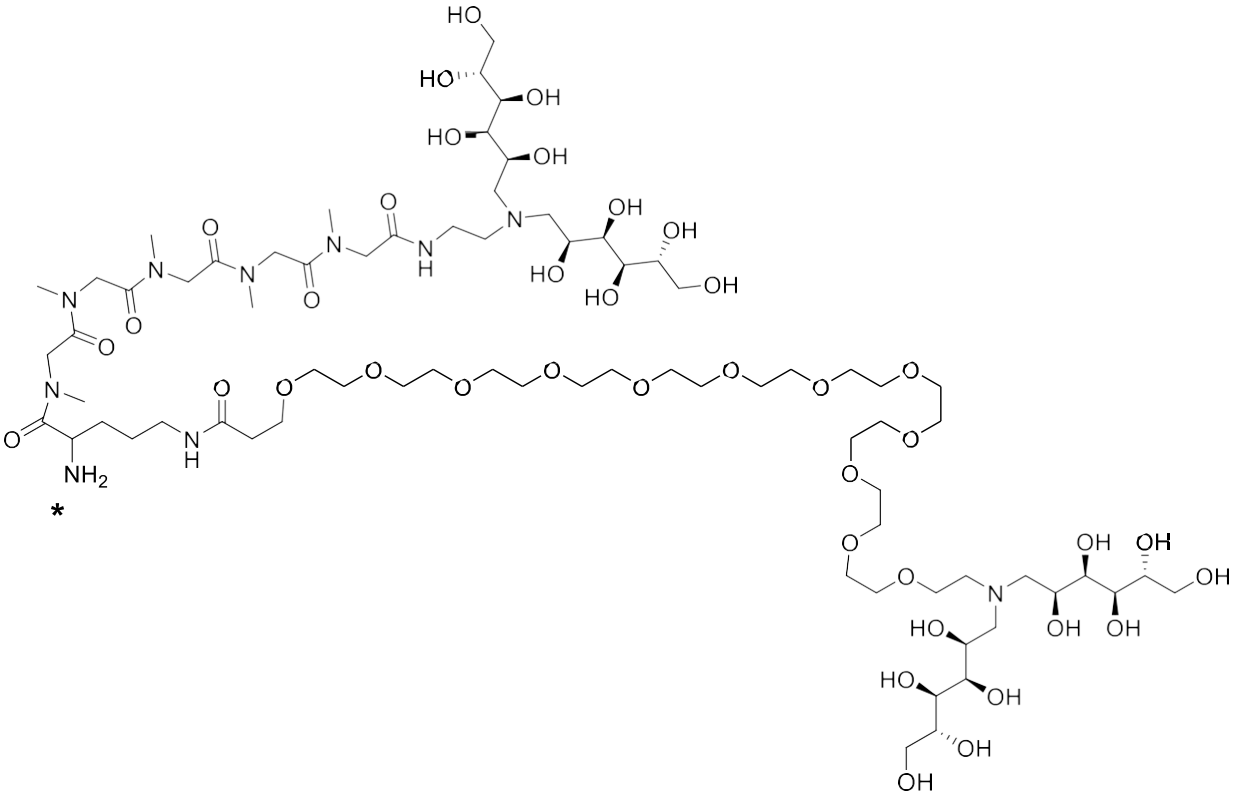
;

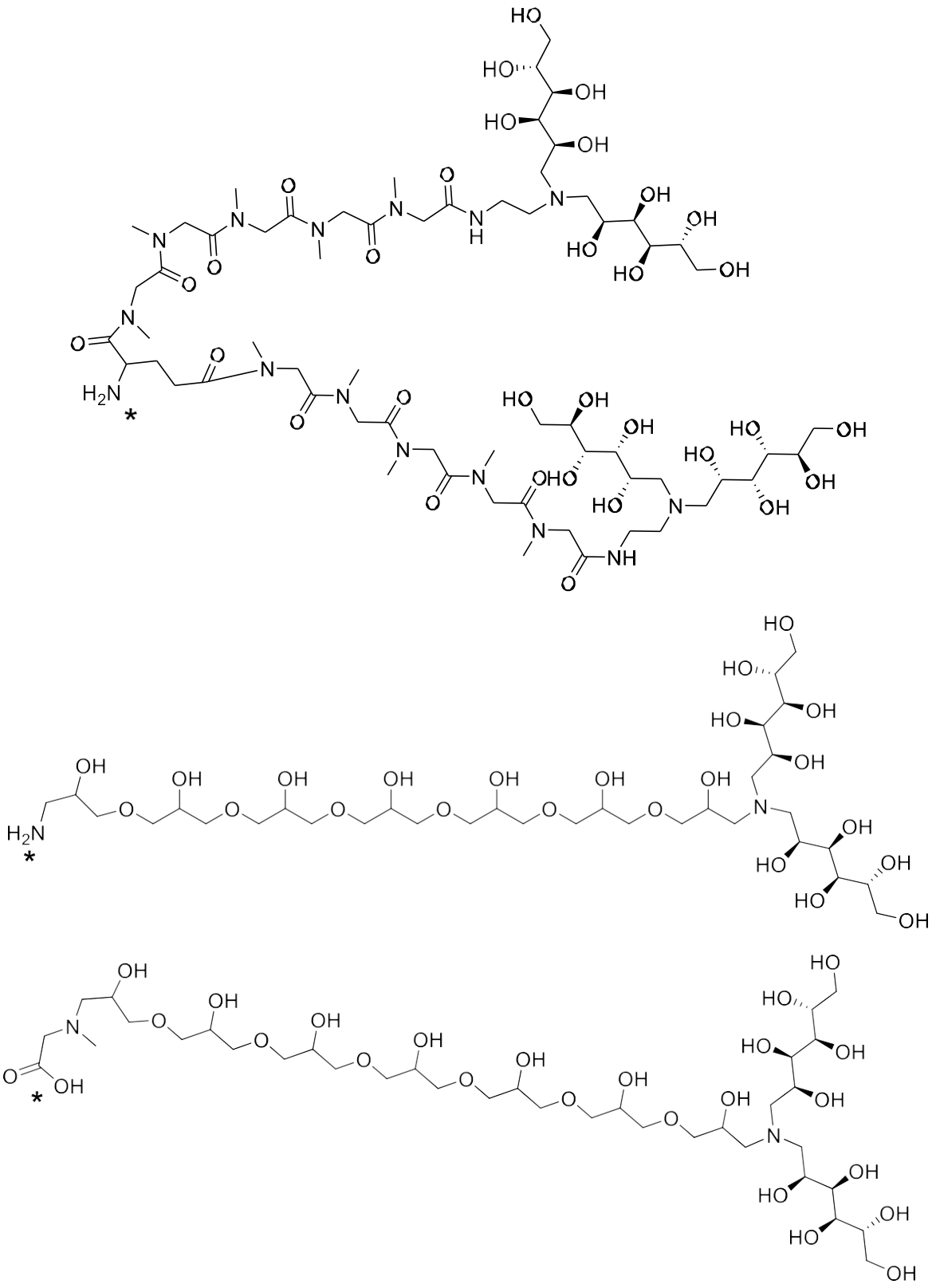


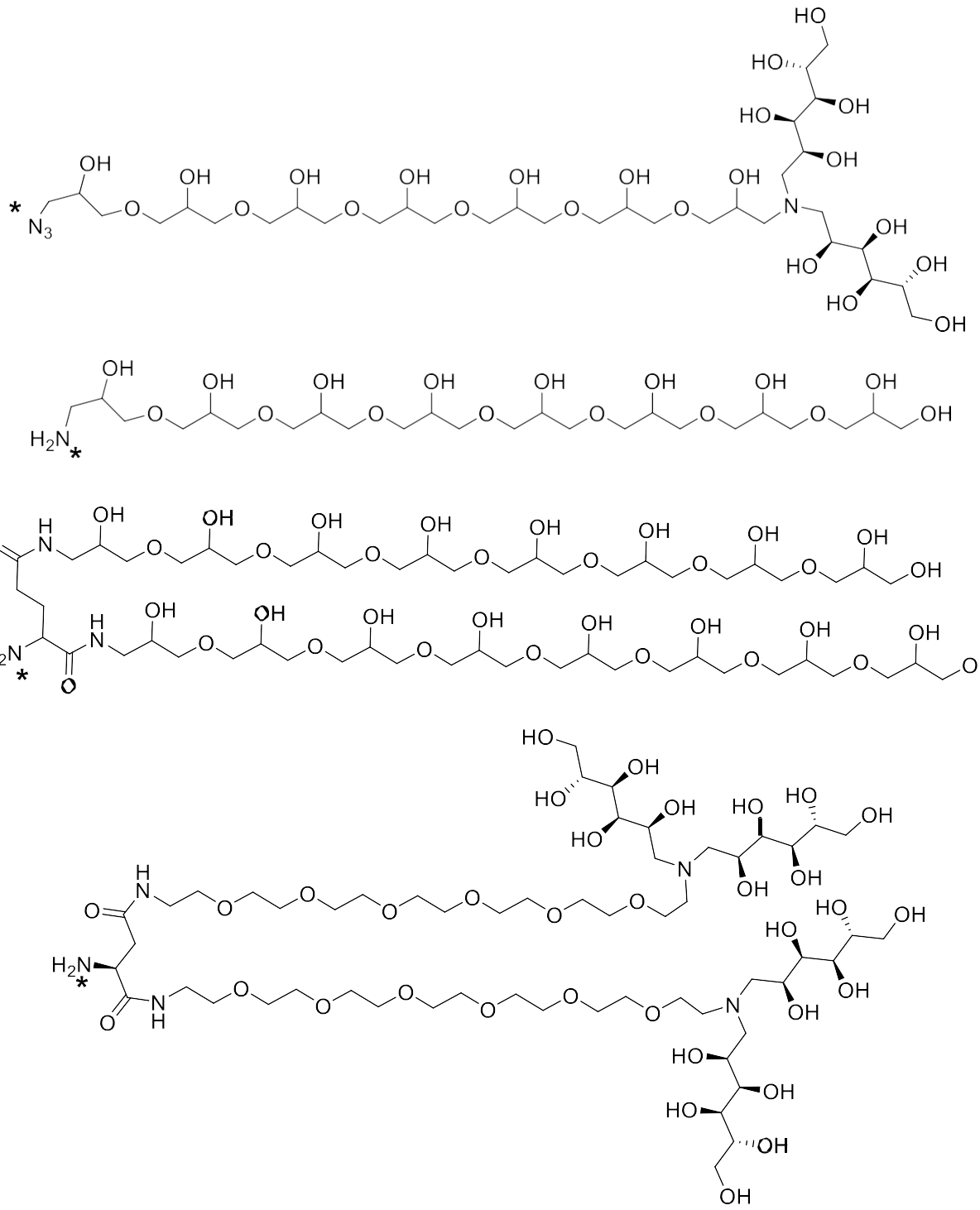


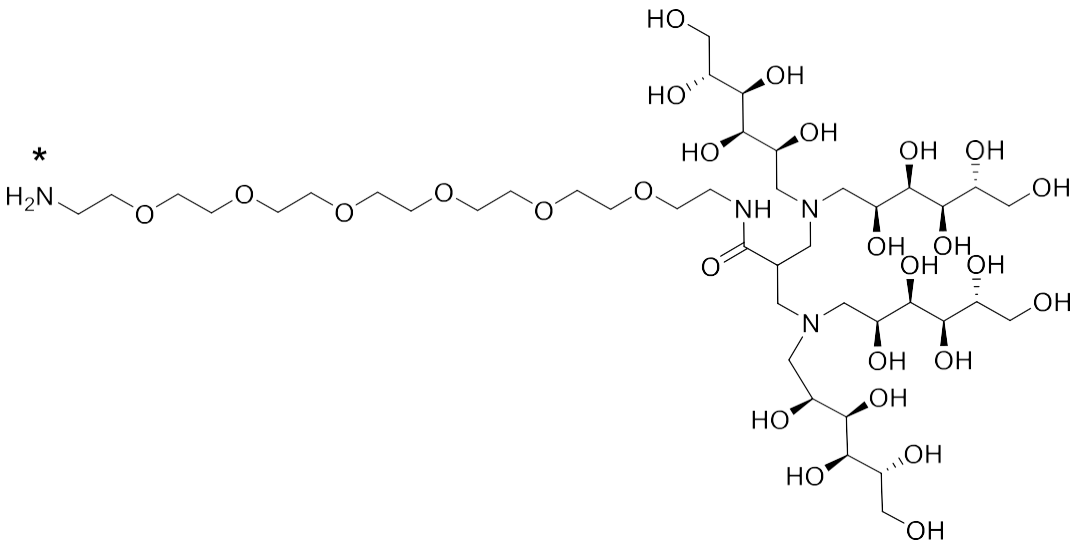


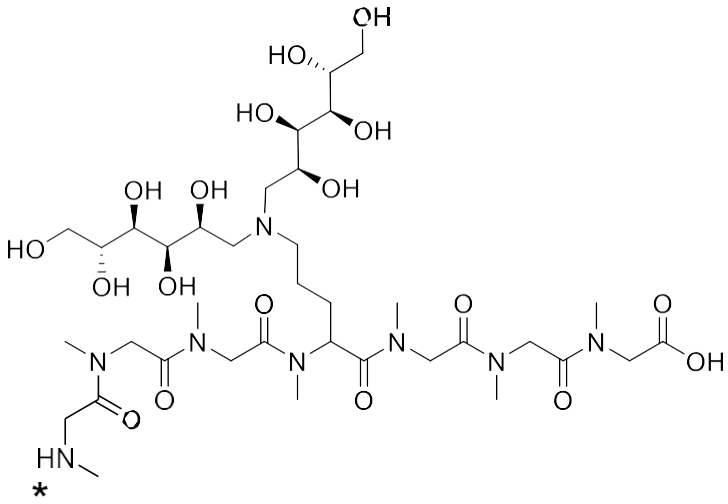


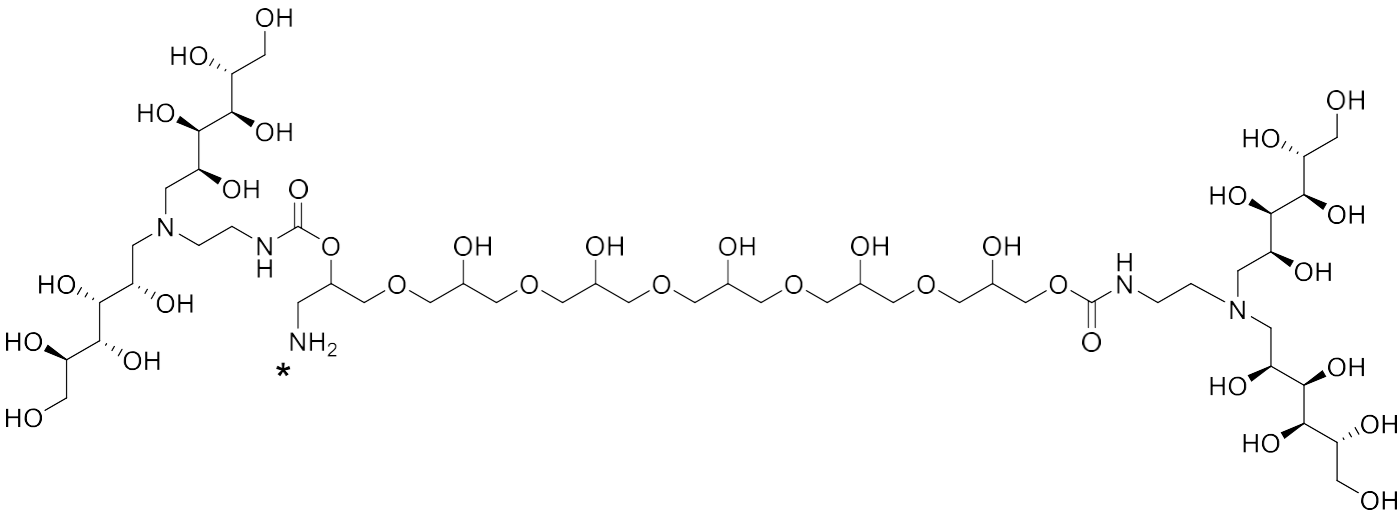


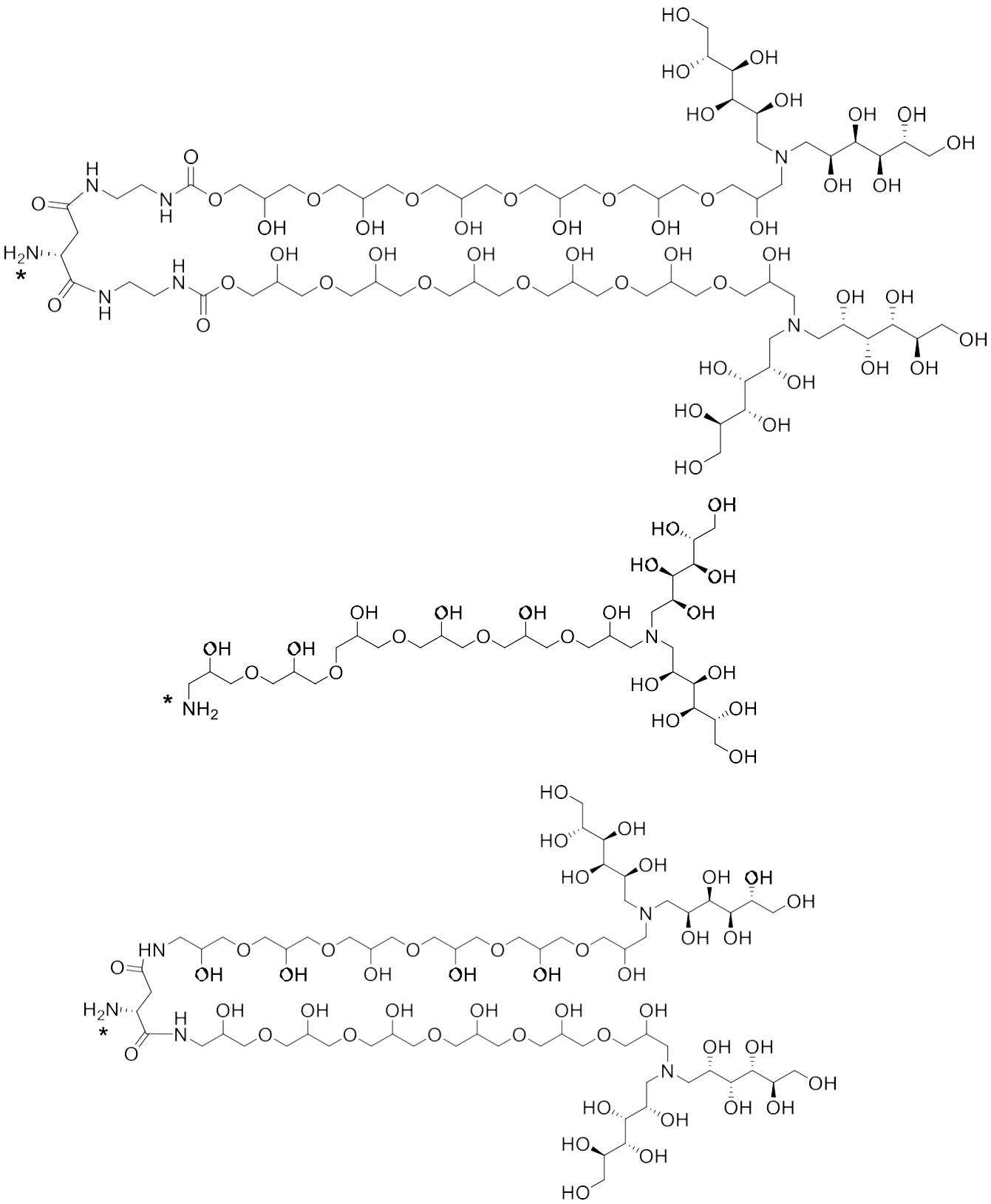


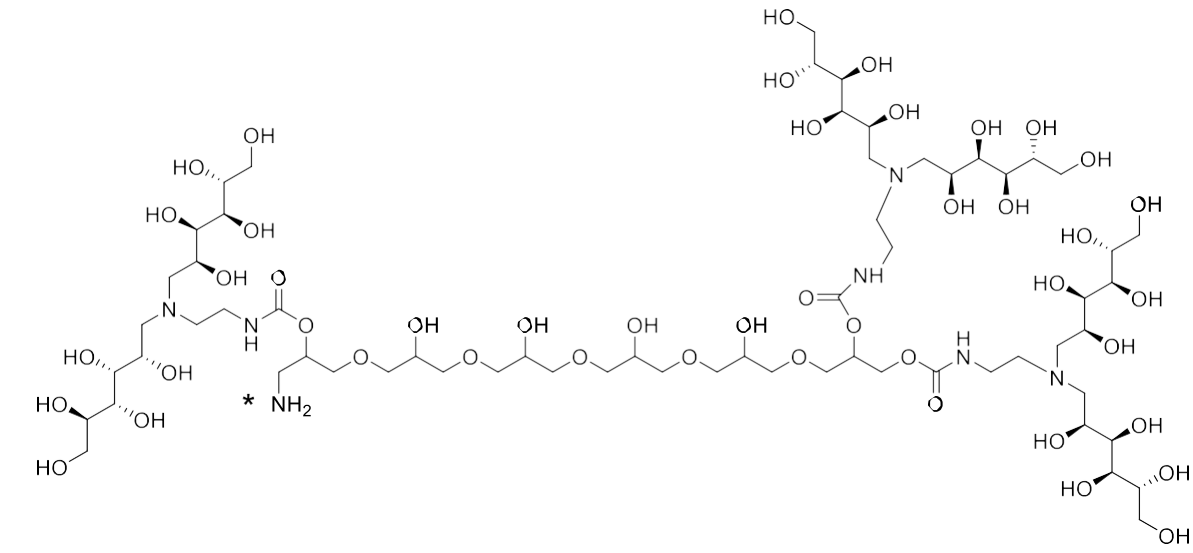


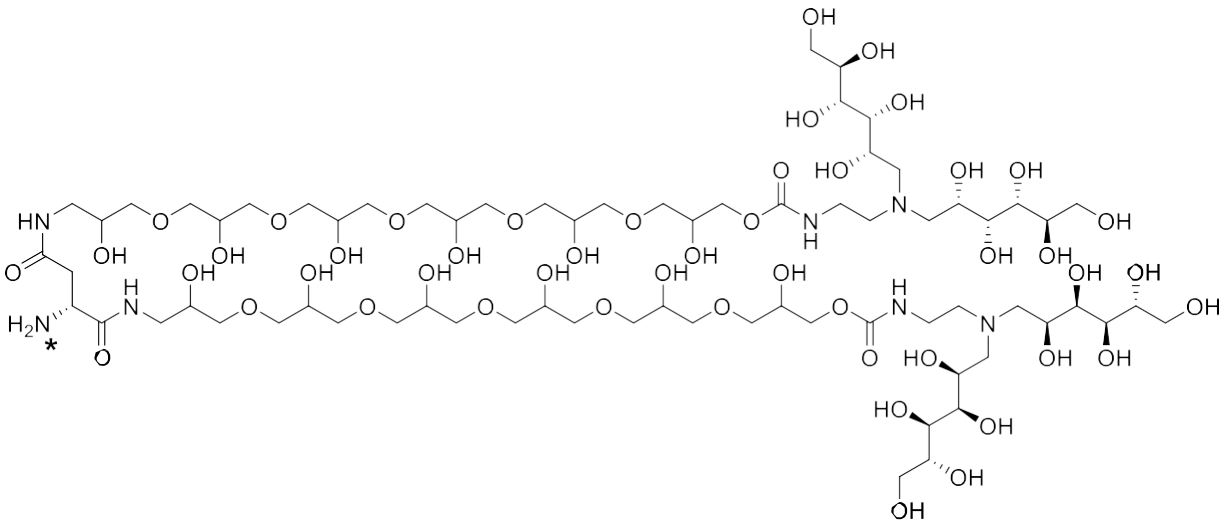


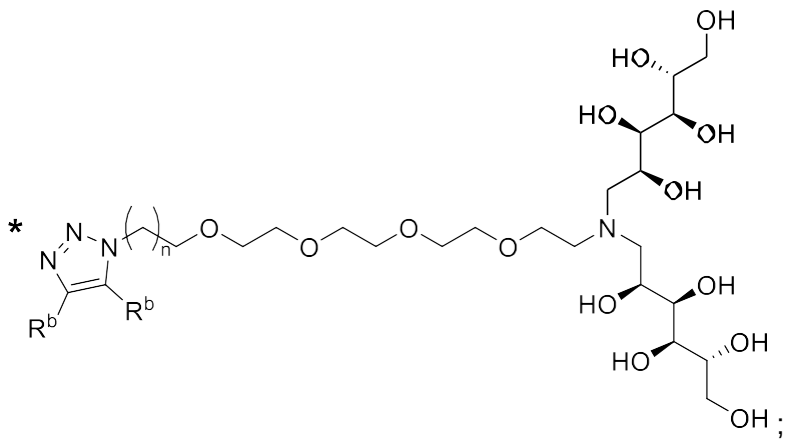


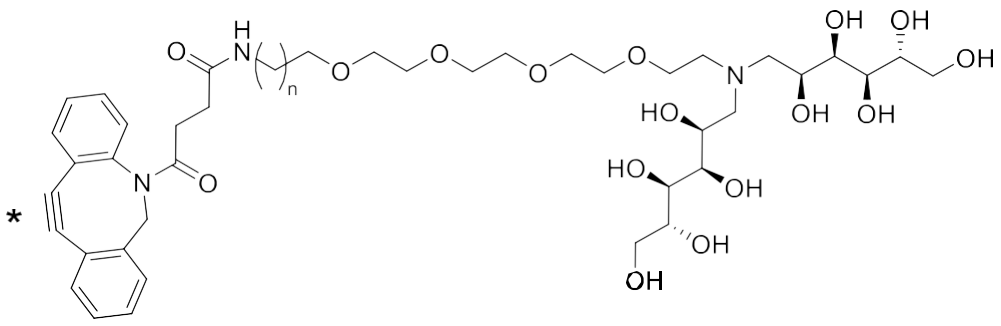




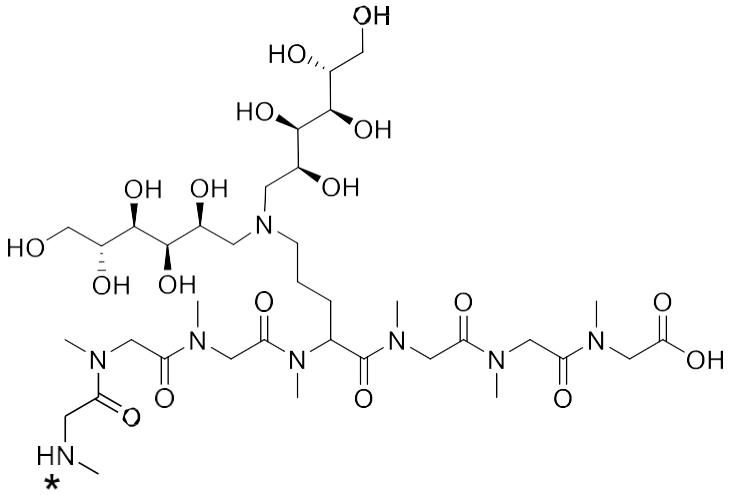




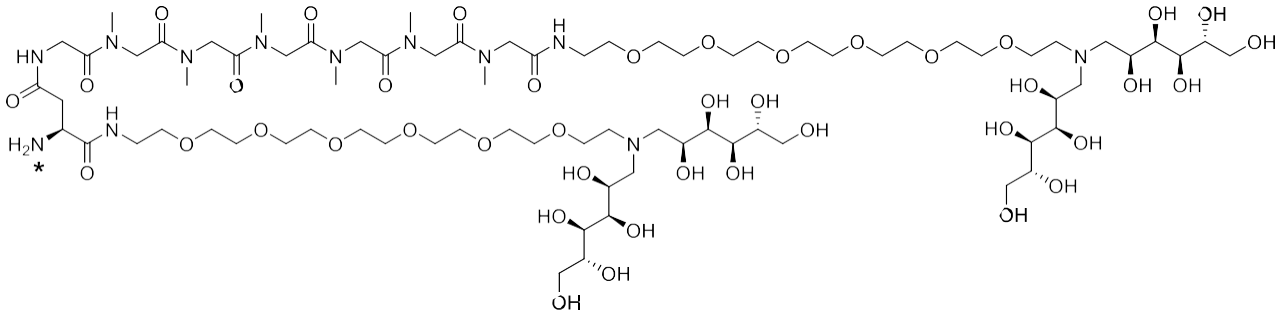




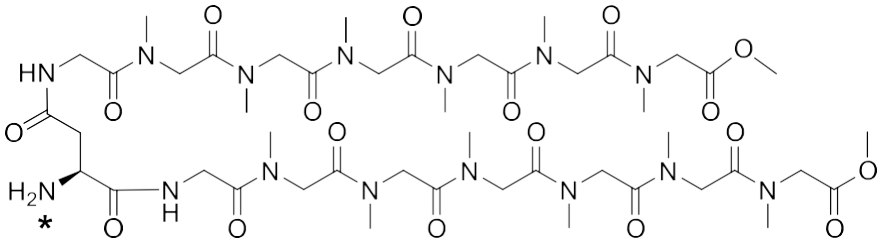
;



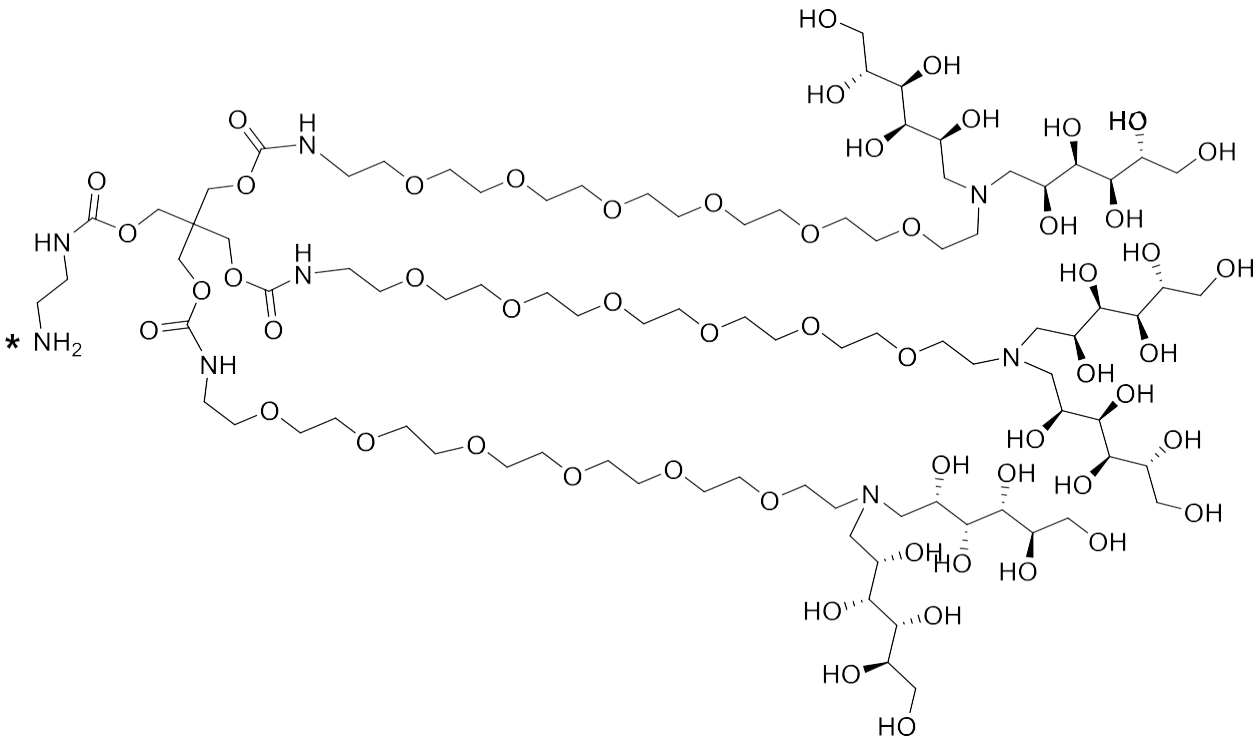
;



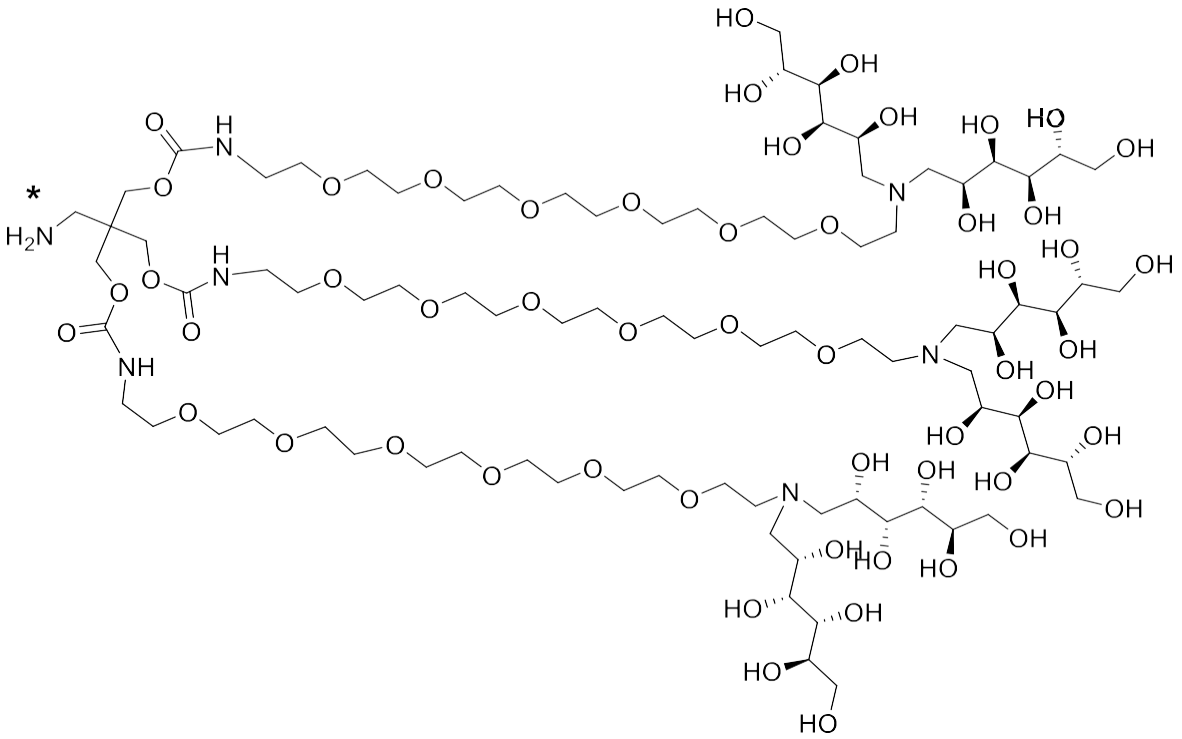
;



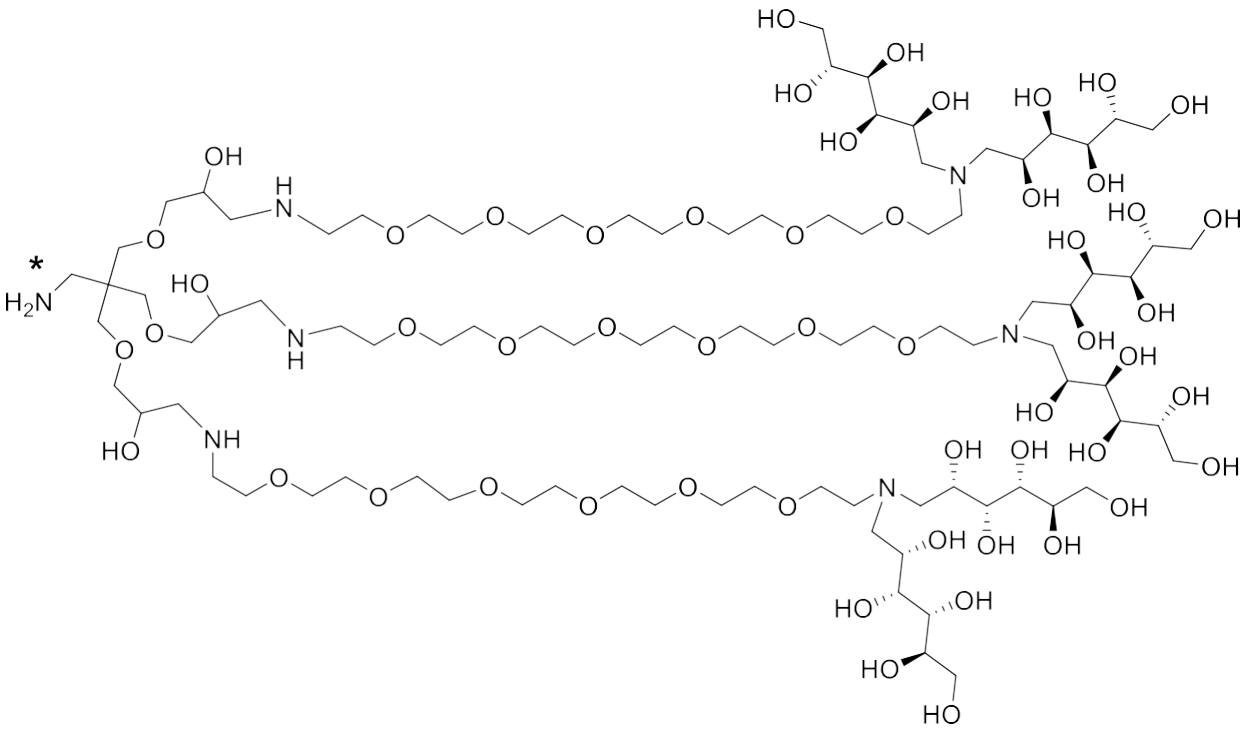
;



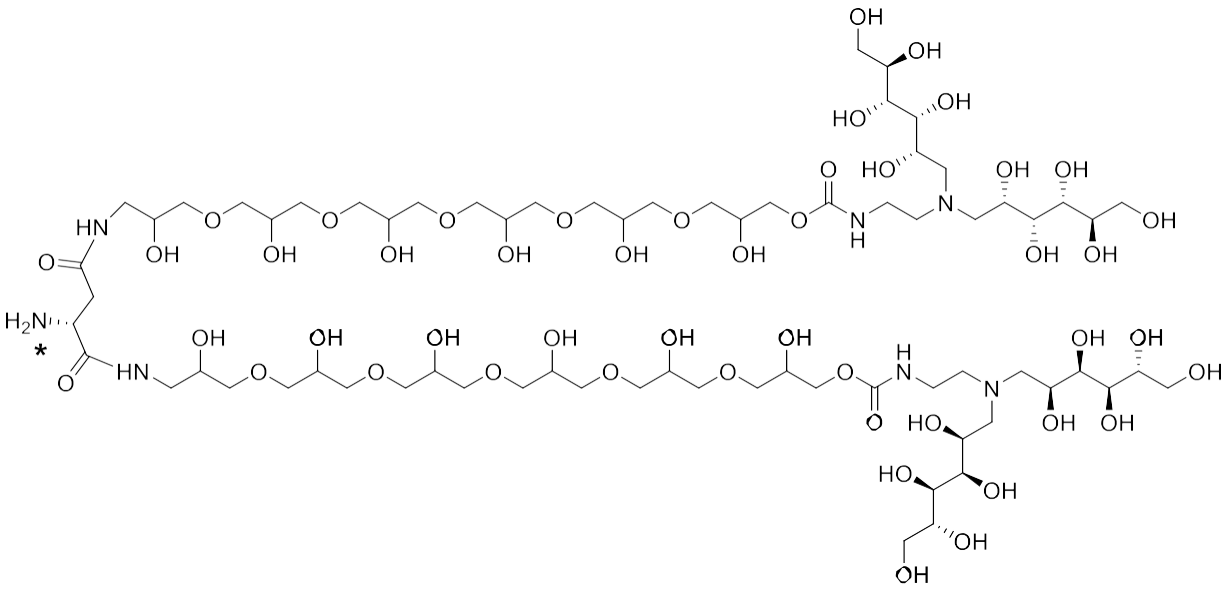
;



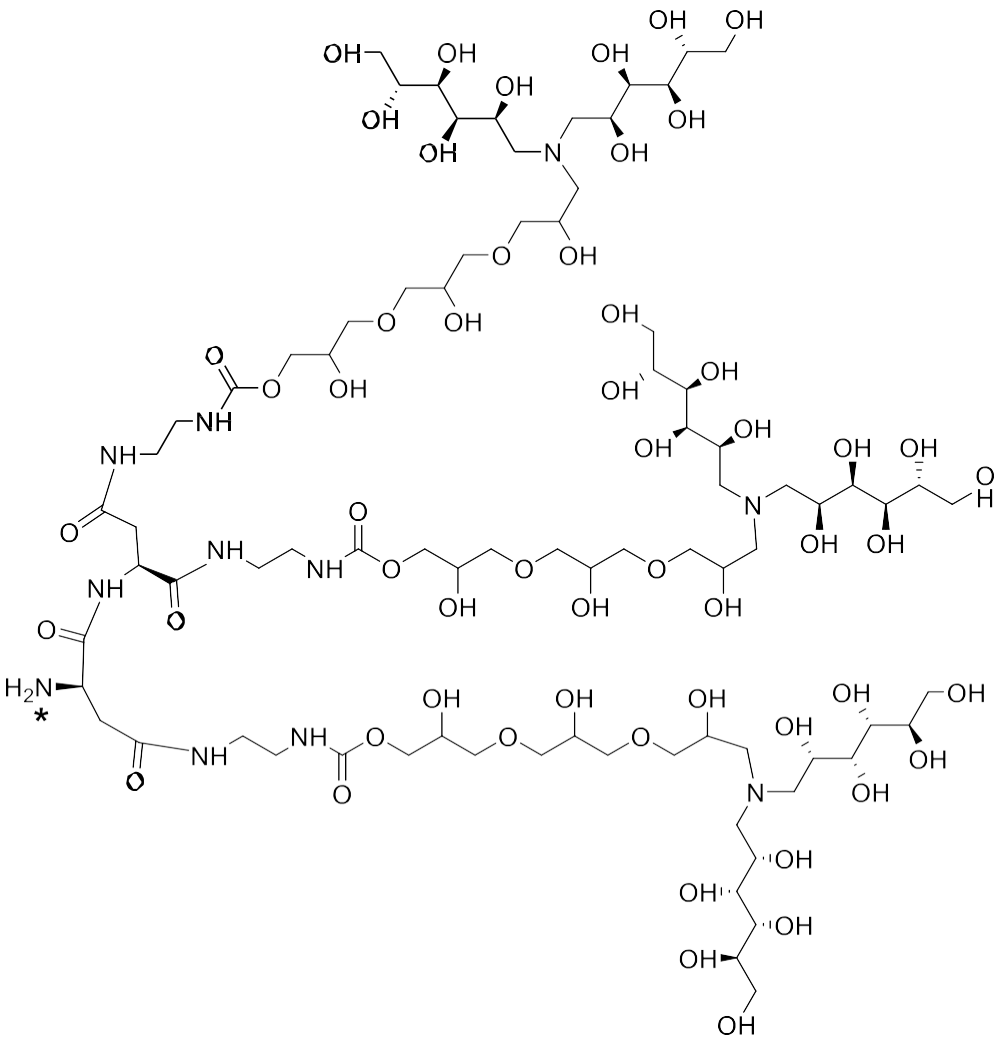
;



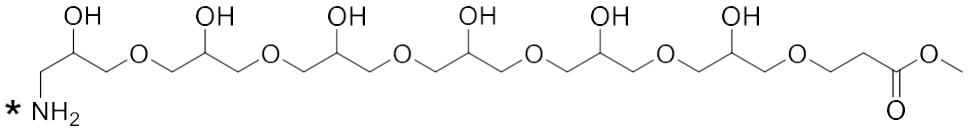
;



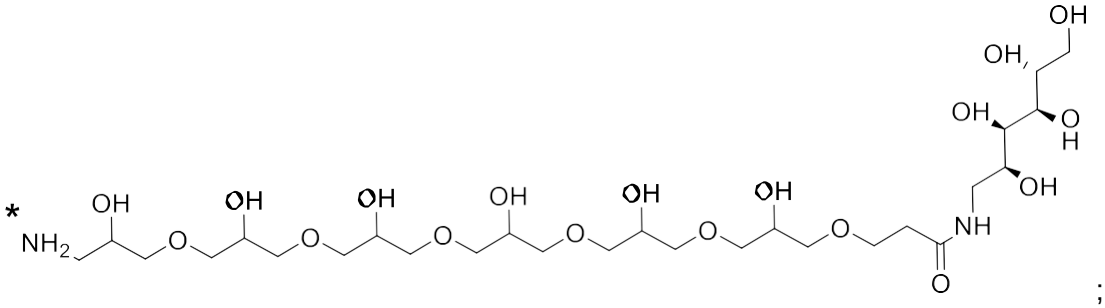
;



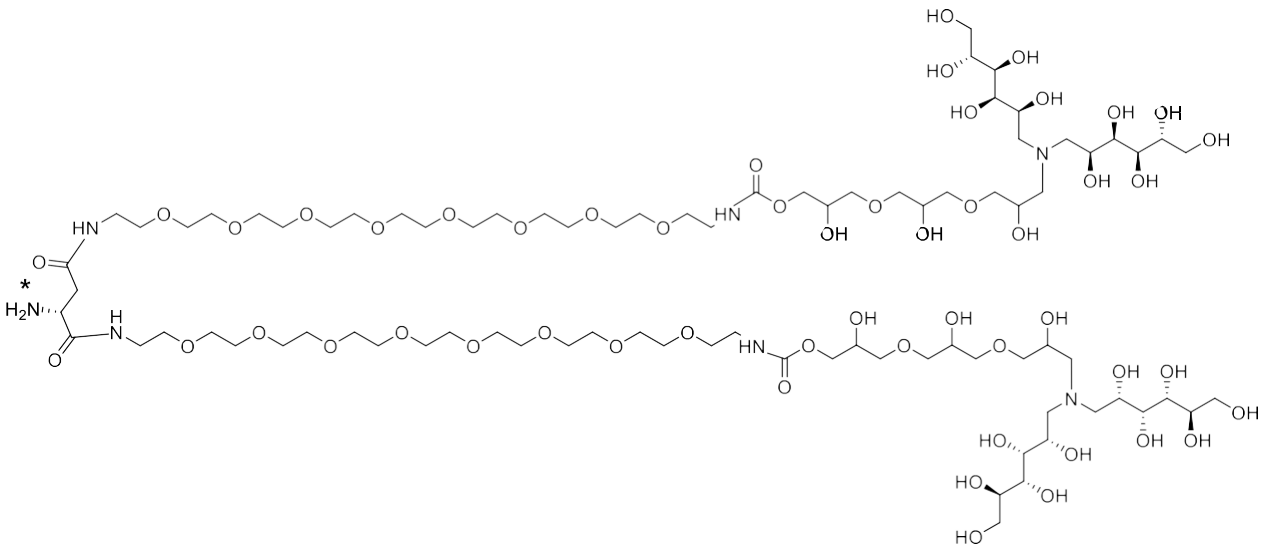
;



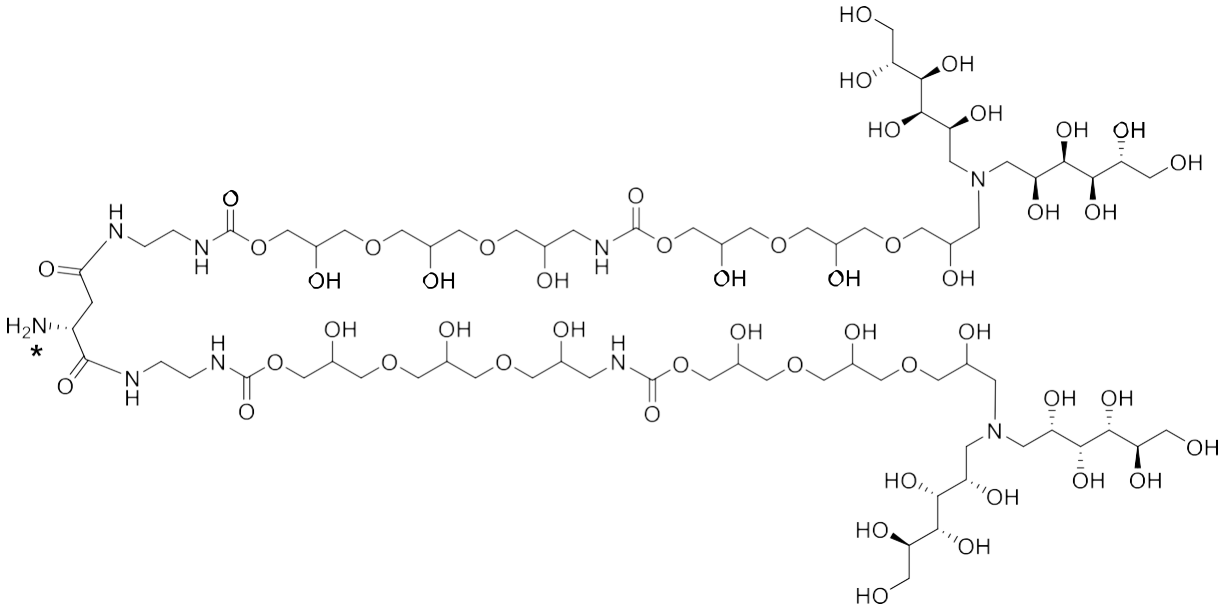
;

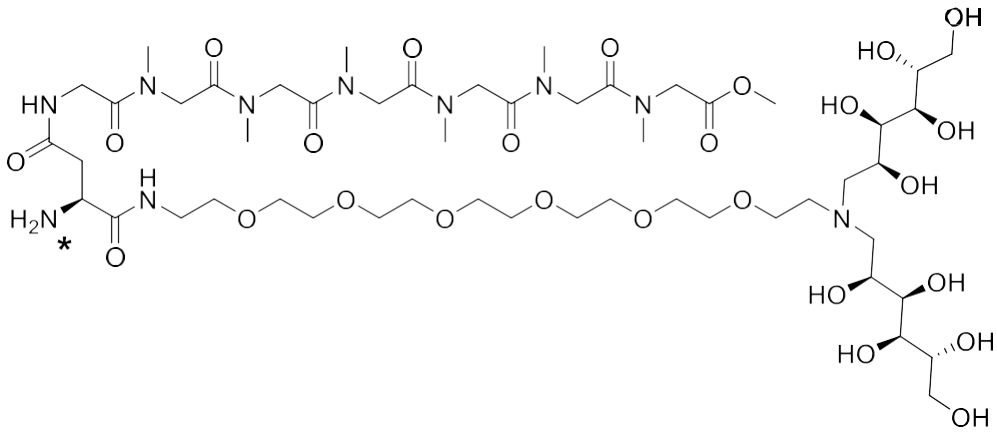


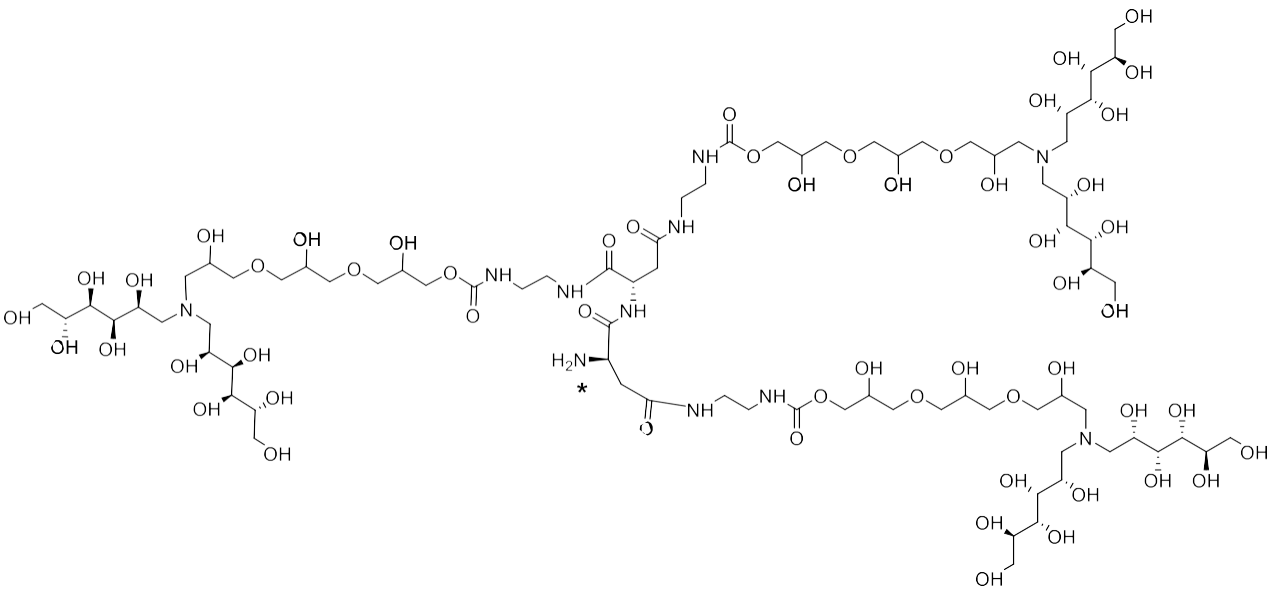
;

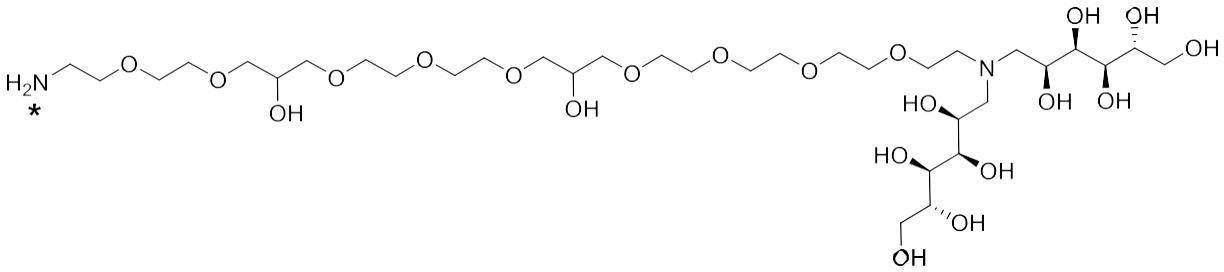


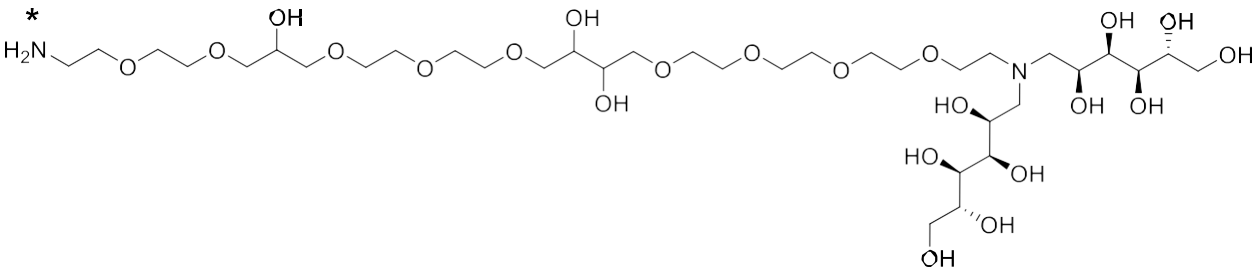
;

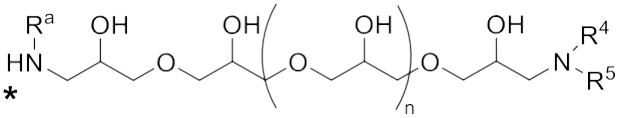


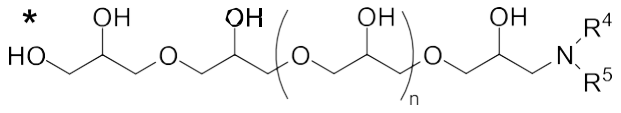


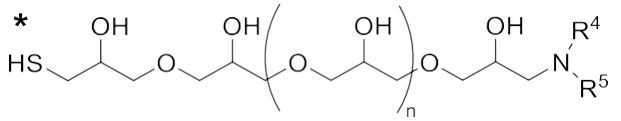


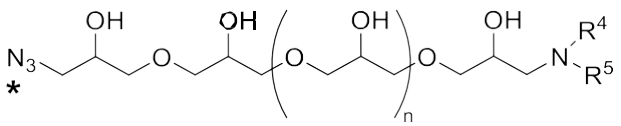


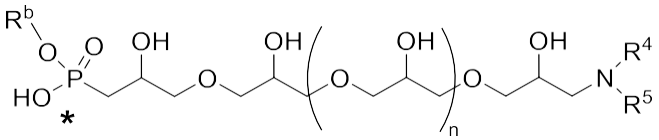


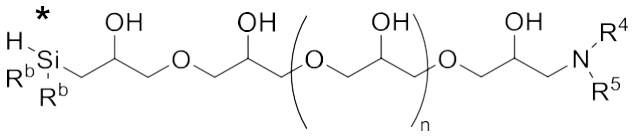


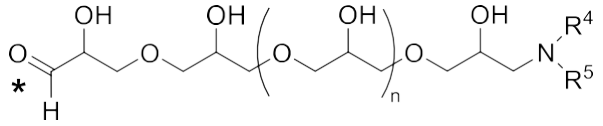


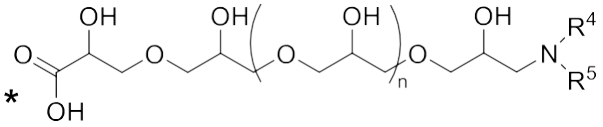


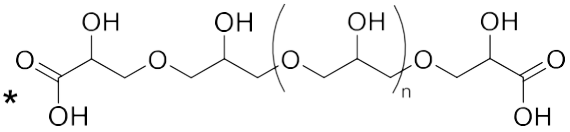


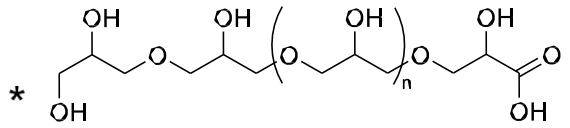


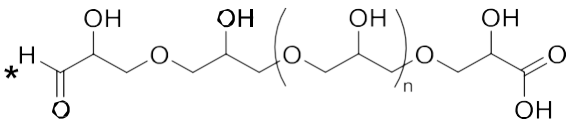


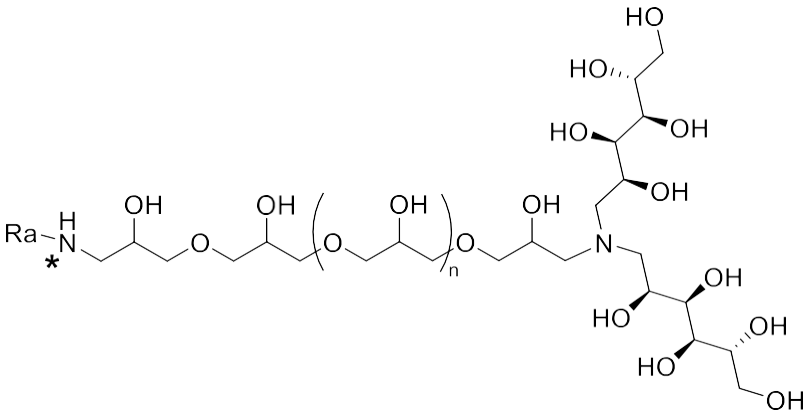


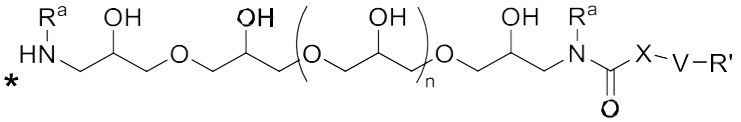


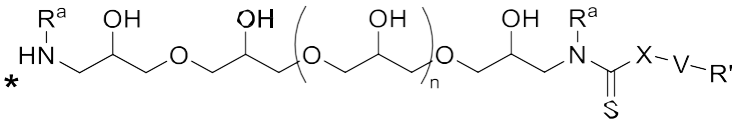


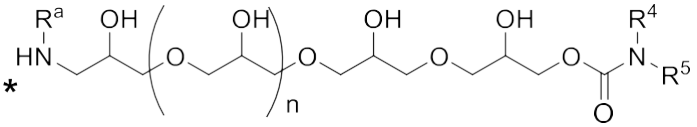


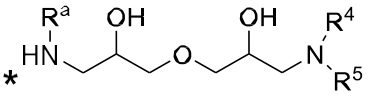


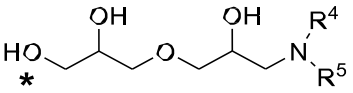


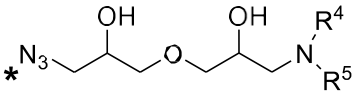


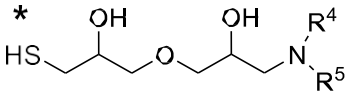


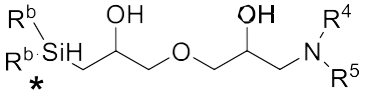


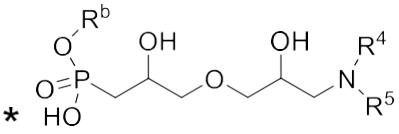


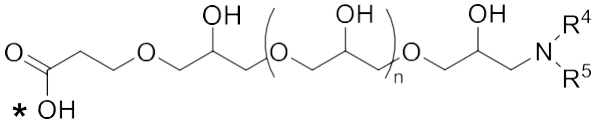


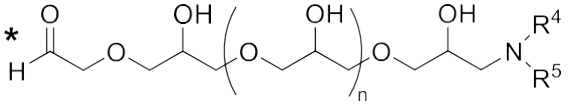


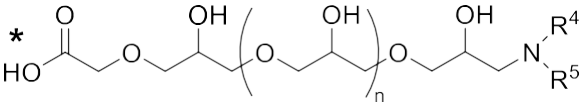


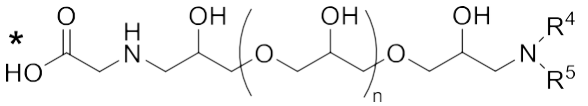


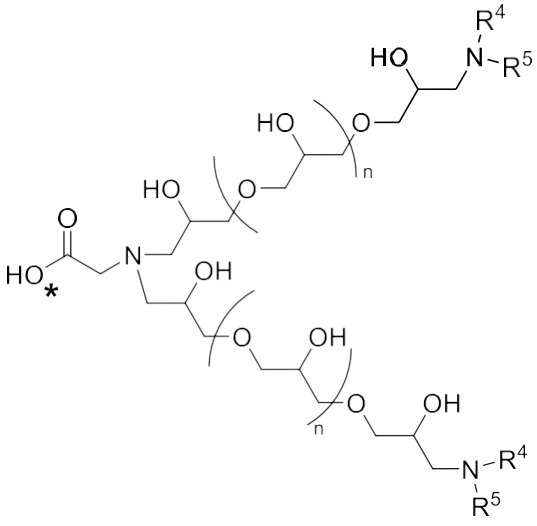


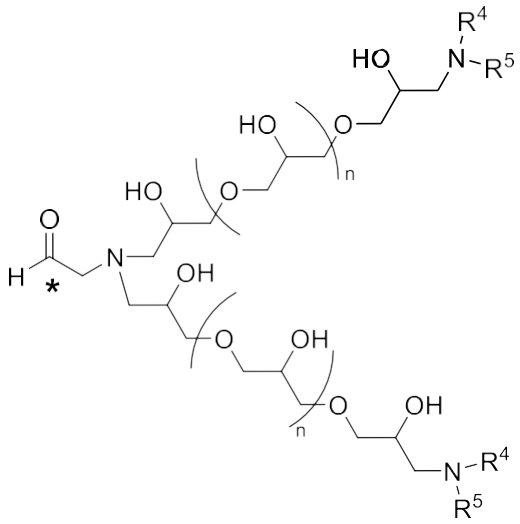


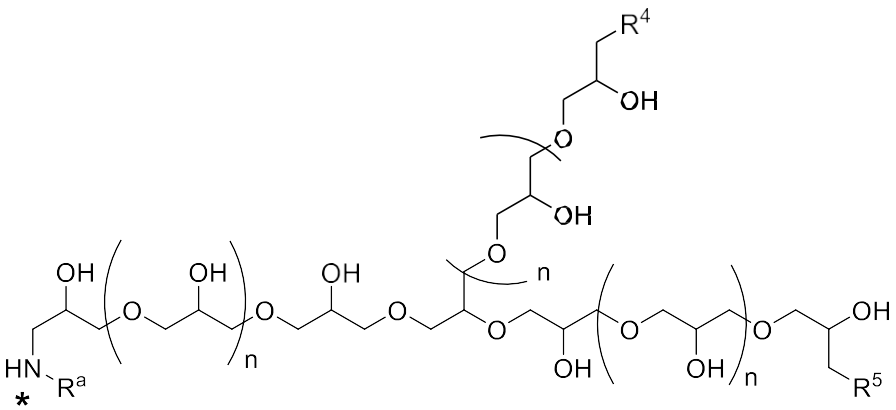


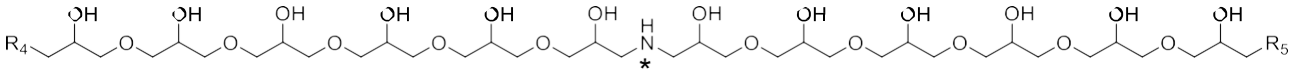


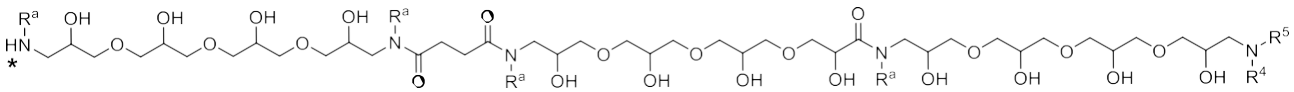


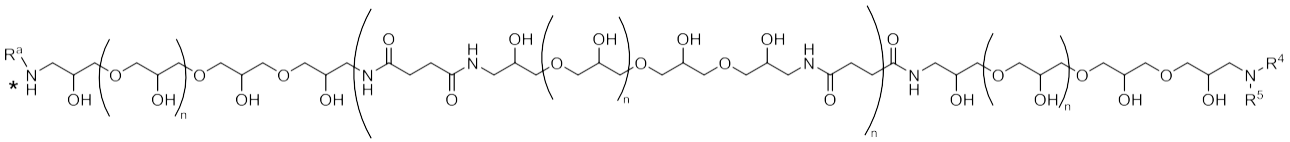


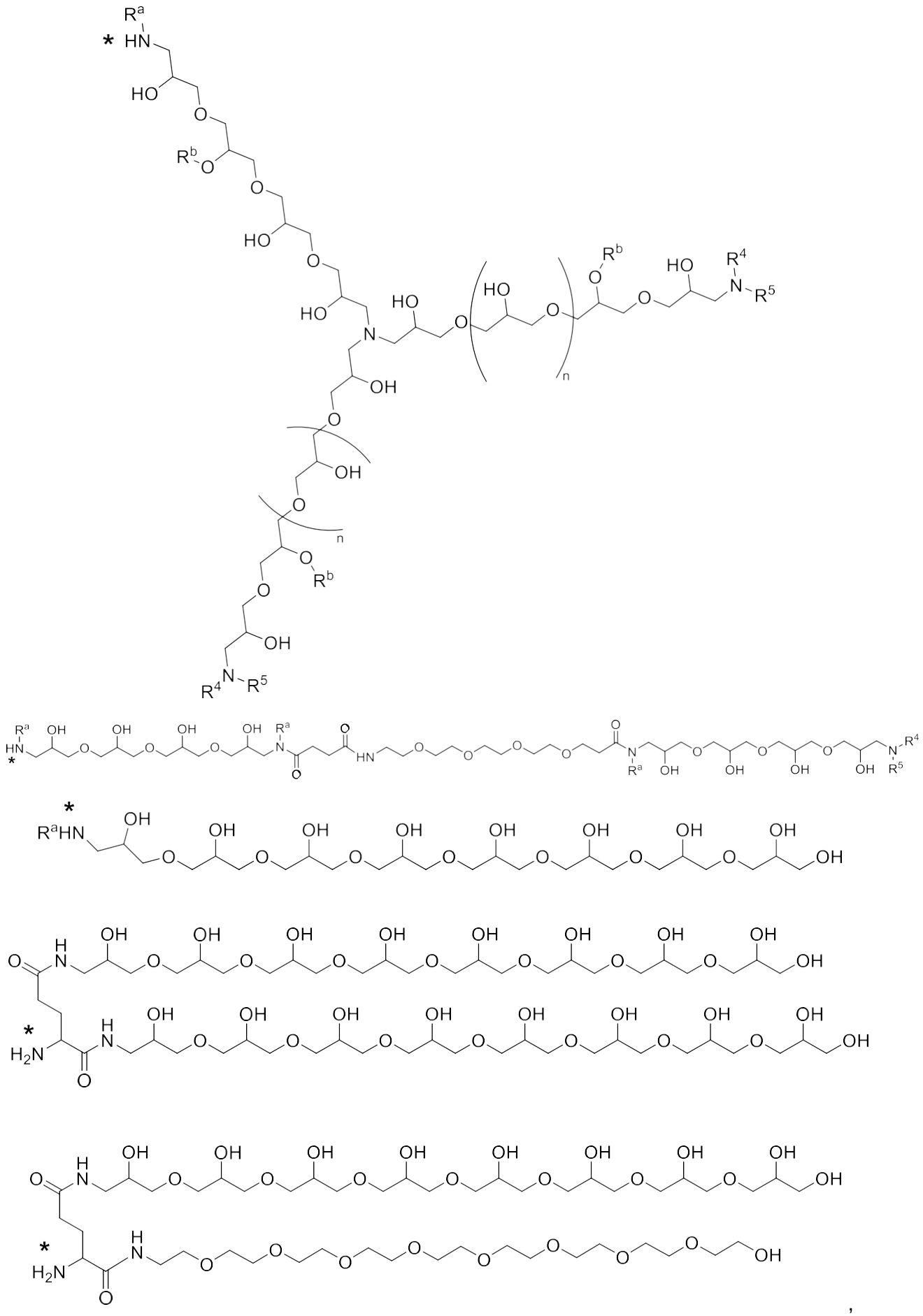




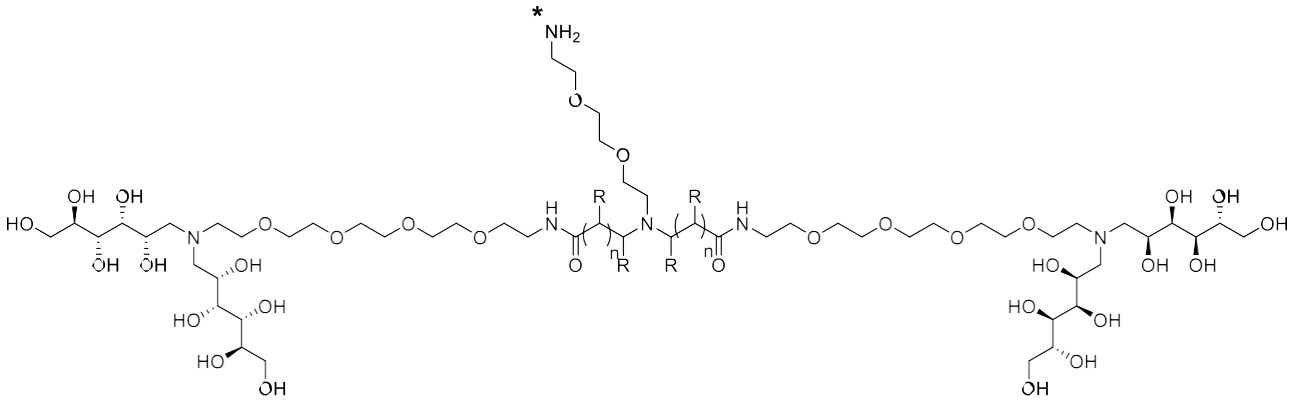




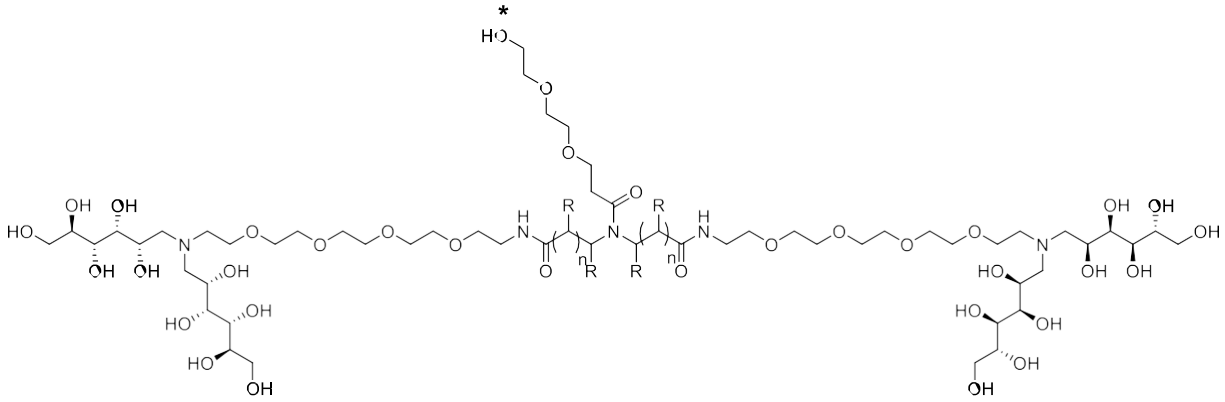




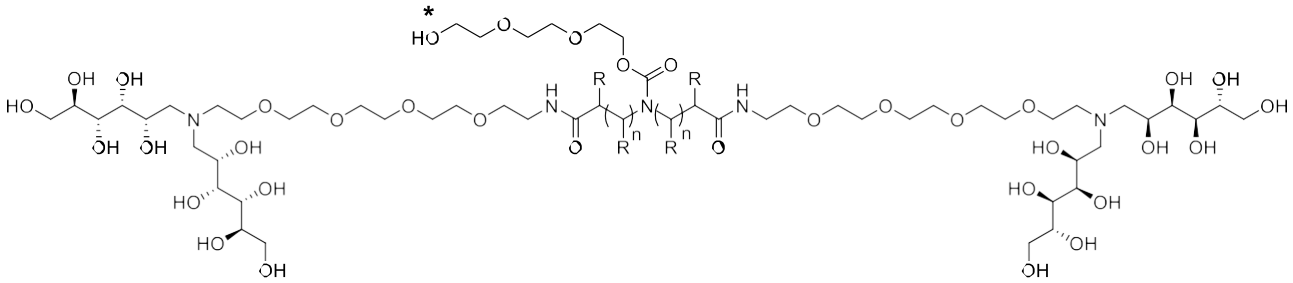
,



,



,



donde:

(*) indica el sitio de unión al sitio R^b, o al grupo enzimáticamente escindible;

cada R es independientemente H o C_1-C_6 alquilo;

R' es H, C_1-C_6 alquilo, -N(R^{24})(R^{25}) o -CO_2H;

cada n es independientemente entre 1 y 12;

X es O, NR o -CH_2-;

V es un enlace o C_1-C_6 alquilo;

uno de R^{24} y R^{25} se selecciona entre H; grupo polihidroxilo; grupo polihidroxilo sustituido; grupo -C(O)-polihidroxilo; grupo -C(O)-polihidroxilo sustituido; -C(O)-C_1-C_8 alquilo sustituido; un quelante; y -C(O)-R^{28}, donde R^{28} es una unidad sacárido de fórmula (XII) o (XIII); y el otro de R^{24} y R^{25} se selecciona entre H; grupo polihidroxilo; grupo polihidroxilo sustituido; grupo -C(O)-polihidroxilo; grupo -C(O)-polihidroxilo sustituido; -C(O)-C_1-C_8 alquilo sustituido; un quelante; -C(O)-R^{28}, donde R^{28} es una unidad sacárido de fórmula (XII) o (XIII); y polietilenglicol, que tiene opcionalmente entre 1 y 24 subunidades etilenglicol, con la condición de que R^{24} y R^{25} no son

ambos H.

45. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 1-6, que comprende un grupo polar que tiene una fórmula seleccionada entre:

(a) $\sim R^{40}\text{-}(R^{43}\text{-}R^{41}\text{-}[O\text{-}CH_2\text{-}CH_2]_{n40}\text{-}R^{46}\text{-}[O\text{-}CH_2\text{-}CH_2]_{n40}\text{-}R^{42}\text{-}R^{43}\text{-}(NR^{44}R^{45})_{n41})_{n42}$

(XLIII)

o un estereoisómero o sal de la misma, donde:

R^{40} es un grupo de unión al sitio R^b, o al grupo enzimáticamente escindible;

R^{41} y R^{42} son independientemente entre sí un enlace o C_1-C_6 alquileno;

cada R^{43} se selecciona independientemente entre un enlace, C_1-C_{12} alquileno, -OC_1-C_{12} alquileno, -C(=O)-, -NH-C_1-C_{12} alquileno, -C_1-C_{12} alquileno-NH-, -C(O)-C_1-C_{12} alquileno, -C_1-C_{12} alquileno-C(O)-, -NH-C_1-C_{12} alquileno-C(O)-, -C(O)-C_1-C_{12} alquileno-NH-, -NH-C(O)-NH-, -NH-C(O)-, -NH-C(O)-C_1-C_{12} alquileno, -C(O)-NH-C_1-C_{12} alquileno, C_1-C_{12}alquileno-NH-C(O)-, -heteroarileno, heteroaril-C_1-C_{12} alquileno, heteroaril-C_1-C_{12} alquileno-C(O)-, o -C(O)$NR^{46}R^{47}$, donde uno de R^{46} y R^{47} es H o C_1-C_{12} alquileno y el otro es C_1-C_{12} alquileno;

R^{44} y R^{45} son independientemente entre sí H, grupo polihidroxilo, grupo polihidroxilo sustituido, grupo -C(O)-polihidroxilo, o grupo -C(O)-polihidroxilo sustituido, donde los sustituyentes opcionales se seleccionan entre sulfato, fosfato, alquilsulfato, y alquilfosfato, con la condición de que R^{44} y R^{45} no son ambos H;

cada R^{46} se selecciona independientemente entre -NR^{50}-, -NR^{50}-C_1-C_6alquileno-NR^{50}-, -NR^{50}-C(O)-NR^{50}-$S(O)_2$-NR^{50}- o -NR^{50}-C(O)-$C_{1\text{-}6}$alquileno-;

cada R^{50} se selecciona independientemente entre H, C_1-C_6 alquilo, o grupo polihidroxilo;

cada n40 es independientemente entre 2 y 26;

n41 es entre 1 y 6; y

n42 es entre 1 y 6;

(b) $\sim R^{40}\text{-}(R^{51}\text{-}[O\text{-}CH_2\text{-}CH_2]_{n43}\text{-}R^{52}\text{-}X_1\text{-}R^{55}\text{-}X_2\text{-}R^{53}\text{-}[O\text{-}CH_2\text{-}CH_2]_{n43}\text{-}R^{54}\text{-}[X_3\text{-}R^{56}]_{n44}\text{-}R^{57})_{n45}$

(XLIV)

o un estereoisómero o sal de la misma, donde:

R^{40} es un grupo de unión al sitio R^b, o al grupo enzimáticamente escindible;

R^{51}, R^{52}, R^{53} y R^{54} son independientemente entre sí un enlace o C_1-C_6 alquileno;

X_1, X_2 y X_3 son independientemente entre sí -NR^N-C(O)- o -C(O)-NR^N-;

cada R^N independientemente representa H, C_1-C_6 alquilo, o grupo polihidroxilo;

R^{55} y R^{56} representan independientemente en cada caso un grupo polihidroxilo bivalente;

R^{57} es H, OH o C_1-C_6 alquilo;

cada n43 es independientemente entre 0 y 26, con la condición de que por lo menos un

n43 es entre 1 y 26;

n44 es entre 0 y 10; y

n45 es 1 o 2; o

(c) $\sim R^{40}\text{-}R^{51}\text{-}[O\text{-}CH_2\text{-}CH_2]_{n43}\text{-}R^{52}\text{-}N\text{-}(R^{53}\text{-}X_1\text{-}R^{54}\text{-}[O\text{-}CH_2\text{-}CH_2]_{n43}\text{-}(NR^{44}R^{45}))_2$

(XLV)

o un estereoisómero o sal de la misma, donde:

R^{40} es un grupo de unión al sitio R^b, o al grupo enzimáticamente escindible;

R^{51}, R^{53} y R^{54} son independientemente entre sí un enlace o C_1-C_6 alquileno opcionalmente sustituido;

R^{52} es un enlace, C_1-C_6 alquileno, -C(O)- o -O-C(O)-;

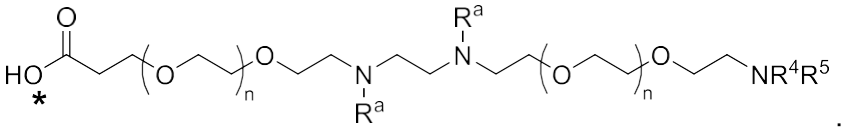
cada X_1 es independientemente $-NR^N\text{-}C(O)-$ o $-C(O)\text{-}NR^N-$;

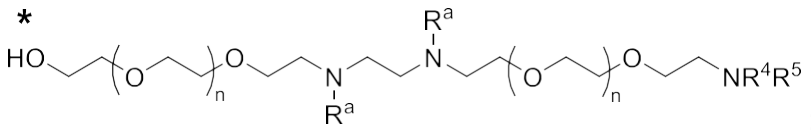
cada R^N independientemente representa H, C_1-C_6 alquilo, o grupo polihidroxilo;

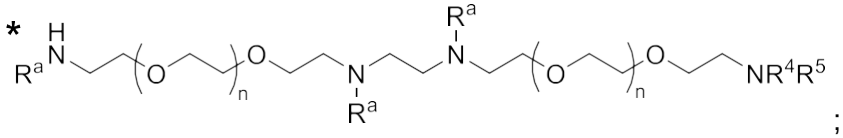
R^{44} y R^{45} son independientemente entre sí H, grupo polihidroxilo, grupo polihidroxilo sustituido, grupo -C(O)-polihidroxilo, o grupo -C(O)-polihidroxilo sustituido, donde los sustituyentes opcionales se seleccionan entre sulfato, fosfato, alquilsulfato, y alquilfosfato, con la condición de que R^{44} y R^{45} no son ambos H; y

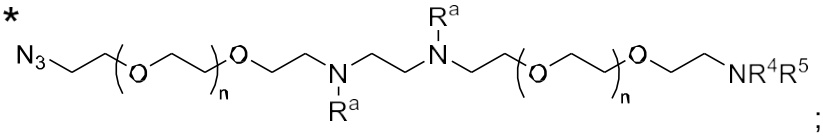
cada n43 es independientemente entre 2 y 26.

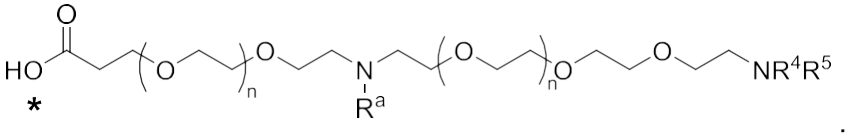
46. El compuesto conector de la reivindicación 45, que comprende un grupo polar que tiene una de las siguientes estructuras antes de unirse al grupo enzimáticamente escindible y/o a la unidad conectora:

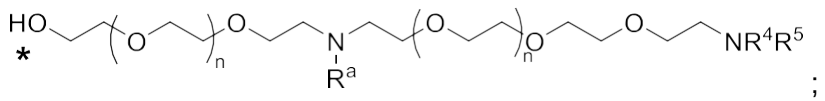

;

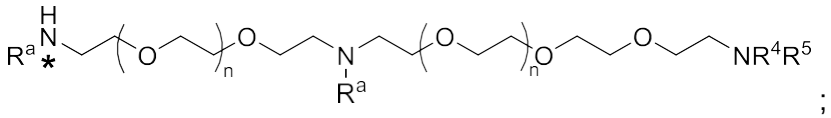

;

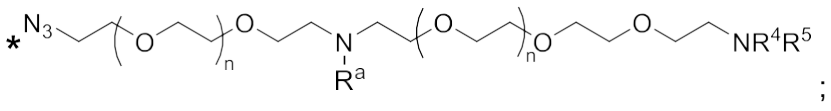

;

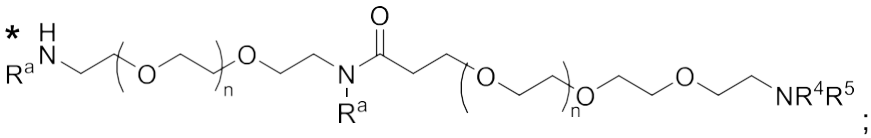

;

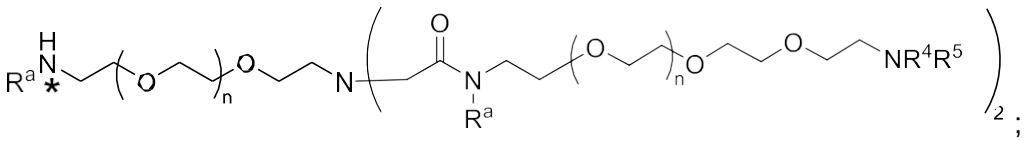

;

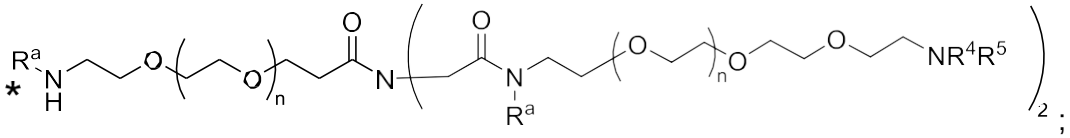

;

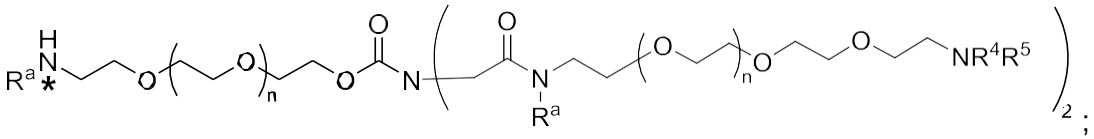

;

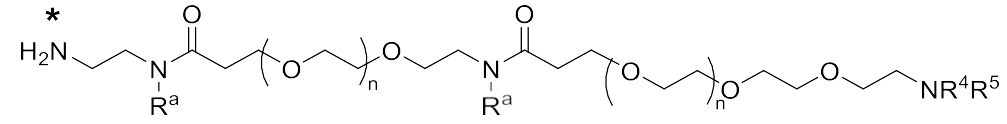

;

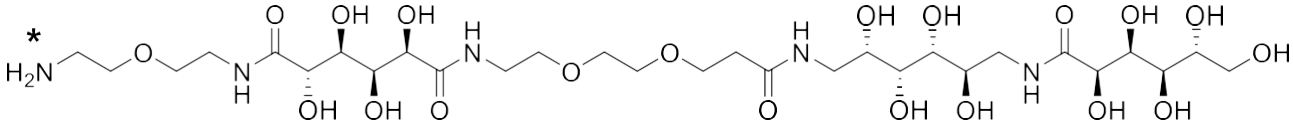

;


;


;


; o





donde:

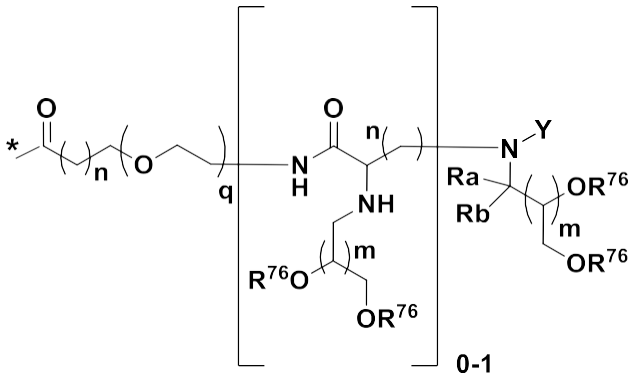
(*) indica el sitio de unión al sitio R^b, o al grupo enzimáticamente escindible;

cada R es independientemente H, alquilo o grupo polihidroxilo;

R^{44} y R^{45} son independientemente entre sí H, grupo polihidroxilo, grupo polihidroxilo sustituido, grupo -C(O)-polihidroxilo, o grupo -C(O)-polihidroxilo sustituido, donde los sustituyentes opcionales se seleccionan entre sulfato, fosfato, alquilsulfato, y alquilfosfato, con la condición de que R^{44} y R^{45} no son ambos H; y

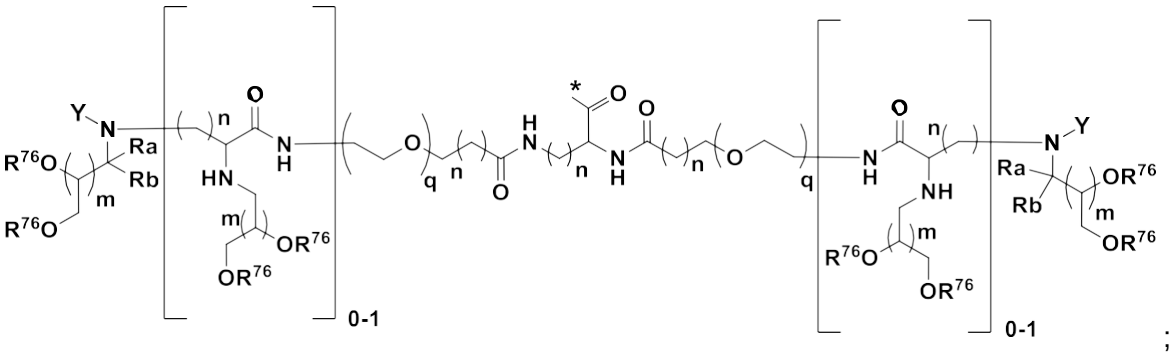
cada n es independientemente entre 1 y 12.

47. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 1-6, que comprende un grupo polar que tiene una fórmula seleccionada entre:



;

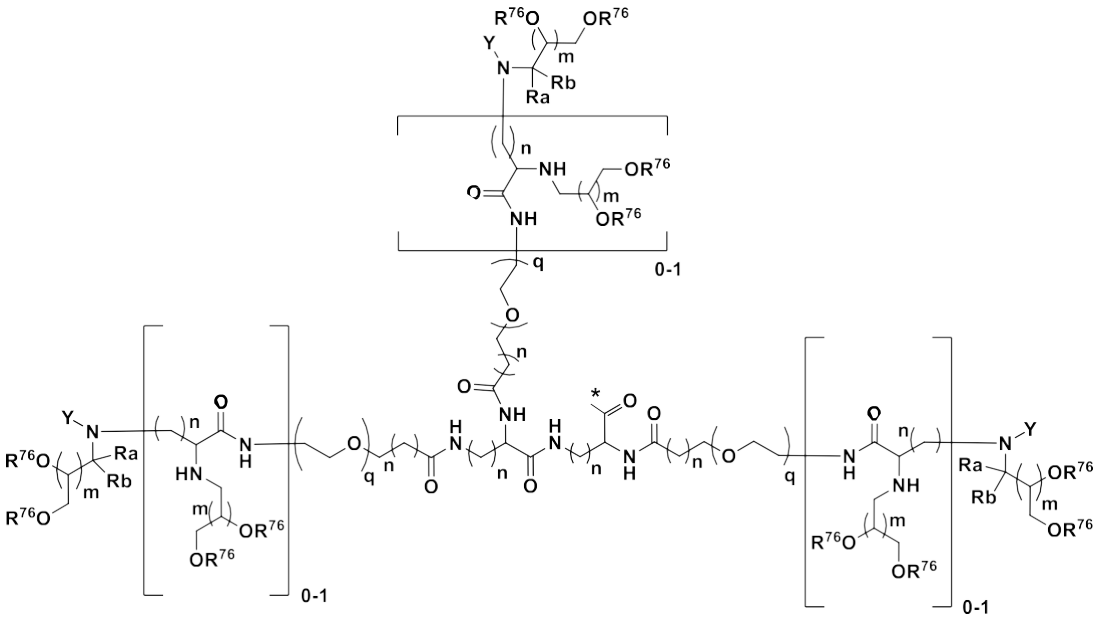
(XVI)



;

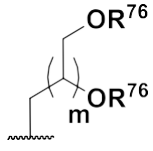
(XVII)

o



; (XVIII)

o un estereoisómero o sal de las mismas, donde:

cada Y es independientemente R^{76} o  ;

cada R^{76} es independientemente H, acetilo, $-P(=O)(OH)_2$, o $-(CH_2)_v-O-S(=O)_2(OH)$;

cada uno de R_a y R_b es independientemente H o R_a y R_b se toman junto con el carbono al que están unidos para formar un grupo oxo;

cada q es independientemente 2-26;

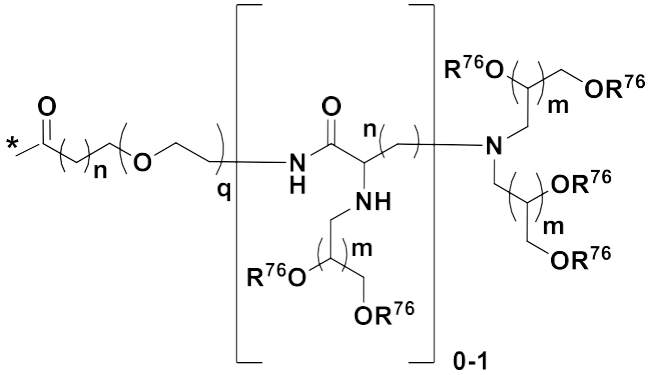
cada m es independientemente entre 1 y 4;

cada n es independientemente entre 1 y 4;

cada v es independientemente entre 1 y 6; y

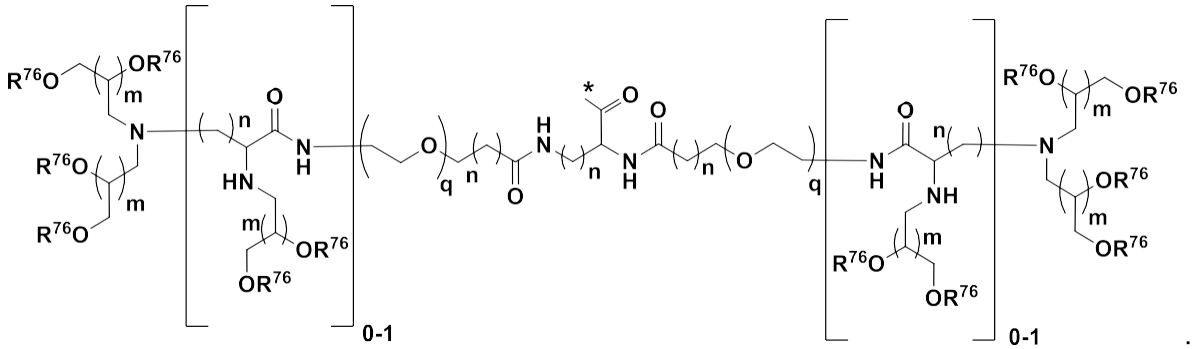
cada * es un sitio de unión a R^b, o al grupo enzimáticamente escindible.

48. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 1-6, que comprende un grupo polar que tiene una fórmula seleccionada entre:



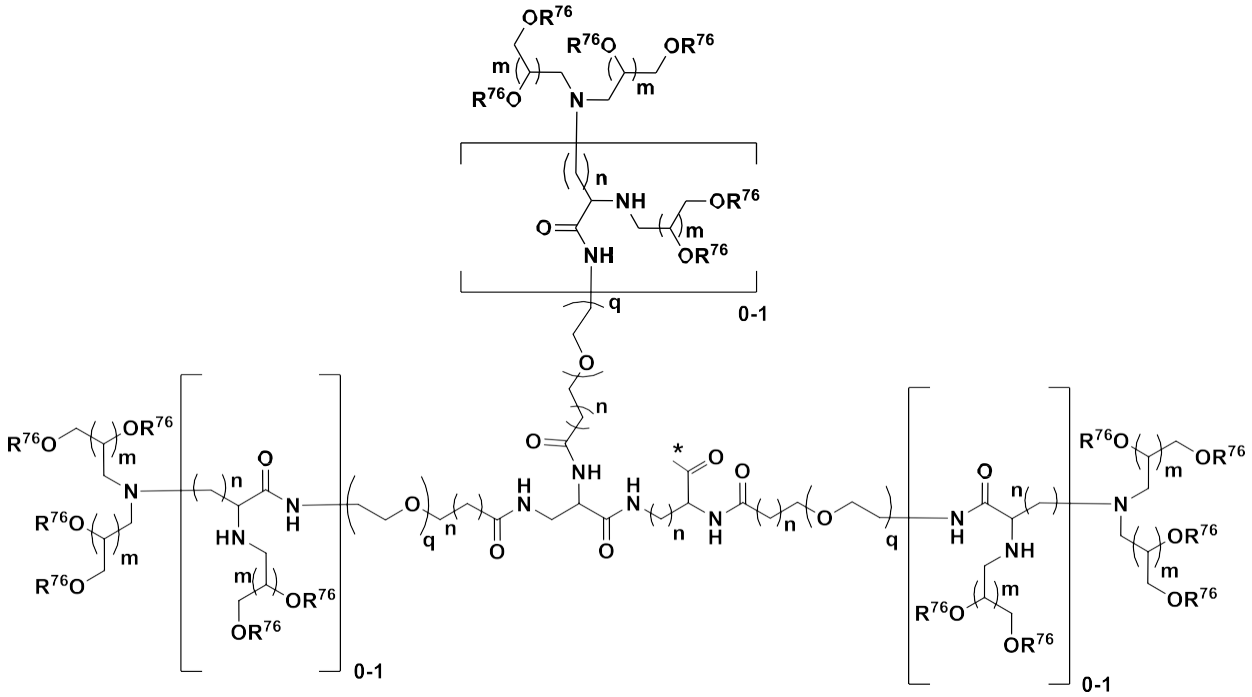
;

(XVIa)



;

(XVIIa) o



(XVIIIa)

o un estereoisómero o sal de las mismas, donde:

cada R^{76} es independientemente H, acetilo, $-P(=O)(OH)_2$, o $-(CH_2)_vS(=O)_2(OH)$;

cada q es independientemente 2-26;

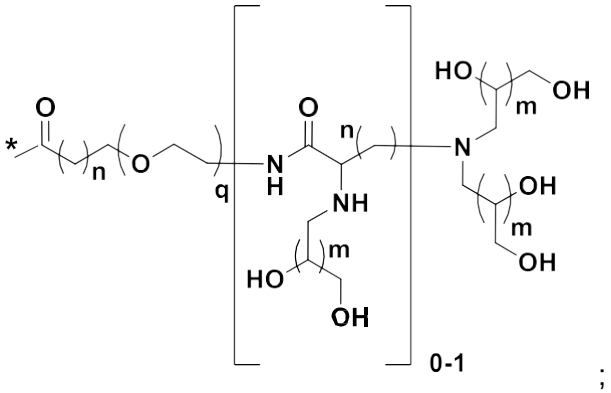
cada m es independientemente entre 1 y 4;

cada n es independientemente entre 1 y 4;

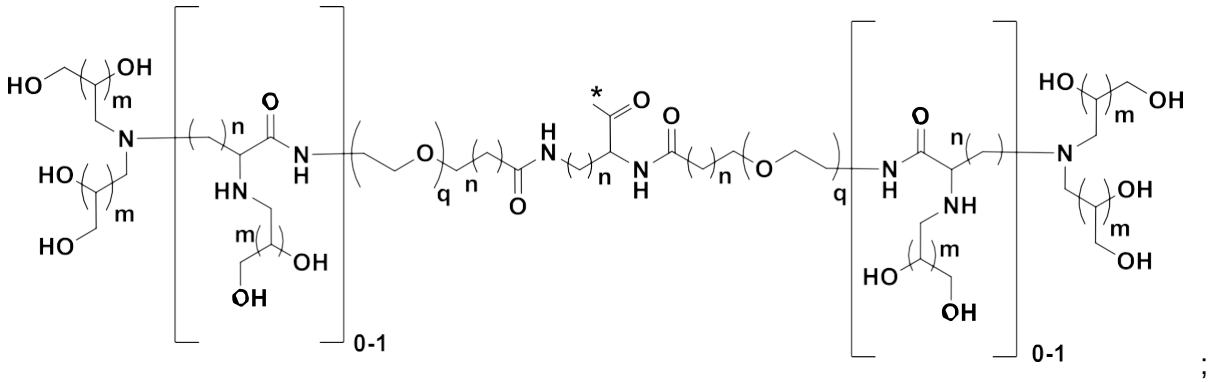
cada v es independientemente entre 1 y 6; y

cada * es un sitio de unión a R^b, o al grupo enzimáticamente escindible.

49. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 1-6, que comprende un grupo polar que tiene una fórmula seleccionada entre:

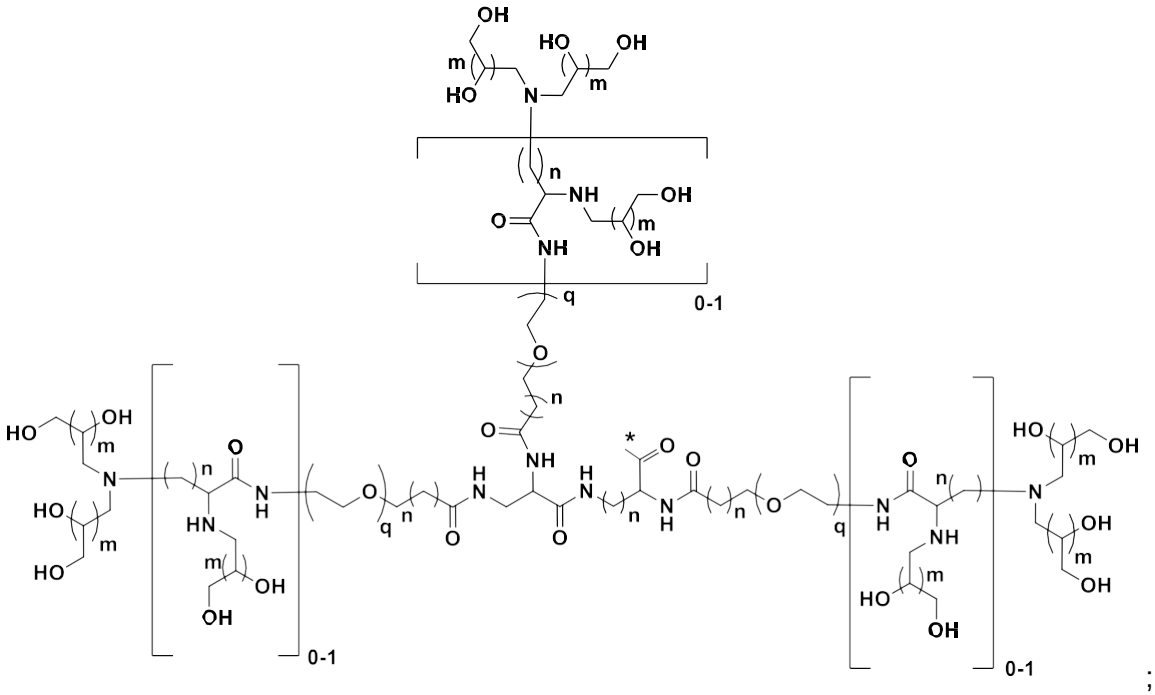


(XVIb)



;

(XVIIb)



;

(XVIIIb)

o un estereoisómero o sal de las mismas, donde:

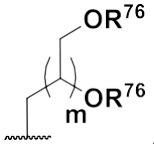
cada q es independientemente 2-26;

cada m es independientemente entre 1 y 4;

cada n es independientemente entre 1 y 4; y

cada * es un sitio de unión a R^b, o al grupo enzimáticamente escindible.

50. El compuesto conector de la reivindicación 47, donde Y es R^{76}.

51. El compuesto conector de la reivindicación 47, donde Y es  .

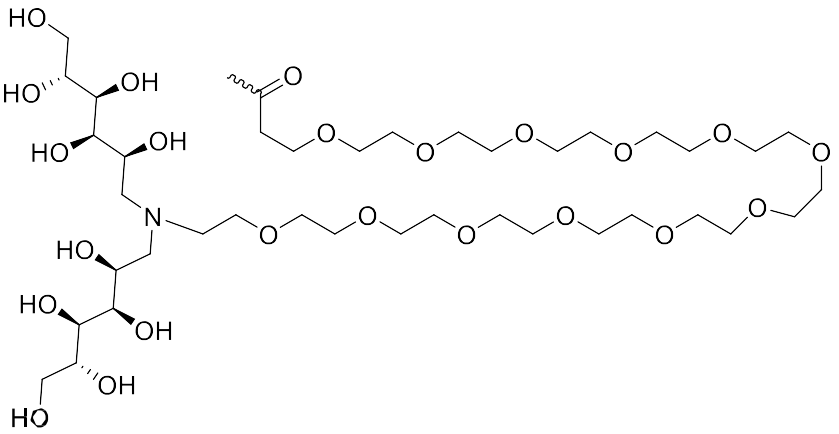
52. El compuesto conector de la reivindicación 47, donde cada uno de R_a y R_b es independientemente H.

53. El compuesto conector de la reivindicación 47, donde R_a y R_b se toman junto con el carbono al que están unidos para formar un grupo oxo.

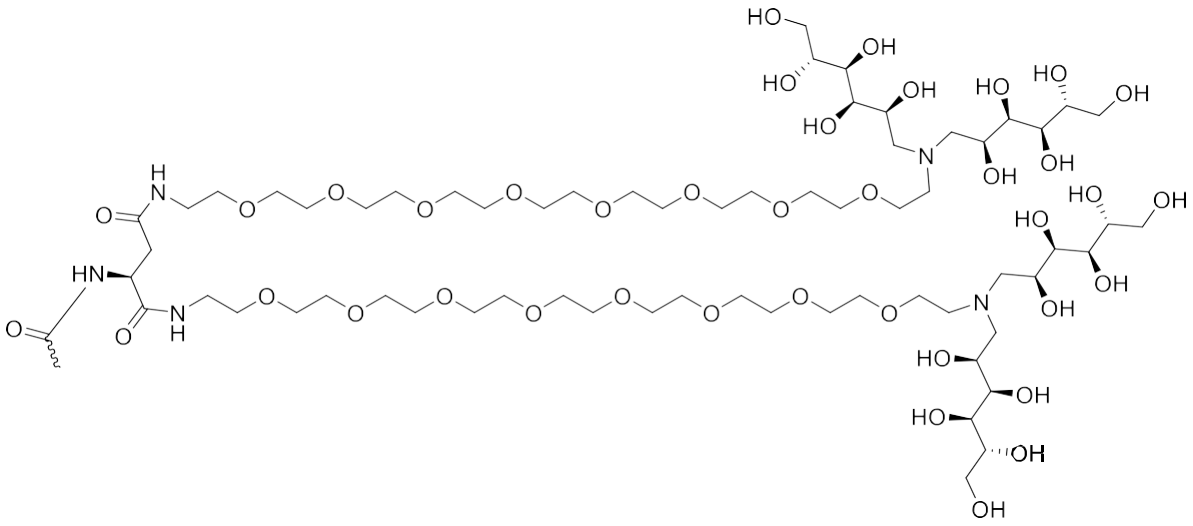
54. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 45-47, donde q es 10-20.

55. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 57-49, donde q es 12.

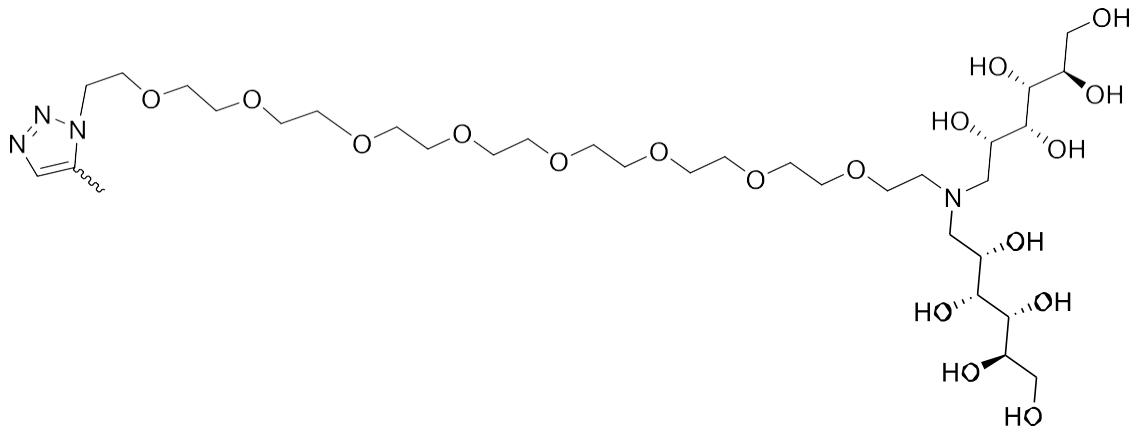
56. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 1-6, 35-37, o 47-49, que comprende un grupo polar seleccionado entre los siguientes, o un estereoisómero o sal de los mismos:

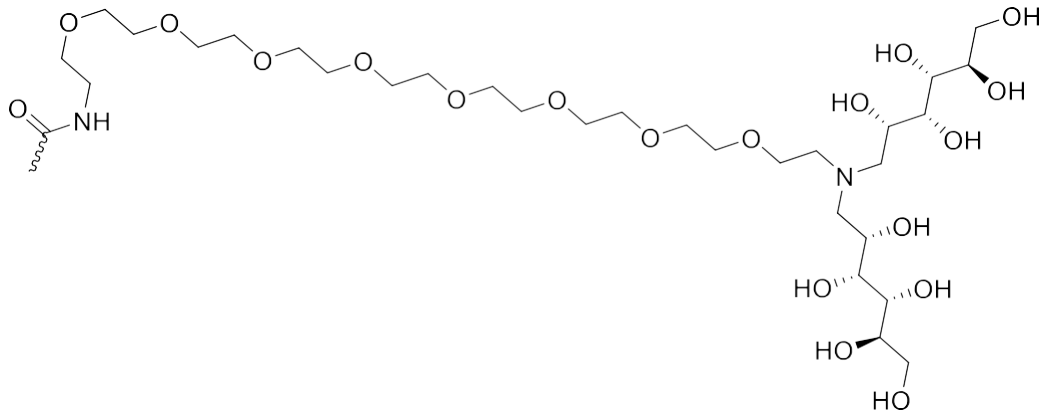


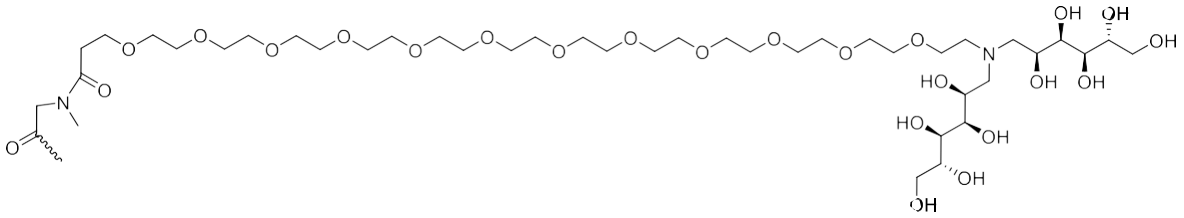
;

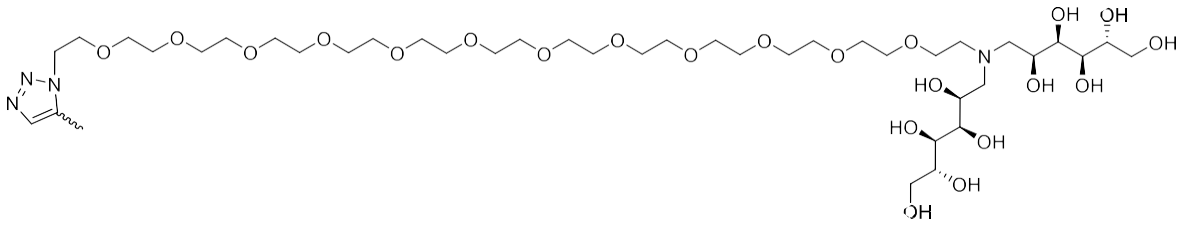


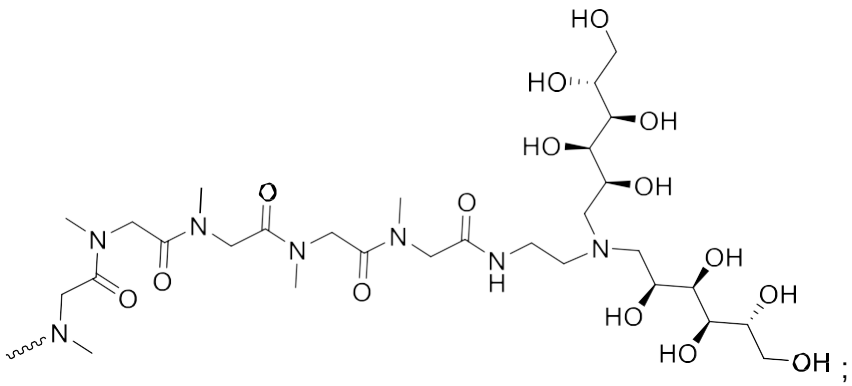
;

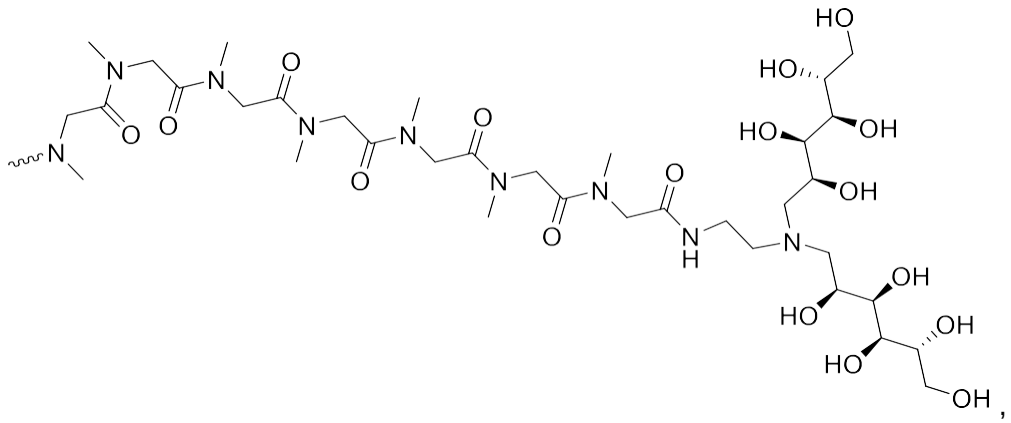

;

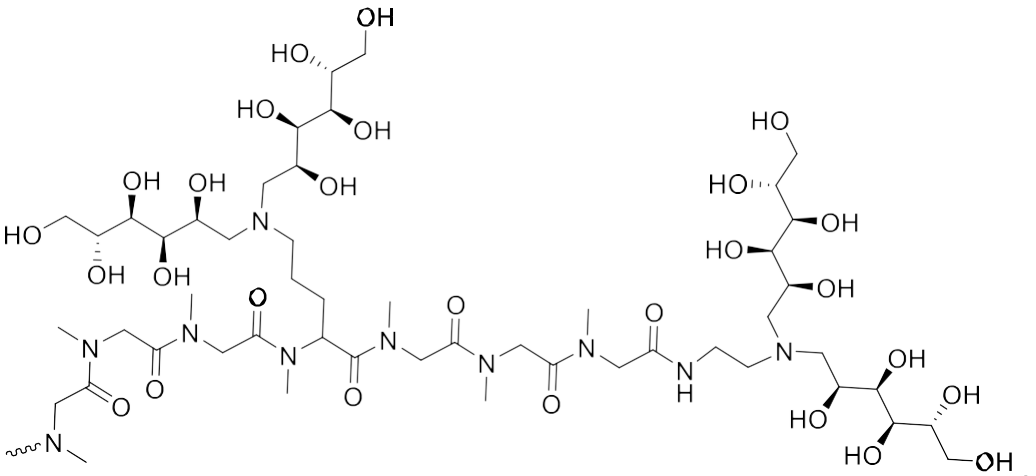

;

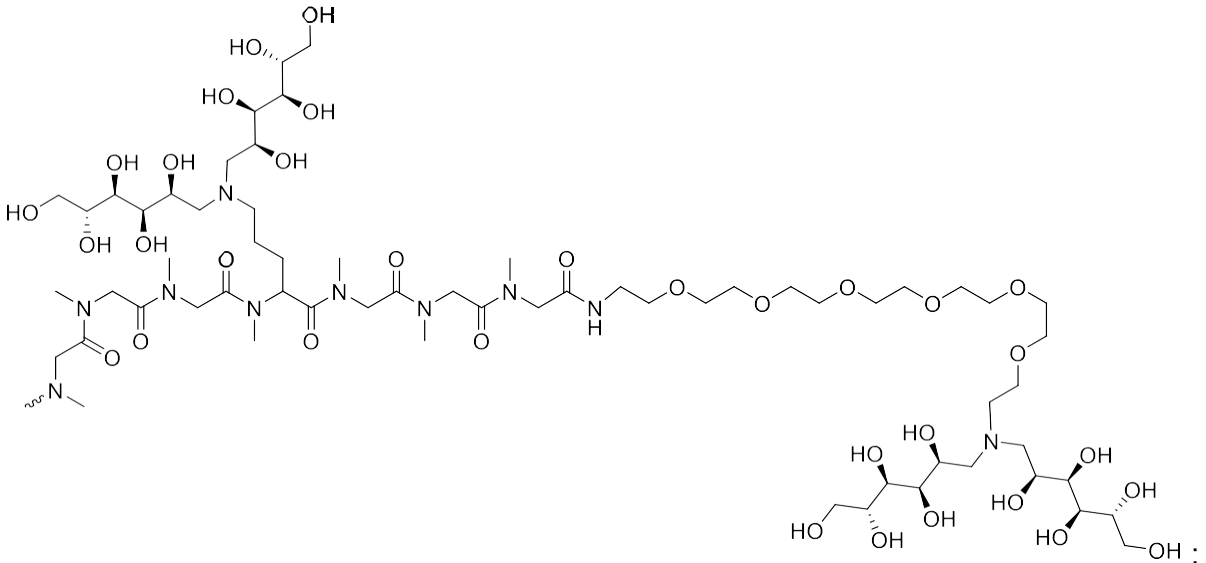

;


;

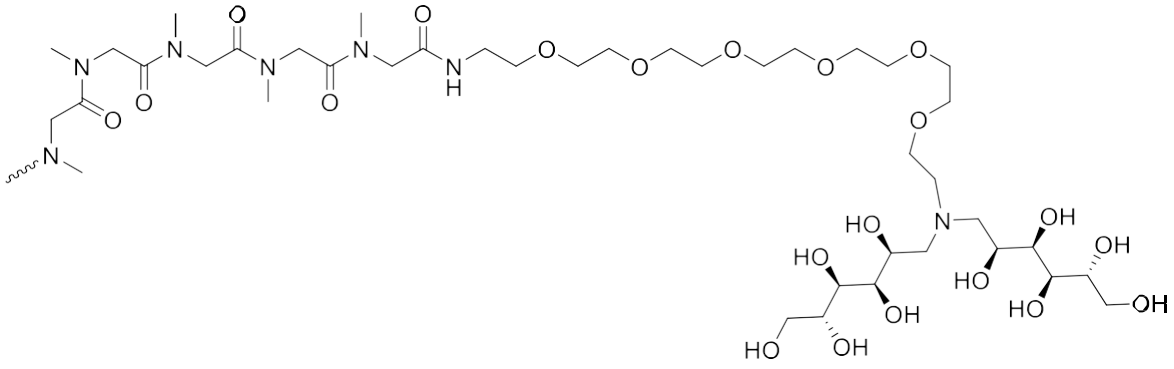

;



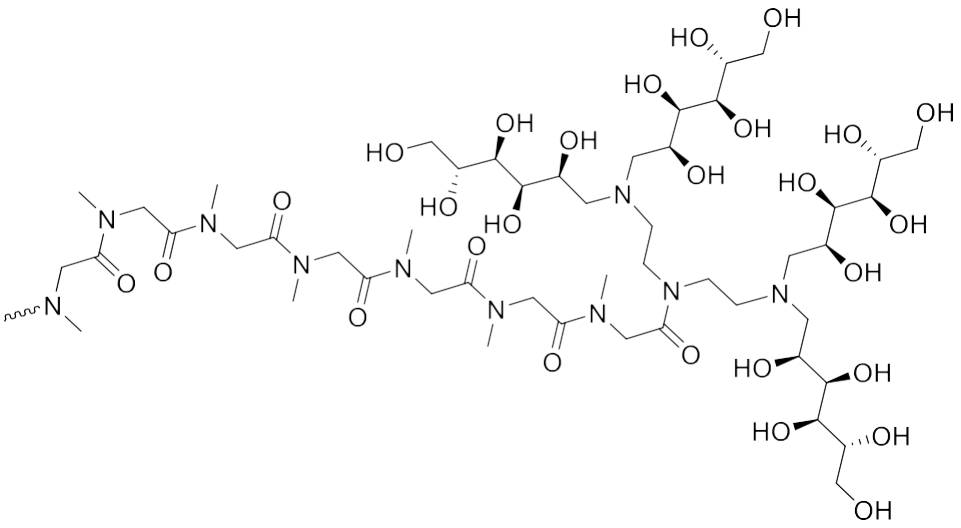




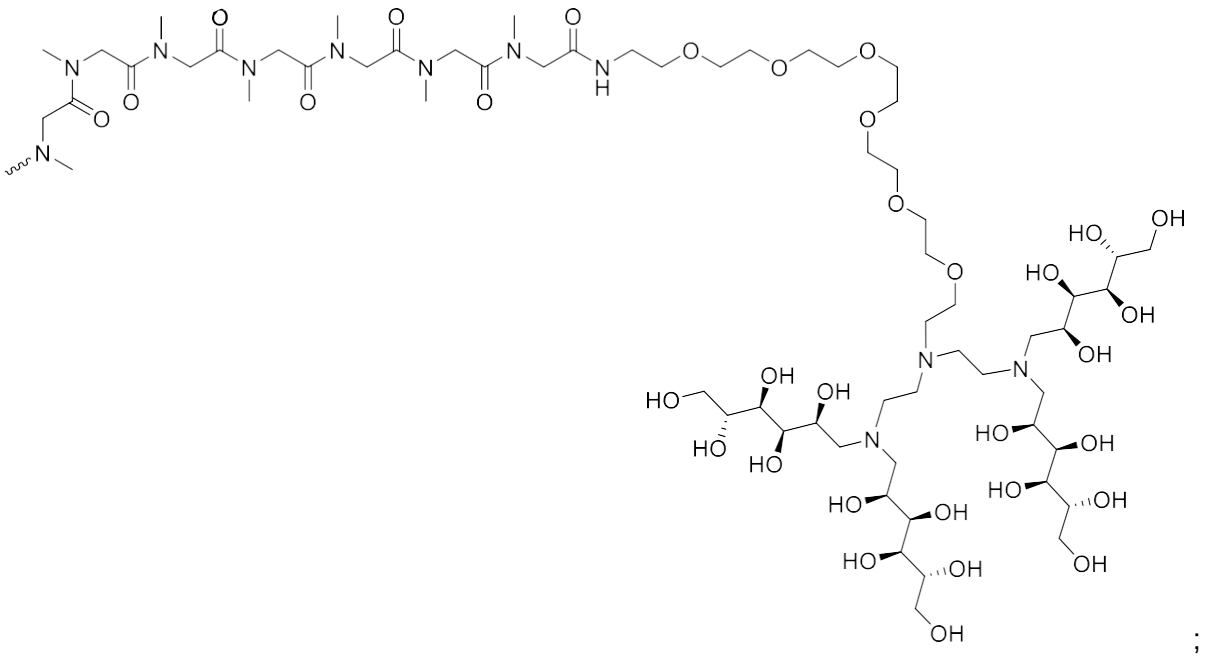
;



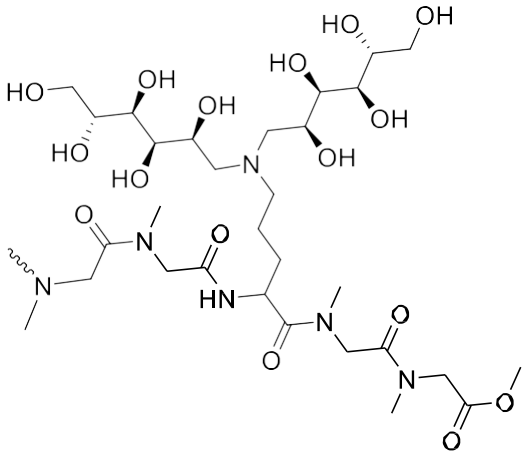
;



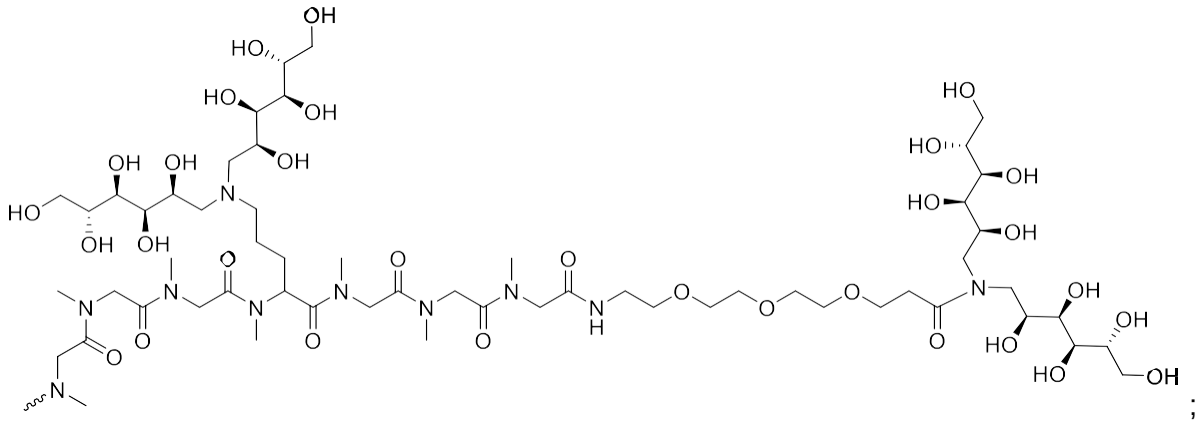
;

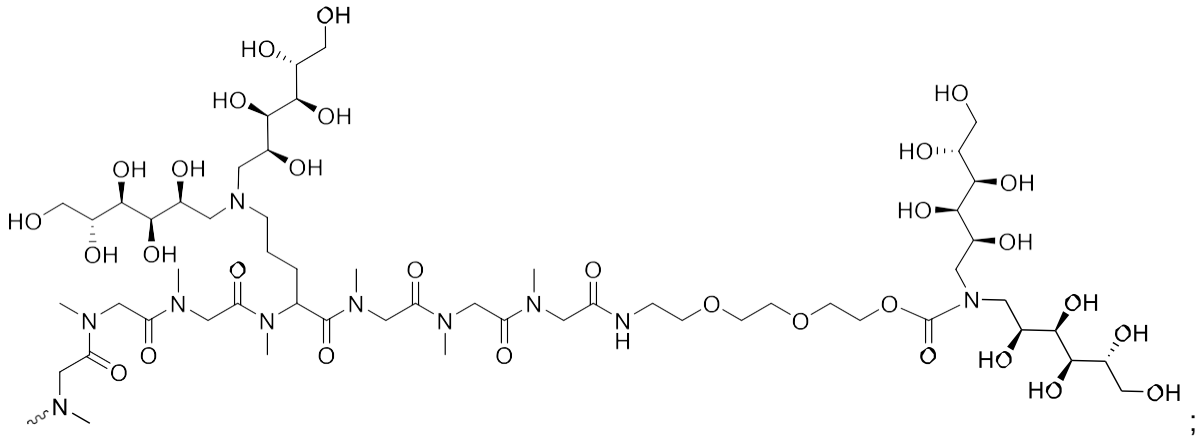


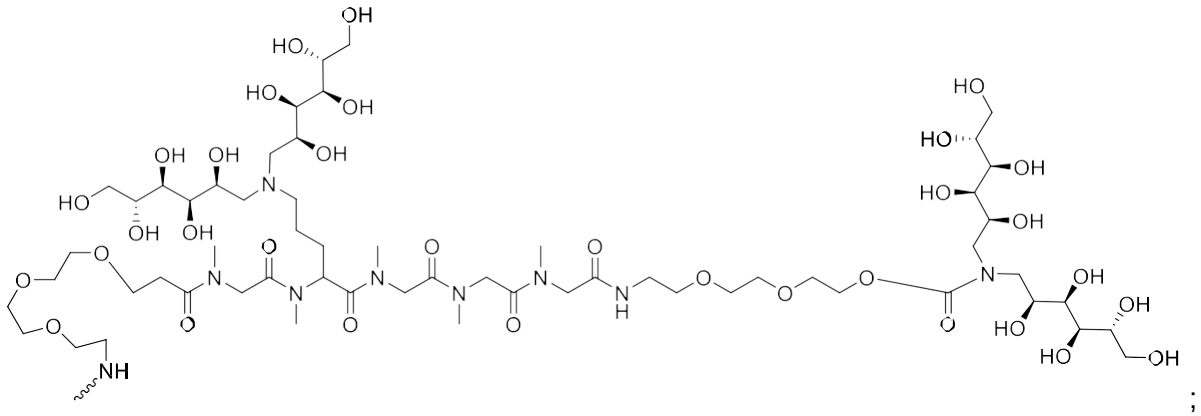
;

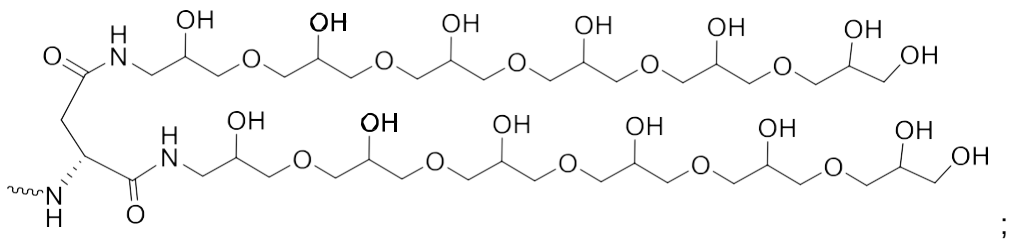


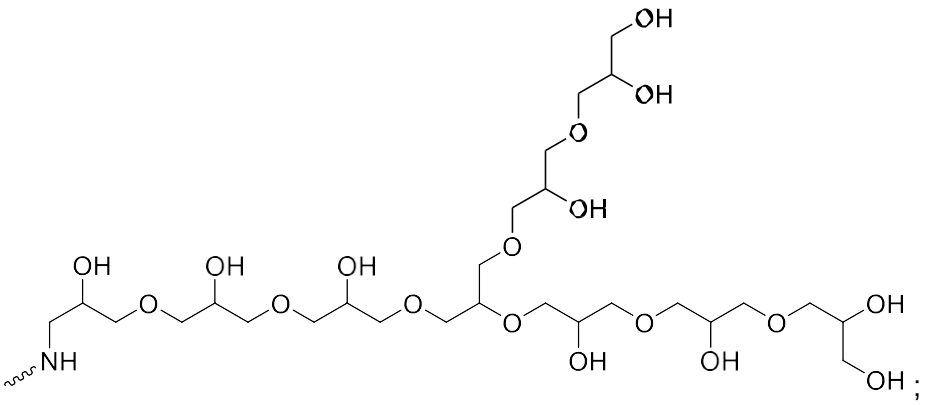
;


;

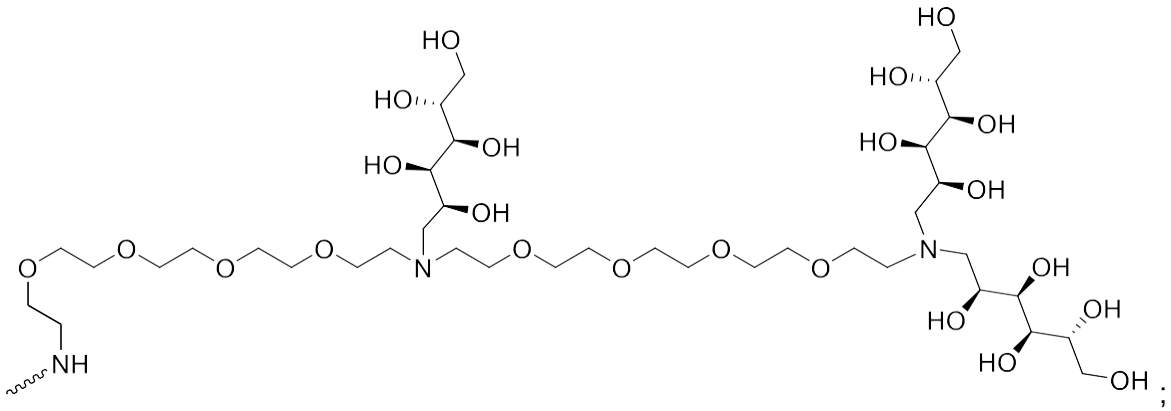

;


;

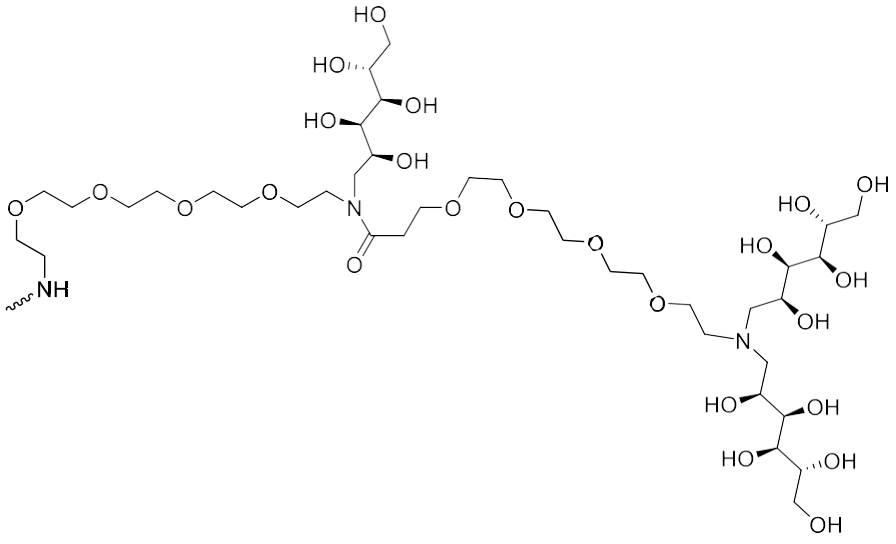

;



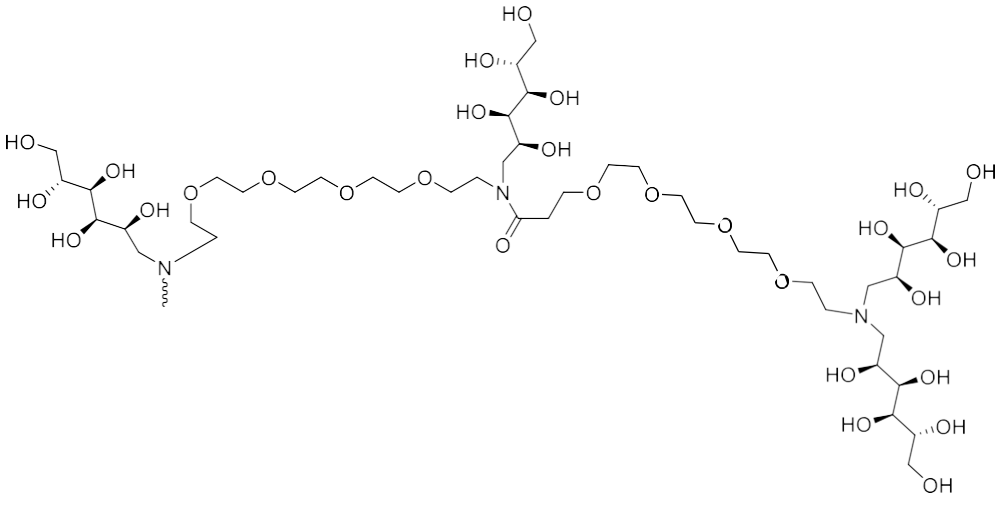
;



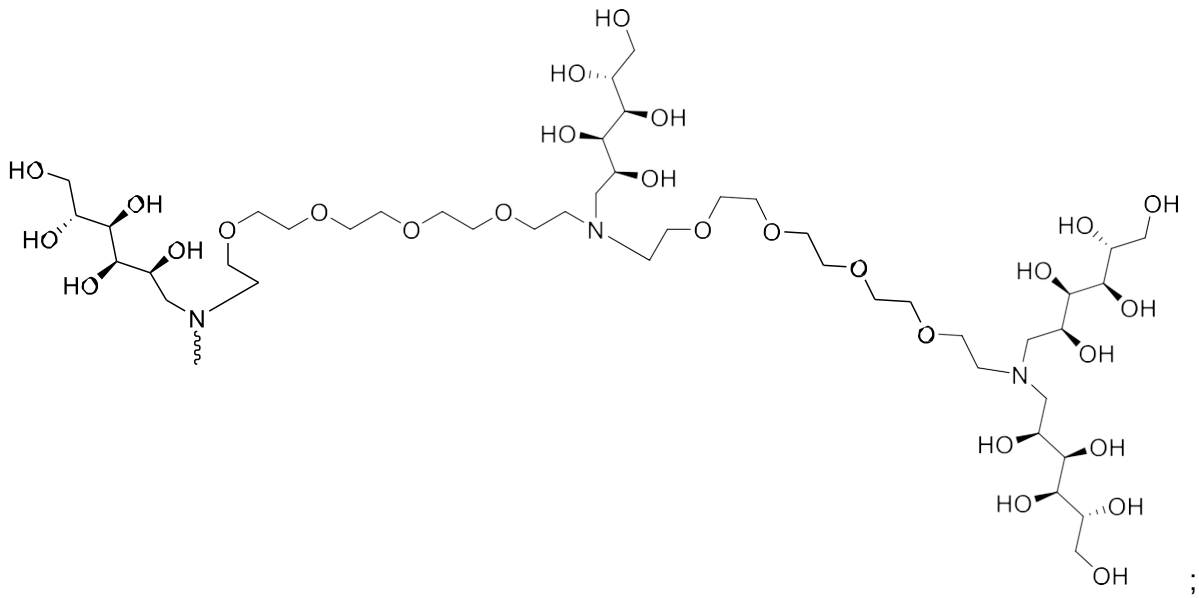
;



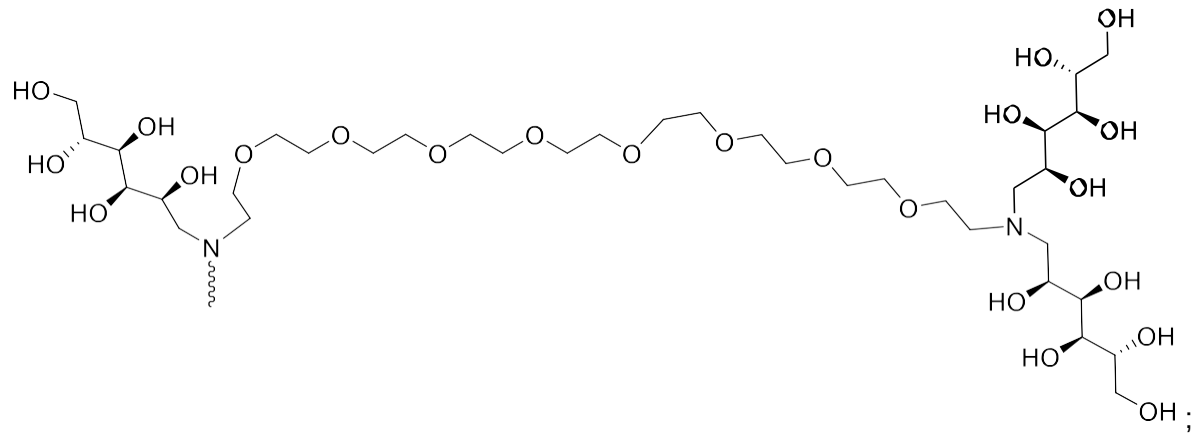
;



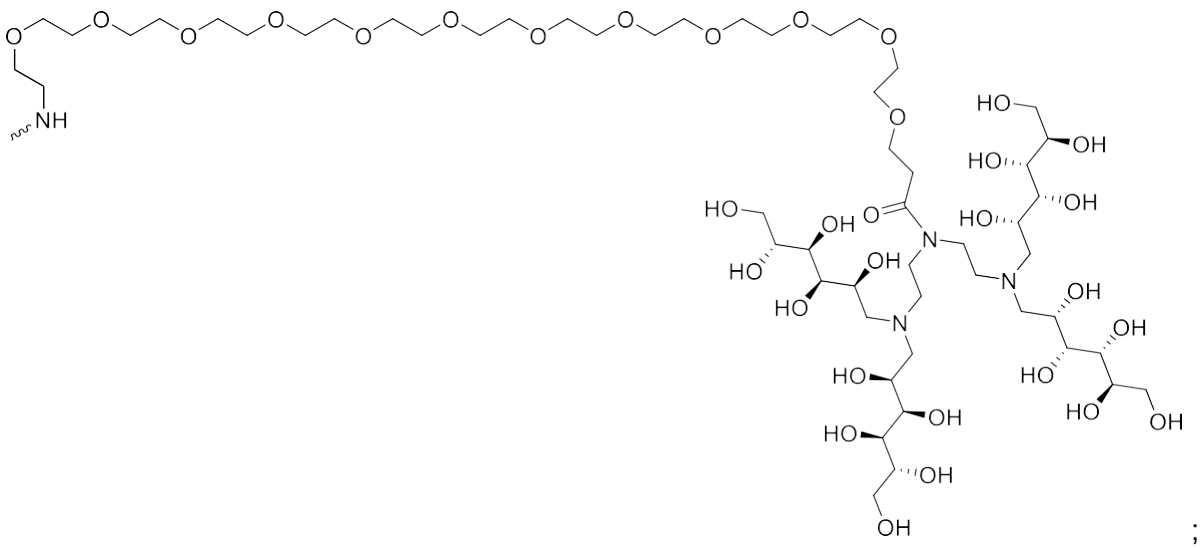
;



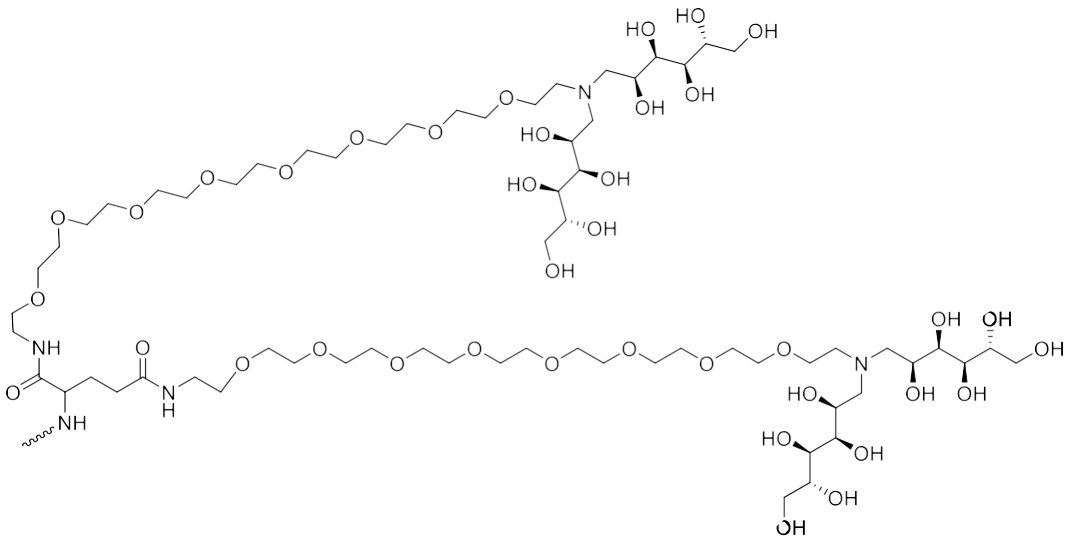
;



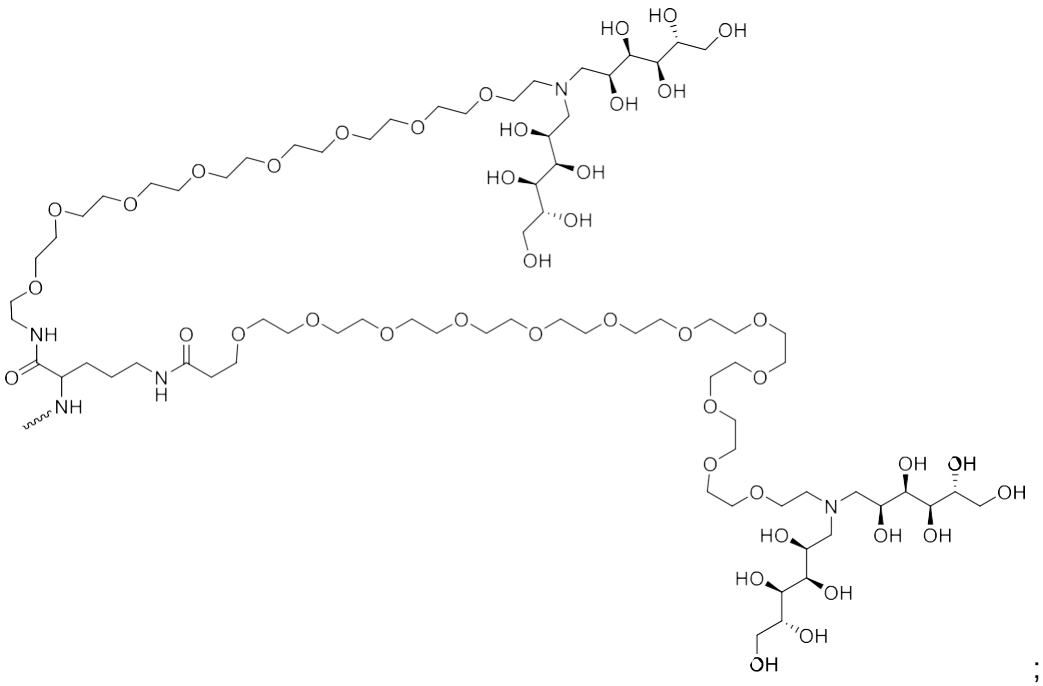
;



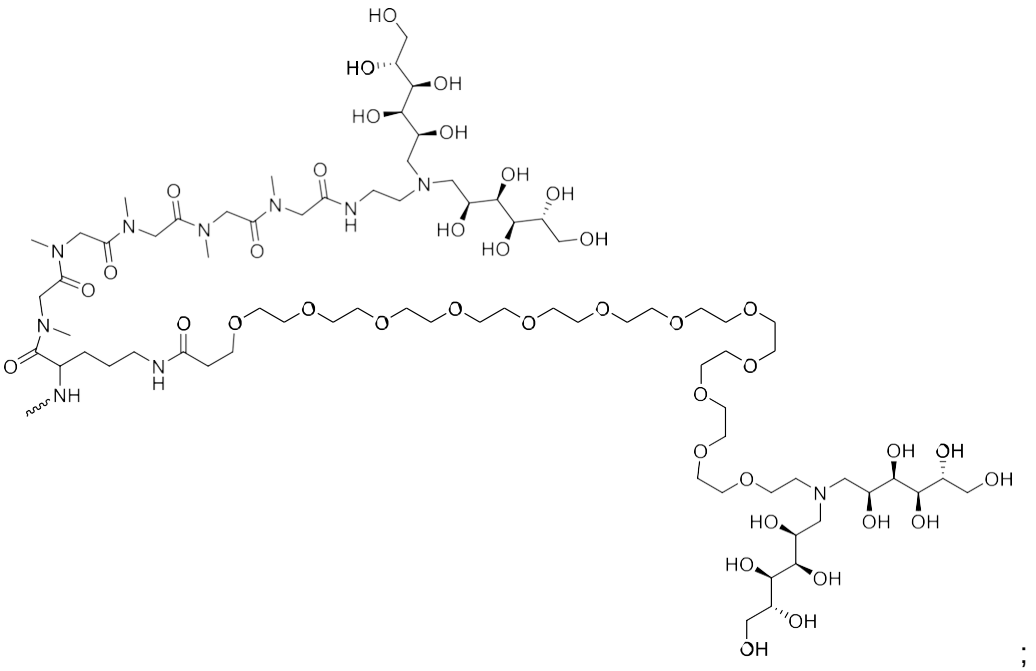
;



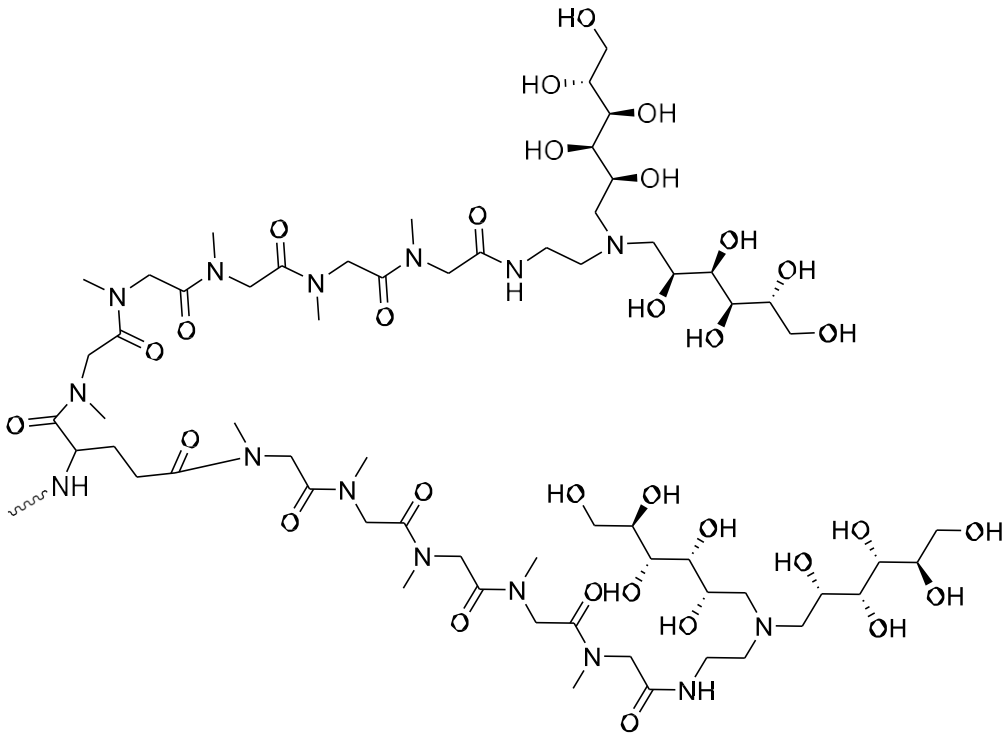
;



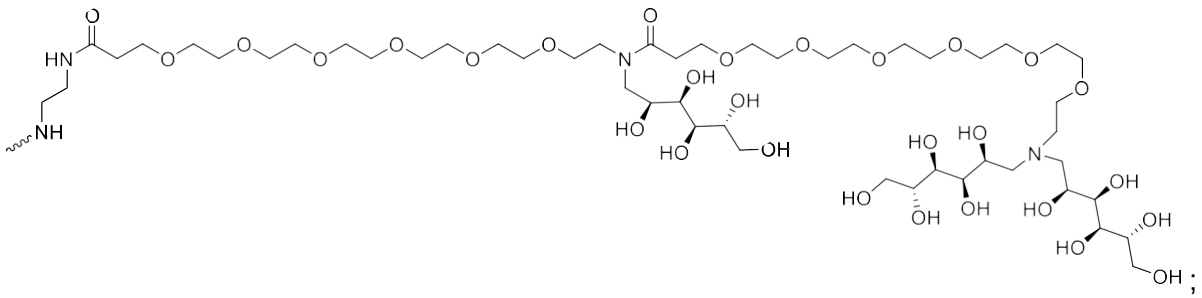
;



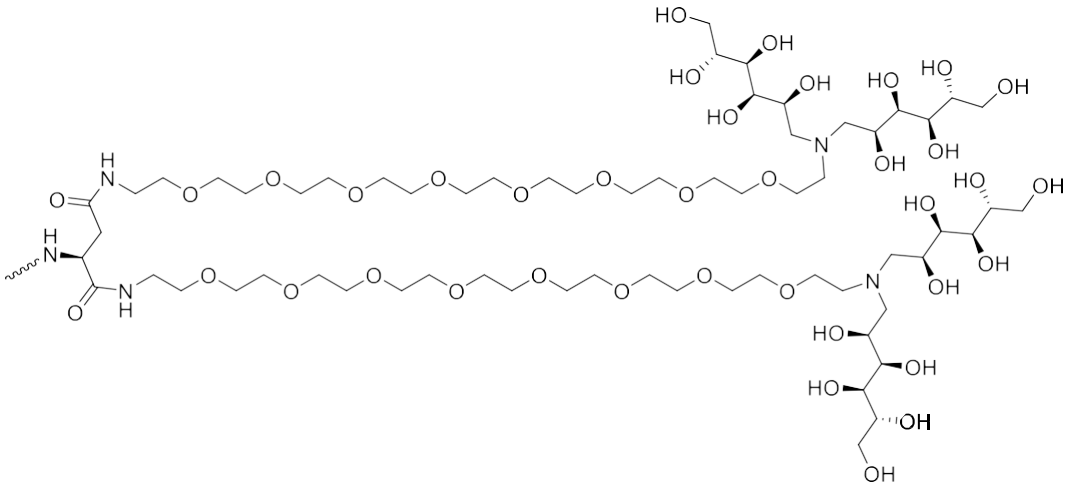
;



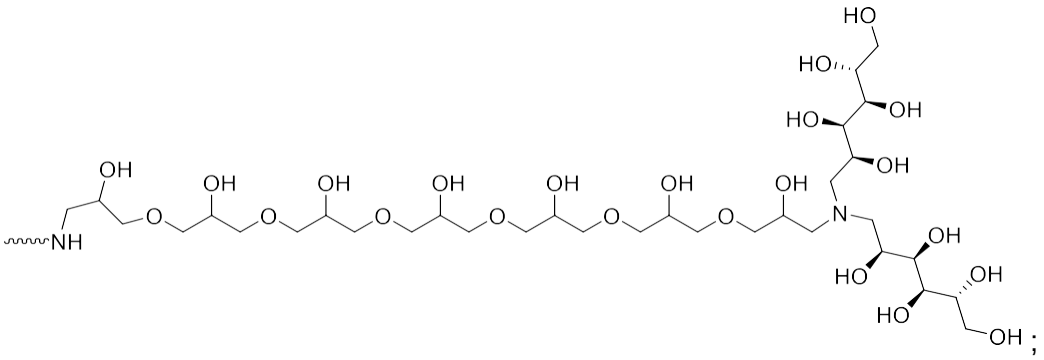
;

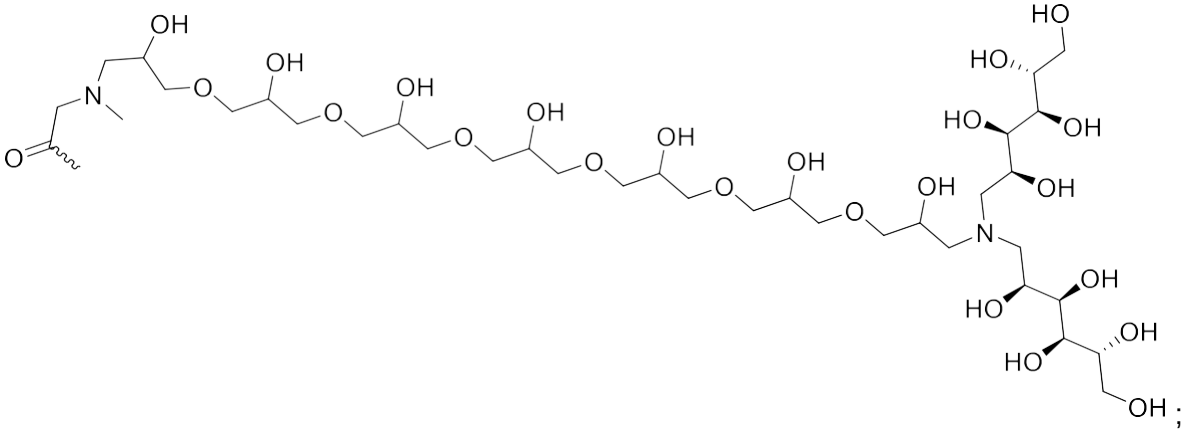


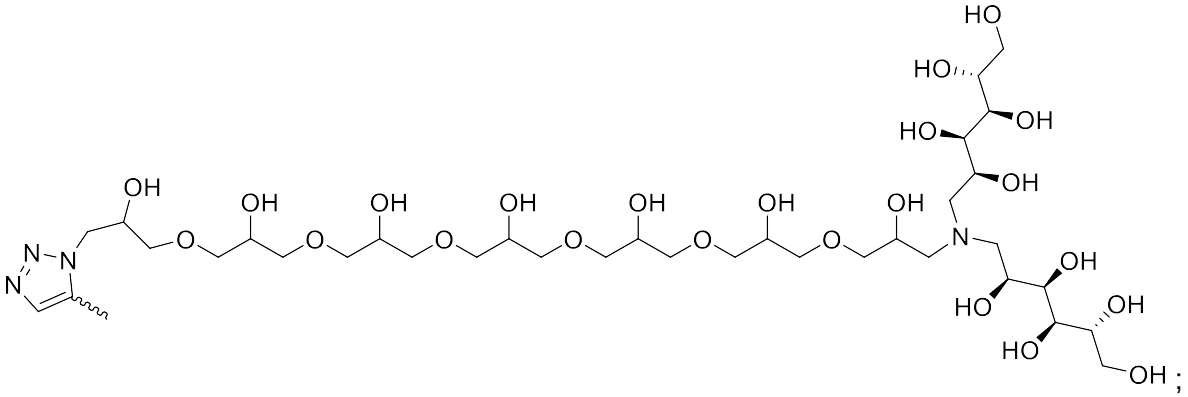
;

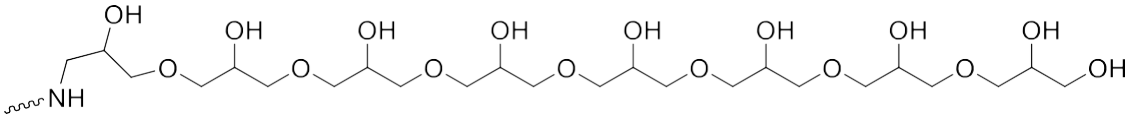


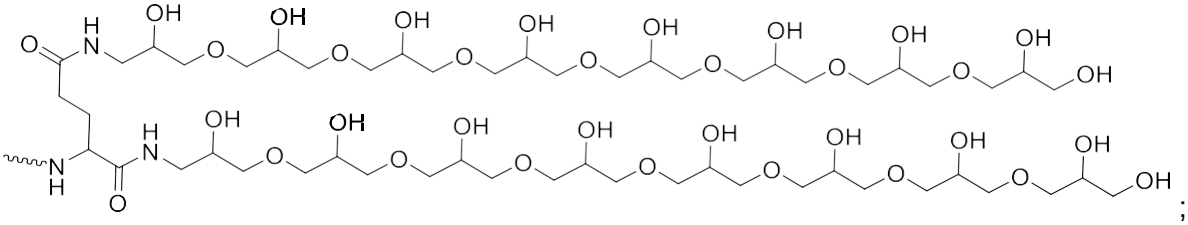
;

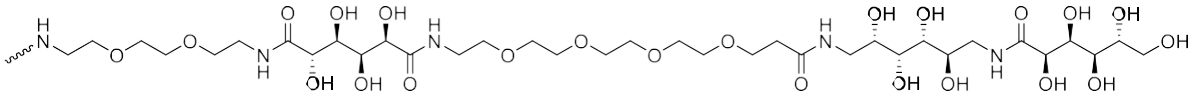


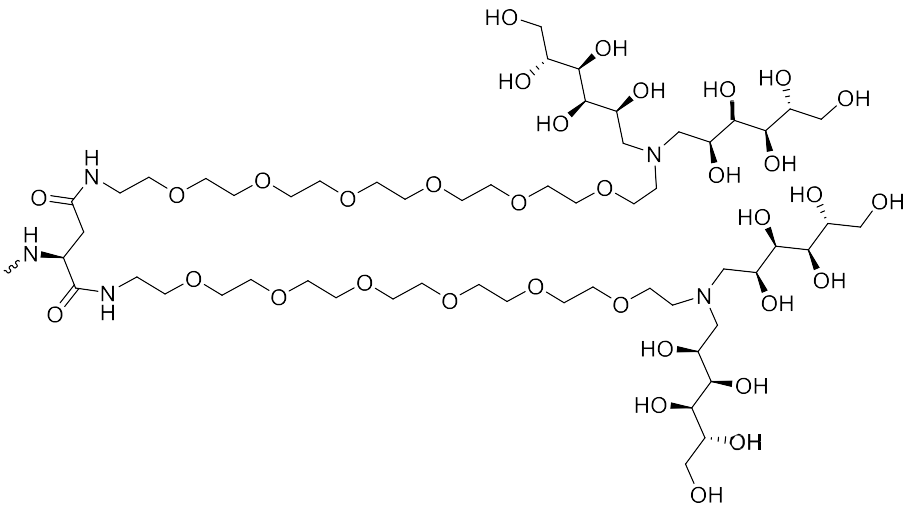




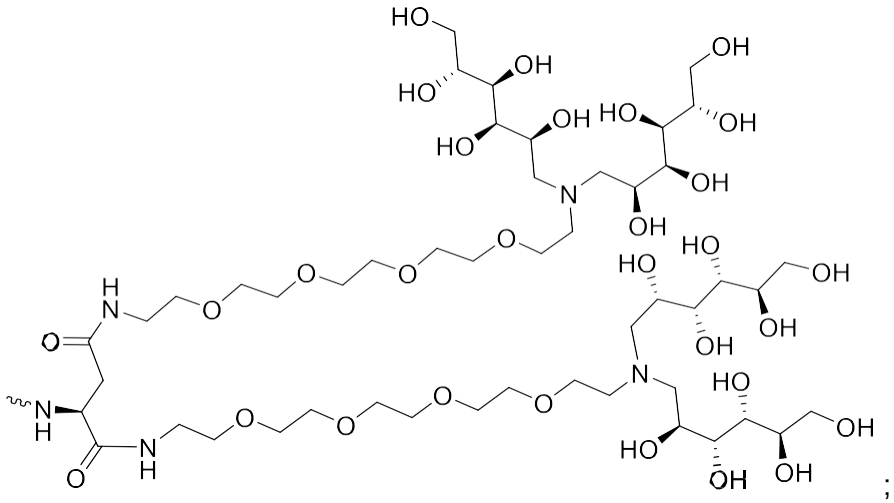




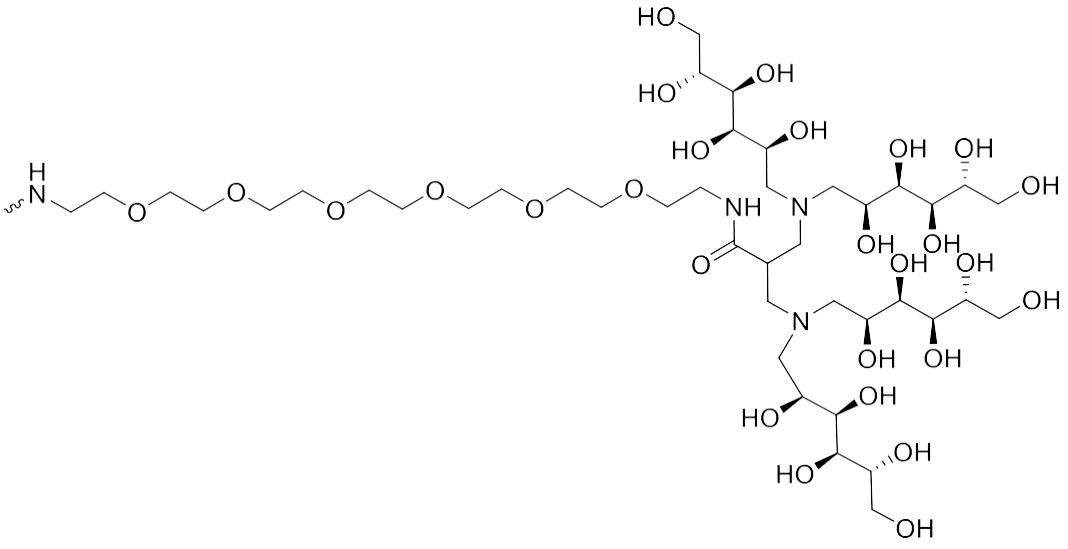




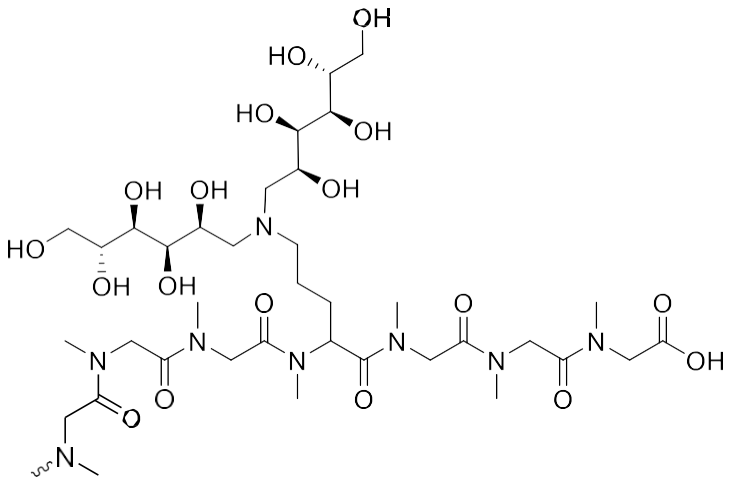
;



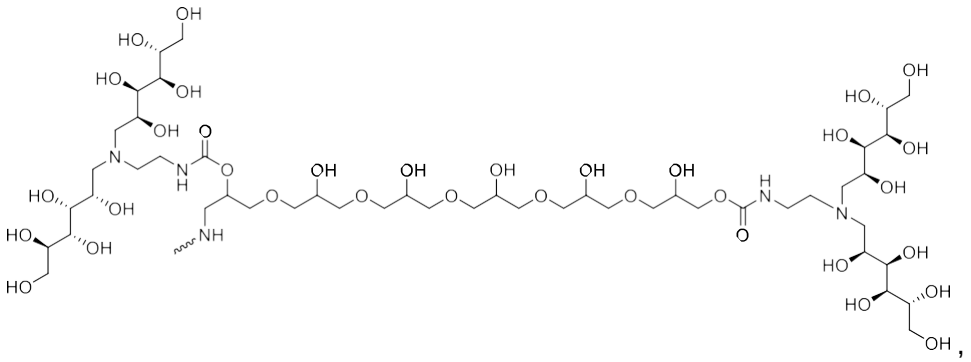
;



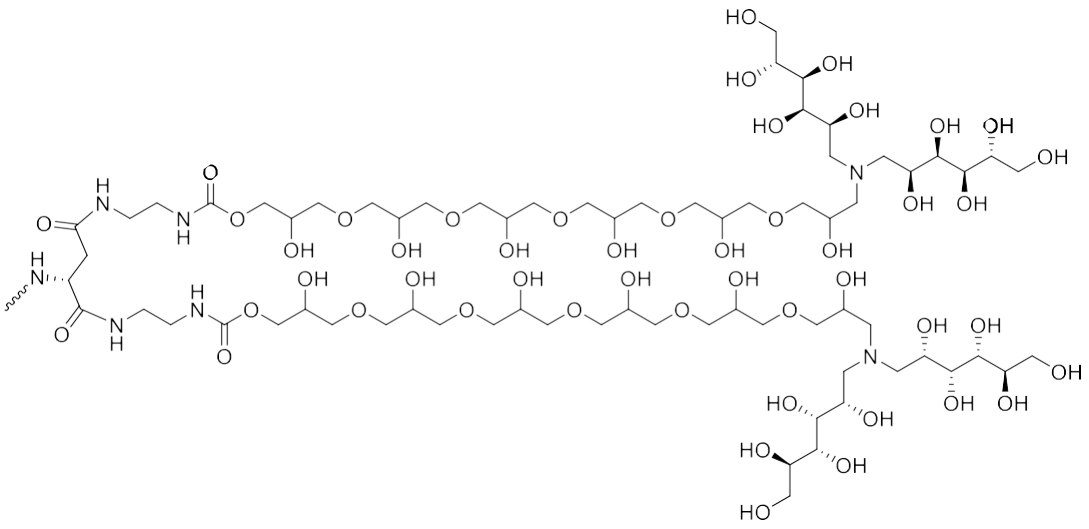
;



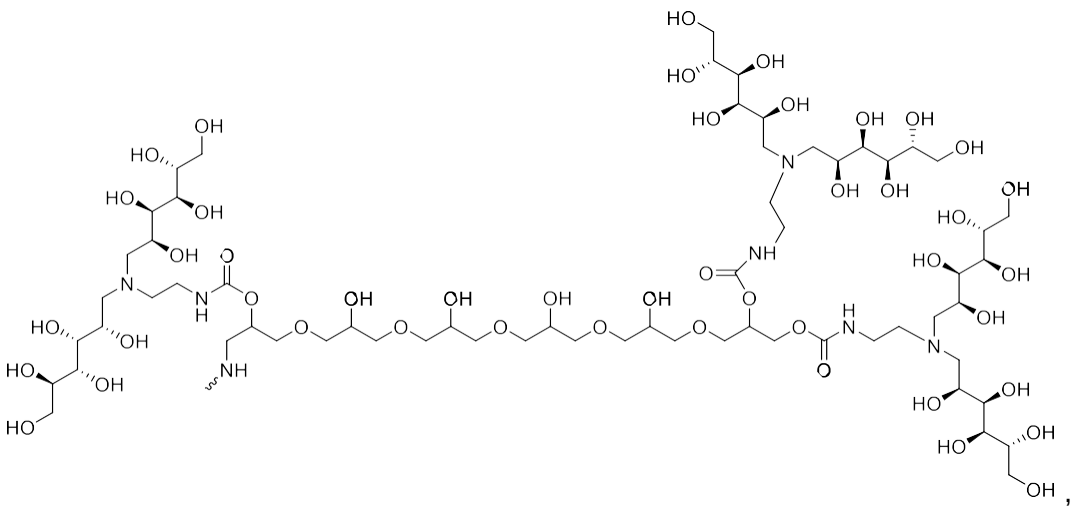
;



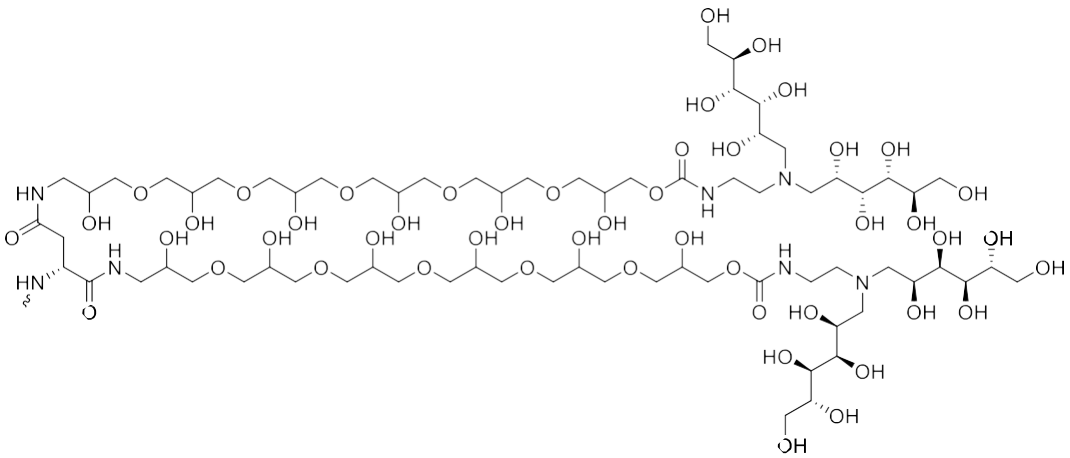
,



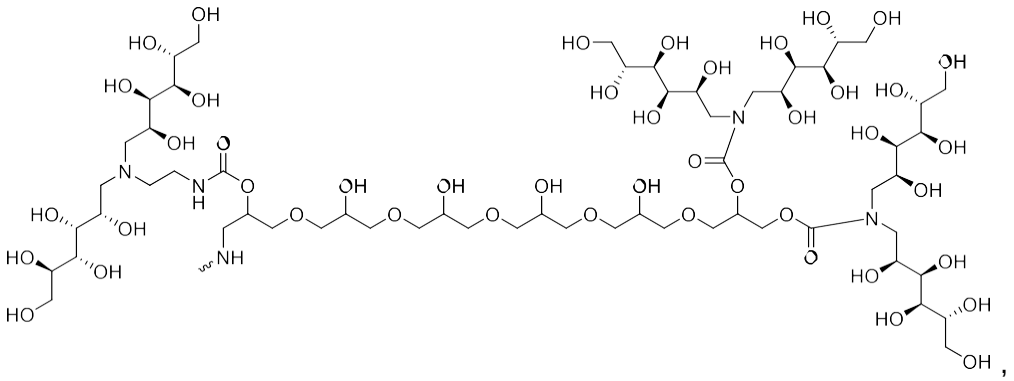
,



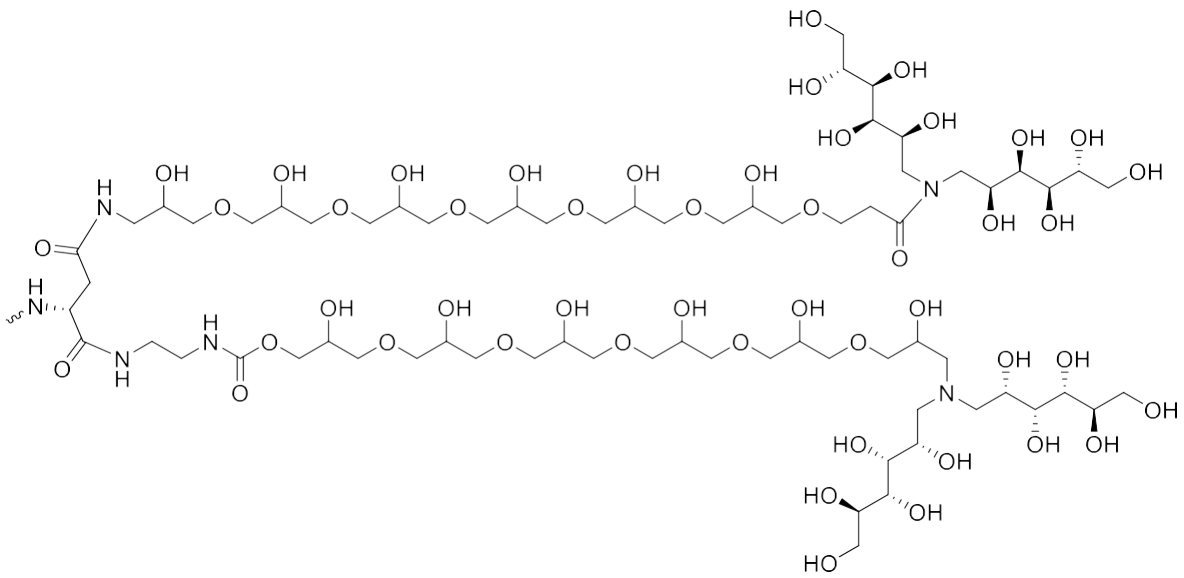
,



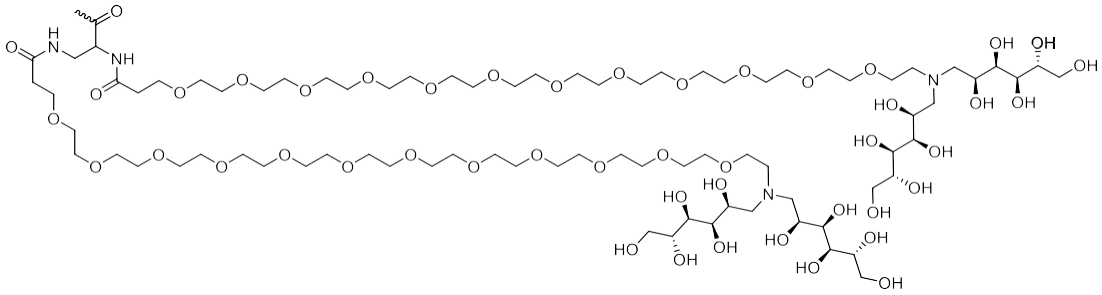
,



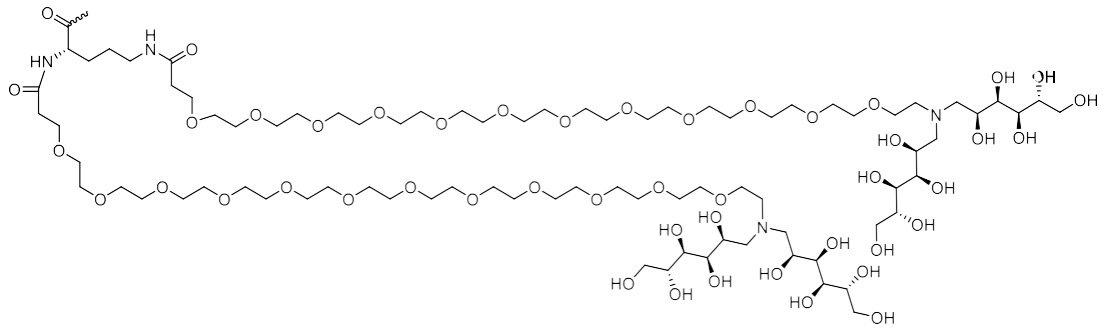
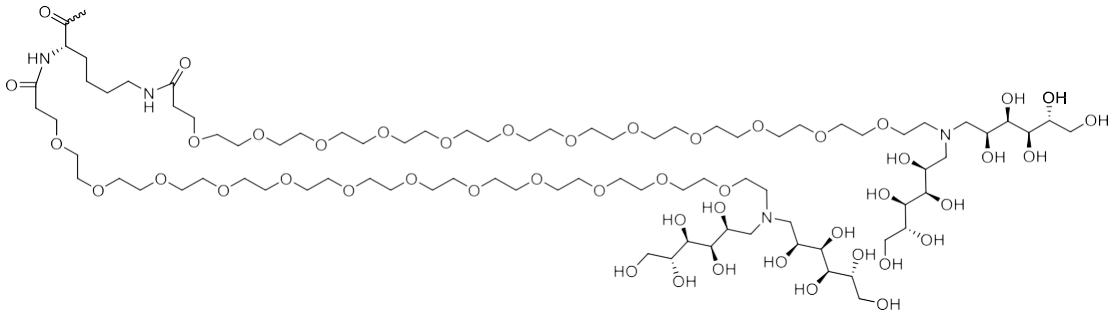
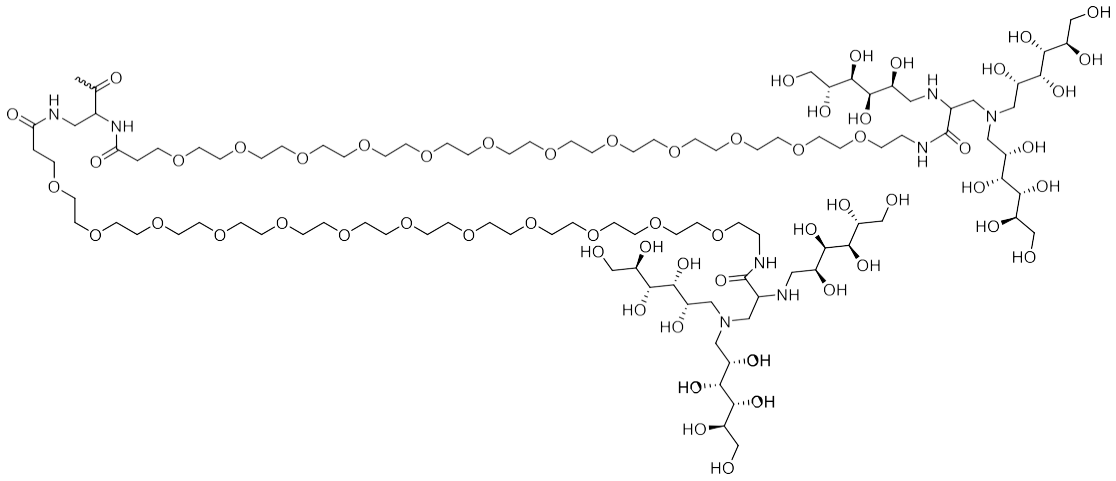
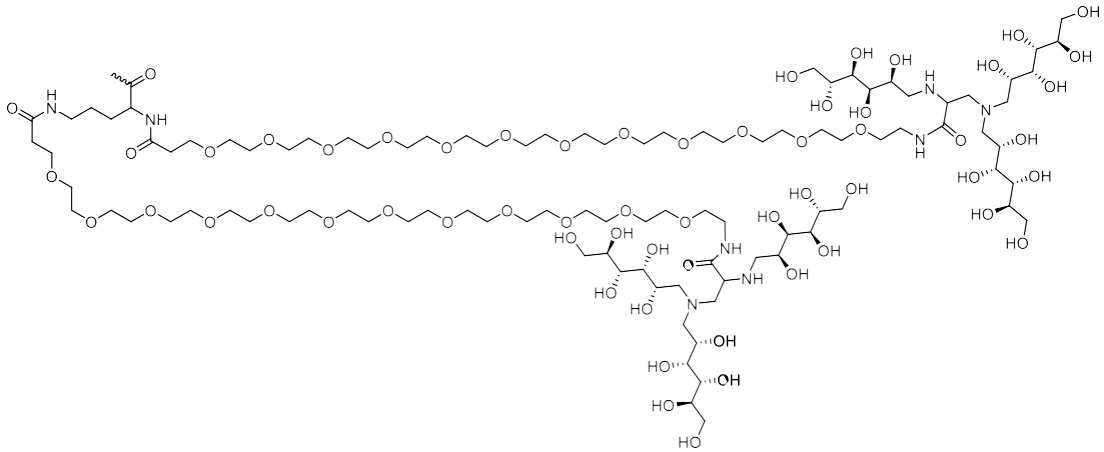
,

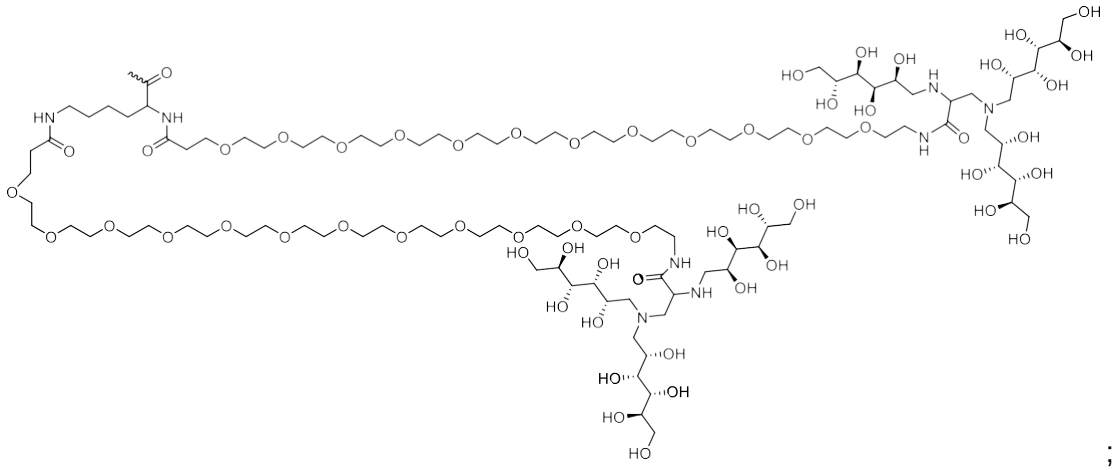


,

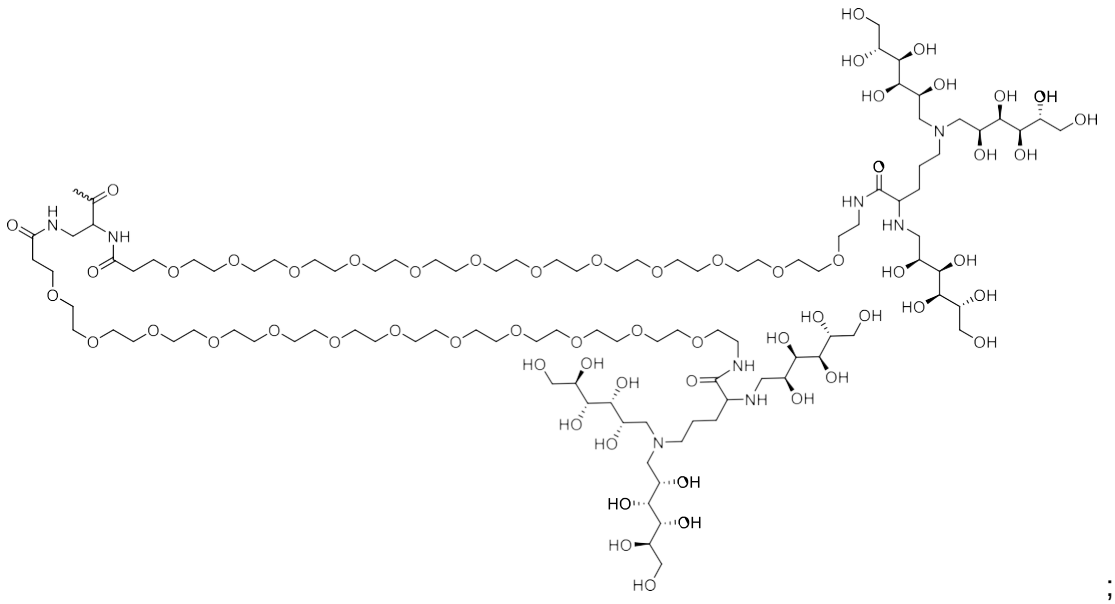


;

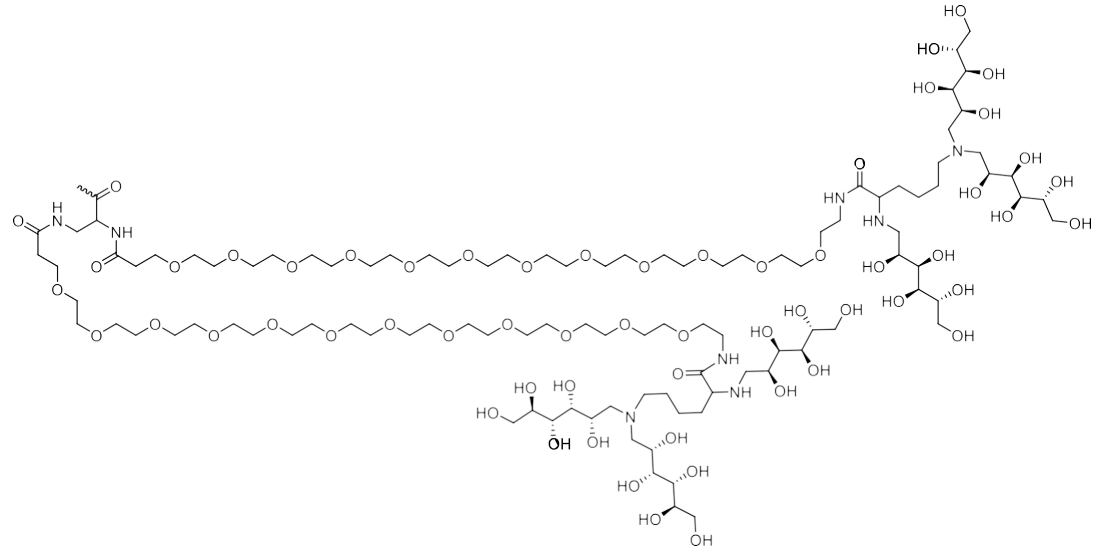

;

;

;

;



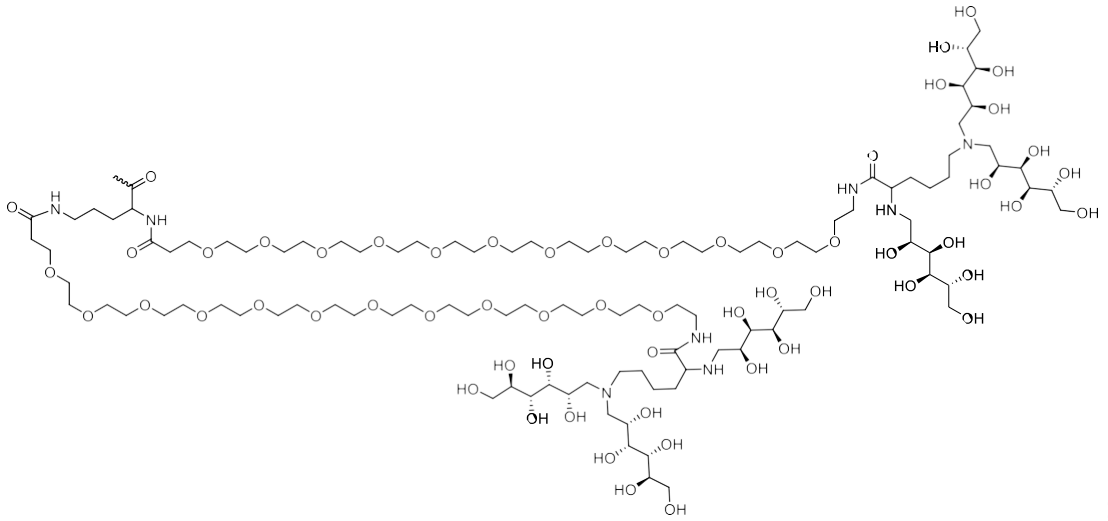
;



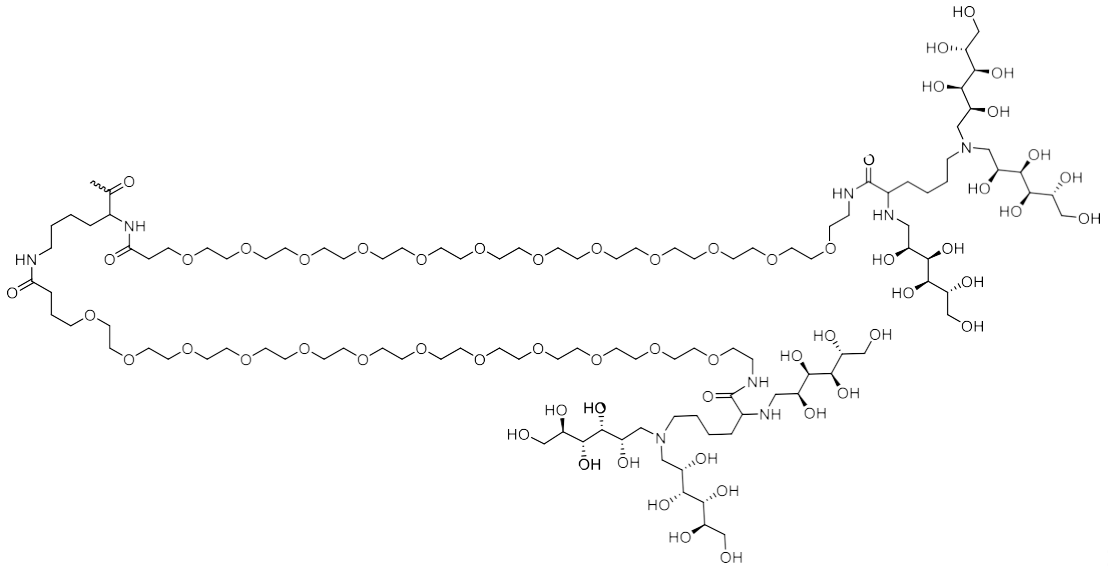
;



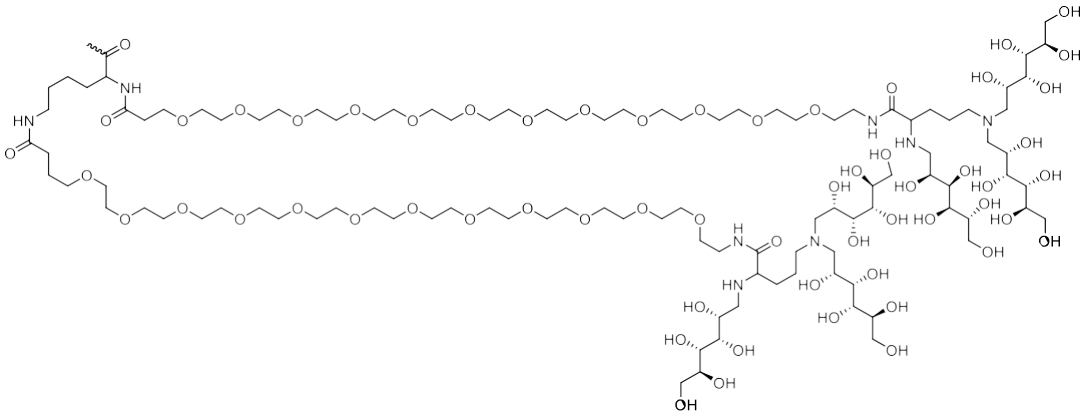
;



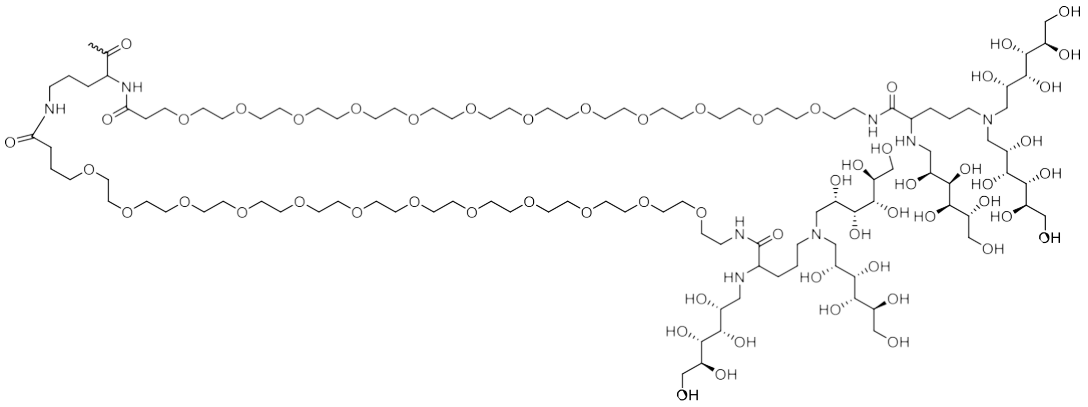
;



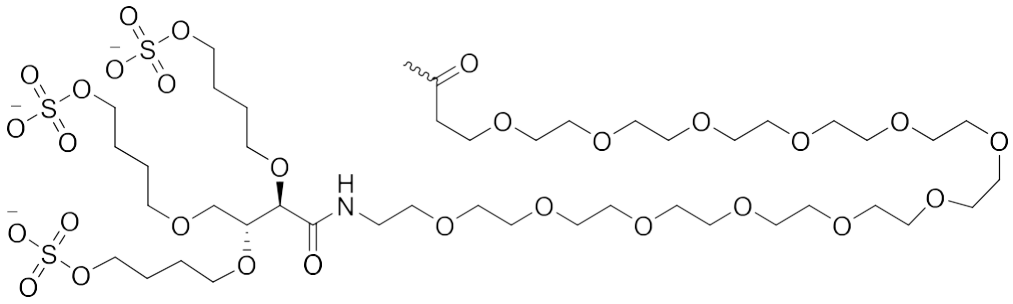
;



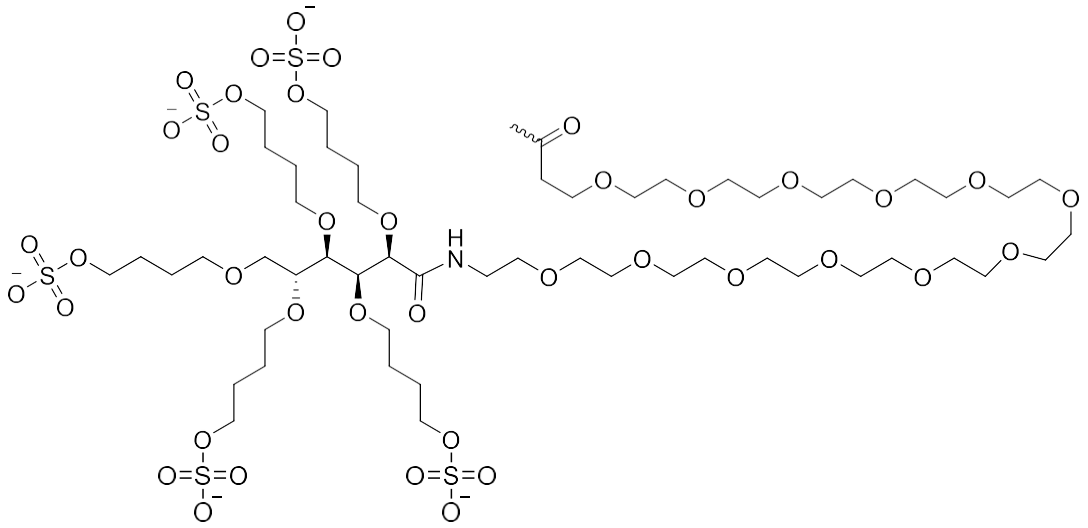
;



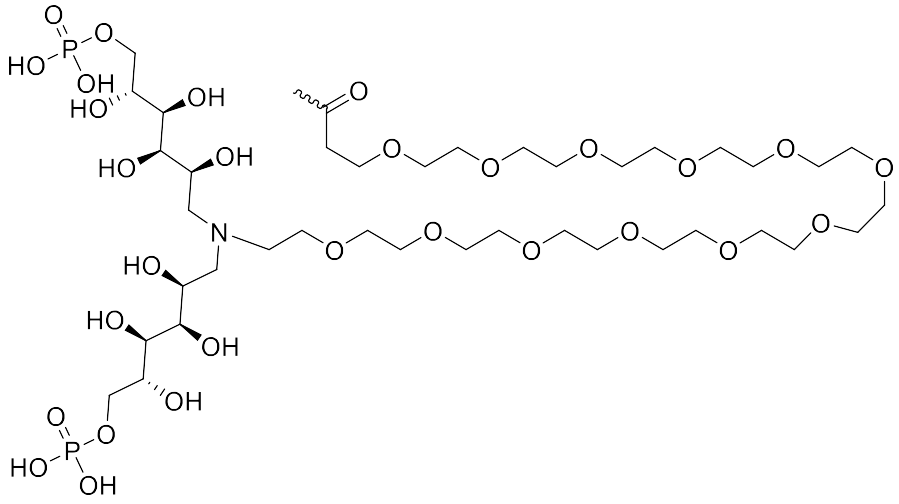
;



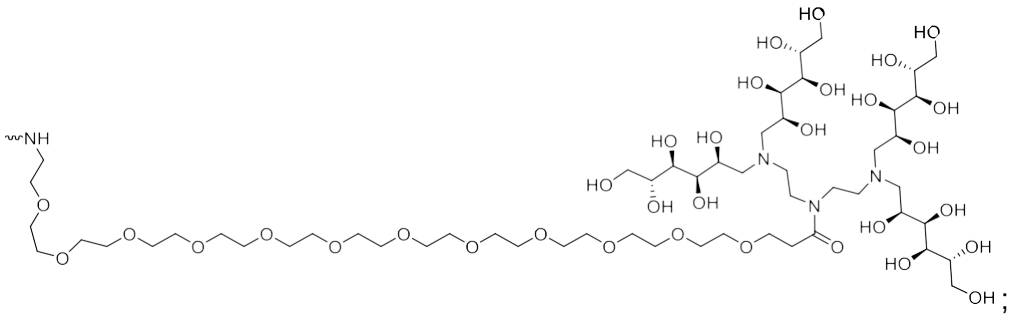
;



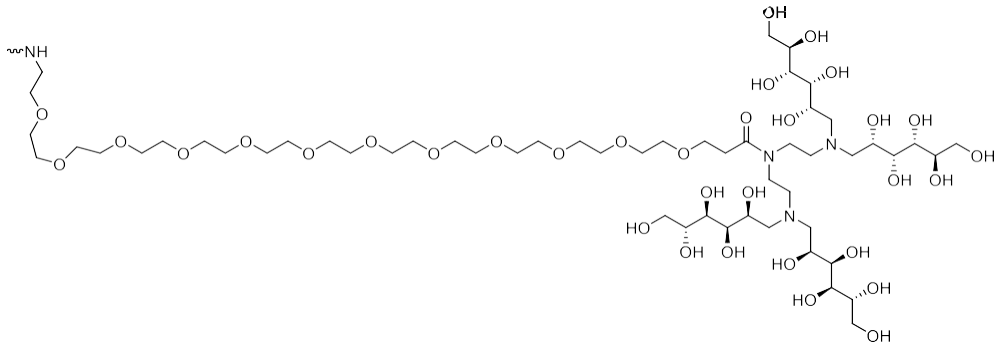
;



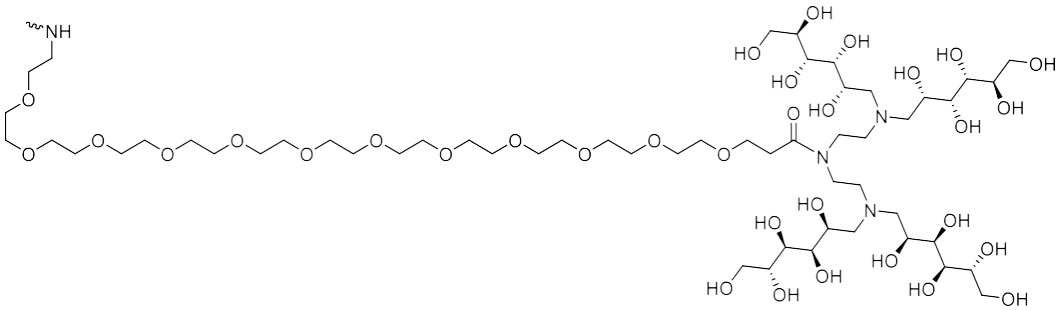
;



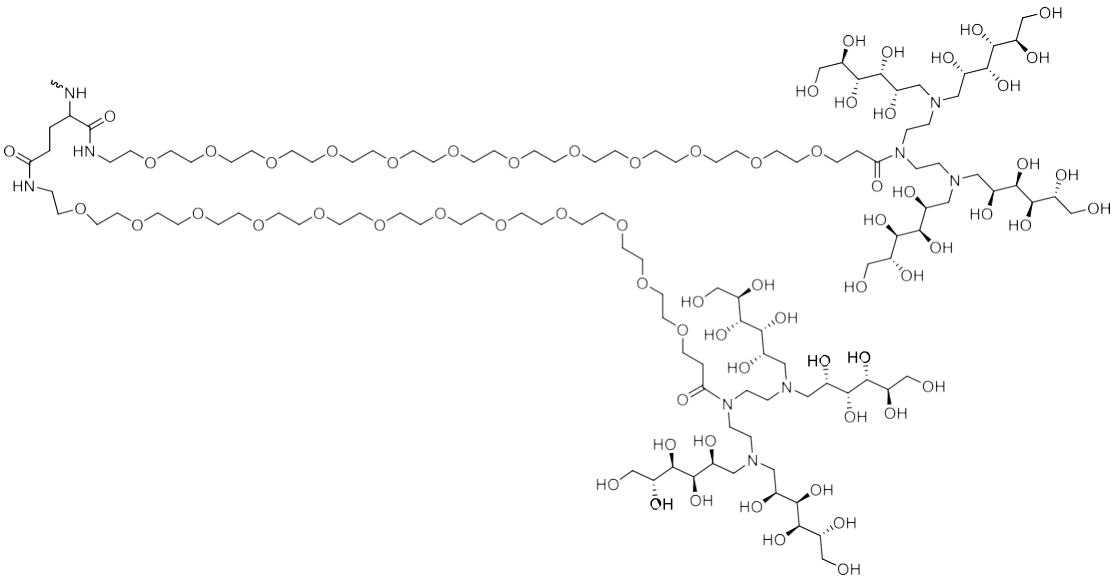
;



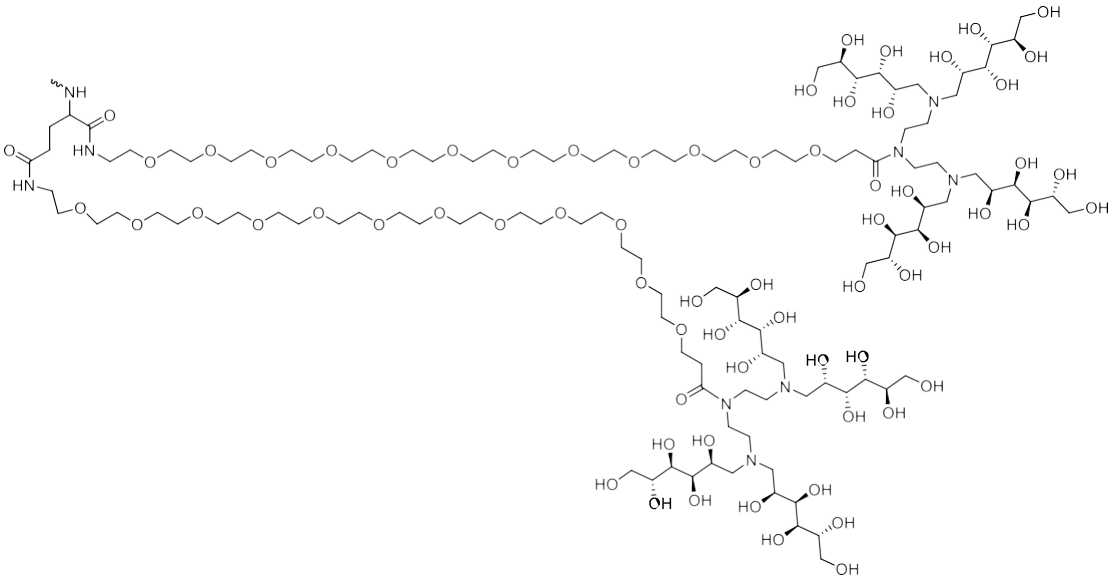
;



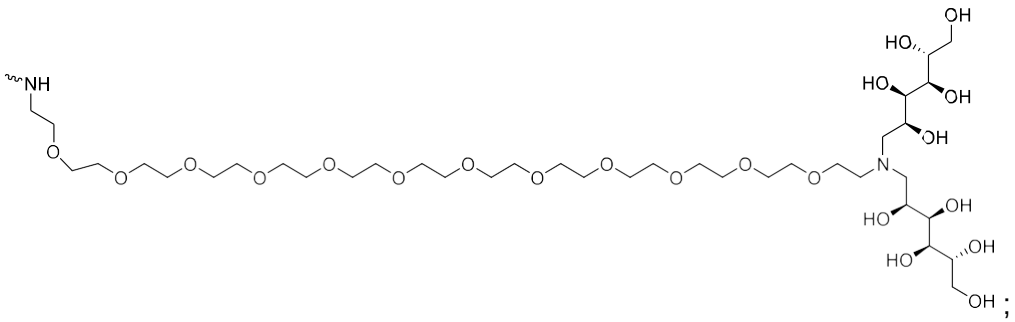
;



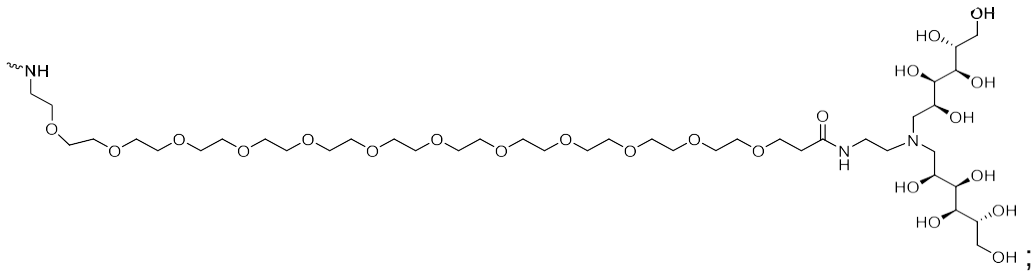
;



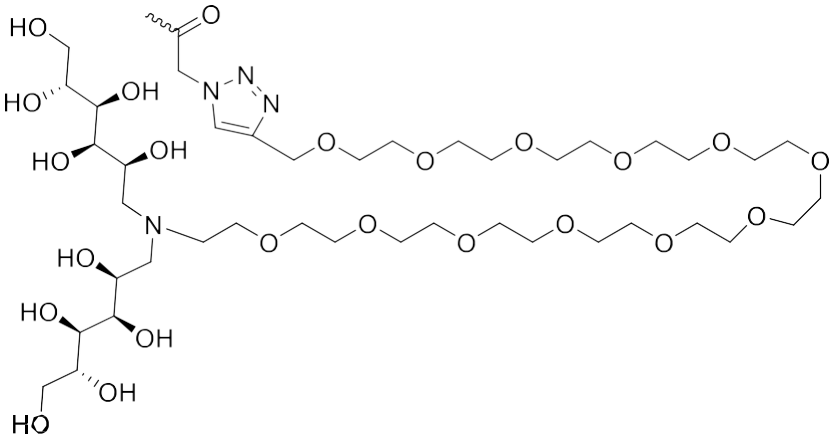
;



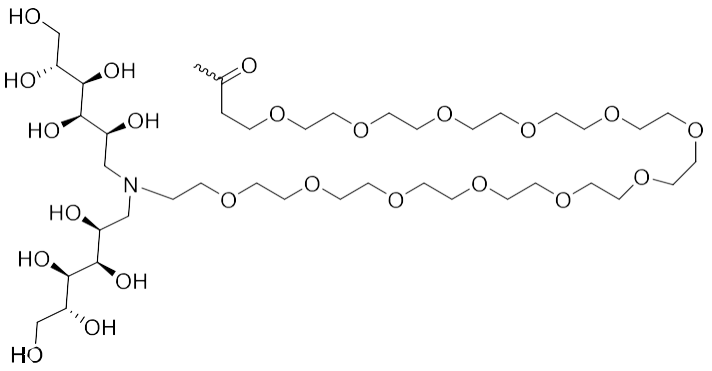
;



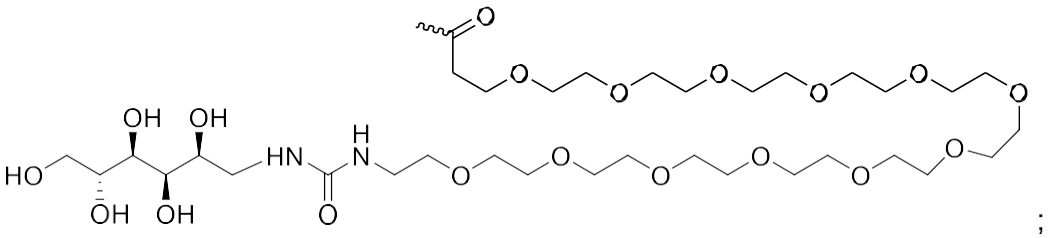
;



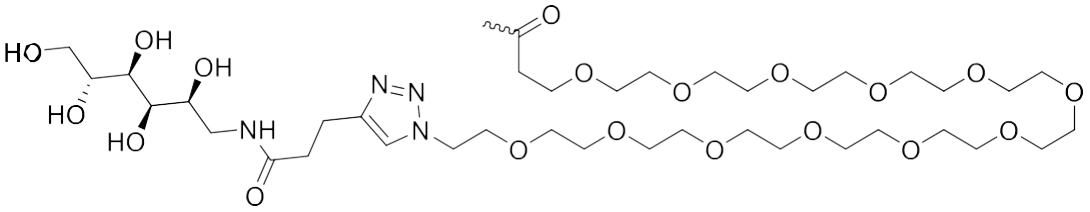
;



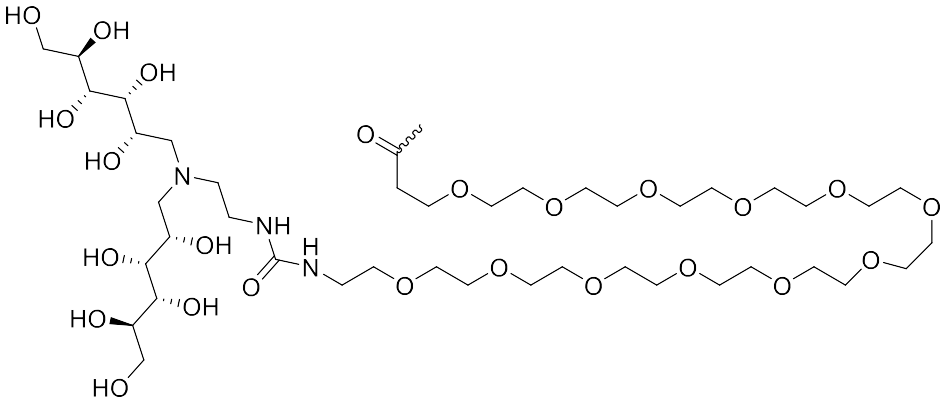
;



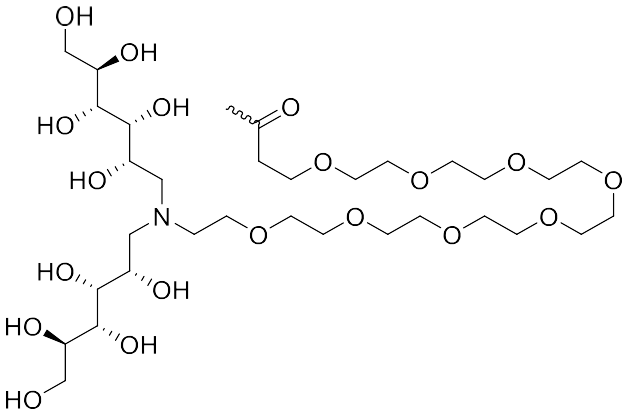
;



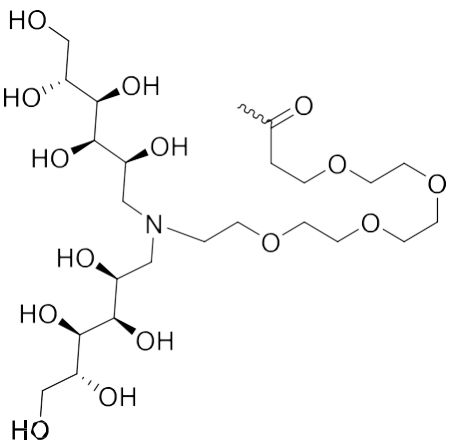
;



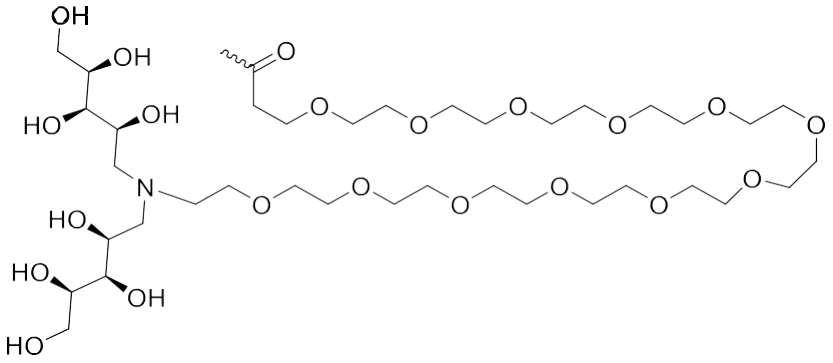
;



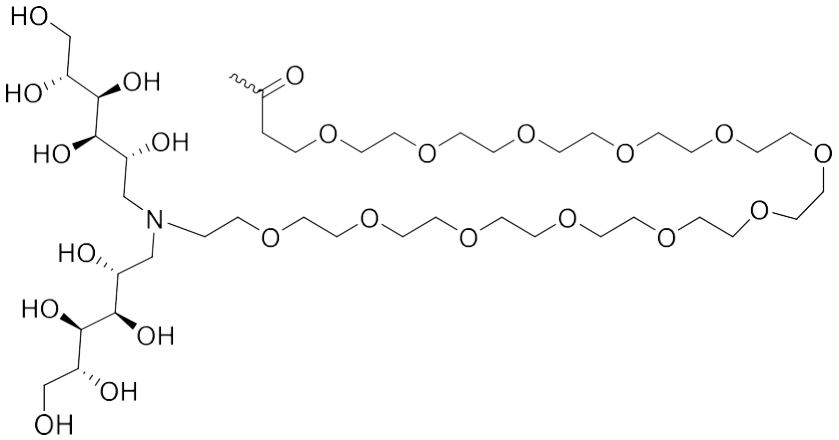
;



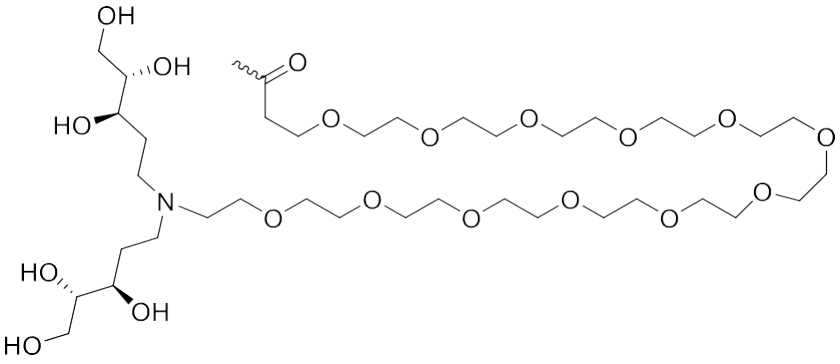
;



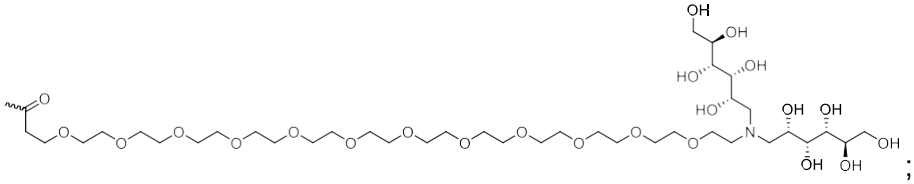
;



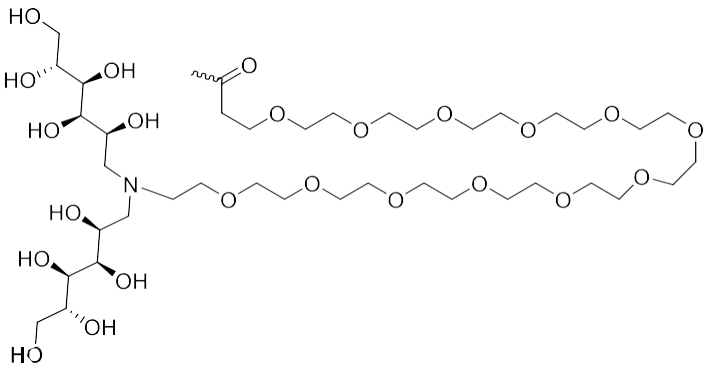
;



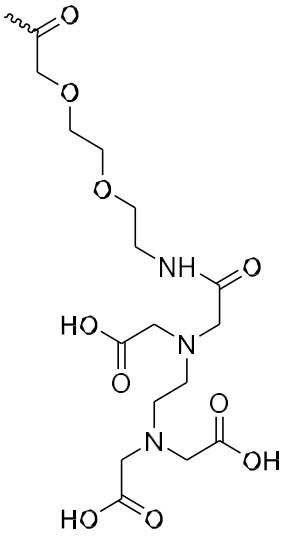
;



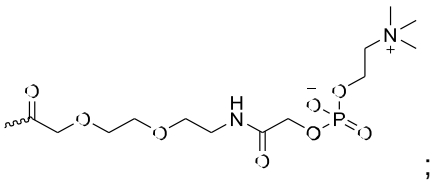
;



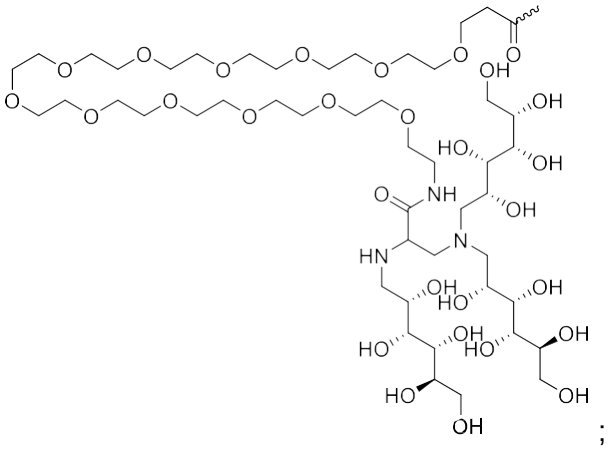
;



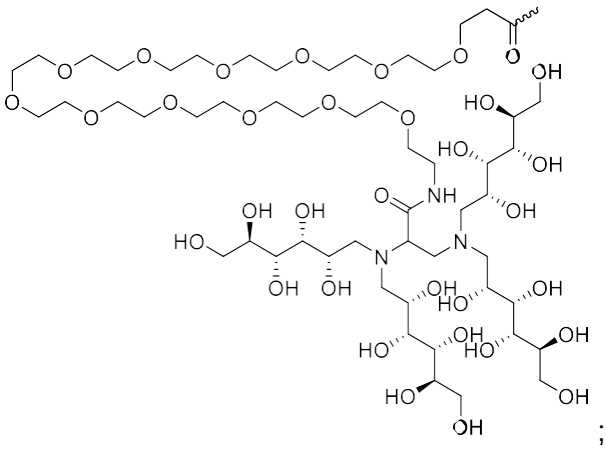
;



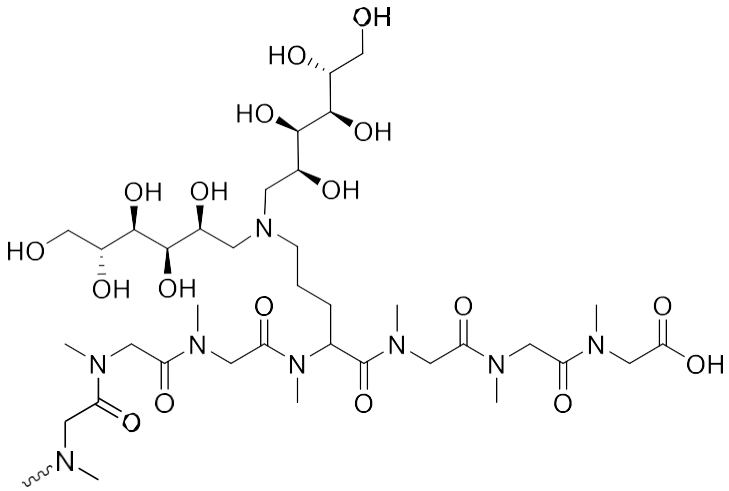
;



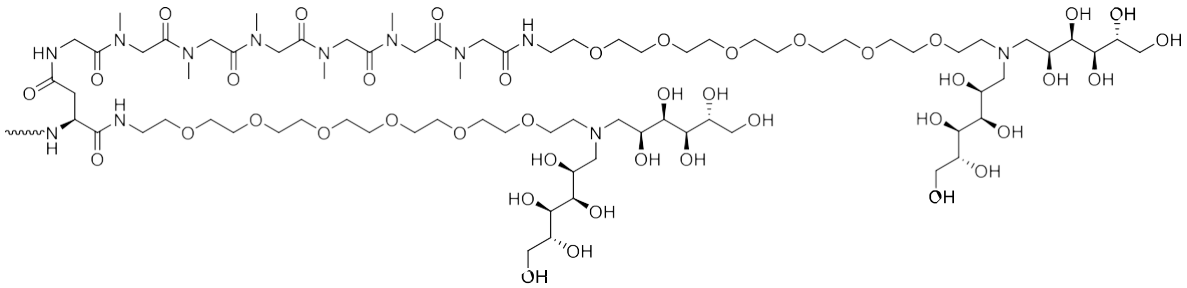
;



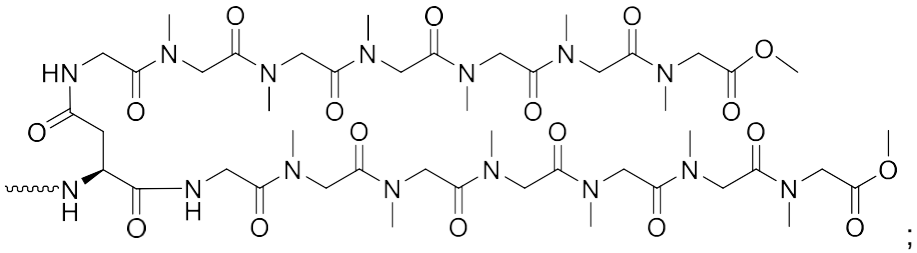
;



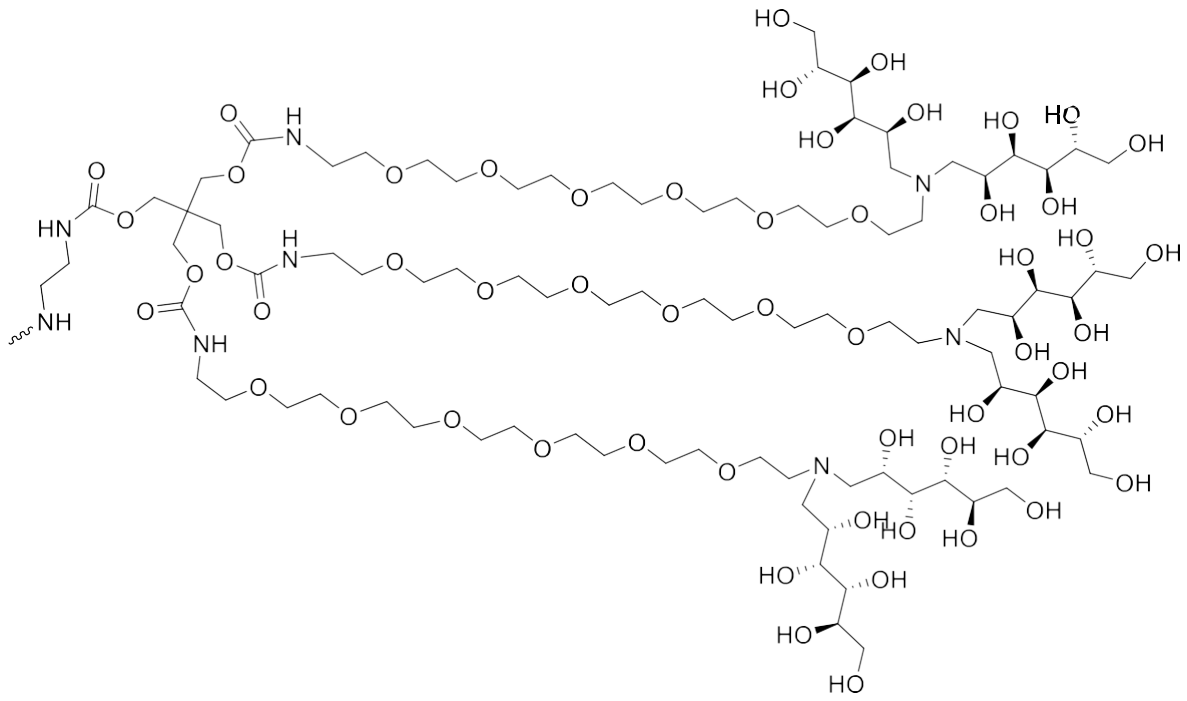
;



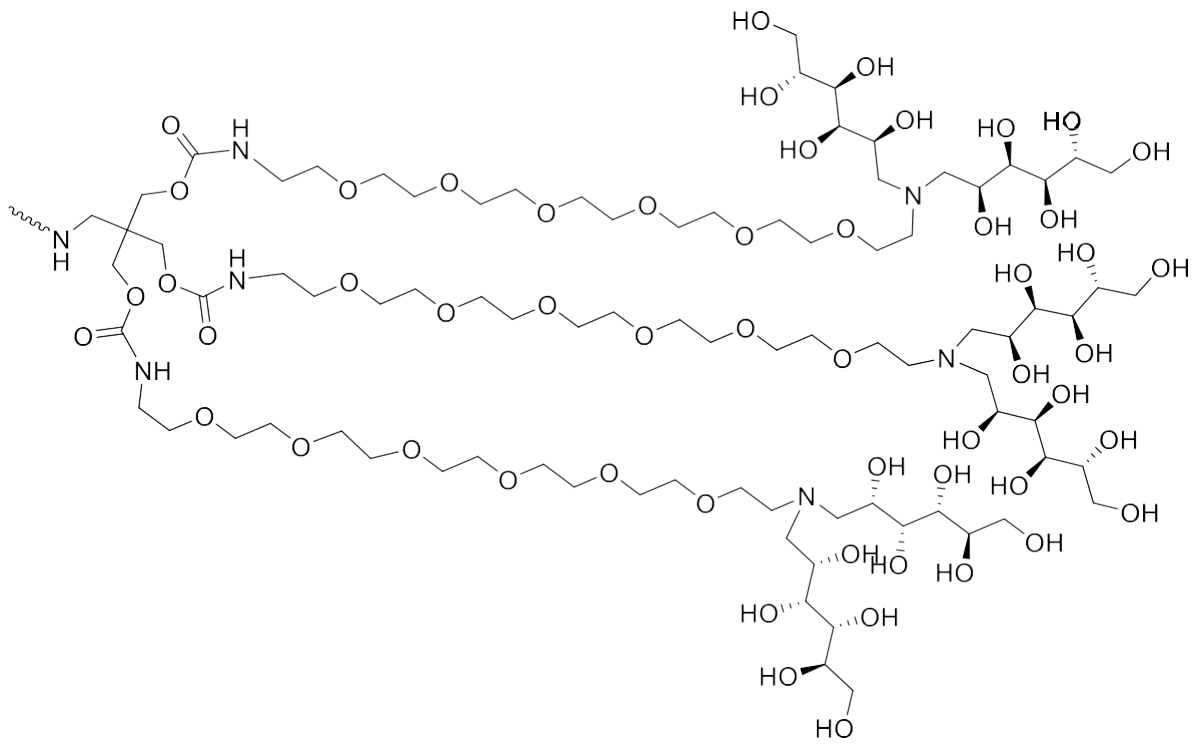
;

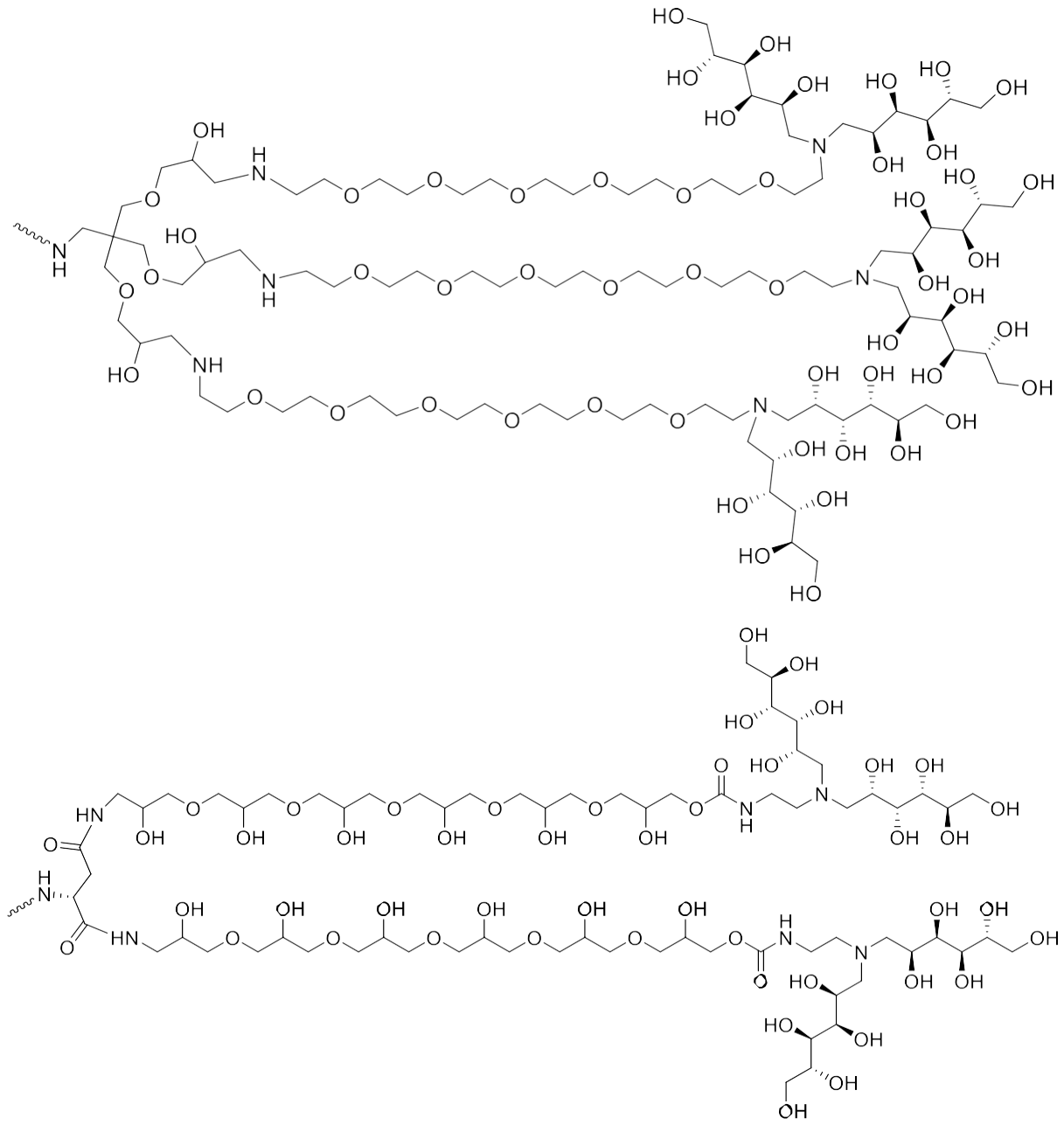


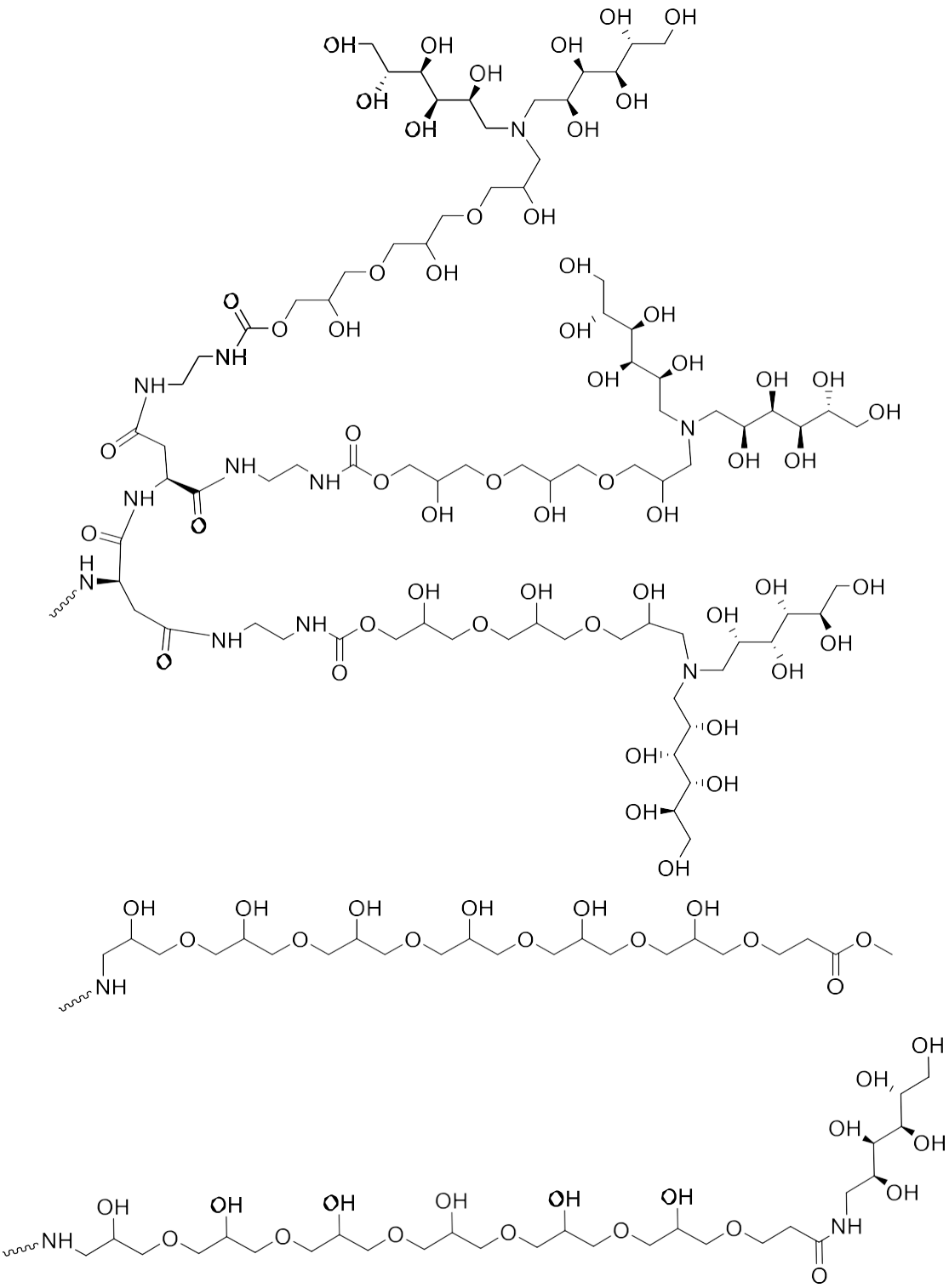
;

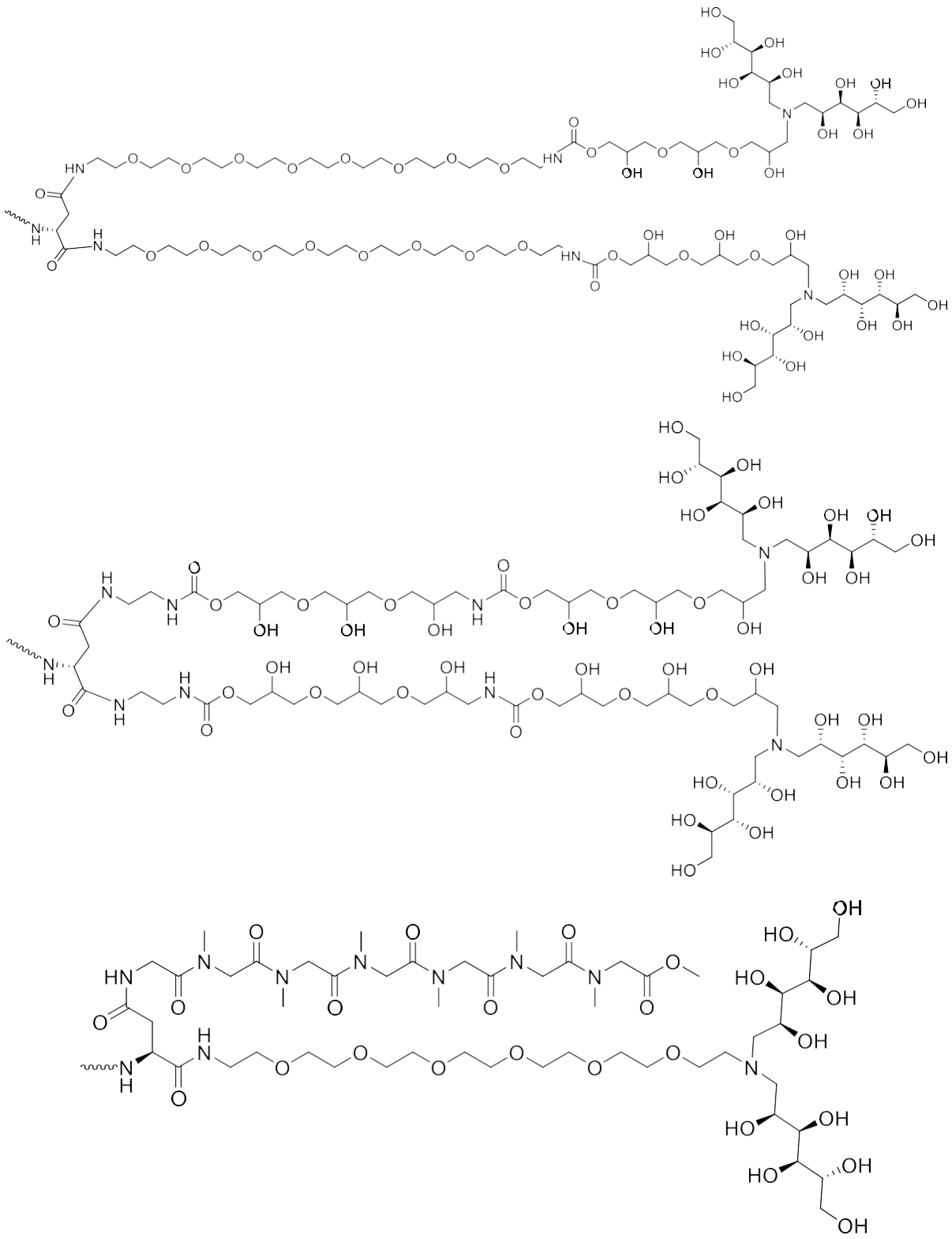


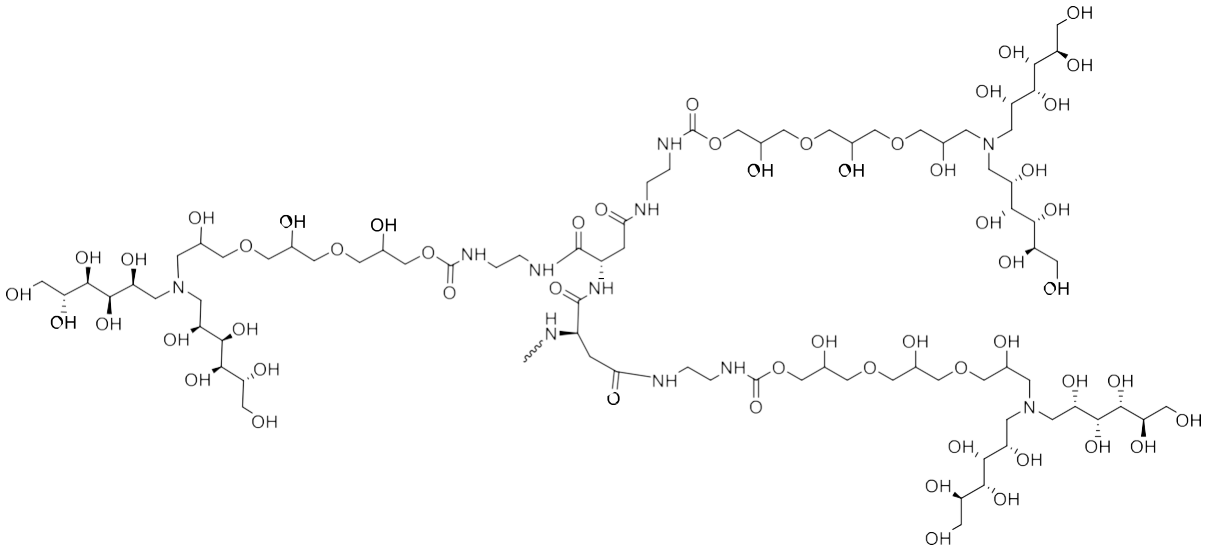
;

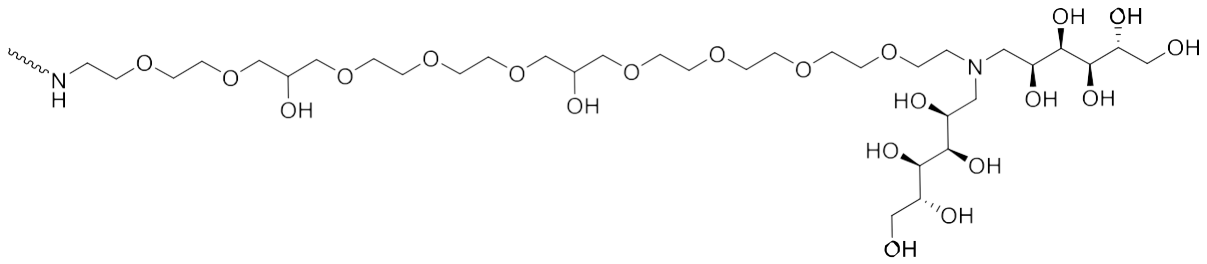


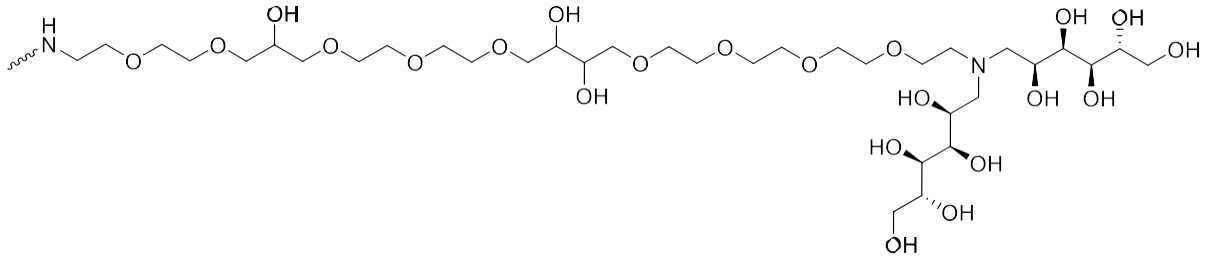


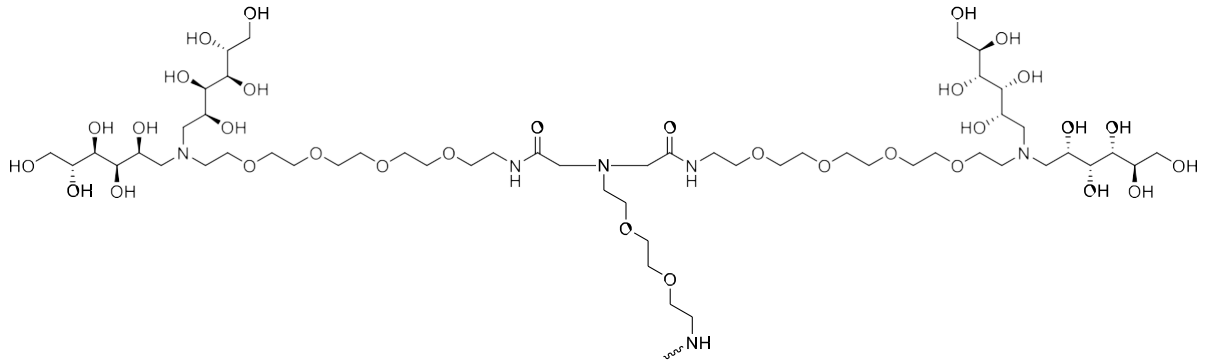


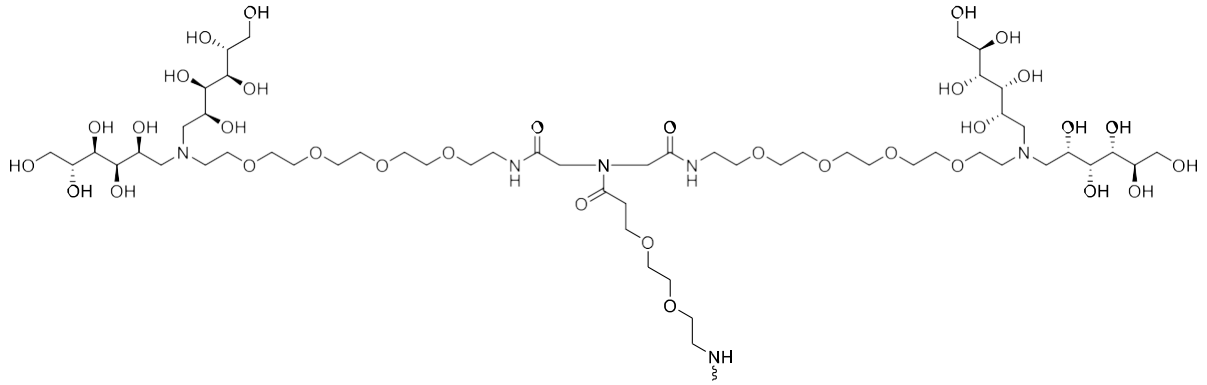


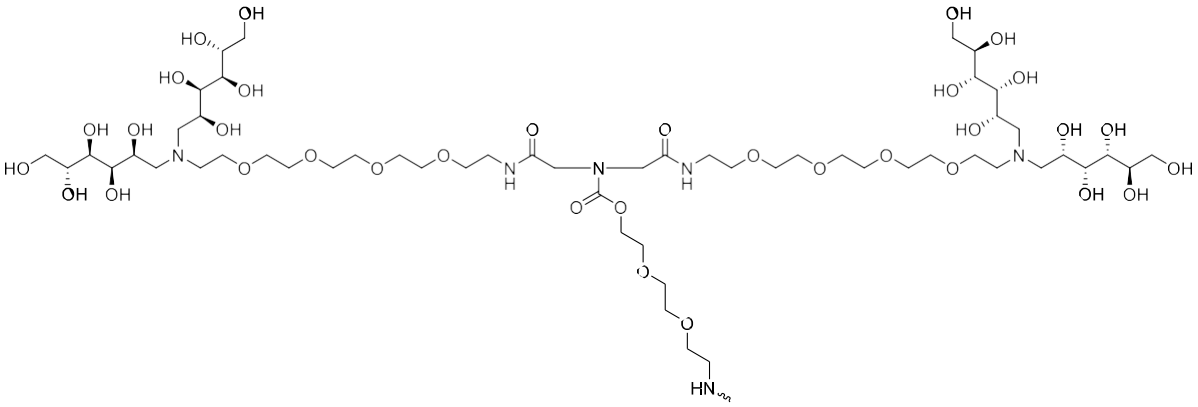


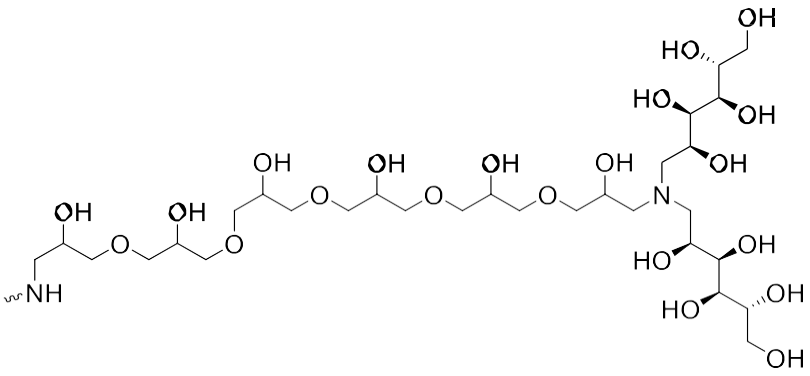


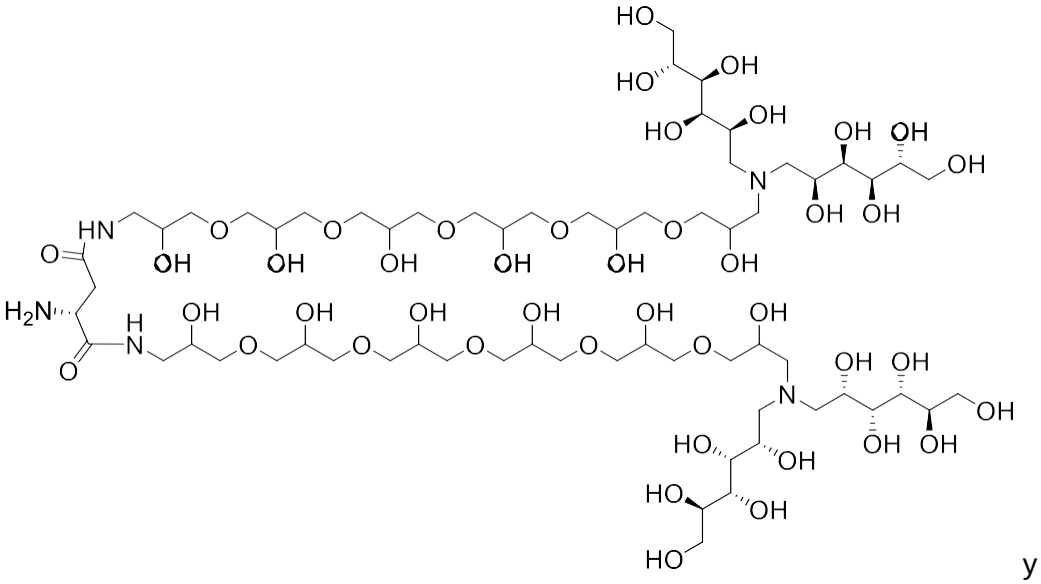




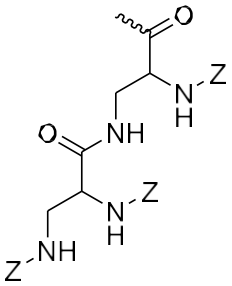




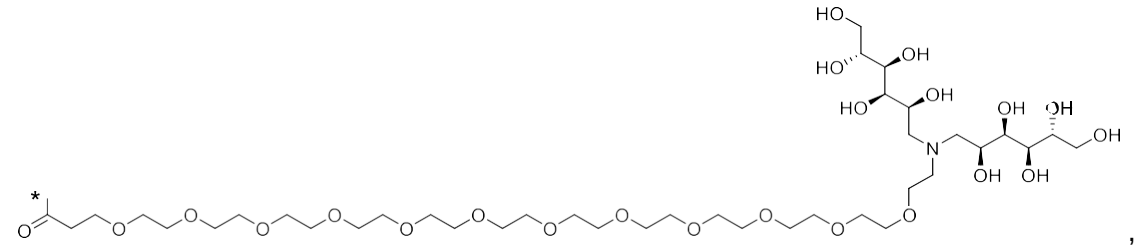


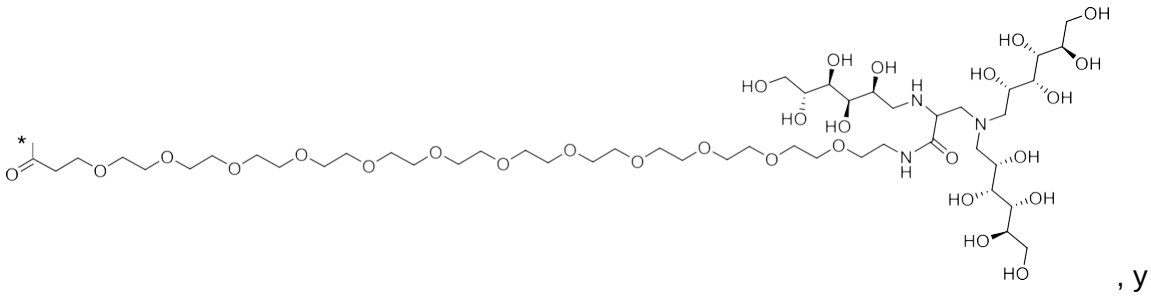


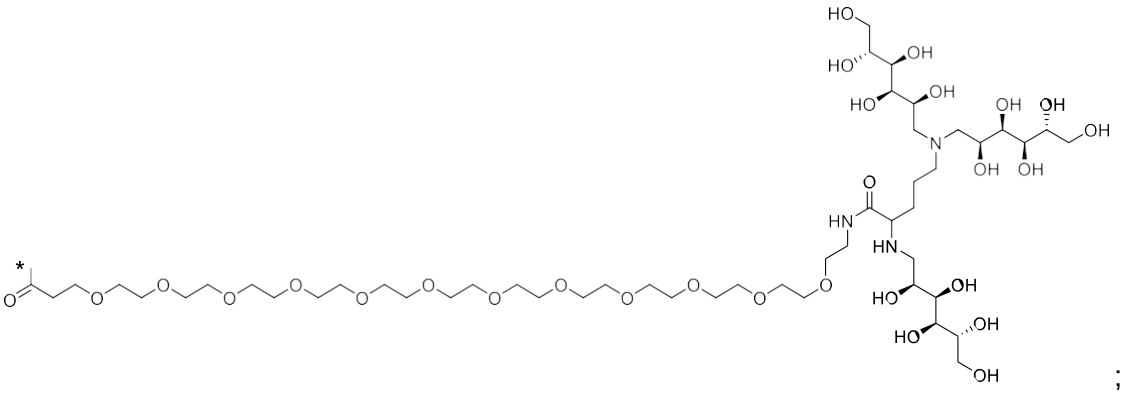
y



donde cada Z se une por * y se selecciona individualmente entre:


,


, y


;

donde cada 〰 es un sitio de unión a R^b, o al grupo enzimáticamente escindible.

57. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, donde el grupo polar comprende por lo menos una unidad carboxilo que tiene la siguiente fórmula:

$$R^{70} - L^{70} - *$$

(XXXX)

o un estereoisómero o sal de la misma, donde:

(a)

L^{70} se selecciona entre C_1-C_8 alquileno, C_1-C_8 alquileno-C(O)-, -C(O)-C_1-C_8 alquileno-, y -C(O)-C_1-C_8 alquileno-C(O)-, y * es un sitio de unión a R^b, al grupo enzimáticamente escindible, o al resto del grupo polar;

R^{70} es ~$NR^{71}(R^{72}$-$R^{73})$, donde R^{71} se selecciona entre H, C_1-C_{12} alquilo, C_1-C_{12} alquilo sustituido, o polietilenglicol (que tiene opcionalmente entre 1 y 12 subunidades etilenglicol), R^{72} es un enlace o se selecciona entre C_1-C_3 alquileno opcionalmente sustituido, éter opcionalmente sustituido, tioéter opcionalmente sustituido, cetona opcionalmente sustituida, amida opcionalmente sustituida, polietilenglicol (que tiene opcionalmente entre 1 y 12 subunidades etilenglicol), carbociclo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido, y R^{73} es un

carboxilo o policarboxilo, donde el policarboxilo comprende entre 1 y 10, o entre 1 y 6, o entre 1 y 4 grupos carboxilo, donde los grupos carboxilo están interconectados por alquilo, alquileno, alquilo sustituido, alquileno sustituido, heteroalquilo, heteroalquileno, amino y/o amida; o

(b)

L^{70} se selecciona entre C_1-C_8 alquileno, C_1-C_8 alquileno-C(O)-, -C(O)-C_1-C_8 alquileno-, y -C(O)-C_1-C_8 alquileno-C(O)-, y * es un sitio de unión a R^b, al grupo enzimáticamente escindible, o al resto del grupo polar;

R^{70} es ~$NR^{71}(R^{75}\text{-}(R^{73})_2)$, donde R^{71} se selecciona entre H, C_1-C_{12} alquilo, C_1-C_{12} alquilo sustituido, o polietilenglicol (que tiene opcionalmente entre 1 y 12 subunidades etilenglicol), R^{75} es un C_1-C_3 alquileno ramificado opcionalmente sustituido, éter opcionalmente sustituido, tioéter opcionalmente sustituido, cetona opcionalmente sustituida, amida opcionalmente sustituida, polietilenglicol (que tiene opcionalmente entre 1 y 12 subunidades etilenglicol), carbociclo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido y cada R^{73} es independientemente carboxilo o policarboxilo, donde el policarboxilo comprende entre 1 y 10, o entre 1 y 6, o entre 1 y 4 grupos carboxilo, donde los grupos carboxilo están interconectados por alquilo, alquileno, alquilo sustituido, alquileno sustituido, heteroalquilo, heteroalquileno, amino y/o amida; o

(c)

L^{70} se selecciona entre C_1-C_8 alquileno, C_1-C_8 alquileno-C(O)-, -C(O)-C_1-C_8 alquileno-, y -C(O)-C_1-C_8 alquileno-C(O)-, y * es un sitio de unión a R^b, al grupo enzimáticamente escindible, o al resto del grupo polar;

R^{70} es ~$N(R^{74}\text{-}R^{73})(R^{72}\text{-}R^{73})$, donde R^{72} y R^{74} se seleccionan independientemente en cada caso entre C_1-C_3 alquileno opcionalmente sustituido, éter opcionalmente sustituido, tioéter opcionalmente sustituido, cetona opcionalmente sustituida, amida opcionalmente sustituida, polietilenglicol (que tiene opcionalmente entre 1 y 12 subunidades etilenglicol), carbociclo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido, y cada R^{73} es independientemente carboxilo o policarboxilo, donde el policarboxilo comprende entre 1 y 10, o entre 1 y 6, o entre 1 y 4 grupos carboxilo, donde los grupos carboxilo están interconectados por alquilo, alquileno, alquilo sustituido, alquileno sustituido, heteroalquilo, heteroalquileno, amino y/o amida.

58. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 57, que comprende un grupo polar que incluye la unidad Polímero y una unidad sacárido.

59. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 57, que comprende un grupo polar que incluye por lo menos dos unidades Polímero.

60. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 57, que comprende un grupo polar que incluye la unidad Polímero y una unidad carboxilo.

61. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 57, que comprende por lo menos dos grupos polares.

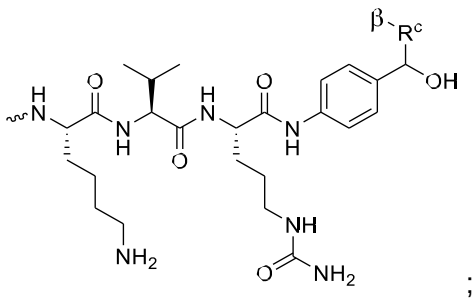
62. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 57, que comprende un grupo polar que incluye la unidad Polímero, la unidad sacárido y la unidad carboxilo.

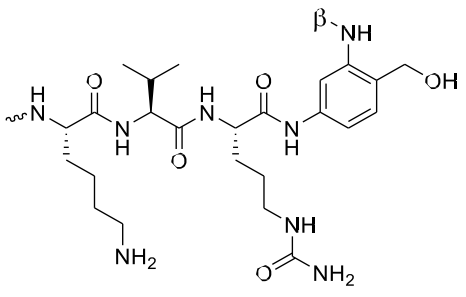
63. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 57, que comprende un grupo polar que incluye por lo menos dos unidades Polímero, por lo menos una unidad sacárido y por lo menos una unidad carboxilo.

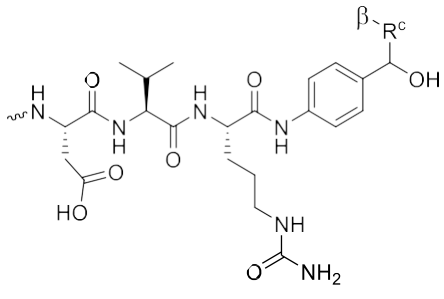
64. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 57, donde el grupo enzimáticamente escindible comprende por lo menos dos unidades de aminoácido.

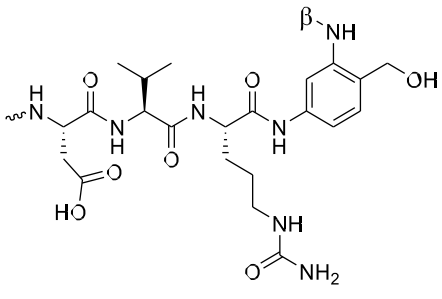
65. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 64, que comprende por lo menos uno de los grupos polares unidos al grupo enzimáticamente escindible.

66. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 1-64, que tiene una de las siguientes estructuras:

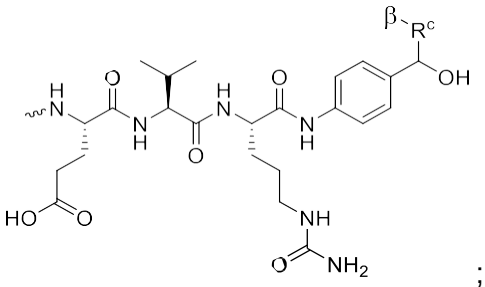
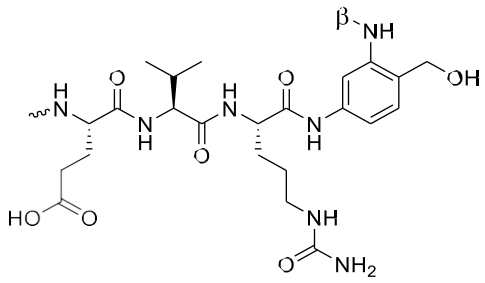
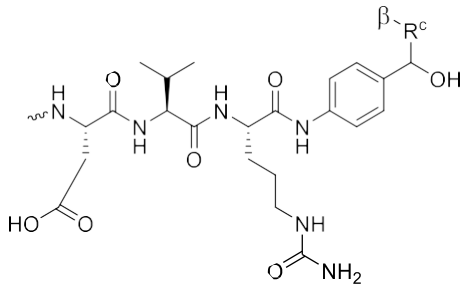
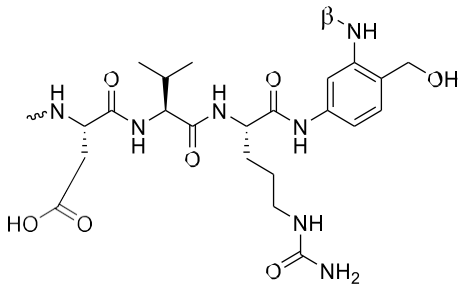
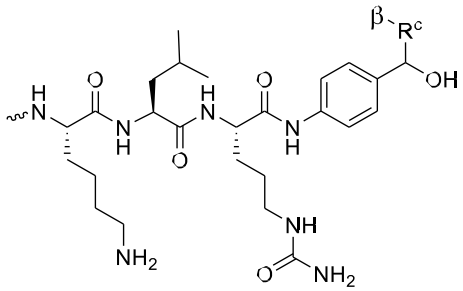
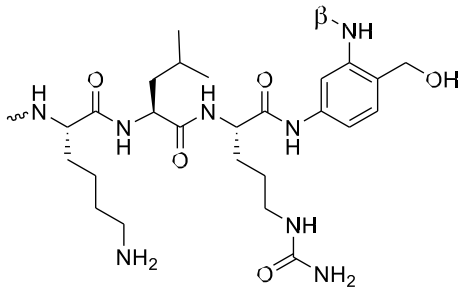
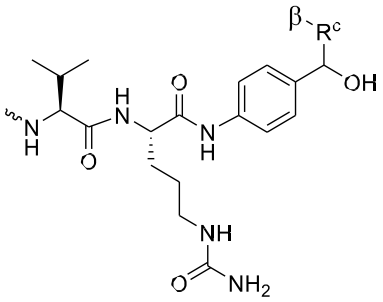
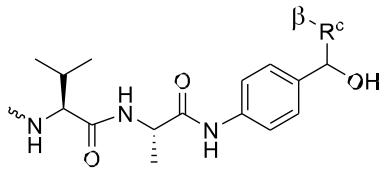
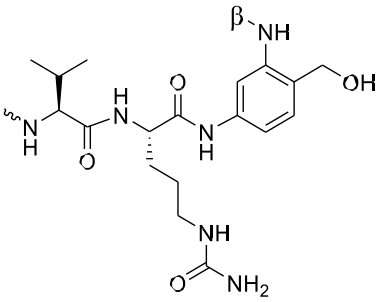
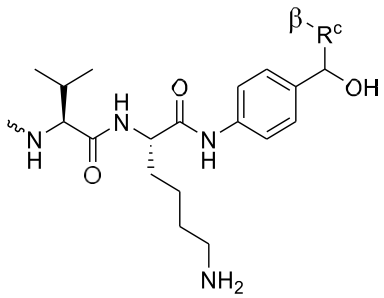
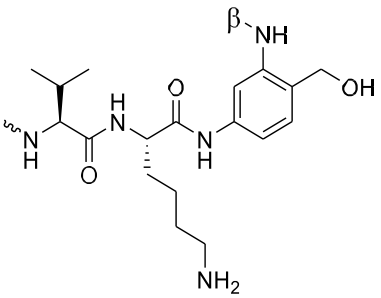
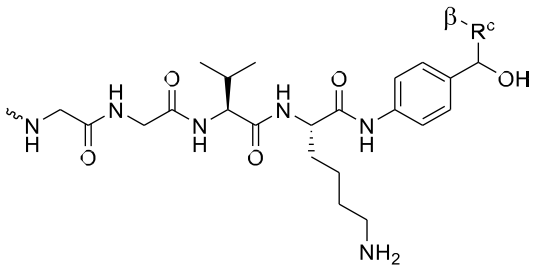
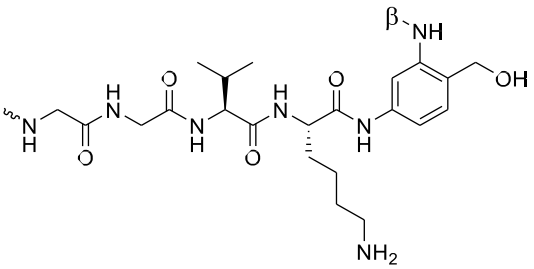


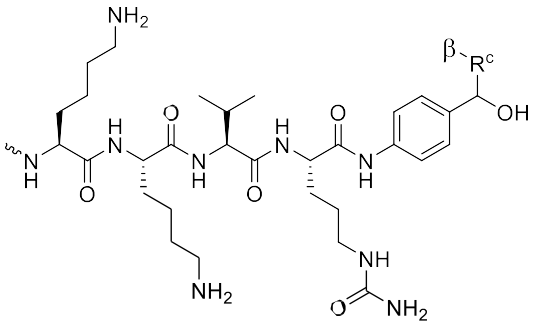
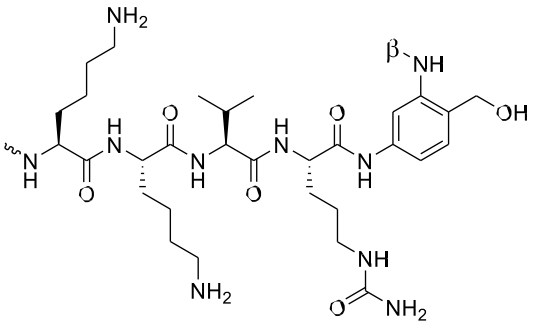
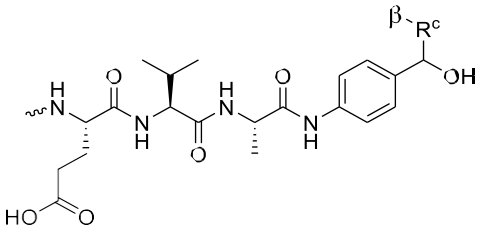
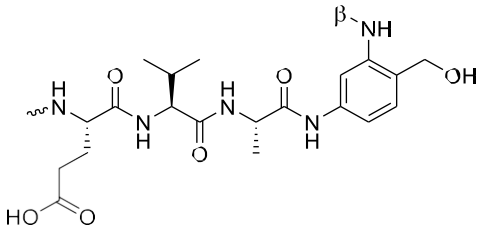
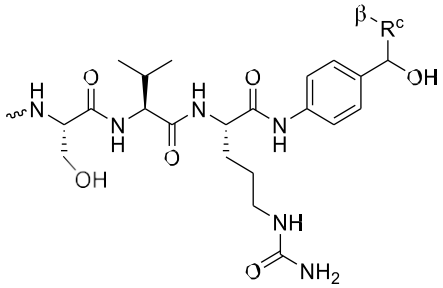
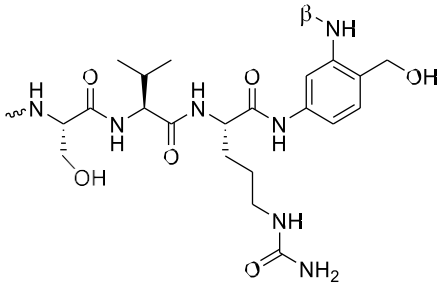
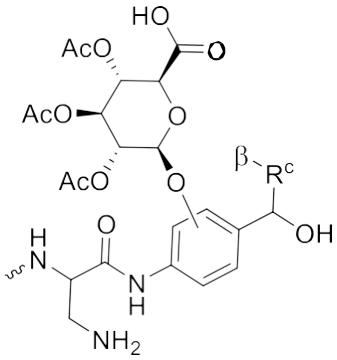
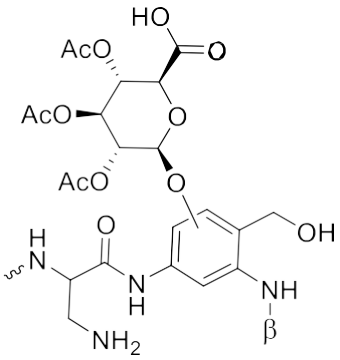
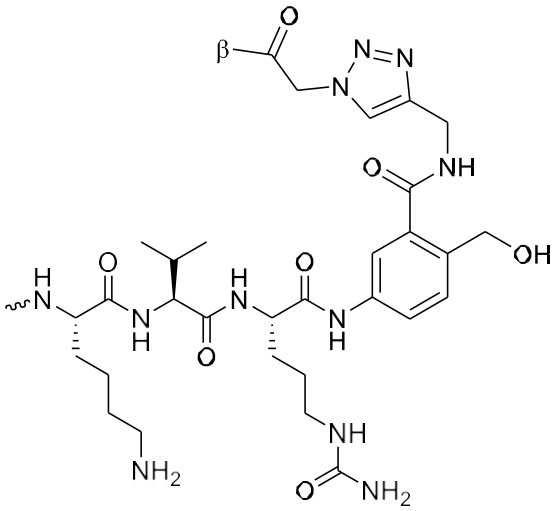
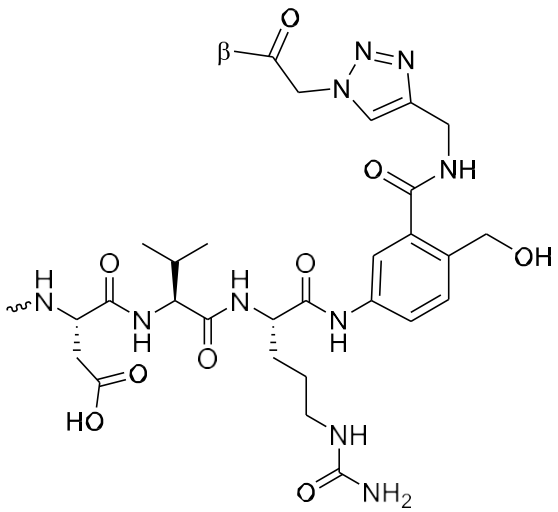
;


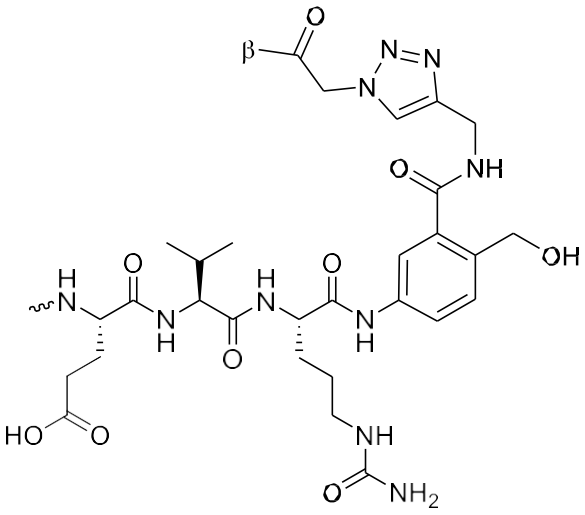
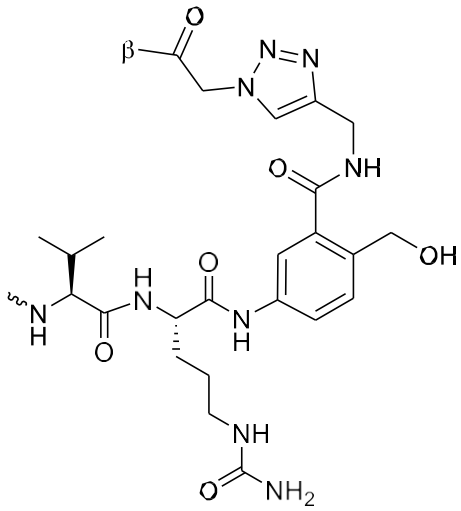
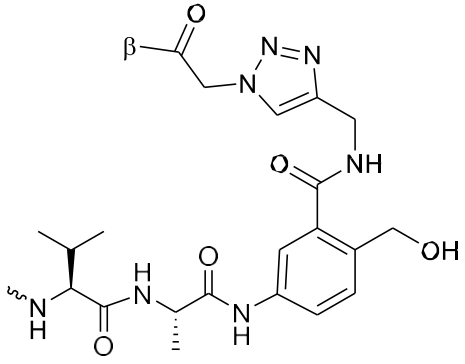
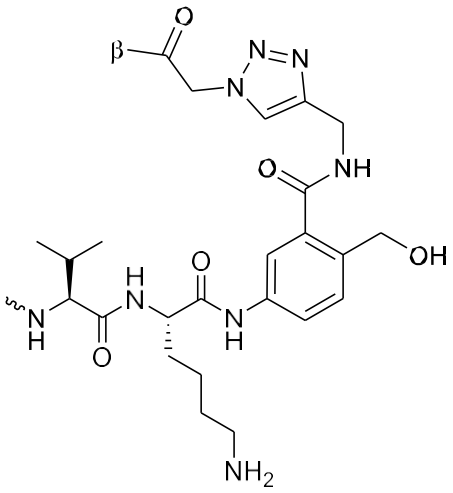
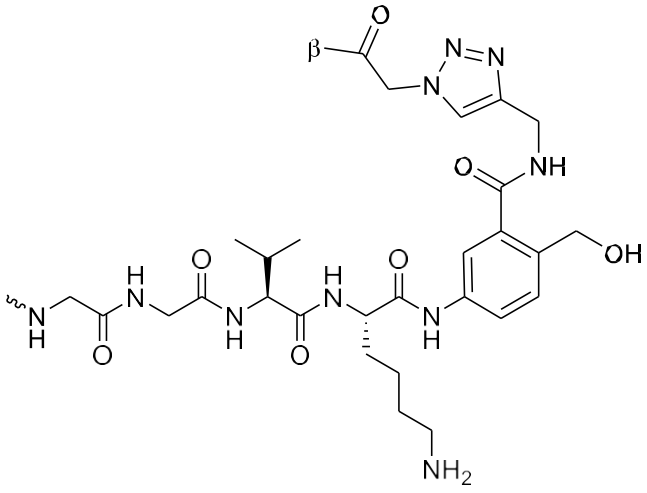
;


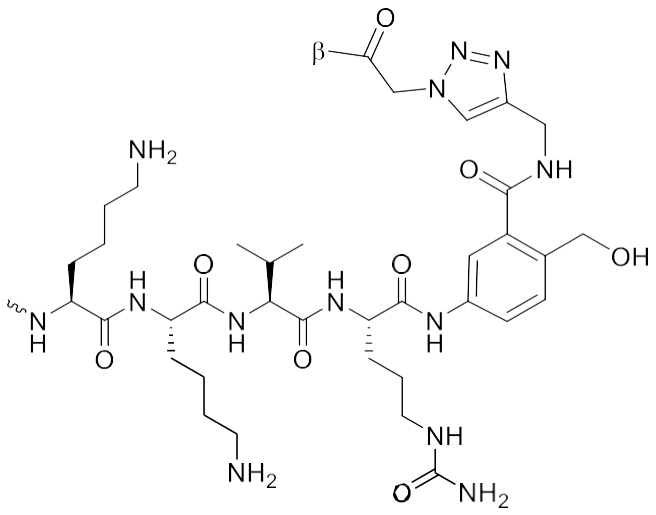
;


;

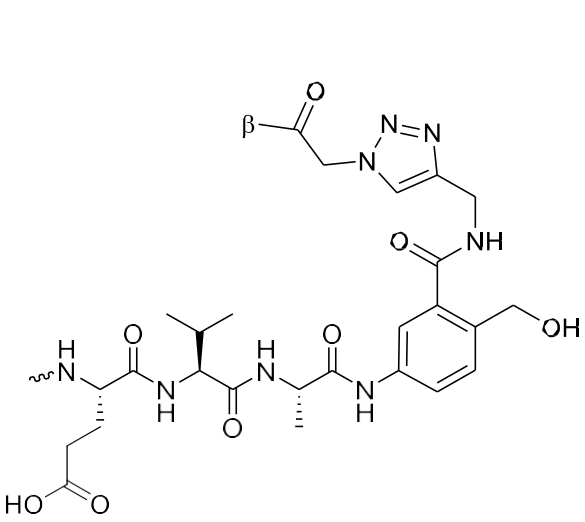

;

;

;

;

;

;

;

;

;

;

;

;

;


;

;

;

;

;

;

o

,

,

,

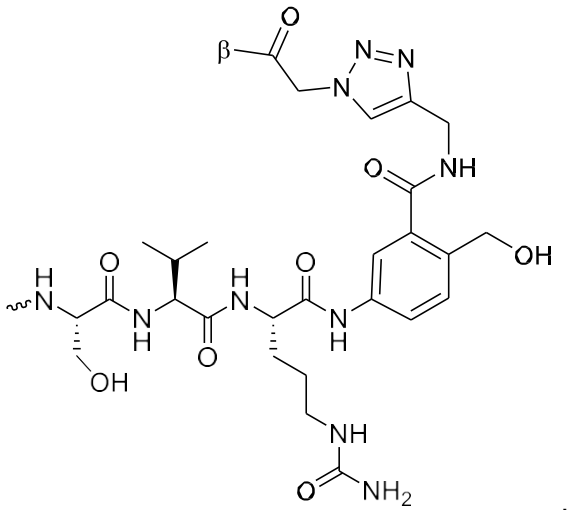

,

,

,

,

,



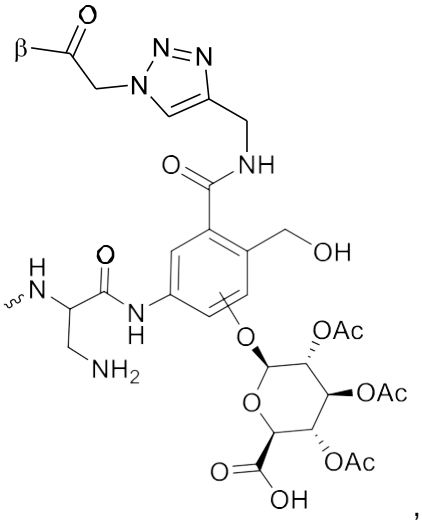
,



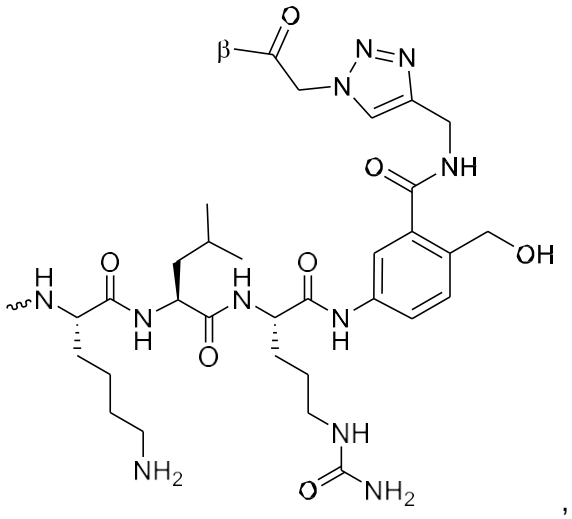
,



,



,



,

donde

R^c es un enlace o C_{1-6} alquileno;

la línea ondulada en el grupo amino indica un sitio de unión para un grupo extensor o, antes de unirse al grupo extensor, indica H;

β— es el sitio de unión al por lo menos un grupo polar; y

el H bencílico en el OH bencílico opcionalmente se reemplaza por un enlace a por lo

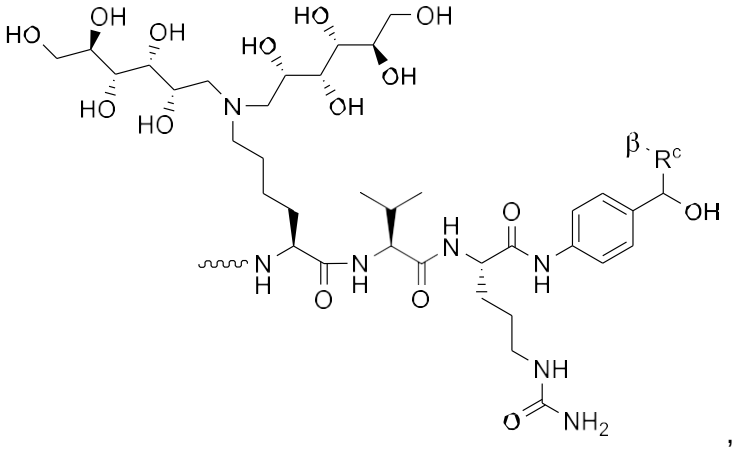
menos una de las unidades de fármaco o al grupo conector unido a por lo menos una de las unidades de fármaco.

67. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 1-66, donde el grupo enzimáticamente escindible comprende un péptido que es escindible por una proteasa intracelular.

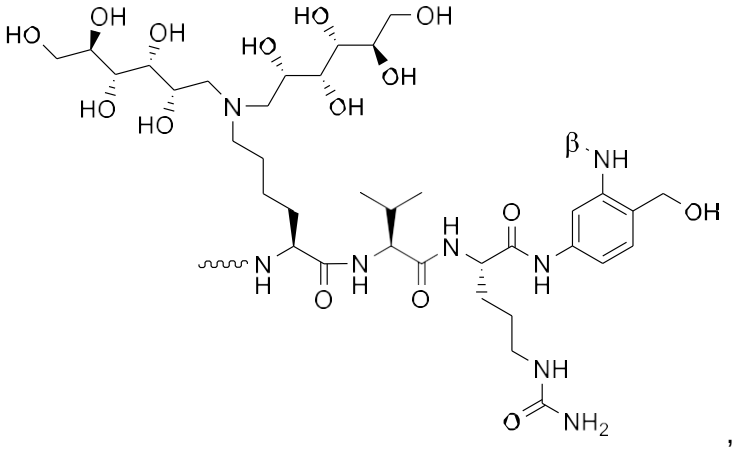
68. El compuesto conector de la reivindicación 67, donde la proteasa intracelular es Catepsina B.

69. El compuesto conector de la reivindicación 68, donde el grupo enzimáticamente escindible comprende un péptido escindible que incluye un péptido valina-citrulina, un péptido valina-alanina, un péptido valina-lisina, un péptido fenilalanina-lisina, o un péptido glicina-glicina-fenilalanina-glicina.

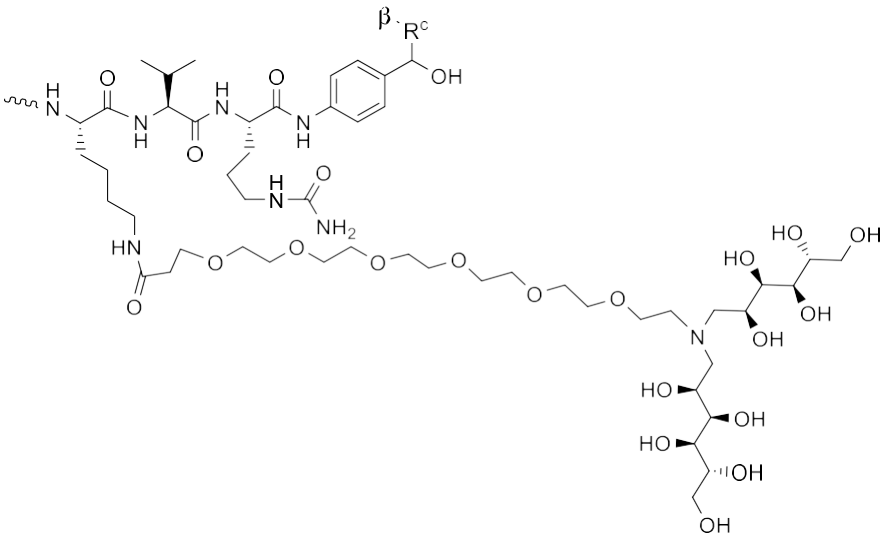
70. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 67-69, que comprende una de las siguientes estructuras:



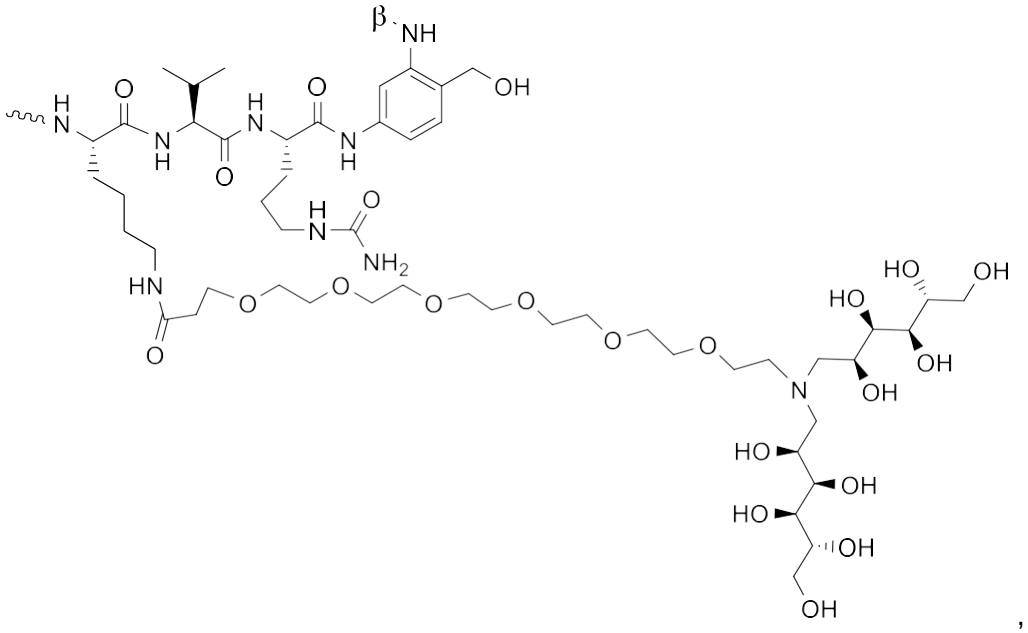
,



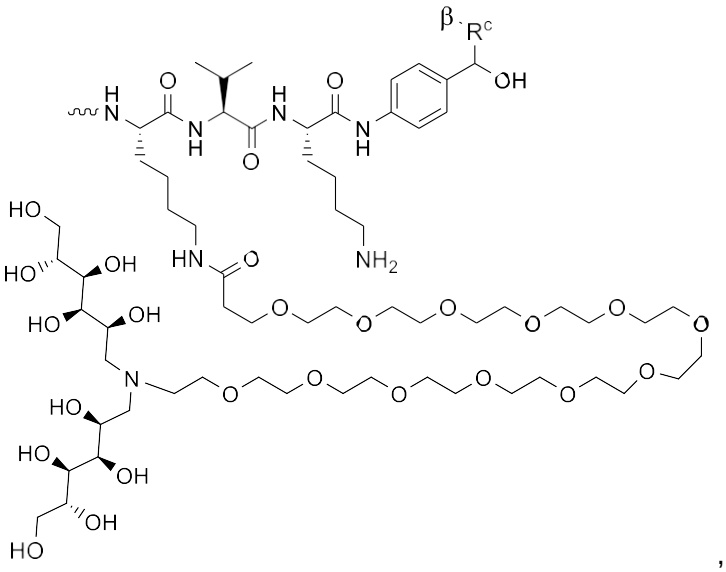
,



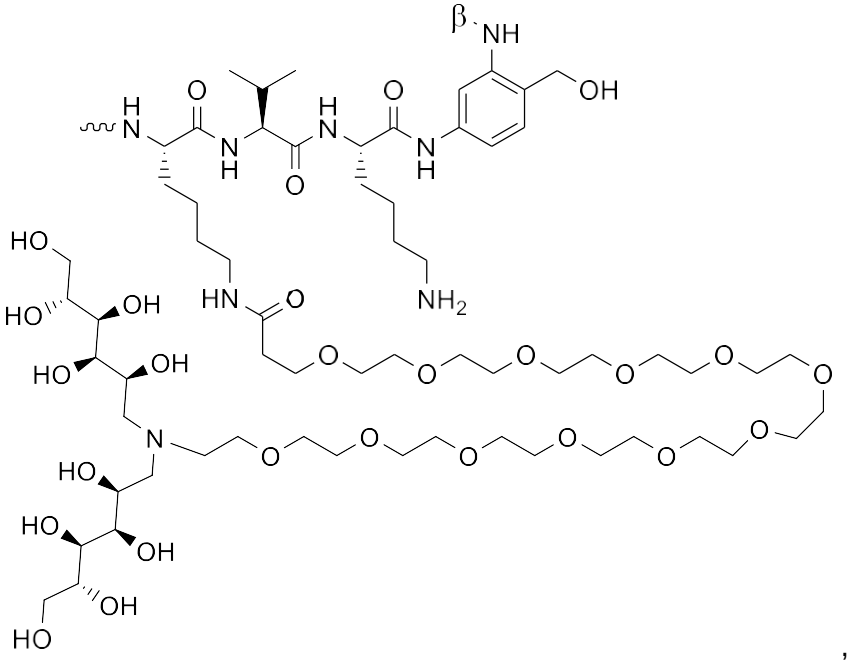
,



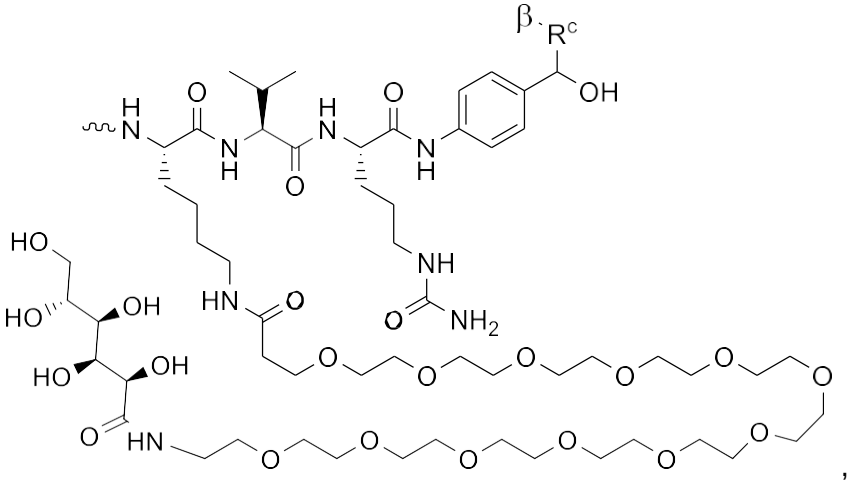
,



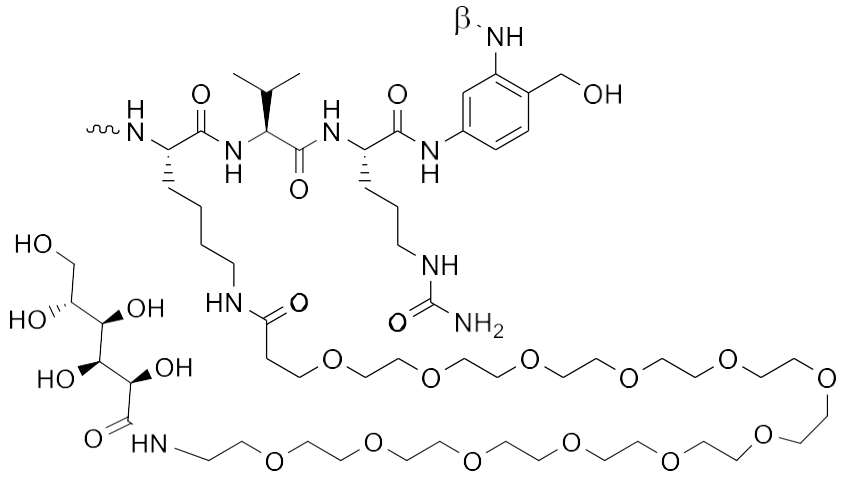
,

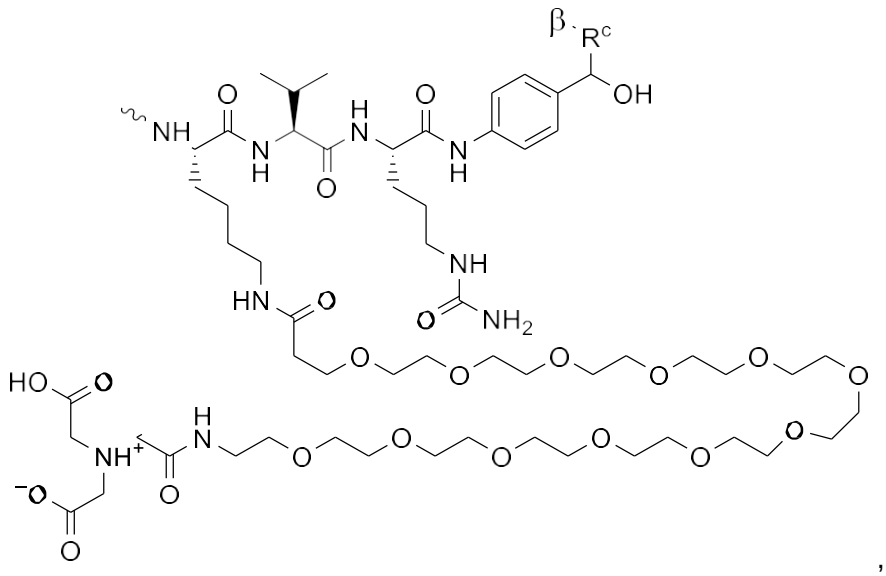


,

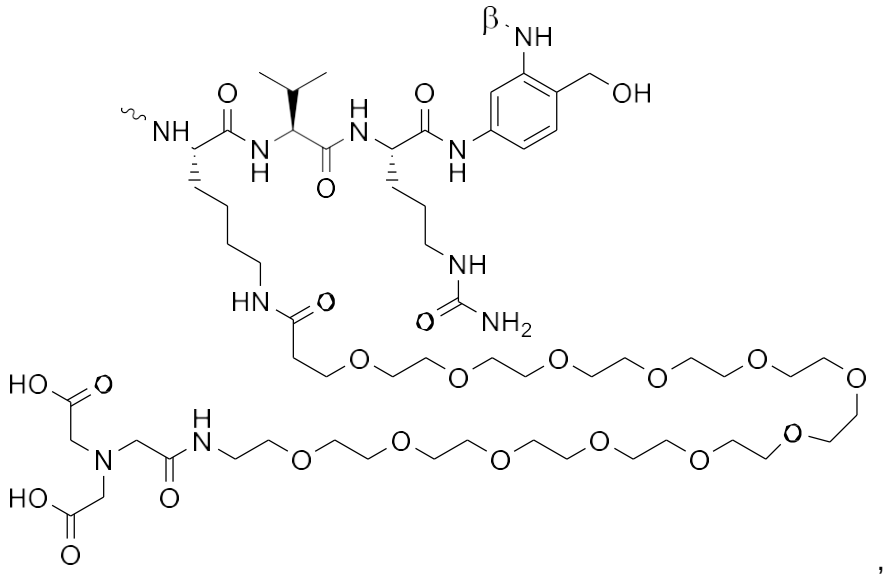


,

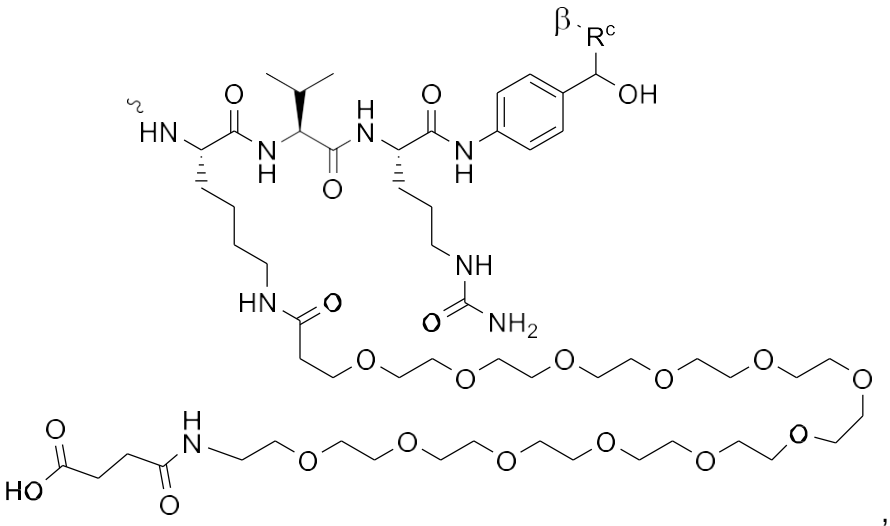




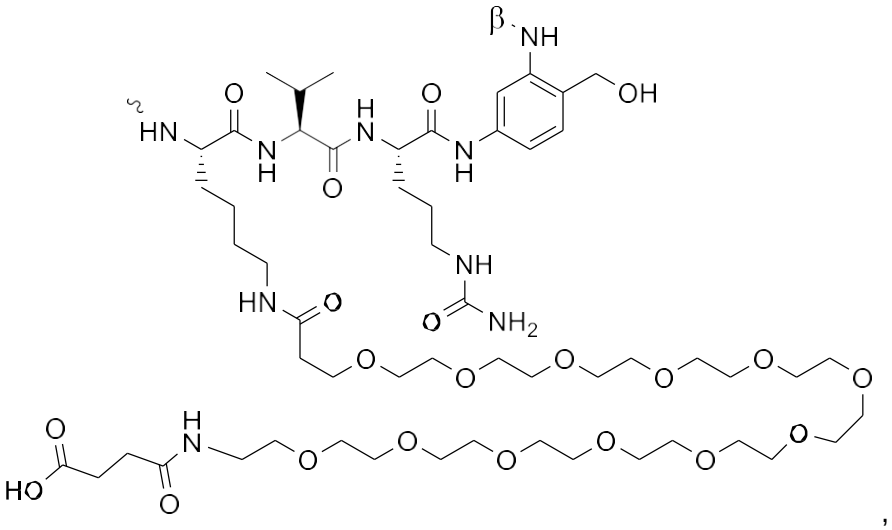
,



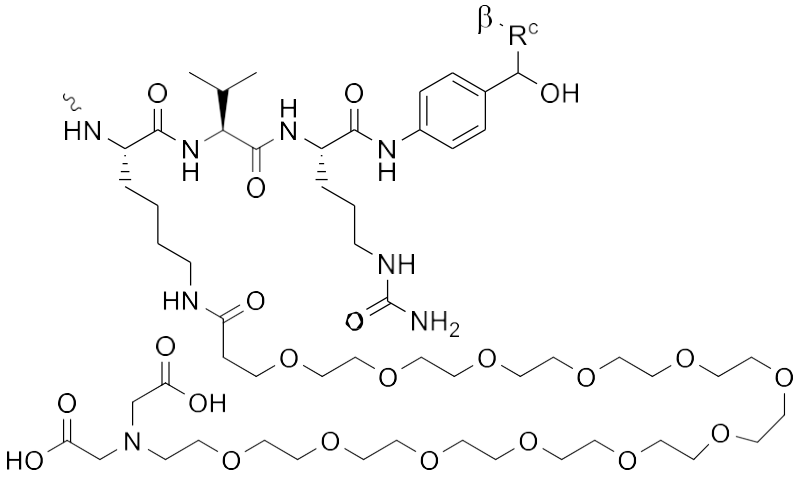
,



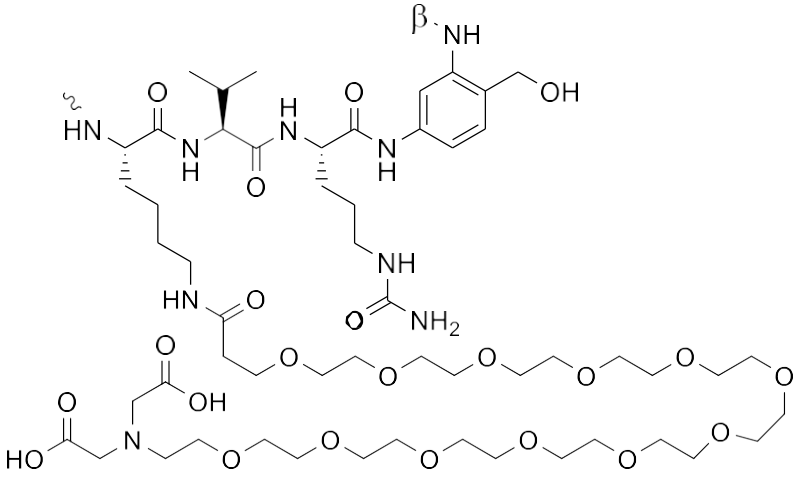
,



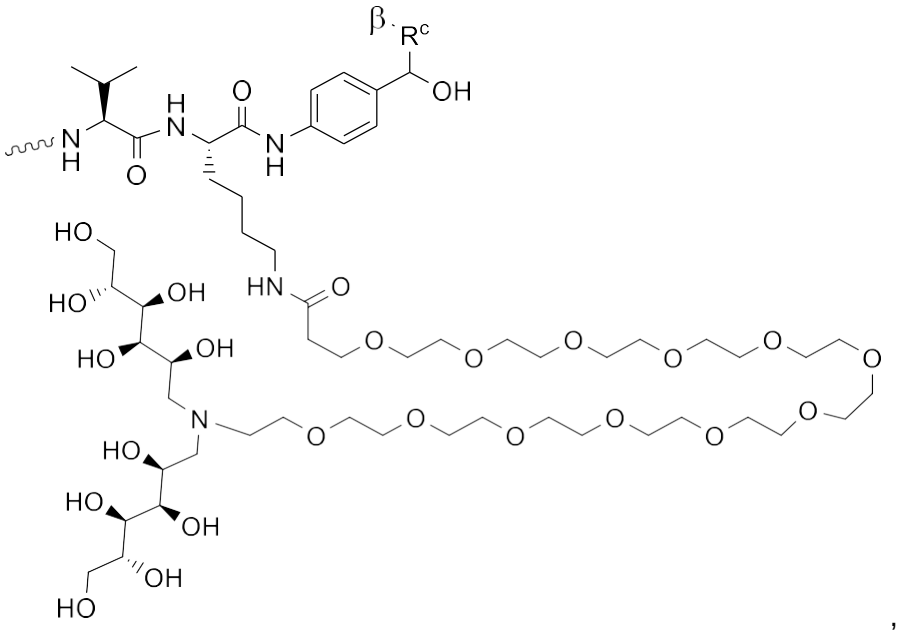
,



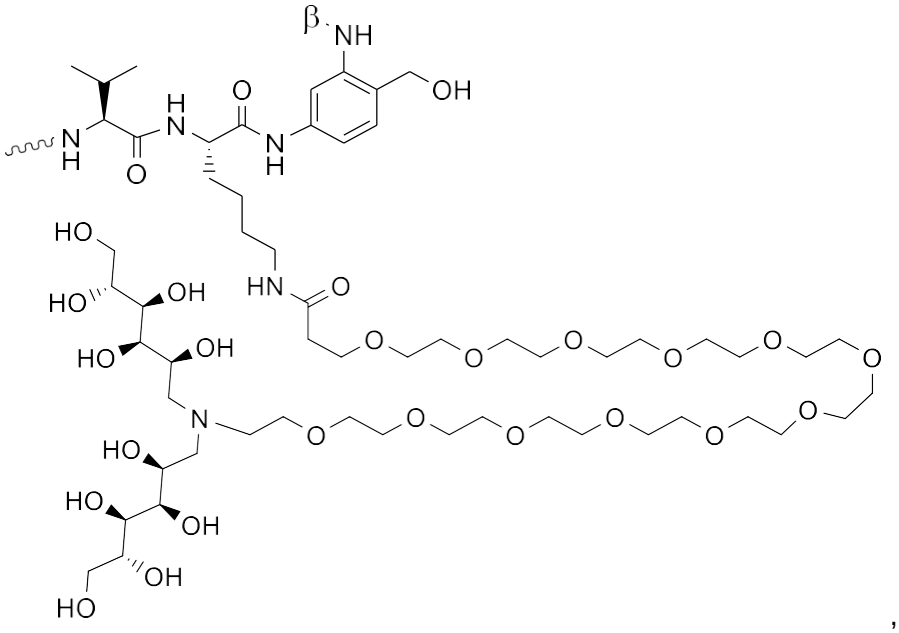
,



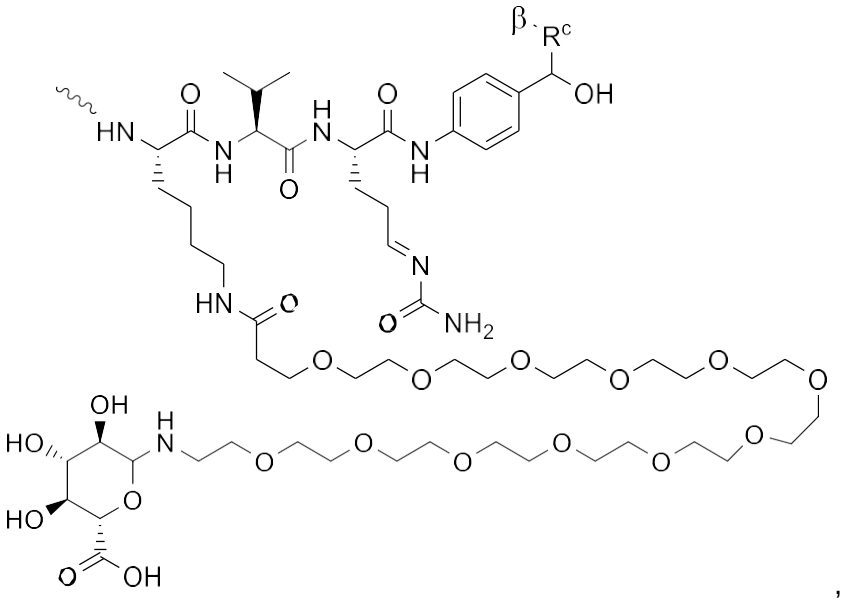
,



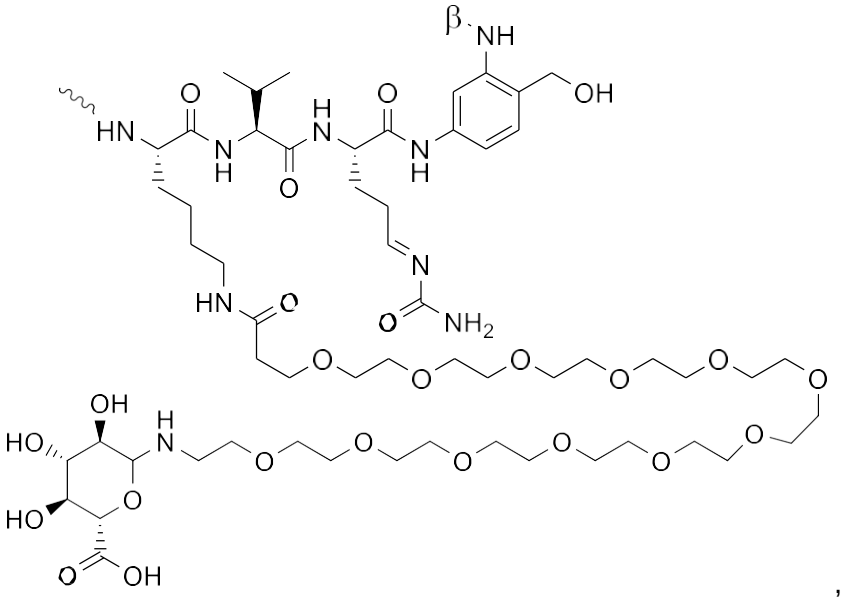
,



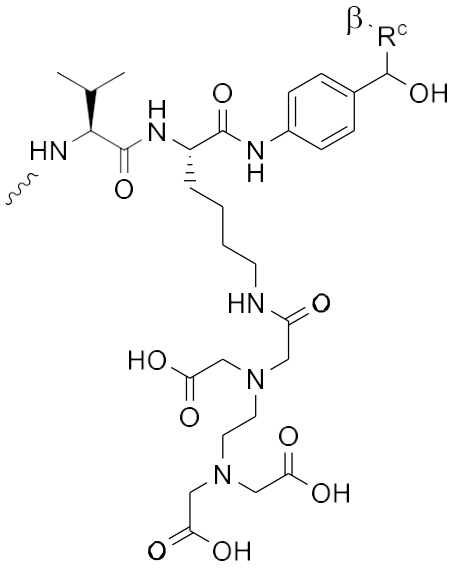
,



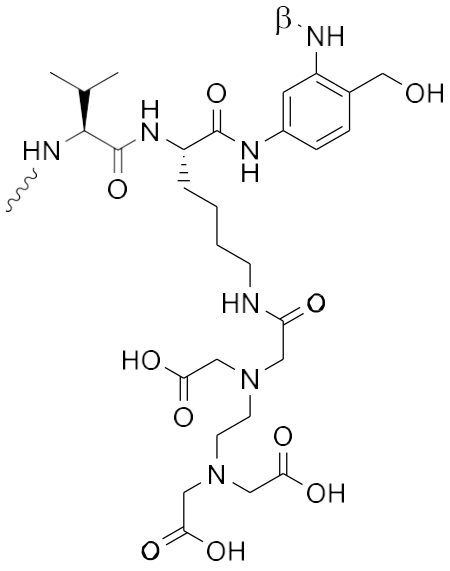
,



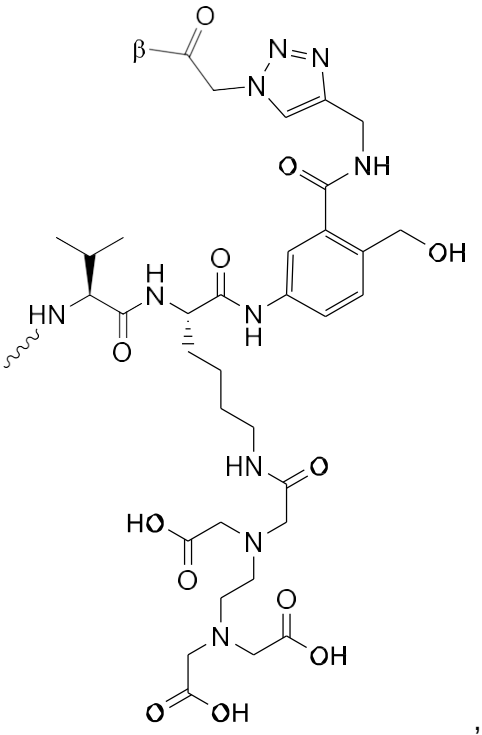
,



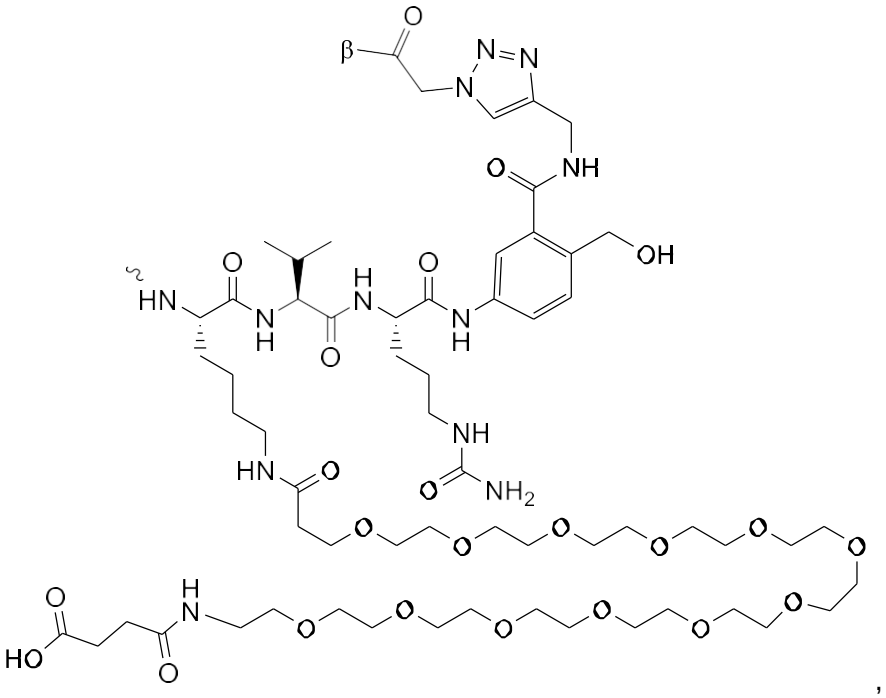
,



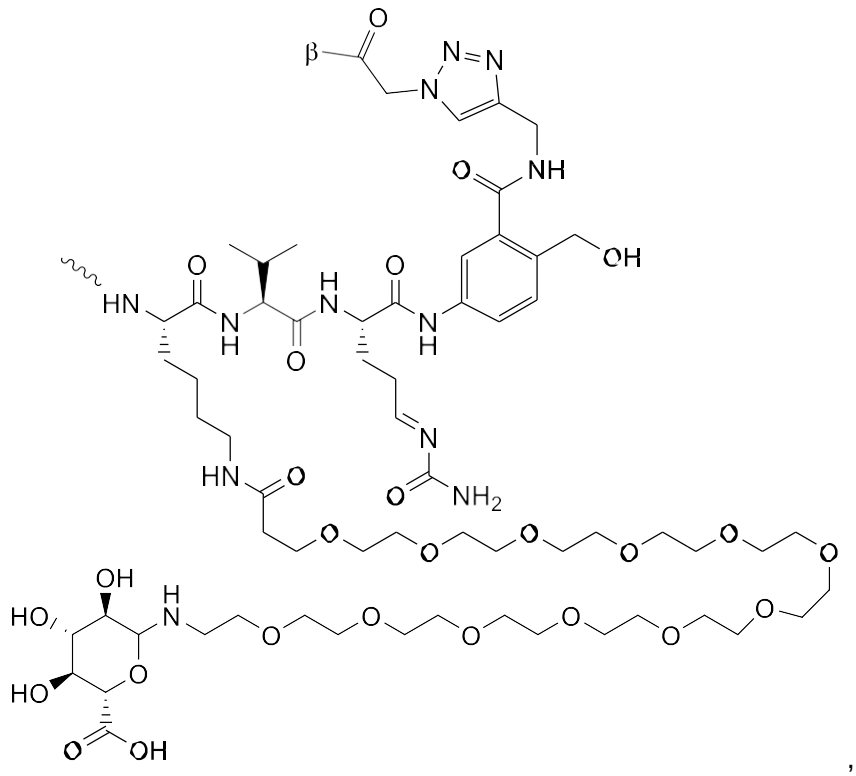
,



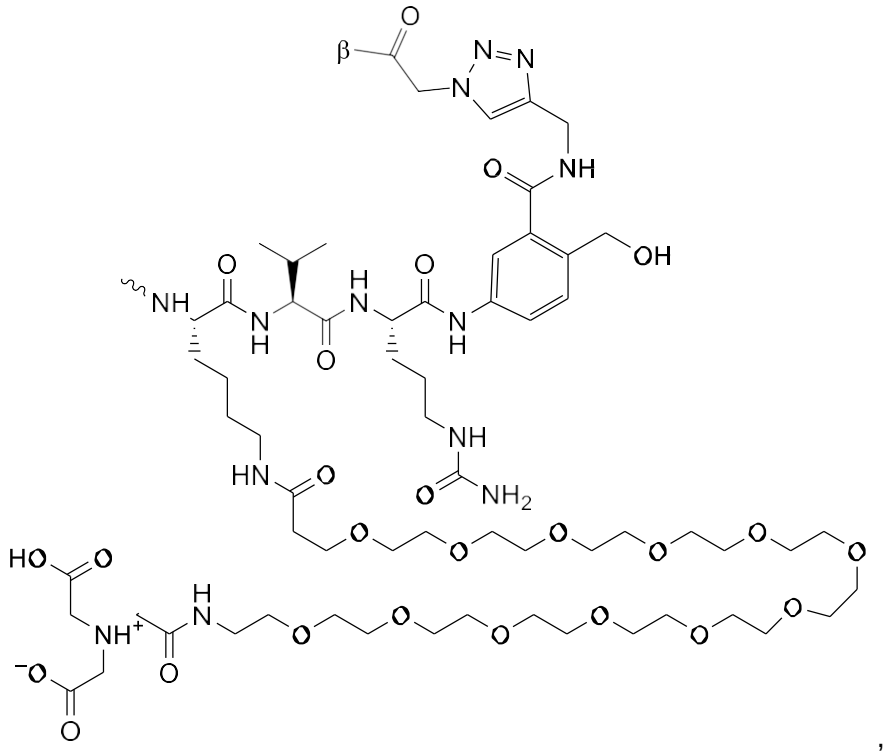
,



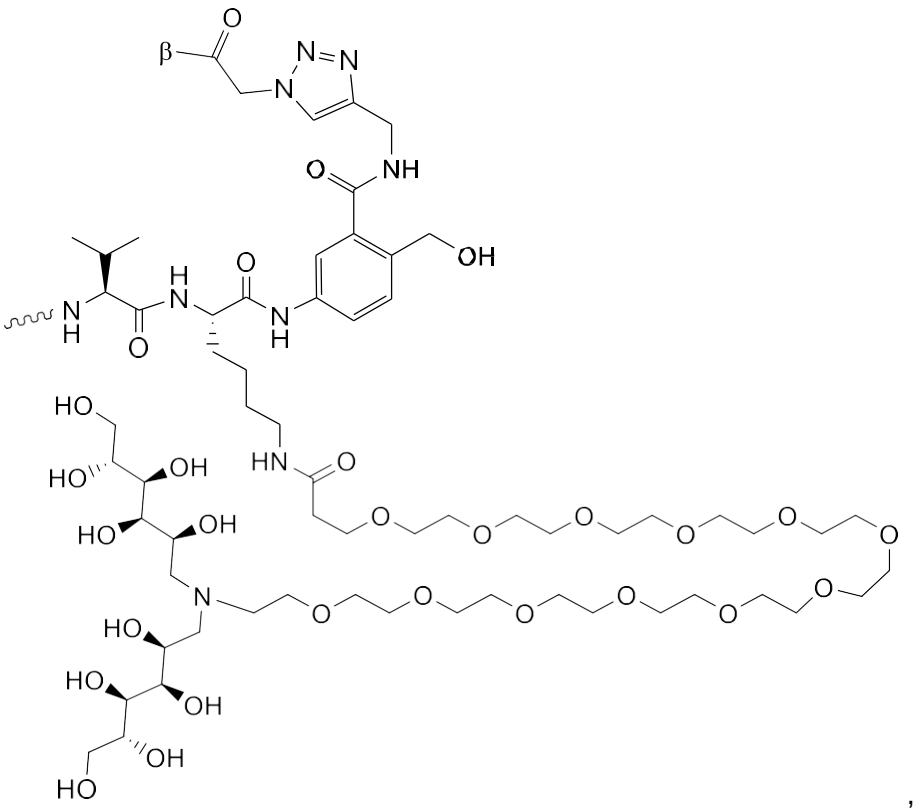
,



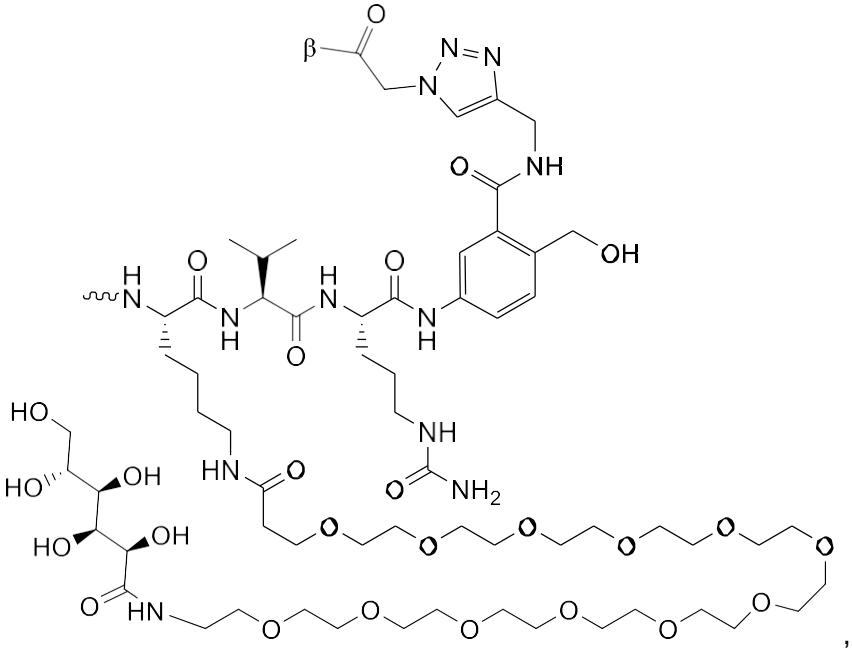
,



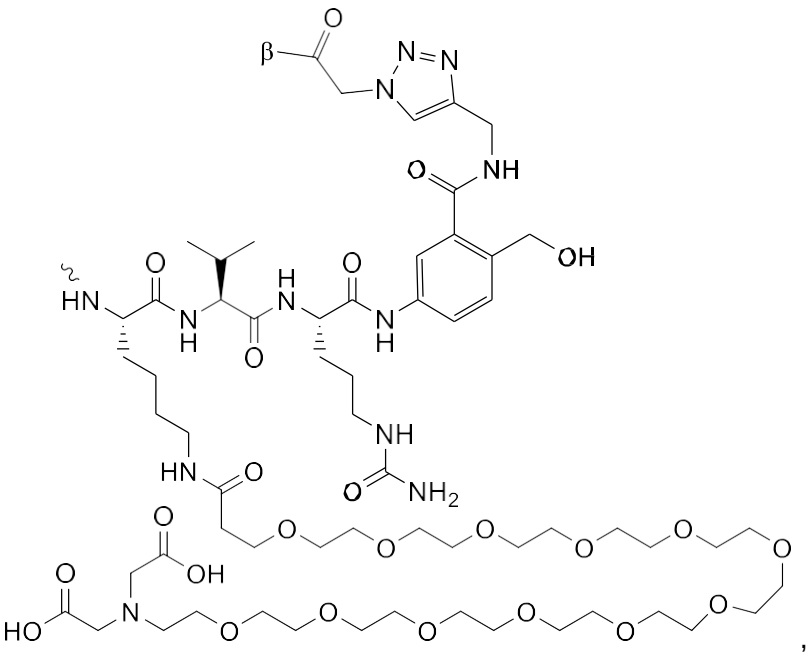
,



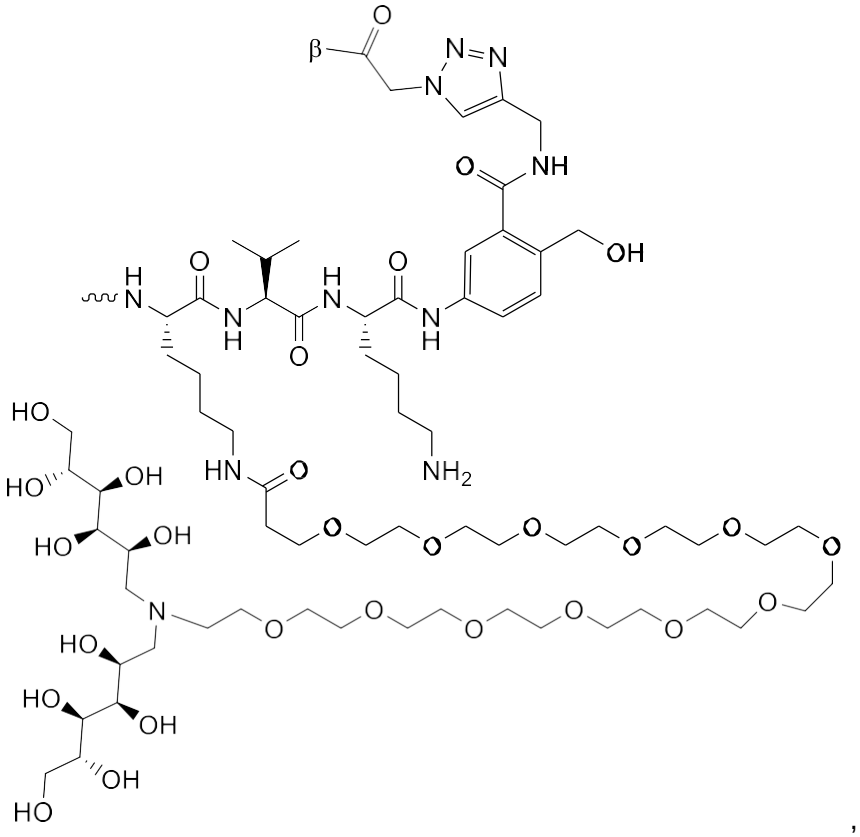
,



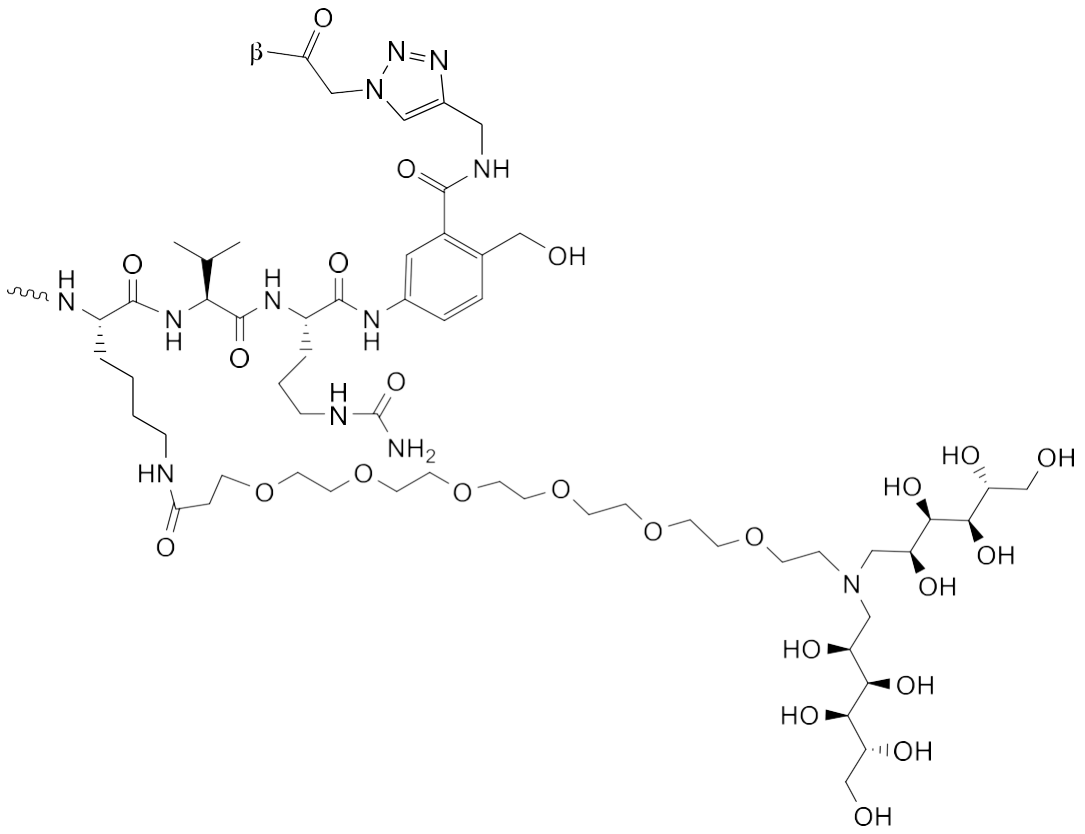
,



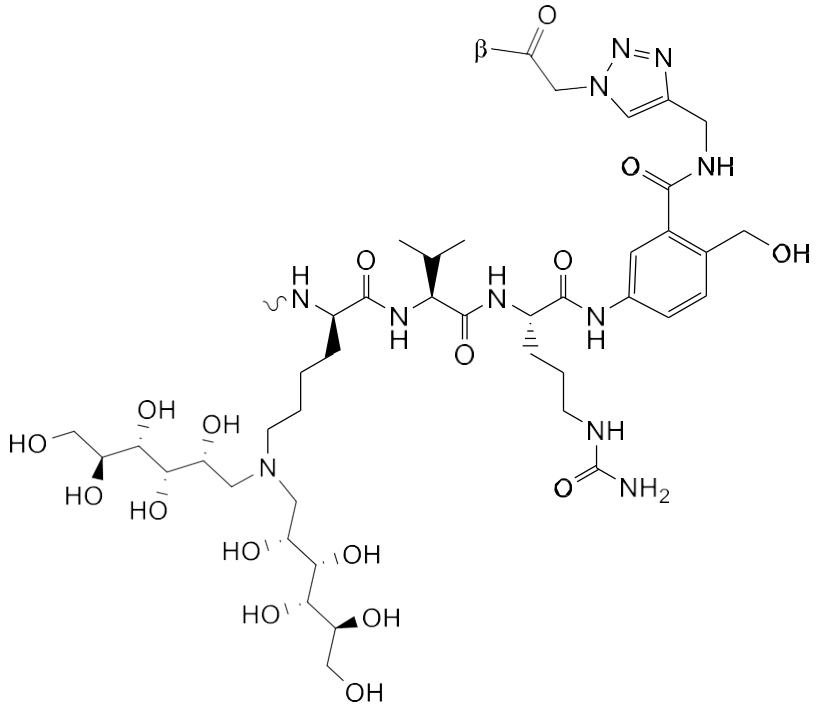
,



,



, o



,

donde

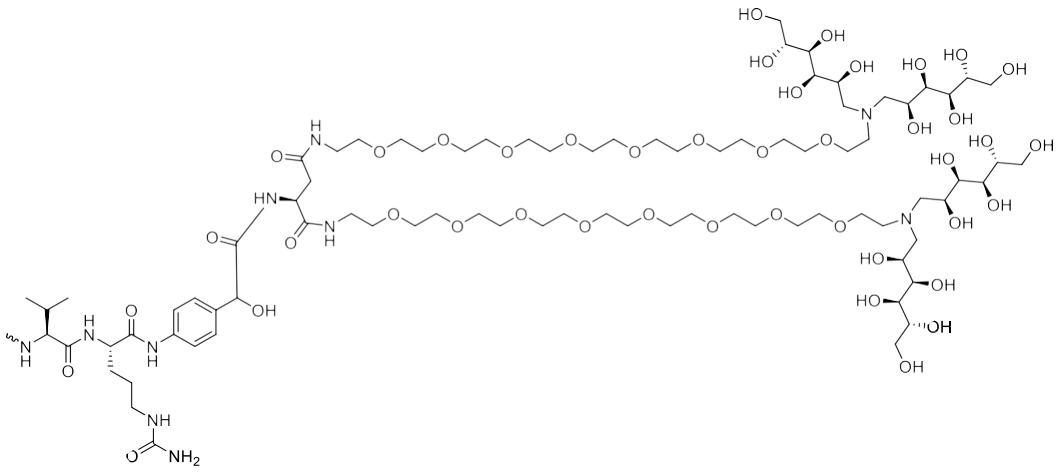
R^c es un enlace o C_{1-6} alquileno;

la línea ondulada en el grupo amino indica un sitio de unión para el grupo extensor; o, antes de unirse al grupo extensor, indica H;

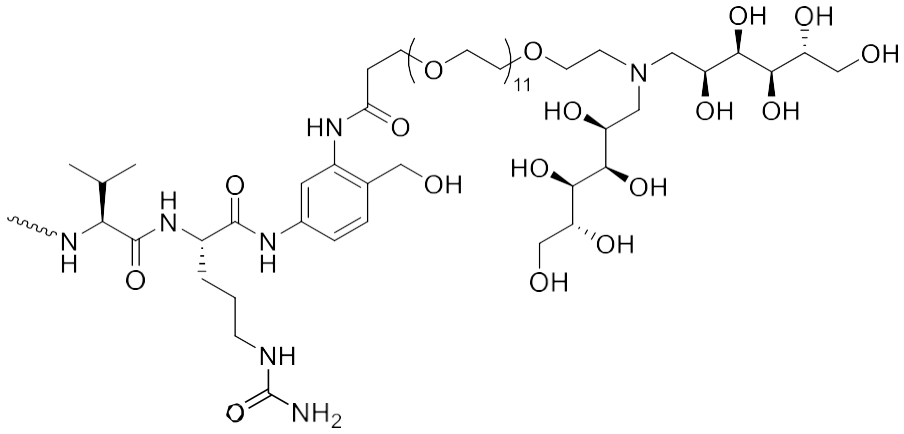
β— es el sitio de unión al por lo menos un grupo polar; y

el H en el OH bencílico opcionalmente se reemplaza por un enlace a por lo menos una de las unidades de fármaco o al sitio de unión a por lo menos una de las unidades de fármaco.

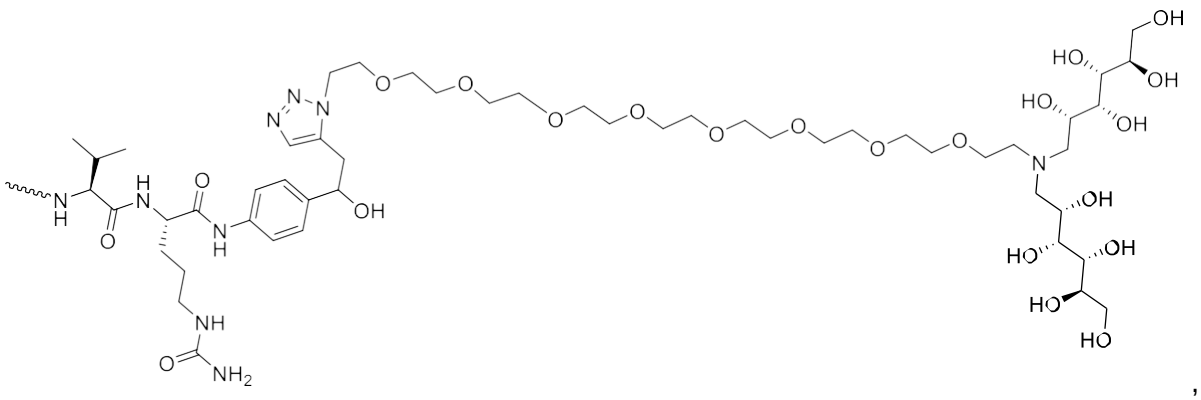
71. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 1-5, que tiene una de las siguientes estructuras:



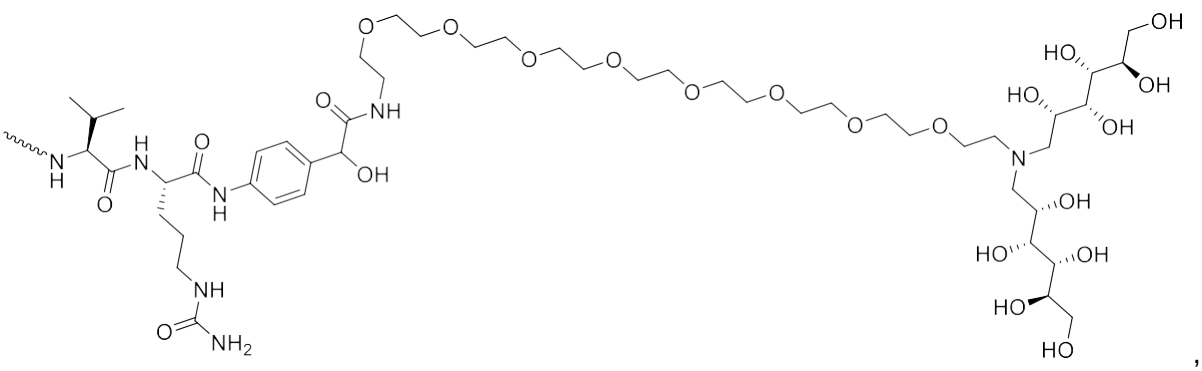
,



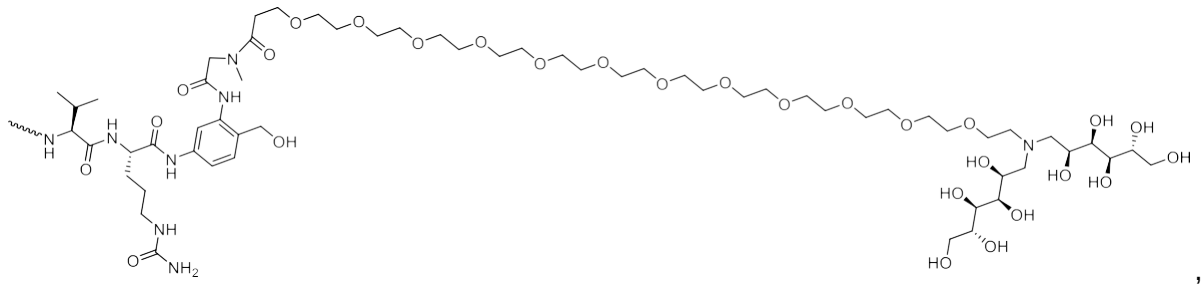
,



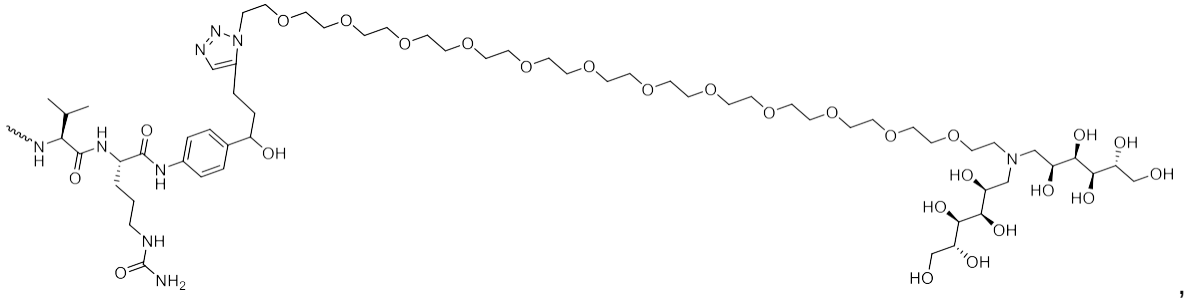
,



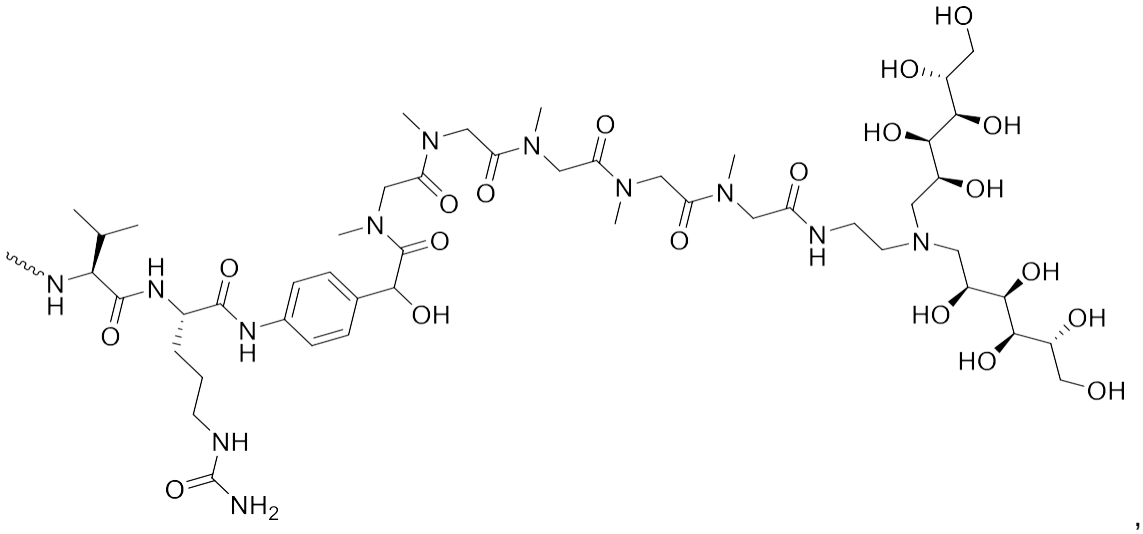
,



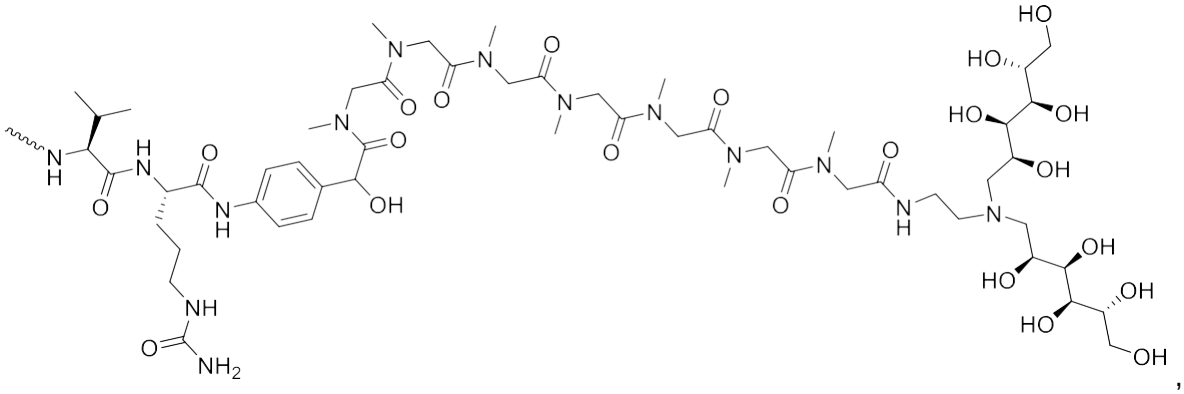
,



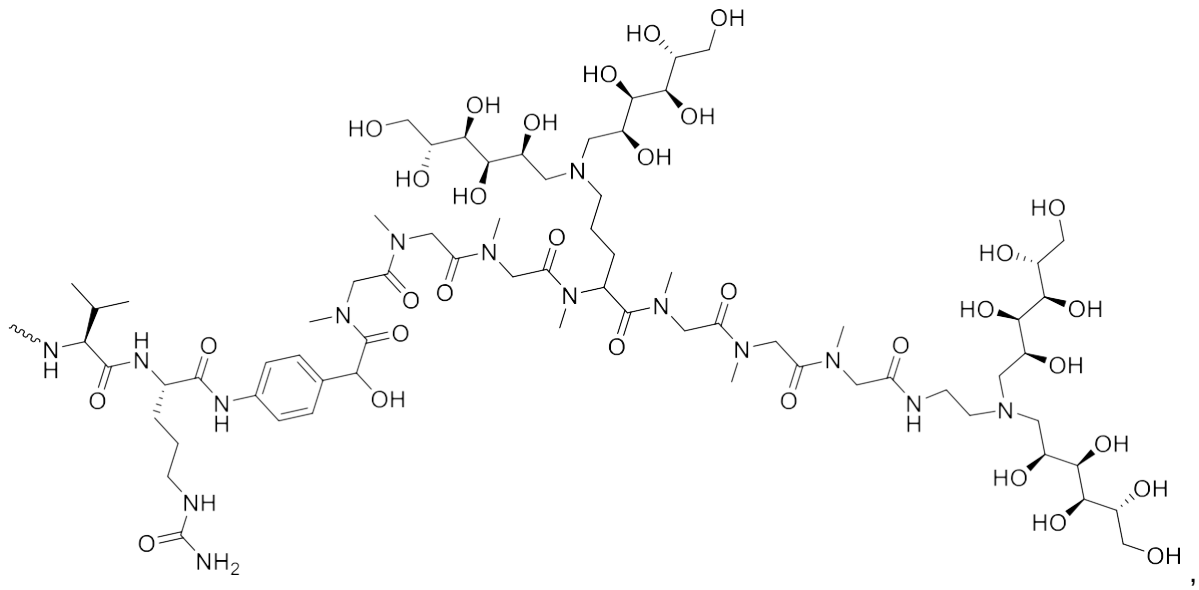
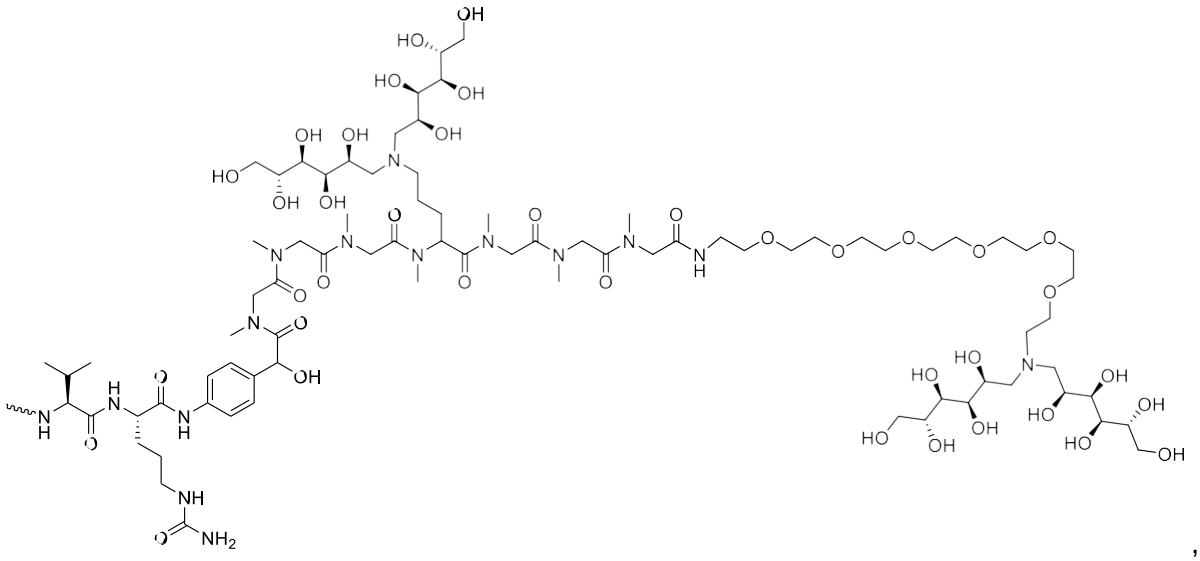
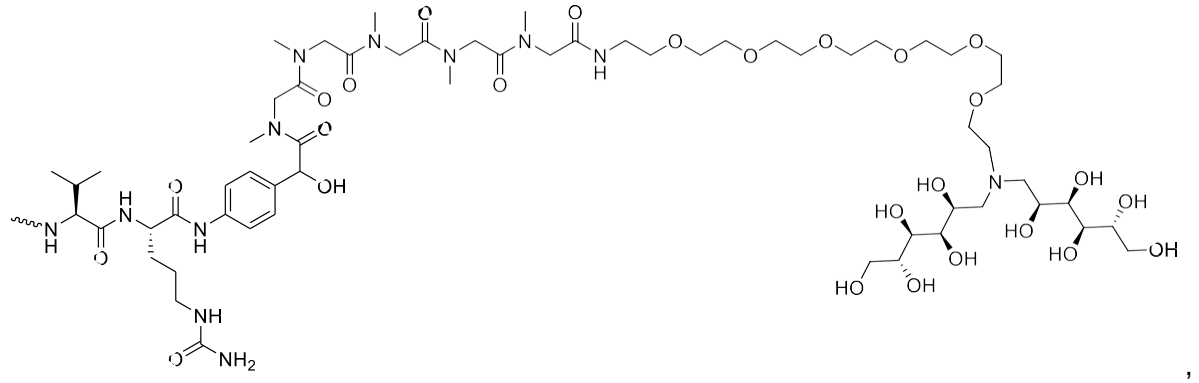
,

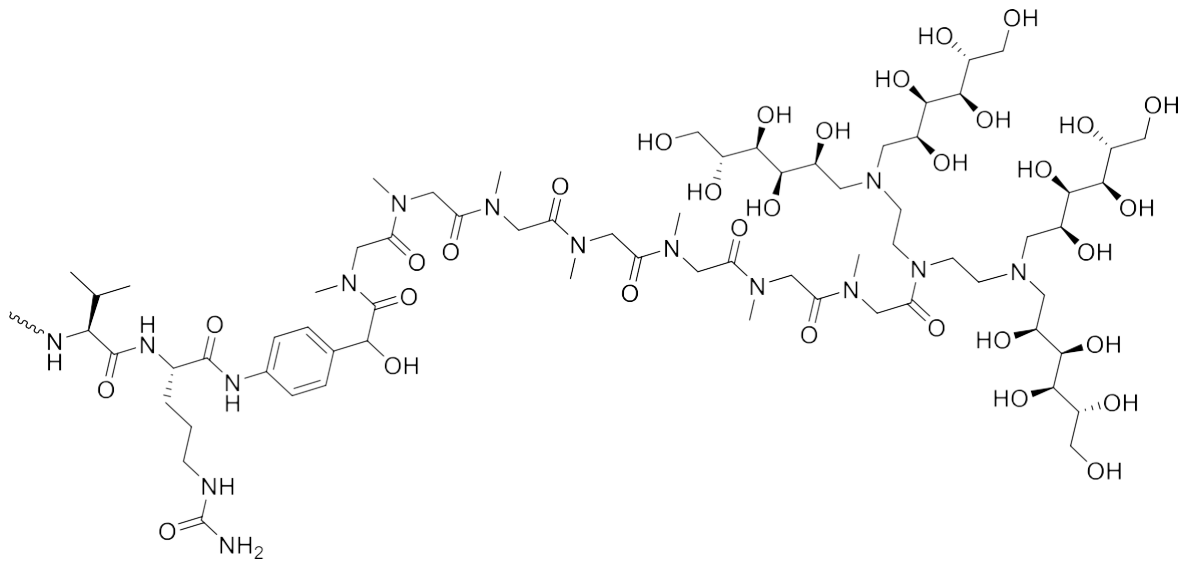


,

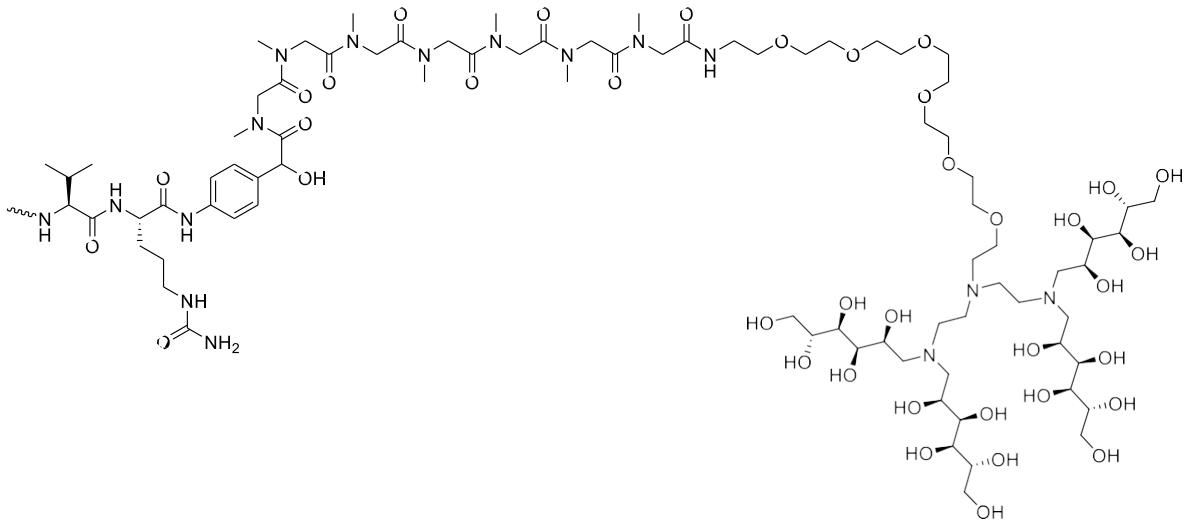


,

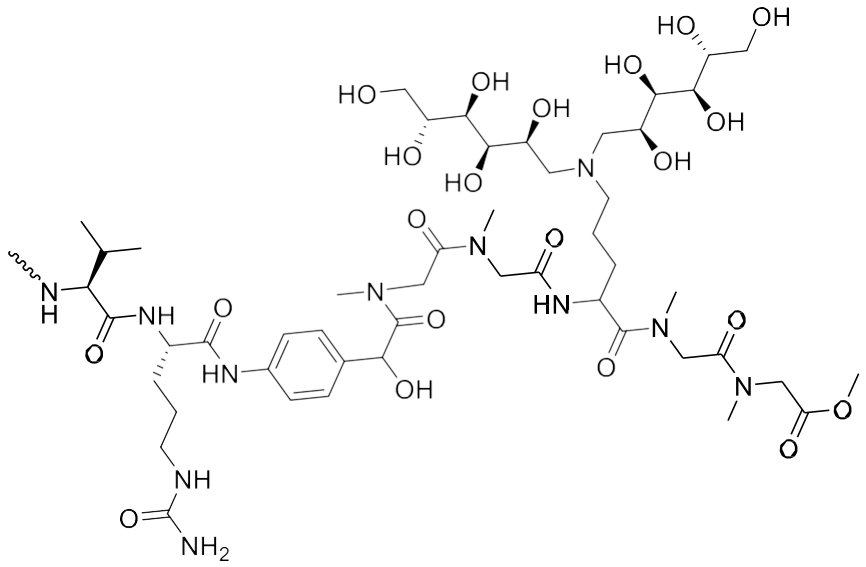

,

,

,



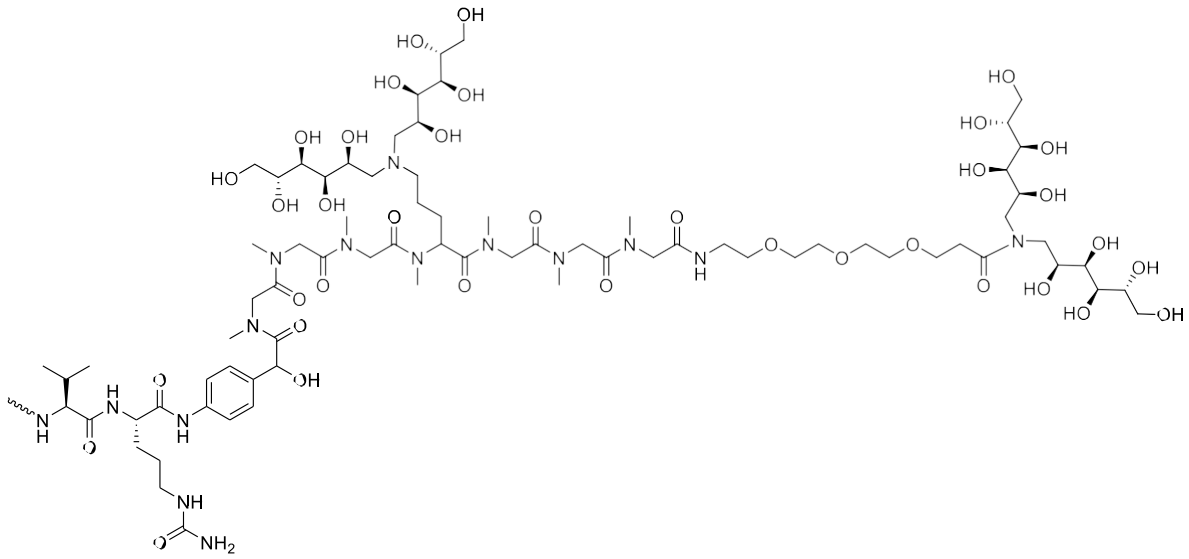
,



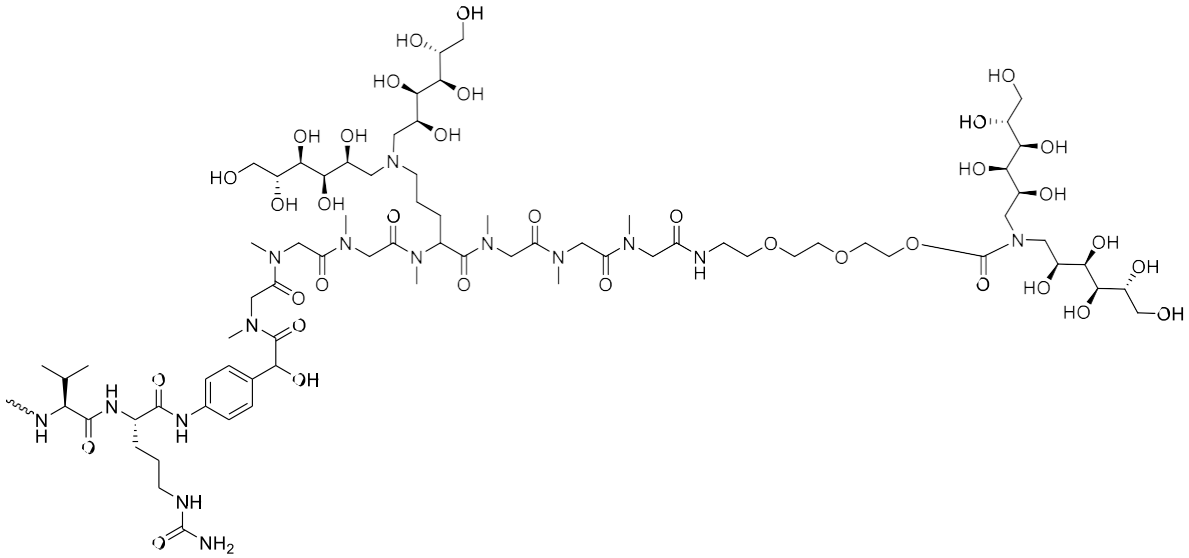
,



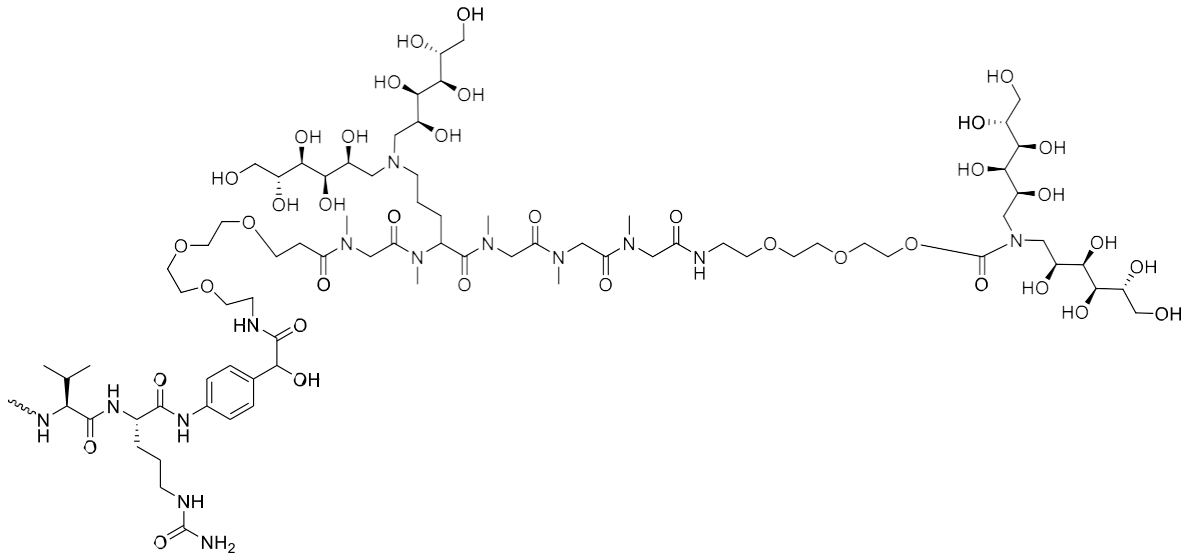
,



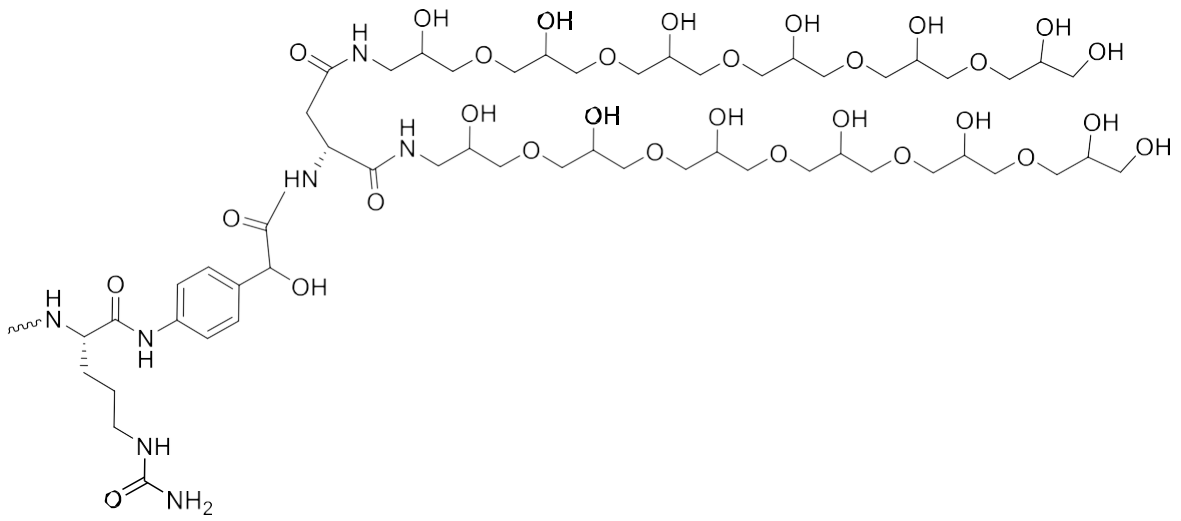
,



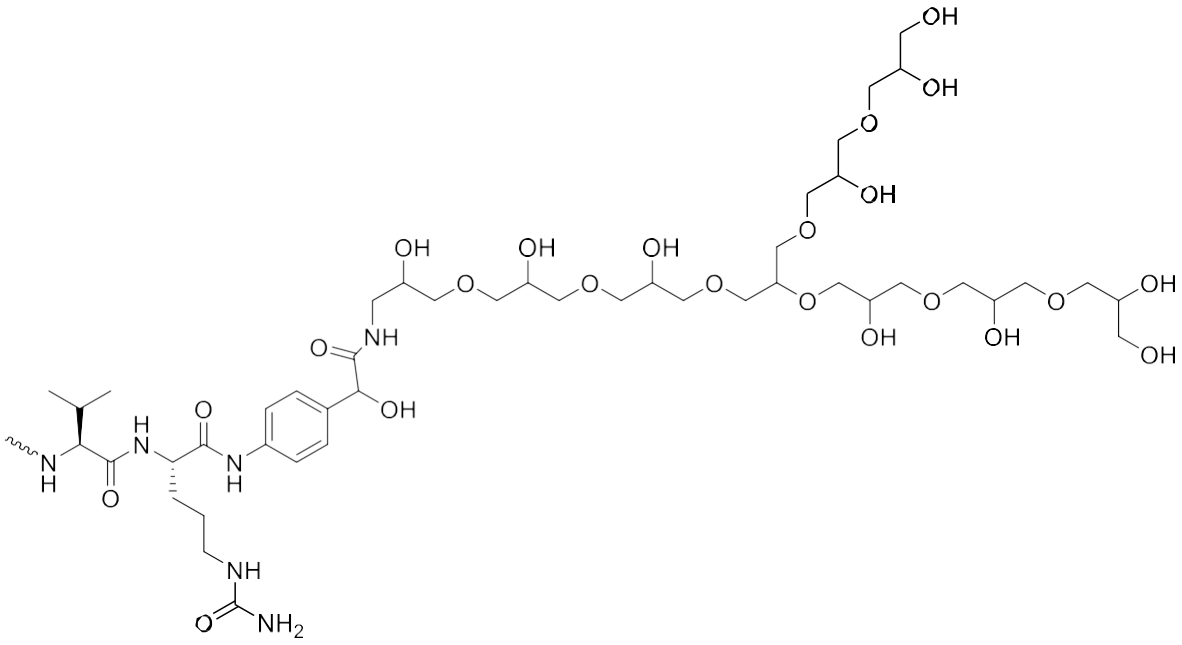
,



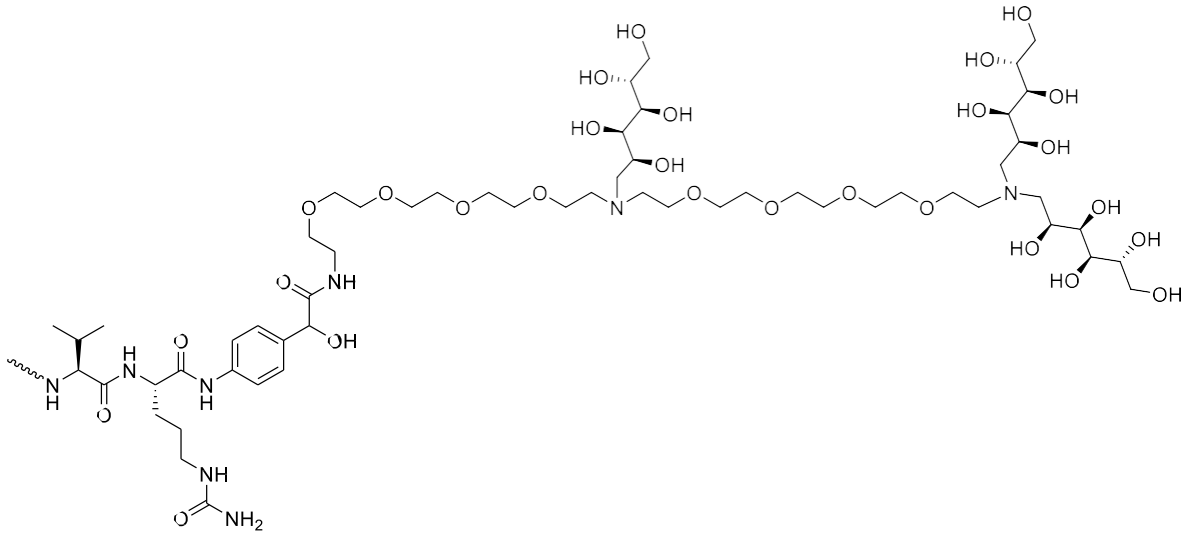
,



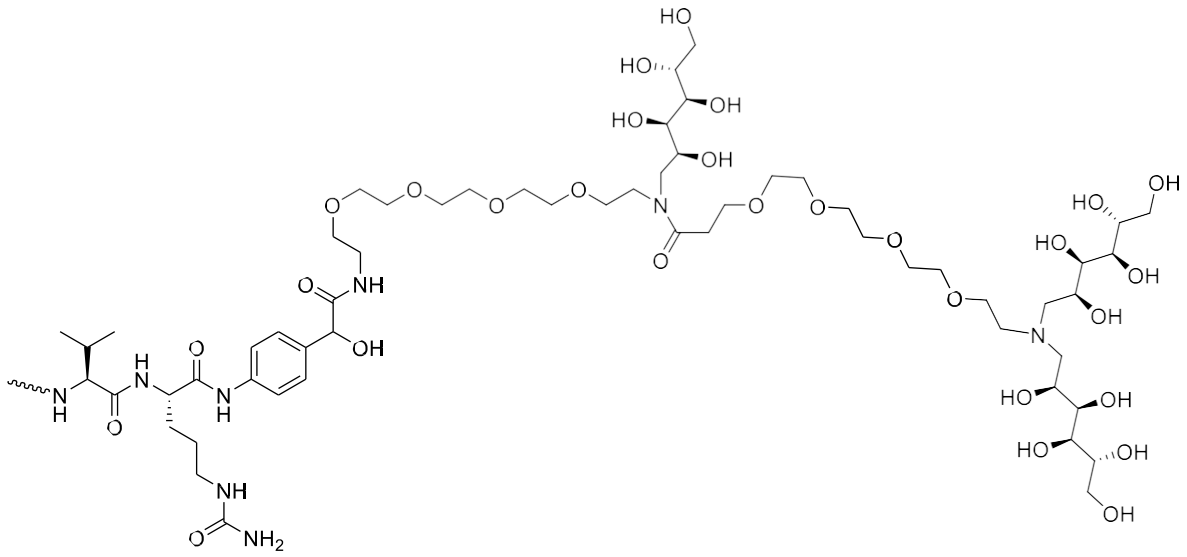
,



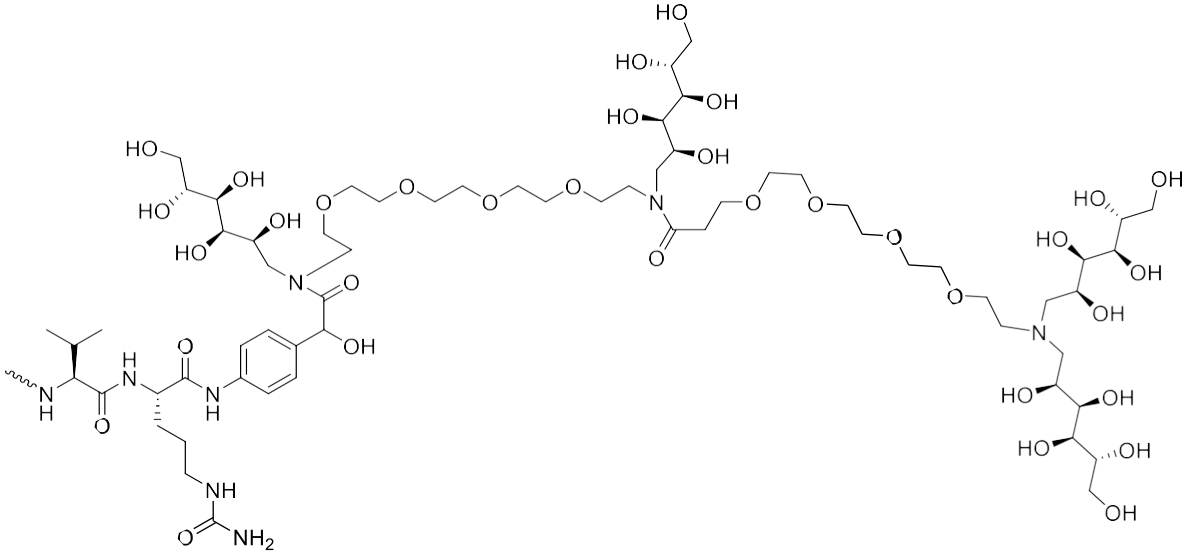
,



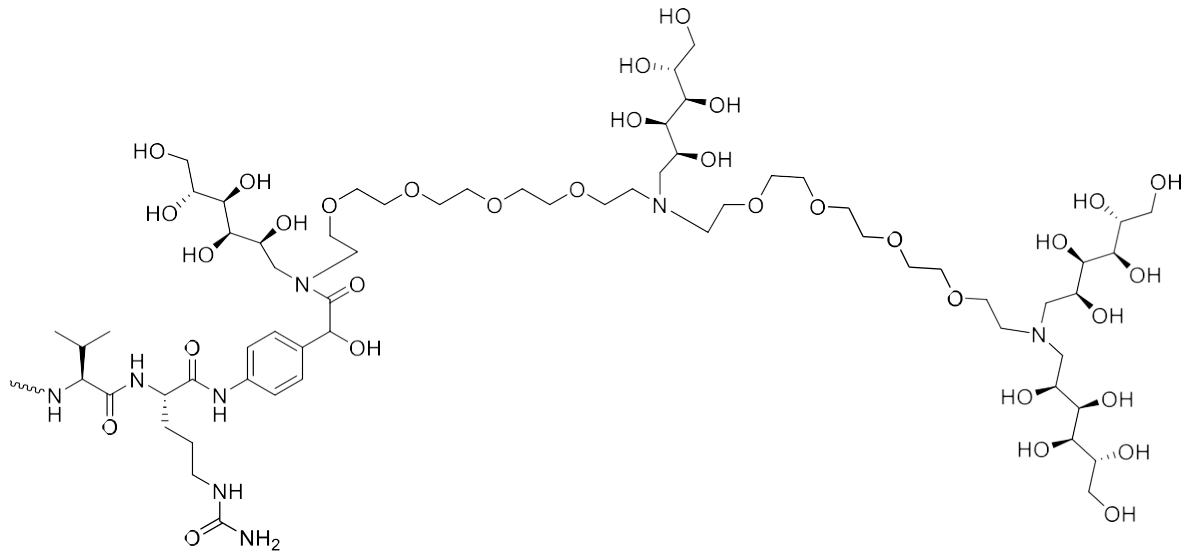
,



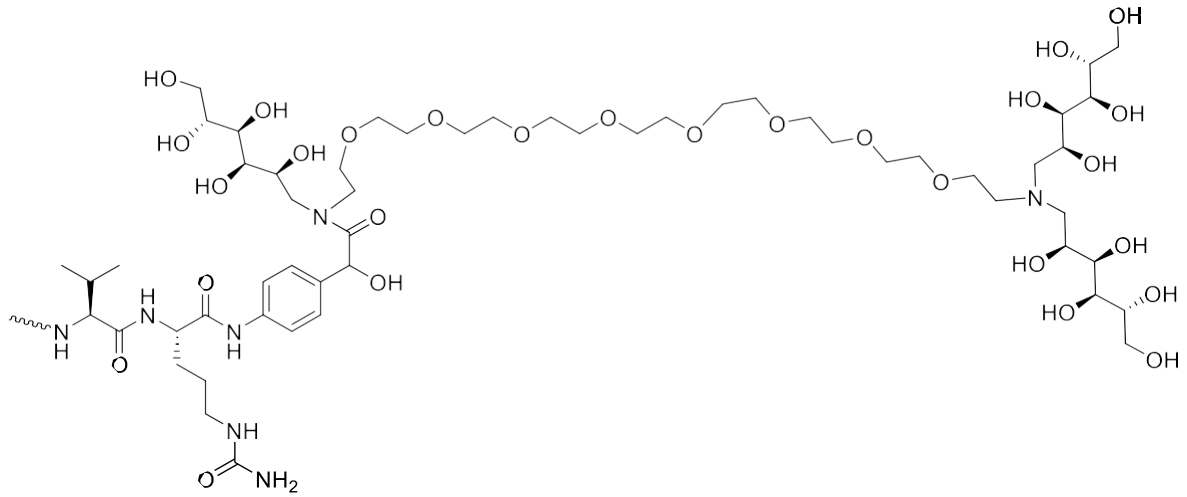
,



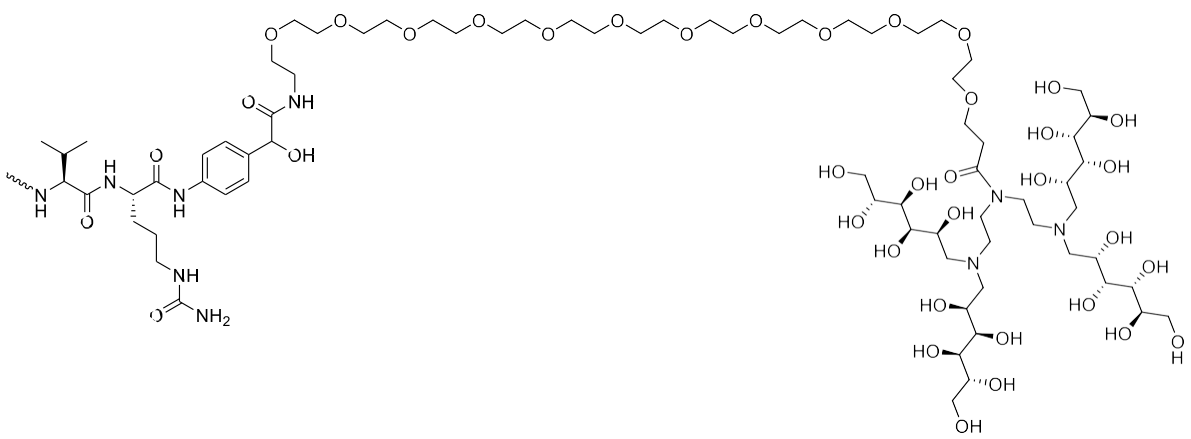
,



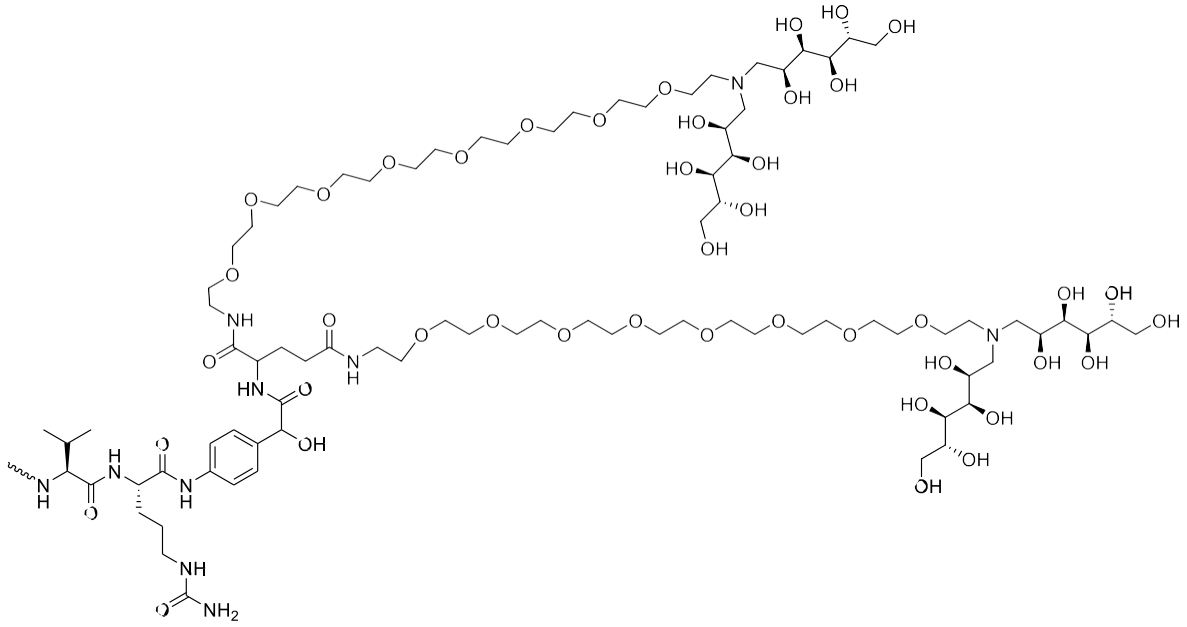
,



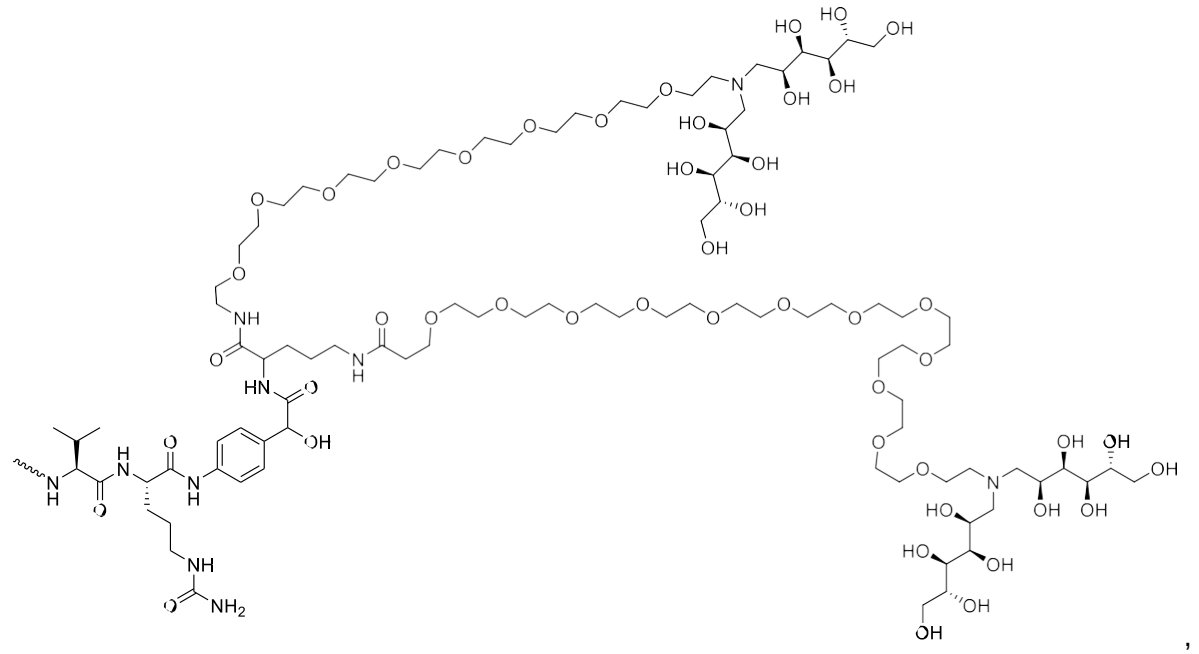
,



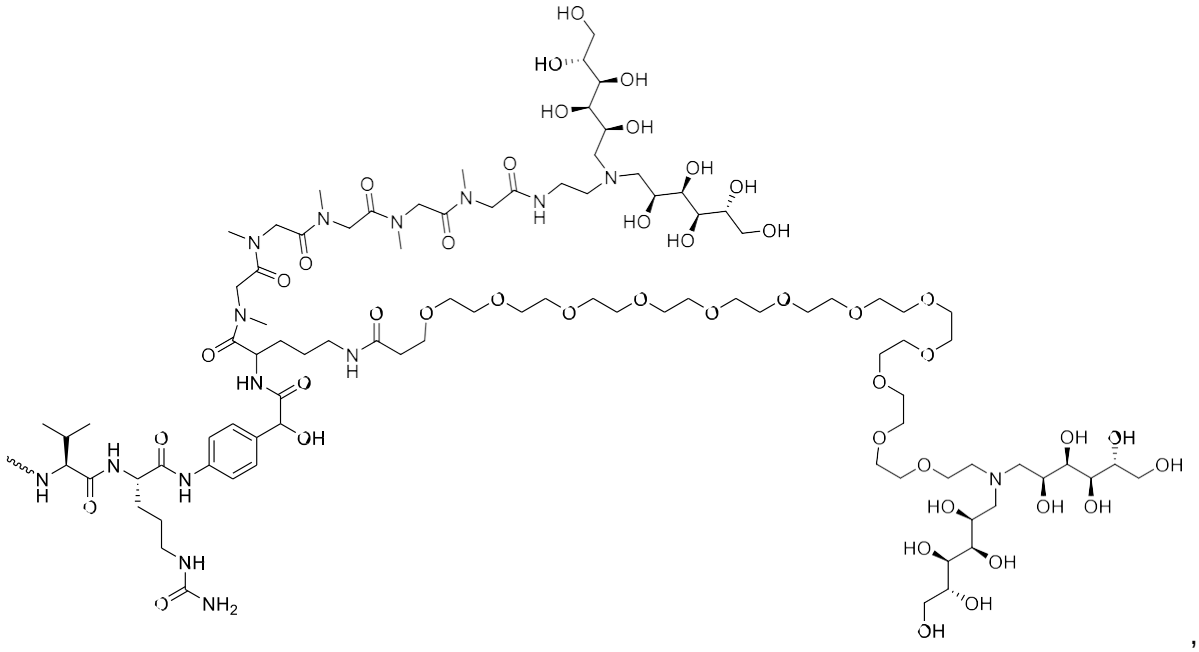
,



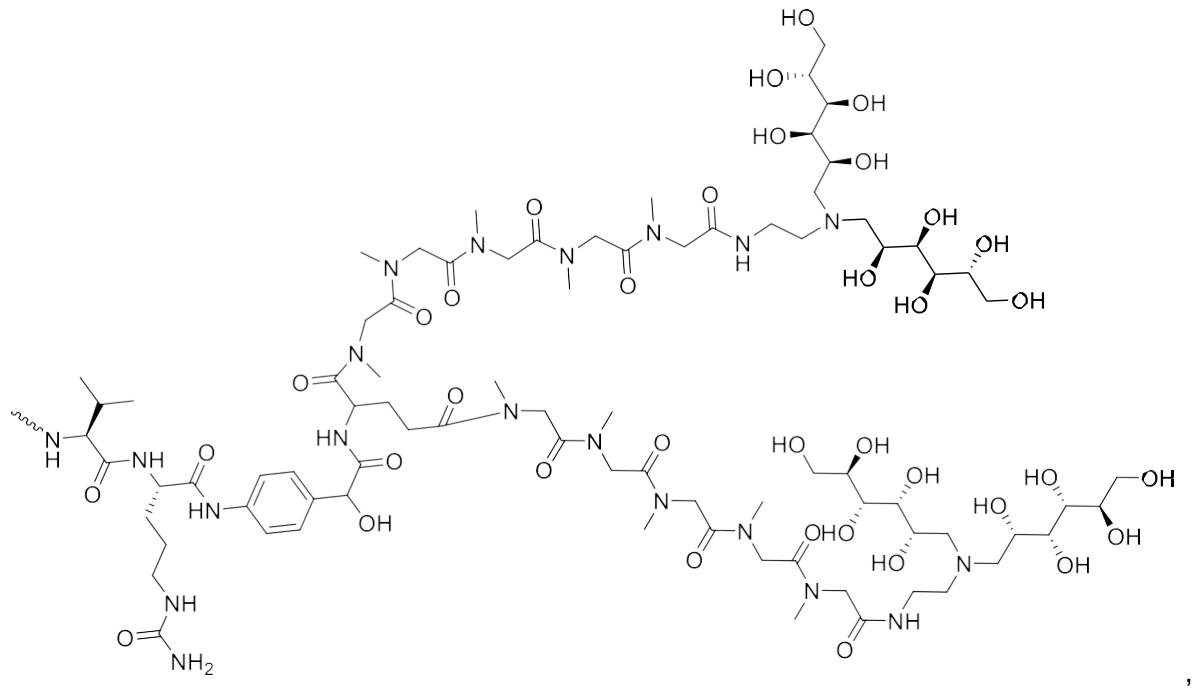
,



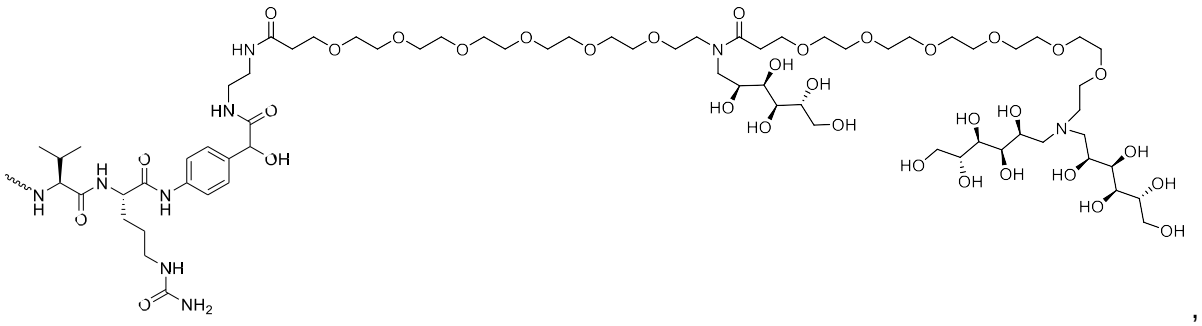
,



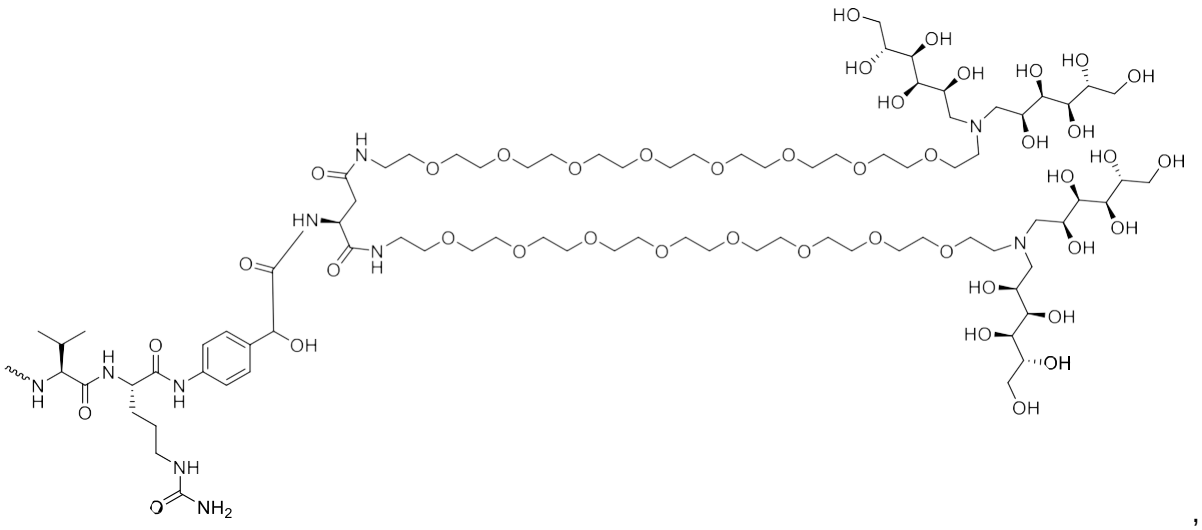
,



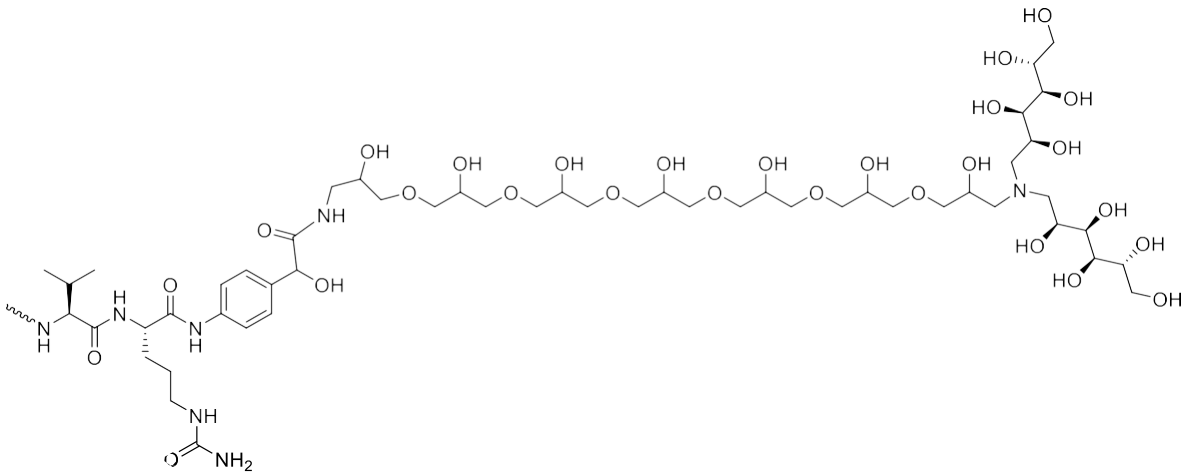
,



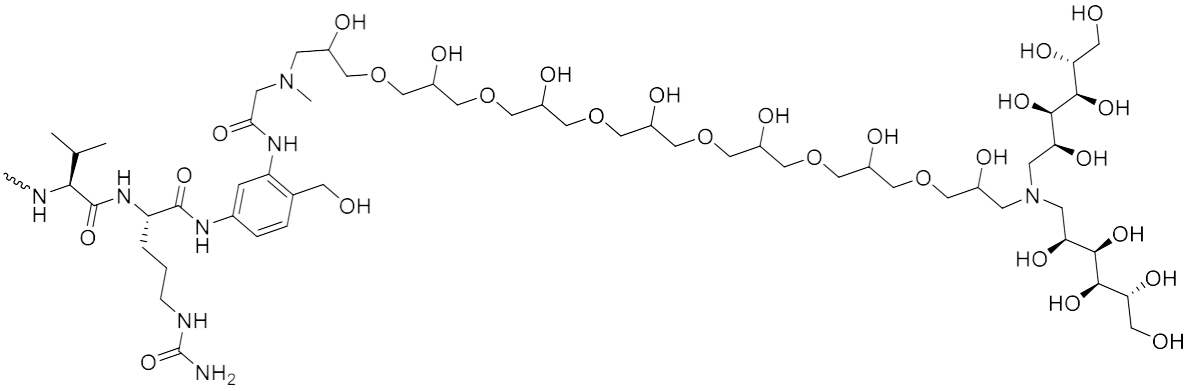
,



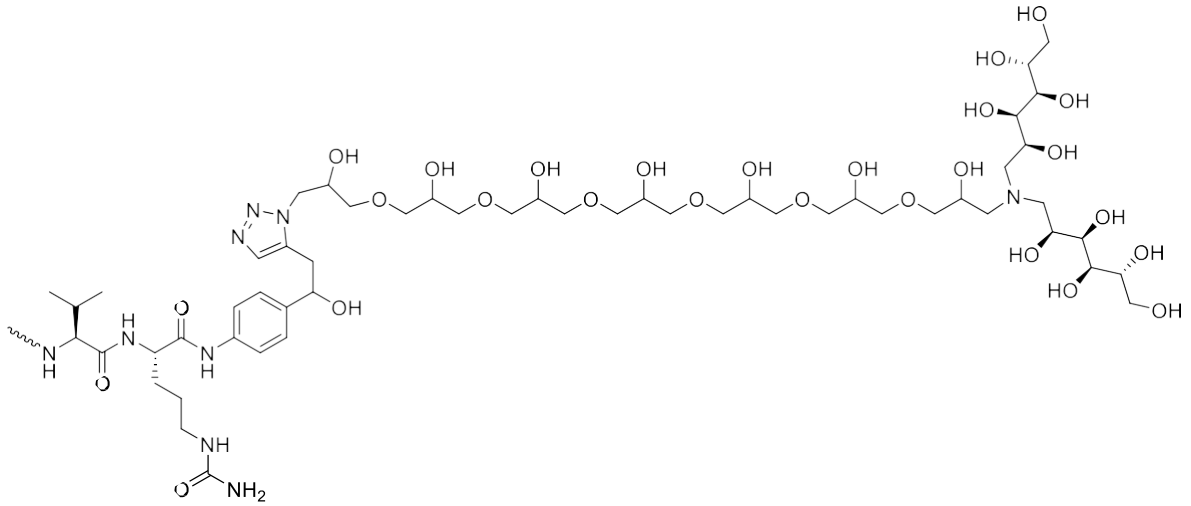
,



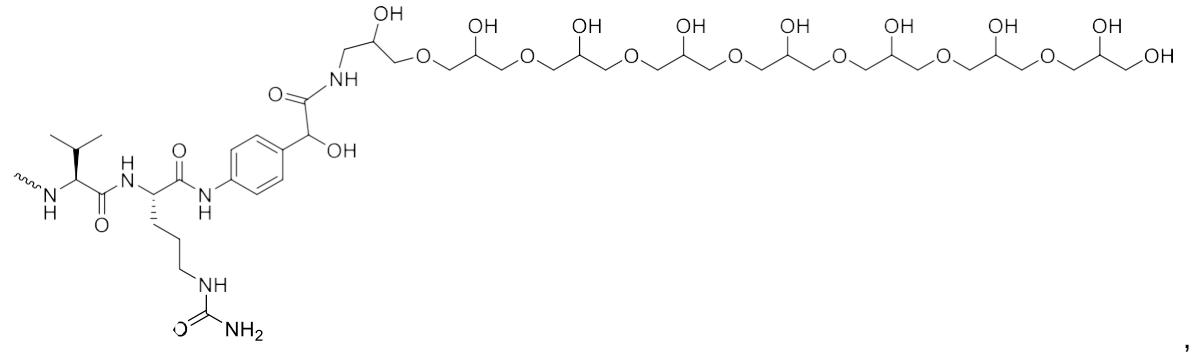
,



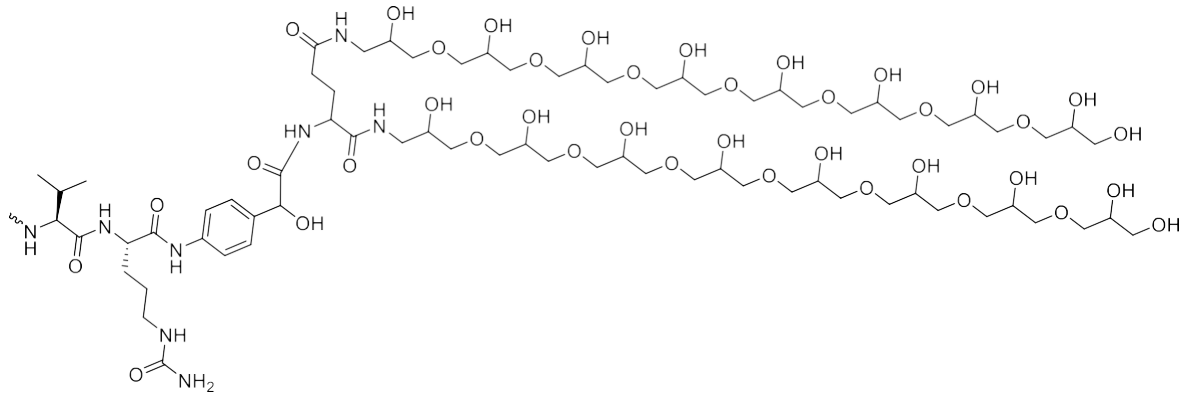
,



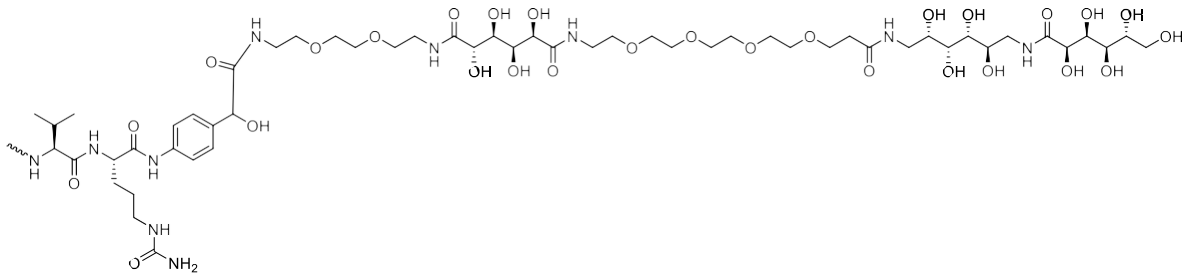
,



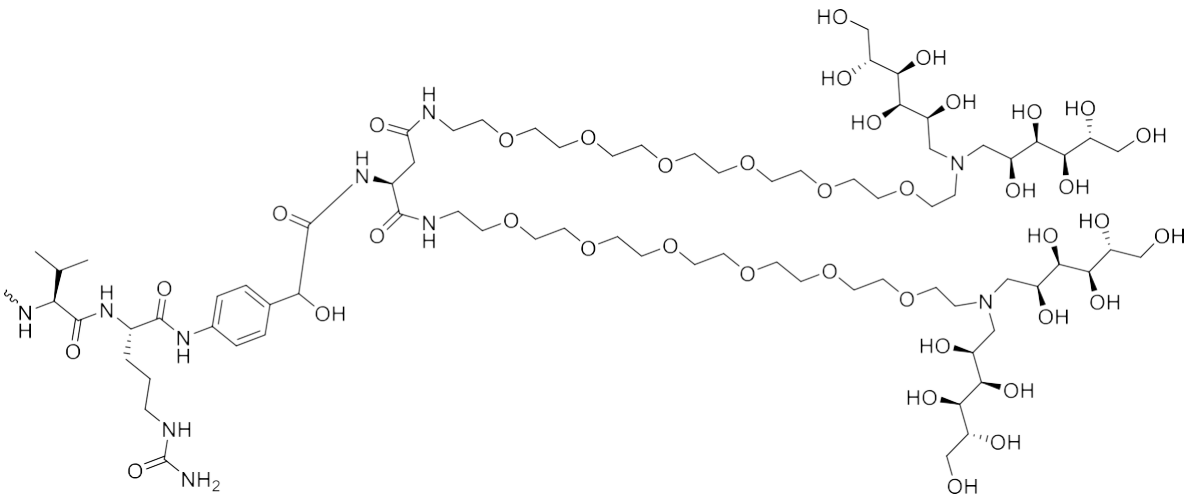
,



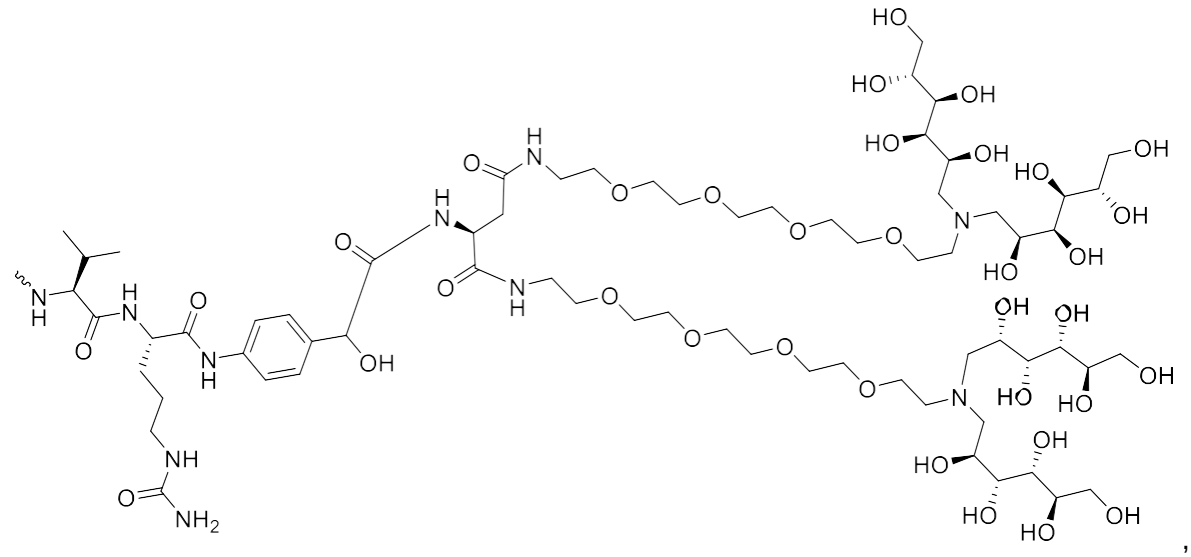
,



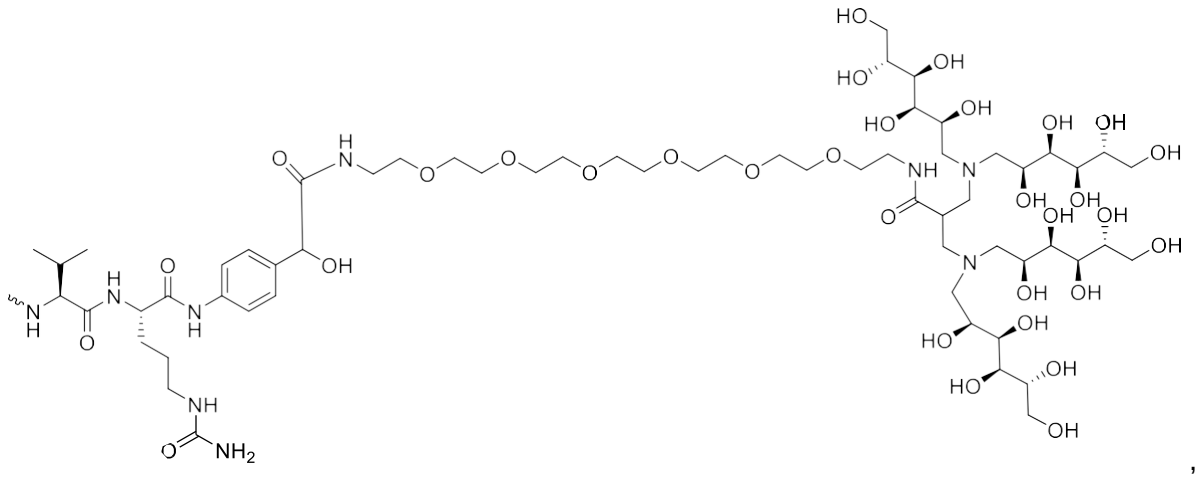
,



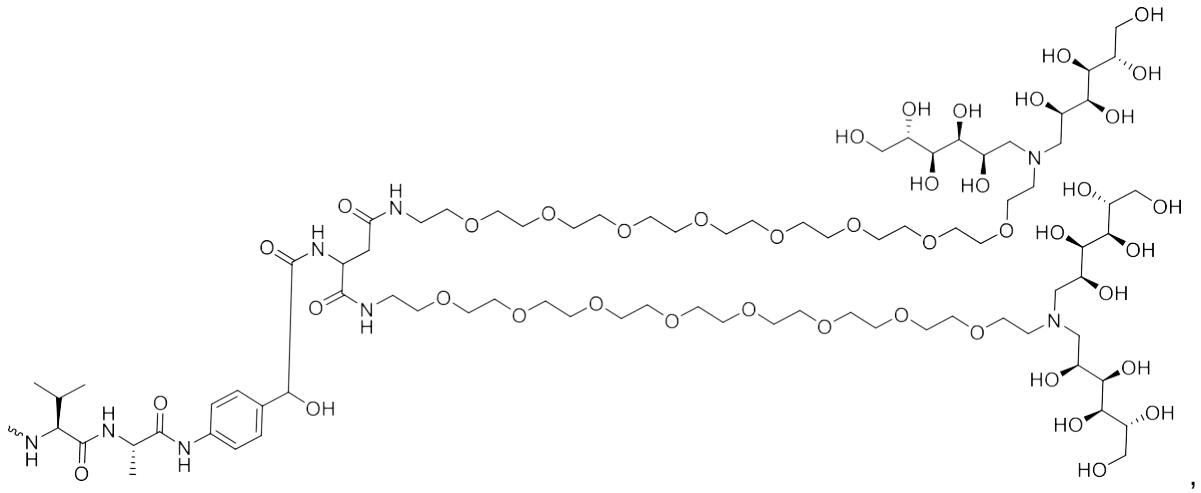
,



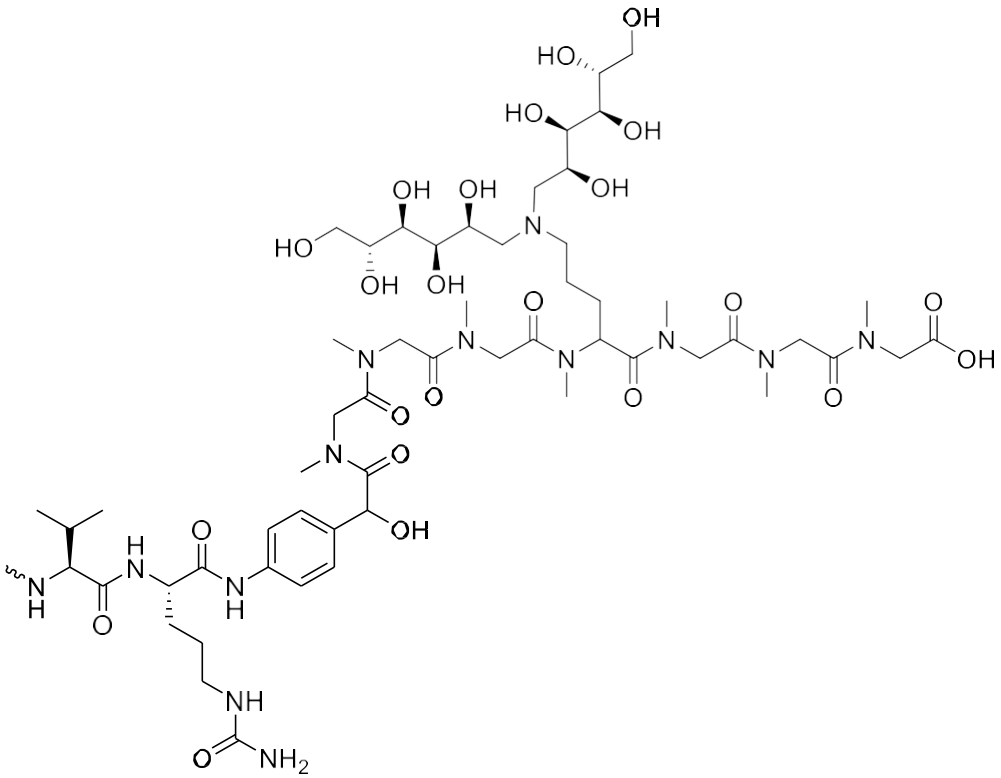
,



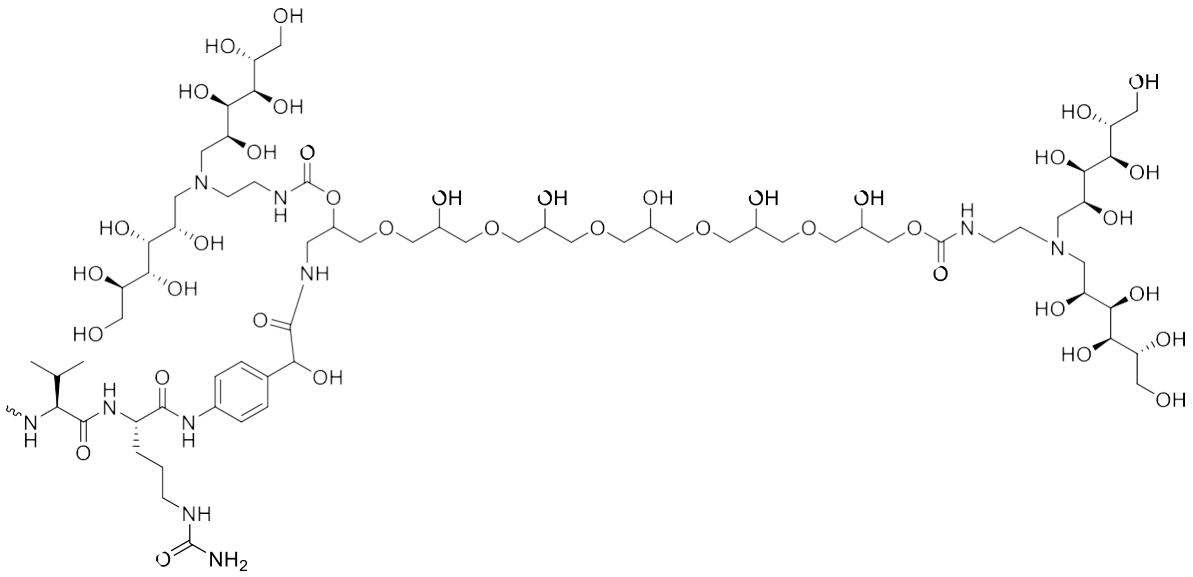
,



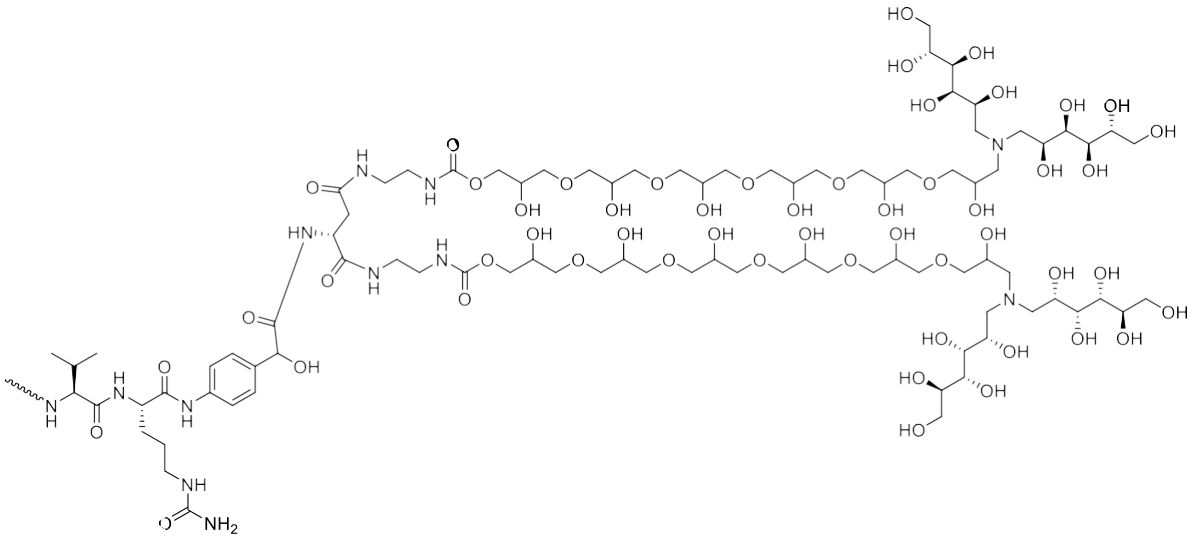
,



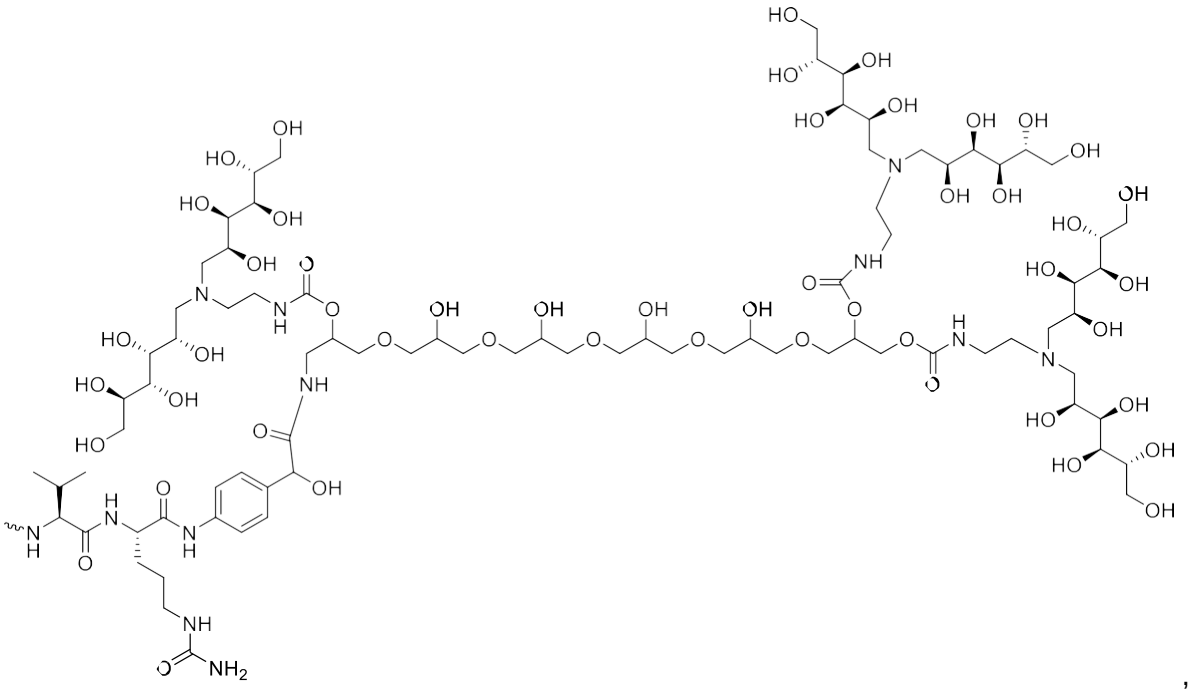
,



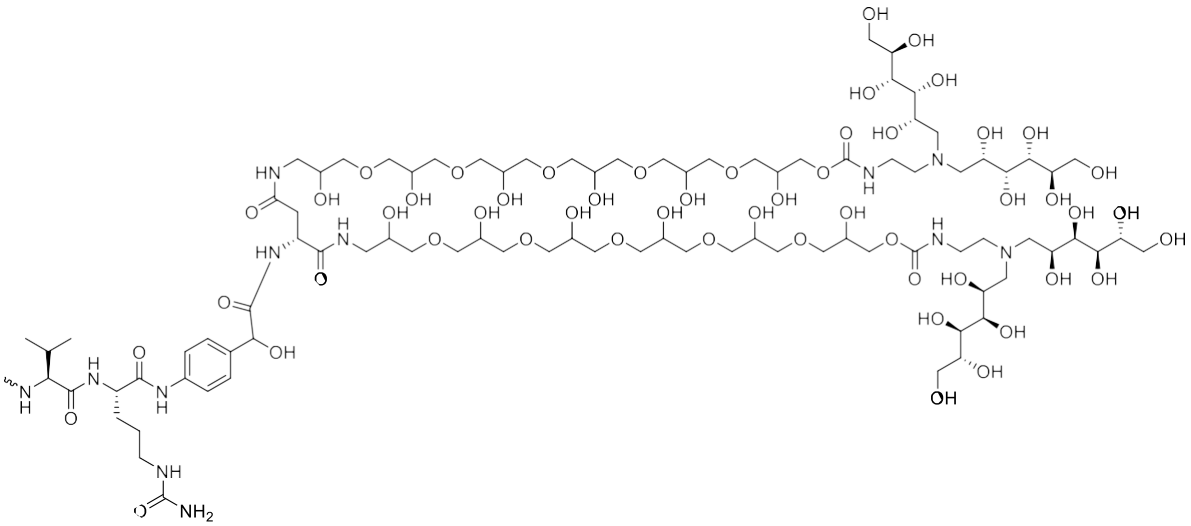
,



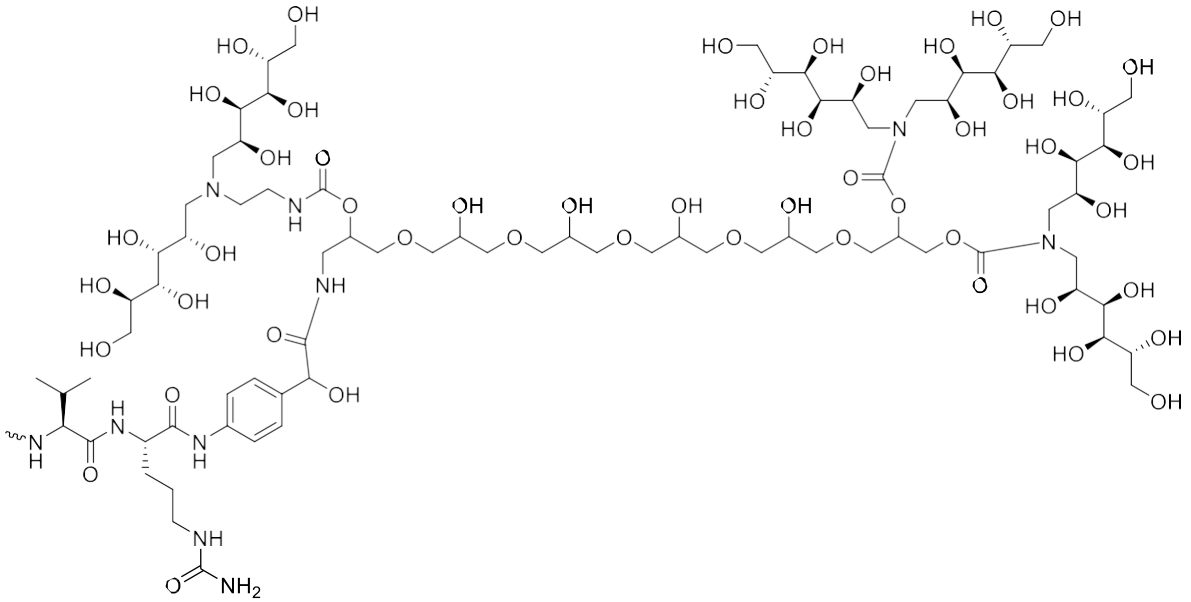
,



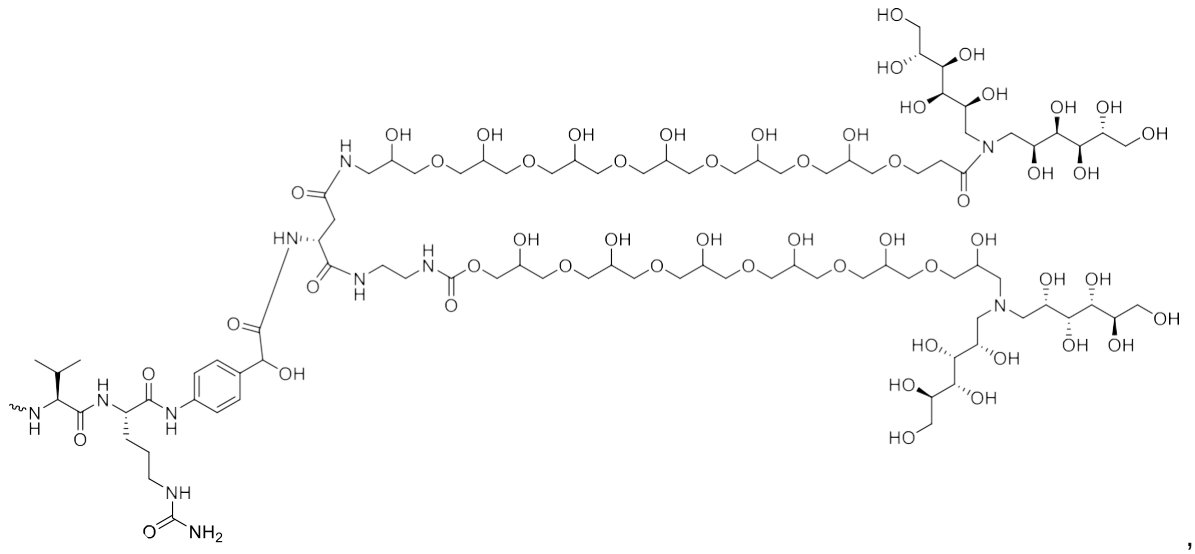
,



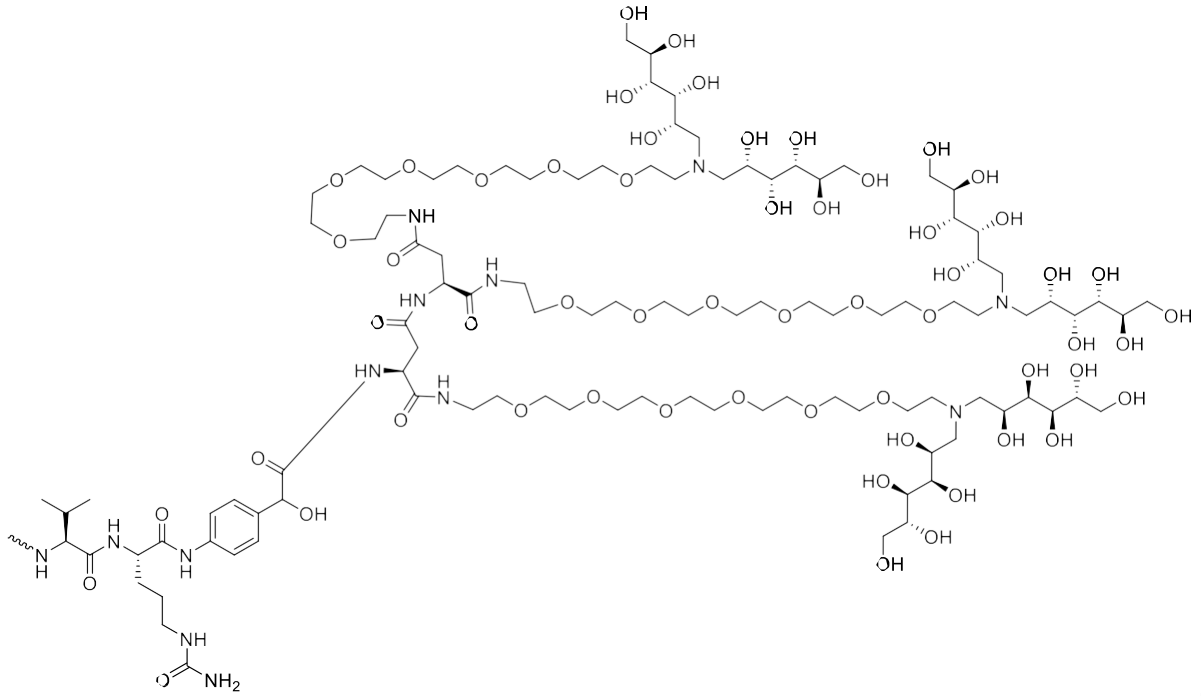
,



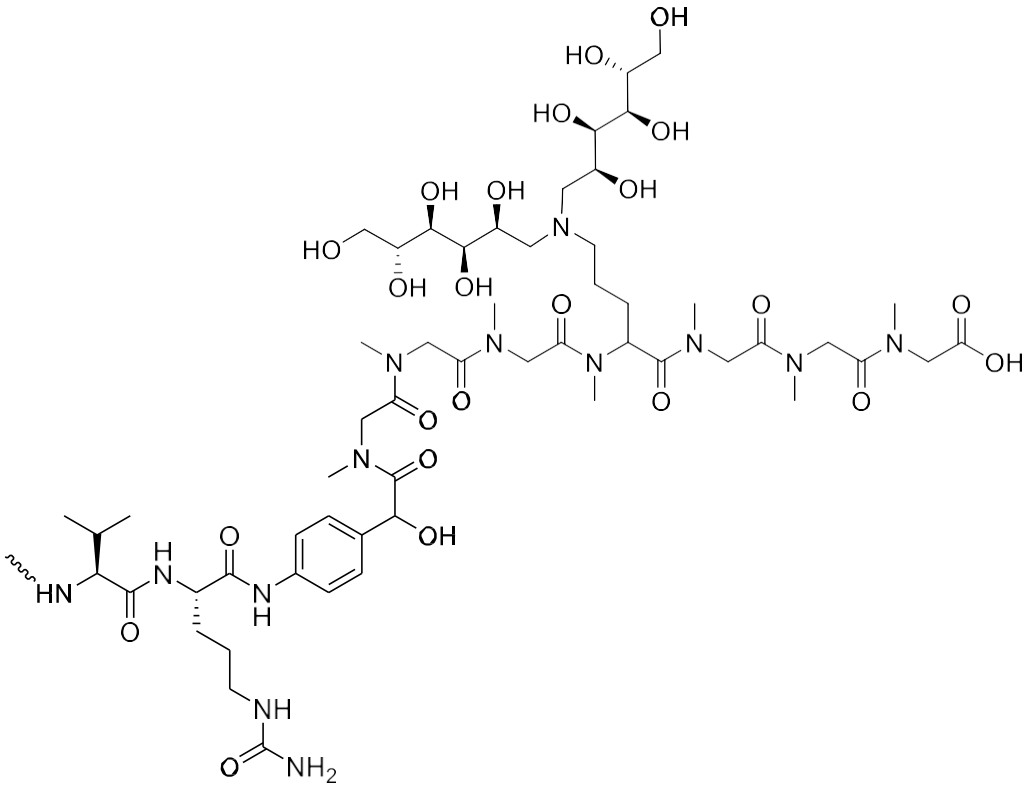
,



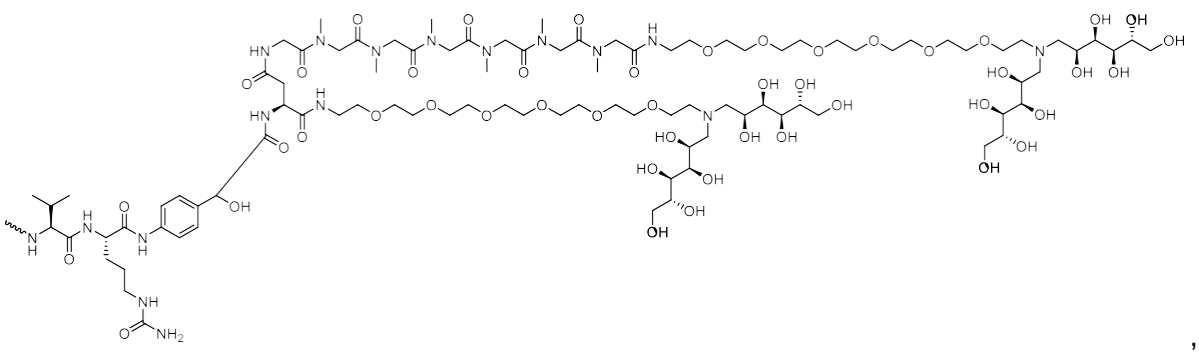
,



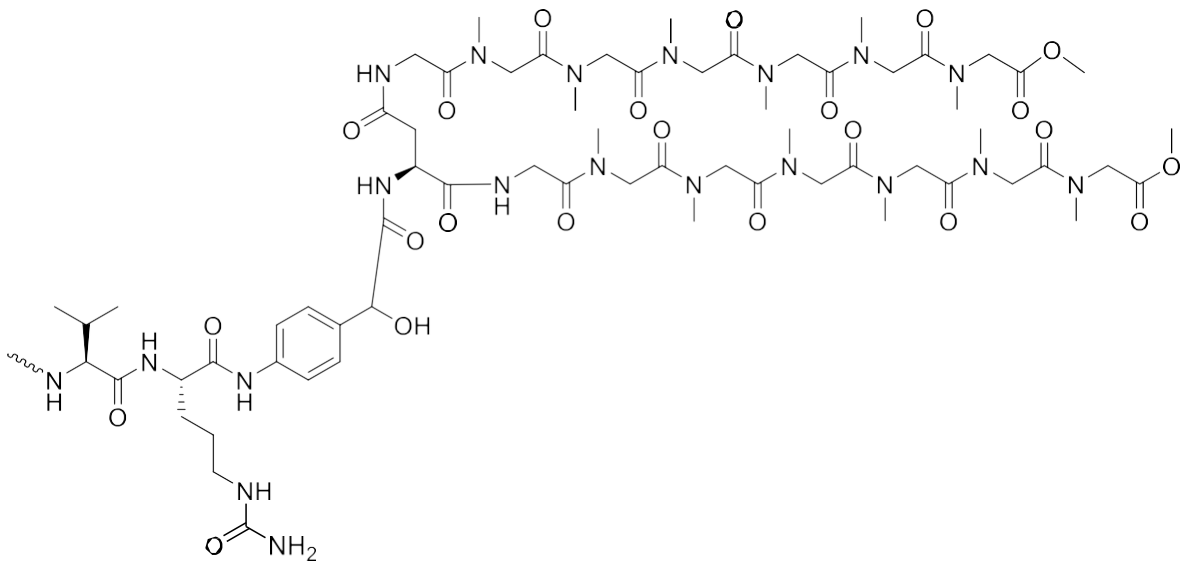
,



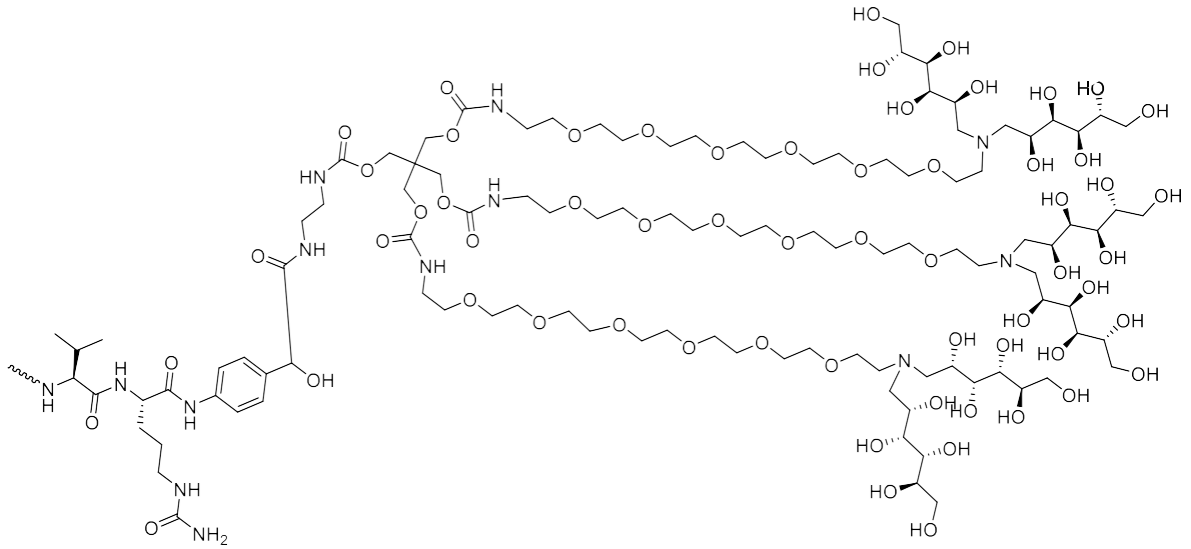
,



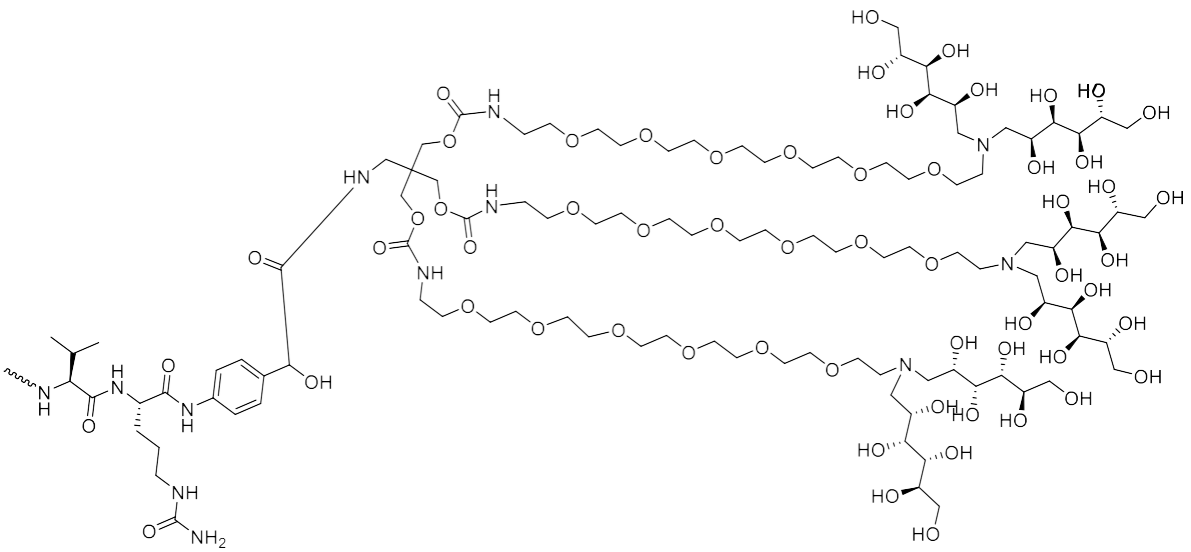
,



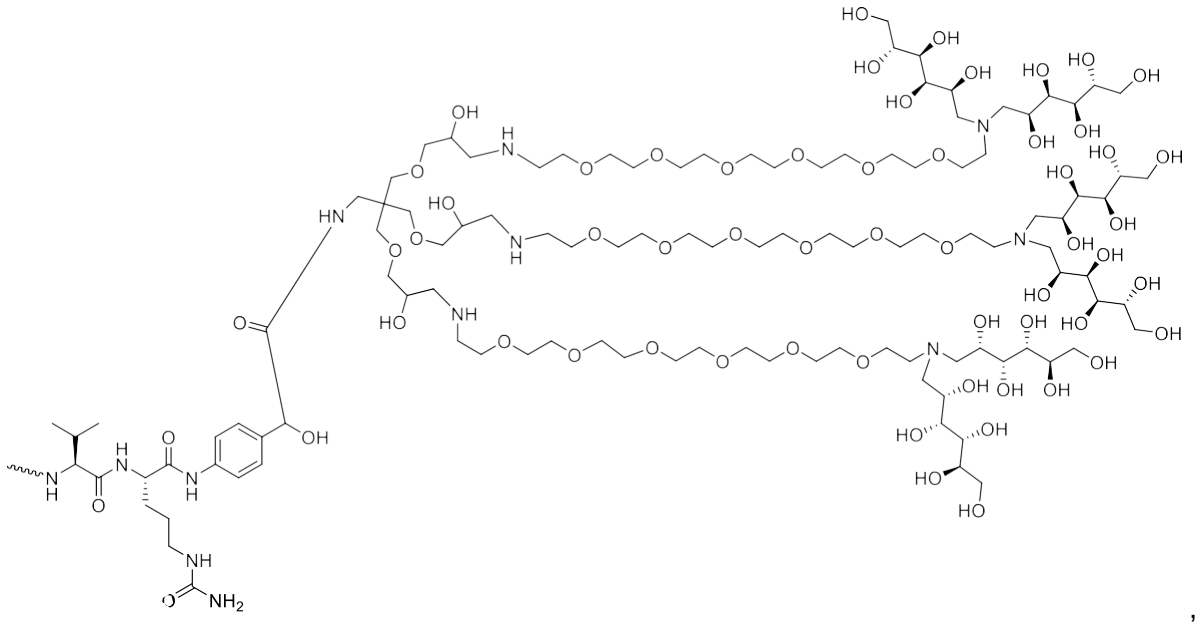
,



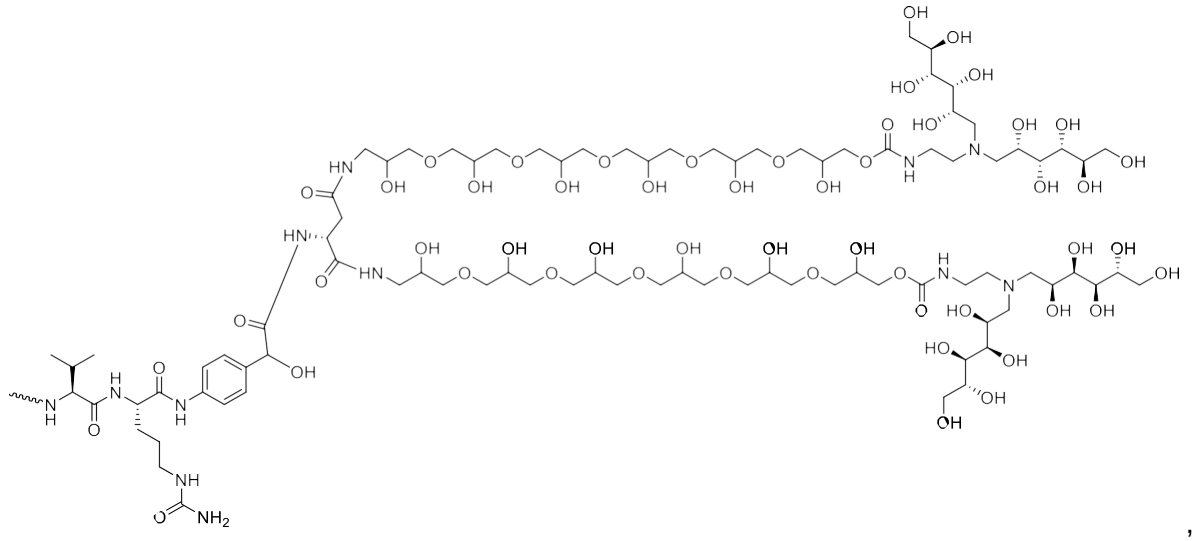
,



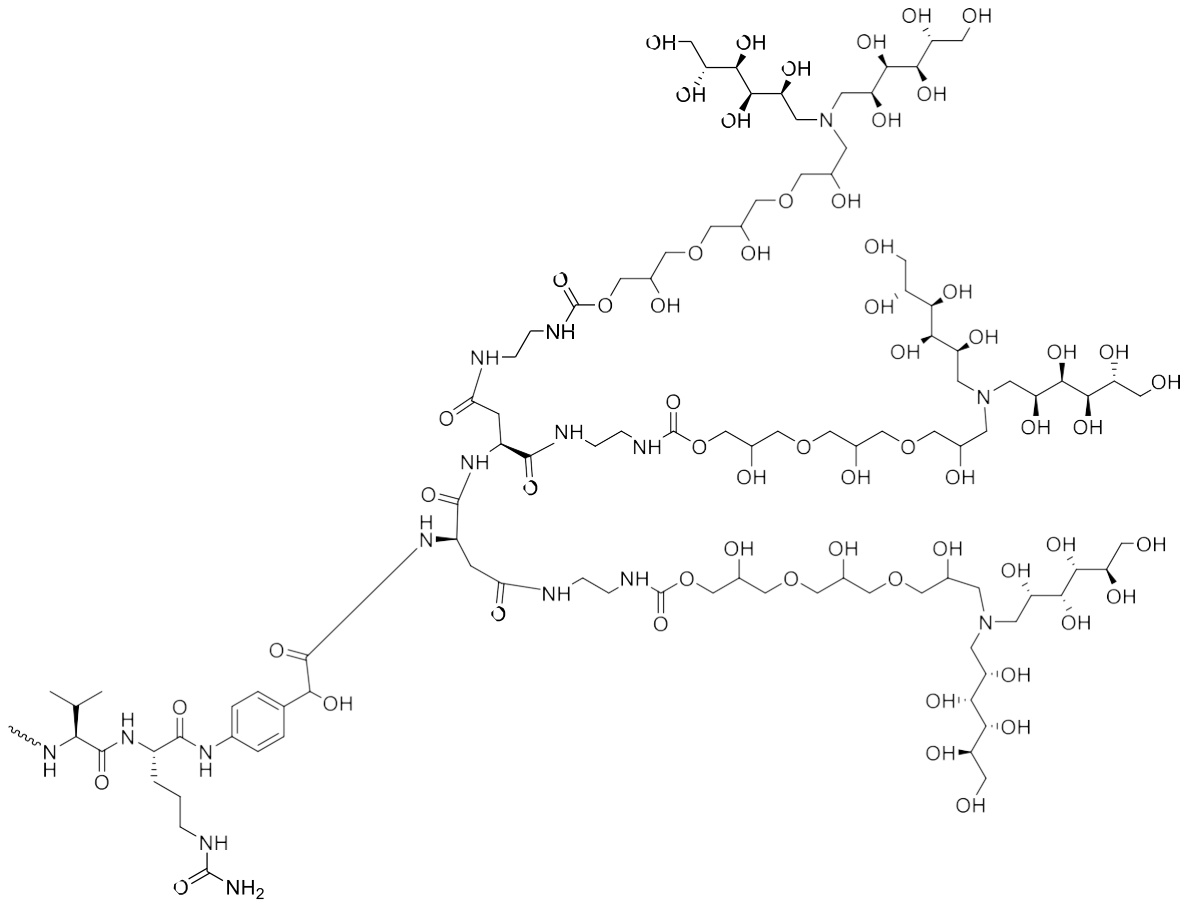
,



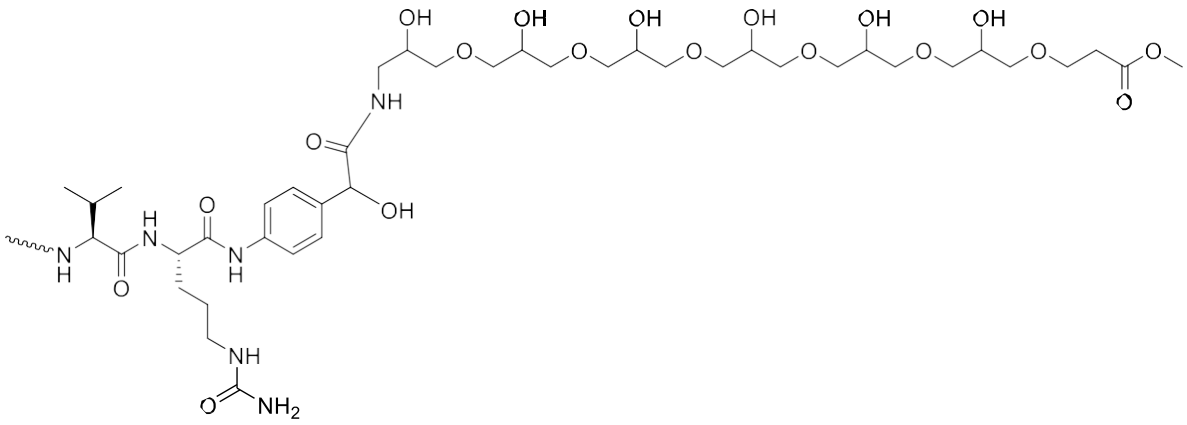
,



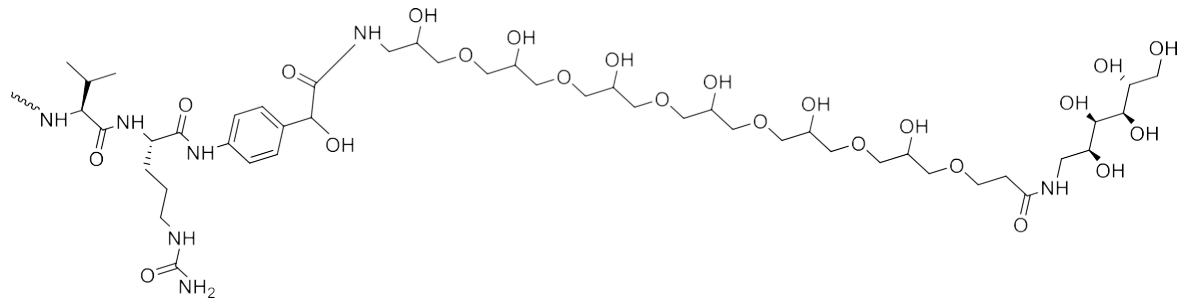
,



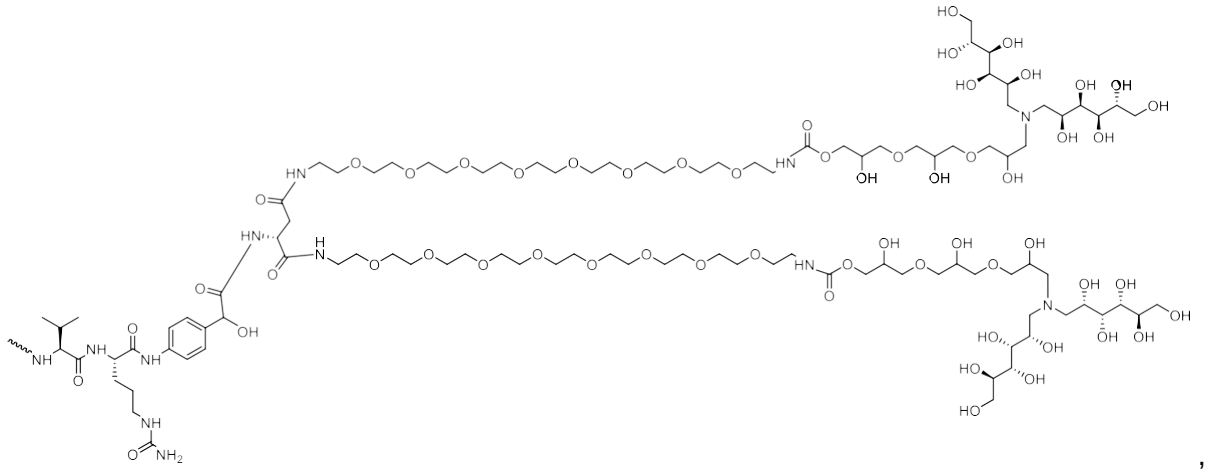
,



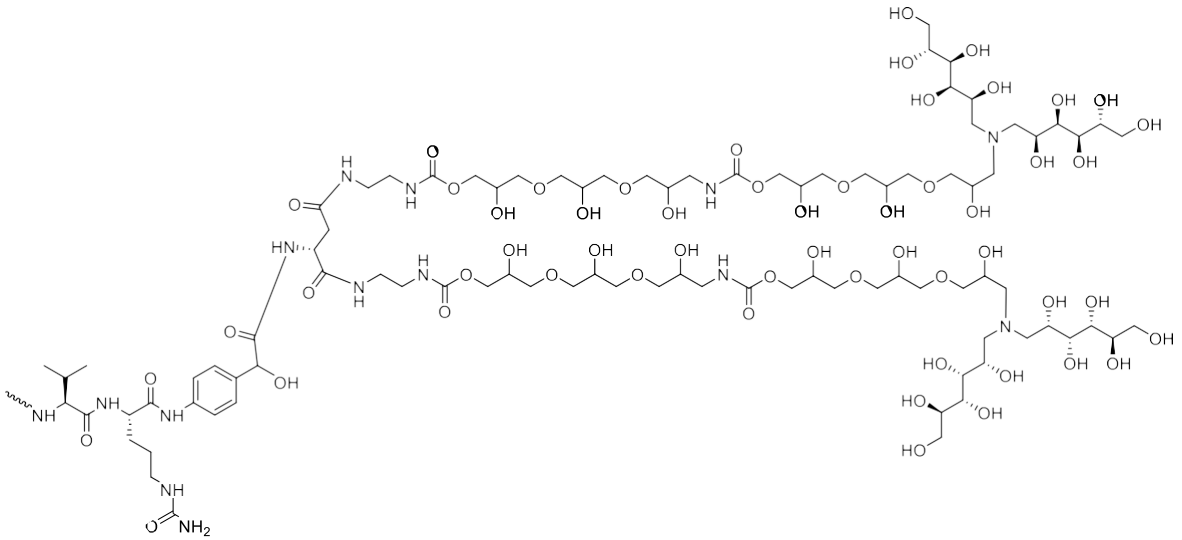
,



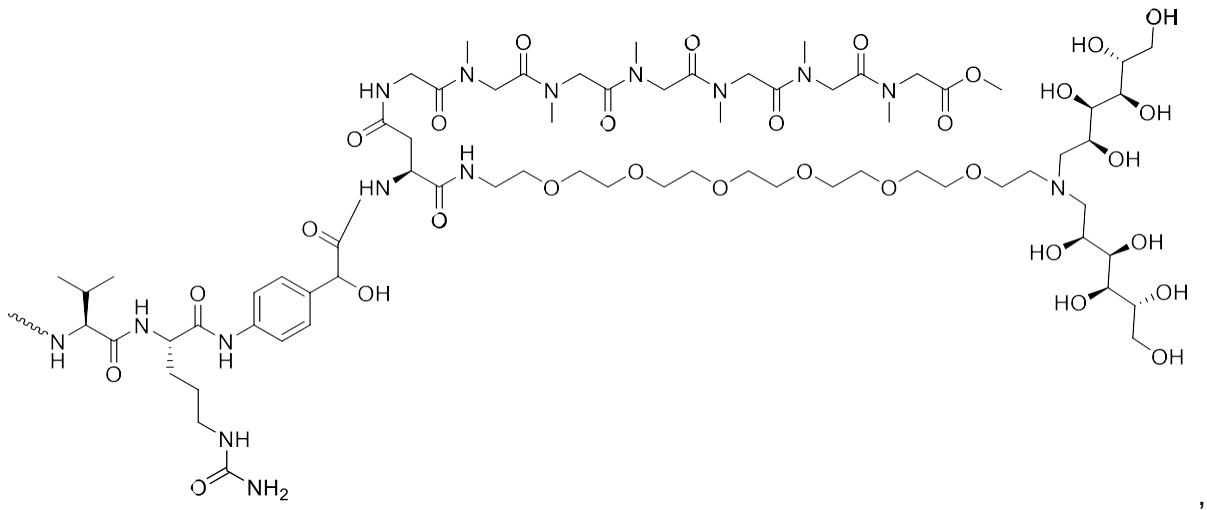
,



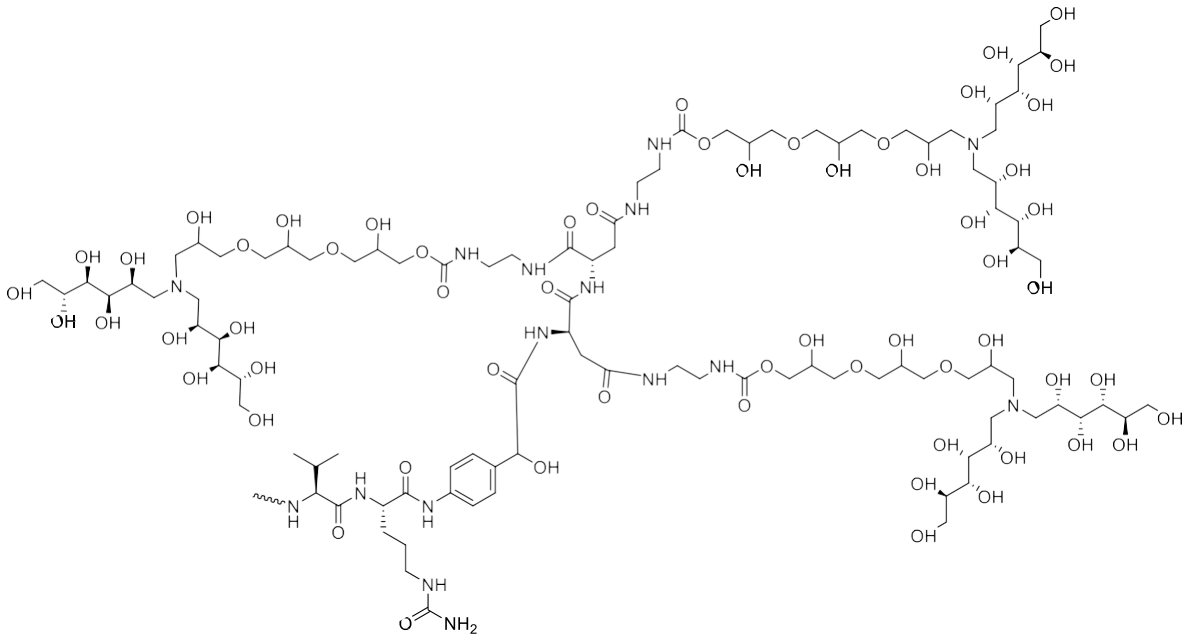
,



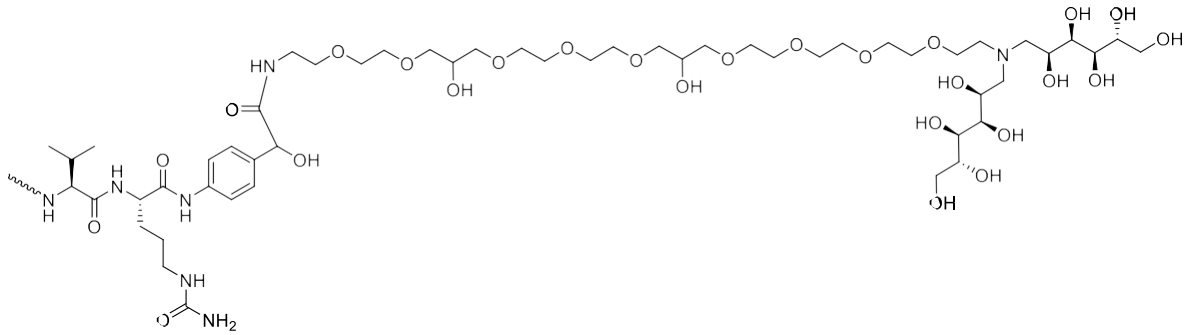
,



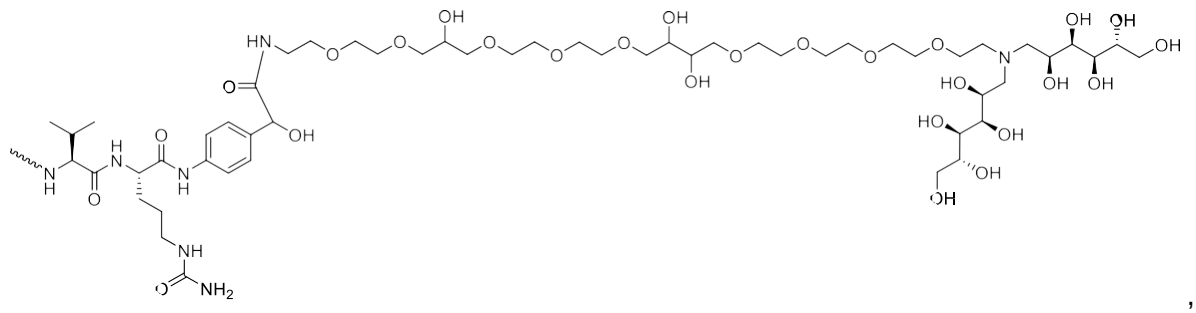
,



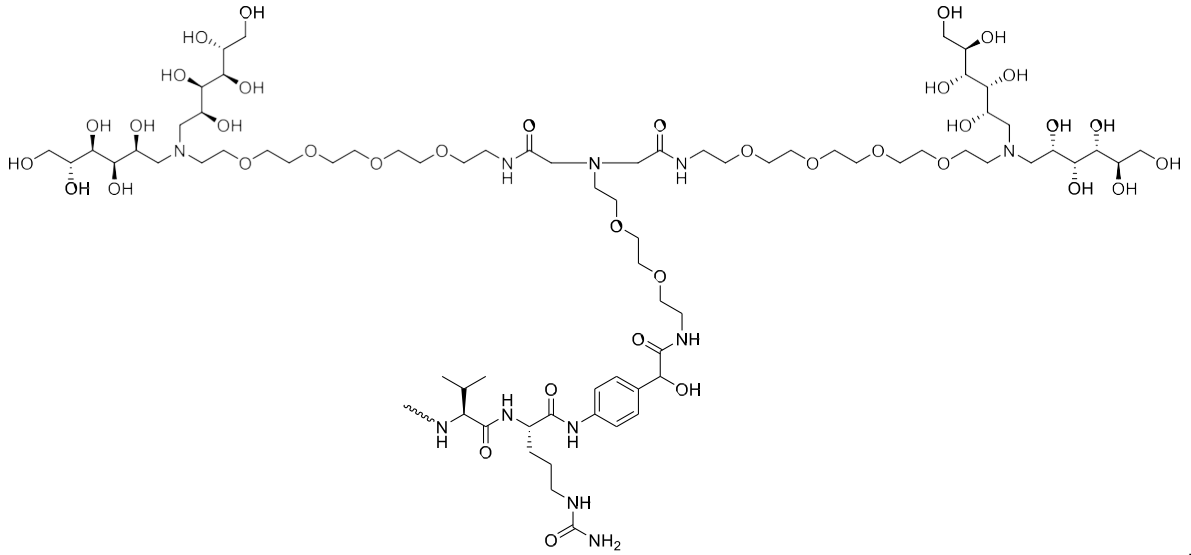
,



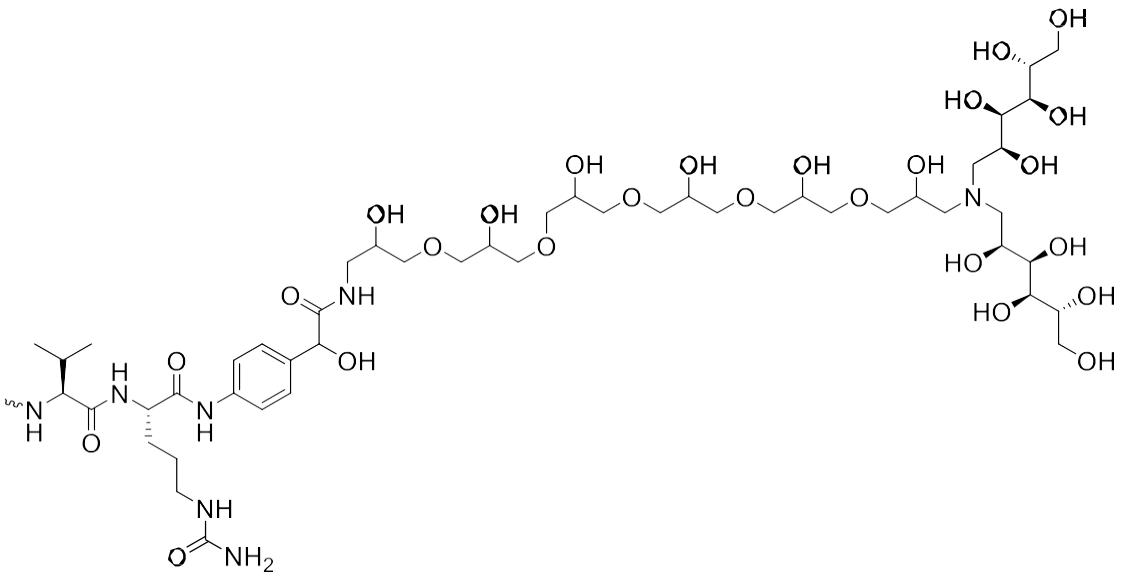
,



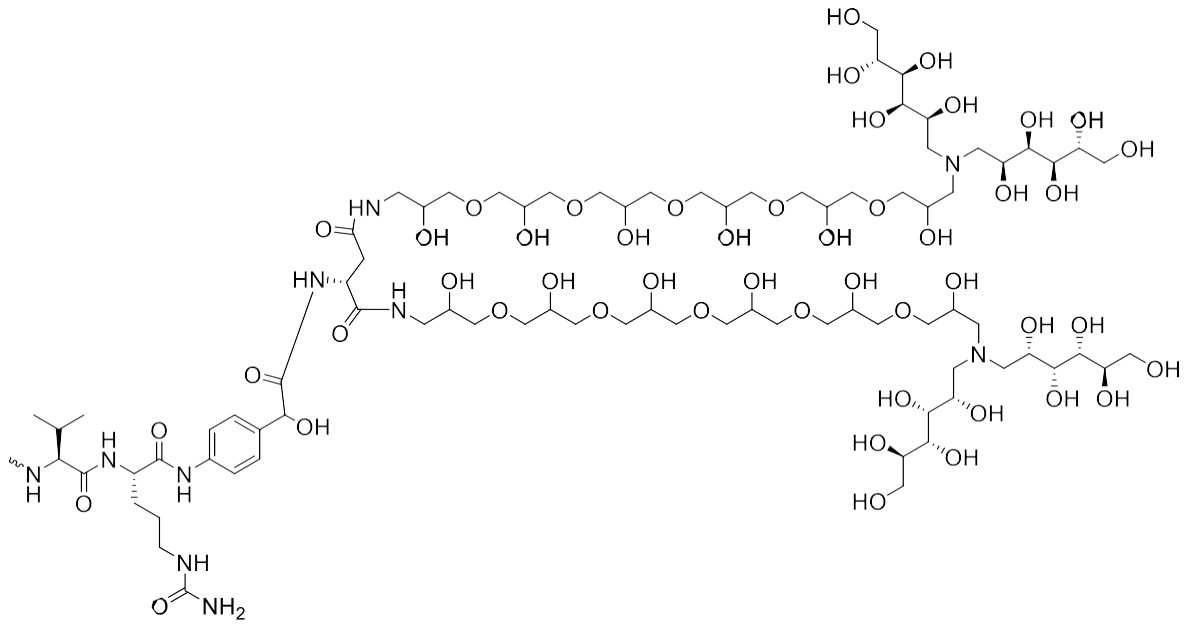
,



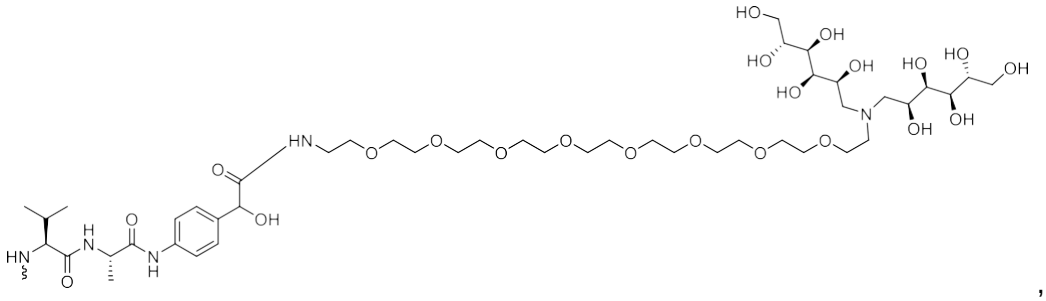
,



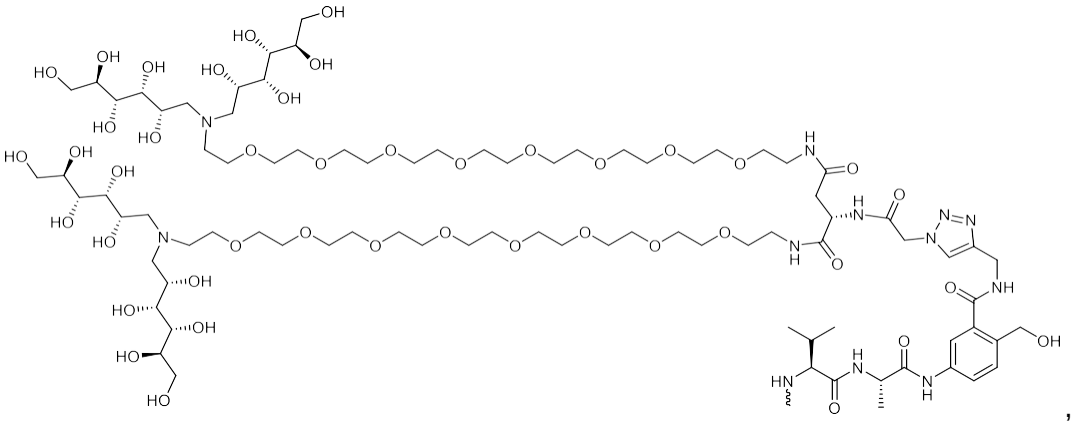
,



,



,



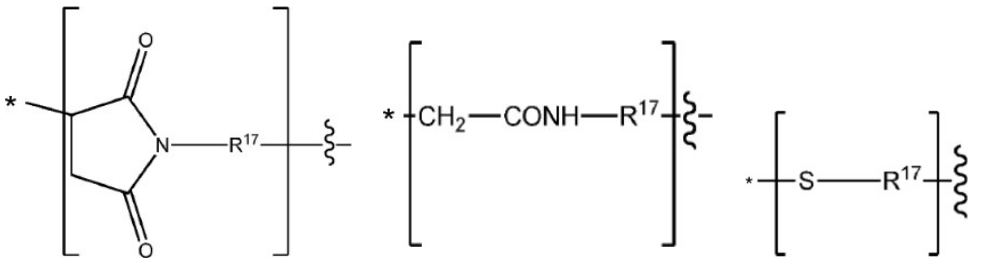
donde la línea ondulada en el grupo amino indica un sitio de unión al grupo extensor; o, antes de unirse al grupo extensor, indica H; y el H en el OH bencílico opcionalmente se reemplaza por un enlace a por lo menos una de las unidades de fármaco o un grupo conector unido a por lo menos una de las unidades de fármaco.

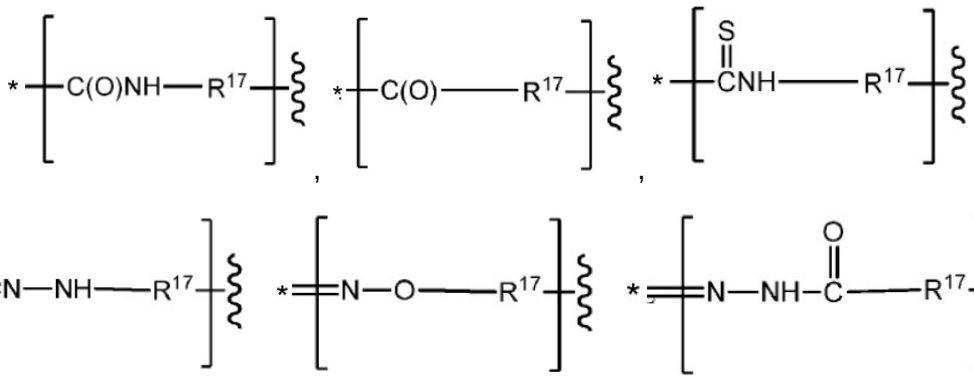
72. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 69, donde el grupo enzimáticamente escindible se une al grupo extensor por medio de un grupo conector no peptídico.

73. El compuesto conector de la reivindicación 72, donde el grupo conector no peptídico se selecciona entre C_1-C_{10} alquileno opcionalmente sustituido, C_2-C_{10} alquenileno opcionalmente sustituido, C_2-C_{10} alquinileno opcionalmente sustituido, o polietilenglicol opcionalmente sustituido.

74. El compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 1-73, que comprende el grupo extensor unido al grupo enzimáticamente escindible.

75. El compuesto conector de la reivindicación 74, donde el grupo extensor se selecciona entre los siguientes:





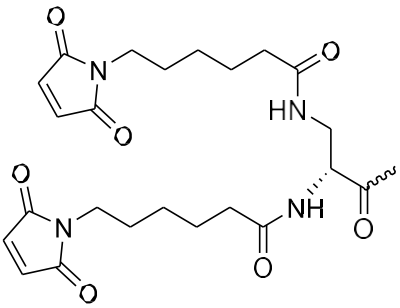
donde R^{17} es -C_1-C_{10} alquileno-, -C_1-C_{10} heteroalquileno-, -C_3-C_8 carbociclo-, -O-(C_1-C_8 alquileno)-, -$(CH_2$-O-$CH_2)_b$-C_1-C_8 alquileno- (donde b es entre 1 y 26), -C_1-C_8 alquileno-$(CH_2$-O-$CH_2)_b$- (donde b es entre 1 y 26), -C_1-C_8 alquileno-$(CH_2$-O-$CH_2)_b$-C_1-C_8 alquileno- (donde b es entre 1 y 26), -arileno-, -C_1-C_{10} alquileno-arileno-, -arileno-C_1-C_{10} alquileno-, -C_1-C_{10} alquileno-(C_3-C_8 carbociclo)-, -(C_3-C_8 carbociclo)-C_1-C_{10} alquileno-, -C_3-C_8 heterociclo-, -C_1-C_{10} alquileno-(C_3-C_8 heterociclo)-, -(C_3-C_8 heterociclo)-C_1-C_{10} alquileno-, -C_1-C_{10} alquileno-C(=O)-, -C_1-C_{10}alquileno-C(O)NH-C_1-C_8alquileno-$[O$-CH_2-$CH_2]_n$-C(O)- (donde n es entre 1 y 26), C_1-C_{10} heteroalquileno-C(=O)-, -C_1-C_8 alquileno-$(CH_2$-O-$CH_2)_b$-C(=O)- (donde b es entre 1 y 26), -$(CH_2$-O-$CH_2)_b$-C_1-C_8 alquileno-C(=O)- (donde b es entre 1 y 26), -C_1-C_8 alquileno-$(CH_2$-O-$CH_2)_b$-C_1-C_8 alquileno-C(=O)- (donde b es entre 1 y 26), -C_3-C_8 carbociclo-C(=O)-, -O-(C_1-C_8 alquil)-C(=O)-, -arileno-C(=O)-, -C_1-C_{10} alquileno-arileno-C(=O)-, -arileno-C_1-C_{10} alquileno-C(=O)-, -C_1-C_{10} alquileno-(C_3-C_8 carbociclo)-C(=O)-, -(C_3-C_8 carbociclo)-C_1-C_{10} alquileno-C(=O)-, -C_3-C_8 heterociclo-C(=O)-, -C_1-C_{10} alquileno-(C_3-C_8 heterociclo)-C(=O)-, -(C_3-C_8 heterociclo)-C_1-C_{10} alquileno-C(=O)-, -C_1-C_{10} alquileno-NH-, -C_1-C_{10} heteroalquileno-NH-, -C_1-C_8 alquileno-$(CH_2$-O-$CH_2)_b$-NH- (donde b es entre 1 y 26), -$(CH_2$-O-$CH_2)_b$-C_1-C_8 alquileno-NH- (donde b es entre 1 y 26), -C_1-C_8 alquileno-$(CH_2$-O-$CH_2)_b$-C_1-C_8 alquileno-NH- (donde b es entre 1 y 26), -C_1-C_8 alquileno-(C(=O))-NH-$(CH_2$-O-$CH_2)_b$-C(=O)- (donde b es entre 1 y 26), -C_1-C_8 alquileno-(C(=O))-NH-$(CH_2$-O-$CH_2)_b$-C_1-C_8 alquileno-C(=O)- (donde b es entre 1 y 26), -C_1-C_8 alquileno-NH-(C(=O))-$(CH_2$-O-$CH_2)_b$-NH- (donde b es entre 1 y 26), -C_1-C_8 alquileno-NH-(C(=O))-$(CH_2$-O-$CH_2)_b$-C_1-C_8 alquileno-NH- (donde b es entre 1 y 26), -C_3-C_8 carbociclo-NH-, -O-(C_1-C_8 alquil)-NH-, -arileno-NH-, -C_1-C_{10} alquileno-arileno-NH-, -arileno-C_1-C_{10} alquileno-NH-, -C_1-C_{10} alquileno-(C_3-C_8 carbociclo)-NH-, -(C_3-C_8 carbociclo)-C_1-C_{10} alquileno-NH-, -C_3-C_8 heterociclo-NH-, -C_1-C_{10} alquileno-(C_3-C_8 heterociclo)-NH-, -(C_3-C_8 heterociclo)-C_1-C_{10} alquileno-NH-, -C_1-C_{10} alquileno-S-, C_1-C_{10} heteroalquileno-S-, -C_3-C_8 carbociclo-S-, -O-(C_1-C_8 alquil)-S-, -arileno-S-, -C_1-C_{10} alquileno-arileno-S-, -arileno-C_1-C_{10} alquileno-S-, -C_1-C_{10} alquileno-(C_3-C_8 carbociclo)-S-, -(C_3-C_8 carbociclo)-C_1-C_{10} alquileno-S-, -C_3-C_8 heterociclo-S-, -C_1-C_{10} alquileno-(C_3-C_8 heterociclo)-S-, o -

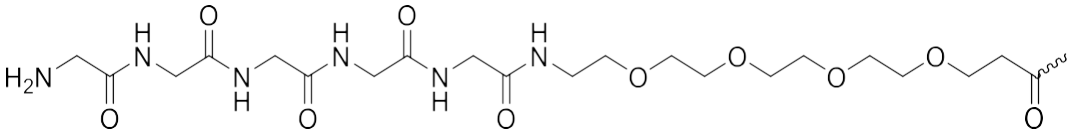
(C_3-C_8 heterociclo)-C_1-C_{10} alquileno-S-; o

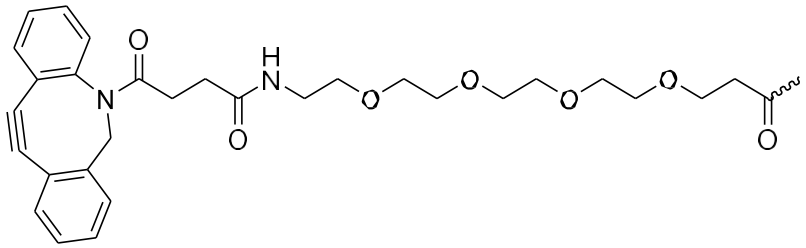
donde el grupo extensor comprende maleimido(C_1-C_{10}alquileno-C(O)-, maleimido(CH_2OCH_2)$_{p2}$(C_1-C_{10}alquileno)C(O)-, maleimido(C_1-C_{10}alquileno)(CH_2OCH_2)$_{p2}$C(O)-, o una forma de anillo abierto de los mismos, donde p2 es entre 1 y 26;

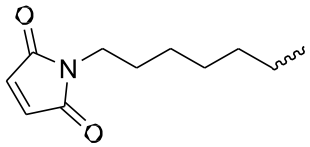
y donde * es un sitio de unión al grupo de direccionamiento, y la línea ondulada es un sitio de unión al grupo enzimáticamente escindible.

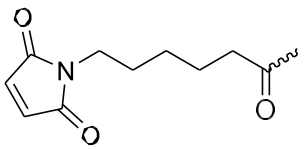
76. El compuesto conector de la reivindicación 74, donde el grupo extensor se selecciona entre los siguientes:

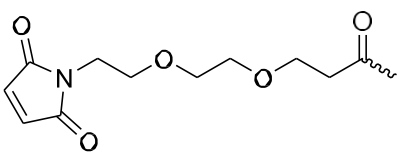

;

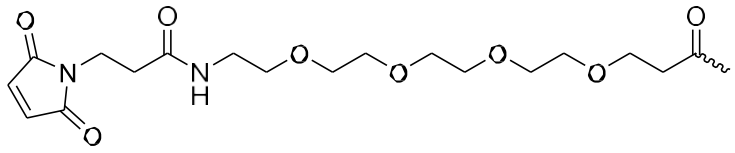

;


;

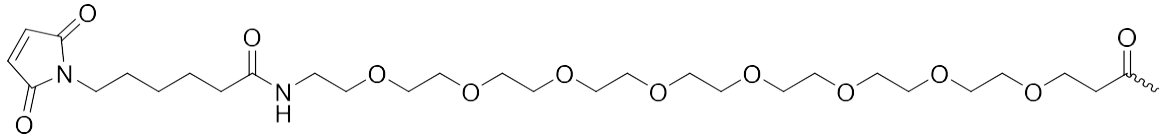

;


;


;

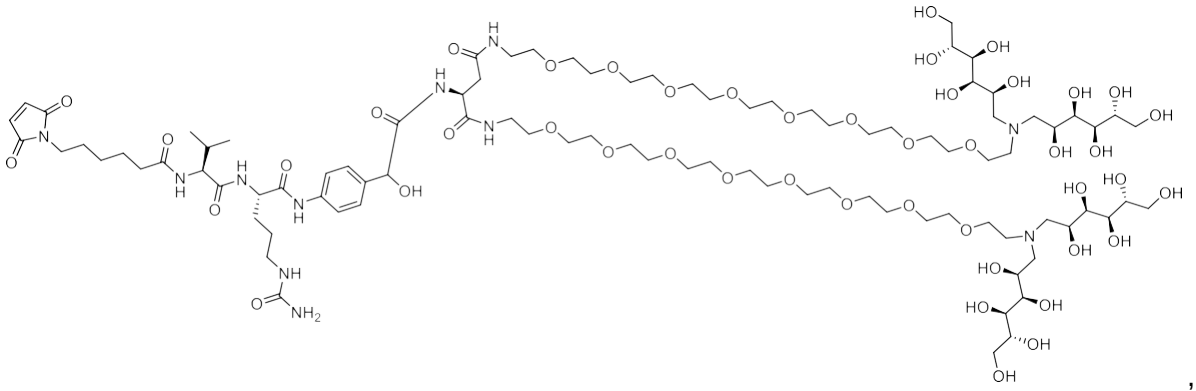


; y

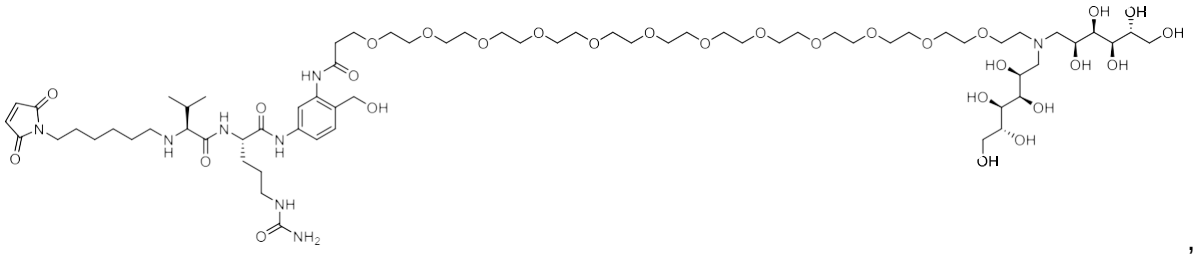


donde la línea ondulada ~~~ indica un sitio de unión del grupo extensor al grupo enzimáticamente escindible, y el sitio de unión al grupo de direccionamiento se encuentra en el grupo funcional maleimida, amina primaria o alquino.

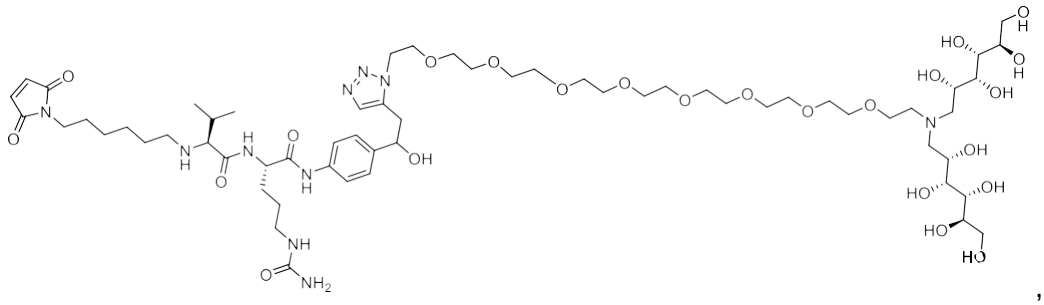
77. El compuesto conector de la reivindicación 1, que tiene una de las siguientes estructuras:



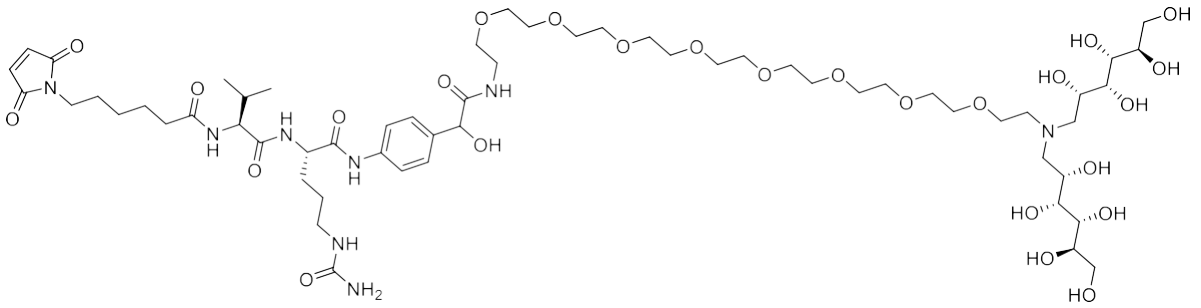
,



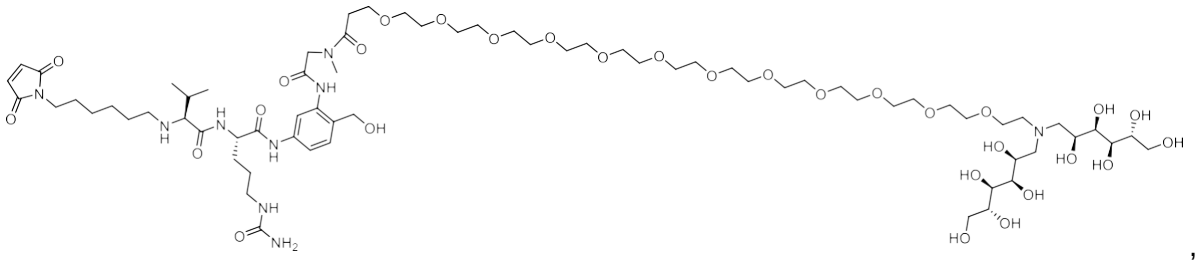
,



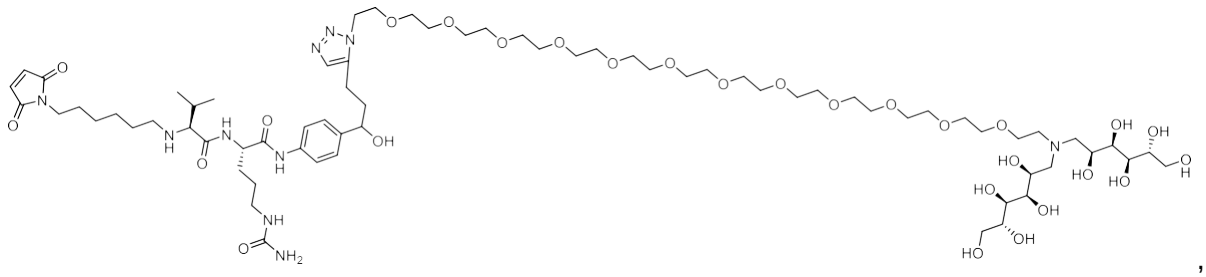
,



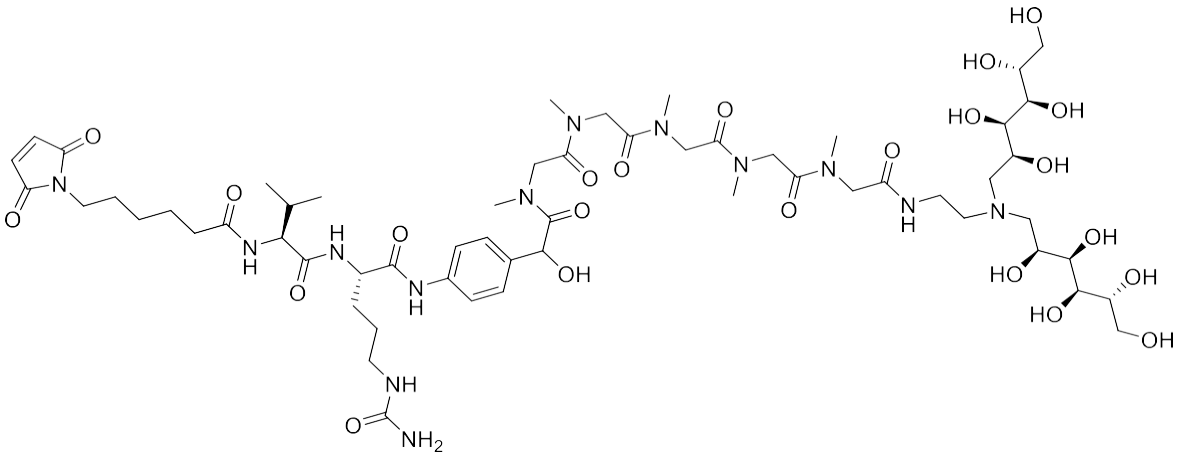
,



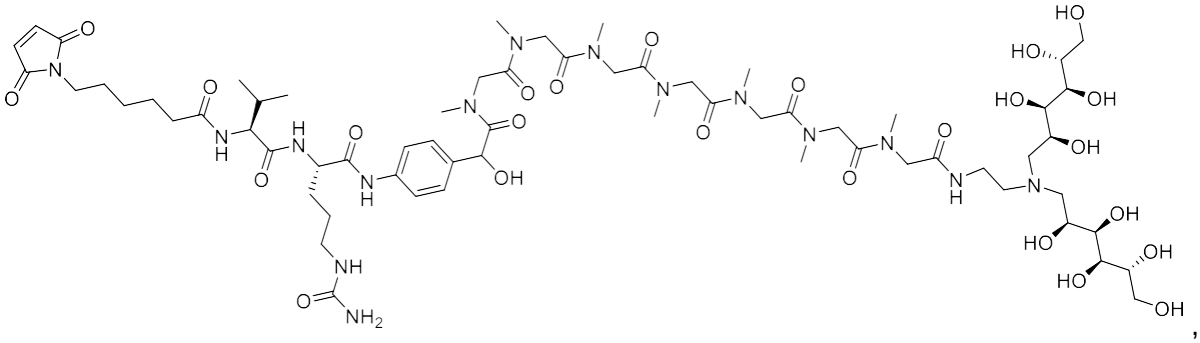
,



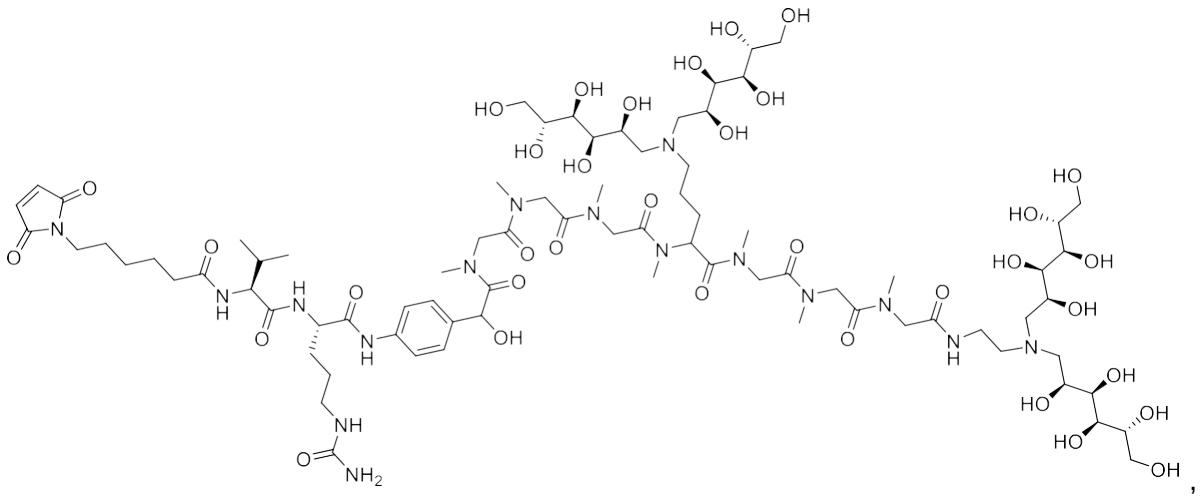
,



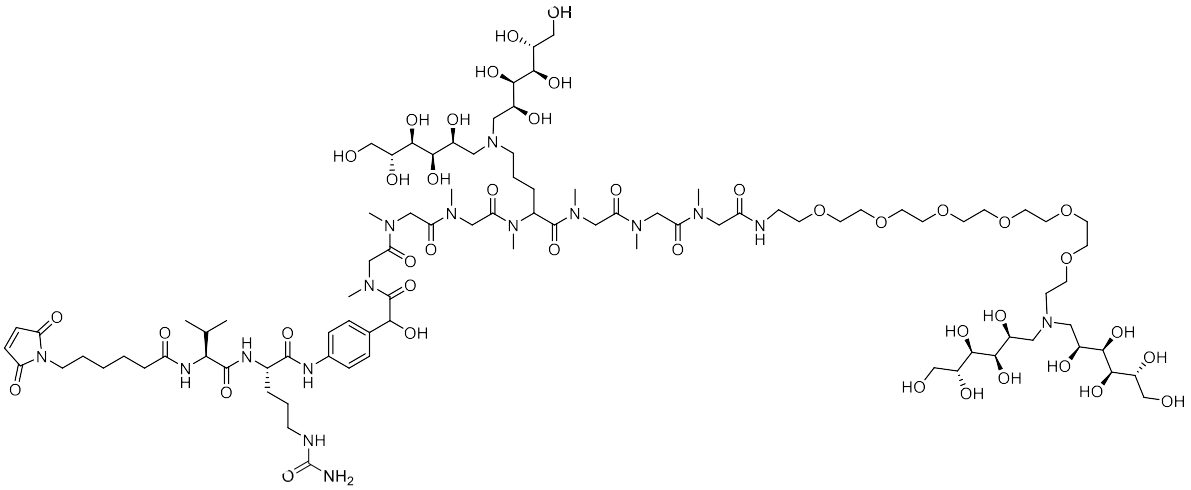
,



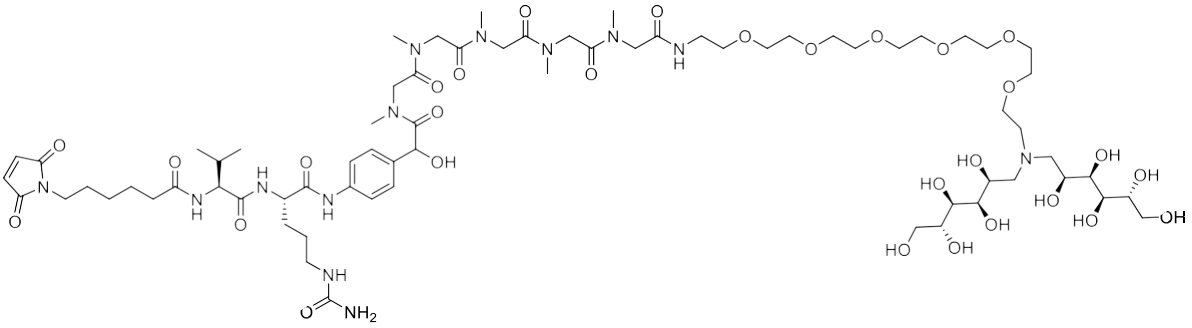
,



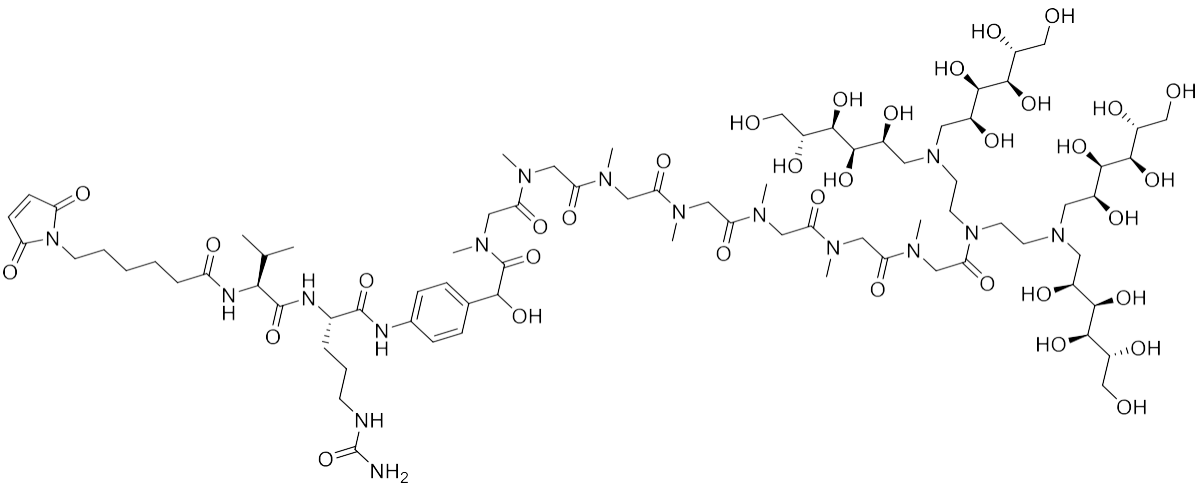
,

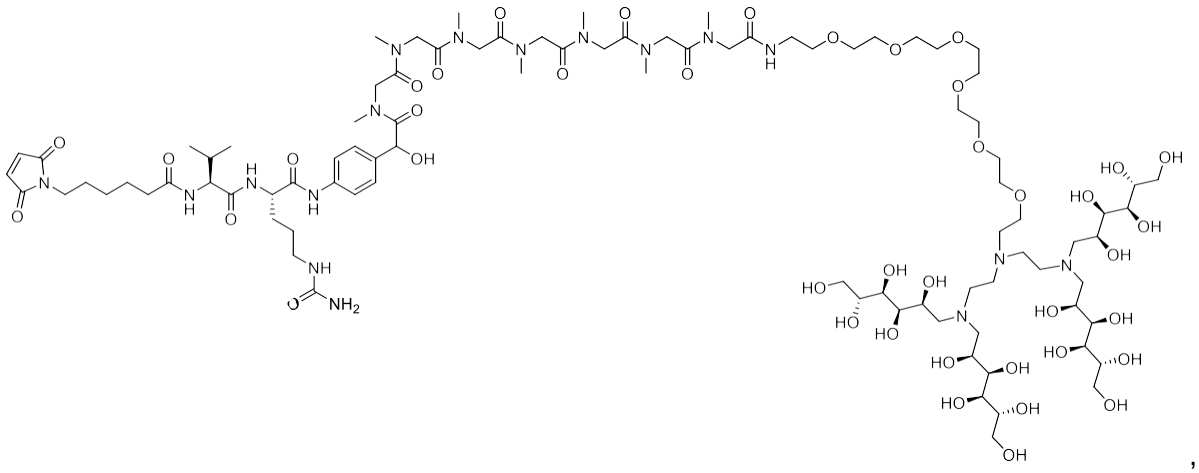


,

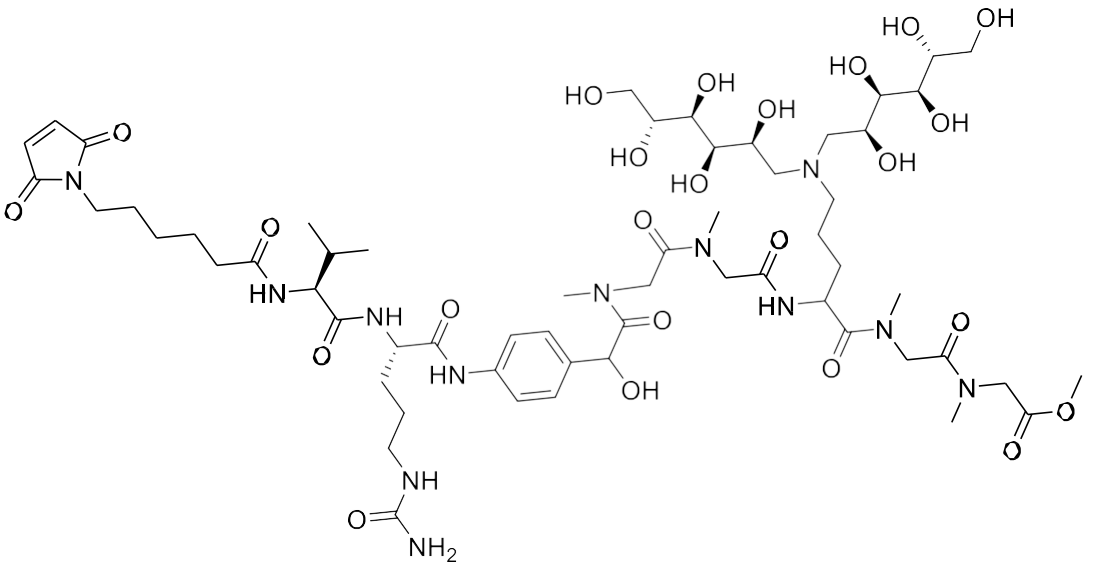


,

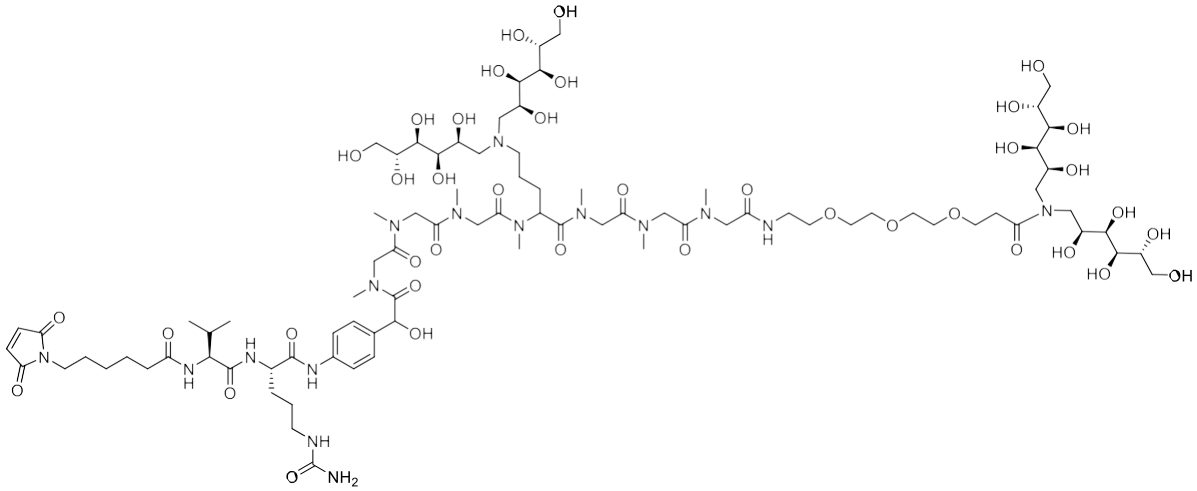




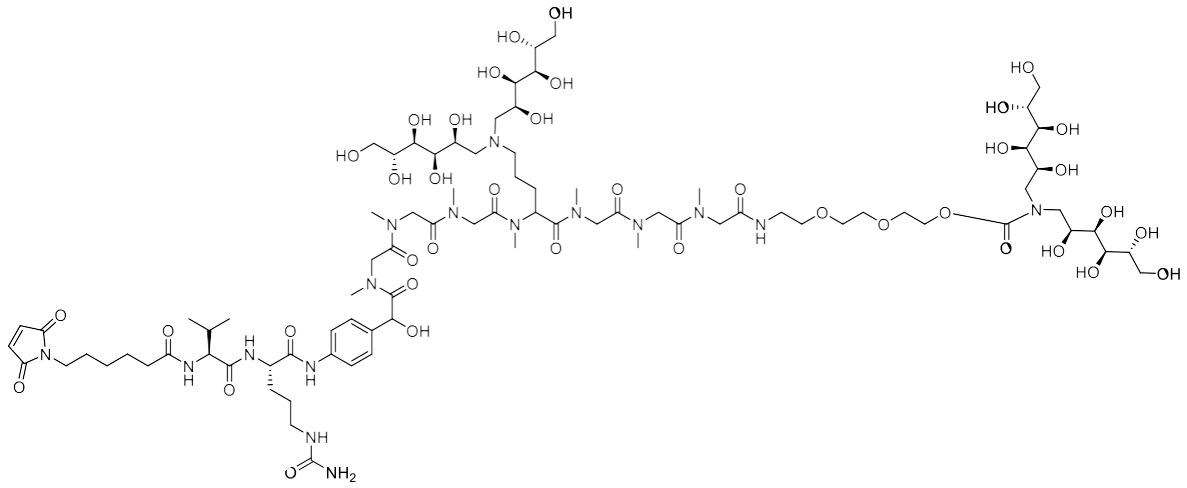
,



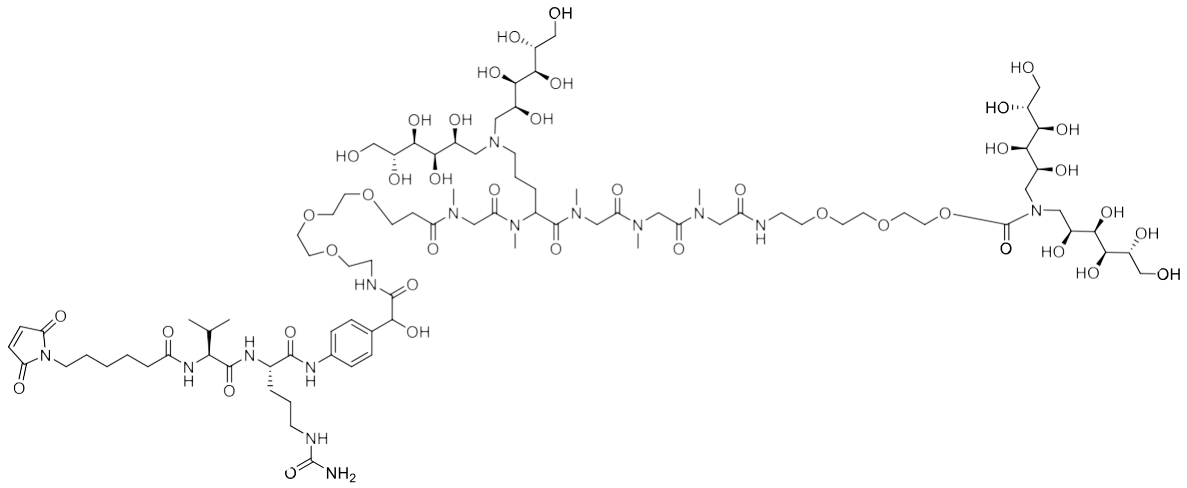
,



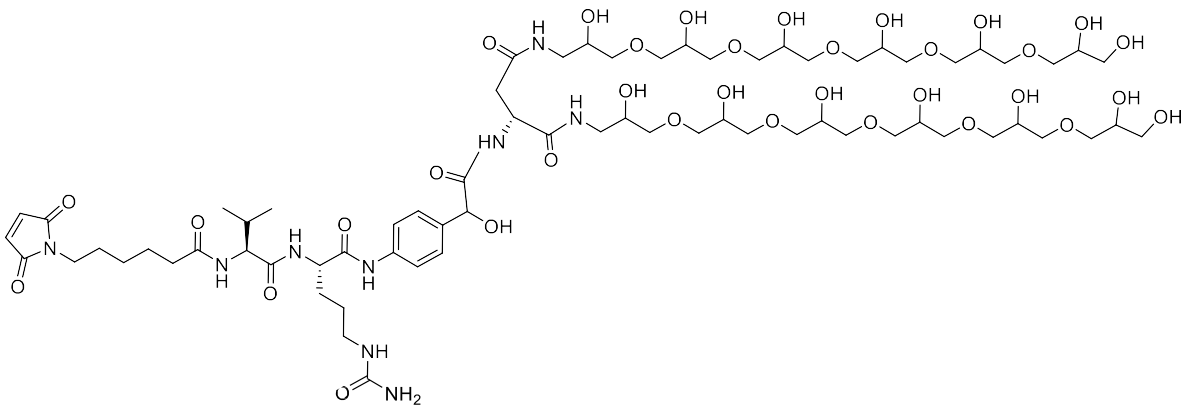
,



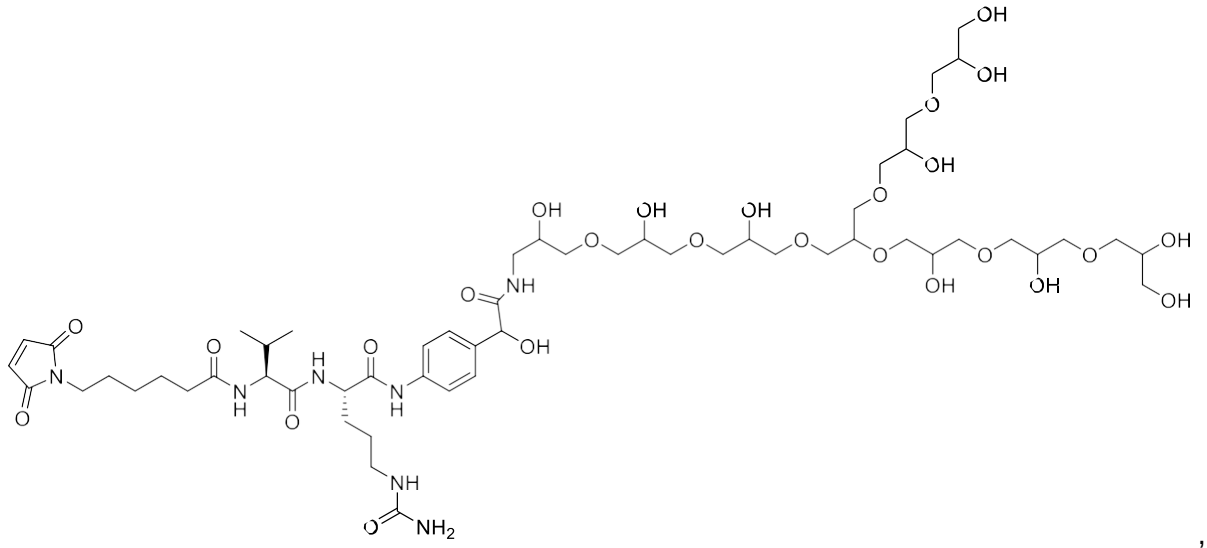
,



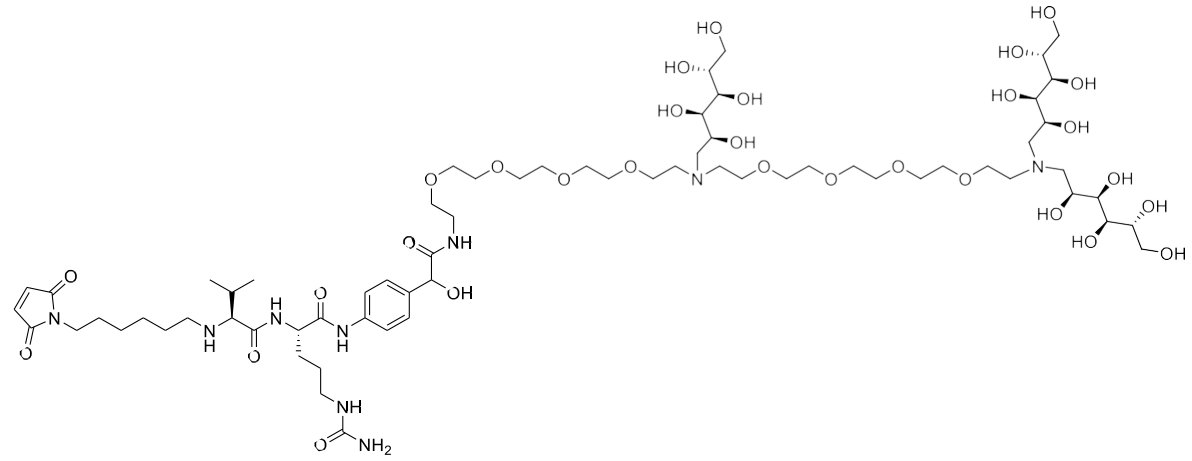
,



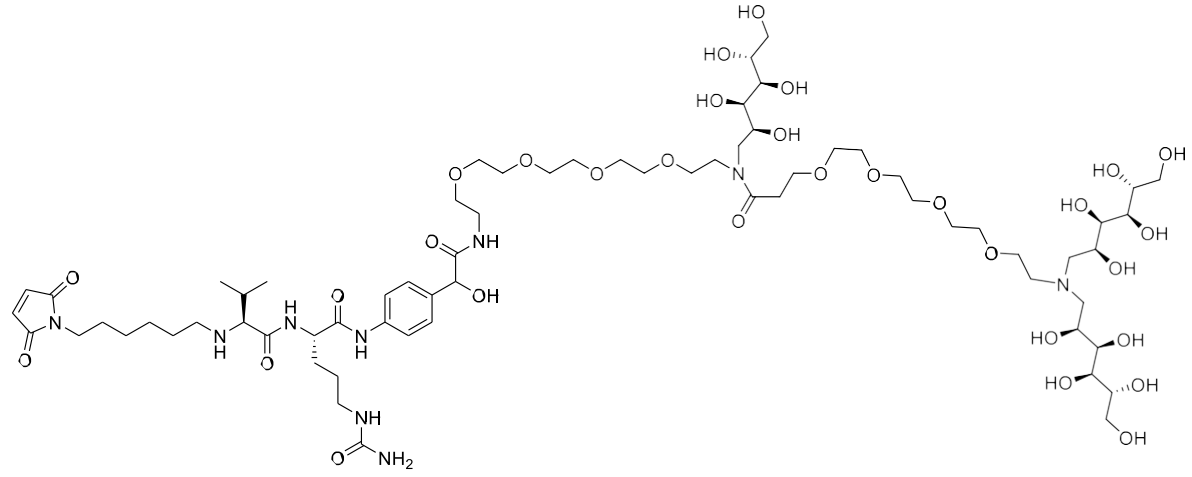
,



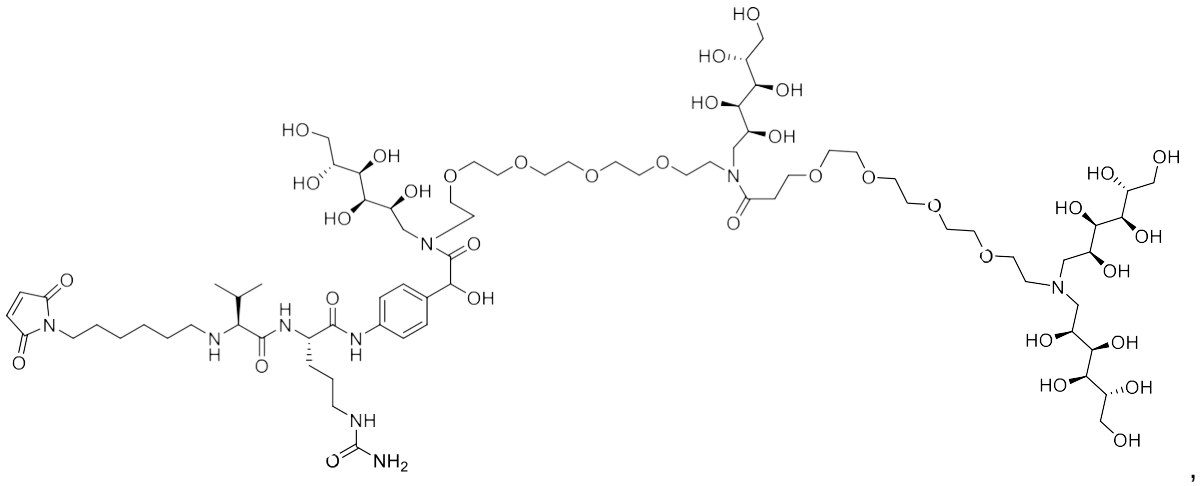
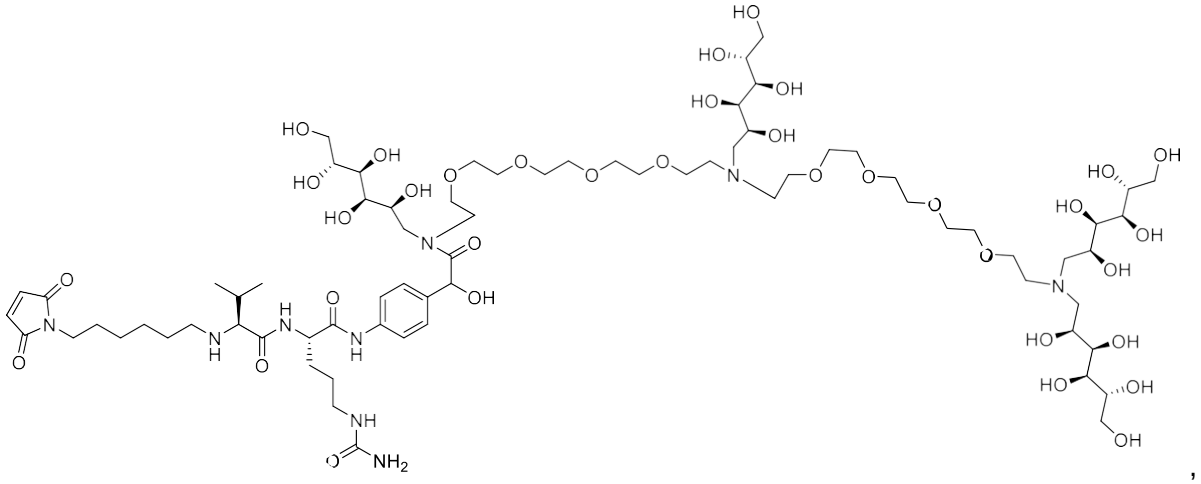
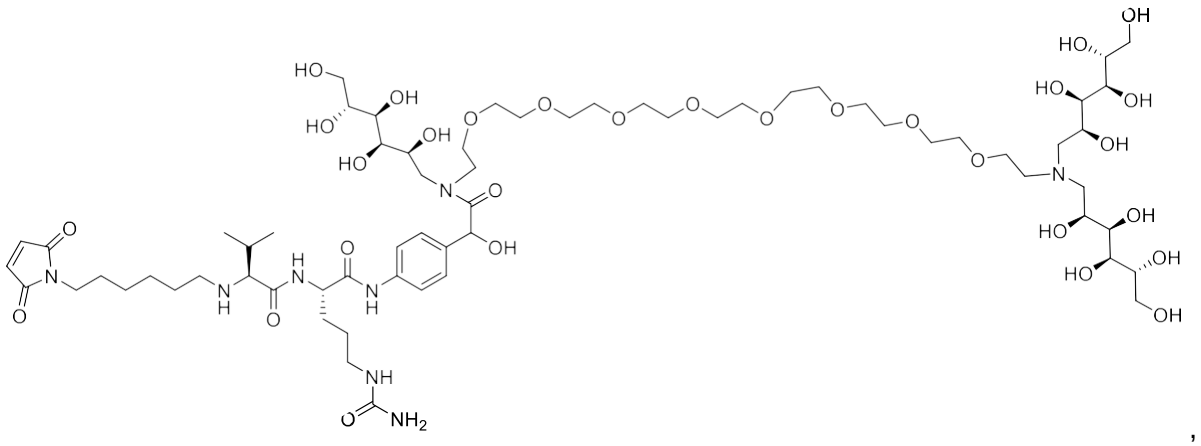
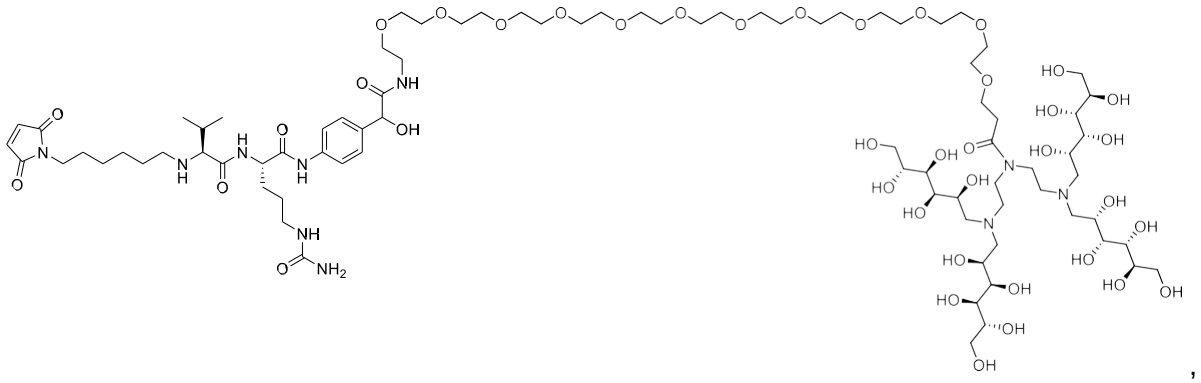
,

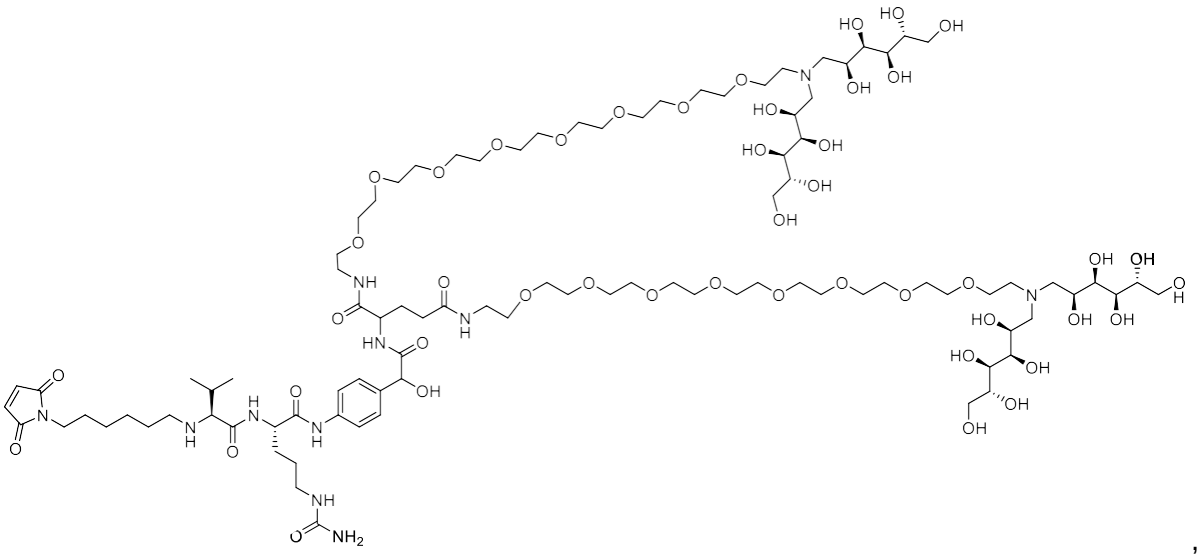


,

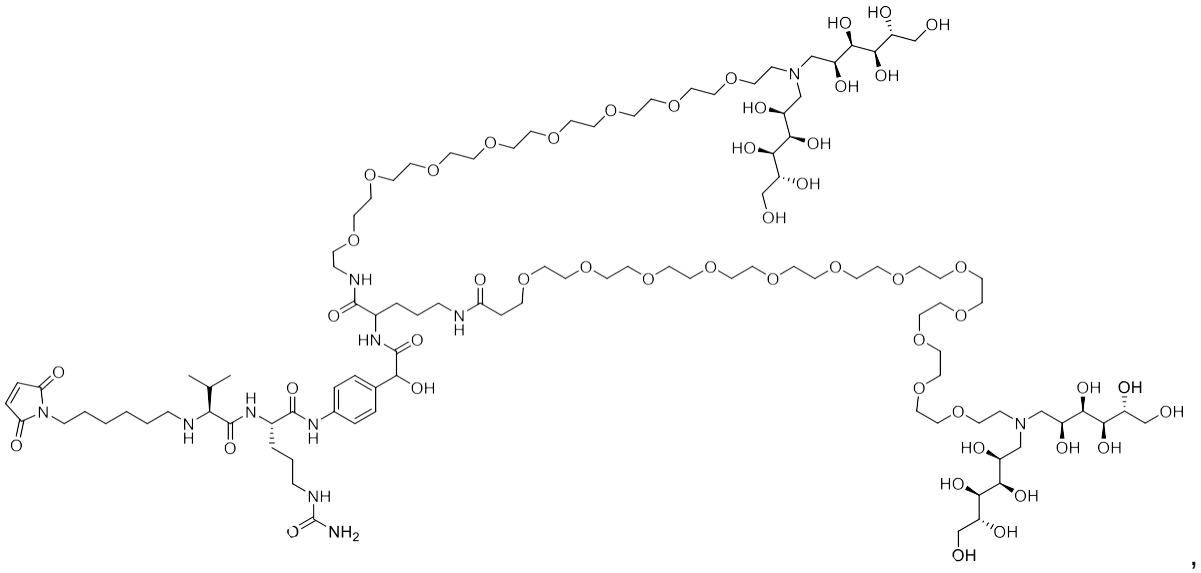


,

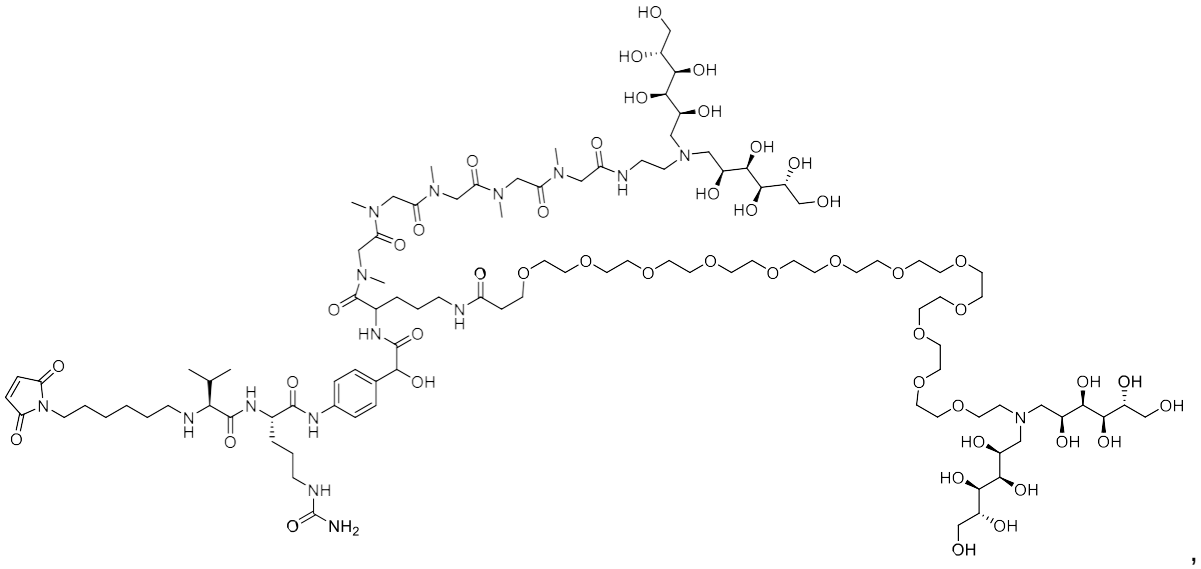

,

,

,

,



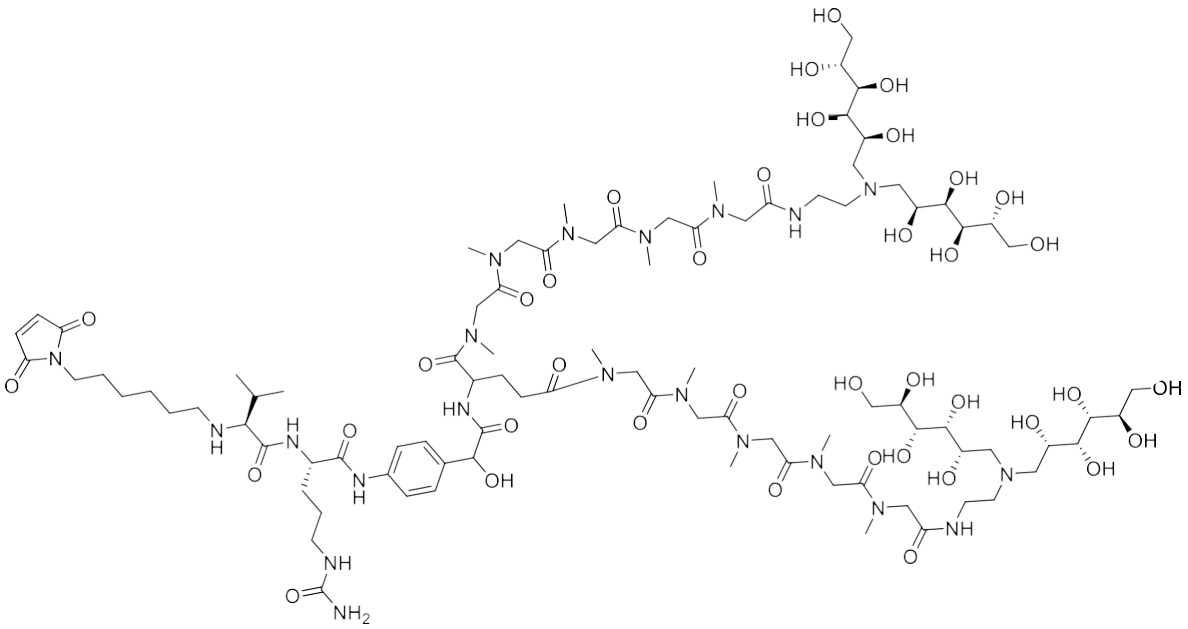
,



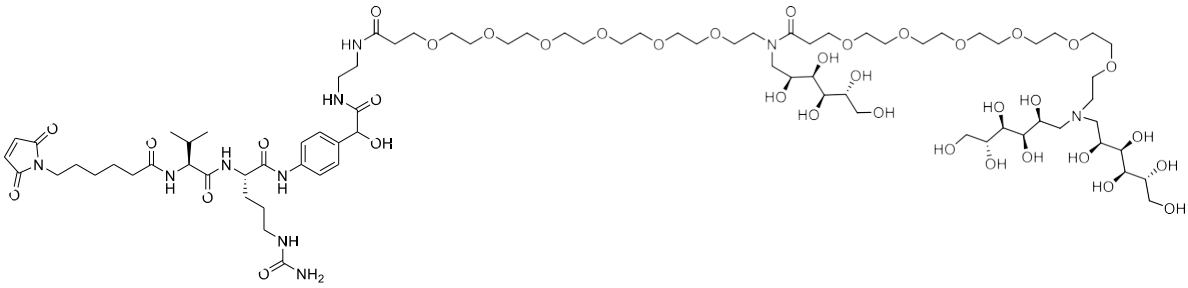
,



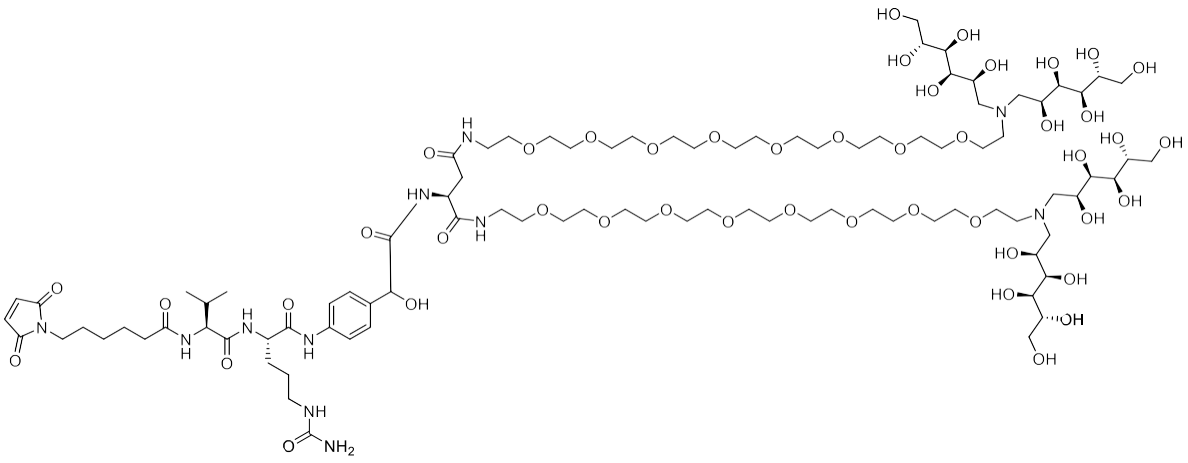
,



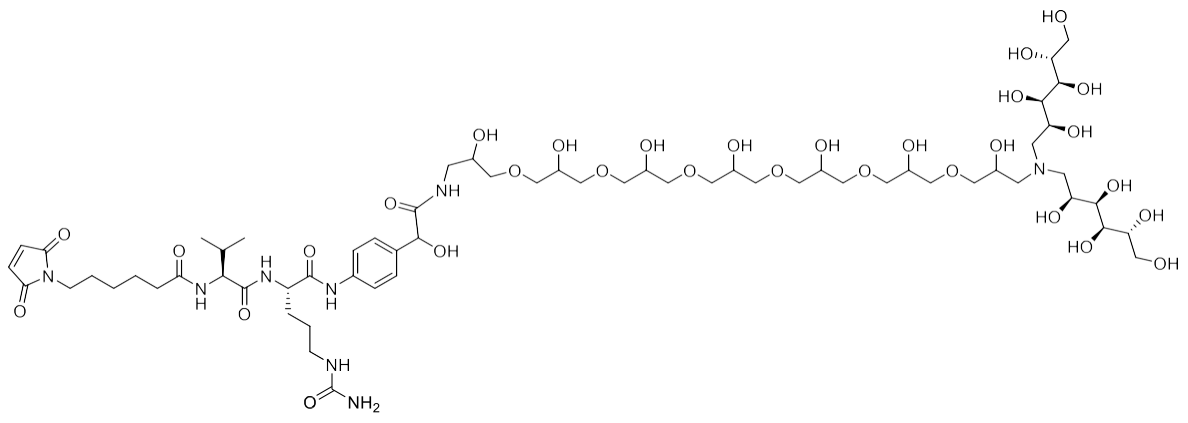
,



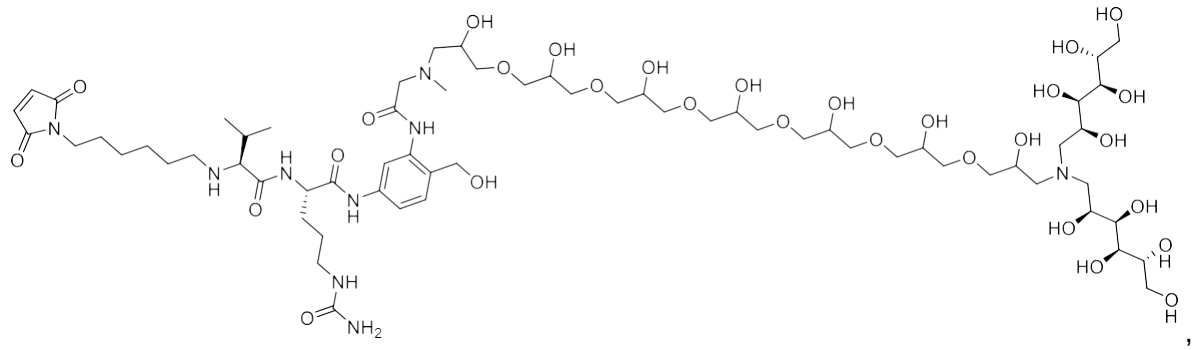
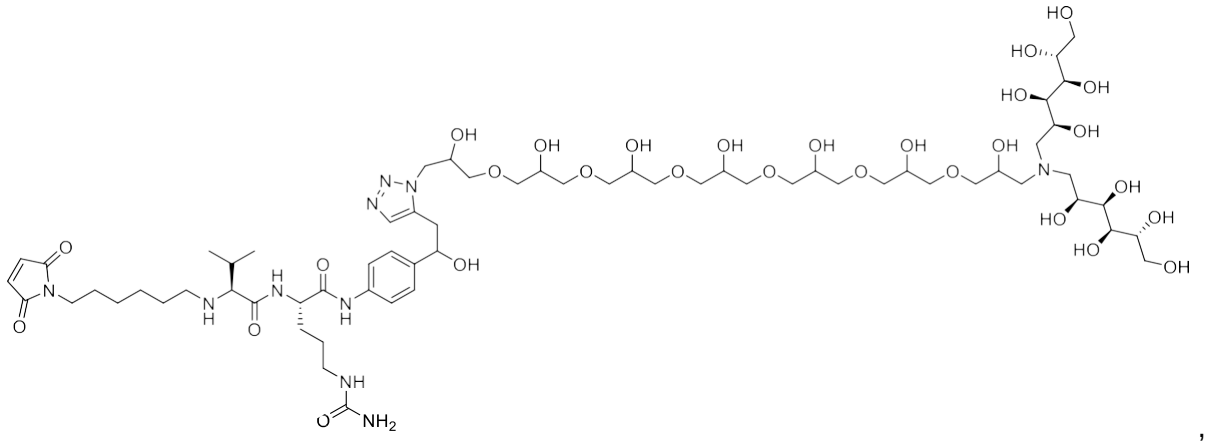
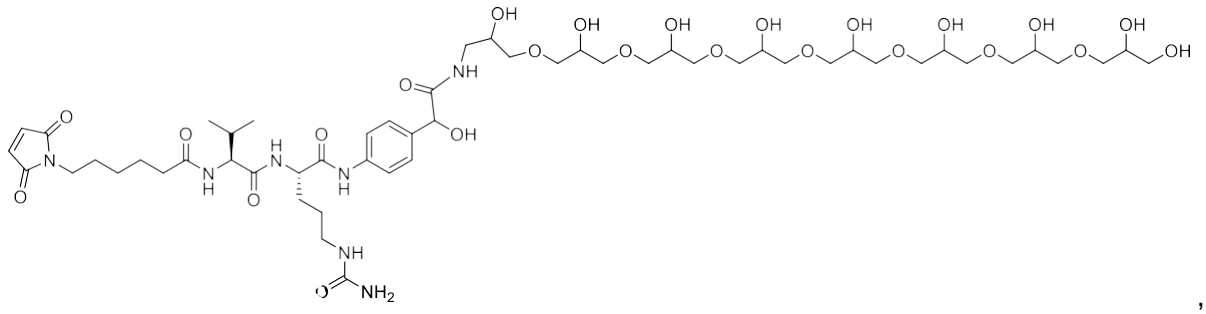
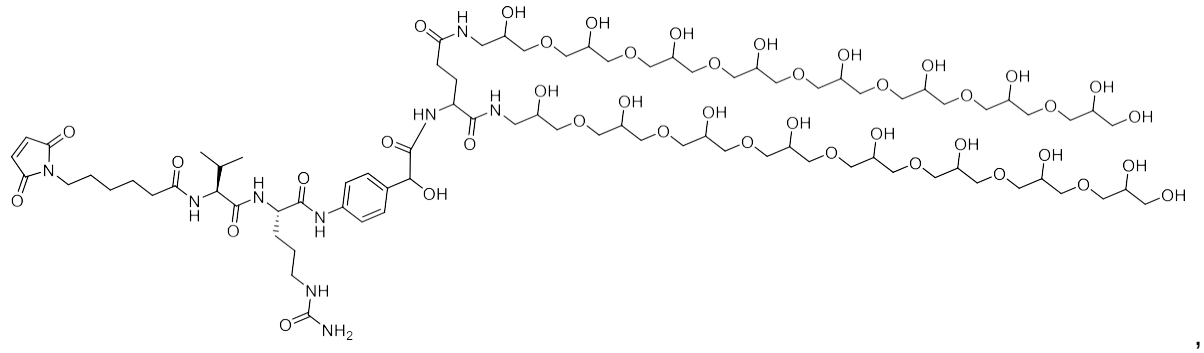
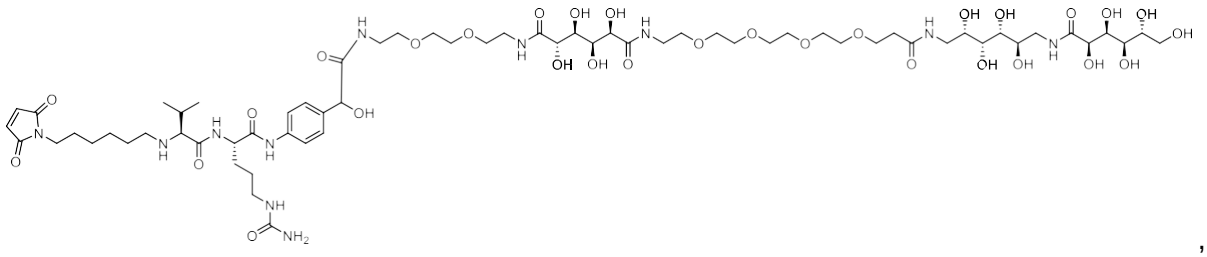
,

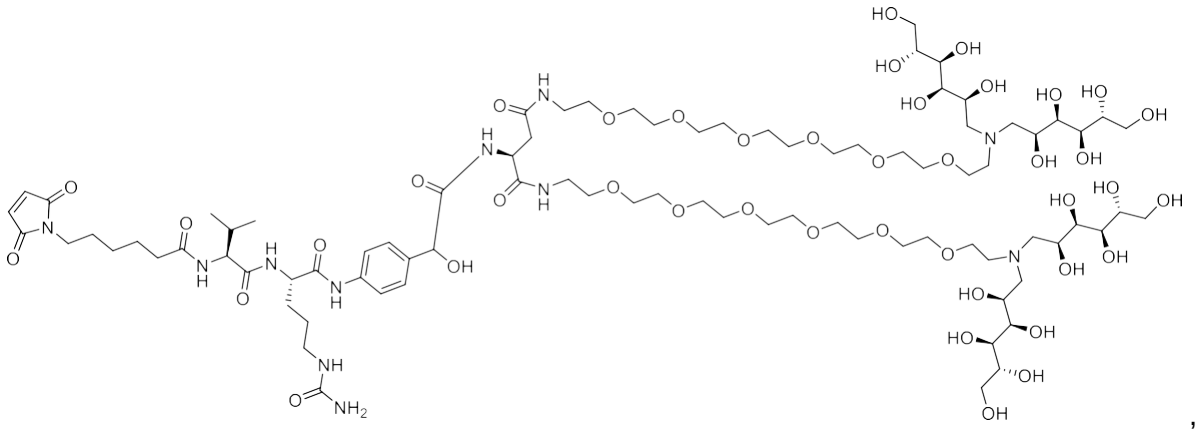
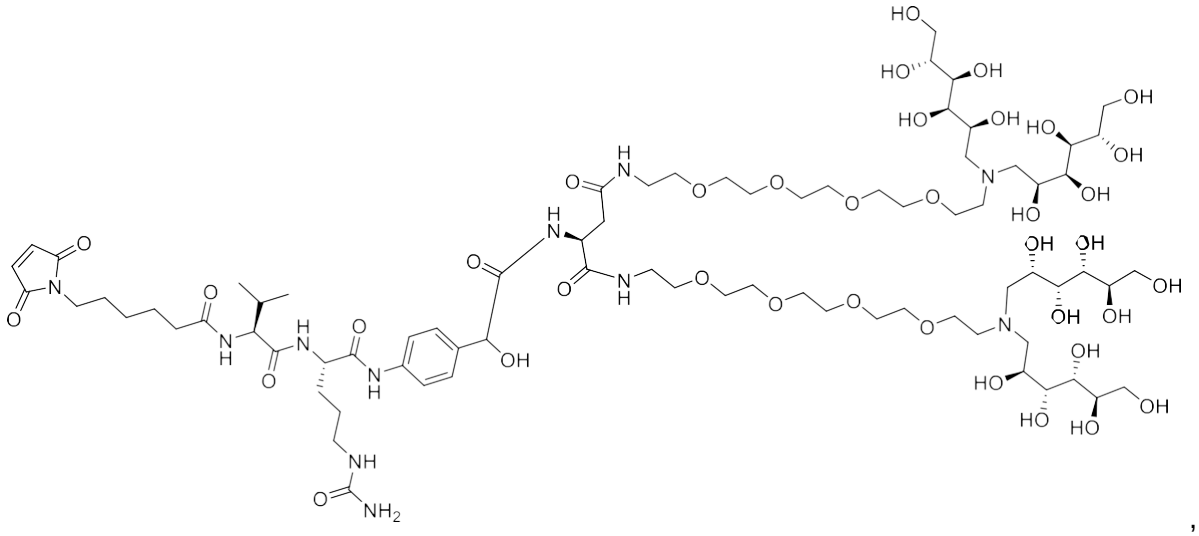
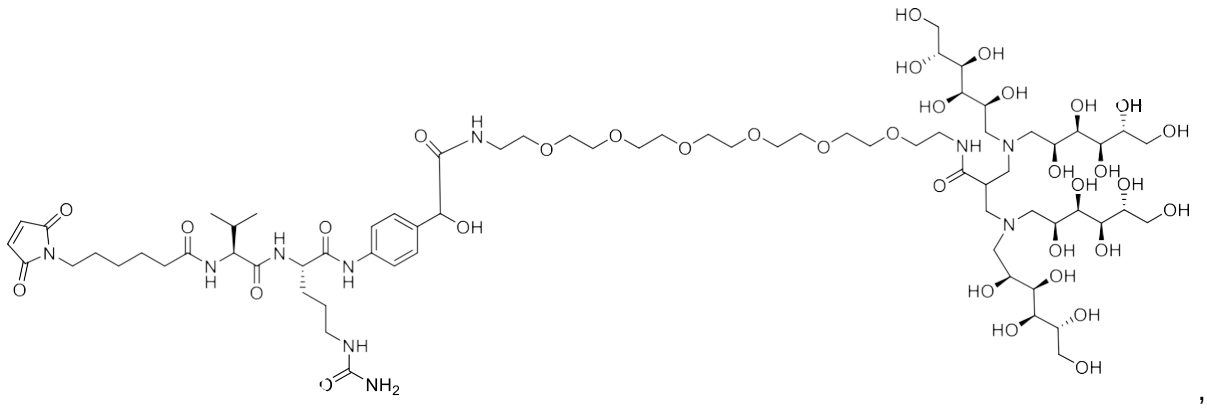
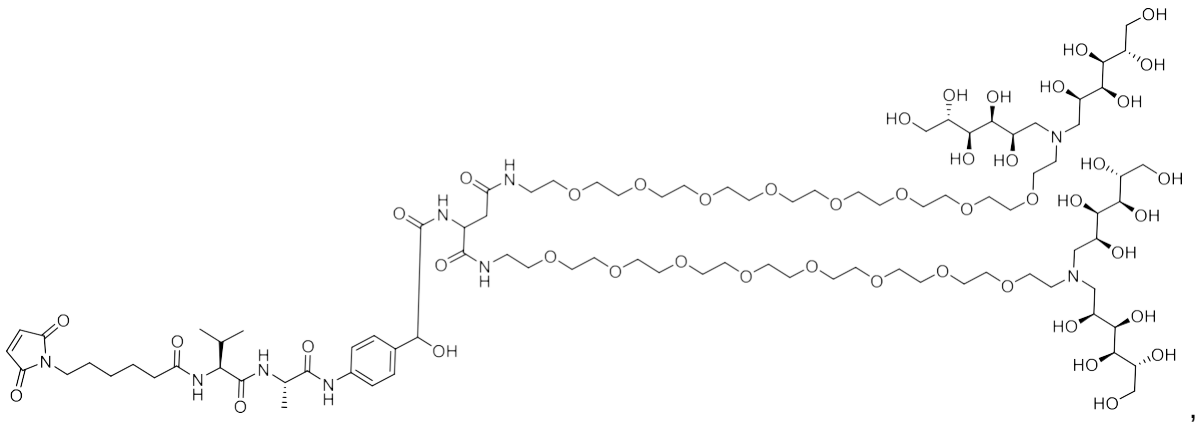


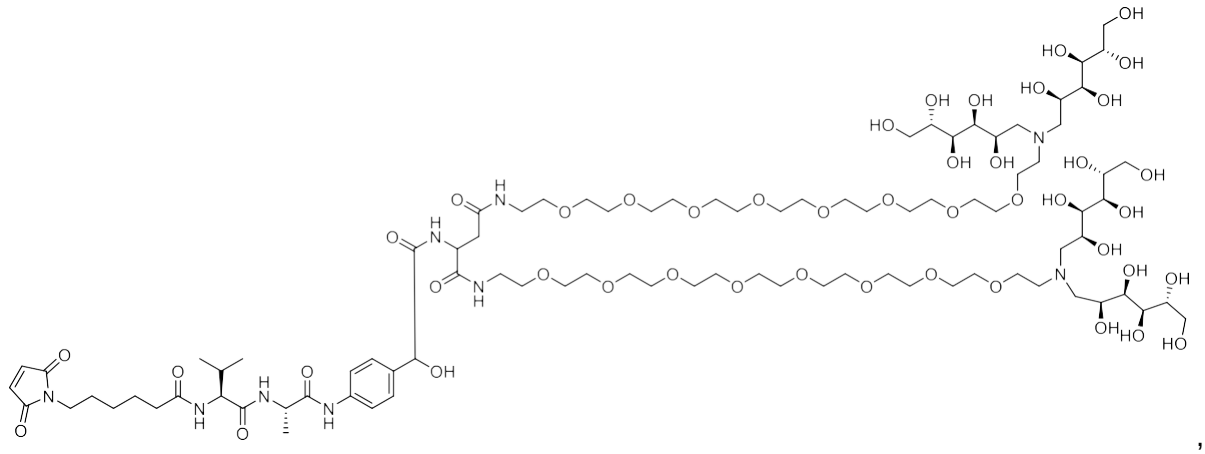
,



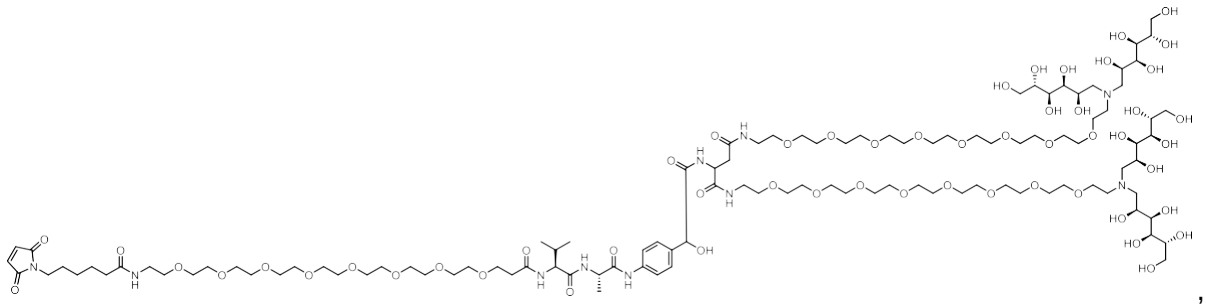
,


,

,

,

,

,

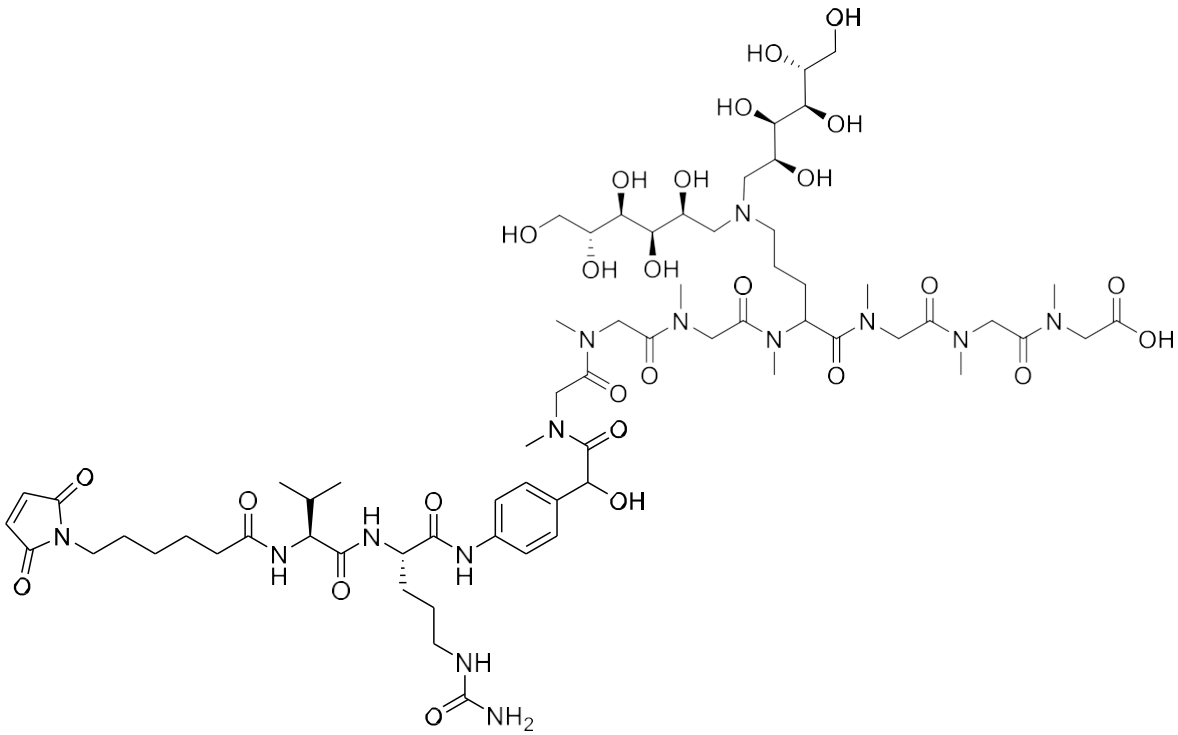

,

,

,

,



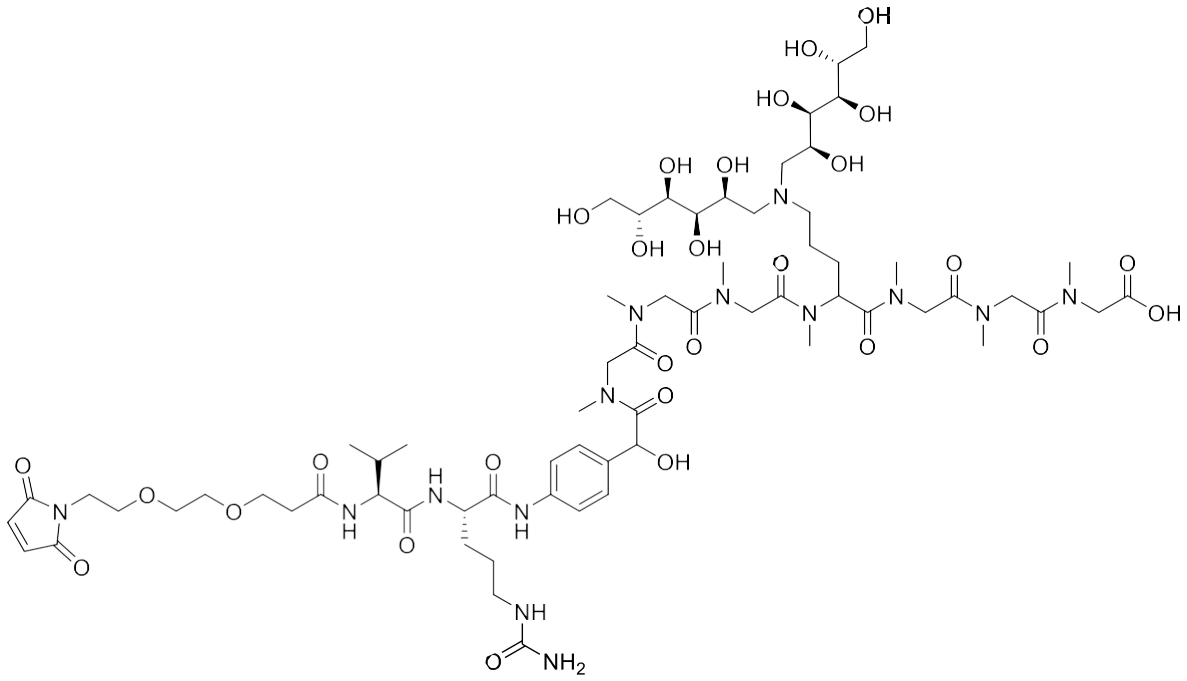
,



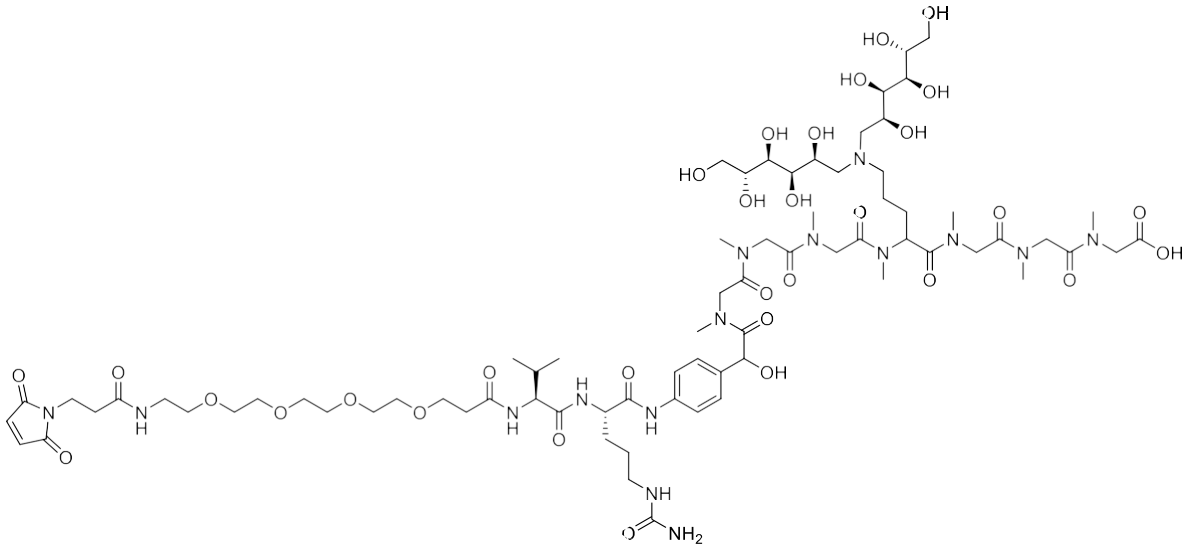
,



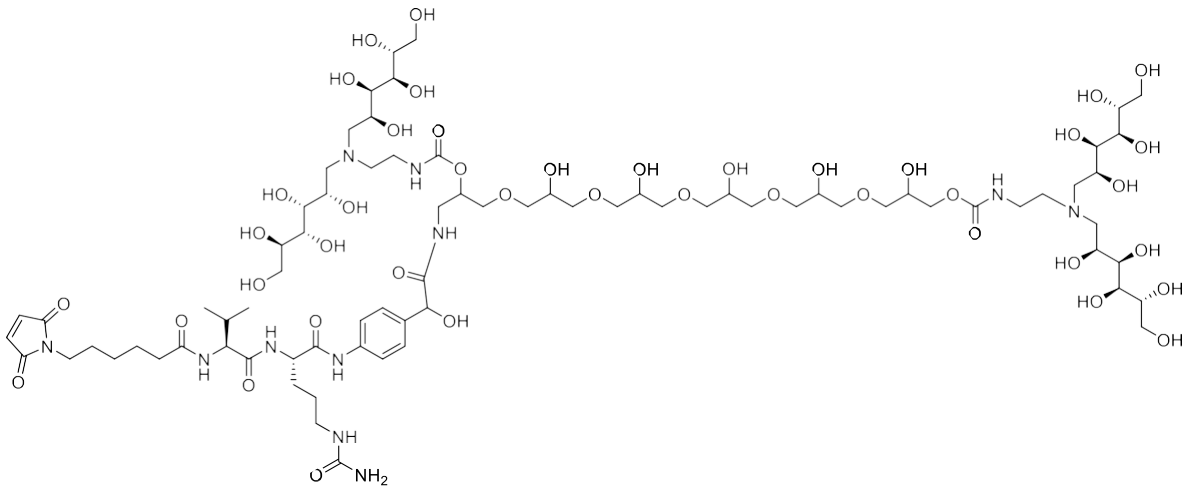
,



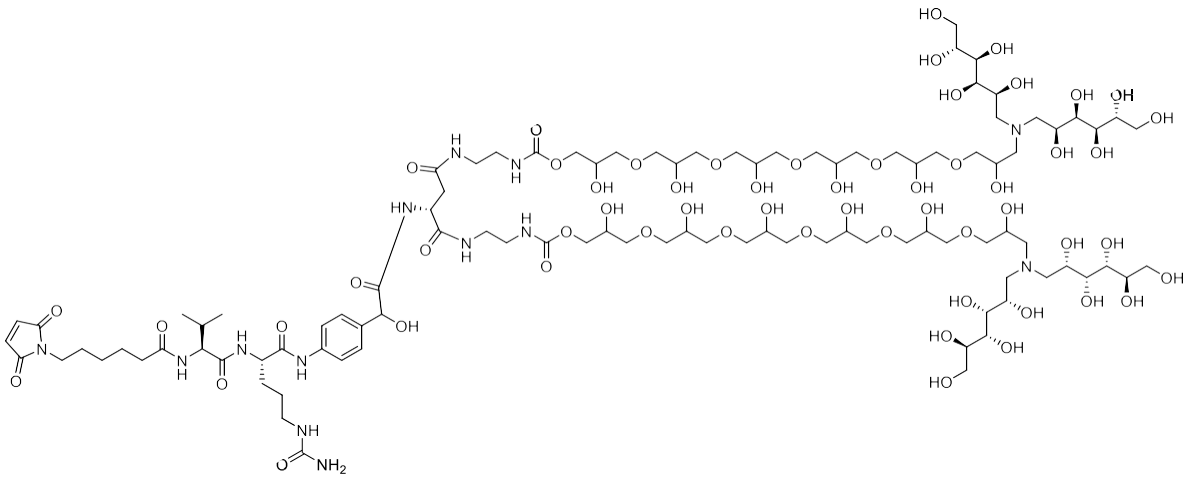
,



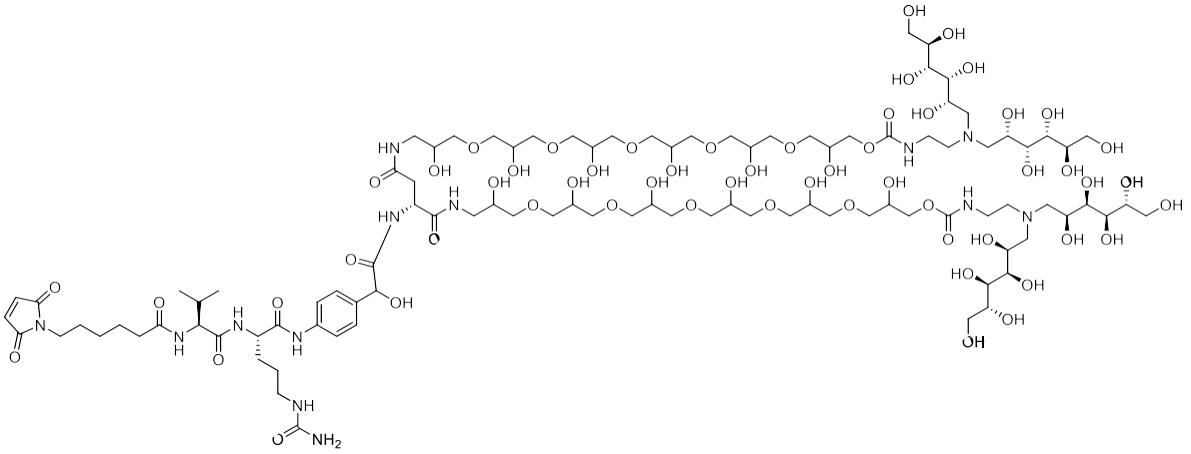
,



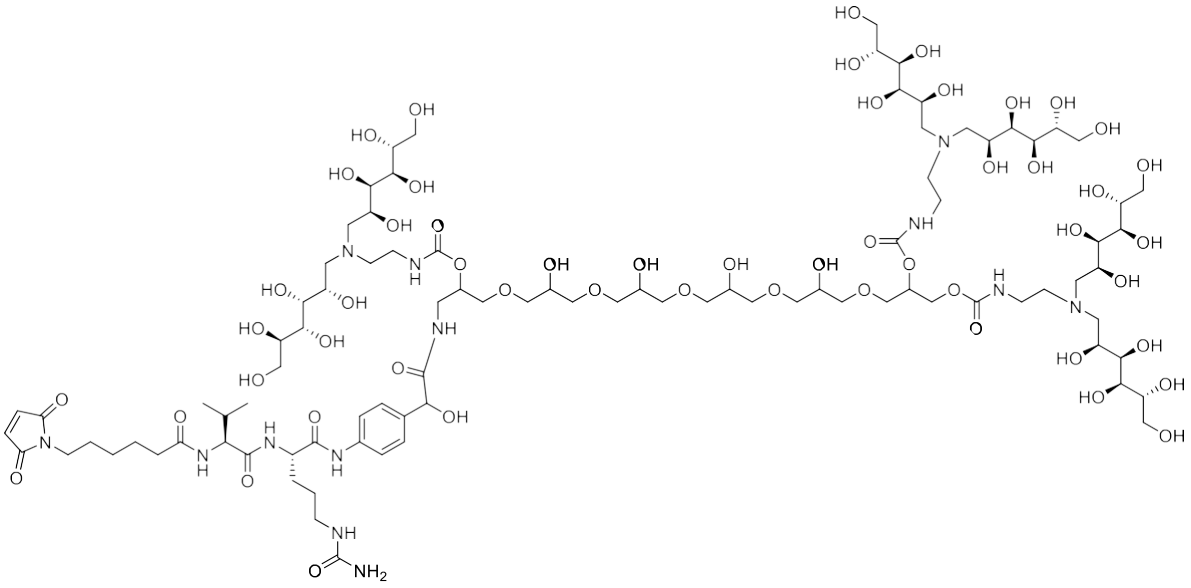
,



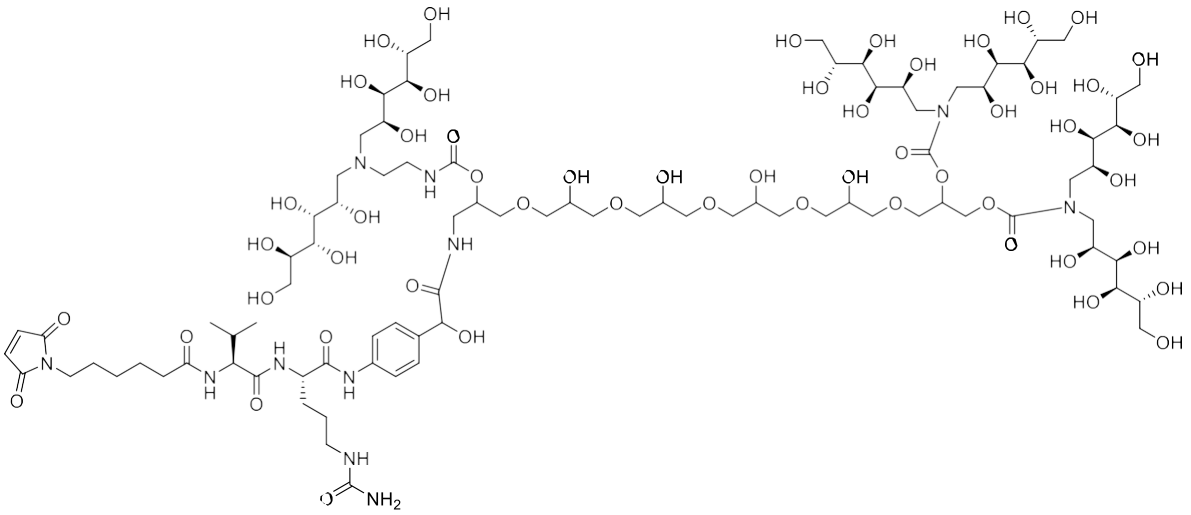
,



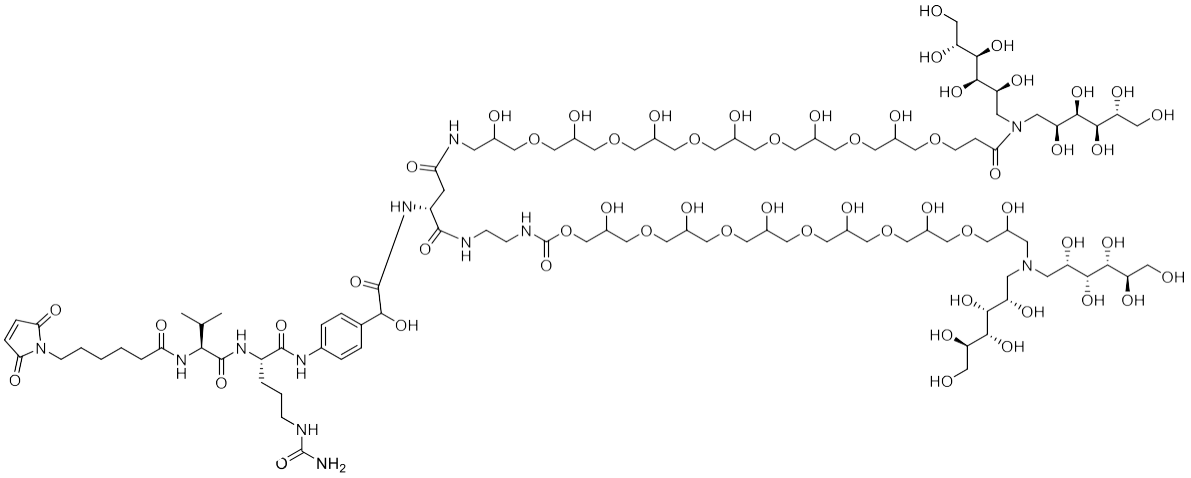
,



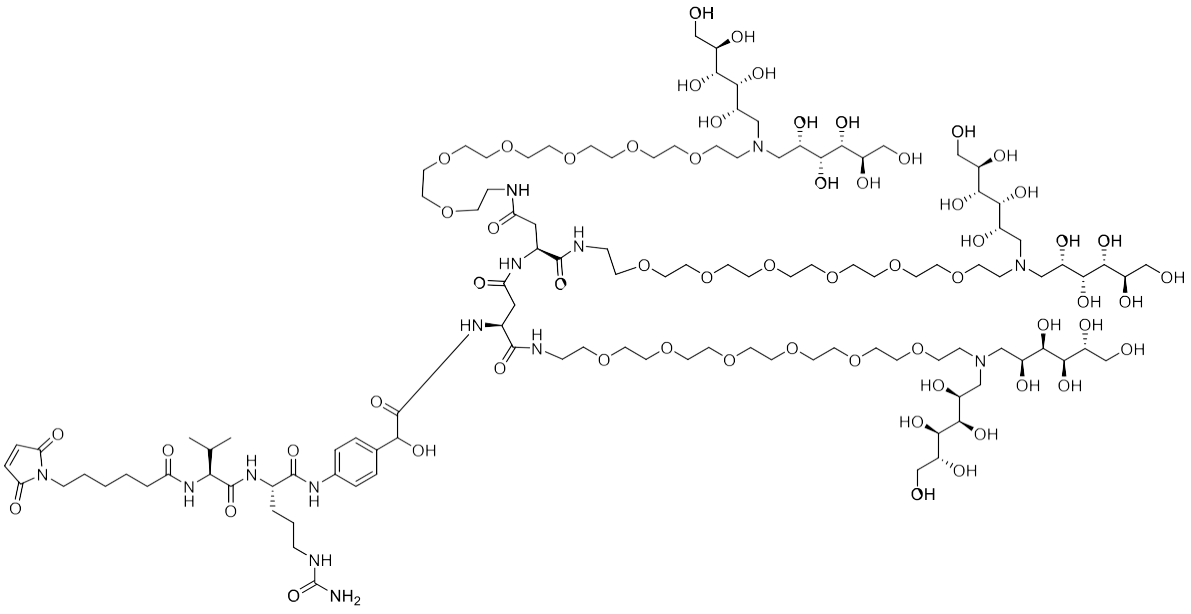
,



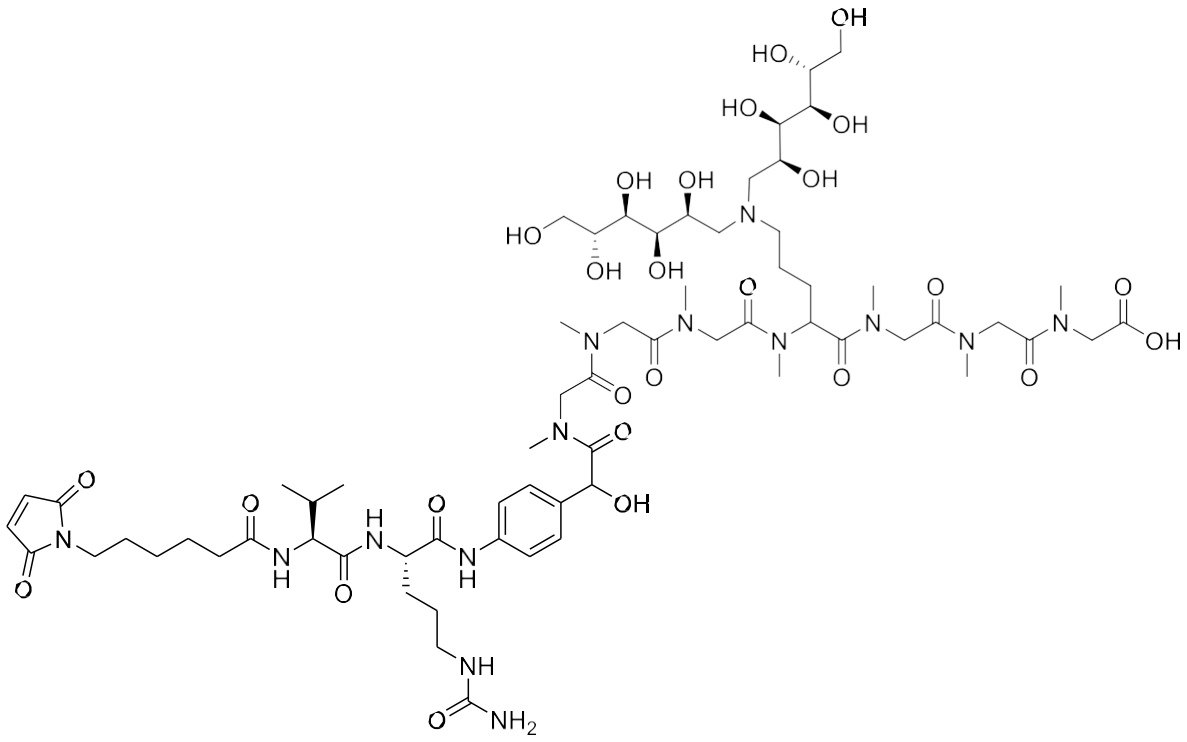
,



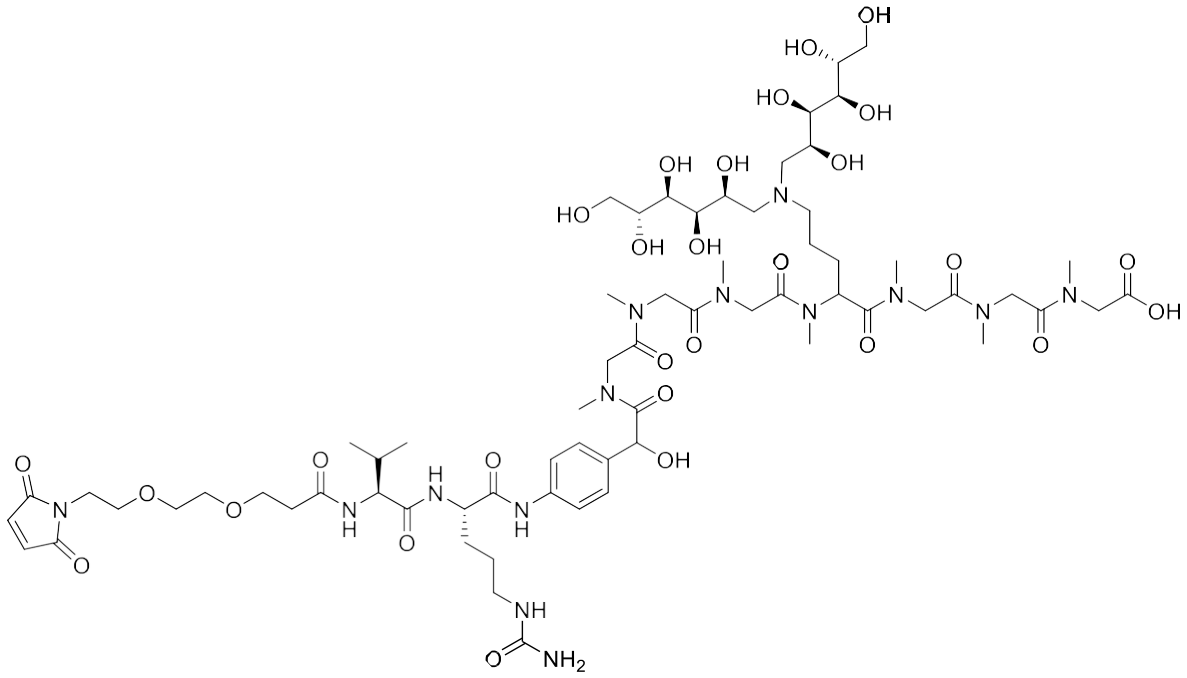
,



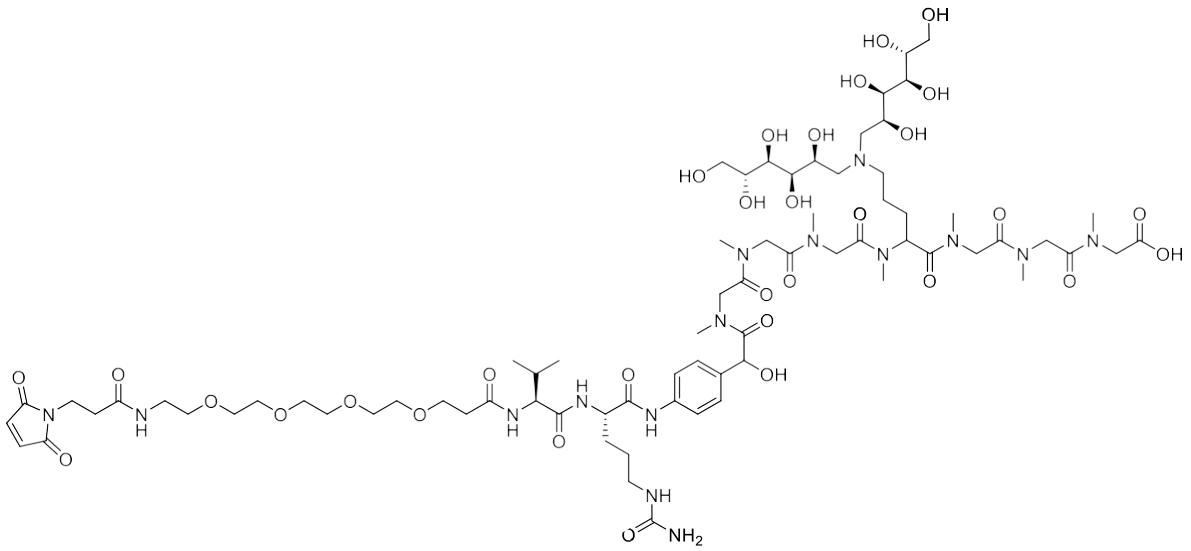
,



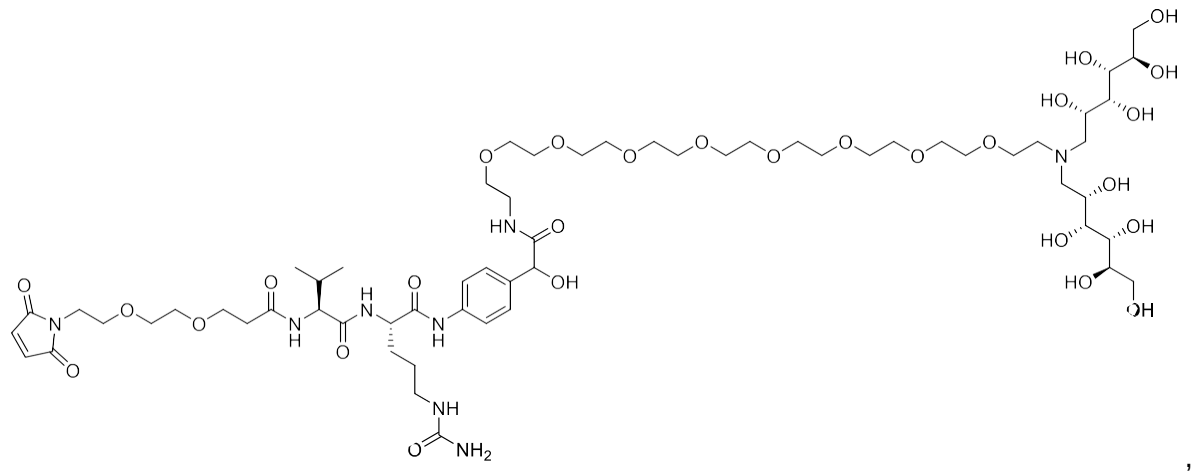
,



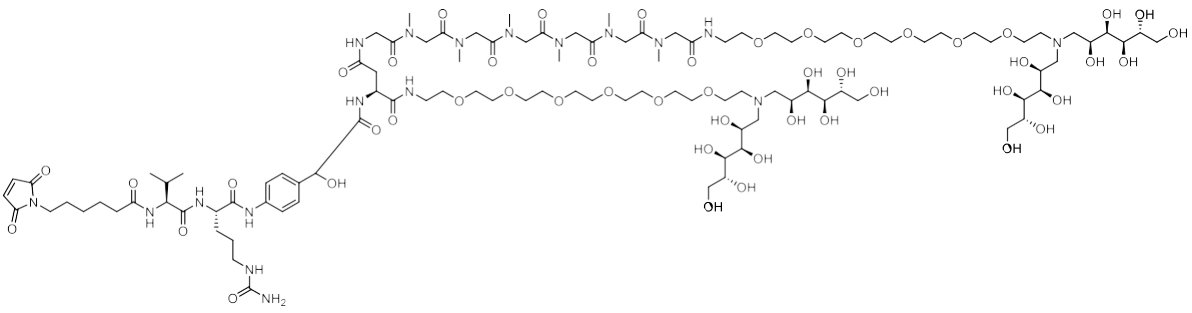
,



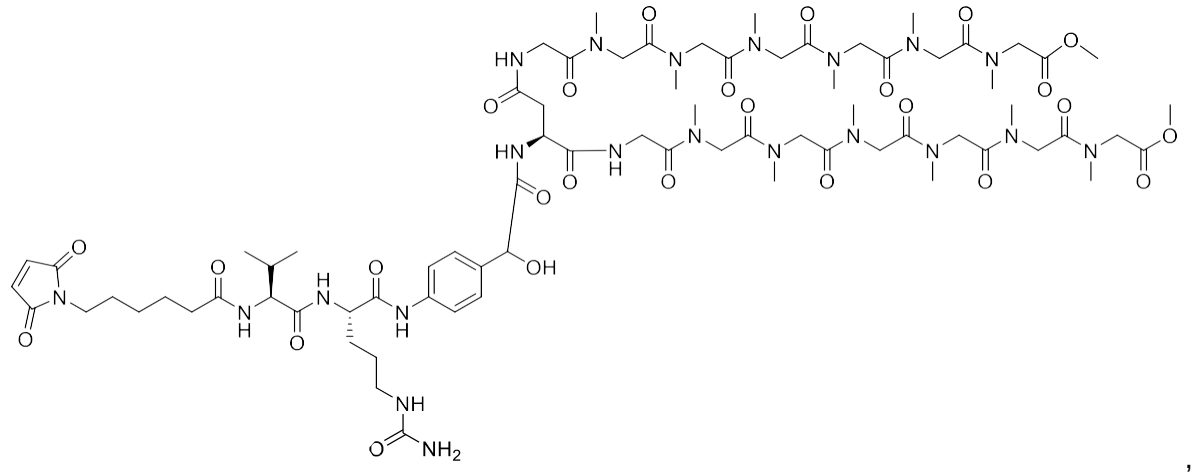
,



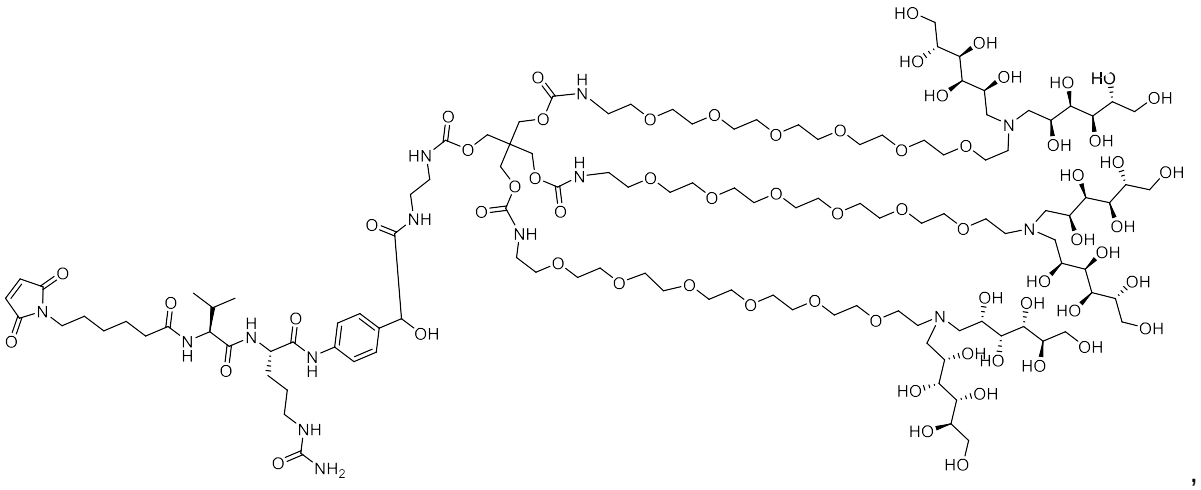
,



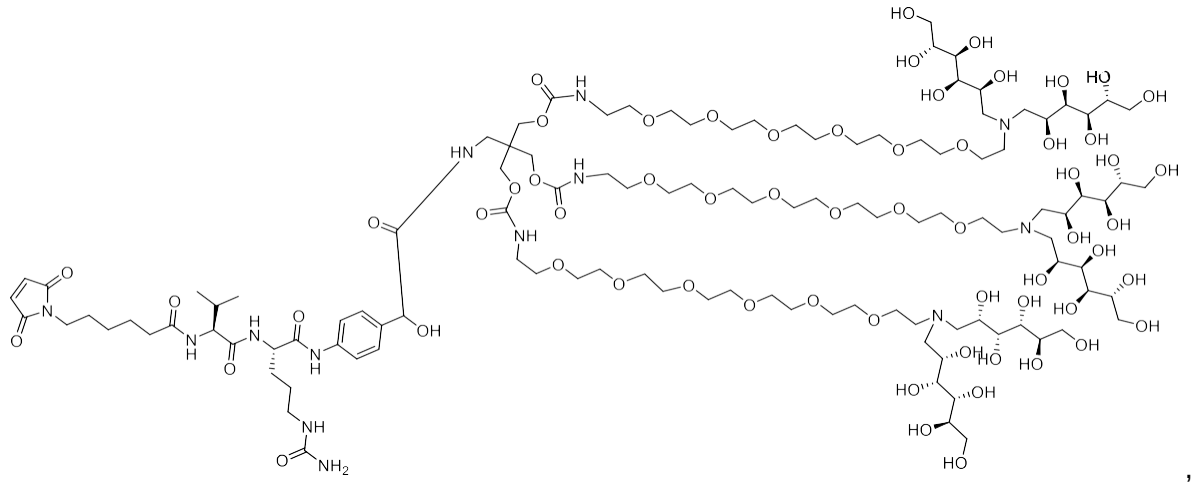
,



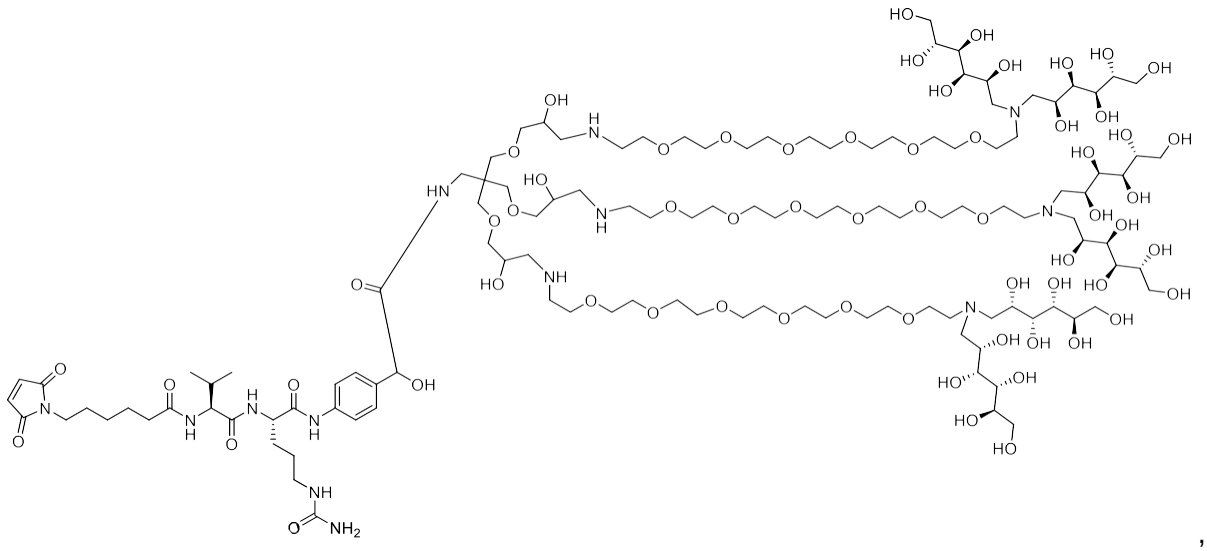
,



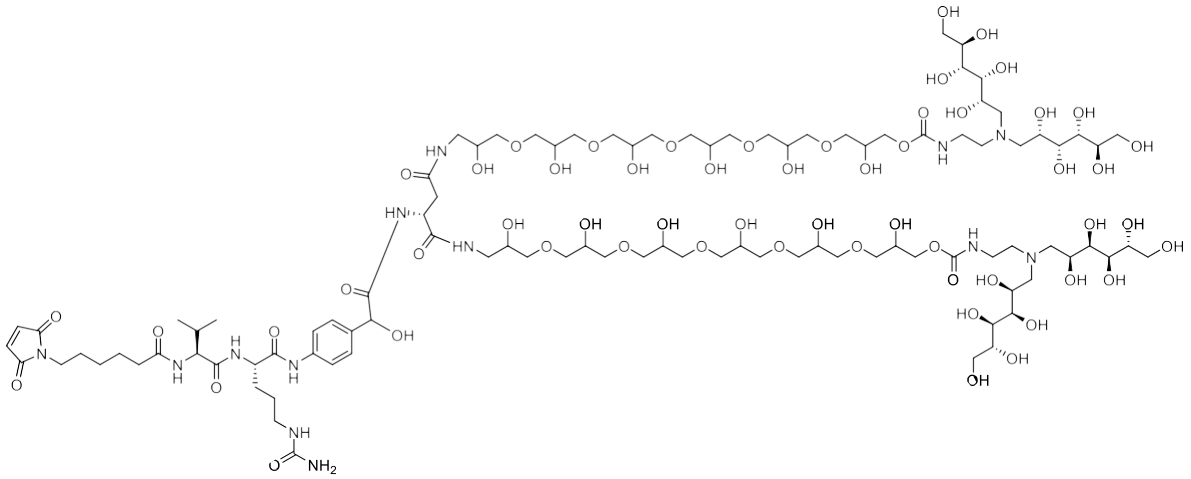
,



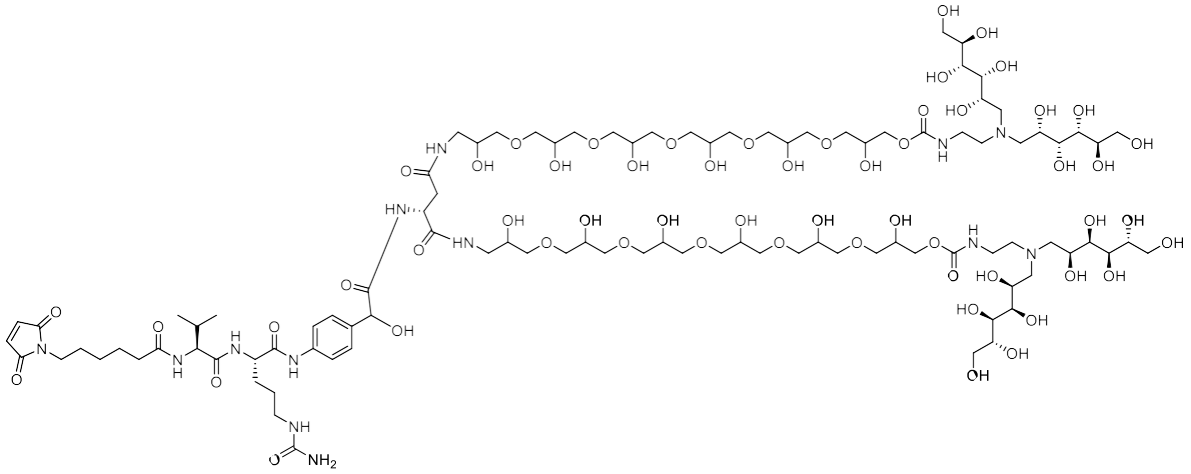
,



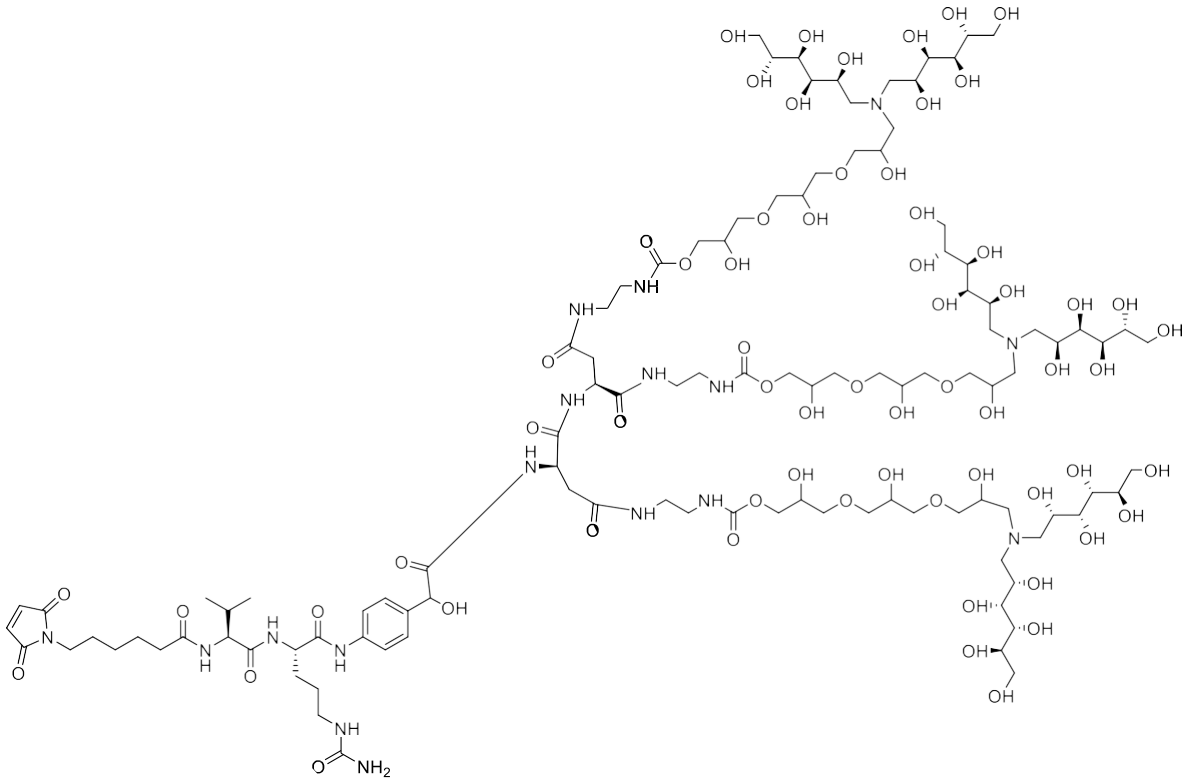
,



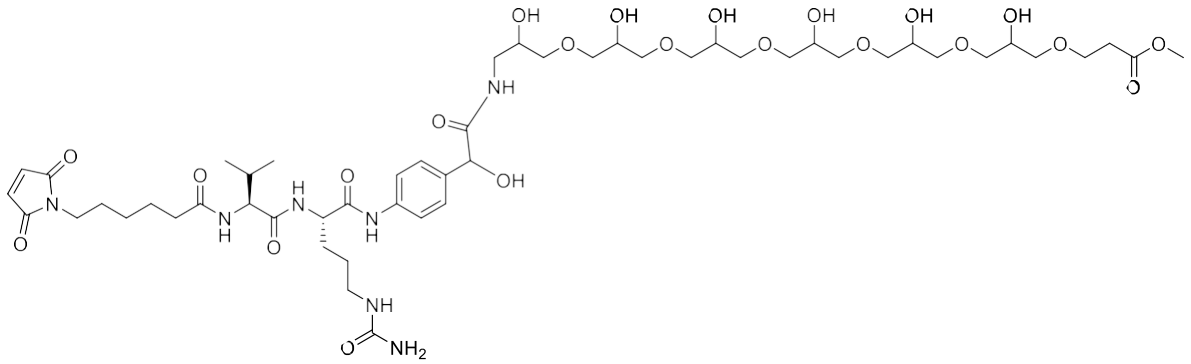
,



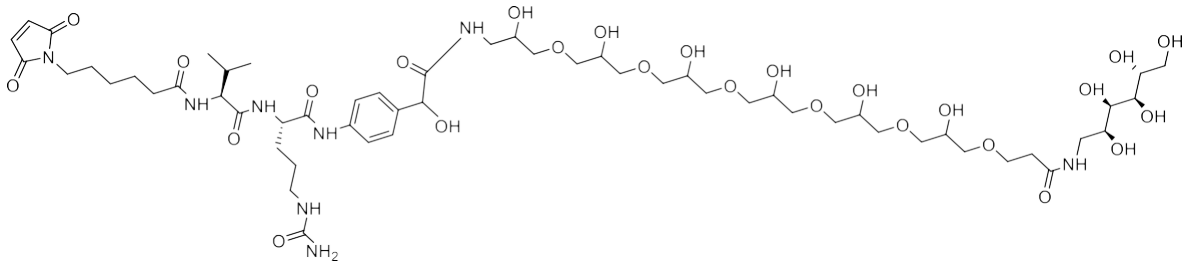
,



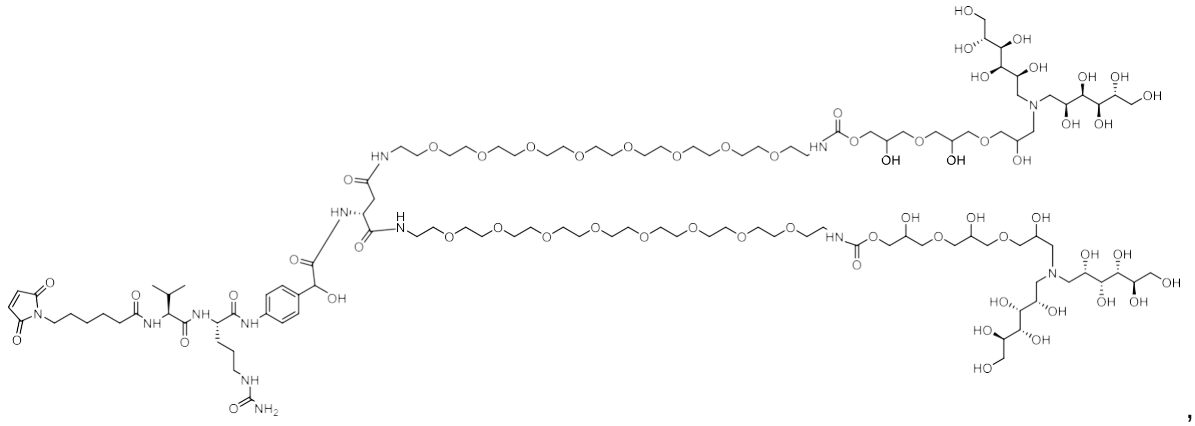
,



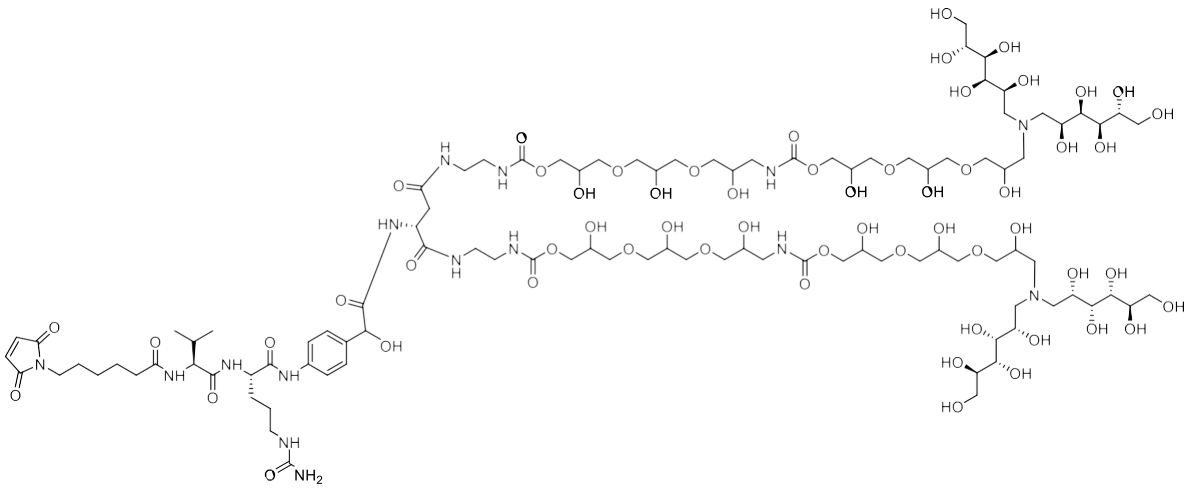
,



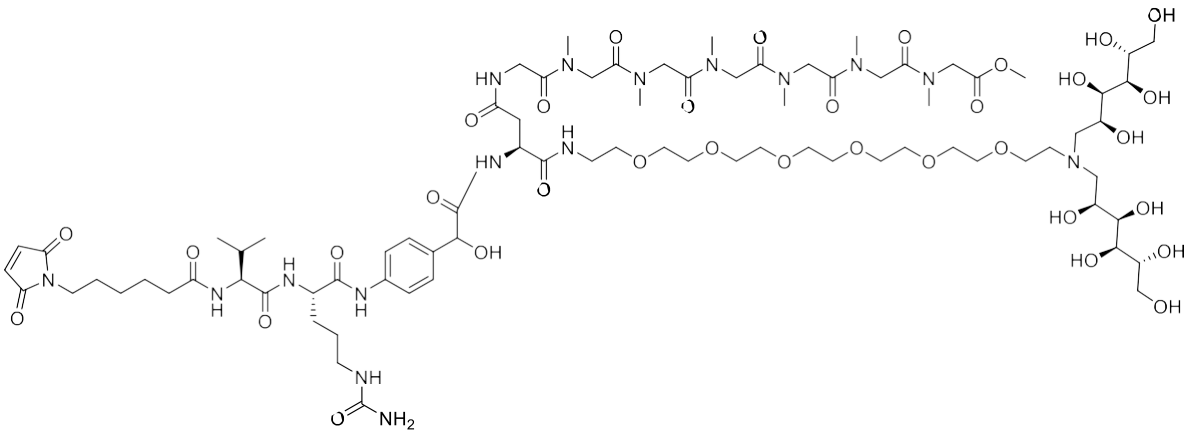
,



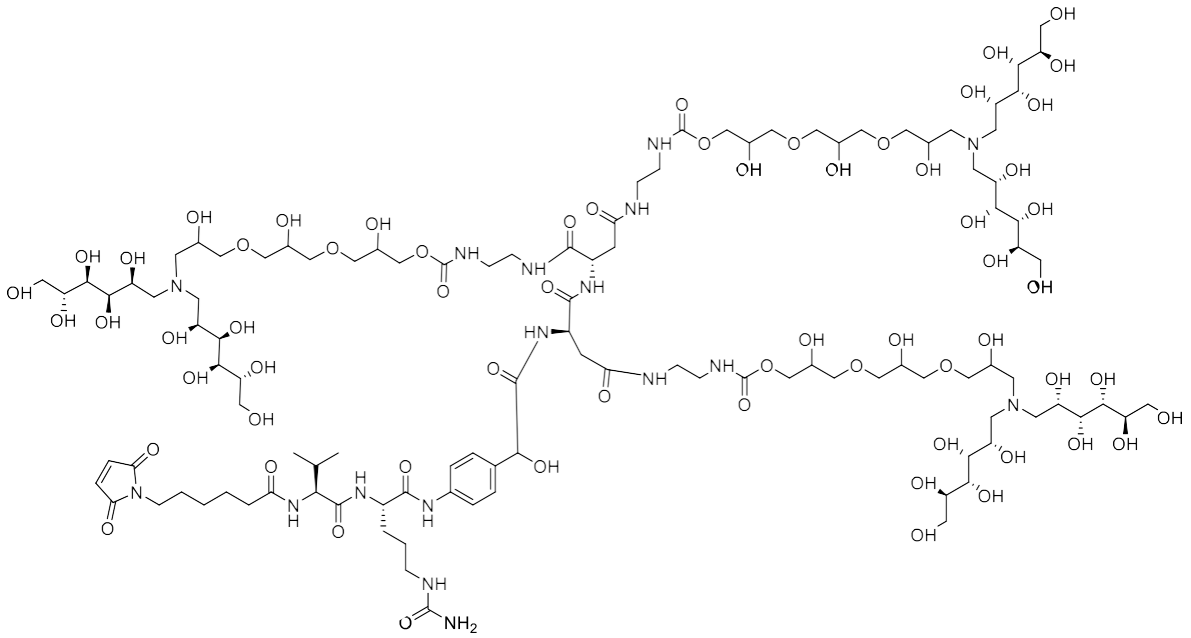
,



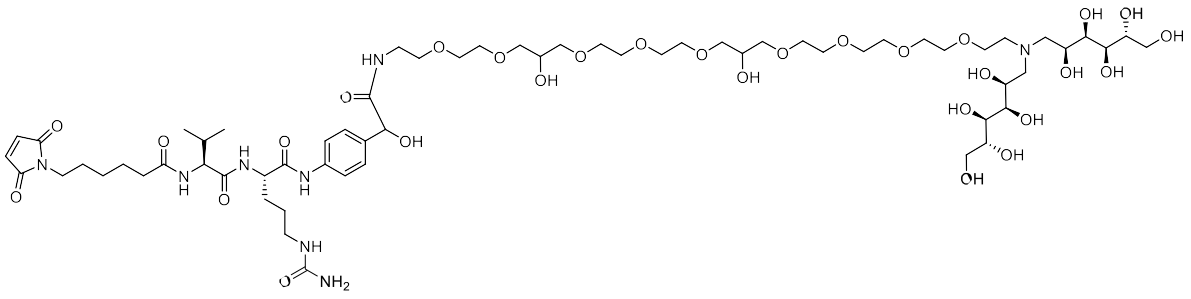
,



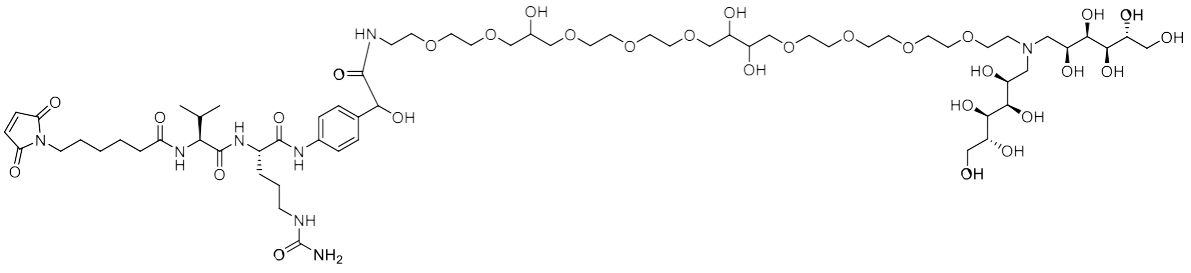
,



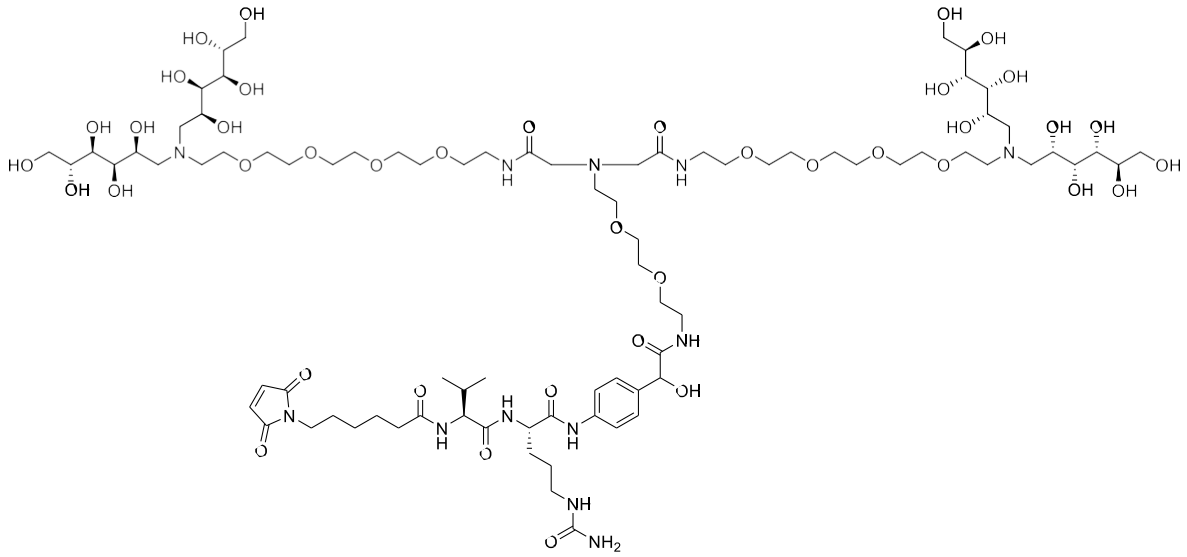
,



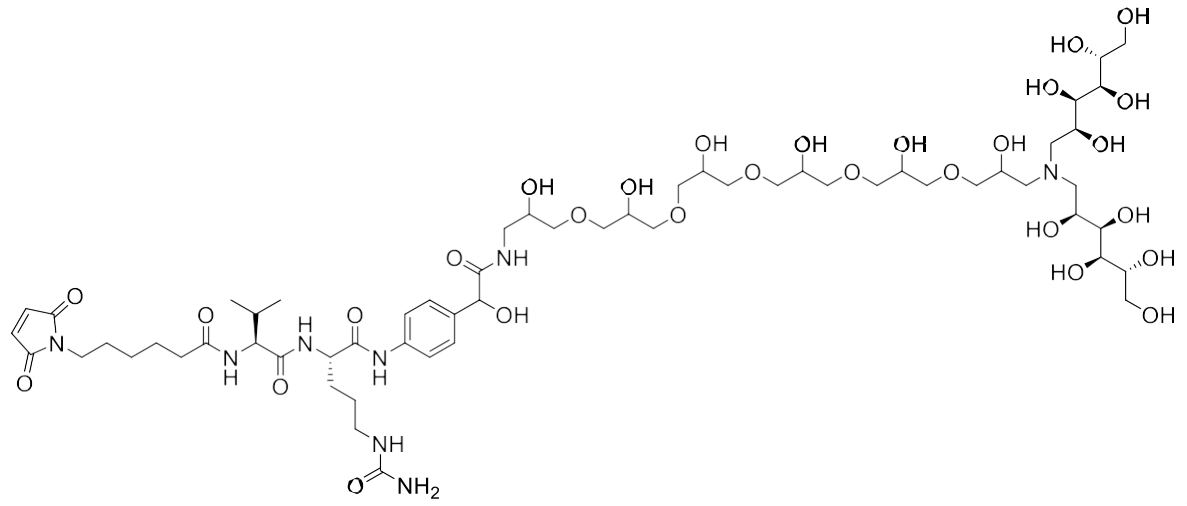
,



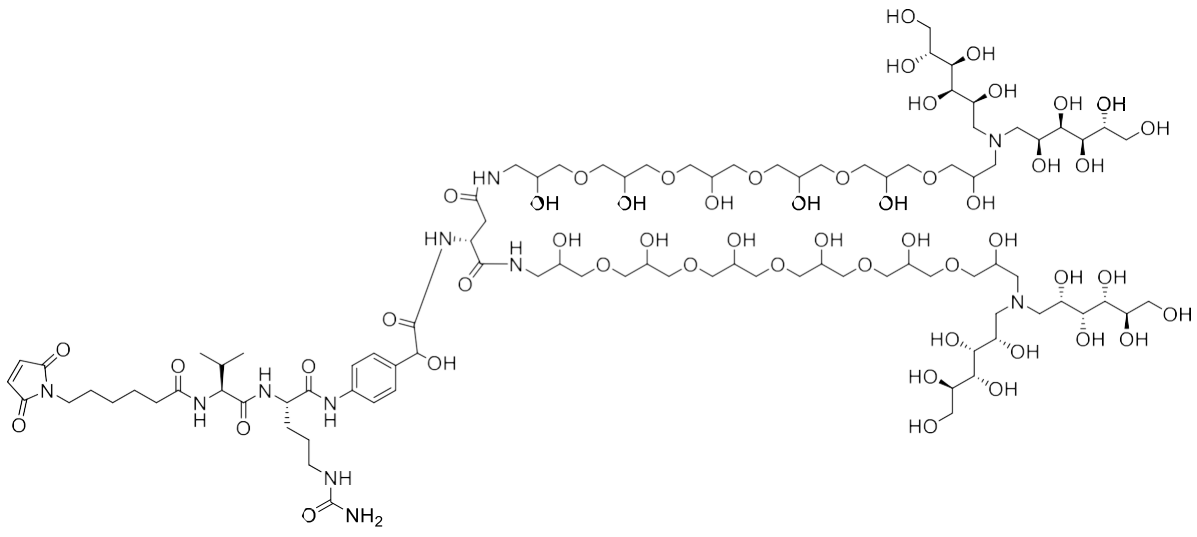
,



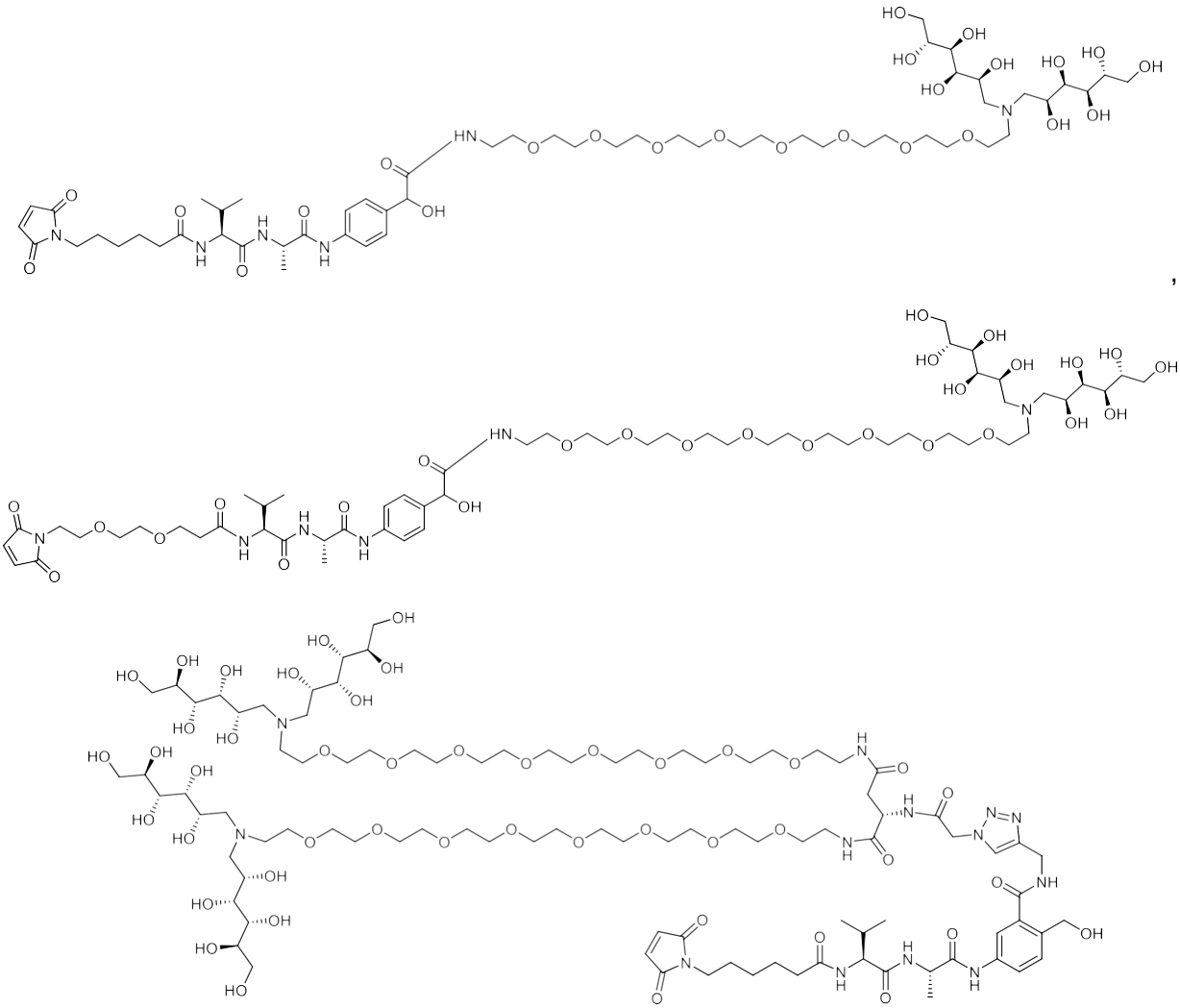
,



,



,



donde el H en el OH bencílico opcionalmente se reemplaza por un enlace a la por lo menos una unidad de fármaco o al grupo conector unido a la por lo menos una unidad de fármaco.

78. Un compuesto de fármaco-conector, que comprende un compuesto conector de cualquiera de las reivindicaciones 1-77 unido a por lo menos una unidad de fármaco, o unido al grupo conector unido a dicha por lo menos una unidad de fármaco, en el sitio de unión.

79. El fármaco-conector de la reivindicación 78, en donde la unidad de fármaco se selecciona entre un agente citotóxico, un agente inmunomodulador, un ácido nucleico, un agente inhibidor del crecimiento, una PROTAC, una toxina, un isótopo radioactivo y un ligando quelante.

80. El fármaco-conector de la reivindicación 79, en donde la unidad de fármaco es un agente citotóxico.

81. El fármaco-conector de la reivindicación 80, en donde el agente citotóxico se selecciona del grupo que consiste en una auristatina, un maitansinoide, una camprotecina, una

duocarmicina y una calqueamicina.

82. El fármaco-conector de la reivindicación 81, en donde el agente citotóxico es una auristatina.

83. El fármaco-conector de la reivindicación 82, en donde el agente citotóxico es MMAE o MMAF.

84. El fármaco-conector de la reivindicación 81, en donde el agente citotóxico es una camprotecina.

85. El fármaco-conector de la reivindicación 84, en donde el agente citotóxico es exatecano o SN-38 o DxD.

86. El fármaco-conector de la reivindicación 85, en donde el agente citotóxico es RS-exatecano o SS-exatecano.

87. El fármaco-conector de la reivindicación 81, en donde el agente citotóxico es una camprotecina.

88. El fármaco-conector de la reivindicación 81, en donde el agente citotóxico es un maitansinoide.

89. El fármaco-conector de la reivindicación 88, en donde dicho maitansinoide es maitansina, maitansinol o ansamatocina-2.

90. El fármaco-conector de la reivindicación 79, en donde la unidad de fármaco es un agente inmunomodulador.

91. El fármaco-conector de la reivindicación 90, en donde el agente inmunomodulador se selecciona entre un agonista de TRL7, un agonista de TLR8, un agonista de STING o un agonista de RIG-I.

92. El fármaco-conector de la reivindicación 91, en donde el agente inmunomodulador es un agonista de TLR7.

93. El fármaco-conector de la reivindicación 92, en donde el agonista de TLR7 es una imidazoquinolina, una amina imidazoquinolina, una tiazoquinolina, una aminoquinolina, una

aminoquinazolina, una pirido [3,2-d]pirimidin-2,4-diamina, pirimidin-2,4-diamina, 2-aminoimidazol, 1-alquill-1H-benzimidazol-2-amina, tetrahidropiridopirimidina, heteroarotiadiazida-2,2-dióxido, una benzonaftiridina, un análogo de guanosina, un análogo de adenosina, un homopolímero de timidina, ARNhs, CpG-A, PoliG10 o PoliG3.

94. El fármaco-conector de la reivindicación 91, en donde el agente inmunomodulador es un agonista de TLR8.

95. El fármaco-conector de la reivindicación 94, en donde el agonista de TLR8 se selecciona entre una imidazoquinolina, una tiazoloquinolina, una aminoquinolina, una aminoquinazolina, una pirido [3,2-d]pirimidin-2,4-diamina, pirimidin-2,4-diamina, 2-aminoimidazol, 1-alquill-1H-benzimidazol-2-amina, tetrahidropiridopirimidina o un ARNhs.

96. El fármaco-conector de la reivindicación 91, en donde el agente inmunomodulador es un agonista de STING.

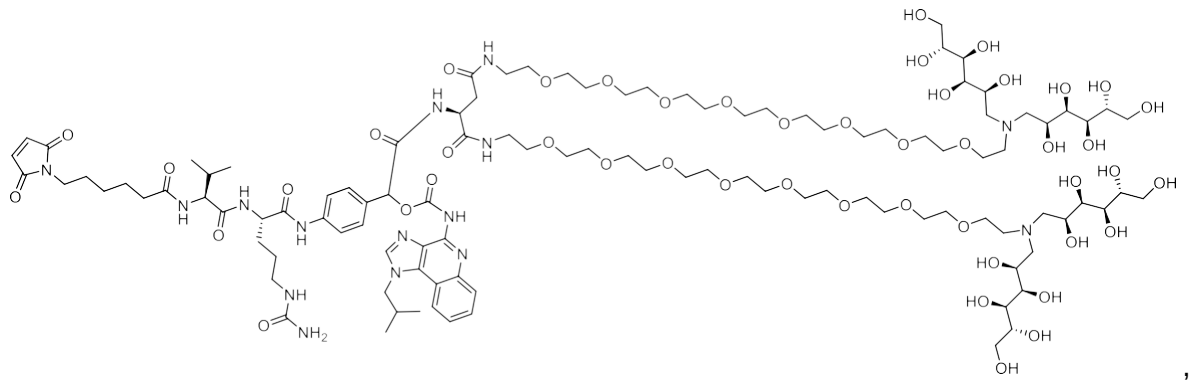
97. El fármaco-conector de la reivindicación 91, en donde el agente inmunomodulador es un agonista de RIG-I.

98. El fármaco-conector de la reivindicación 97, en donde el agonista de RIG-I se selecciona entre KIN1148, SB-9200, KIN700, KIN600, KIN500, KIN100, KIN101, KIN400 y KIN2000.

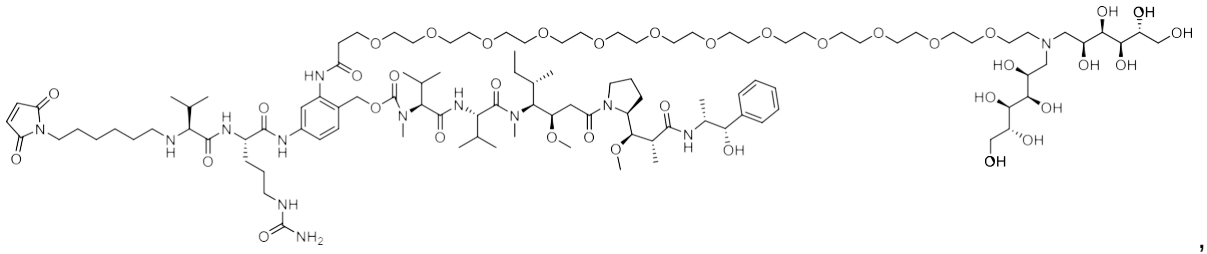
99. El fármaco-conector de la reivindicación 79, en donde la unidad de fármaco es un ligando quelante.

100. El fármaco-conector de la reivindicación 99, en donde el ligando quelante se selecciona entre platino (Pt), rutenio (Ru), rodio (Rh), oro (Au), plata (Ag), cobre (Cu), molibdeno (Mo), titanio (Ti), o iridio (Ir); un radioisótopo tal como itrio-88, itrio-90, tecnecio-99, cobre-67, renio-188, renio-186, galio-66, galio-67, indio-111, indio-114, indio-115, lutecio-177, estroncio-89, samario-153, y plomo-212.

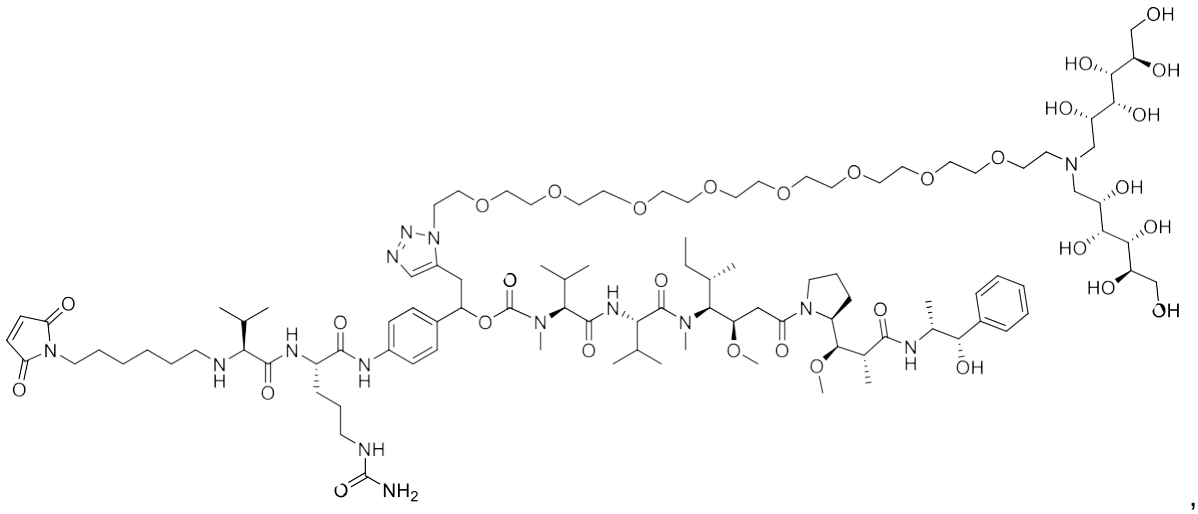
101. El fármaco-conector de la reivindicación 78, que tiene una de las siguientes estructuras:



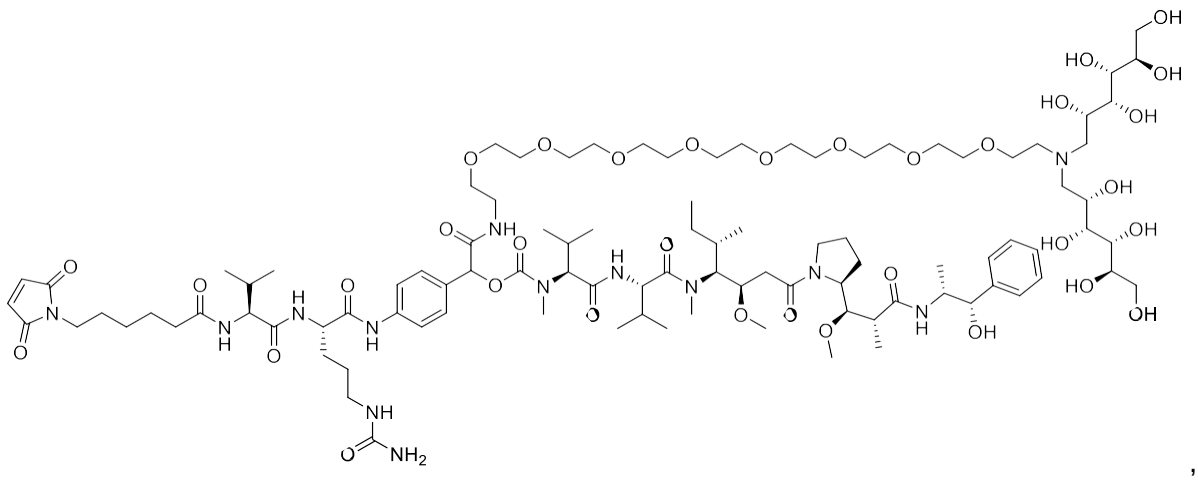
,



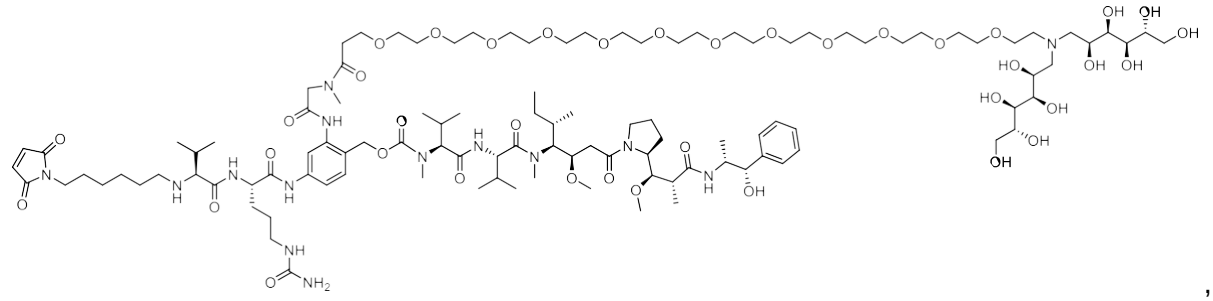
,



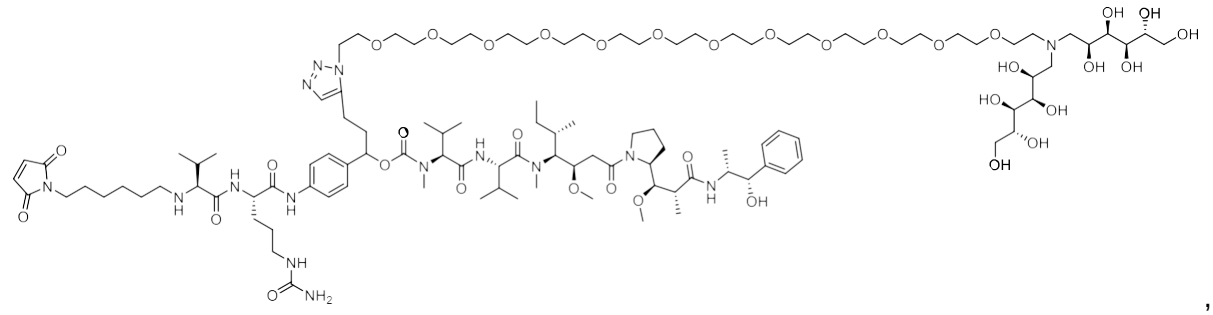
,



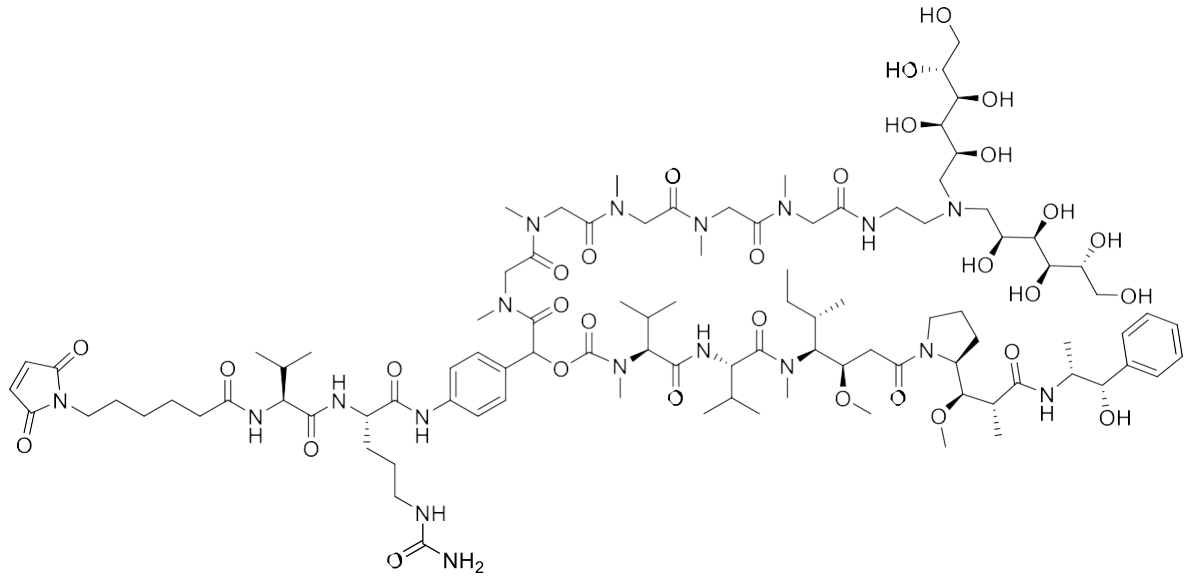
,



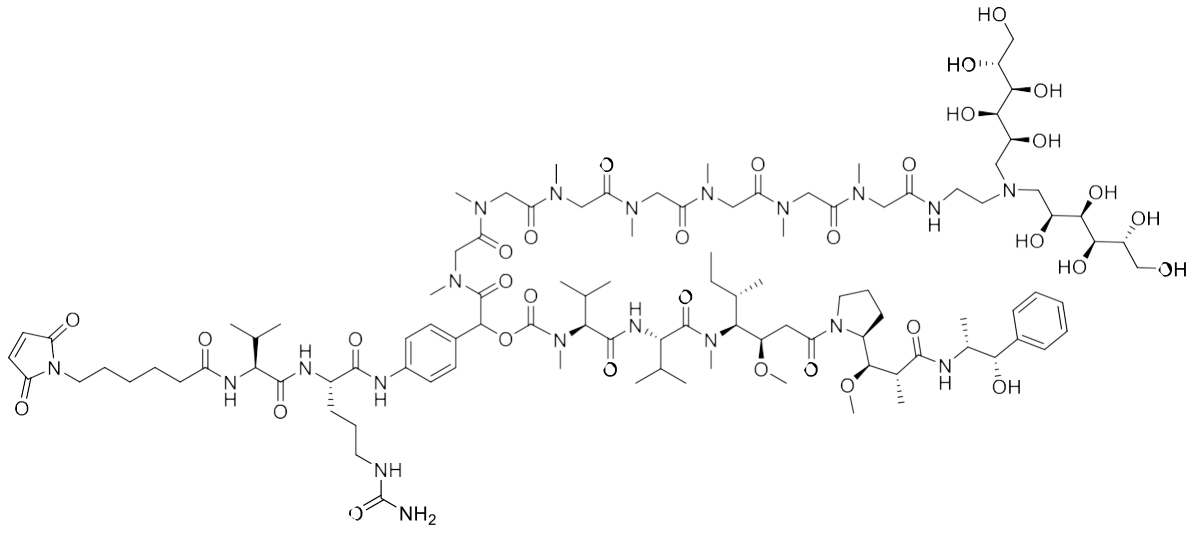
,



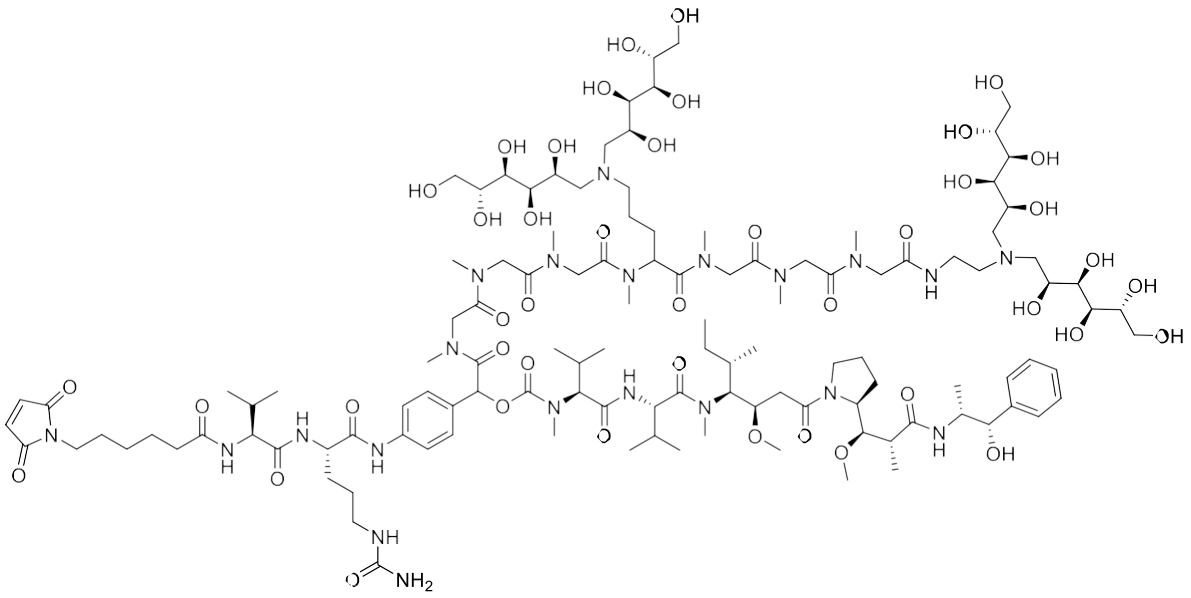
,



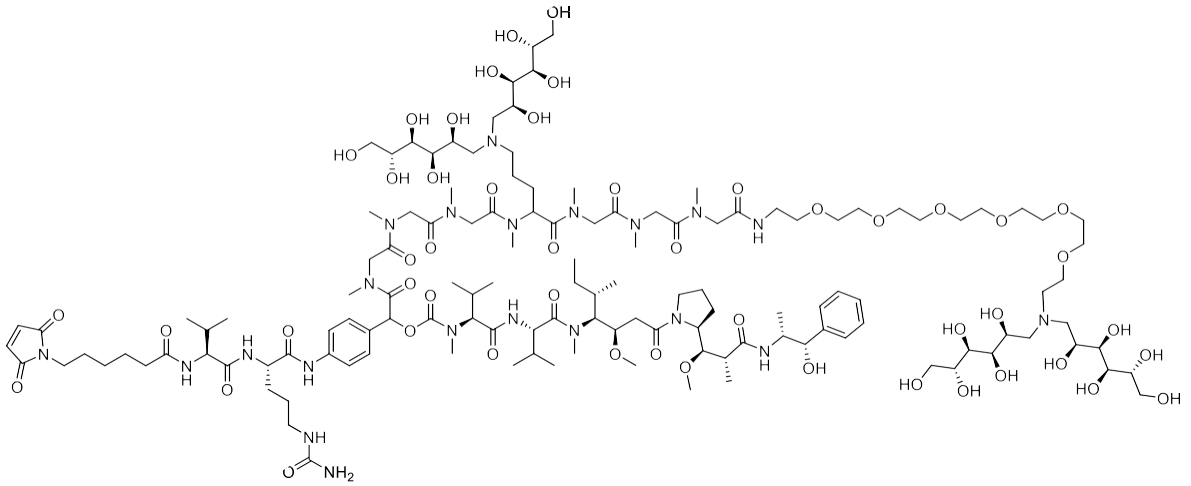
,



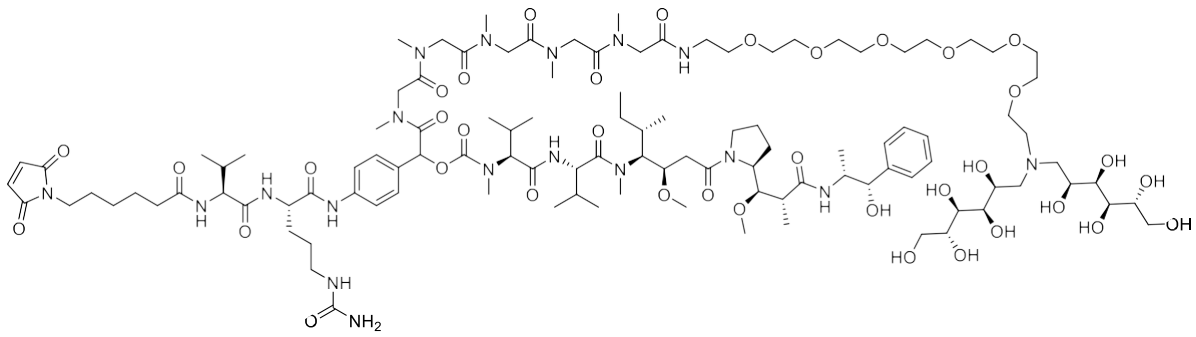
,



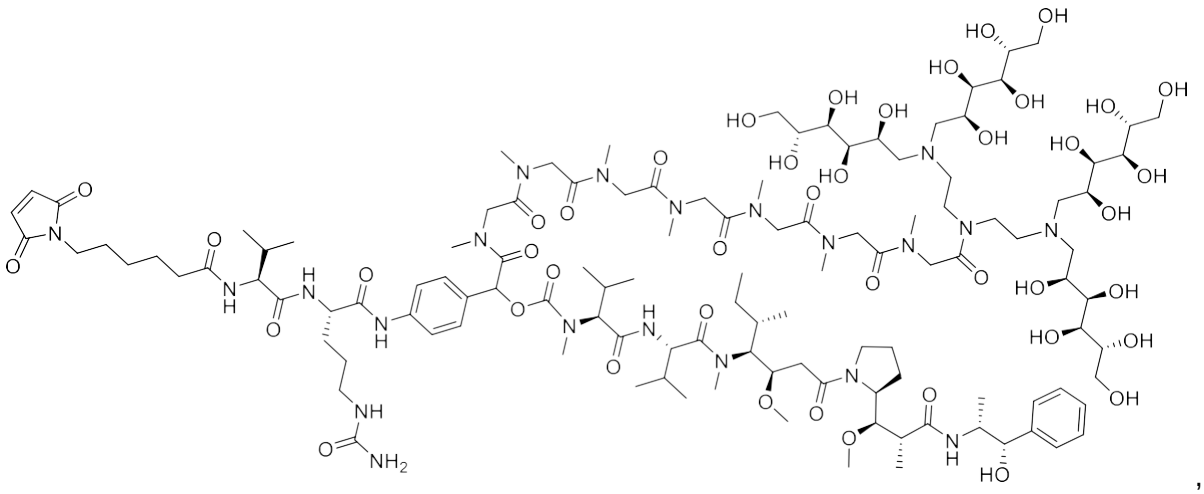
,



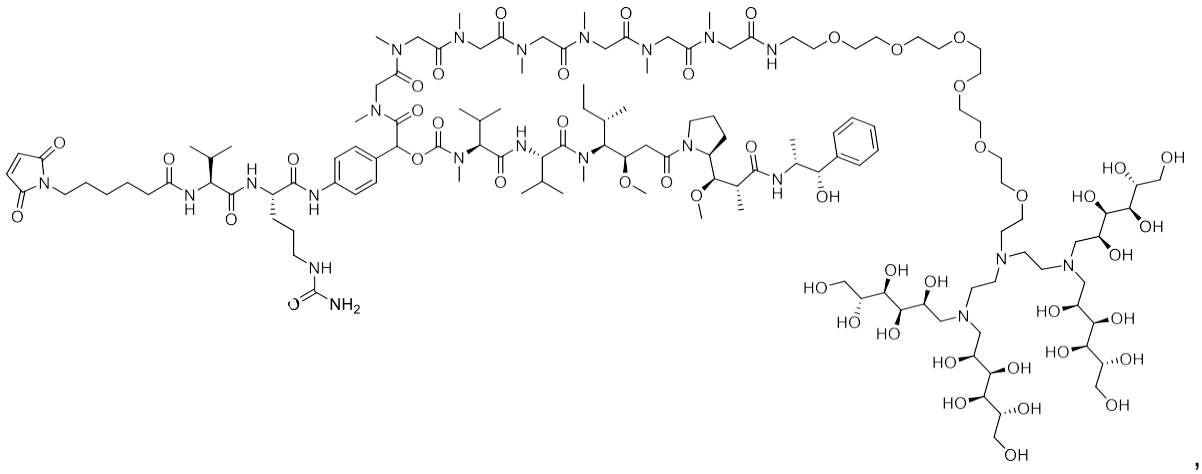
,



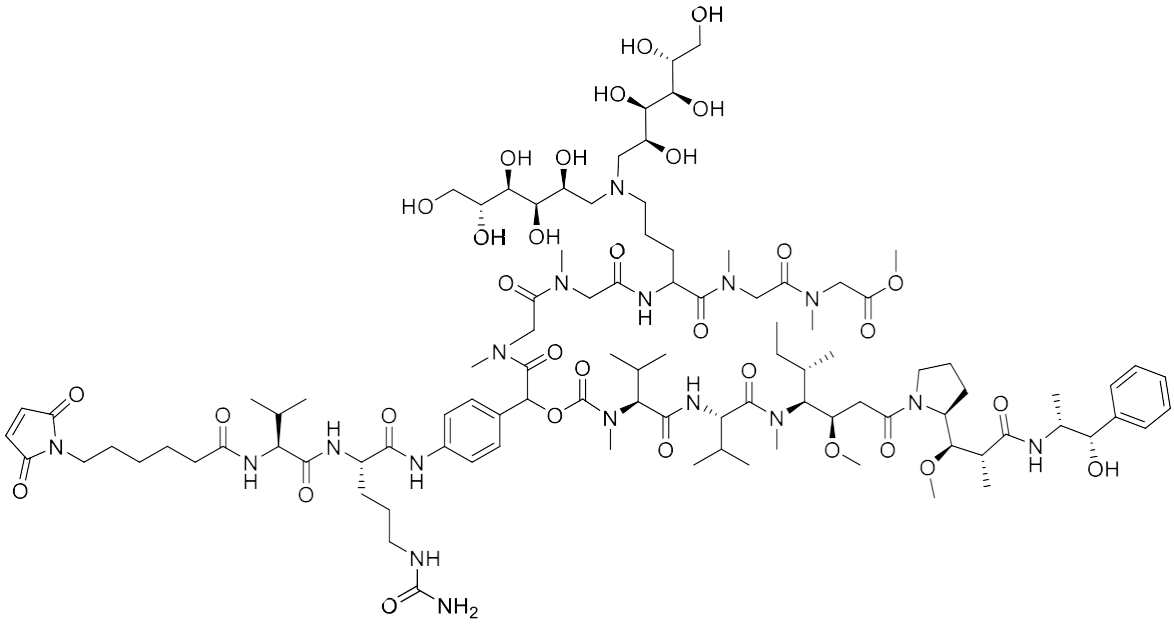
,



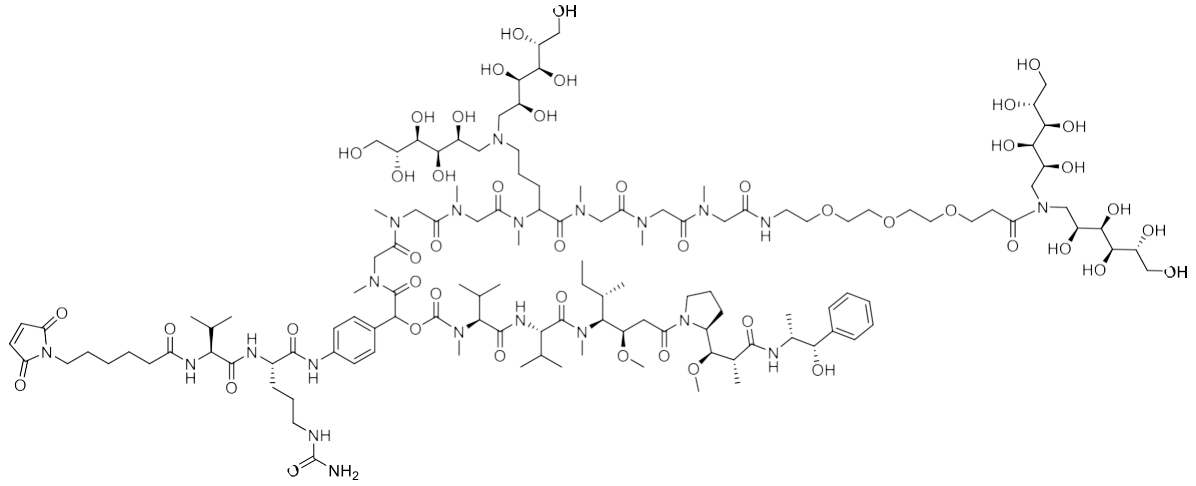
,



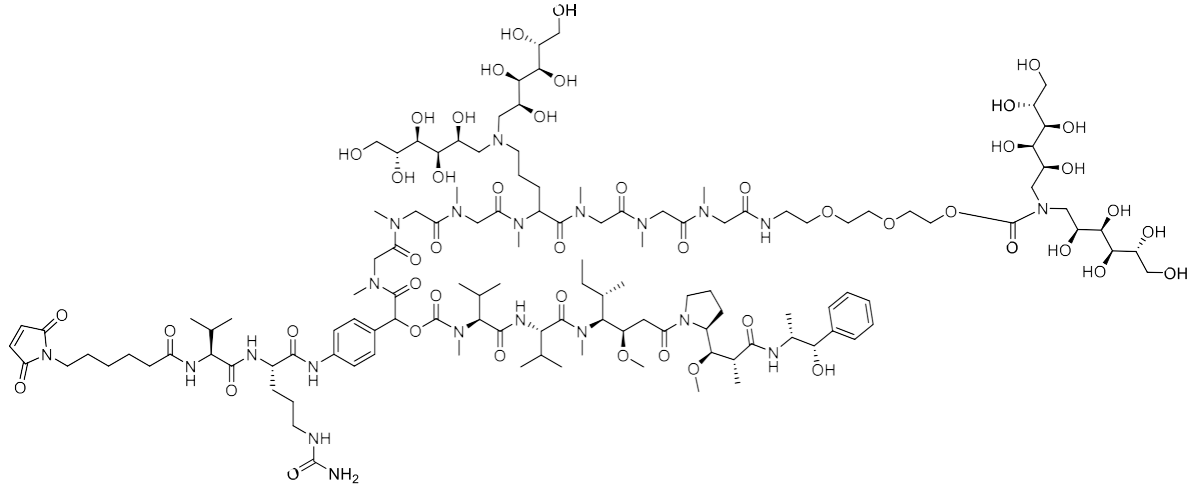
,



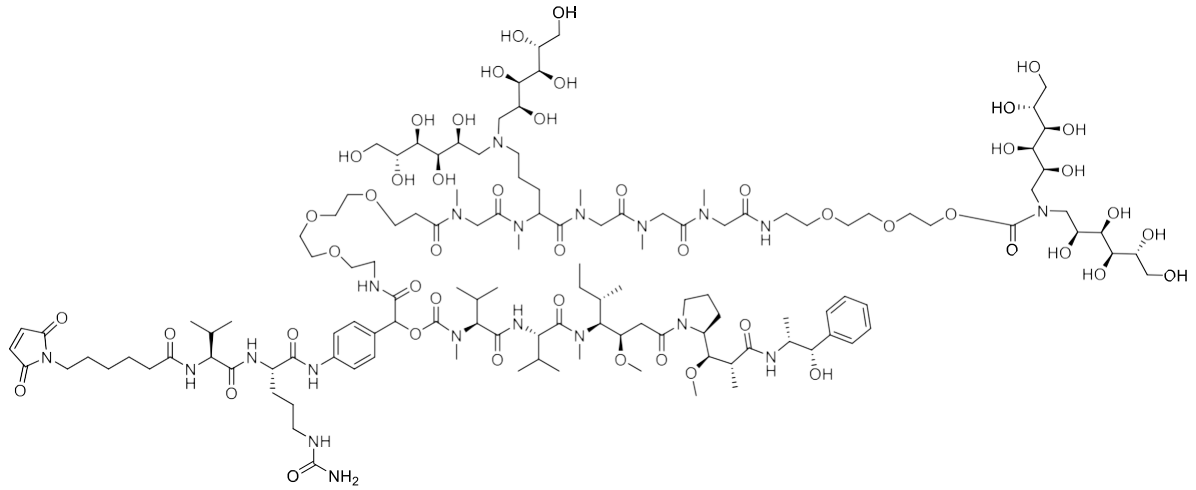
,



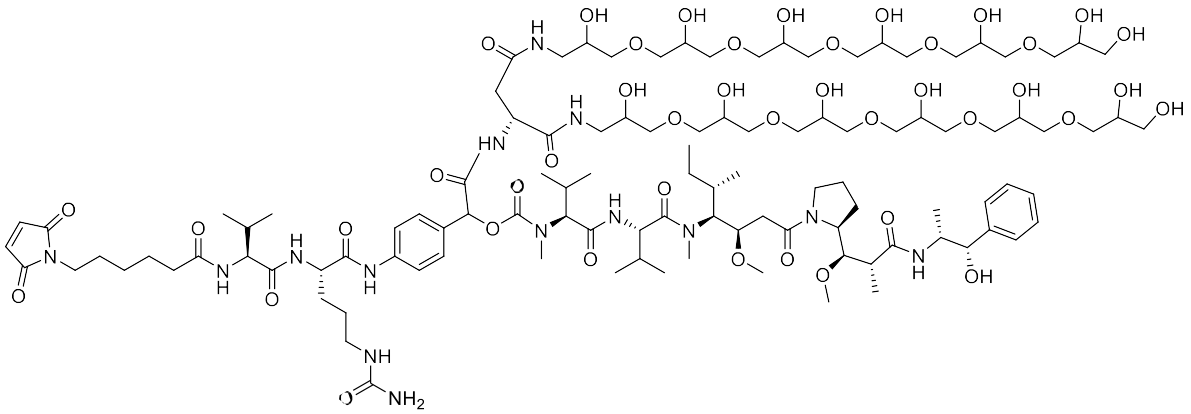
,



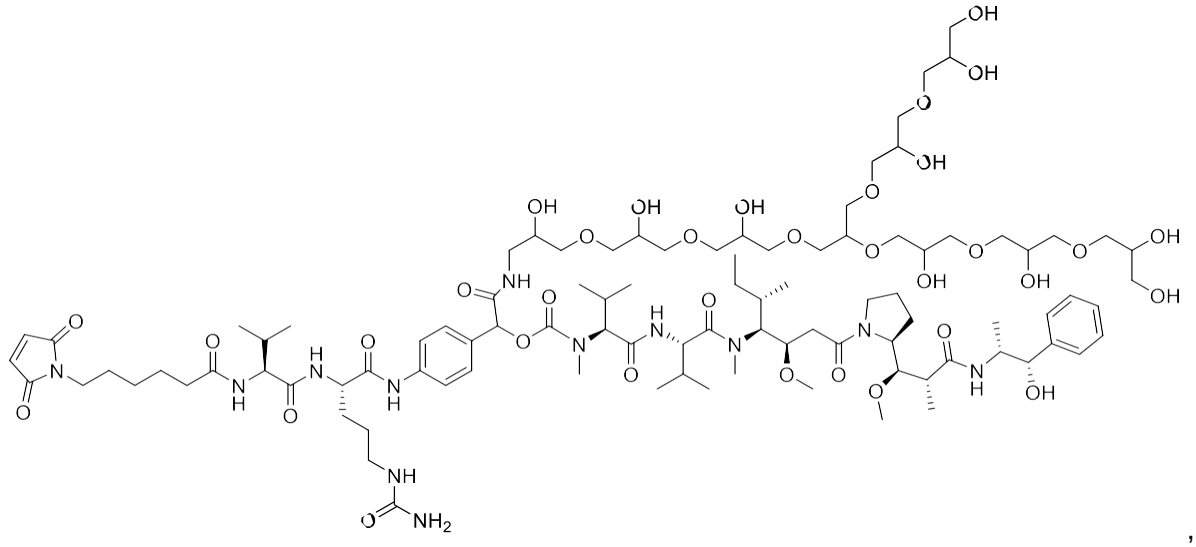
,



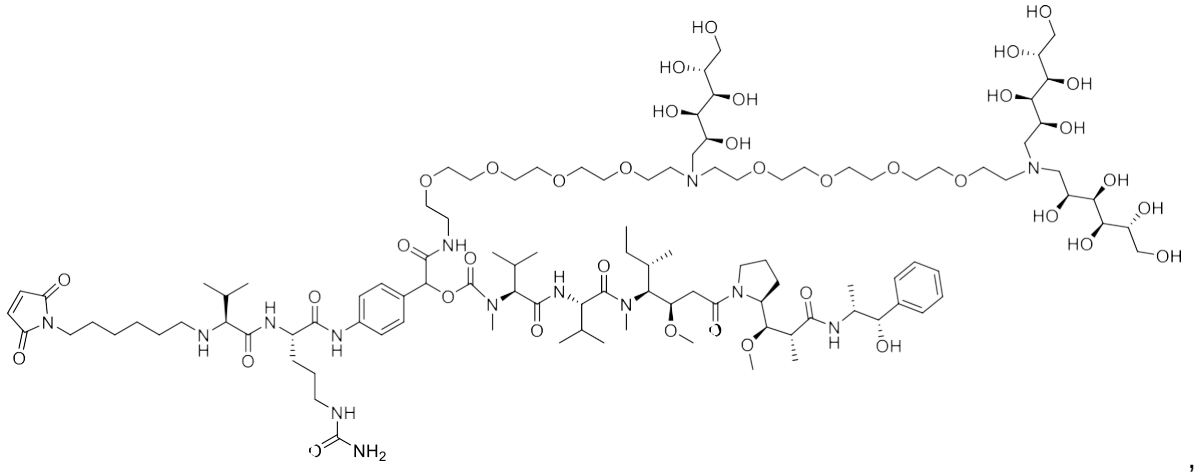
,



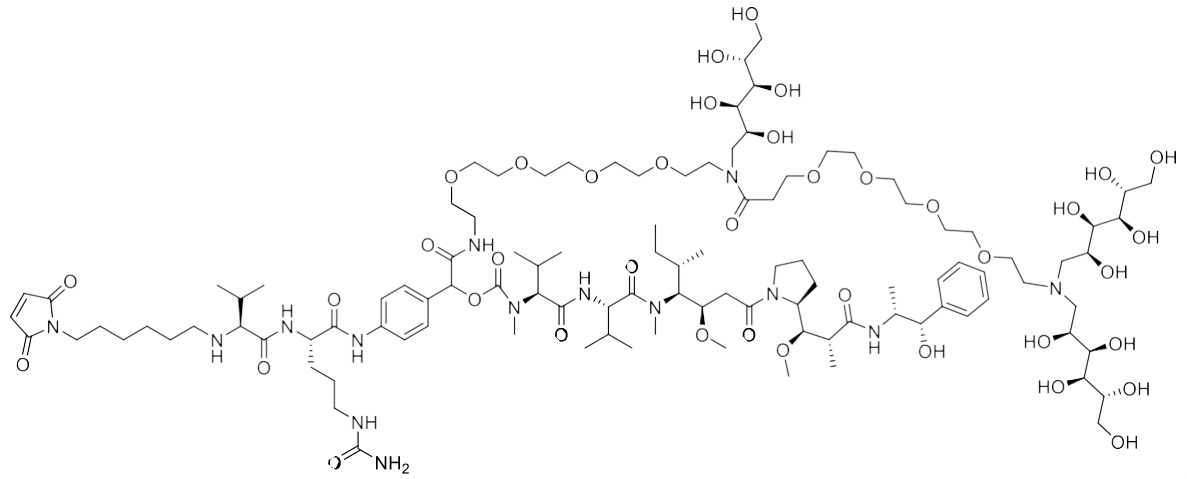
,



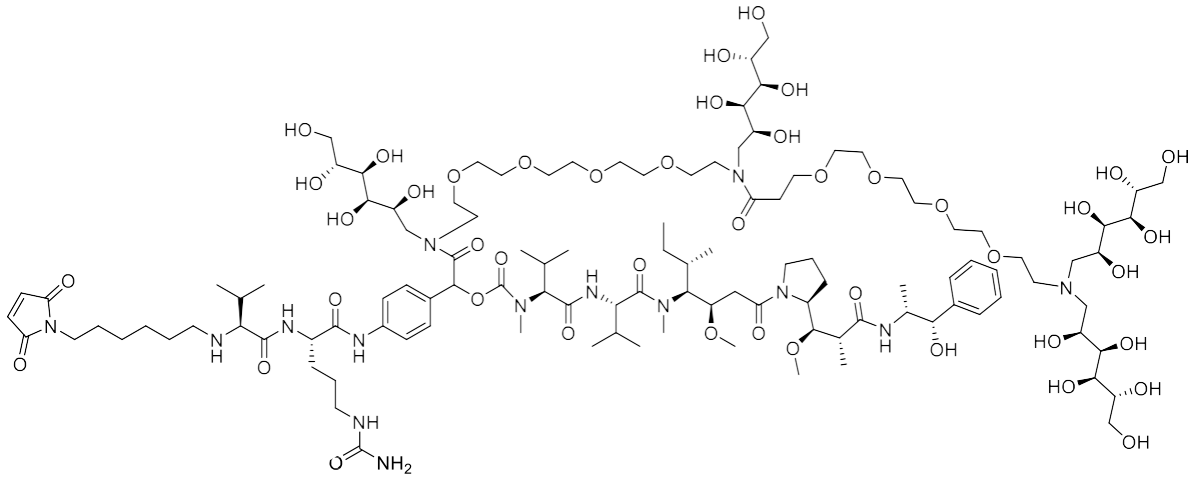
,



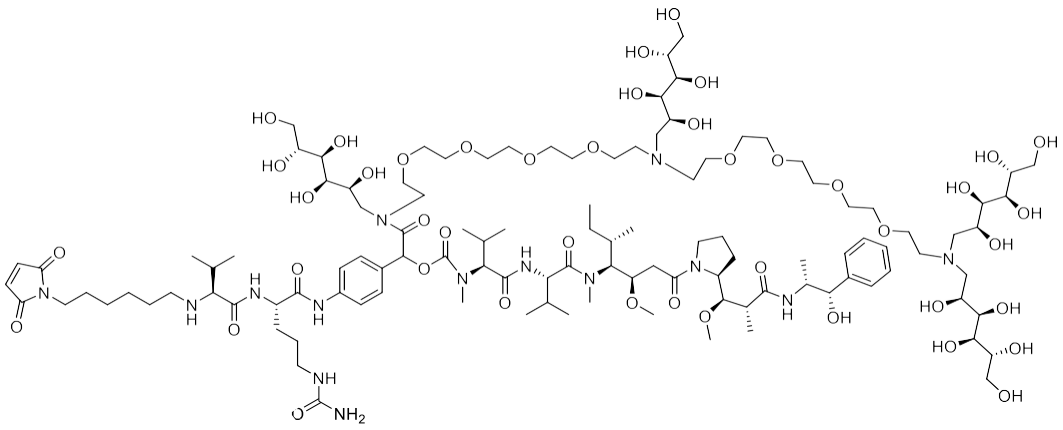
,



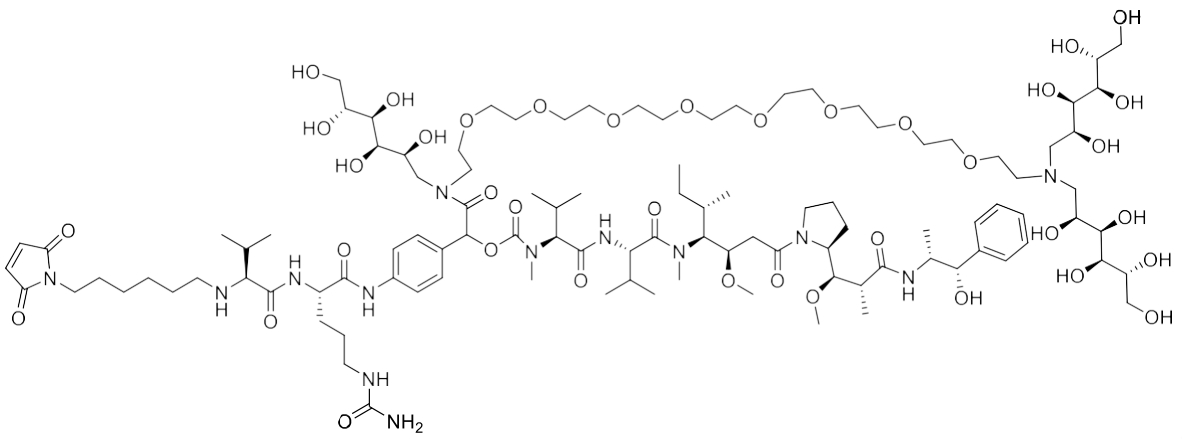
,



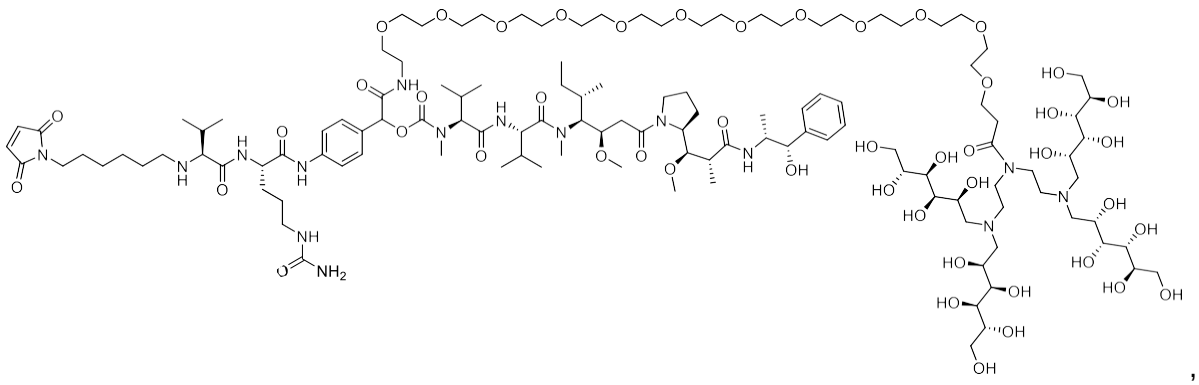
,



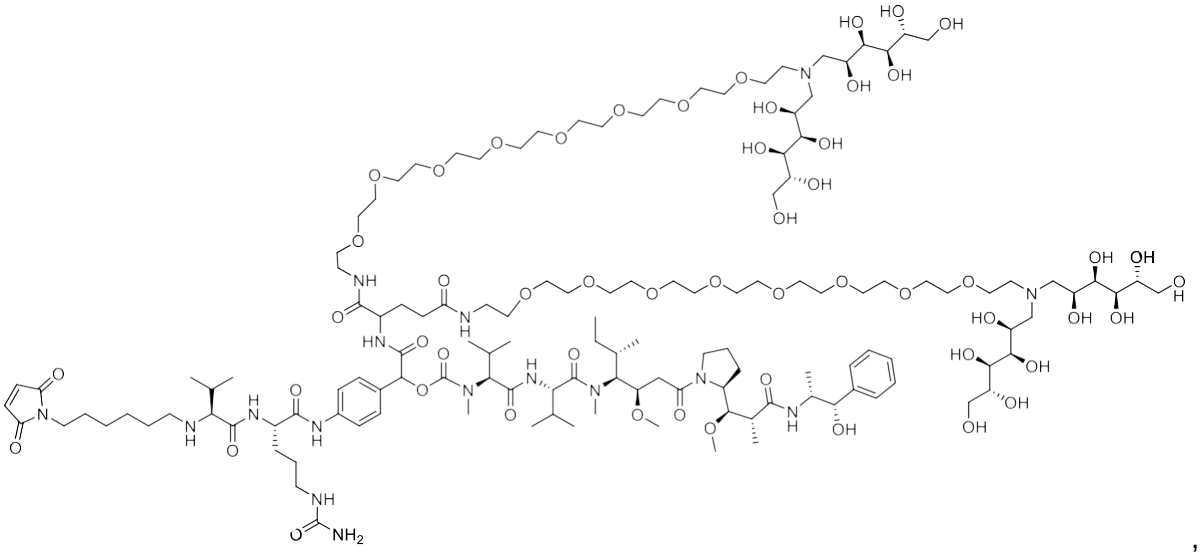
,



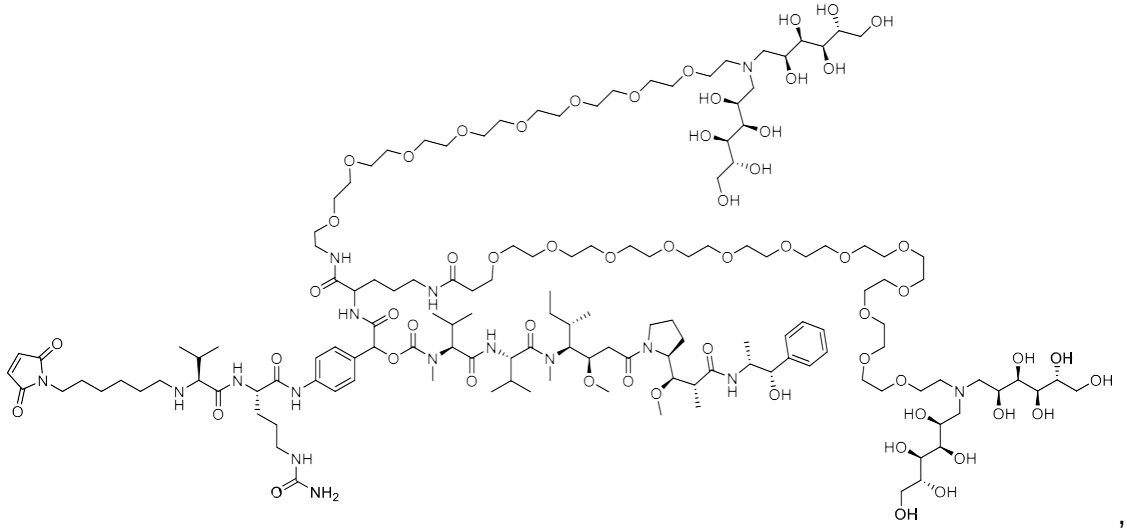
,



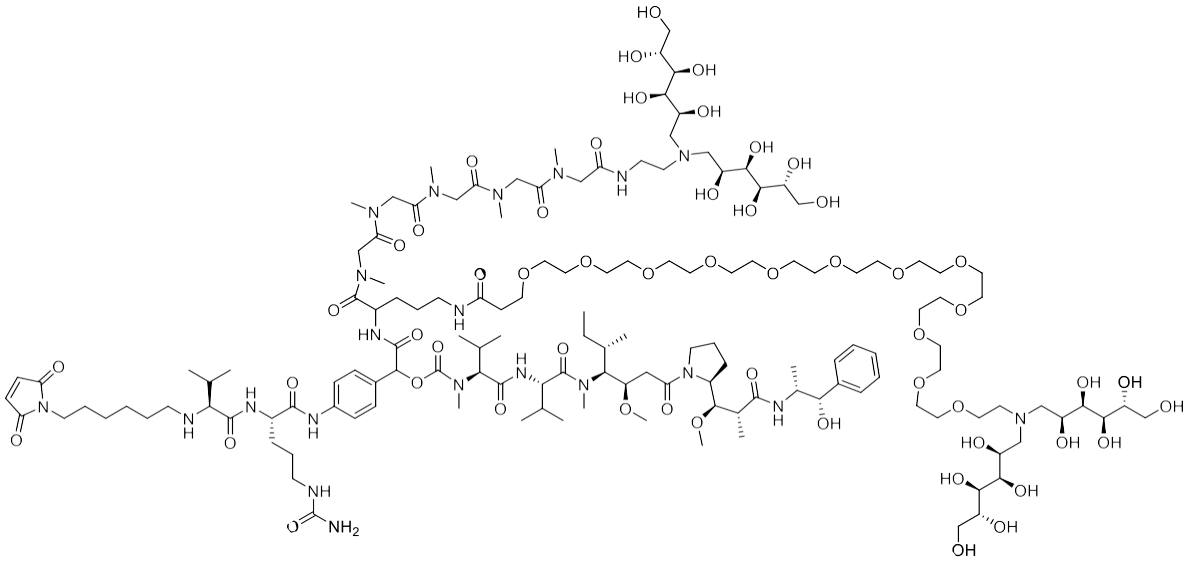
,



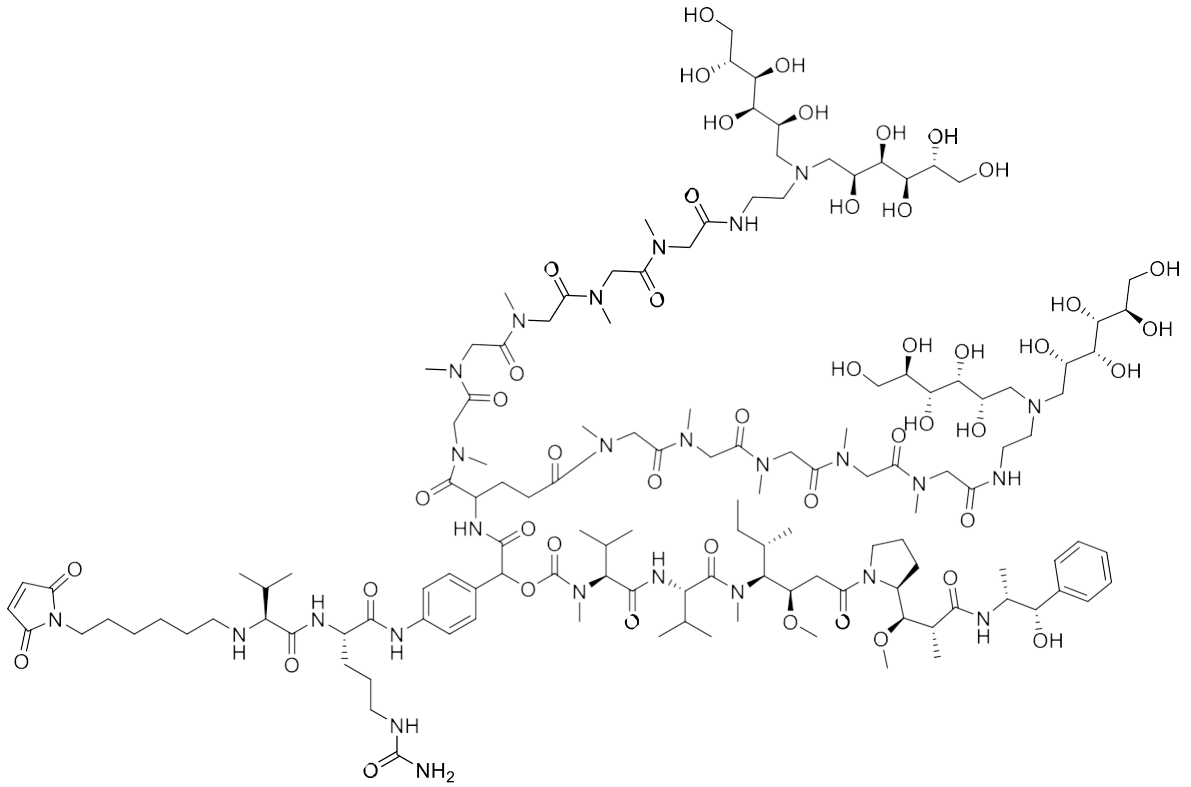
,



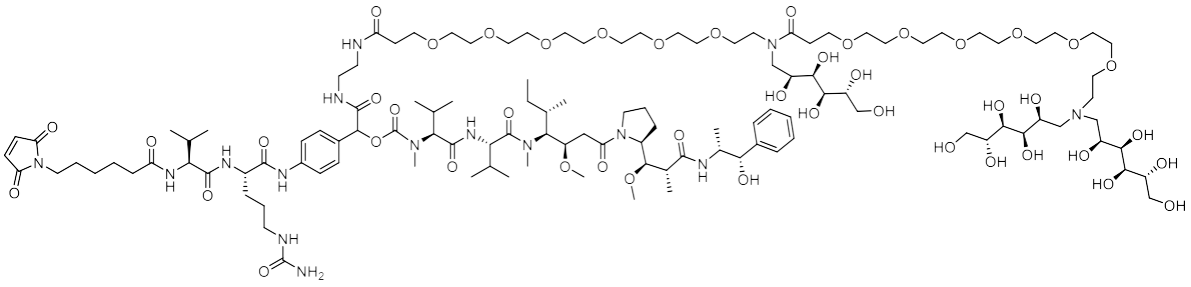
,



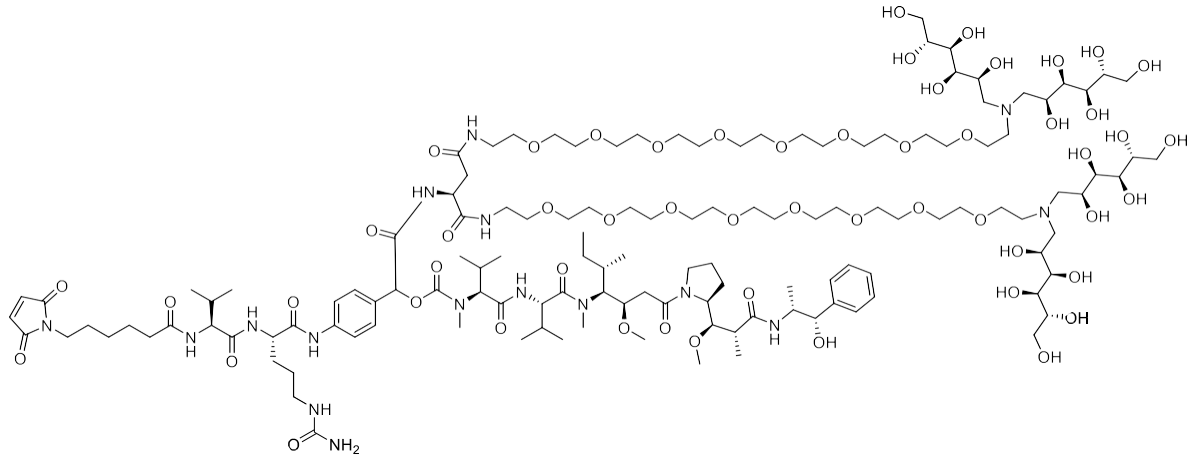
,



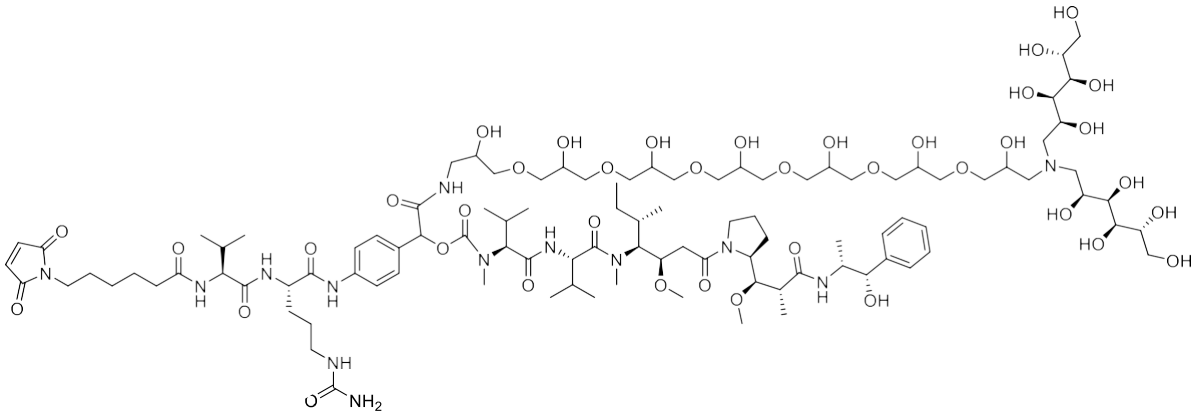
,



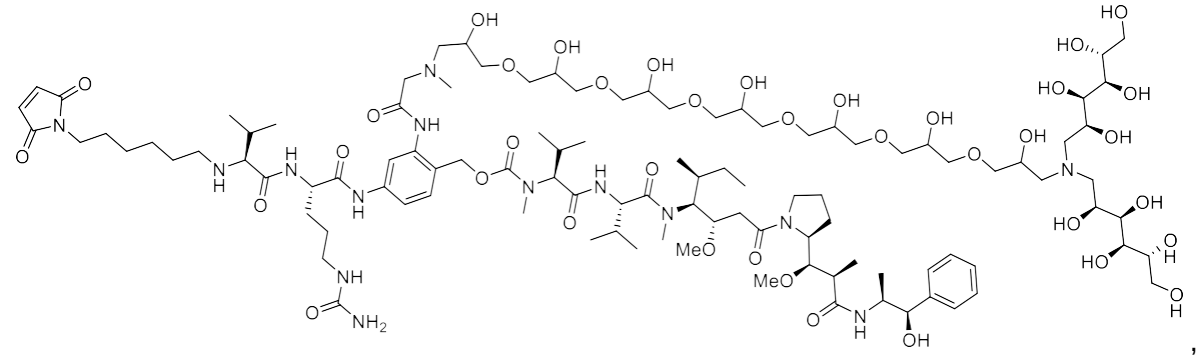
,



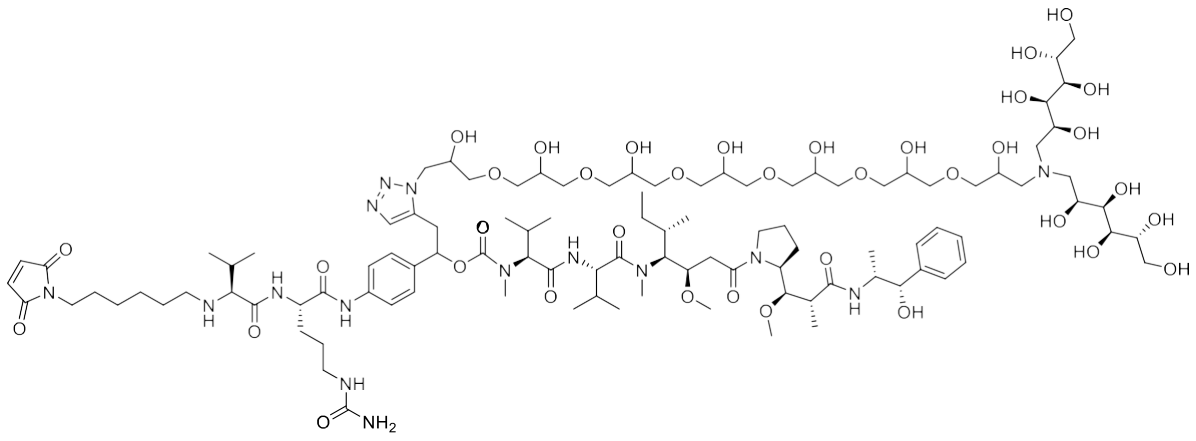
,



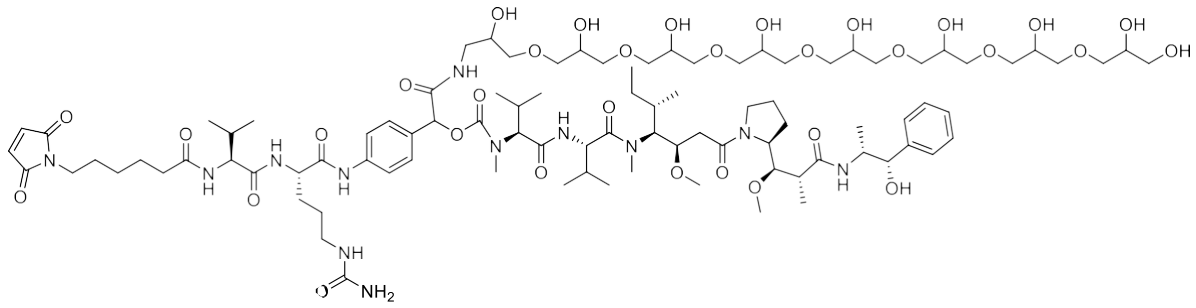
,



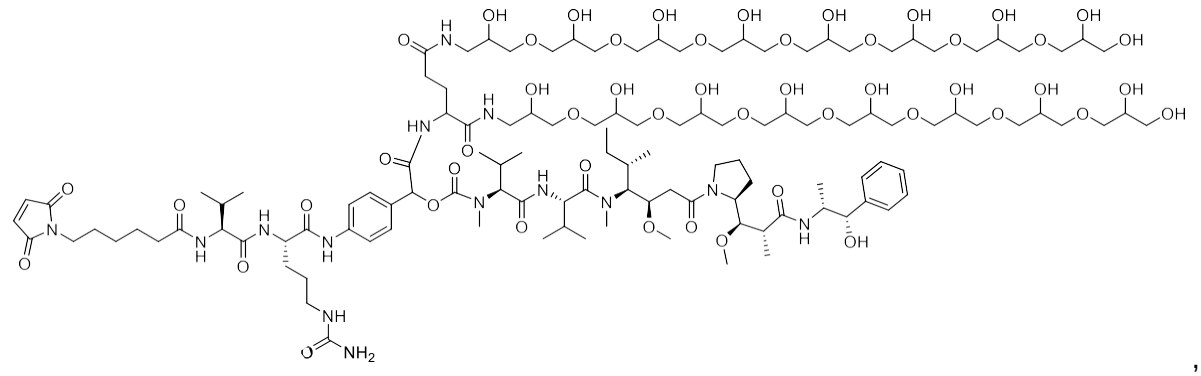
,



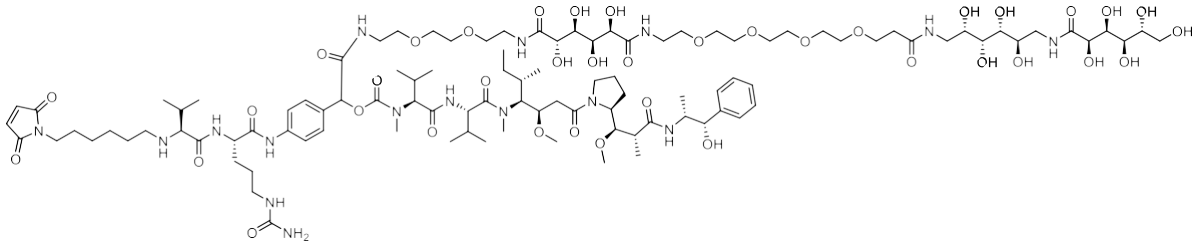
,



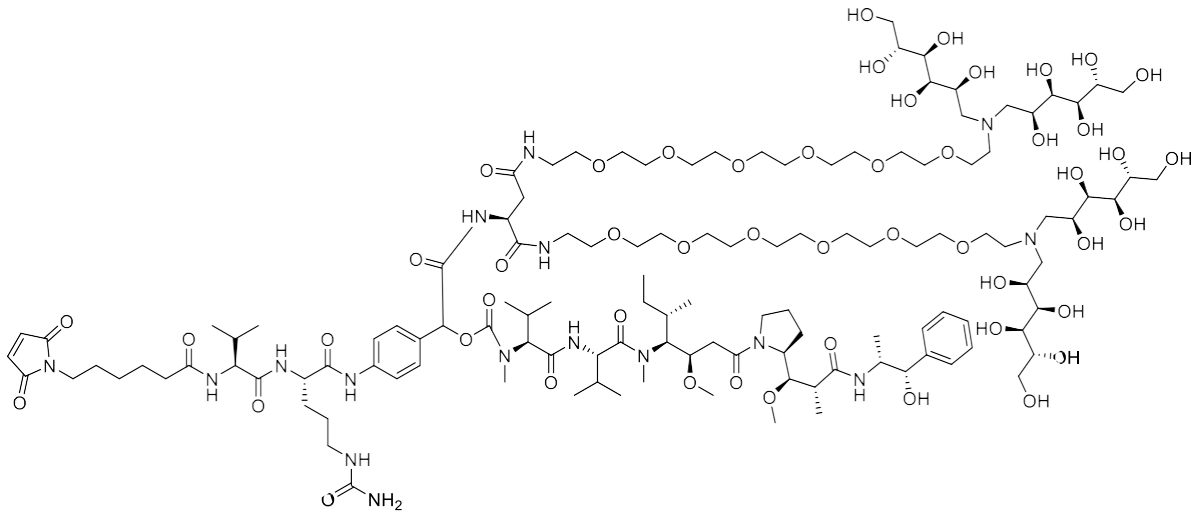
,



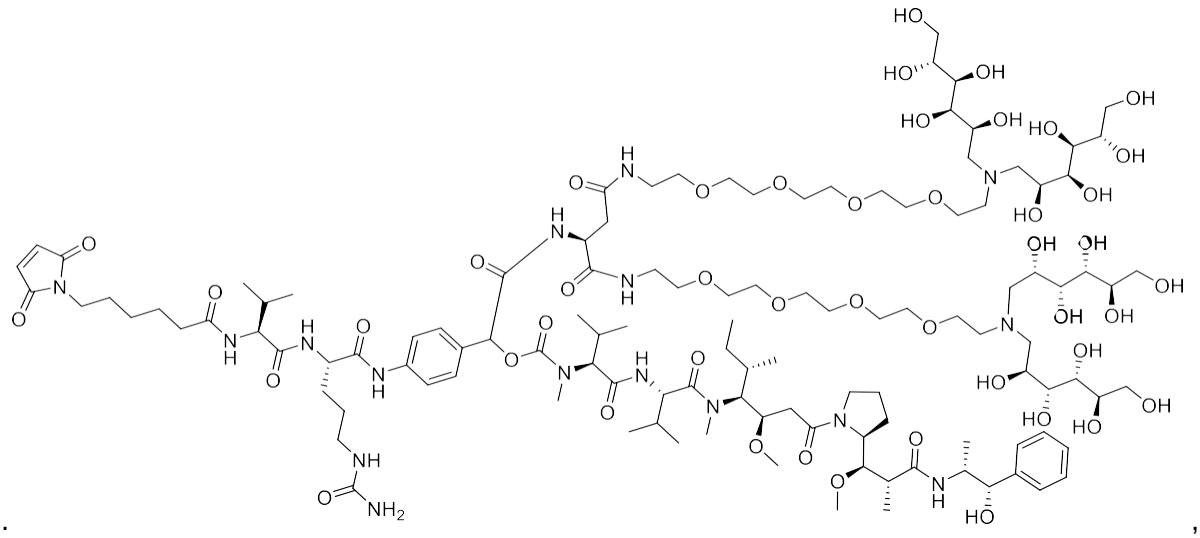
,



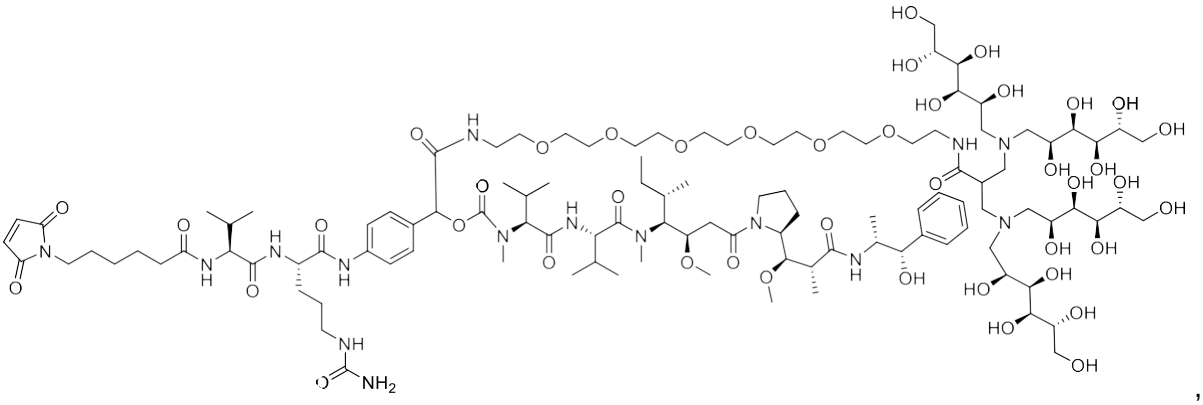
,



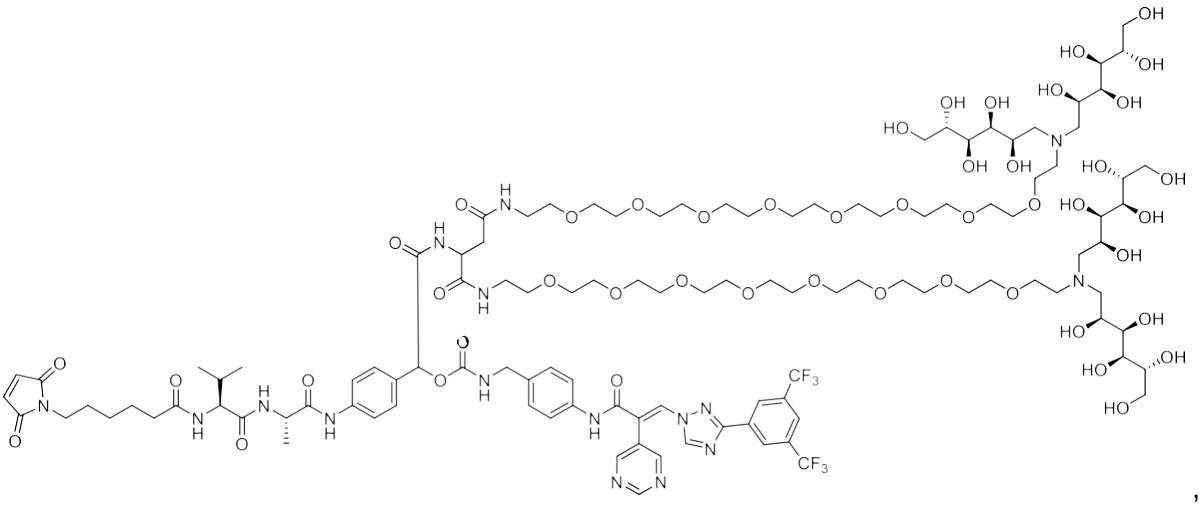
,



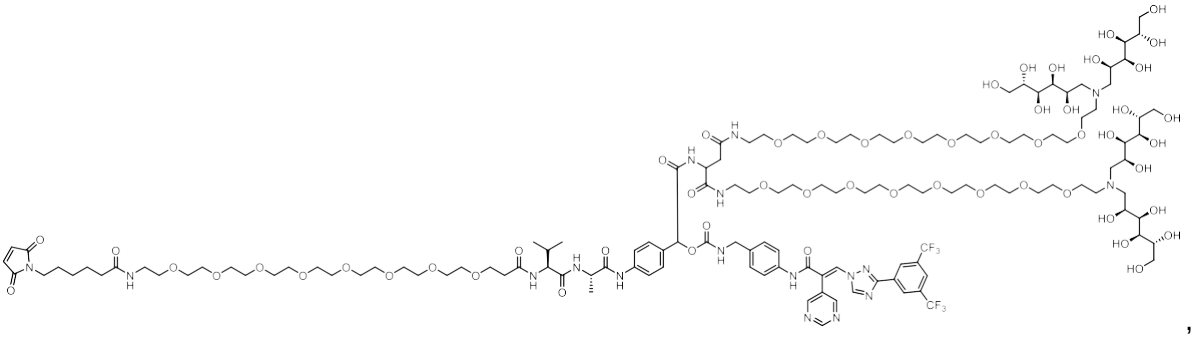
,



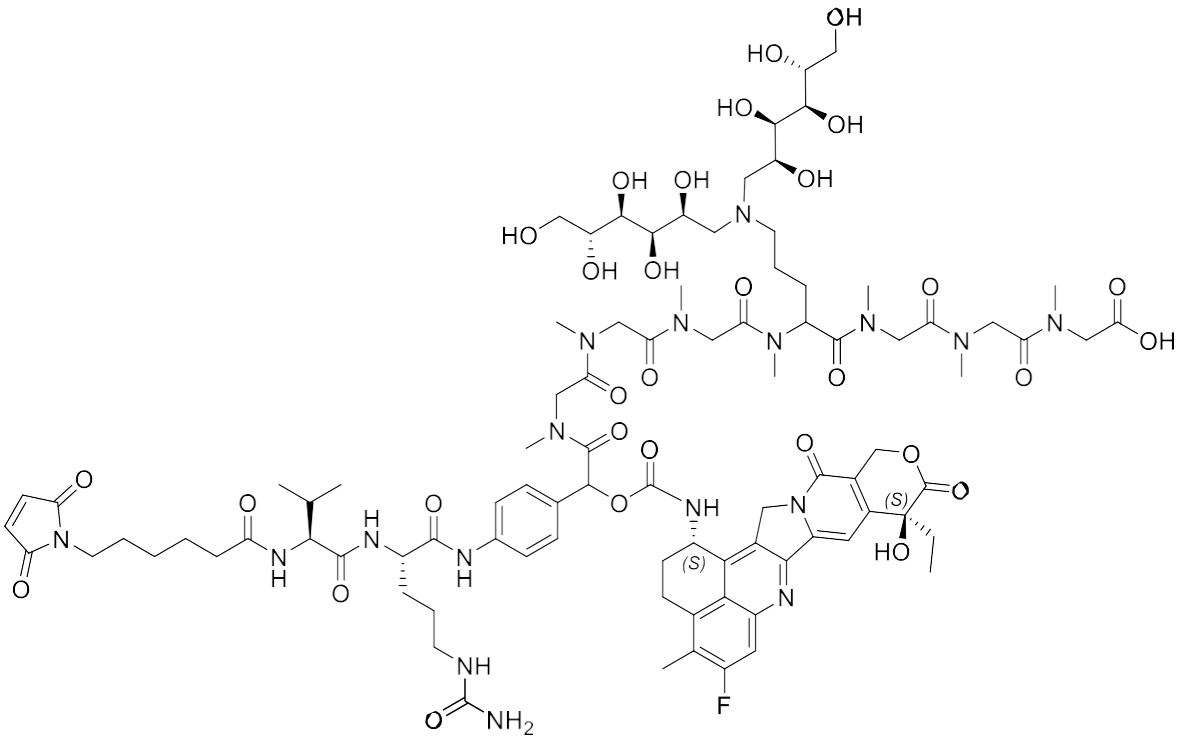
,



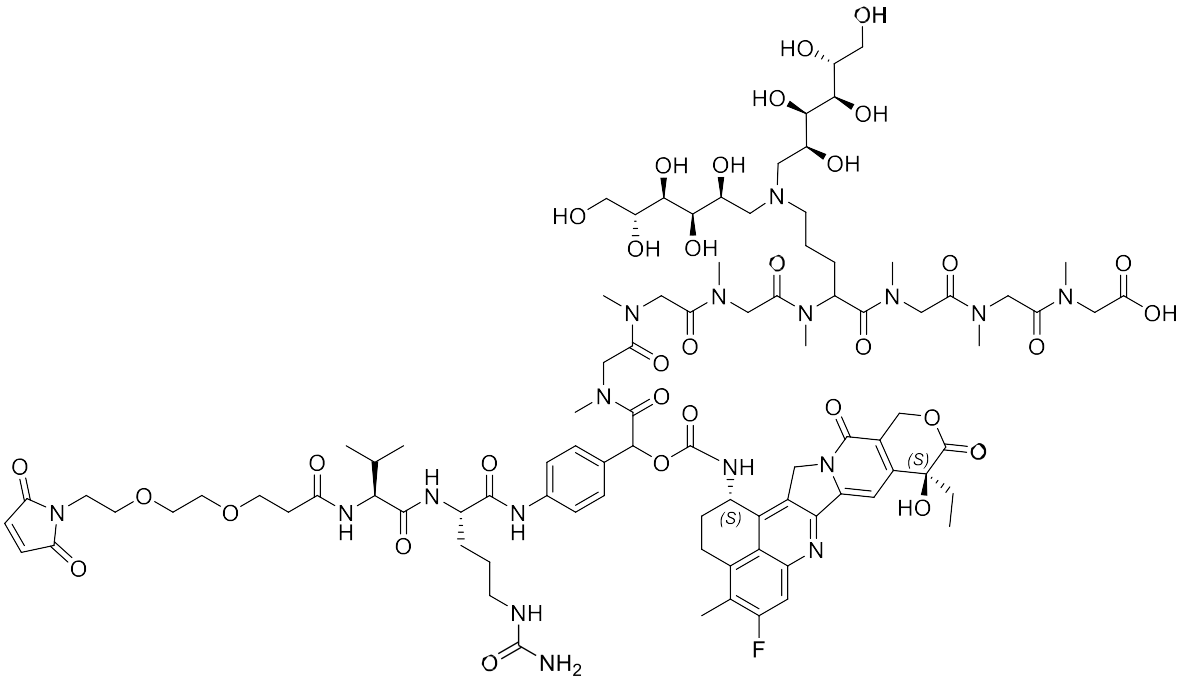
,



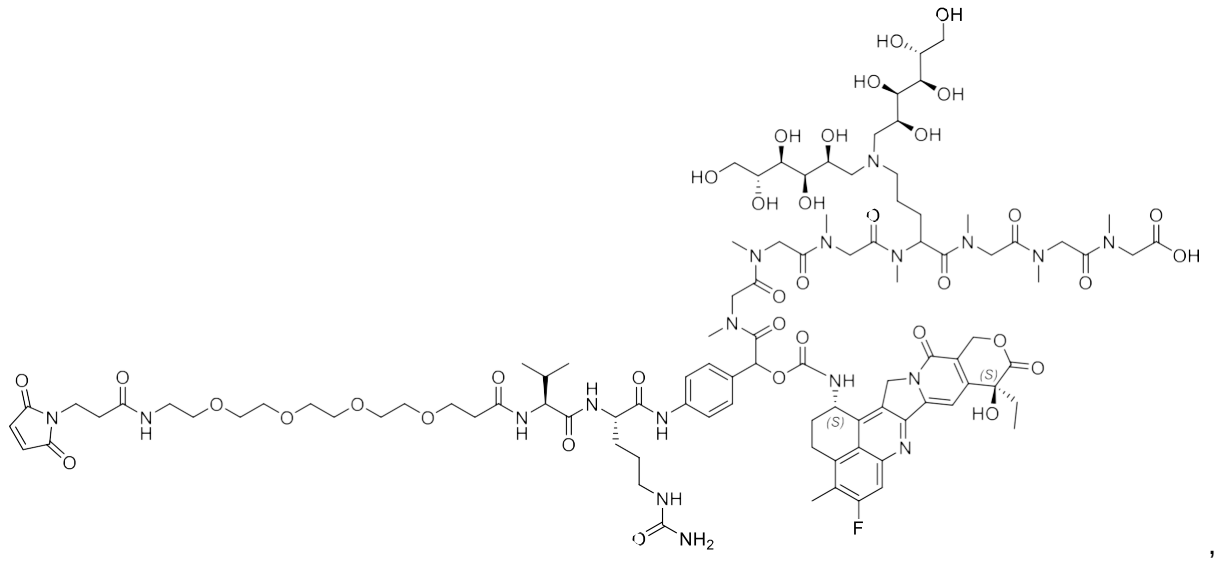
,



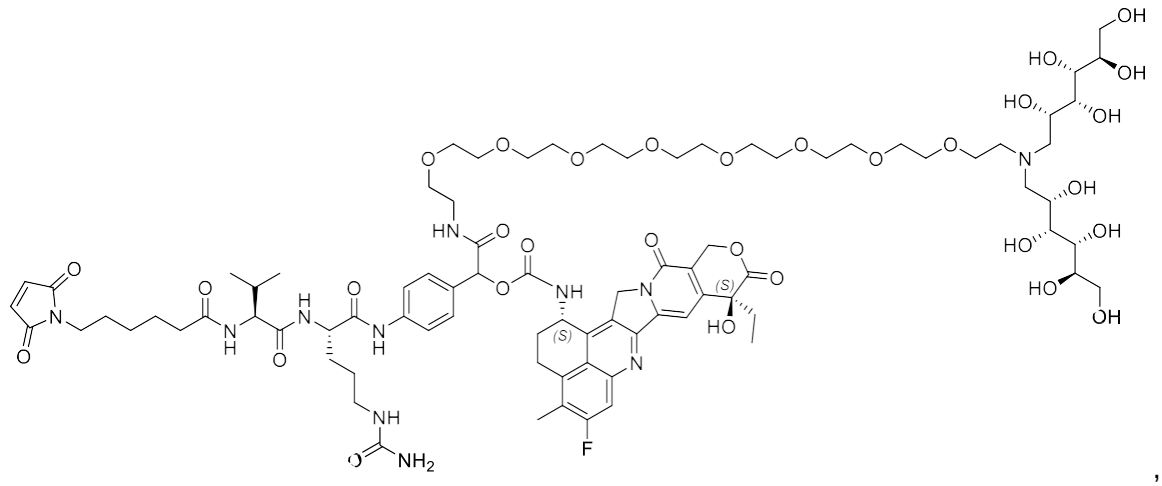
,



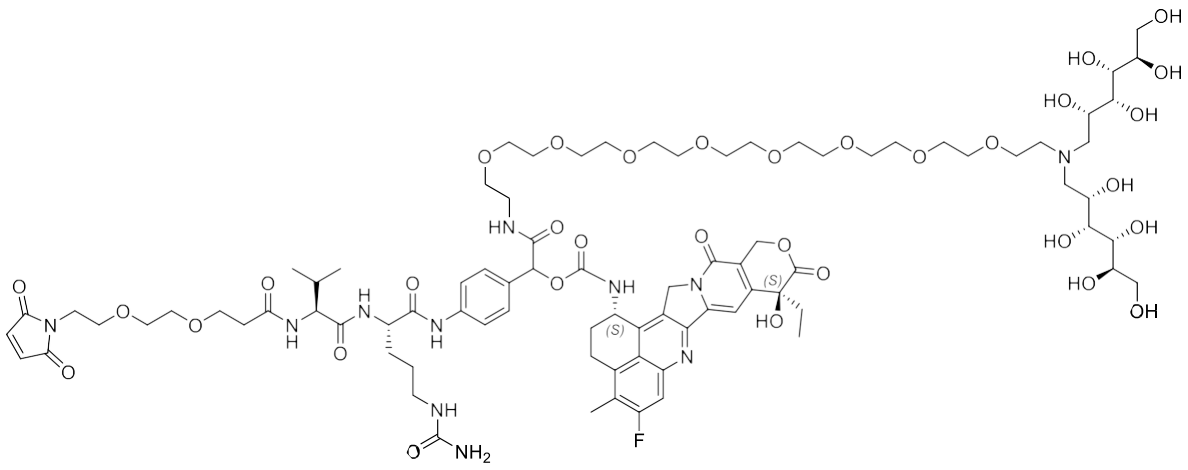
,



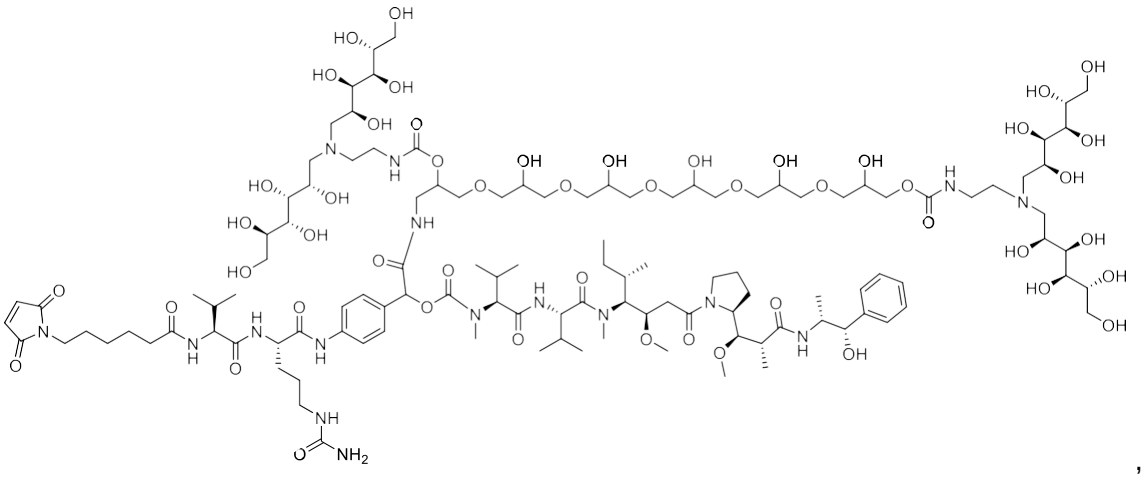
,



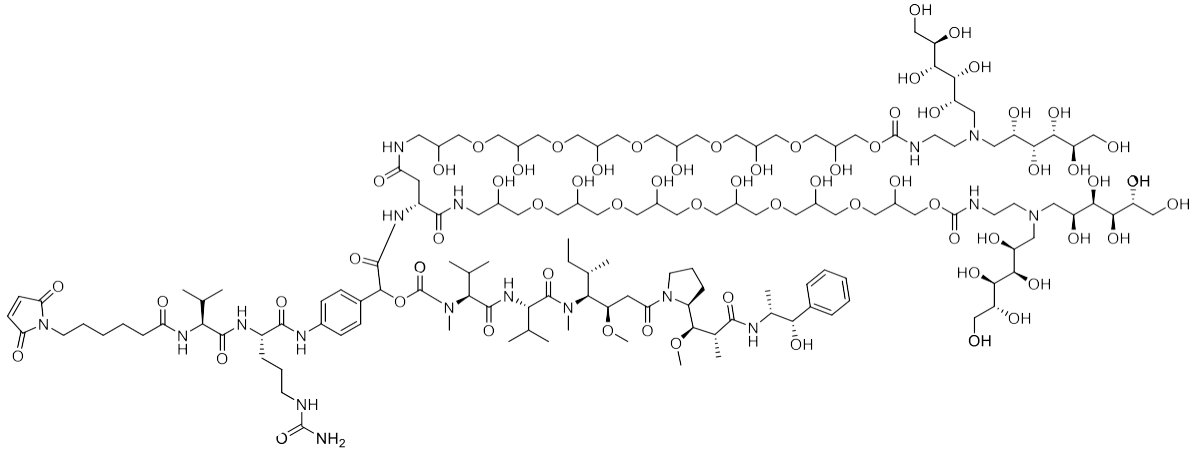
,



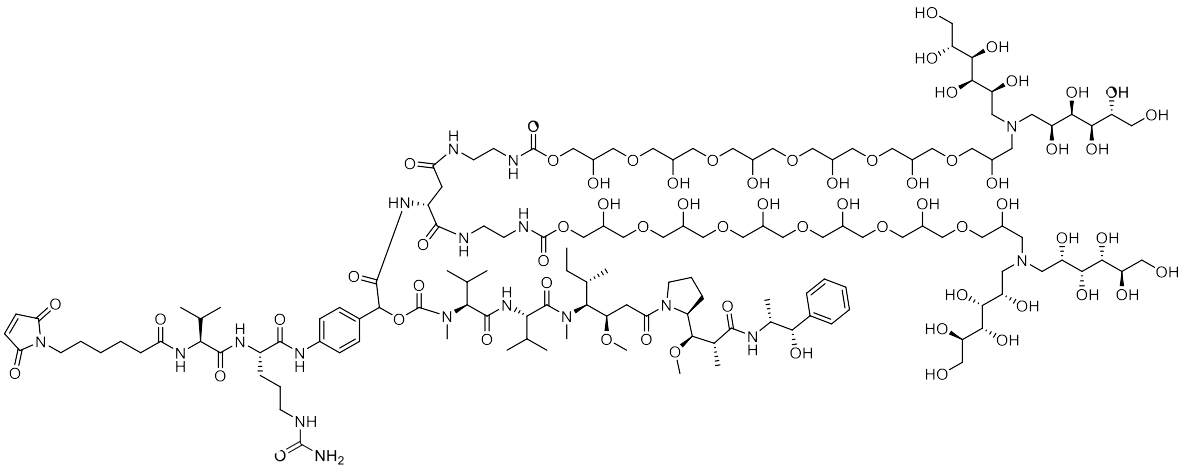
,



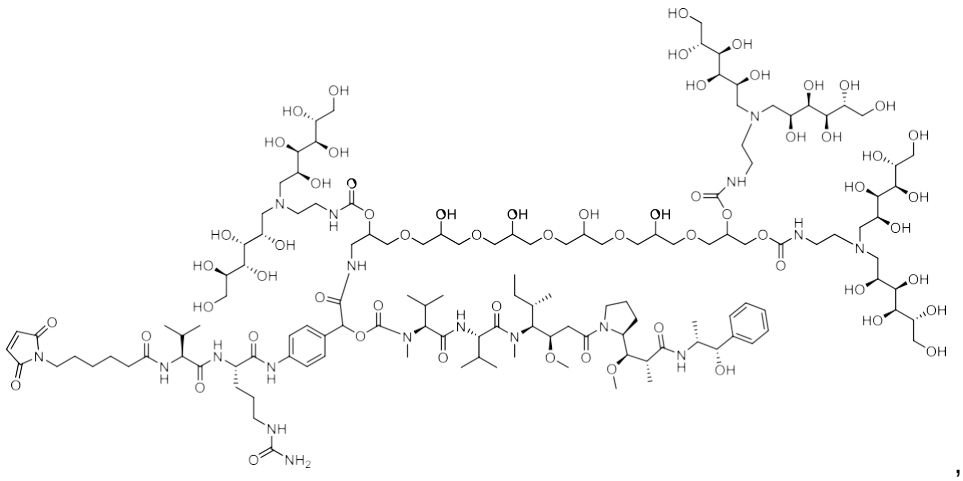
,



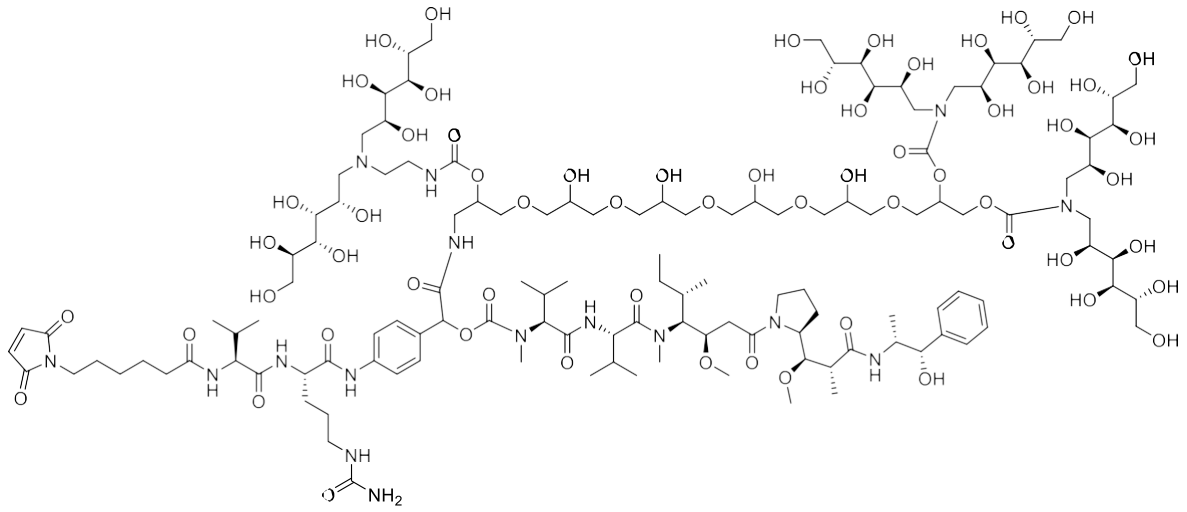
,



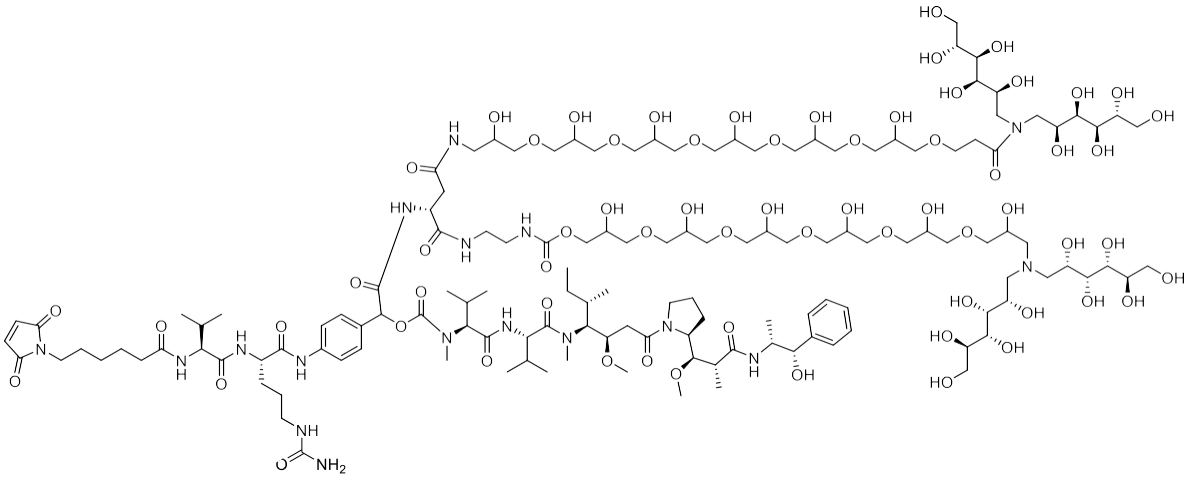
,



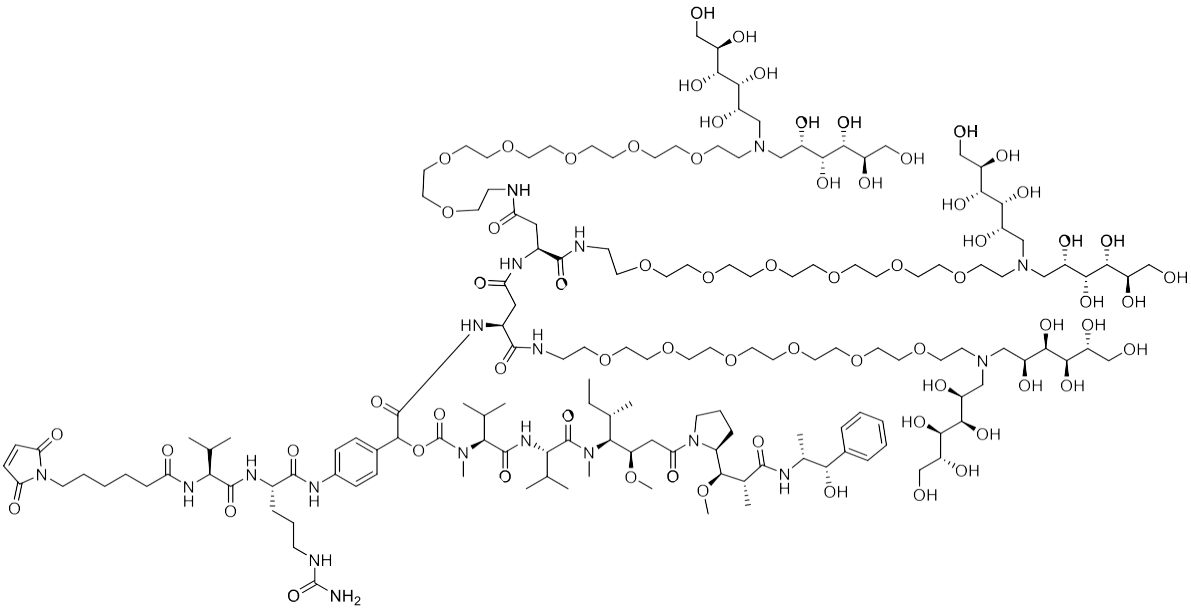
,



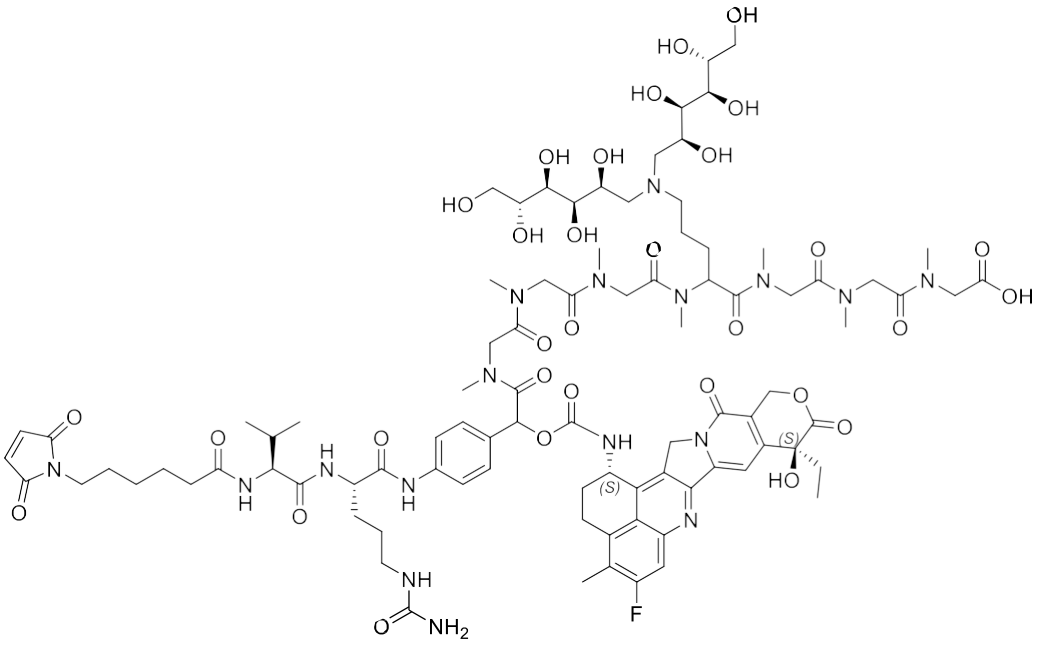
,



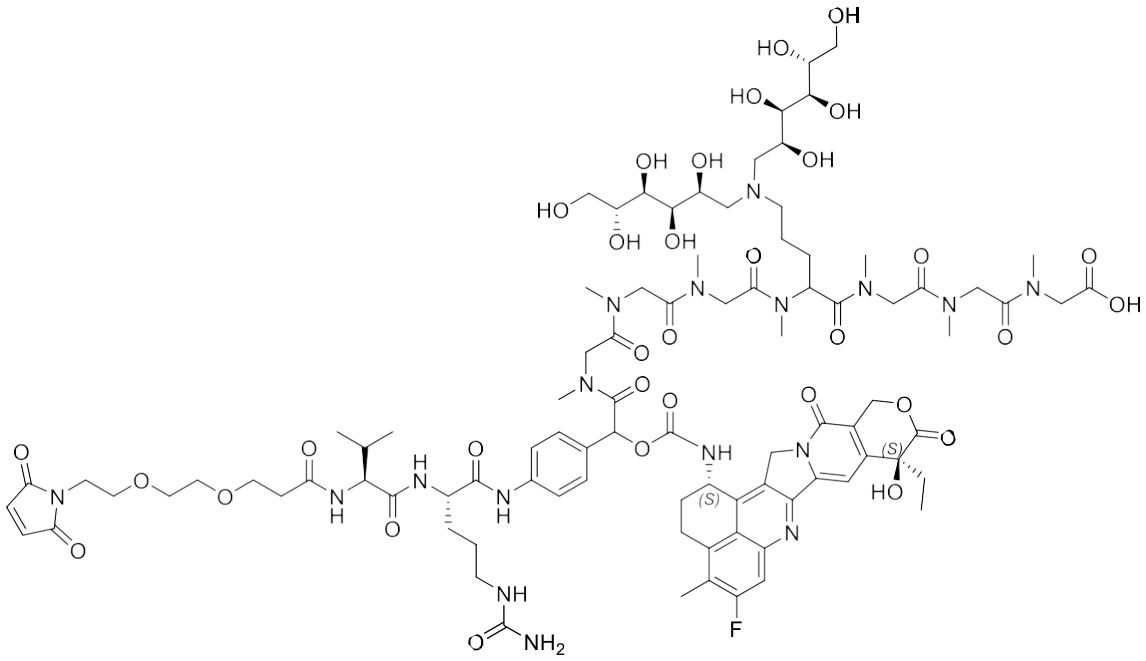
,

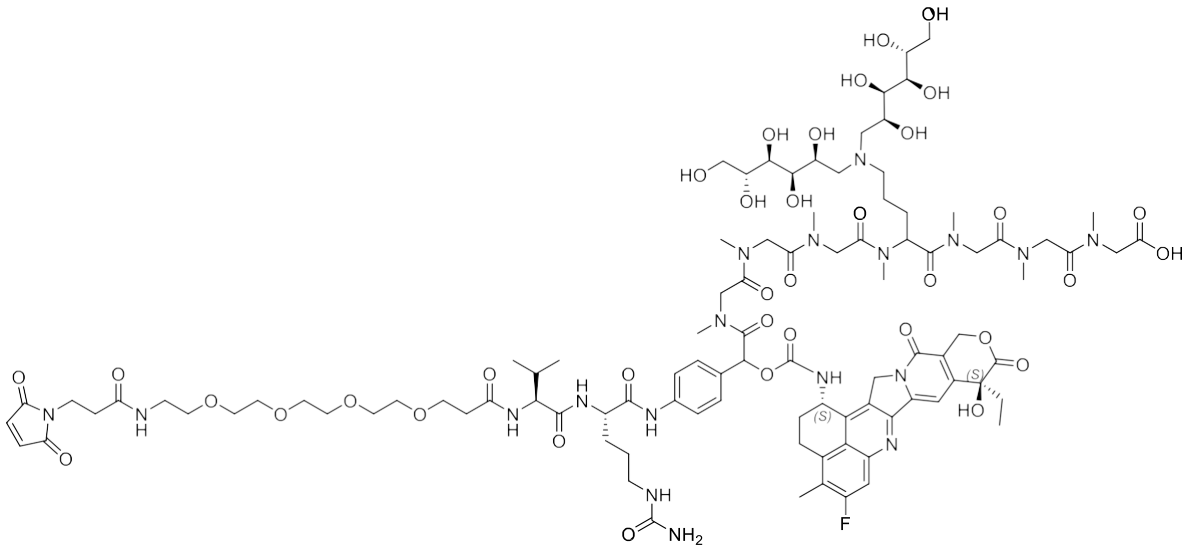


,

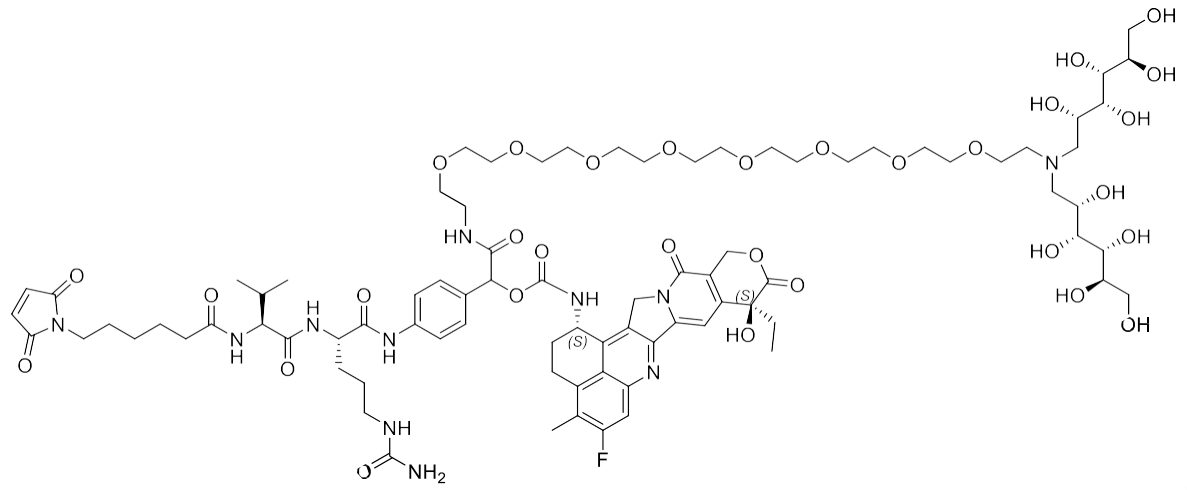


,

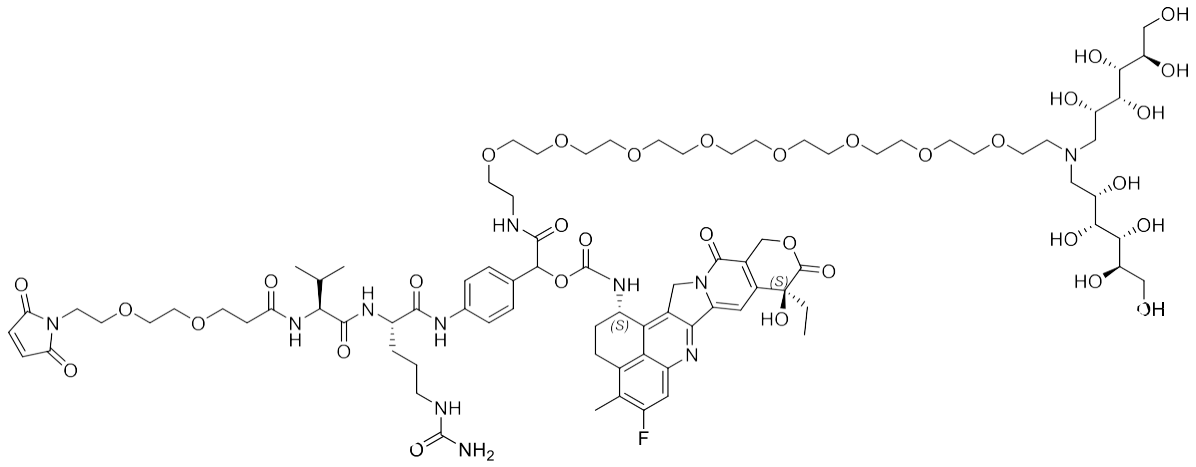




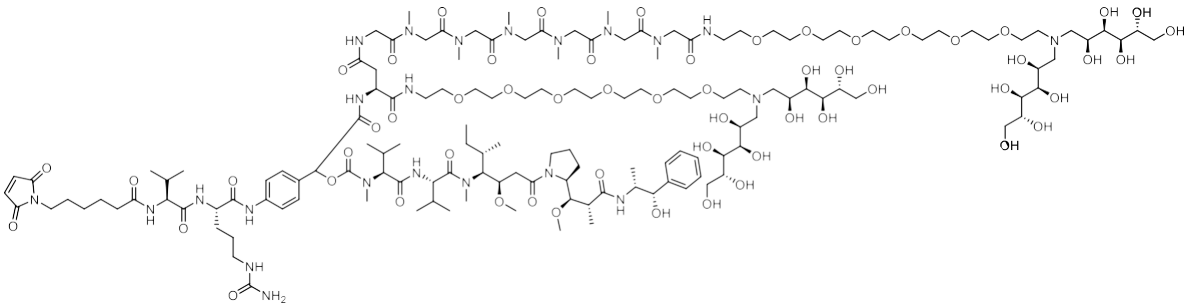
,



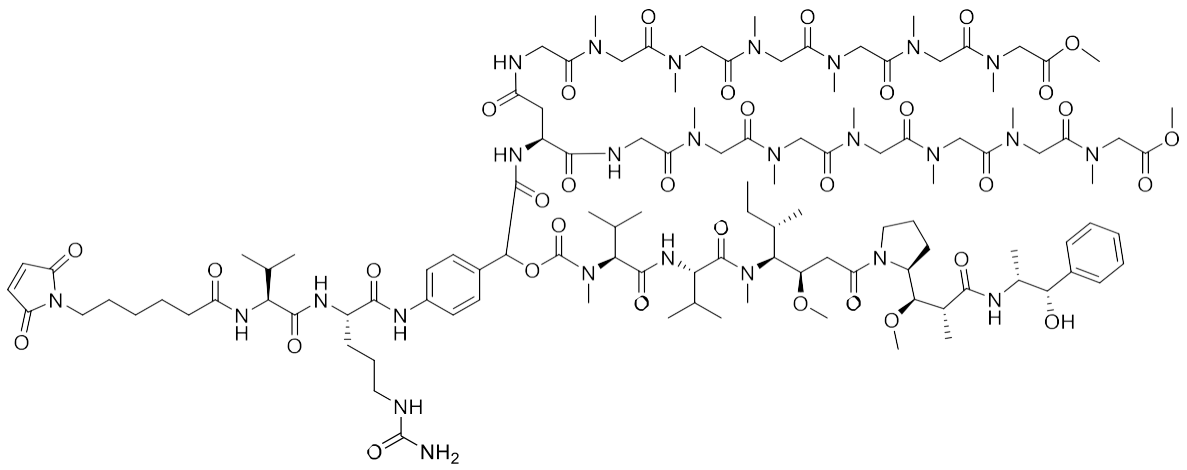
,



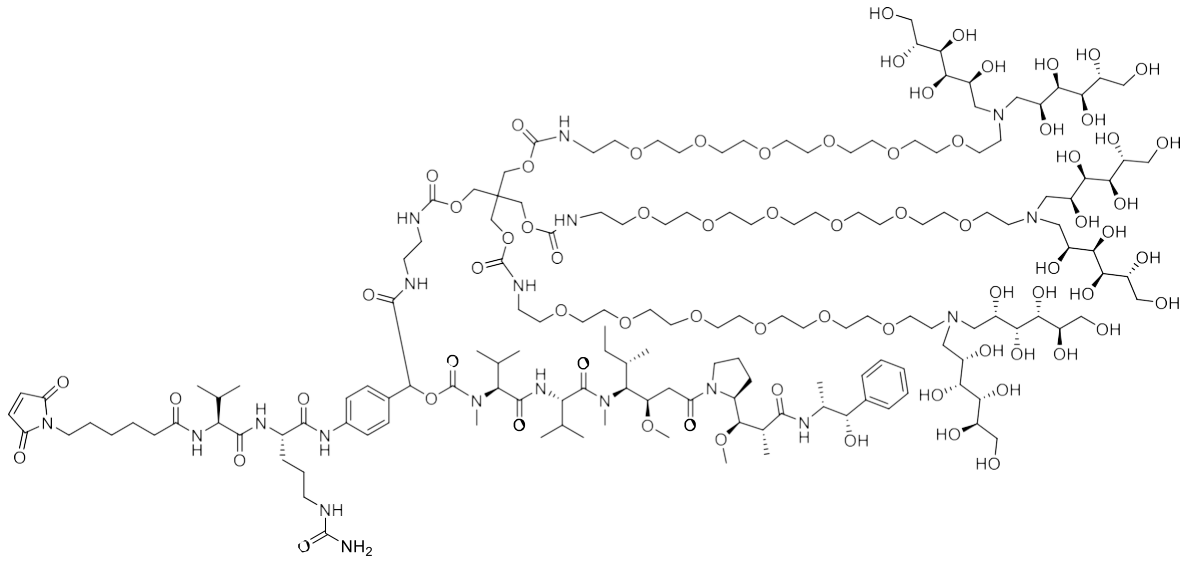
,



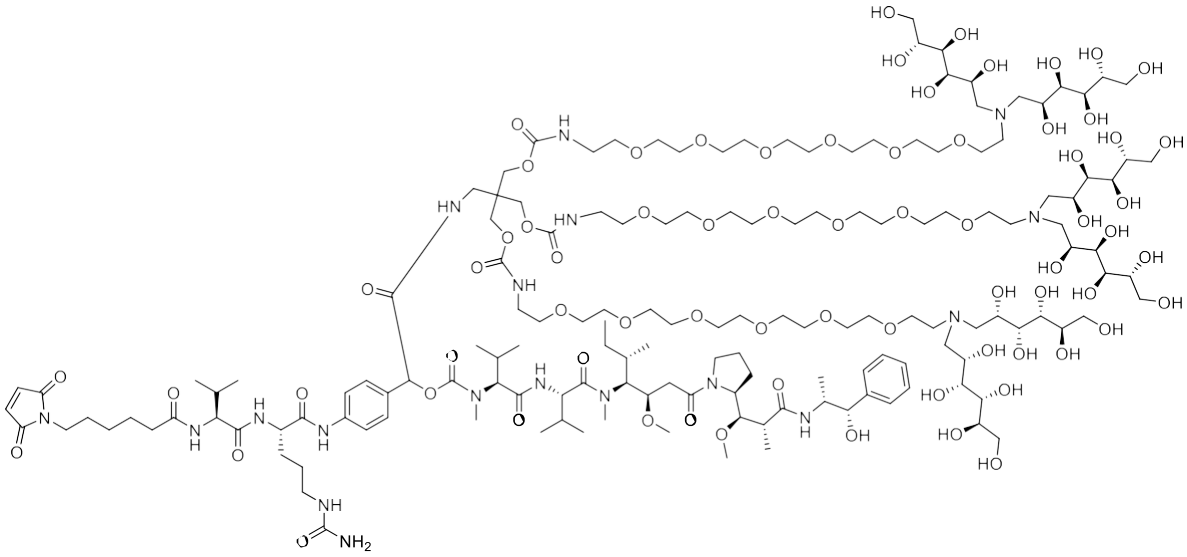
,



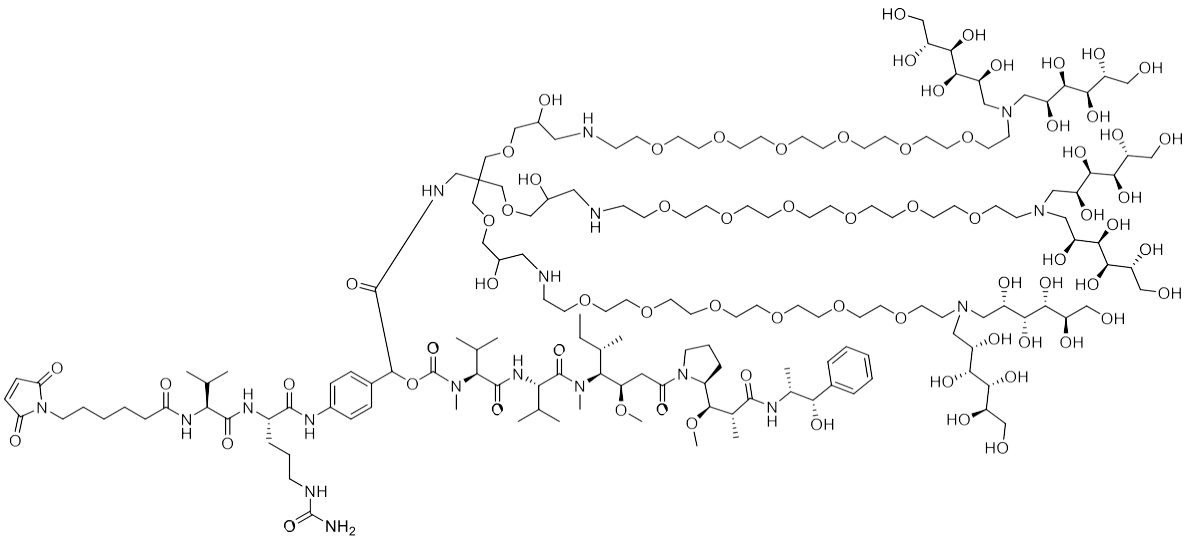
,



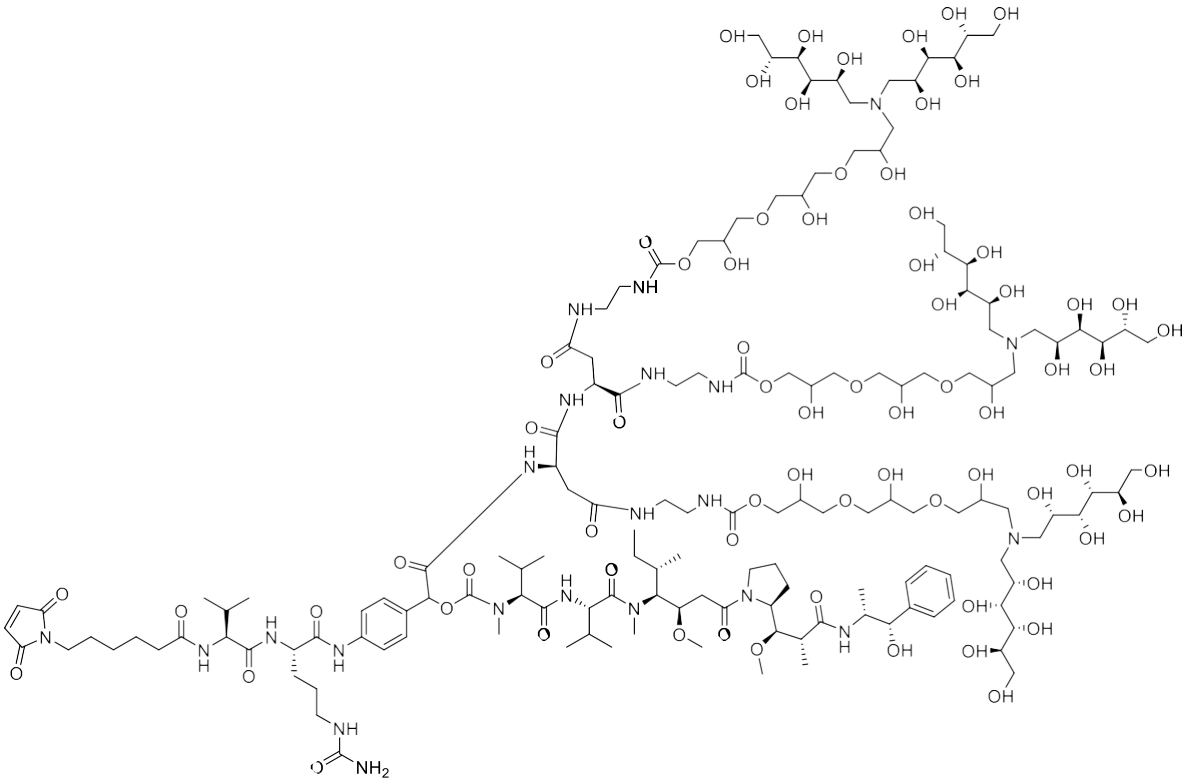
,



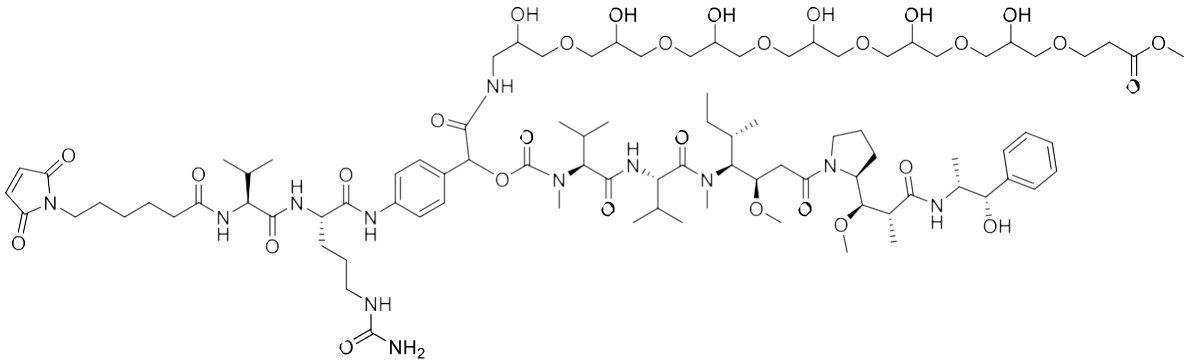
,



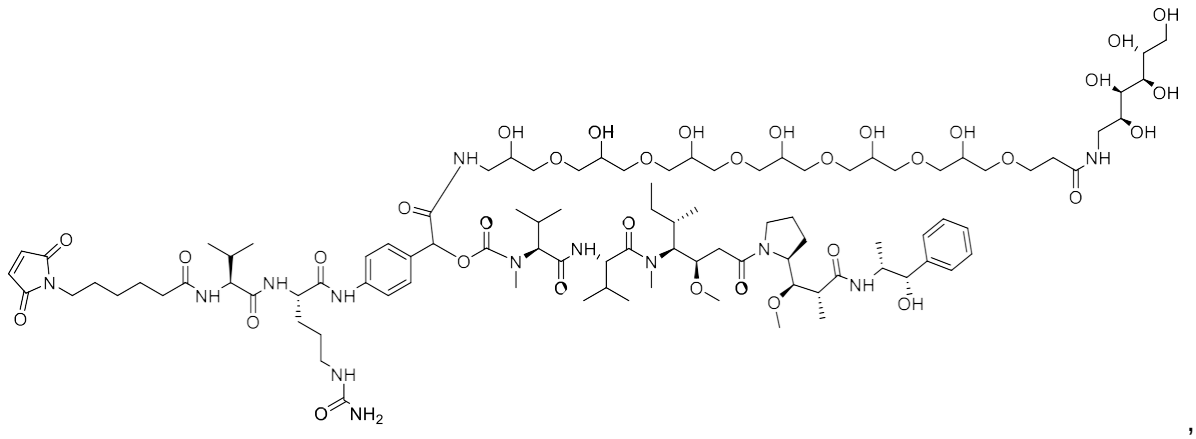
,



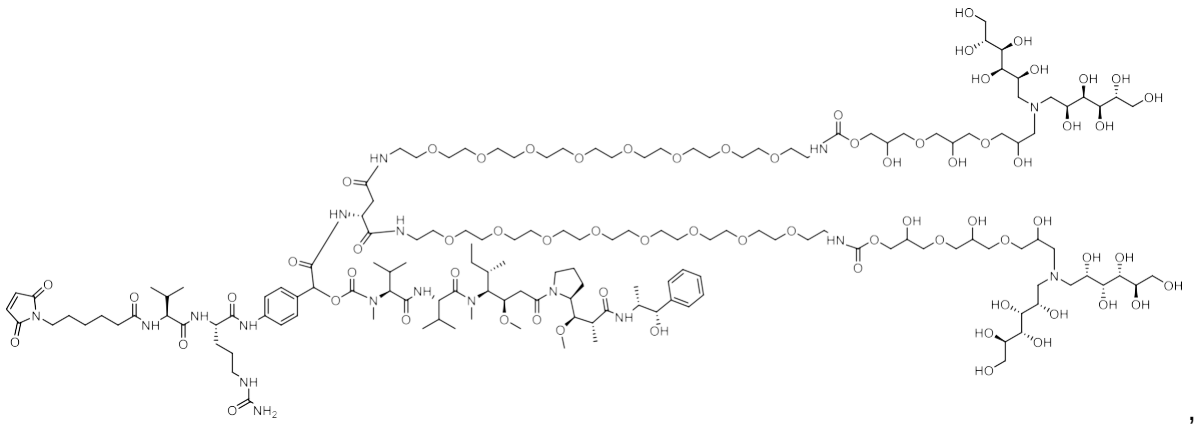
,



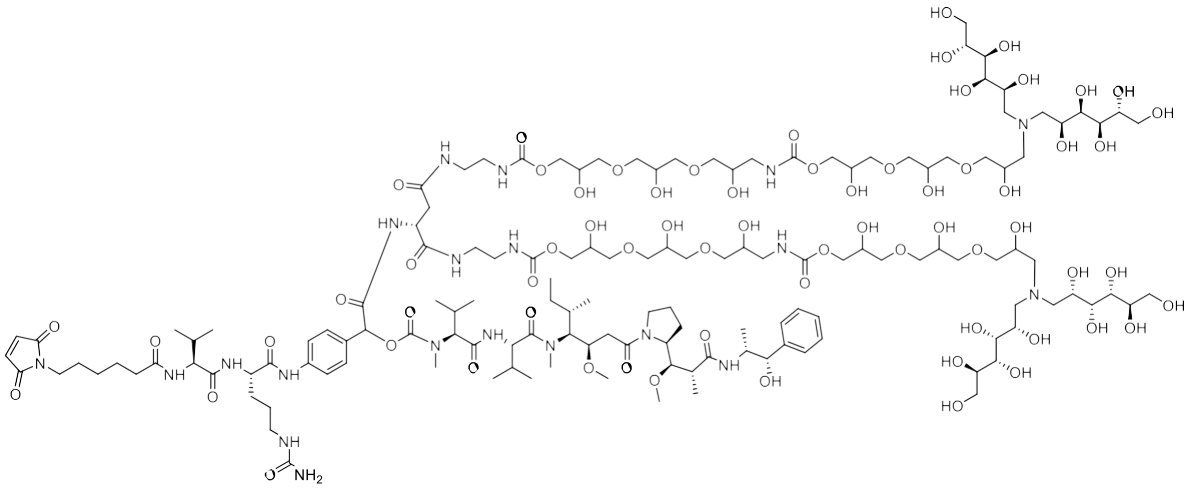
,



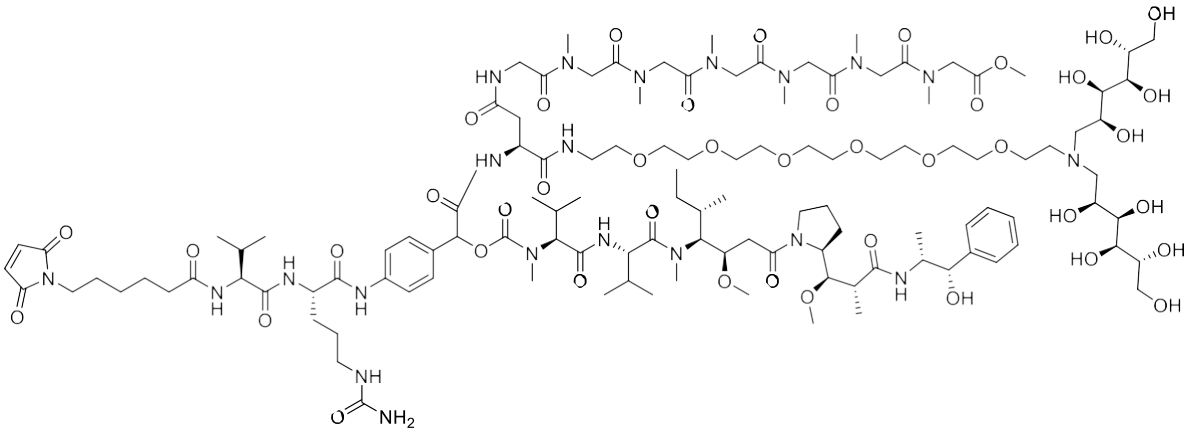
,



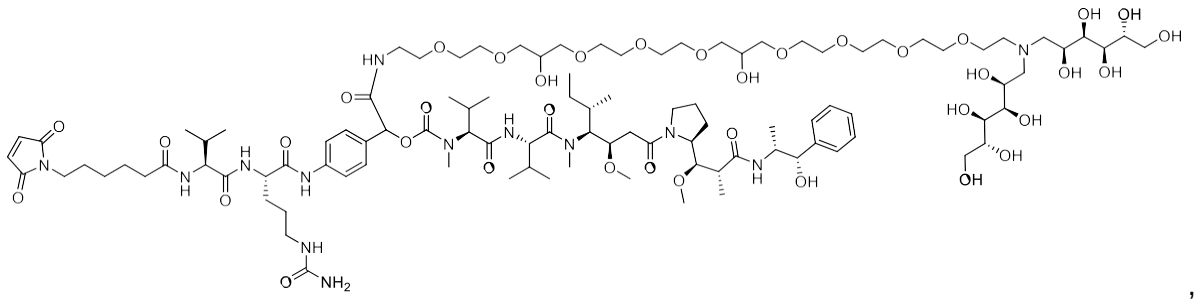
,



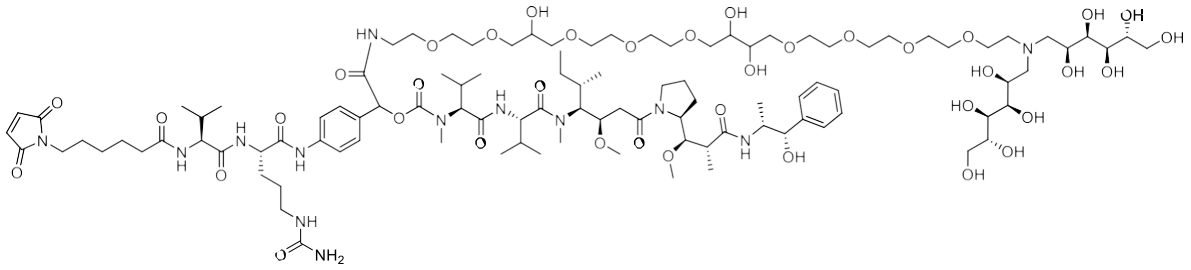
,



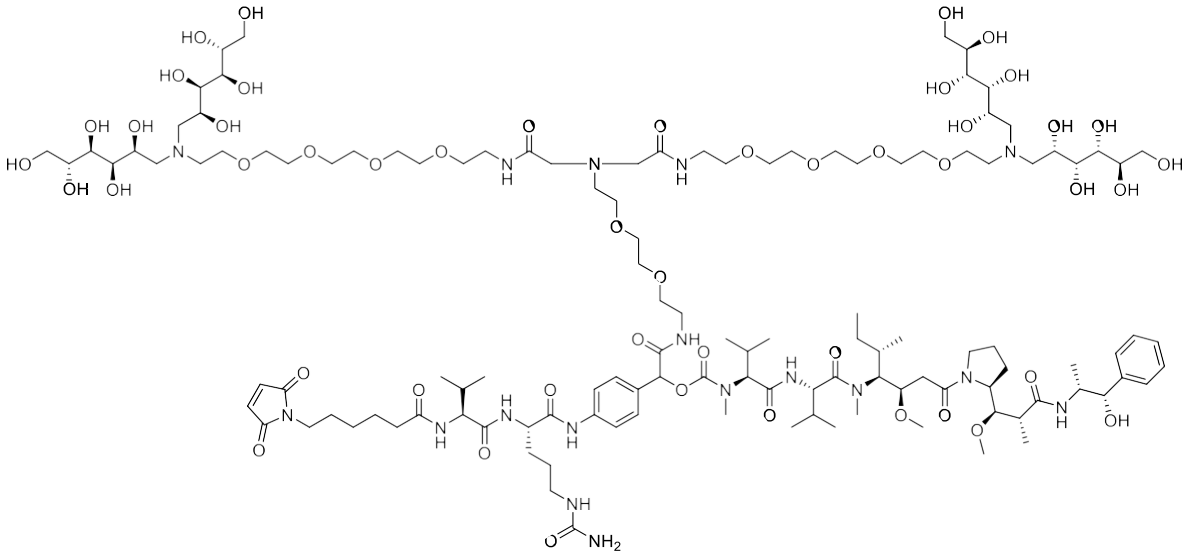
,



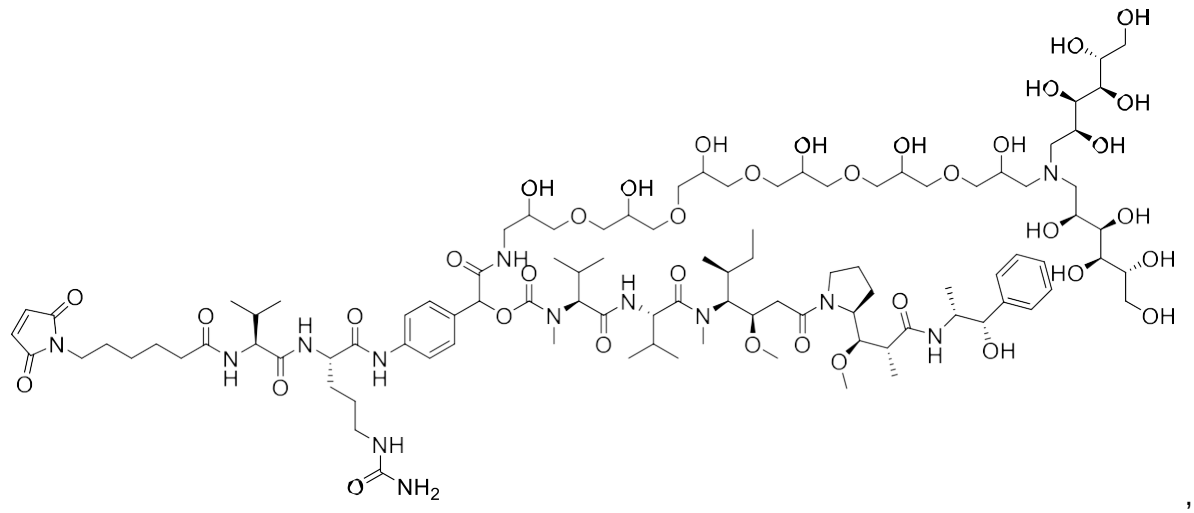
,



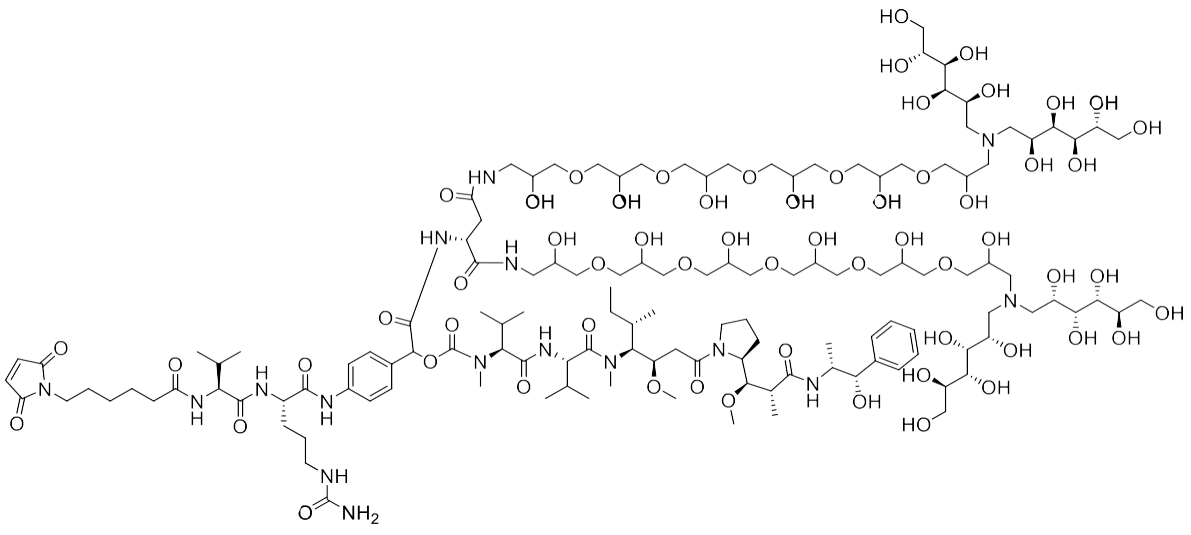
,



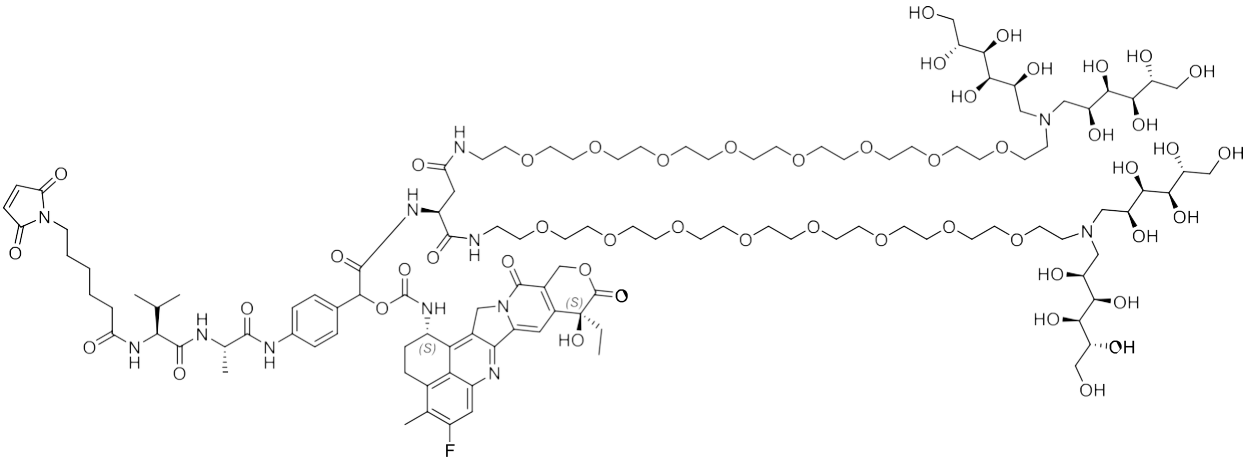
,

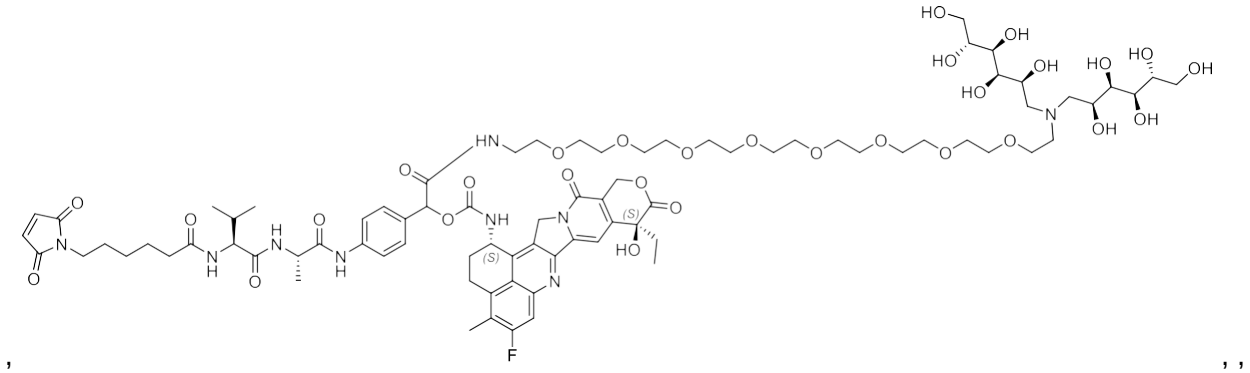


,

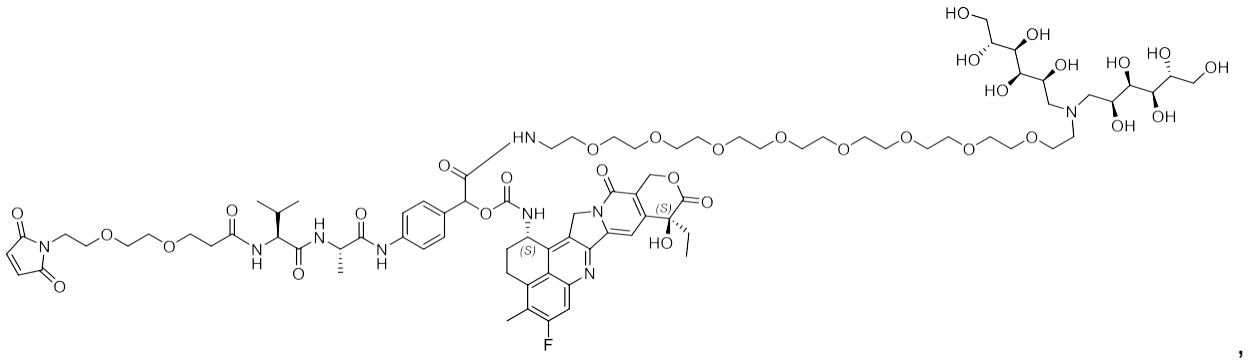


,

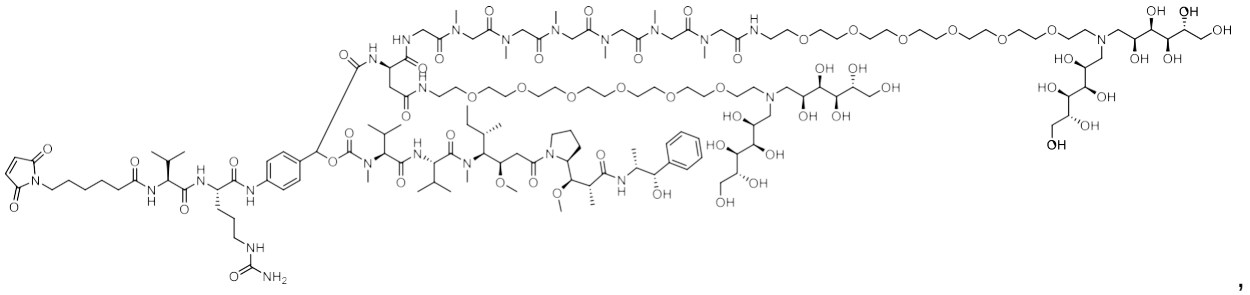




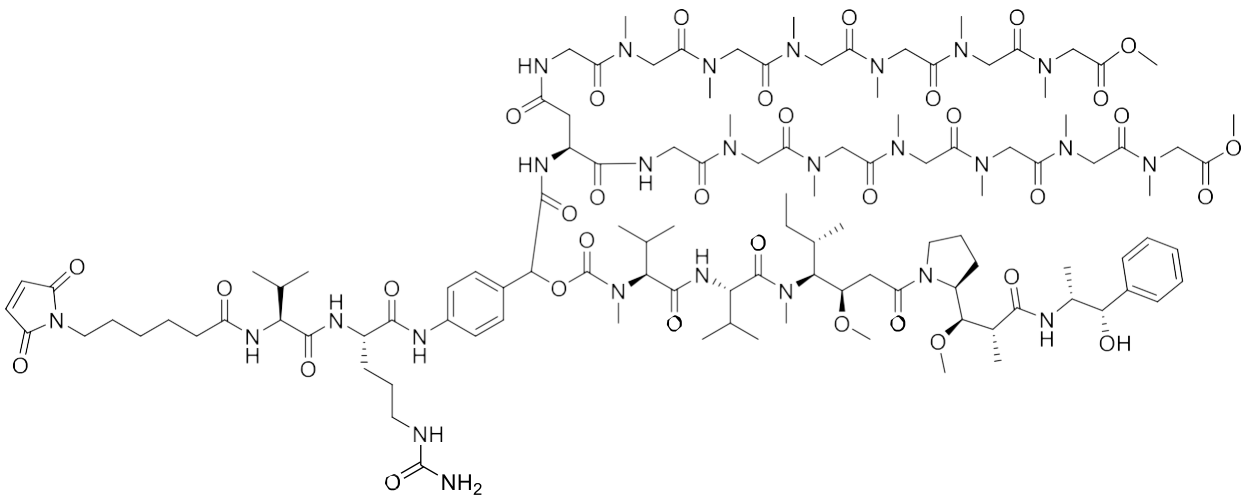
, , ,



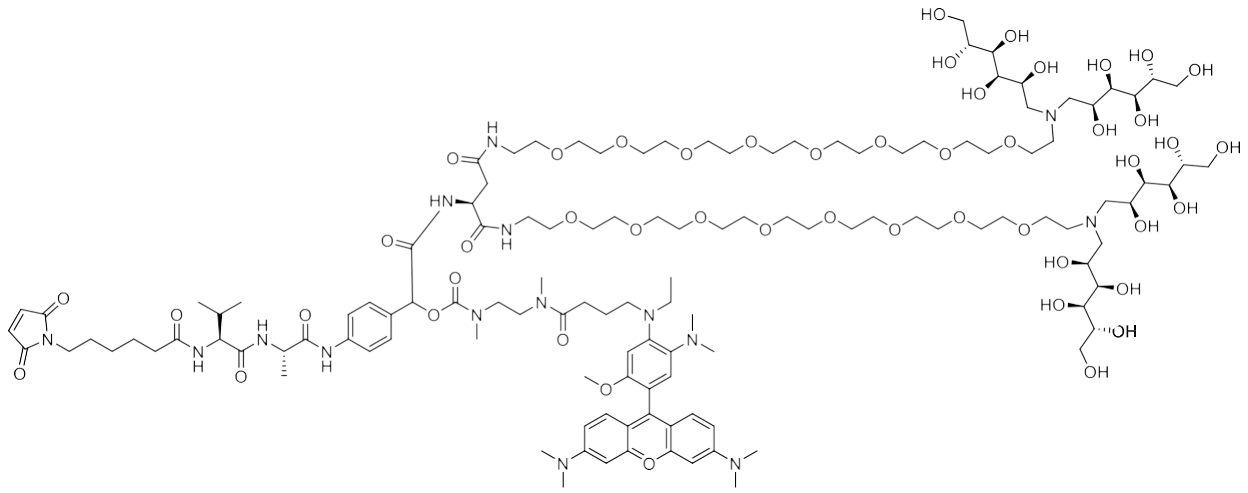
,



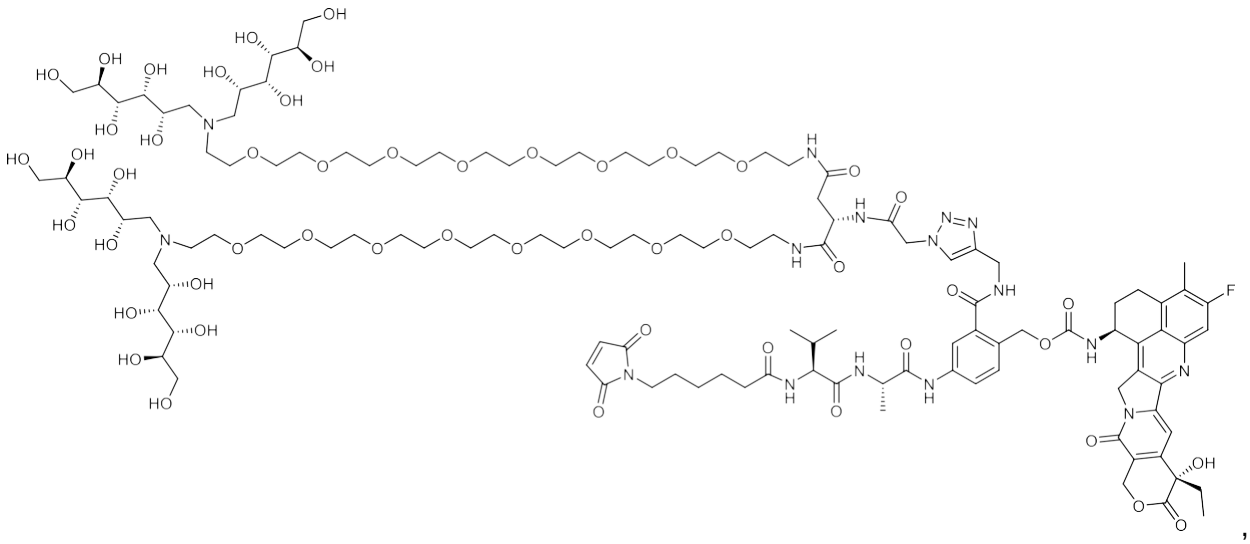
,



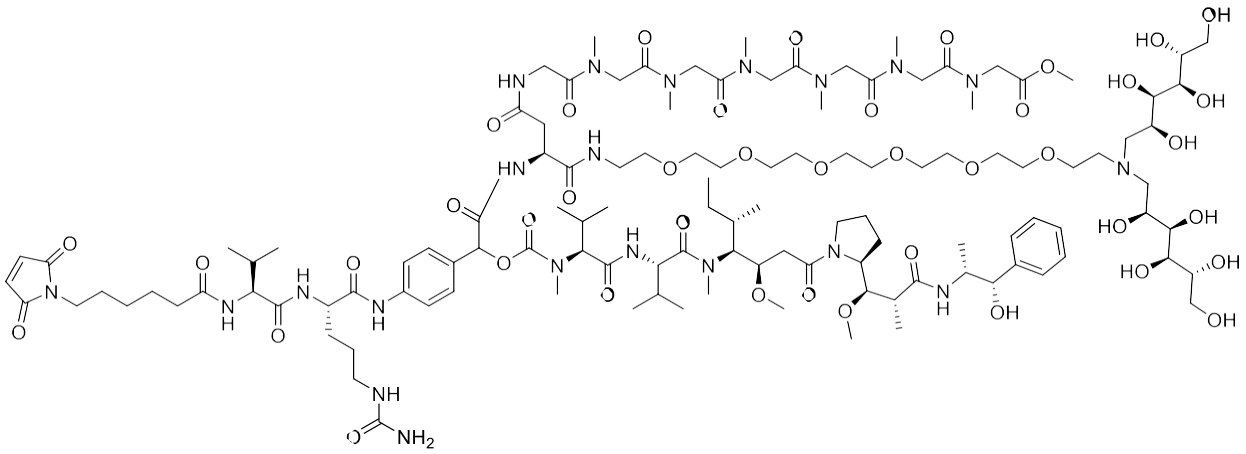
,



,



,



.

102. Un conjugado que comprende un grupo de direccionamiento unido al fármaco-conector de cualquiera de las reivindicaciones 78 a 101, donde el grupo de direccionamiento se une específicamente a la molécula diana.

103. El conjugado de la reivindicación 102, donde el grupo de direccionamiento se selecciona entre un anticuerpo o una porción de unión a antígeno del mismo.

104. El conjugado de la reivindicación 103, donde el grupo de direccionamiento es un anticuerpo monoclonal, un Fab, un Fab', un F(ab'), un Fv, un Fc con unión disulfuro, un scFv, un anticuerpo de dominio único, un diacuerpo, un anticuerpo biespecífico, o un anticuerpo multiespecífico.

105. El conjugado de la reivindicación 102, donde el grupo de direccionamiento es un diacuerpo, un DART, una anticalina, un aficuerpo, un avímero, una DARPin o una adnectina.

106. El conjugado de cualquiera de las reivindicaciones 102 a 105, donde el grupo de direccionamiento es monoespecífico.

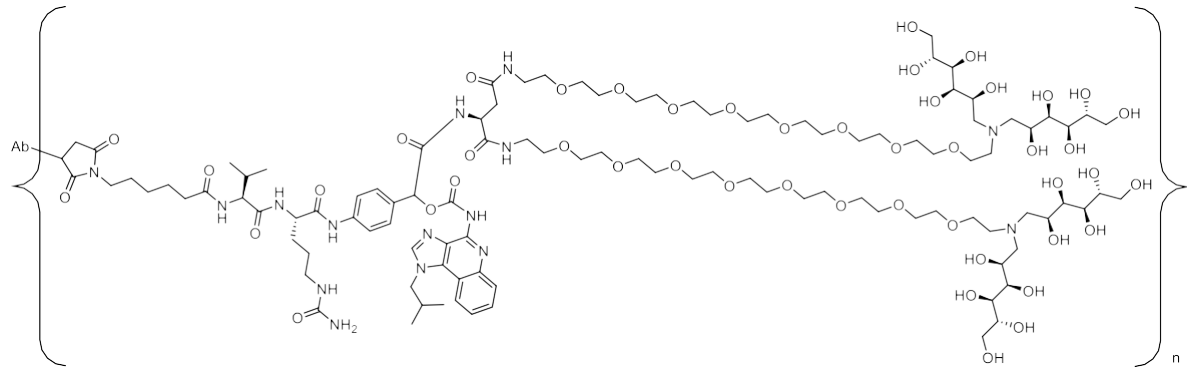
107. El conjugado de cualquiera de las reivindicaciones 102 a 106, donde el grupo de direccionamiento es bivalente.

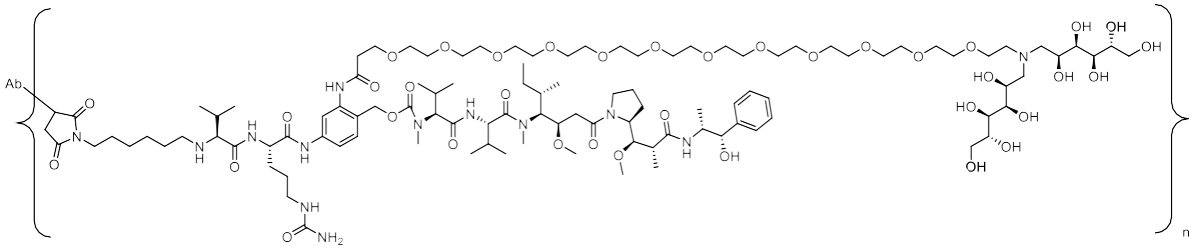
108. El conjugado de cualquiera de las reivindicaciones 102 a 105, donde el grupo de direccionamiento es biespecífico.

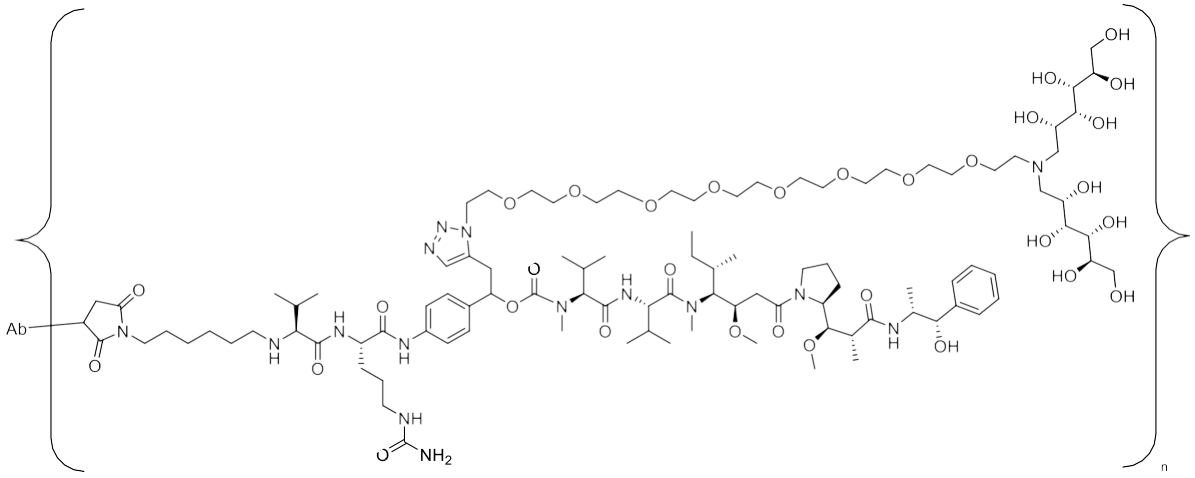
109. El conjugado de cualquiera de las reivindicaciones 102 a 108, donde la carga promedio de fármaco (p^{load}) del conjugado es entre aproximadamente 1 y aproximadamente 8, aproximadamente 2, aproximadamente 4, aproximadamente 6, aproximadamente 8, aproximadamente 10, aproximadamente 12, aproximadamente 14, aproximadamente 16,

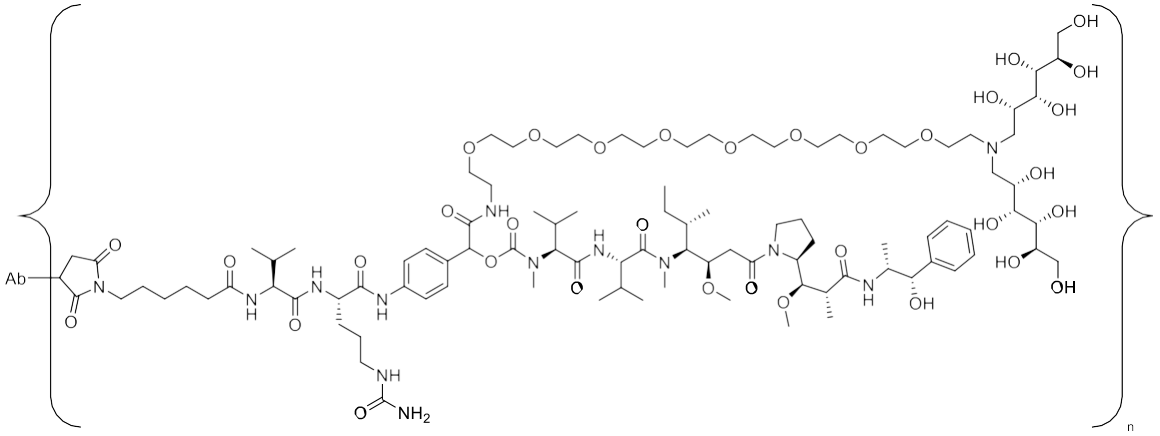
aproximadamente 3 a aproximadamente 5, aproximadamente 6 a aproximadamente 8, o entre aproximadamente 8 y aproximadamente 16.

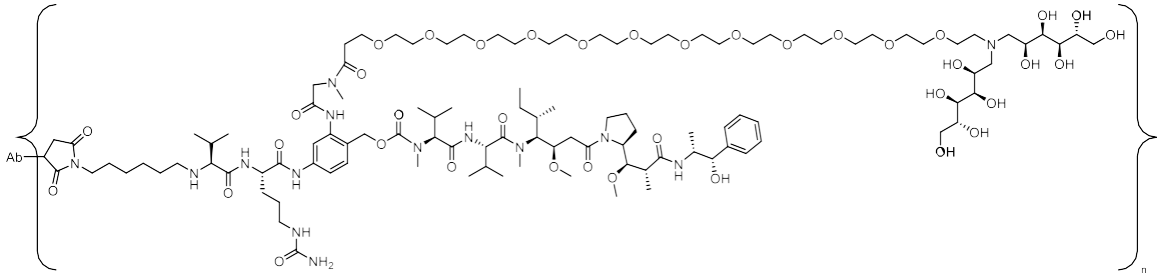
110. El conjugado de cualquiera de las reivindicaciones 102-109, seleccionado entre los siguientes:

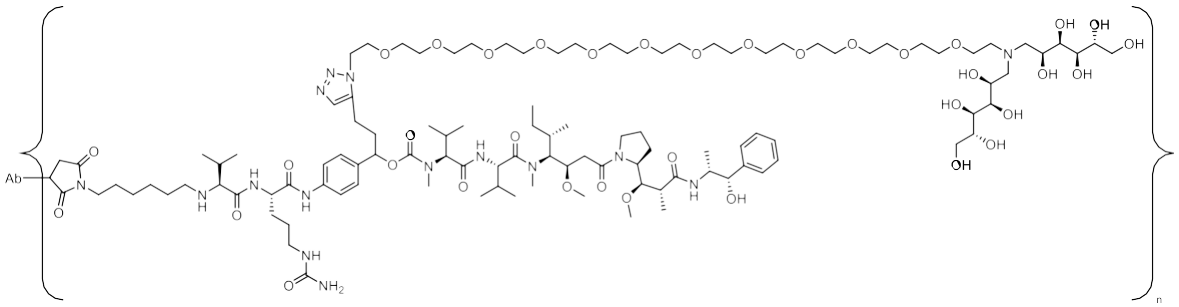


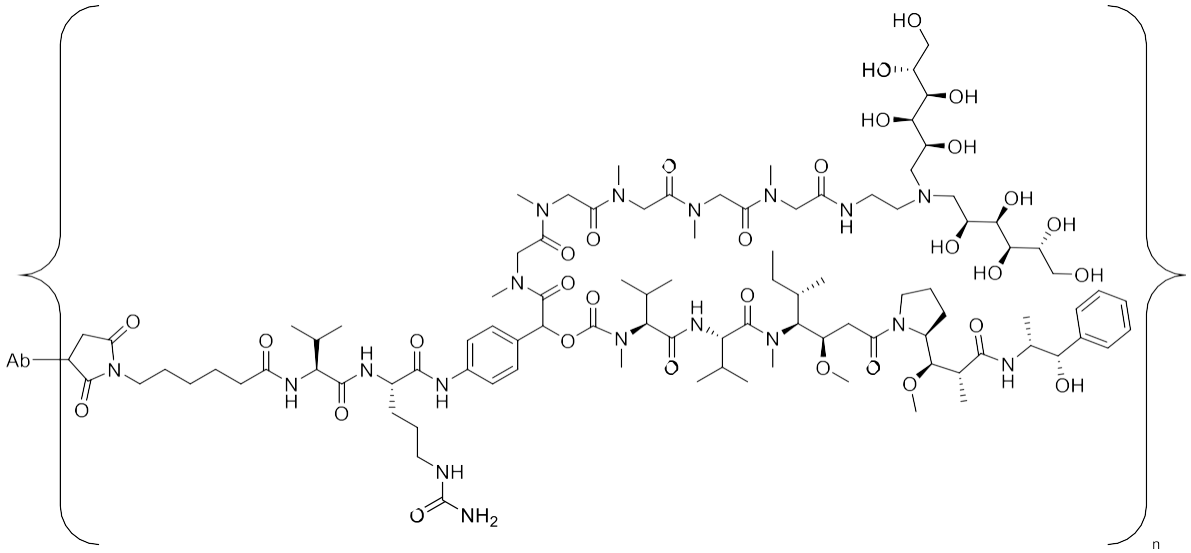


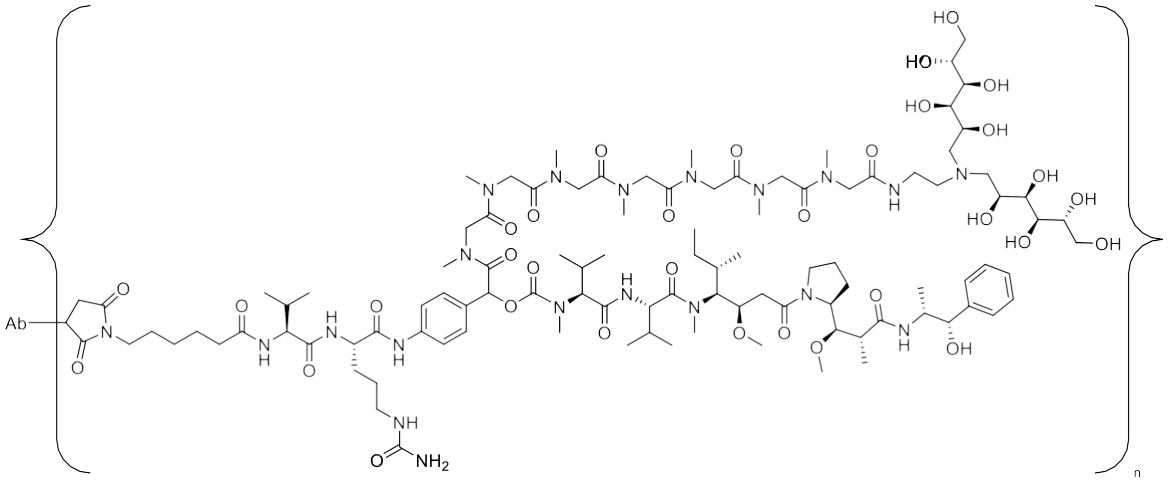


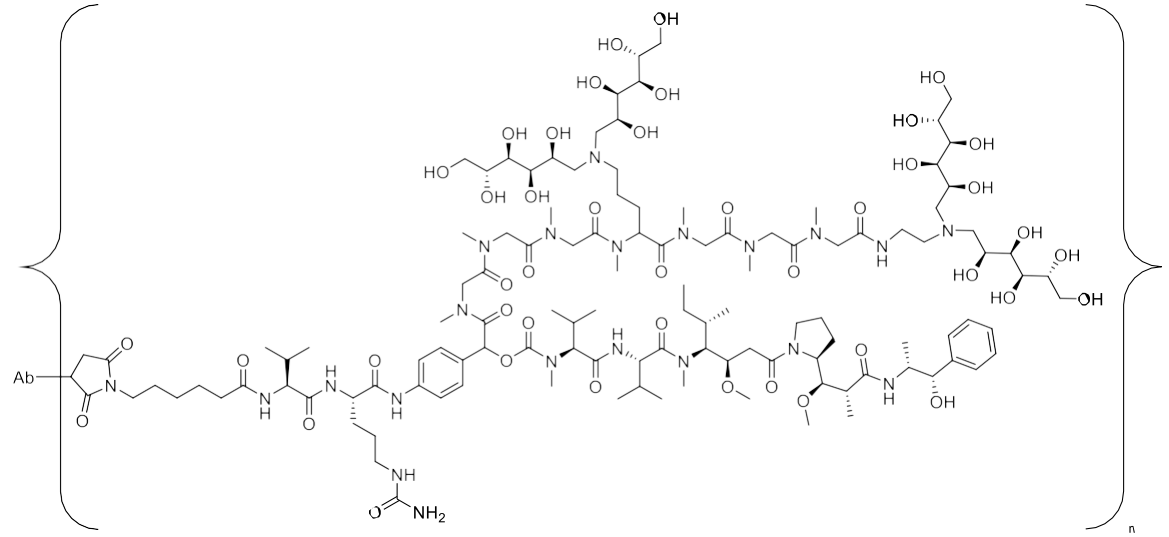


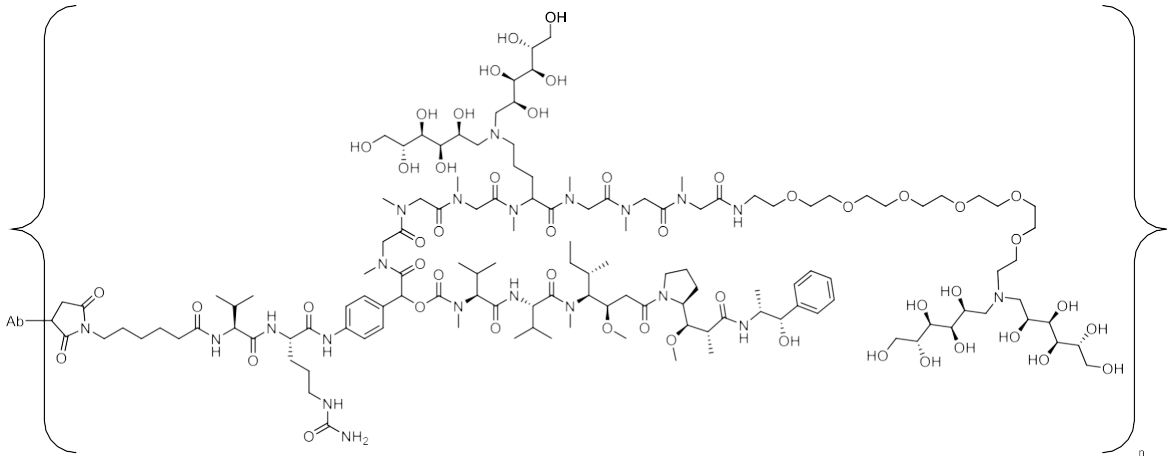


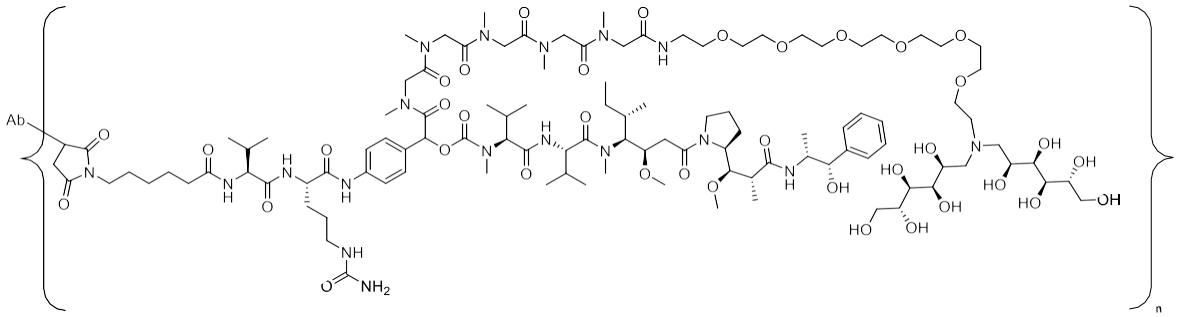


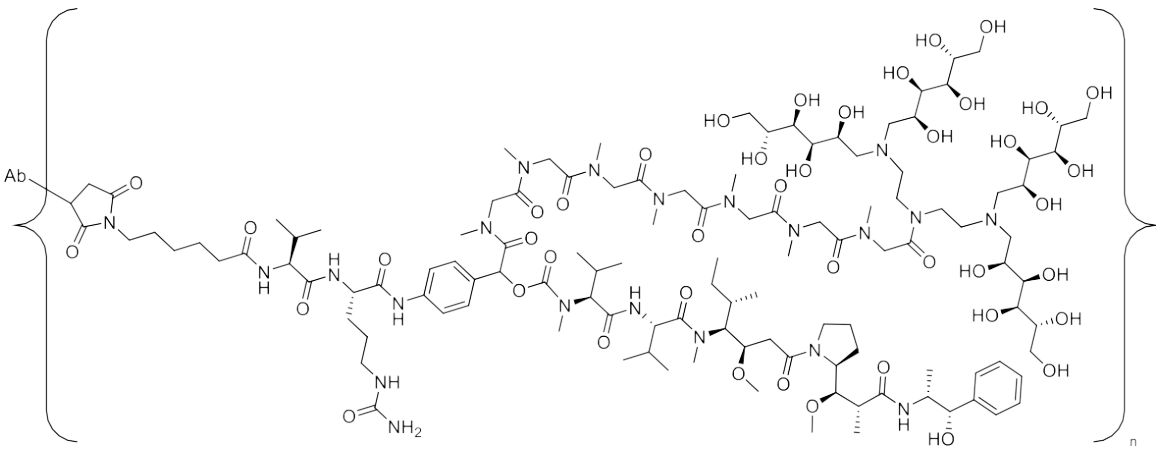


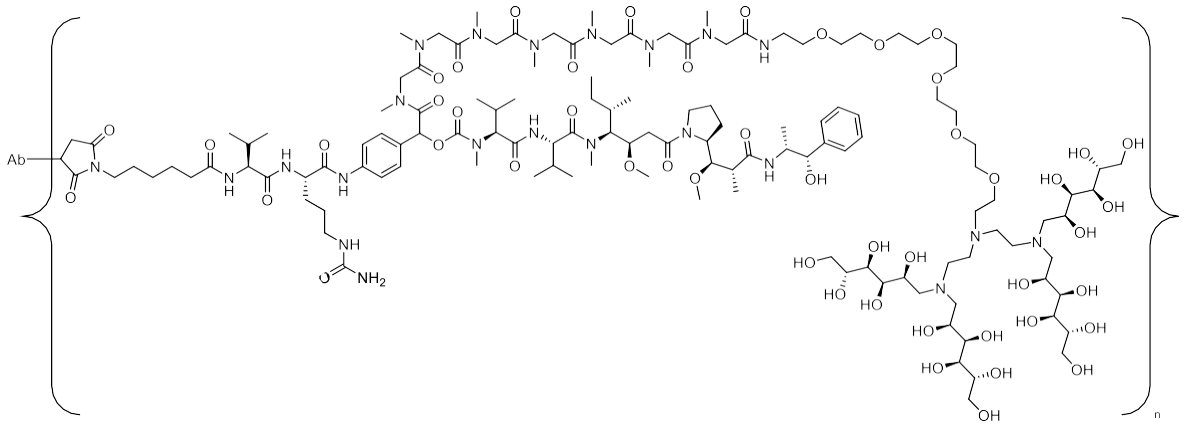


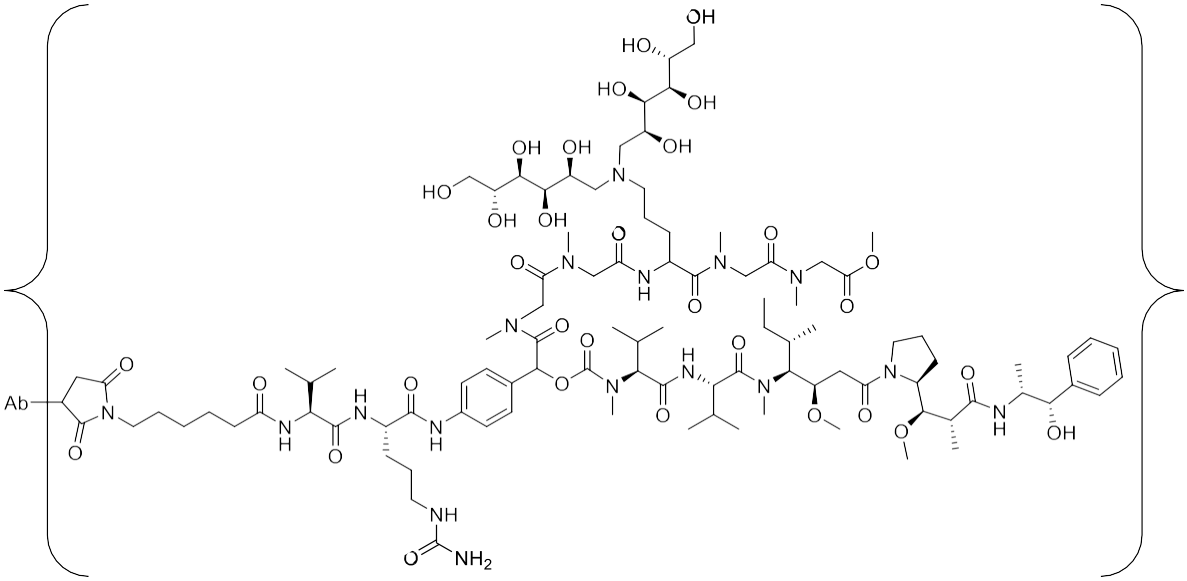


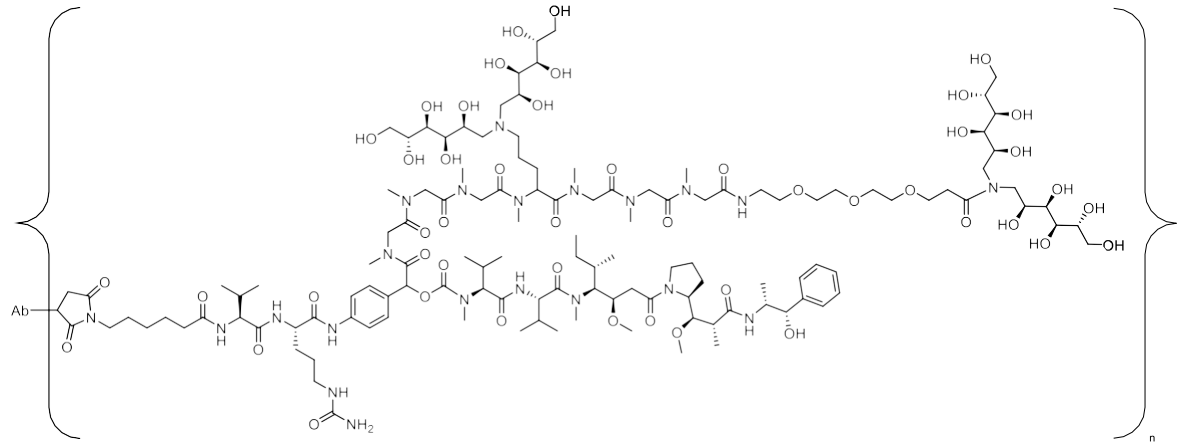


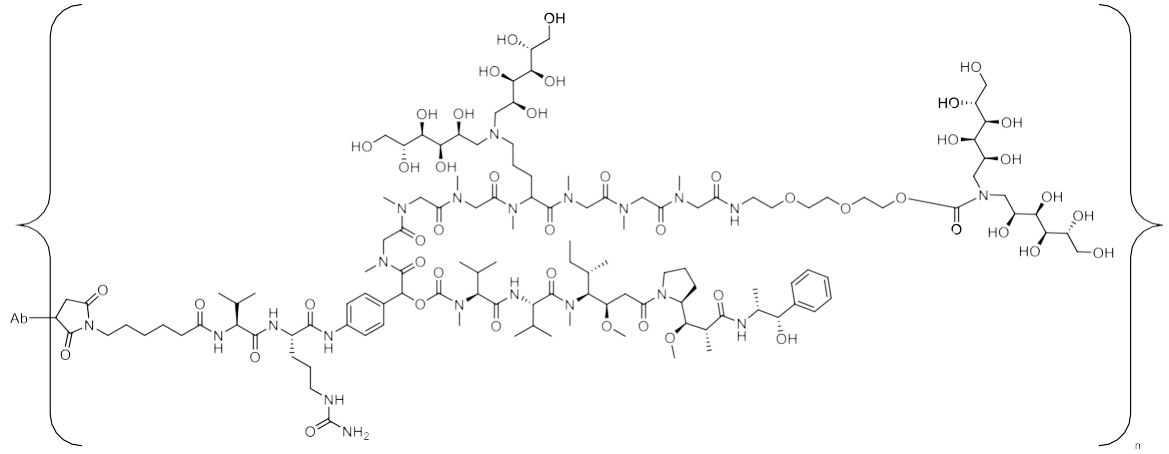


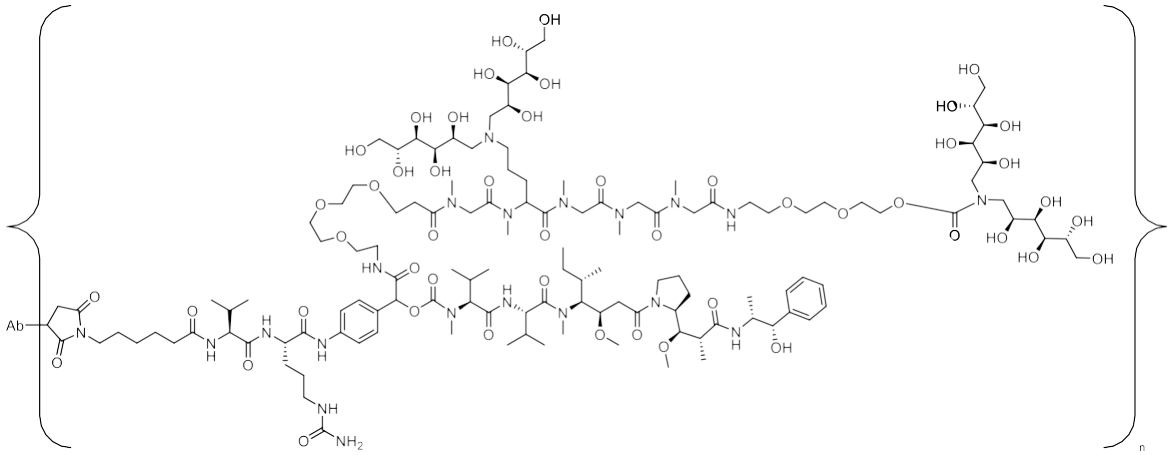


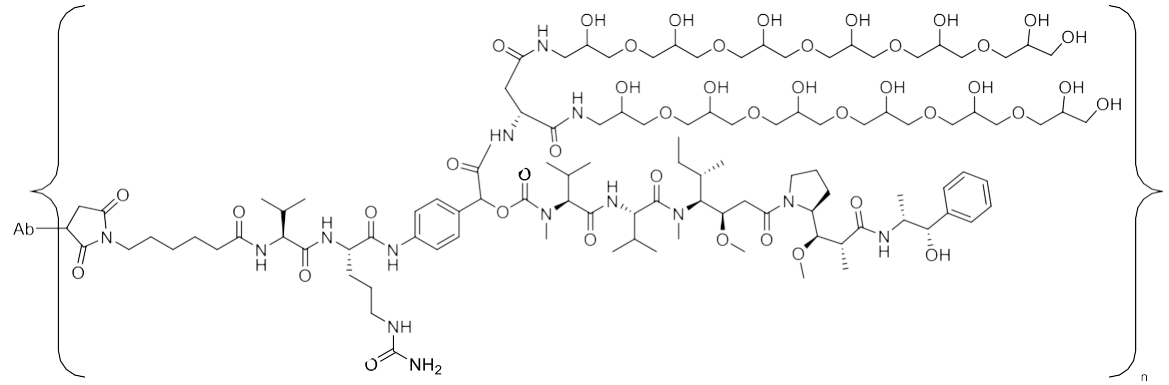


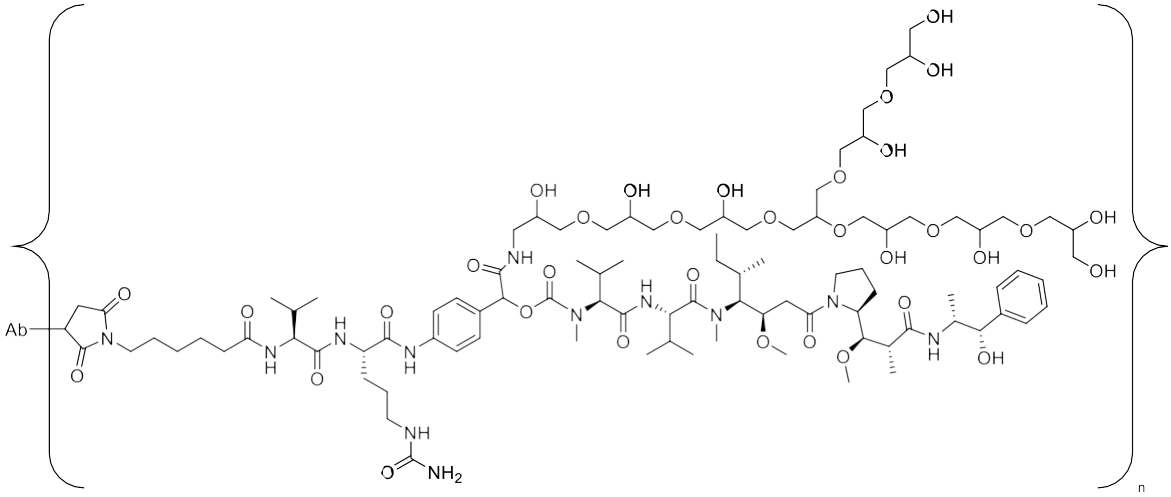


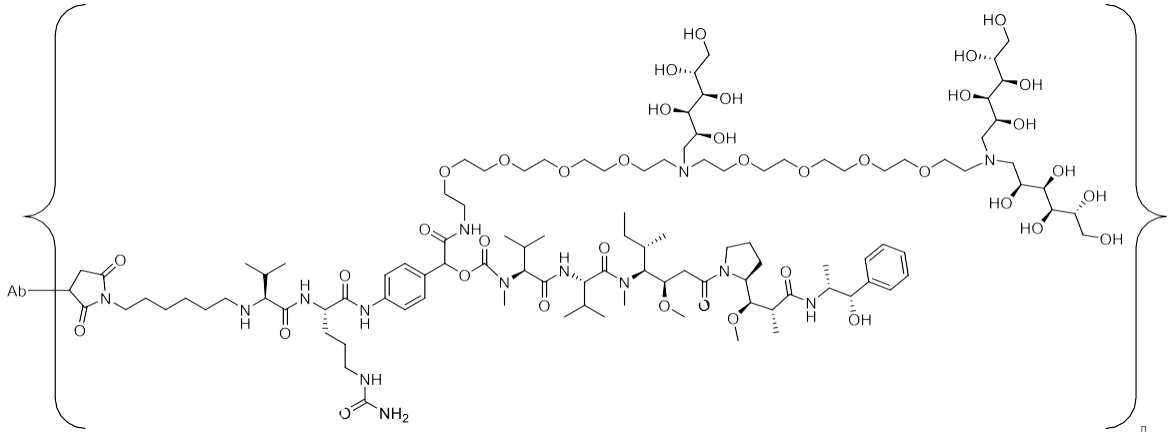


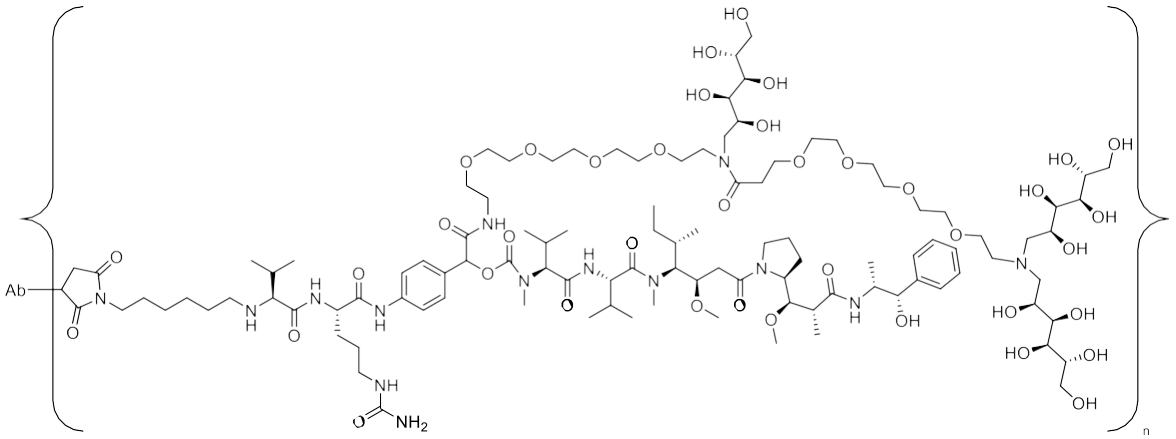


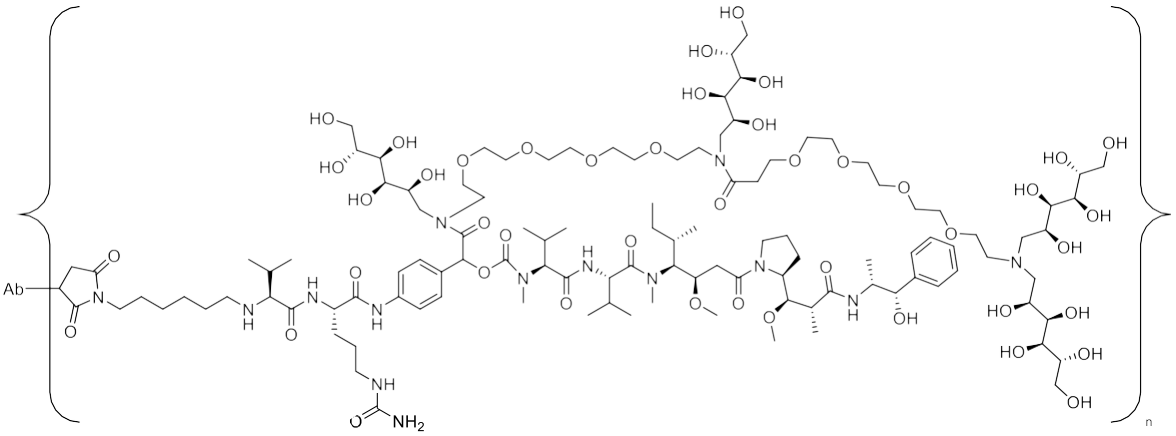


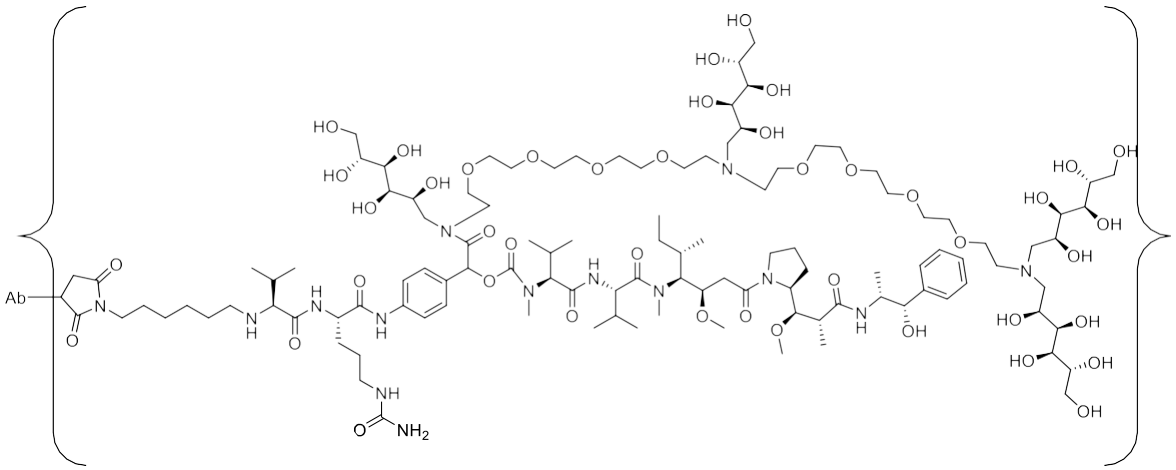


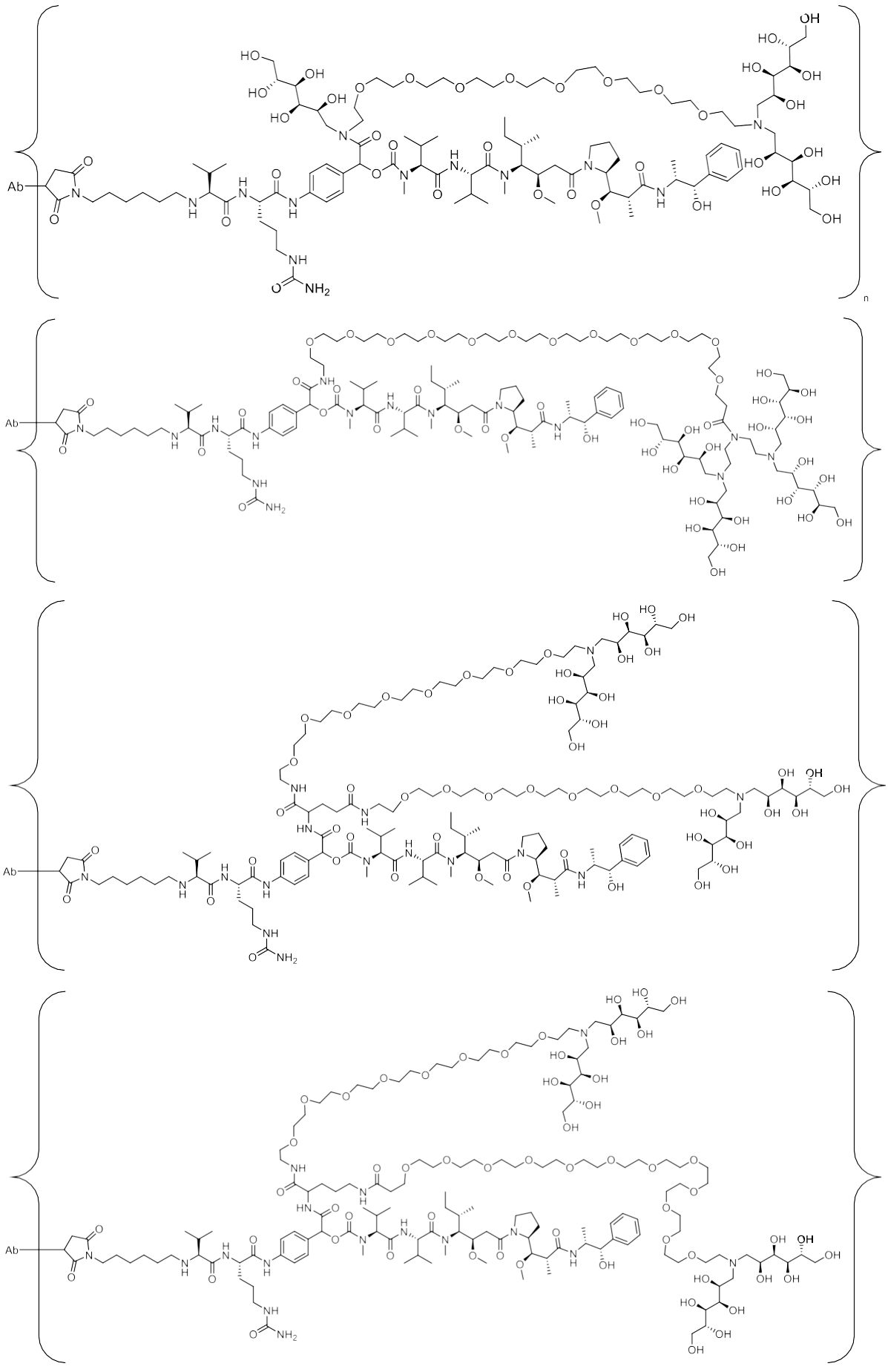


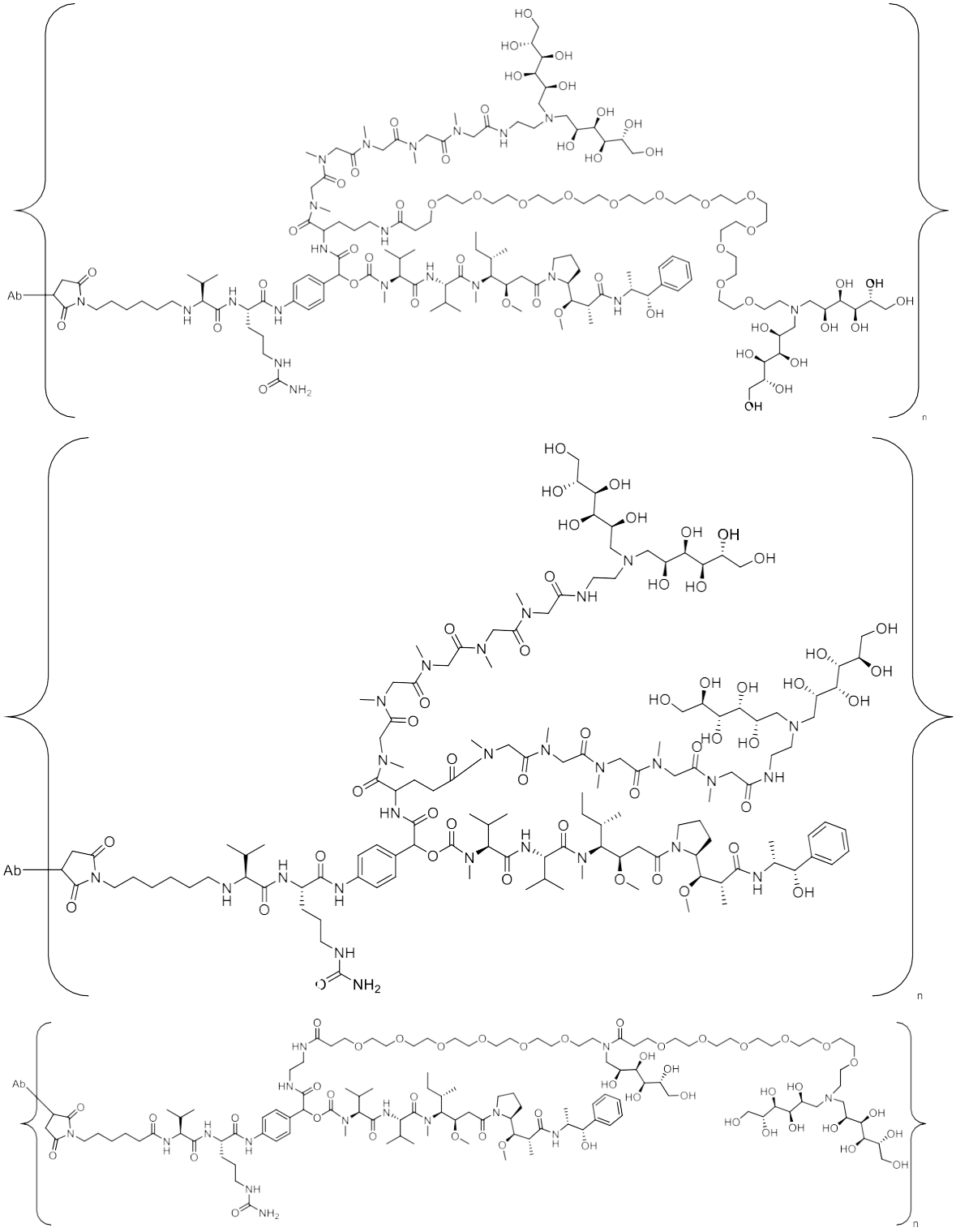


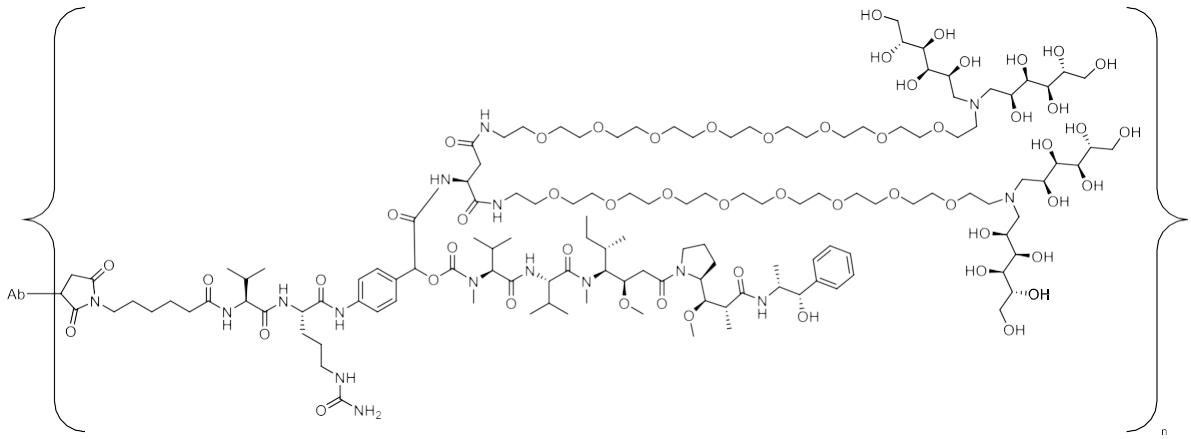


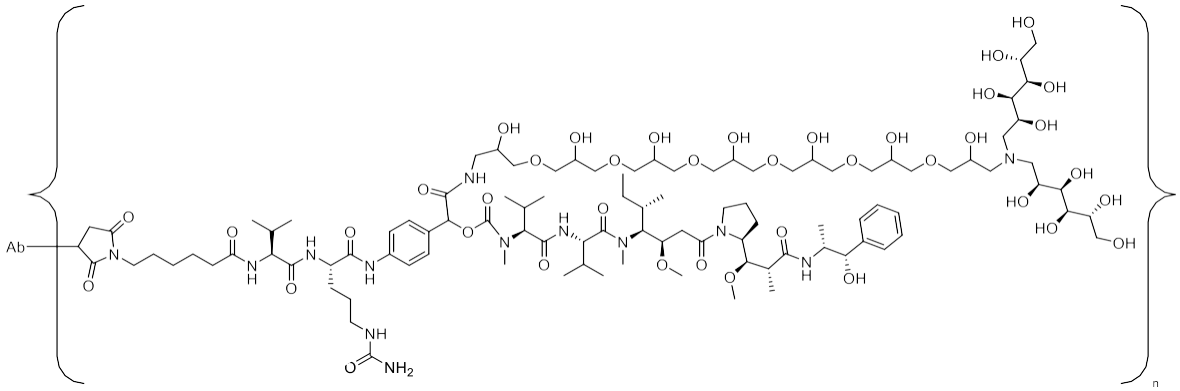


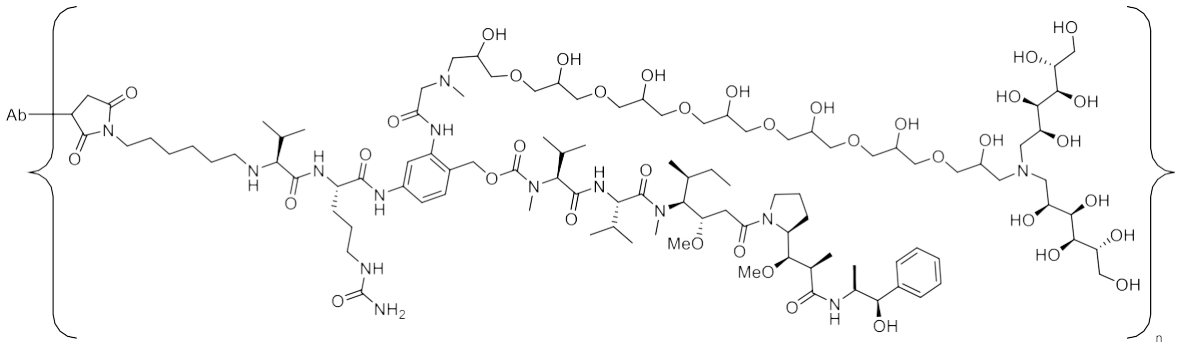


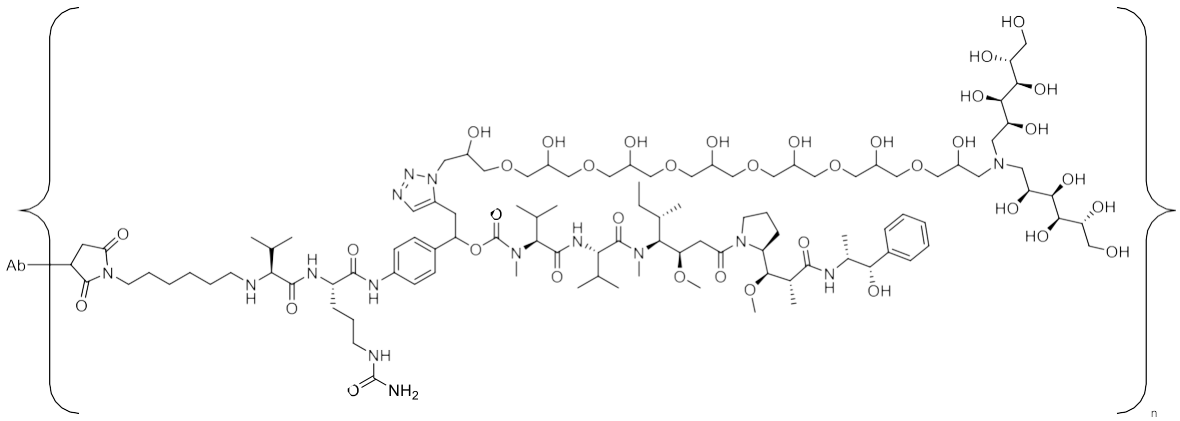


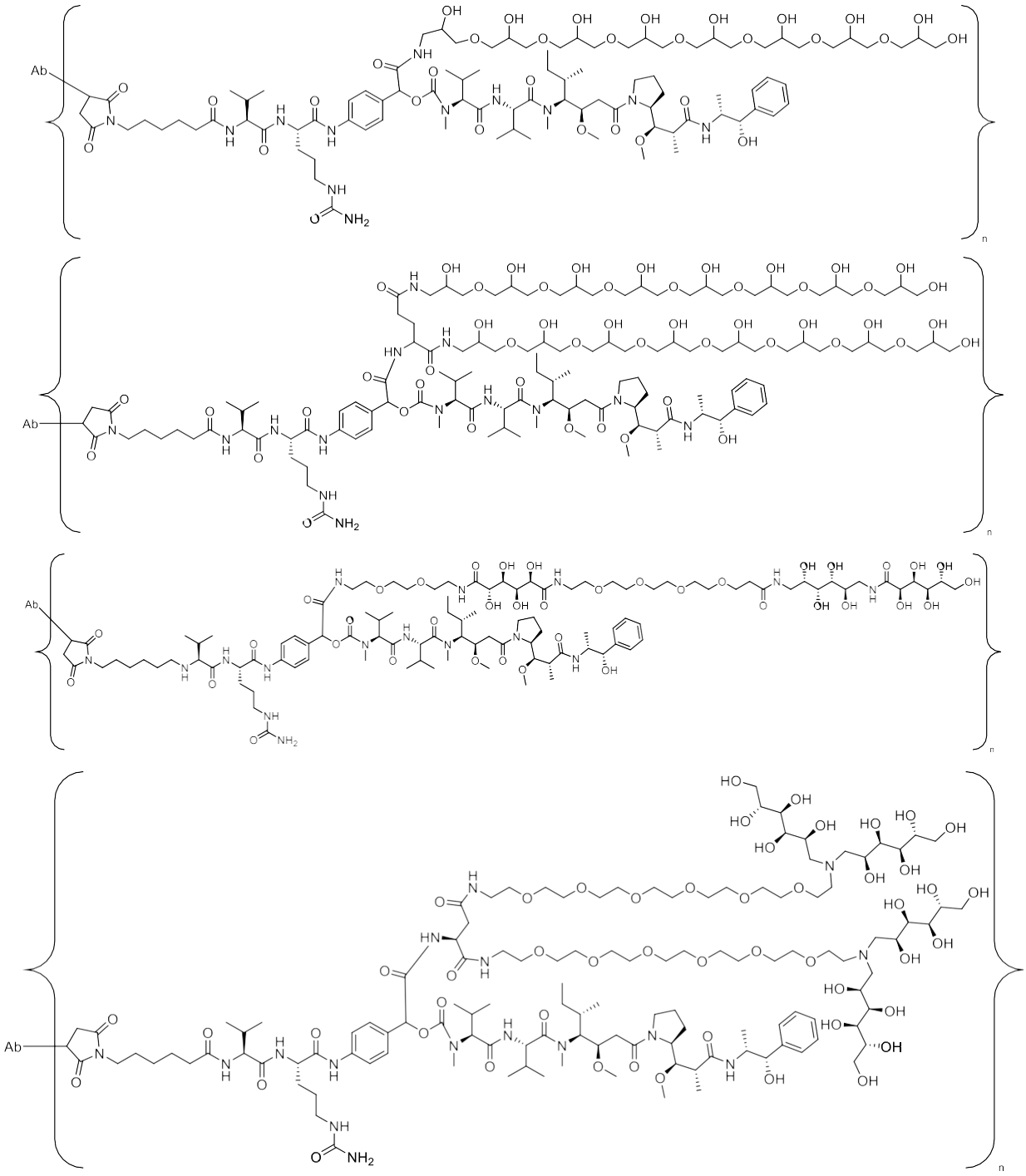


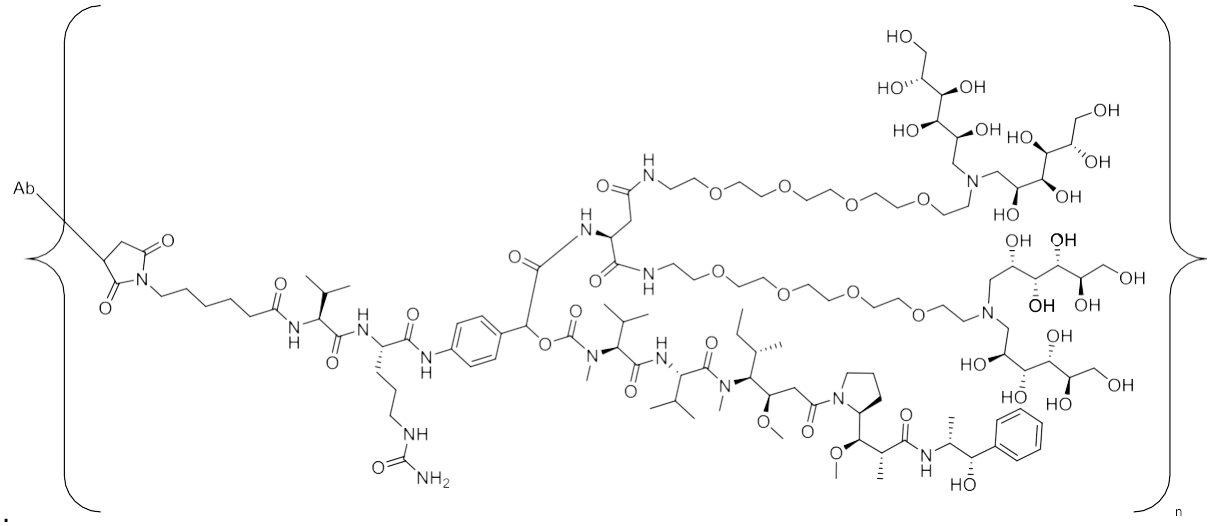


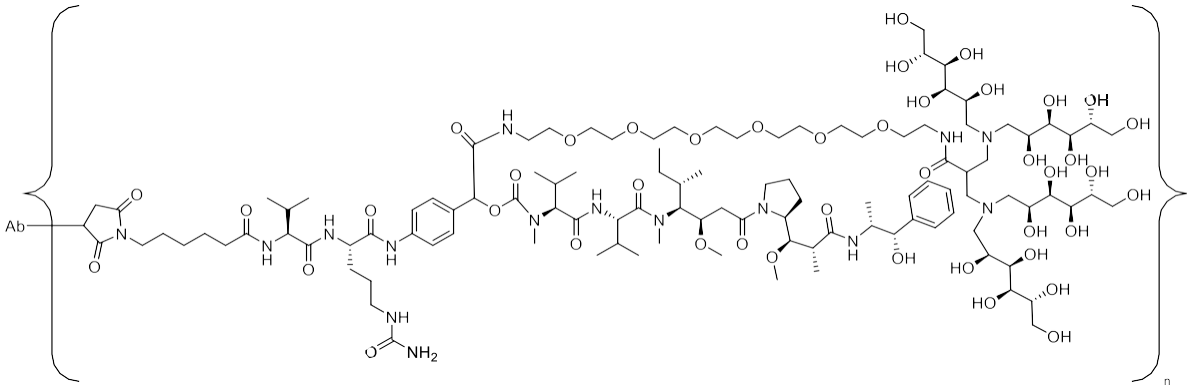


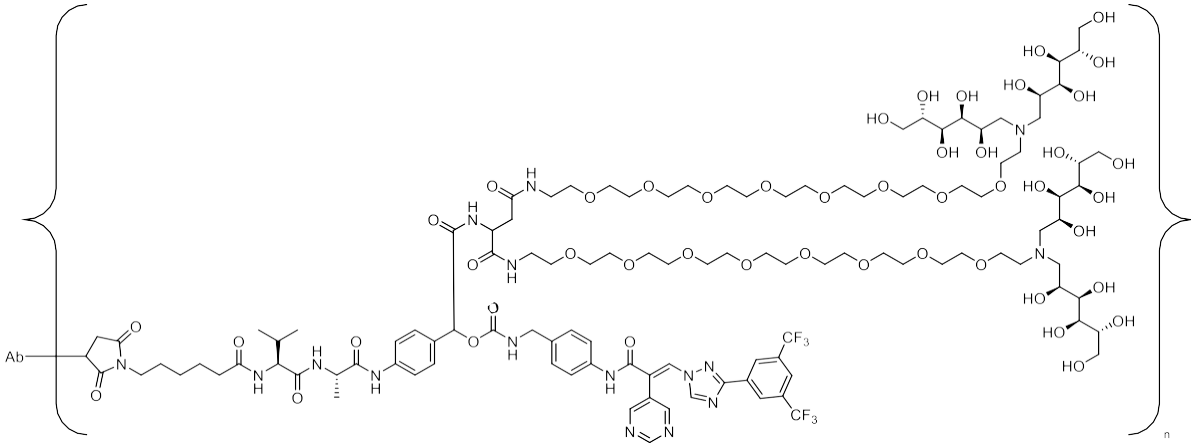


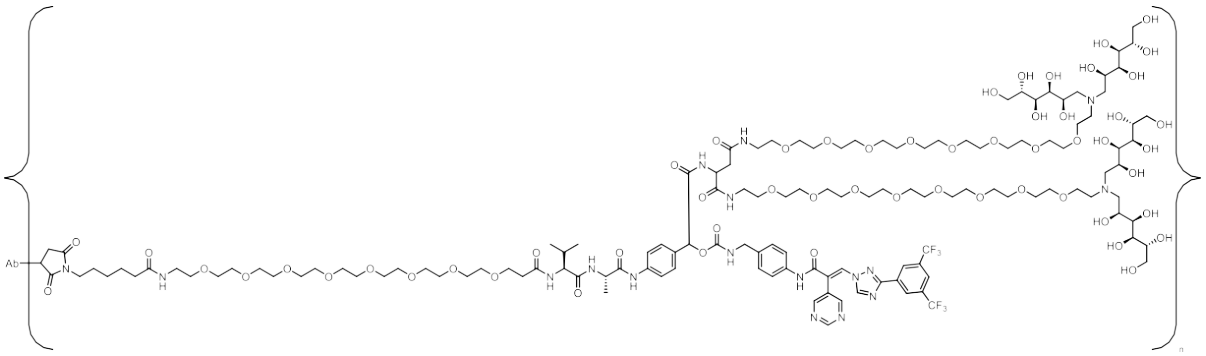


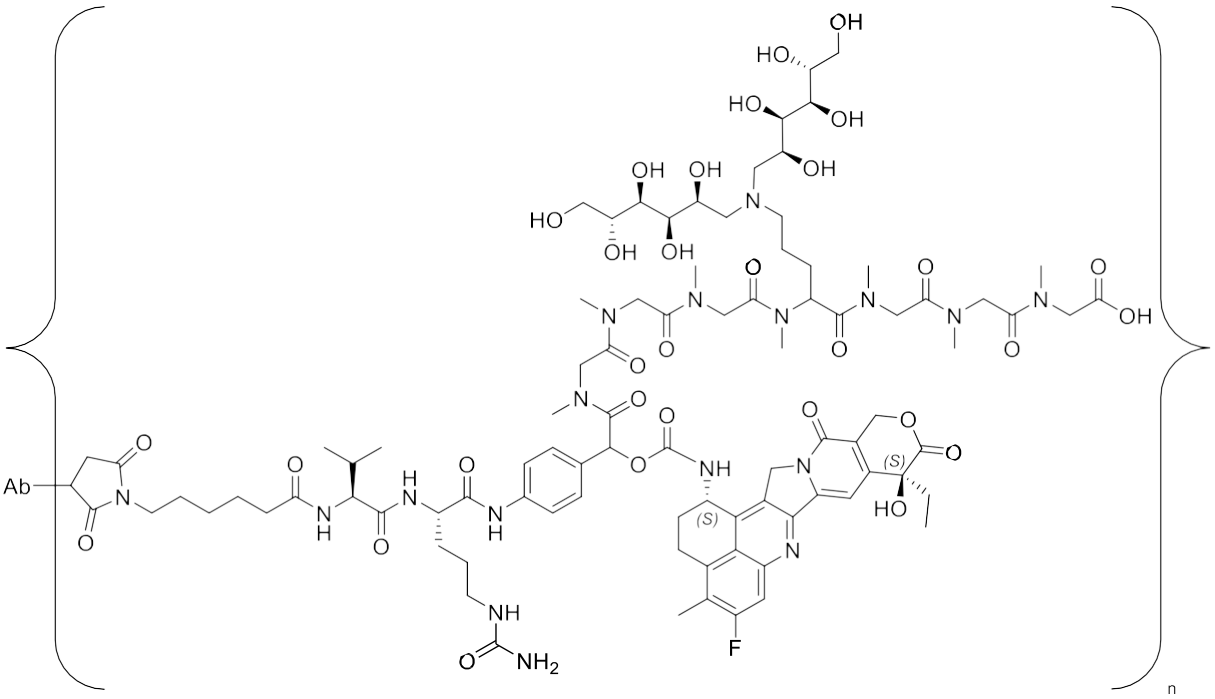


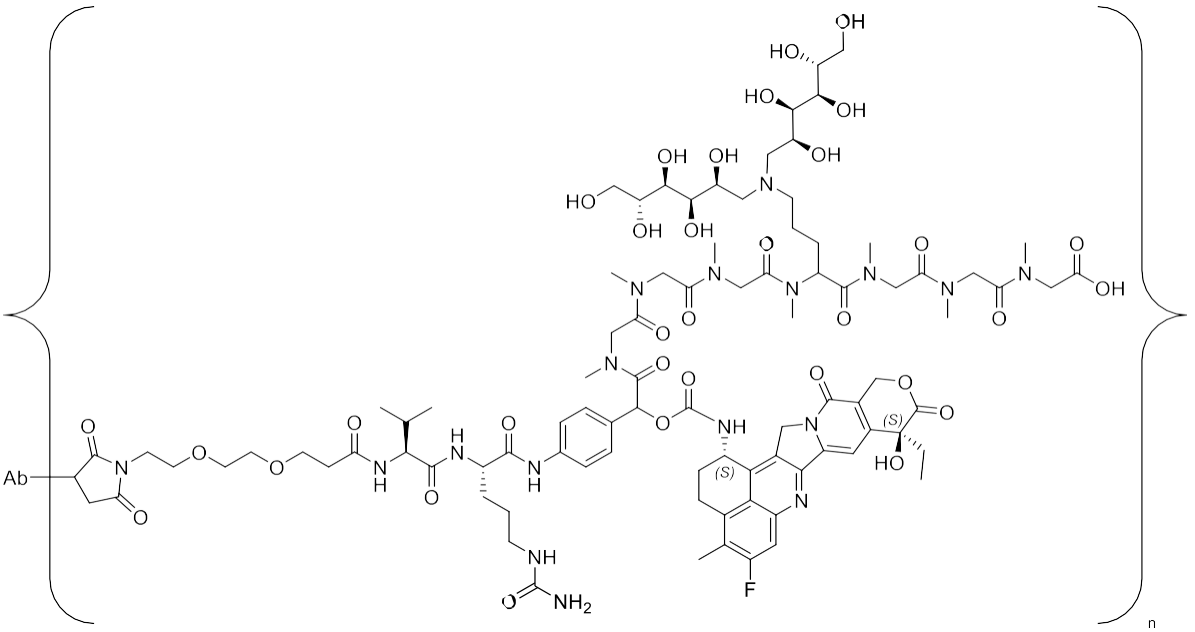


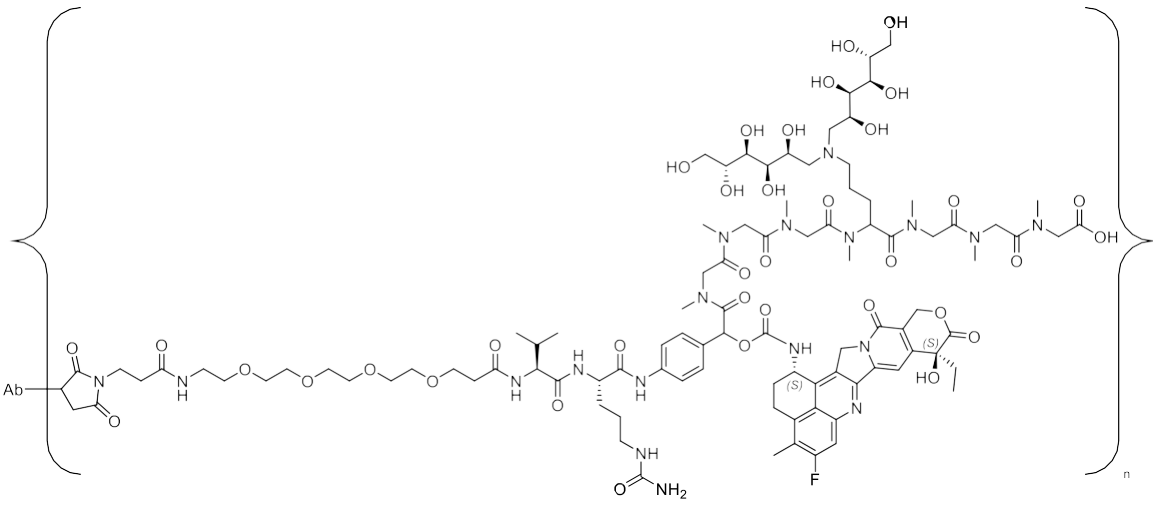


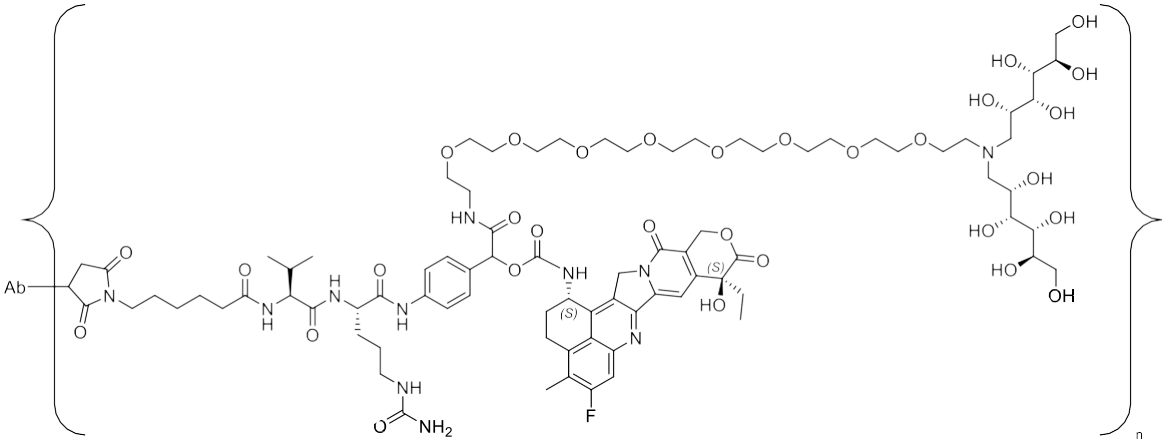


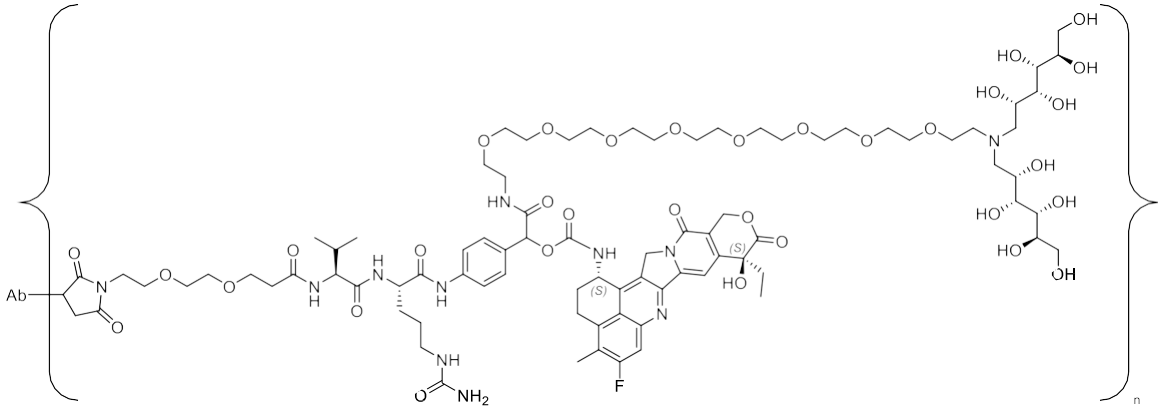


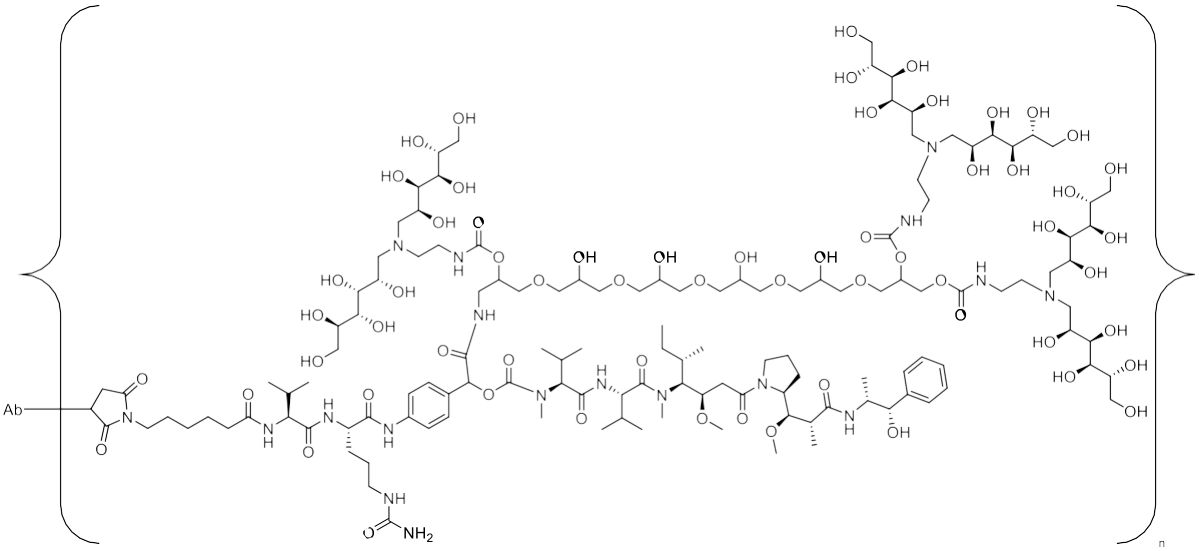


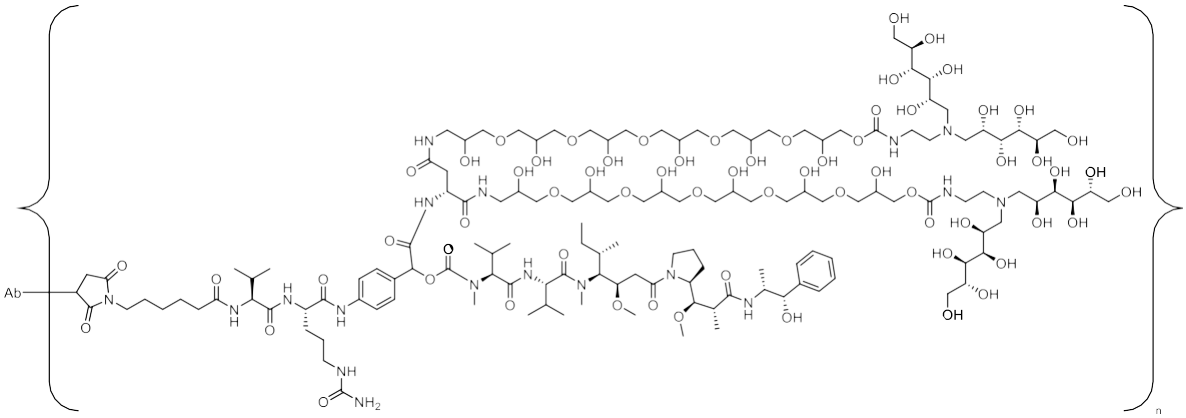


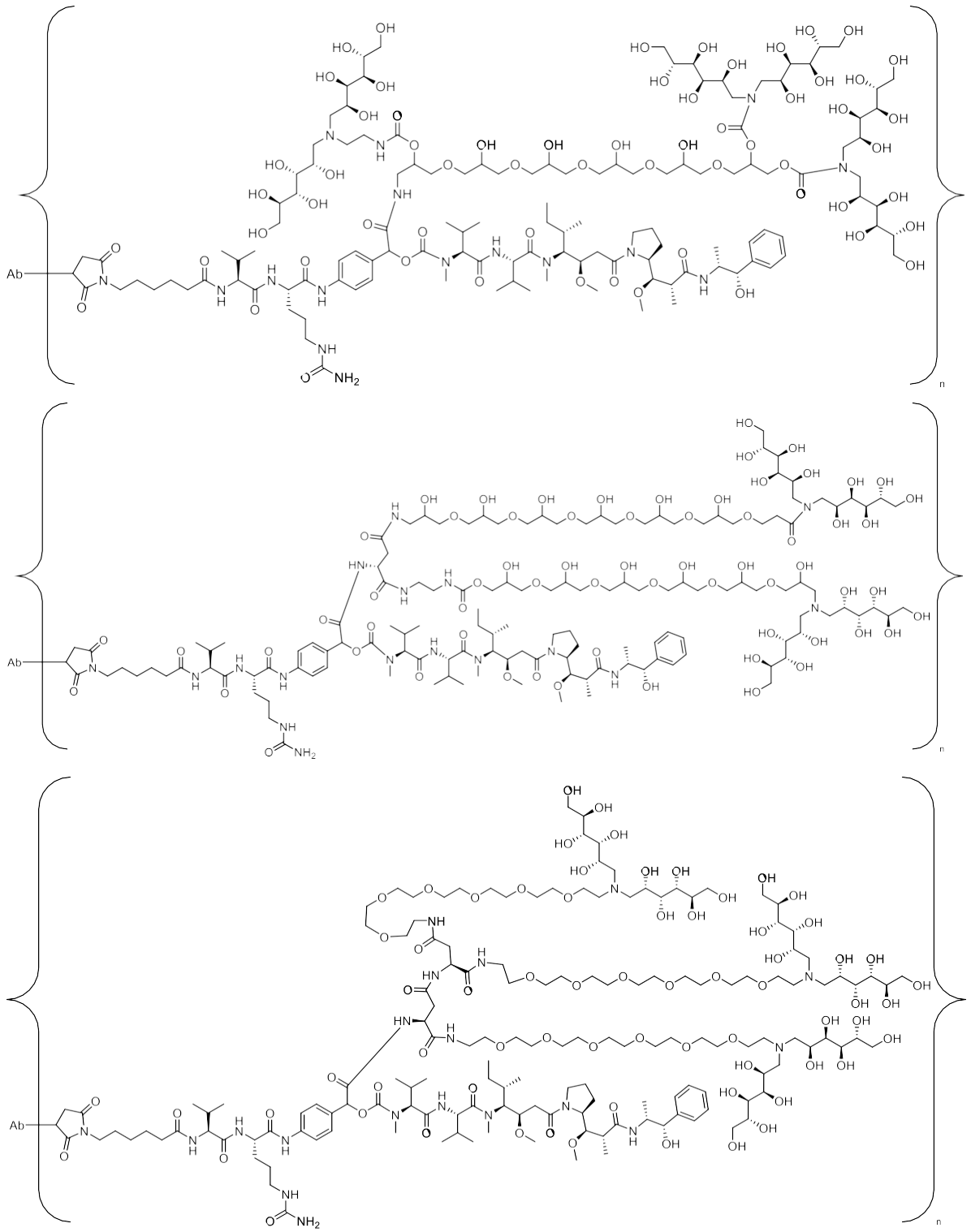


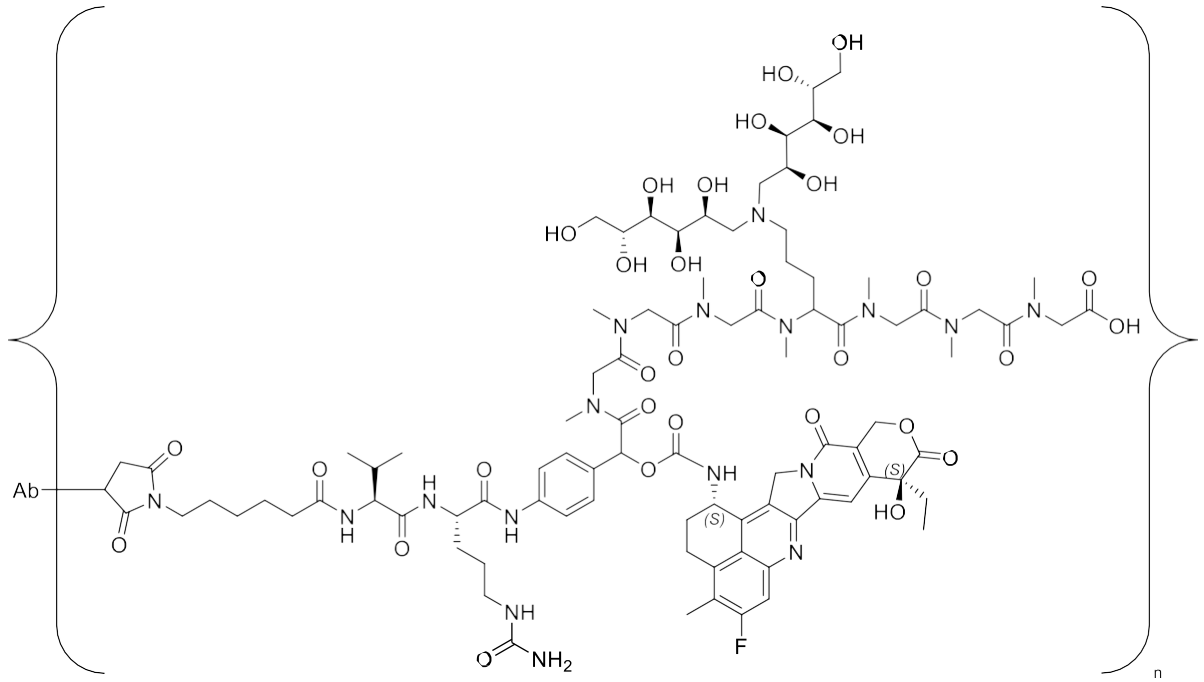


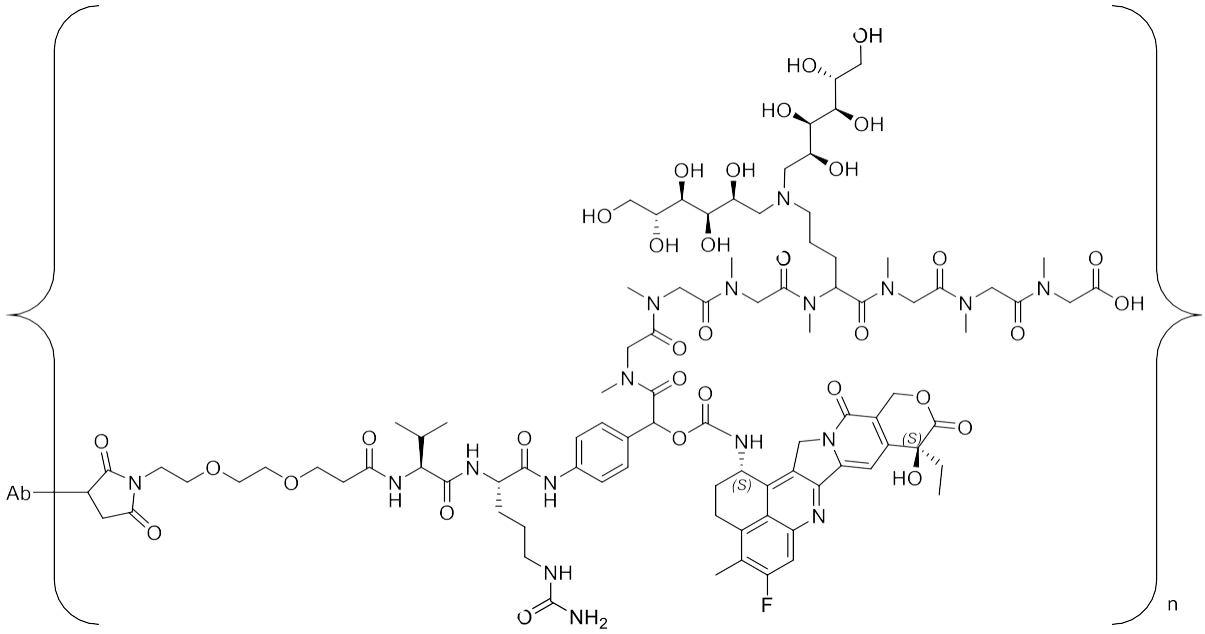


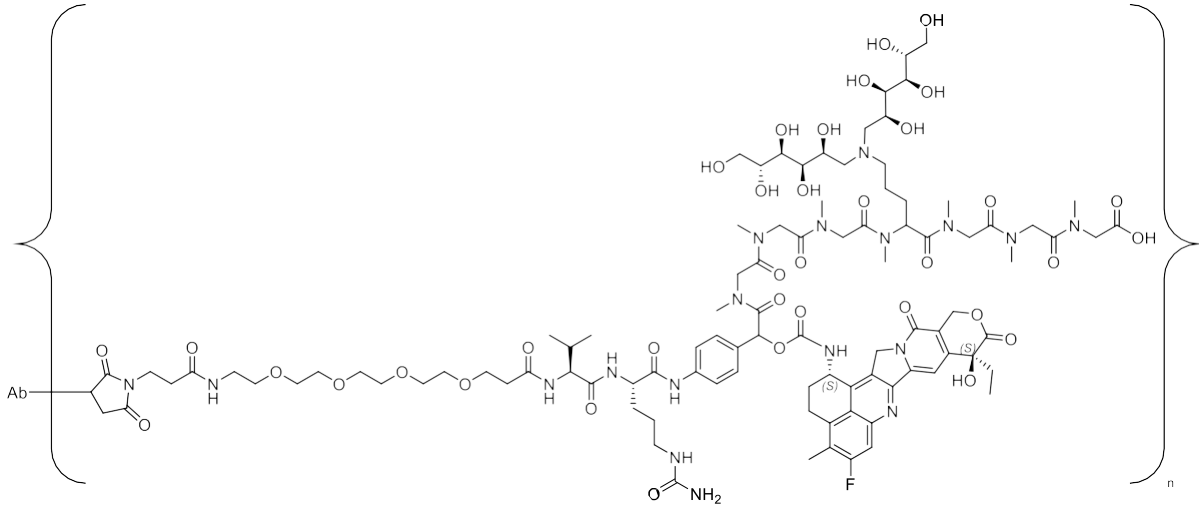


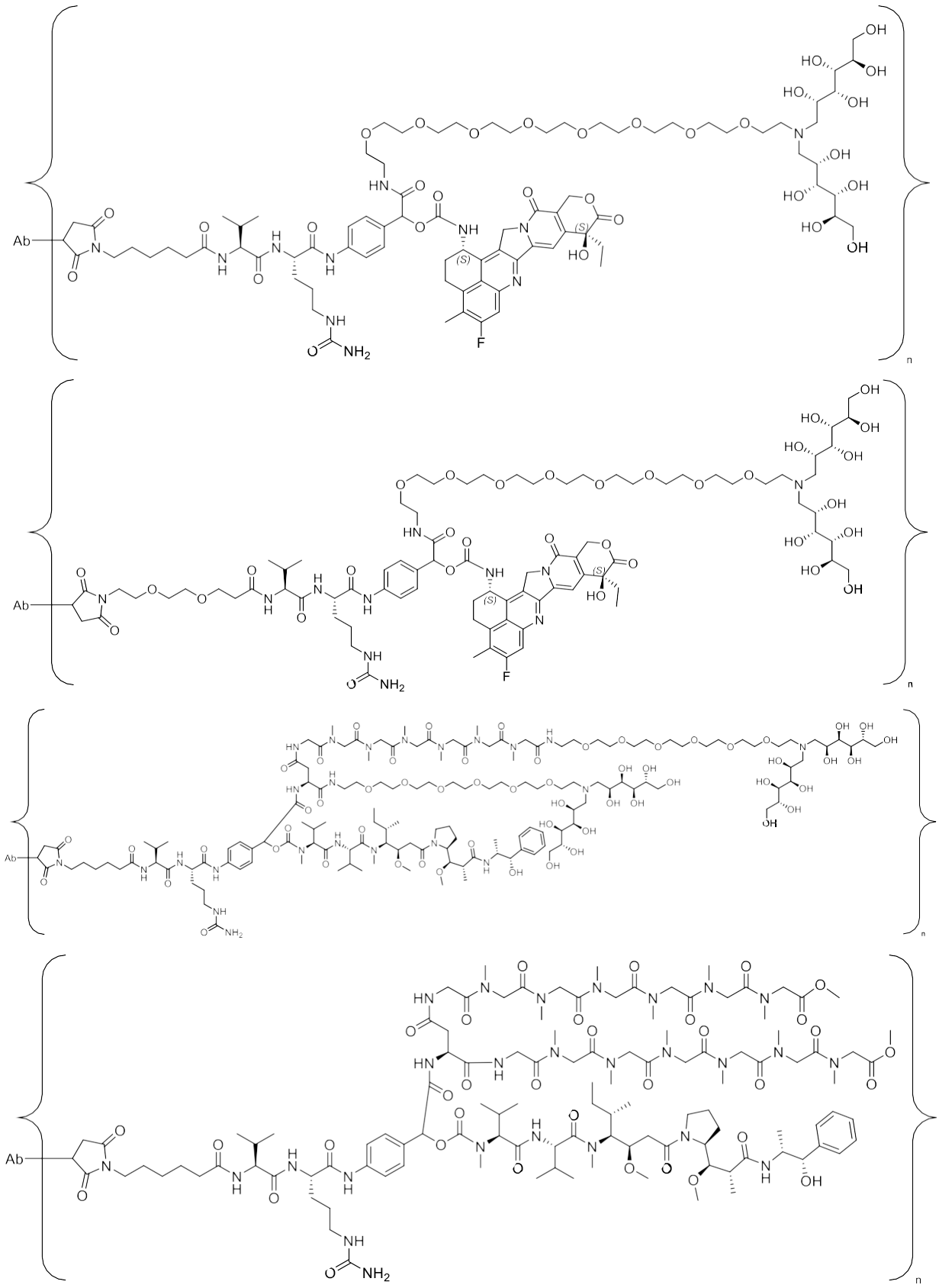


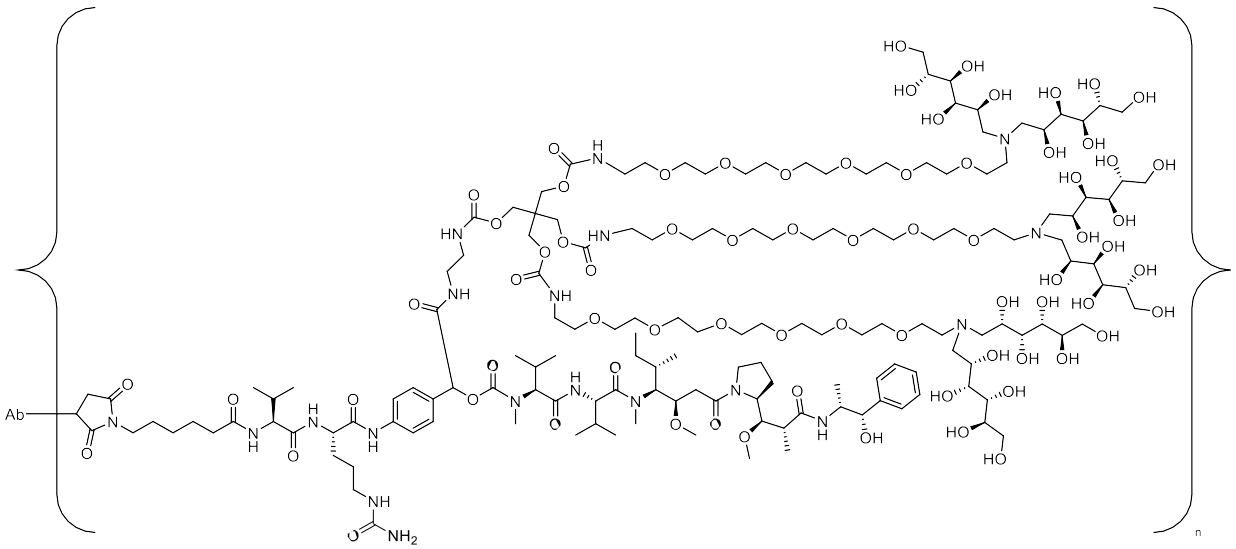


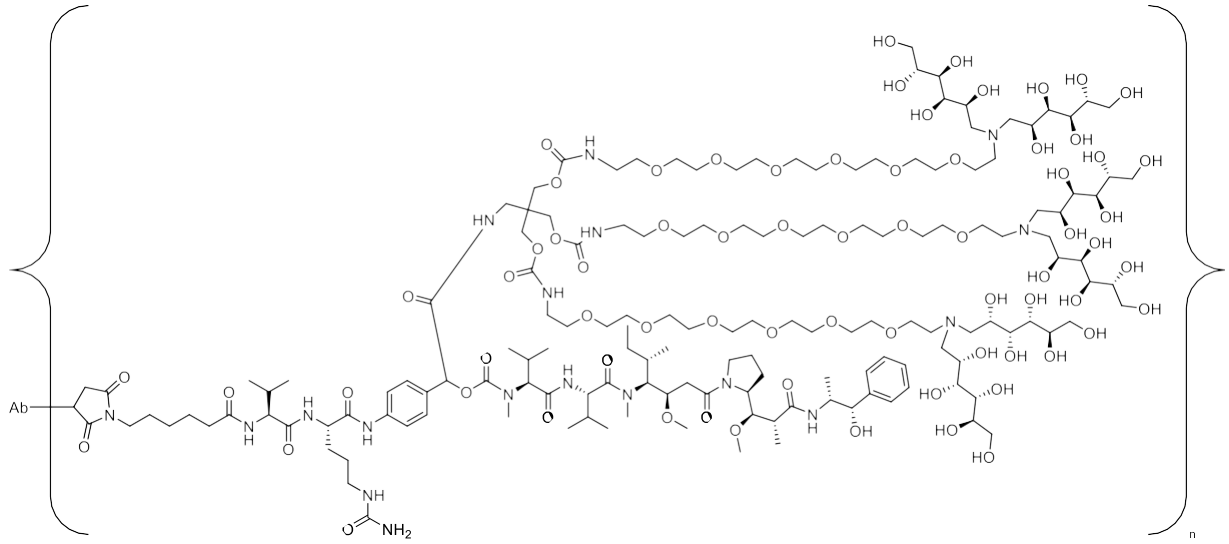


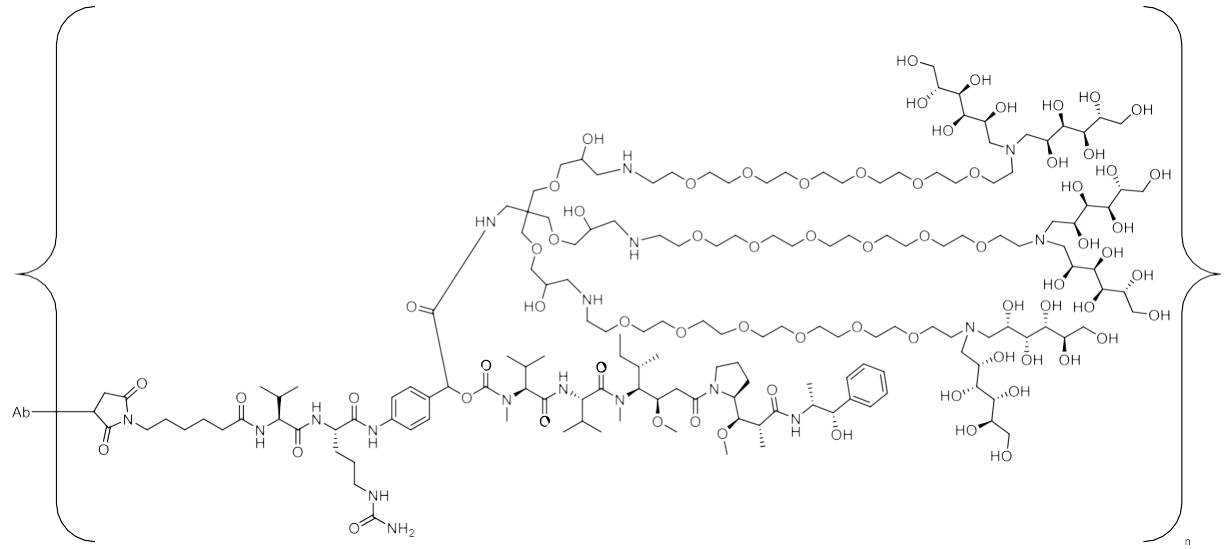


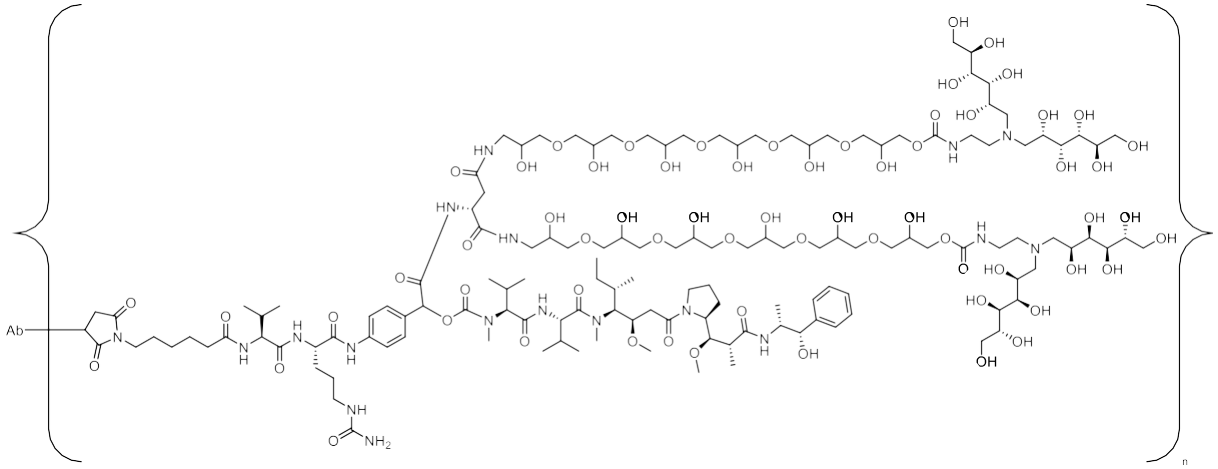


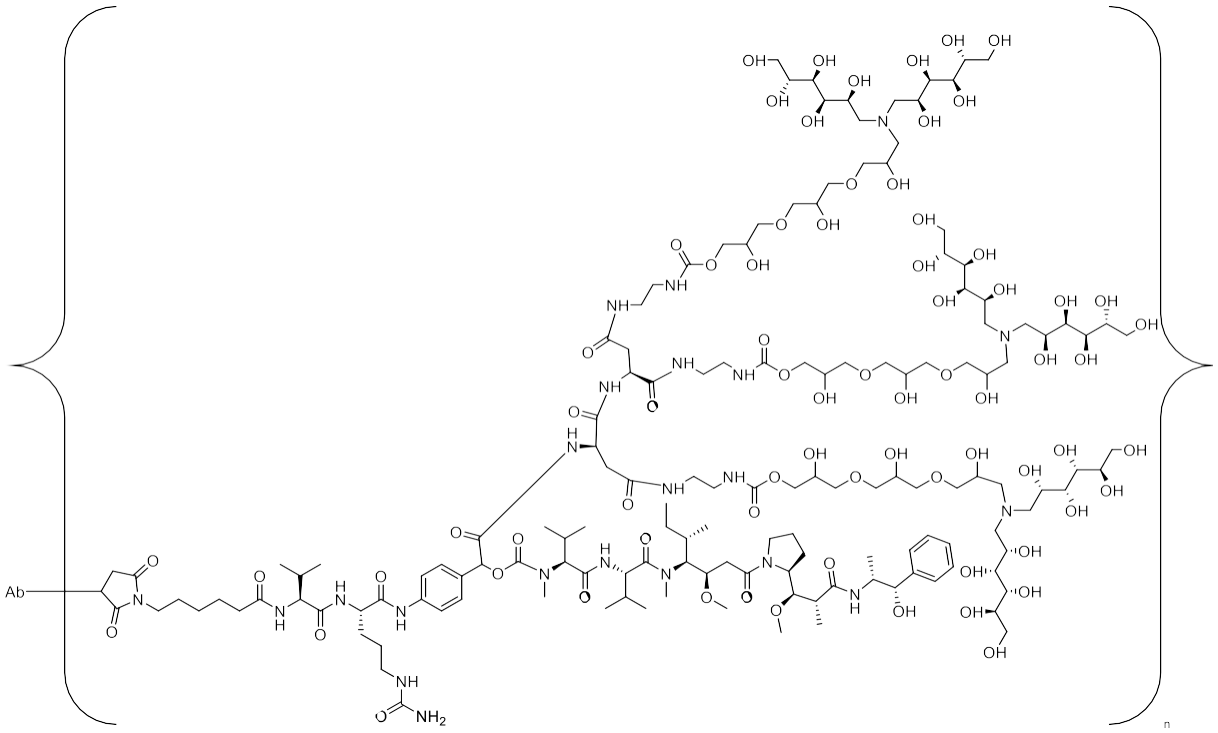


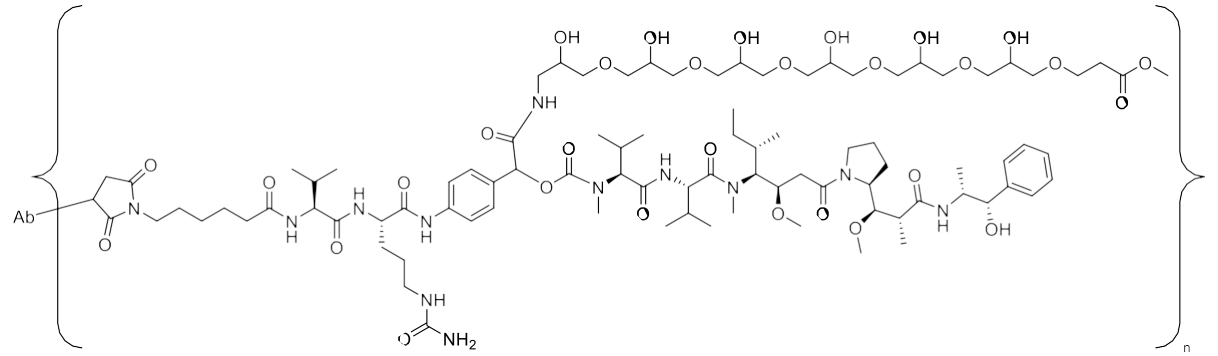


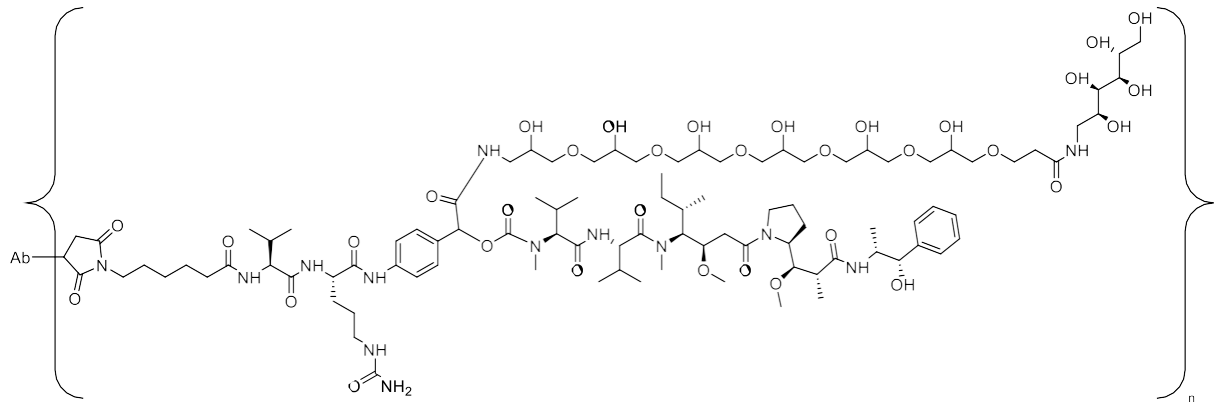


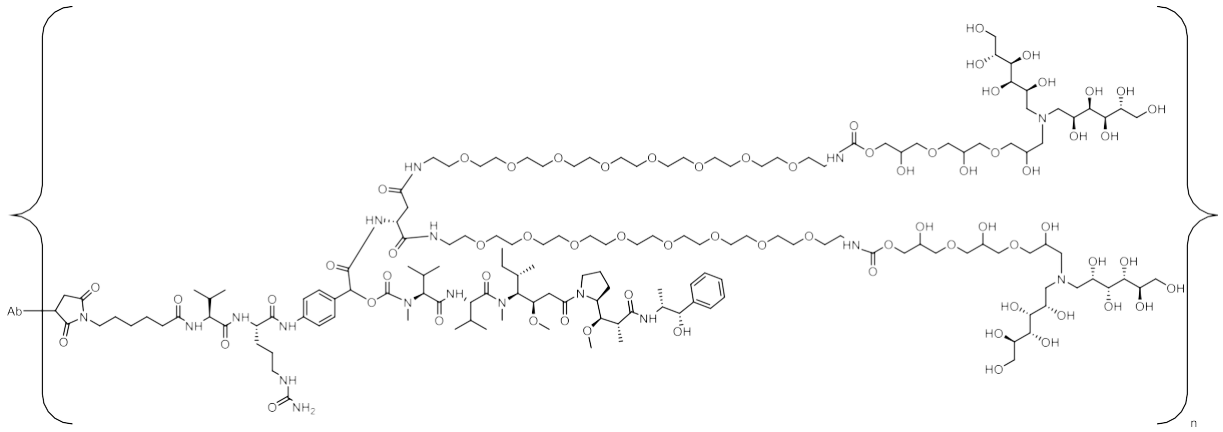


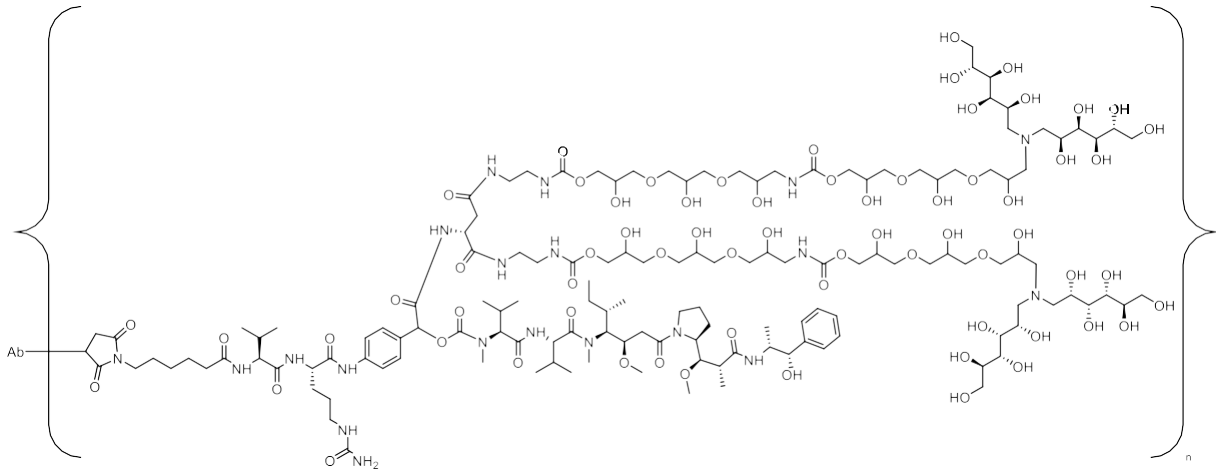


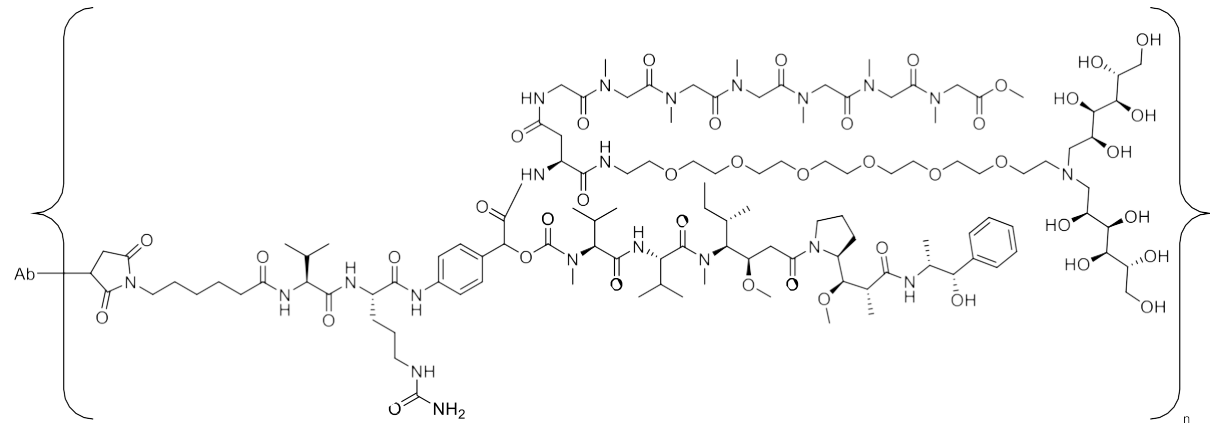


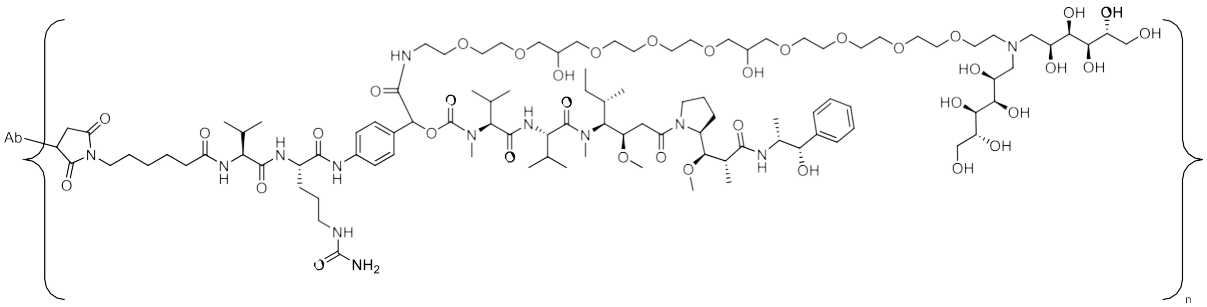


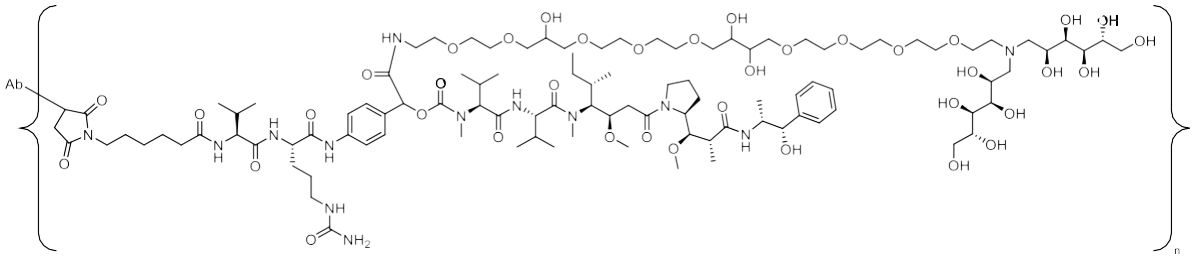


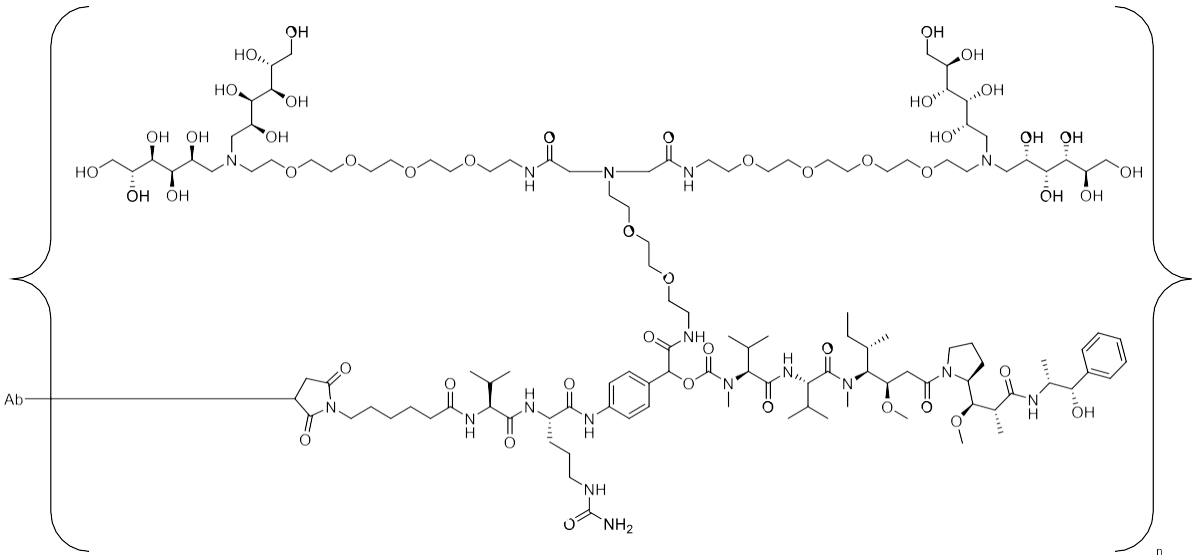


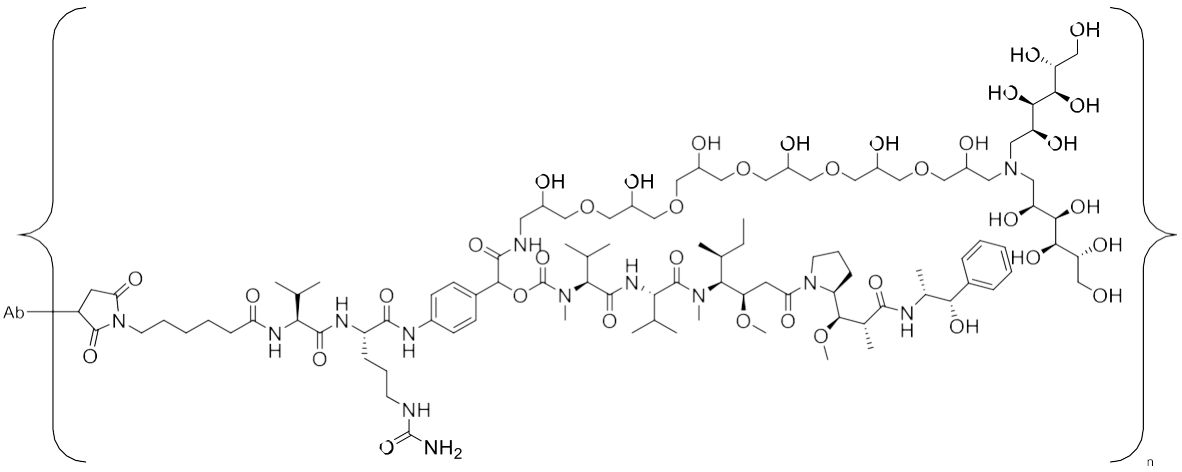


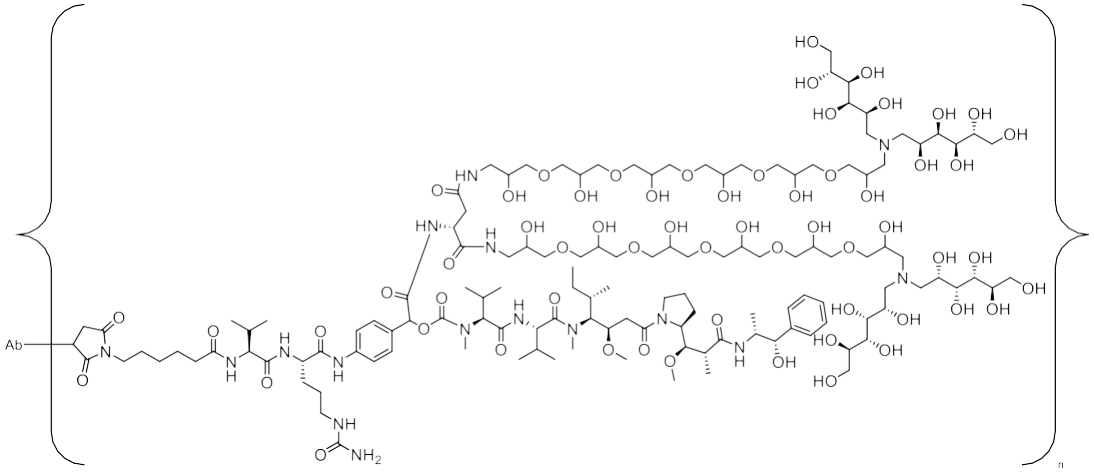


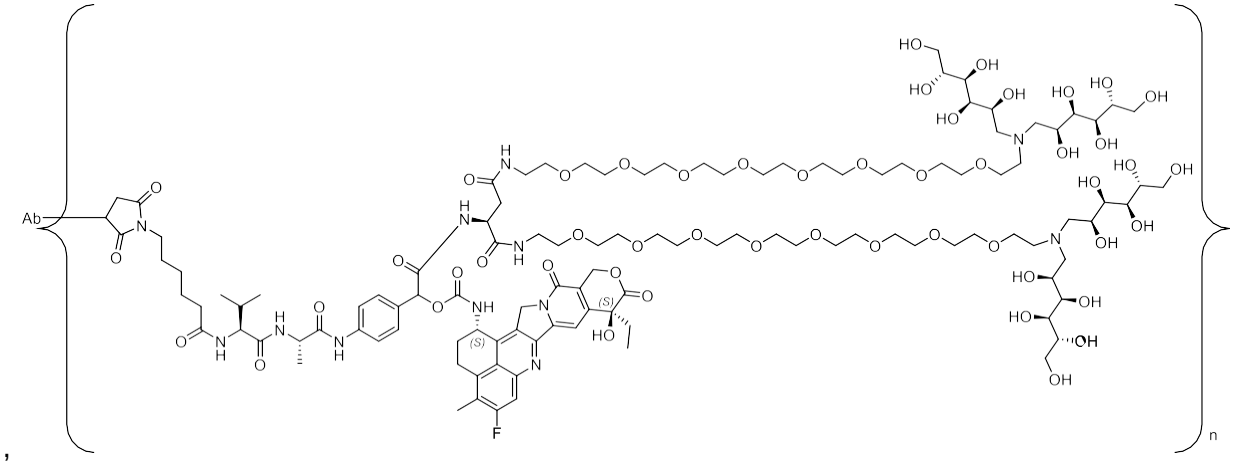




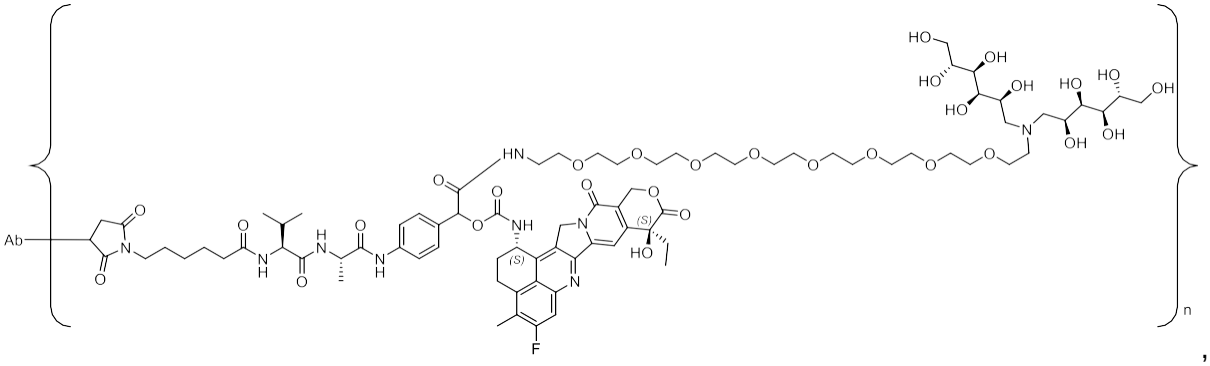




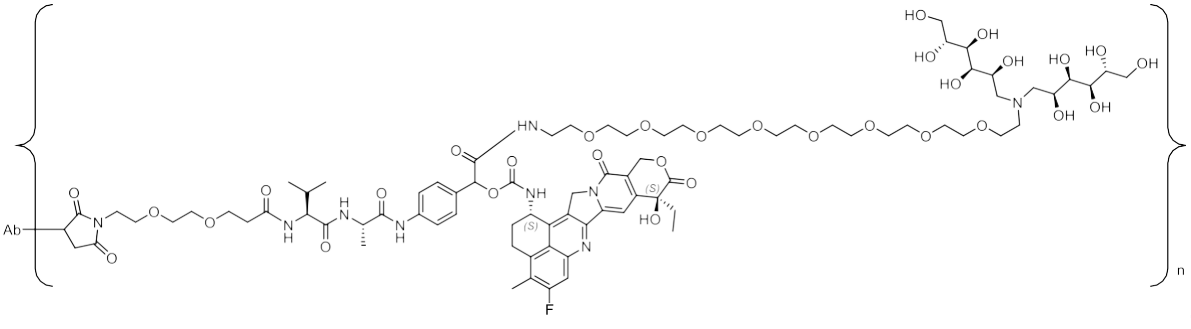




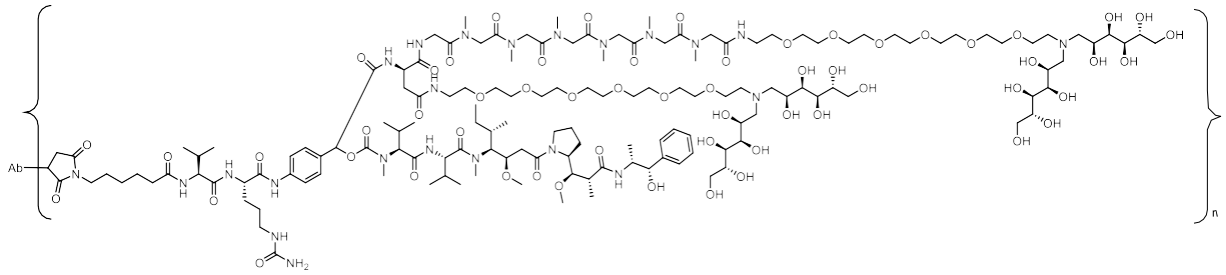
,



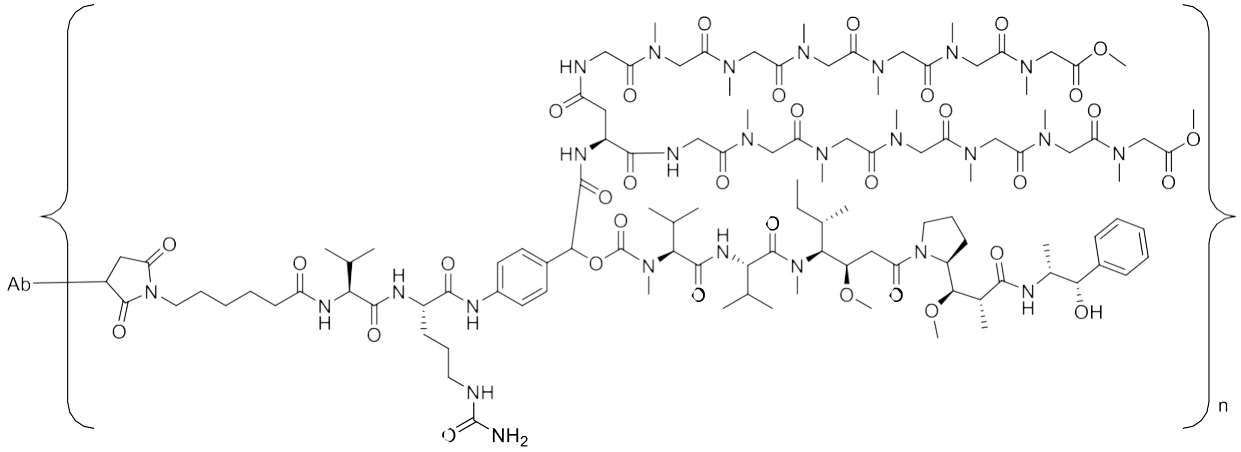
,



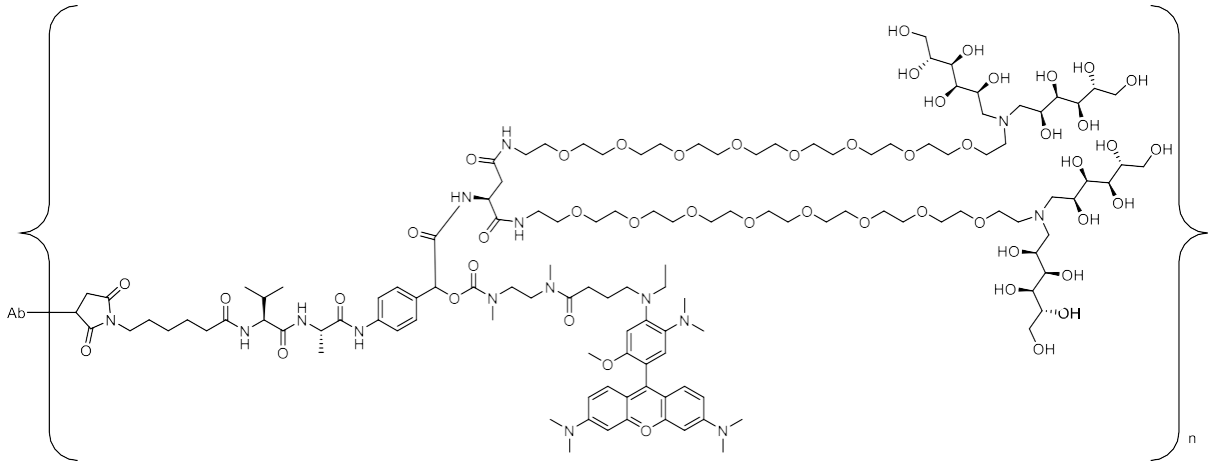
,



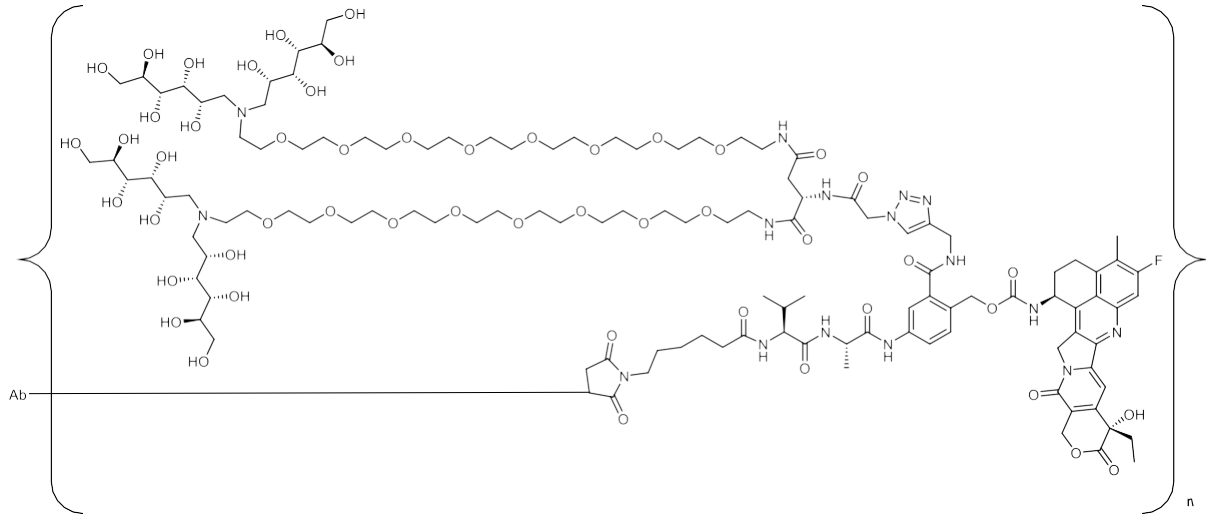
,



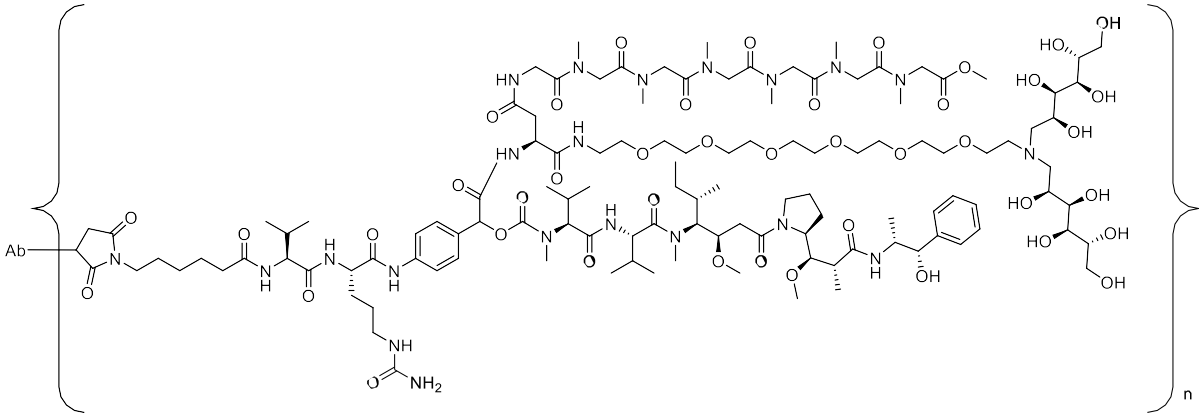
,



,



,



donde Ab es un grupo de direccionamiento y n es p^{load}.

111. El conjugado de cualquiera de las reivindicaciones 102-110, en donde la molécula diana es CD19, CD20, CD30, CD33, CD70, LIV-1, EGFRv3 o HER2.

112. El conjugado de cualquiera de las reivindicaciones 102-111, en donde la molécula diana es un antígeno asociado con cáncer.

113. El conjugado de cualquiera de las reivindicaciones 102-111, en donde la molécula diana es CD19, CD20, CD30, CD33, CD38, CA125, HER2, MUC-1, un antígeno de membrana específico de próstata (PSMA), una molécula de adhesión superficial CD44, mesotelina (MLSN), un antígeno carcinoembrionario (CEA), un receptor del factor de crecimiento epidérmico (EGFR), EGFRvIII, el receptor 2 del factor de crecimiento del endotelio vascular (VEGFR2), un antígeno asociado a melanoma de alto peso molecular (HMW-MAA), MAGE-A1, IL-13R-a2, GD2, 1p19q, HER2, ABL1, AKT1, ALK, APC, AR, ATM, BRAF, BRCA1, BRCA2, cKIT, cMET, CSF1R, CTNNB1, FGFR1, FGFR2, FLT3, GNA11, GNAQ, GNAS, HRAS, IDH1, IDH2, JAK2, KDR (VEGFR2), KRAS, MGMT, MGMT-Me, MLH1, MPL, NOTCH1, NRAS, PDGFRA, Pgp, PIK3CA, PR, PTEN, RET, RRM1, SMO, SPARC, TLE3, TOP2A, TOPO1, TP53, TS, TUBB3, VHL, CDH1, ERBB4, FBXW7, HNF1A, JAK3, NPM1, PTPN11, RB1, SMAD4, SMARCB1, STK1, MLH1, MSH2, MSH6, PMS2, ROS1, ERCC1, 5T4 (TPBG), B7-H3, CCR7, CD105, CD22, CD46, CD47, CD56, CD70, CD71, CD79b, CDH6, CLDN6, CLDN18.2, CLEC12A, DLL3, DR5, ERBB3 (HER3), EPCAM, FOLR1, IGF1R, IL2RA (CD25), IL3RA, ITGB6, LIV-1, LRRC15, mesotelina (MSLN), NaPi2b (SLC34A2), nectina-4, PTK7, ROR1, SEZ6, SLC44A4, SLITRK6, un factor tisular (TF), TROP2 o B7-H4.

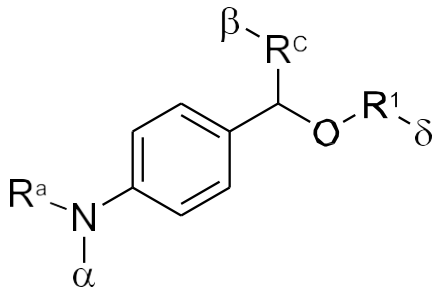
114. El conjugado de cualquiera de las reivindicaciones 102-104, en donde el grupo de direccionamiento es un anticuerpo, o un fragmento del mismo, que comprende rituximab (Rituxan®), trastuzumab (Herceptin®), pertuzumab (Perjeta®)), bevacizumab (Avastin®), ranibizumab (Lucentis®), cetuximab (Erbitux®), alemtuzumab (Campath®), panitumumab (Vectibix®), ibritumomab tiuxetan (Zevalin®), tositumomab (Bexxar®), ipilimumab,

zalutumumab, dalotuzumab, figitumumab, ramucirumab, galiximab, farletuzumab, ocrelizumab, ofatumumab (Arzerra®), tositumumab, ibritumomab, los anticuerpos CD20 2F2 (HuMax-CD20), 7D8, IgM2C6, IgG1 2C6, 11B8, B1, 2H7, LT20, 1FS o AT80, daclizumab (Zenapax®), o anticuerpos anti-receptor de LHRH que incluyen los clones A9E4, F1G4, AT2G7, GNRH03 o GNRHR2.

115. Una composición farmacéutica que comprende el conjugado de cualquiera de las reivindicaciones 102 a 114 y un vehículo farmacéuticamente aceptable.

116. Un método de tratamiento de un sujeto que lo necesita, que comprende administrar al sujeto un conjugado de cualquiera de las reivindicaciones 102 a 114 o la composición farmacéutica de la reivindicación 115, en donde el sujeto tiene cáncer o una enfermedad autoinmune y el conjugado se une a un antígeno diana asociado con el cáncer o con la enfermedad autoinmune.

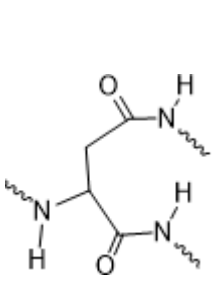
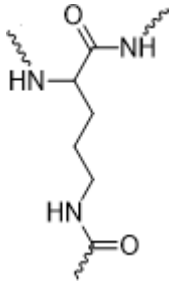
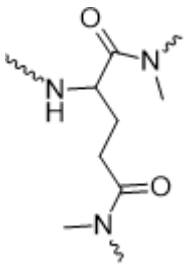
117. Un compuesto fármaco-conector, representado por la estructura de Fórmula (A)



Fórmula (A);

o una sal de la misma, donde:

(i) β es $R^{20}(-R^{21}-[O-CH_2-CH_2]_{n20}-R^{22}-NR^{24}R^{25})_z$; donde

R^{20} es NH,  ,  , o  ;

R^{21} y R^{22} son independientemente entre sí un enlace o C_1-C_3 alquileno;

R^{24} y R^{25} se seleccionan independientemente en cada caso entre H; grupo polihidroxilo; y grupo -C(O)-polihidroxilo; con la condición de que R^{24} y R^{25} no son ambos H; z es 1 o 2;

y

n20 es entre 2 y 26;

(ii) R^a es H o C_1-C_6 alquilo;

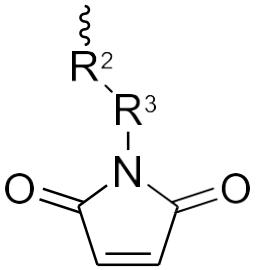
(iii) R^c es un enlace, -C(O)-, -S(O)-, -SO_2-, C_1-$_6$ alquileno, C_{1-6} alquinileno, o C_{1-6}

alquinileno-triazolilo;

(iv) R^1 es un enlace, -C(O)-, o C_{1-6} alquileno; y

(v) δ se selecciona entre un Fármaco;

(vi) α se representa por medio de la fórmula

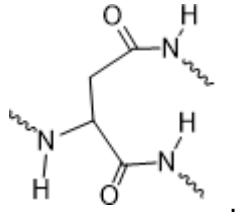


; donde

R^2 es un péptido que tiene 2-5 aminoácidos;

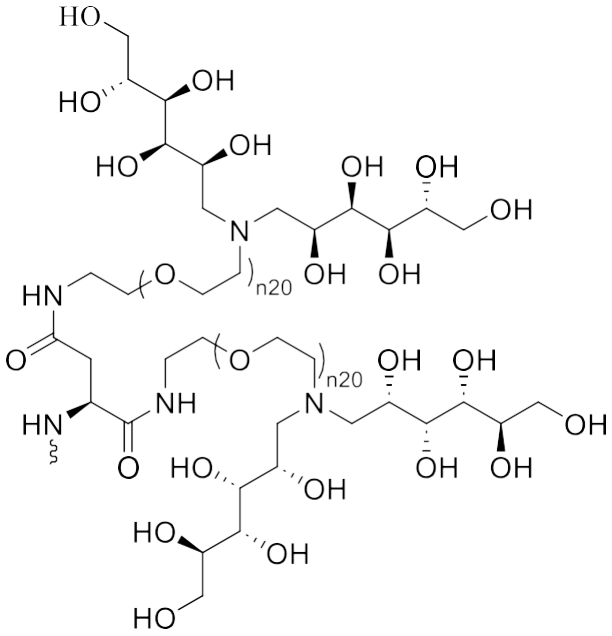
R^3 es -C_1-C_{10} alquileno-C(=O)-, -C_1-C_{10} alquileno-,-C_1-C_{10}alquileno-C(O)NH-C_1-C_8alquileno-[O-CH_2-CH_2]$_n$-C(O)- (donde n es entre 1 y 26), o -C_1-C_8 alquileno-(CH_2-O-CH_2)$_b$-C(=O)- (donde b es entre 1 y 26).

118. El compuesto fármaco-conector de la reivindicación 117, donde R^{20} es



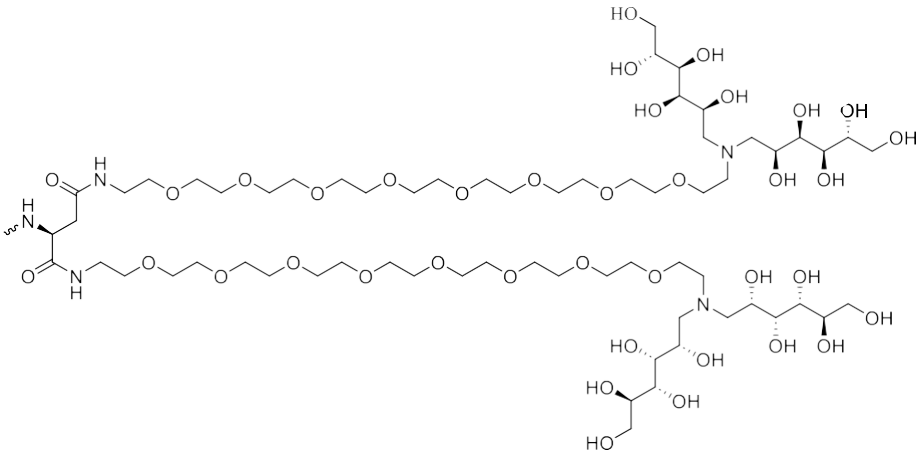
.

119. El compuesto fármaco-conector de la reivindicación 117, donde β es

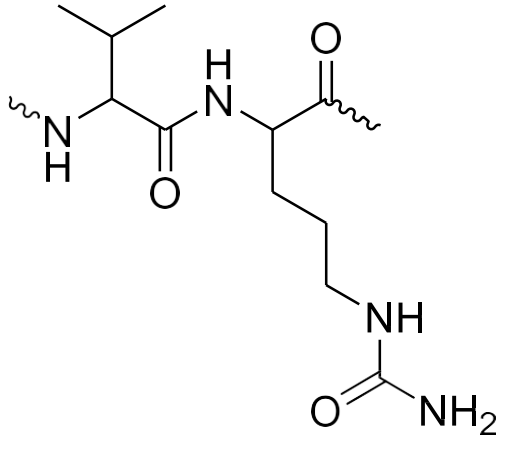


y n20 es entre 4 y 12;

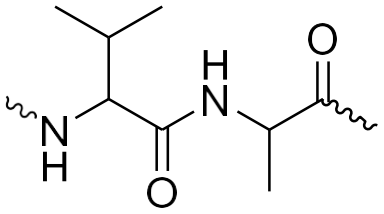
120. El compuesto fármaco-conector de la reivindicación 117, donde β es



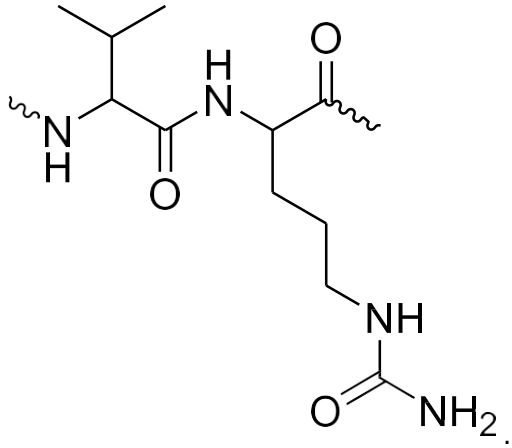
121. El compuesto fármaco-conector de cualquiera de las reivindicaciones 117 a 120, donde R^2 se selecciona entre:



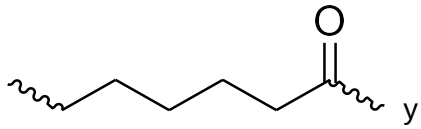
y



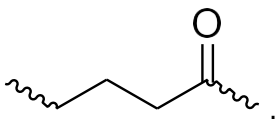
122. El compuesto fármaco-conector de cualquiera de las reivindicaciones 117 a 121, donde R^2 se selecciona entre:



123. El compuesto fármaco-conector de cualquiera de las reivindicaciones 117 a 122, donde R^3 se selecciona entre:

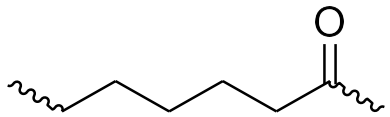


y



124. El compuesto fármaco-conector de cualquiera de las reivindicaciones 117 a 123, donde R^3

se selecciona entre:


.

125. El compuesto fármaco-conector de cualquiera de las reivindicaciones 117 a 124, donde R^c es -C(O)-.

126. El compuesto fármaco-conector de cualquiera de las reivindicaciones 117 a 125, donde R^1 es -C(O)-.

127. El compuesto fármaco-conector de cualquiera de las reivindicaciones 117 a 126, donde el fármaco se selecciona entre un agente citotóxico.

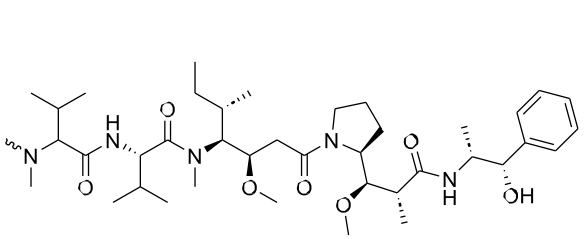
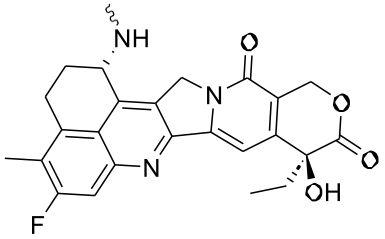
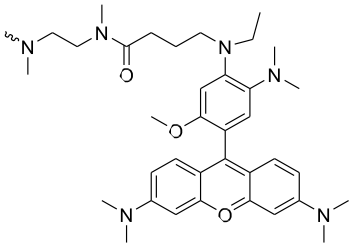
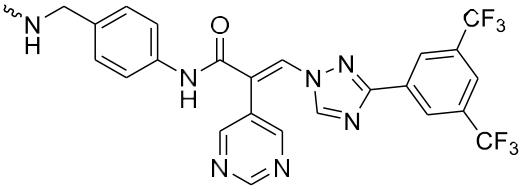
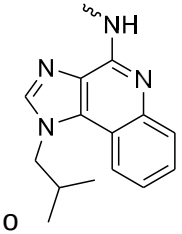
128. El compuesto fármaco-conector de cualquiera de las reivindicaciones 117 a 126, donde el fármaco es MMAE o MMAF.

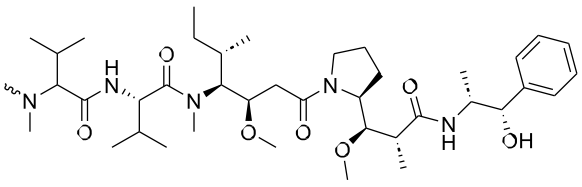
129. El compuesto fármaco-conector de cualquiera de las reivindicaciones 117 a 126, donde el fármaco es MMAE.

130. El compuesto fármaco-conector de cualquiera de las reivindicaciones 117 a 126, donde el fármaco es exatecan.

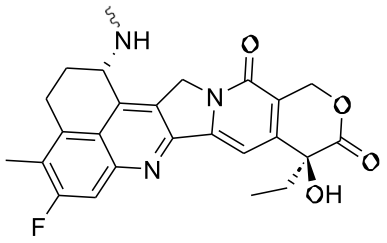
131. El compuesto fármaco-conector de cualquiera de las reivindicaciones 117 a 126, donde el fármaco se selecciona entre un agente inmunomodulador.

132. El compuesto fármaco-conector de cualquiera de las reivindicaciones 117 a 126, donde δ se selecciona entre


,

,

,

, o

.

133. El compuesto fármaco-conector de cualquiera de las reivindicaciones 117 a 126, donde δ es

.

134. El compuesto fármaco-conector de cualquiera de las reivindicaciones 117 a 126, donde δ

es  .

135. Un conjugado que comprende un grupo de direccionamiento unido al fármaco-conector de cualquiera de las reivindicaciones 117 a 134, donde el grupo de direccionamiento se une específicamente a la molécula diana.

136. El conjugado de la reivindicación 135, donde la relación de Fármaco-Conector a grupo de direccionamiento se representa por medio de un valor DAR, donde el valor DAR es entre 1 y 8.