

### PREMI 2016 DELLA DIVISIONE DI CHIMICA FARMACEUTICA

Daniele Donati

Nerviano Medical Sciences Srl

Divisione di Chimica Farmaceutica

Società Chimica Italiana

[Daniele.Donati@nervianoms.com](mailto:Daniele.Donati@nervianoms.com)

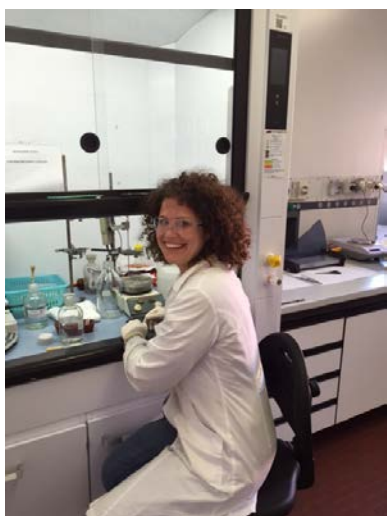


In occasione del recente "XXIV National Meeting In Medical Chemistry - 10<sup>th</sup> Young Medicinal Chemists' Symposium" di Perugia, la Divisione di Chimica Farmaceutica (DCF) della Società Chimica Italiana, ha conferito i premi per le migliori tesi di dottorato ed i premi DCF per i giovani ricercatori.

La Divisione di Chimica Farmaceutica (DCF) della Società Chimica Italiana, continuando a perseguire la strategia mirante a riconoscere e promuovere le attività dei giovani ricercatori, ha conferito il Premio annuale per le migliori tesi di Dottorato durante il recente "XXIV National Meeting in Medicinal Chemistry - 10<sup>th</sup> Young Medicinal Chemists' Symposium" tenutosi a Perugia dal 10 al 14 settembre 2016. Il Premio, che vuole riconoscere l'eccellenza scientifica dei giovani ricercatori nel campo della chimica farmaceutica, nelle sue varie espressioni, è indirizzato ai ricercatori che hanno superato l'esame finale di Dottorato nel corso dell'anno precedente a quello d'assegnazione.

In occasione dello stesso Convegno, è stato conferito anche il Premio annuale DCF per i giovani ricercatori, volto a riconoscere i risultati di particolare rilievo ottenuti da ricercatori under 40 per ricerche condotte nell'ambito della Chimica Farmaceutica, sia in ambito accademico sia presso enti di ricerca non accademici.

Il premio per le migliori Tesi di Dottorato è stato conferito a Sara Consalvi e Valeria Famiglini, entrambe dell'Università di Roma "La Sapienza". Le due ricercatrici hanno poi presentato i risultati delle loro recenti attività in occasione di due sessioni del Convegno, svolgendo anche il ruolo di moderatrici per le stesse sessioni.



Sara Consalvi ha conseguito la Laurea in Chimica e Tecnologie Farmaceutiche, con lode, nel 2011 sotto la supervisione della Prof. Mariangela Biava; presso lo stesso gruppo di ricerca ha poi conseguito il Dottorato di Ricerca in Scienze Farmaceutiche, con menzione di "Doctor Europaeus" (2015) discutendo una tesi dal titolo "Synthesis and biological evaluation of 1,5-diphenylpyrrole derivatives as COX-2 selective inhibitors and NO-releasing agents and development of a novel BRD9 chemical probe", svolgendo parte del lavoro di ricerca (aprile-ottobre 2014) presso il Dipartimento di Chimica dell'Università di Oxford (UK) nel gruppo di ricerca del Prof. Darren J. Dixon (Chemistry Department, Oxford University) e del Dr. Paul Brennan (StructuralGenomicConsortium, Oxford). Attualmente, Sara Consalvi svolge attività di ricercatrice post-dottorato nel gruppo della Prof. Biava, dove svolge attività di progettazione e sintesi di piccole molecole sia per la ricerca di nuovi inibitori COX-2 selettivi sia per l'identificazione di nuovi agenti

antitubercolari. È co-autrice di circa 10 articoli su riviste internazionali e di altrettanti poster e comunicazioni orali a convegni nazionali ed internazionali.

Durante il Convegno, la Dr.ssa Consalvi ha presentato una relazione in cui ha riassunto i principali risultati ottenuti nell'ambito di tre diverse linee di ricerca che hanno caratterizzato la tesi di dottorato: la progettazione e la sintesi di derivati 1,5-difenilpirrolici quali inibitori COX-2 selettivi e di una serie di ibridi farmacodinamici quali inibitori COX-2 selettivi/rilasciatori di NO e lo sviluppo di un potenziale chemical probe del target epigenetico BRD9. Tale progetto, in particolare, è stato realizzato presso l'Università di Oxford.



Dopo aver conseguito la Laurea in Farmacia (2010) presso l'Università di Roma "La Sapienza", Valeria Famigliani ha conseguito il Dottorato di Ricerca in Scienze Farmaceutiche, con menzione di "Doctor Europaeus" (2015) presso il Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco, Università di Roma "La Sapienza". La Tesi di Dottorato, dal titolo "Progettazione, sintesi ed attività biologica di nuovi agenti antiretrovirali e antitumorali" è stata svolta sotto la supervisione del Prof. Romano Silvestri ed ha comportato anche un periodo di lavoro presso la "Welsh School of Pharmacy", Cardiff University, Cardiff, UK. Dopo un periodo come post-dottorato presso l'Istituto Pasteur-Italia Fondazione Cenci Bolognetti, Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco, Università

di Roma "La Sapienza" per lo studio della progettazione e sintesi di nuovi agenti antiretrovirali, è ora assegnista di ricerca presso lo stesso Dipartimento ed è coinvolta nella progettazione e sintesi di nuovi agenti antitumorali come inibitori della polimerizzazione della tubulina.

La Dr.ssa Famigliani è co-autrice di 14 articoli pubblicati su riviste internazionali, oltre ad aver presentato i propri risultati in comunicazioni orali e poster a congressi nazionali ed internazionali.

Come sopra anticipato, i risultati ottenuti durante il lavoro per la Tesi di Dottorato sono stati oggetto della conferenza tenuta durante il Convegno di Perugia. L'obiettivo del progetto di ricerca è originato dalla necessità di superare le problematiche che si incontrano nell'applicazione delle terapie antivirali ed antitumorali, in particolare la farmaco resistenza, che portano alla necessità di identificare e sviluppare nuovi agenti antimetabolici. I risultati ottenuti, parallelamente ad uno studio d'ottimizzazione di un intermedio chiave nella sintesi dei composti finali, hanno evidenziato il potenziale terapeutico di derivati indolilarilsolfonici e ariltioindolici quali agenti antiretrovirali e antimetabolici.

Il Premio annuale DCF per i giovani ricercatori è stato assegnato a Fabrizio Carta, Università di Firenze, e a Rosella Ombrato (Angelini Research Center - ACRAF). I due vincitori hanno poi presentato i risultati delle loro attività durante il Convegno.



Rosella Ombrato ha conseguito la Laurea in Chimica e Tecnologie Farmaceutiche (2002) presso l'Università degli Studi di Pisa, sotto la supervisione del Prof. Adriano Martinelli. È quindi entrata a far parte del gruppo di Computational Chemistry nel Centro Ricerche Angelini nel 2003 ed è stata coinvolta in diversi progetti di ricerca utilizzando approcci sia structure- sia ligand-based. Nel 2005 ha assunto la posizione di team leader del gruppo di Computational Chemistry nel Dipartimento di Drug Discovery e nel 2007 è diventata project leader della piattaforma "Target to Hit", seguendo campagne di screening sia in silico sia in high throughput. Nel periodo 2011-2013 è stata coinvolta nel progetto "IDDN Chemical Library Project" con il

principale ruolo di disegno, selezione e acquisizione di composti. Il suo principale interesse è l'identificazione di new chemical entities e la loro ottimizzazione in fase di "hit to lead" e "lead to candidate" per le aree terapeutiche del CNS, dolore e nell'ambito delle infezioni batteriche. La dott.ssa Ombrato è autore e co-autore di 6 brevetti, 7 pubblicazioni in riviste internazionali ad alto impact factor, 5 comunicazioni orali e 24 comunicazioni poster a conferenze nazionali ed internazionali.

Durante il Convegno, la dott.ssa Ombrato ha presentato la relazione "Discovery of Novel GSK-3 $\beta$  Inhibitors" mostrando la linea di ricerca seguita nei laboratori del Centro Ricerche di Angelini.



Fabrizio Carta ha conseguito la Laurea in Chimica e Tecnologie Farmaceutiche (2002) con lode, presso l'Università degli Studi di Sassari, sotto la supervisione del Dr. Mario Sechi, con una tesi sperimentale sull'identificazione di nuovi inibitori di HIV-1 Integrasi. Nel 2008 ha poi conseguito il titolo di Dottore di Ricerca in Scienze Chimiche (Ph.D.) presso la School of Chemistry of the Bristol University (UK) dove si è occupato di studi di meccanismi di reazione Prins-type, sotto la supervisione del Prof. C.L. Willis e del Prof. R.W. Alder. In seguito, ha

svolto attività di ricerca presso il Massachusetts Institute of Technology (MIT-USA) in qualità di post-dottorato, occupandosi della sintesi stereoselettiva di composti naturali complessi. Tornato in Italia, ha proseguito per alcuni mesi la sua attività di ricerca in qualità di collaboratore presso il laboratorio del Dr. Mario Sechi dell'Università di Sassari, lavorando su diversi progetti riguardanti lo sviluppo di inibitori dell'enzima HIV-1 Integrasi. Dalla fine del 2008, il Dr. Carta prosegue la sua attività di ricerca presso l'Università degli Studi di Firenze, nei Dipartimenti di Chimica e NEUROFARBA, in qualità di post-dottorato, sotto la supervisione dei Proff. Scozzafava e Supuran. I suoi principali interessi riguardano la ricerca e sviluppo di modulatori di metalloenzimi e delle loro applicazioni per il trattamento di patologie di particolare rilevanza.

Il Dr. Carta, fino a dicembre 2015 è stato Lecturer at University of New Haven, Tagliatela College of Engineering, Department of Chemistry and Chemical Engineering; è inoltre Associate Editor di *Current Enzyme Inhibition* (CEI), Editorial Board Member di *Journal of Enzyme Inhibition and Medicinal Chemistry* (JEIMC) e del *Journal of the Turkish Chemical Society, Section A: Chemistry* (JOTCSA) ed è co-autore di circa 100 pubblicazioni su riviste scientifiche internazionali, 3 capitoli di libro e 4 brevetti.

La conferenza tenuta in occasione del Premio dal Dr. Carta è stata dedicata alla caratterizzazione dell'attività farmacologica di monotiocarbammati come inibitori della anidrasi carbonica in modelli animali di glaucoma. Questa ricerca ha permesso di identificare composti ad attività nel range basso-medio nanomolare; alcuni di questi composti sono poi stati valutati in modelli animali di glaucoma per la capacità di abbassare la pressione intraoculare, mostrando interessanti attività farmacologiche.