

UNIVERSITÀ DEGLI STUDI DI MILANO

Procedura di valutazione per la chiamata a professore di I fascia da ricoprire ai sensi dell'art. 24, comma 6, della Legge n. 240/2010 per il settore concorsuale 03/D1 - Chimica e Tecnologie Farmaceutiche, Tossicologiche e Nutraceutico-Alimentari (settore scientifico-disciplinare CHIM/08 Chimica Farmaceutica) presso il Dipartimento di Scienze Farmaceutiche, Codice concorso 4092

## **Paola Conti**

### **CURRICULUM VITAE**

#### **INFORMAZIONI PERSONALI**

<b>COGNOME</b>	<b>CONTI</b>
<b>NOME</b>	<b>PAOLA</b>
<b>DATA DI NASCITA</b>	<b>14/02/1970</b>

#### **TITOLI**

**2017** Abilitazione scientifica nazionale per la posizione di Professore di I fascia per il settore 03/D1 (CHIM/08) (Valida dal 31/03/2017 al 31/03/2023).

**2005** Nomina a Professore associato (settore CHIM/08) della Facoltà di Farmacia, Università degli Studi di Milano.

**2003** Dichiarata idonea nella Procedura di valutazione comparativa per la copertura di un posto di Professore associato presso la Facoltà di Farmacia dell'Università degli Studi Federico II di Napoli, per il settore CHIM/08.

**2000** Presa di servizio presso l'Università degli Studi di Milano, Facoltà di Farmacia, con la qualifica di Ricercatore universitario.

**1999** Vincitrice di una procedura di valutazione comparativa ad un posto da ricercatore universitario; procedura comparativa bandita dalla Facoltà di Farmacia dell'Università degli Studi di Milano per il settore C07X (attualmente CHIM/08).

**1999** Vincitrice del concorso per l'attribuzione di un Assegno per la Collaborazione alla Ricerca nel settore scientifico disciplinare delle Scienze Farmaceutiche e Farmacologiche, presso l'Istituto di Chimica Farmaceutica e Tossicologica dell'Università di Milano.

**1999** Vincitrice di una borsa di studio NATO-CNR per il perfezionamento all'estero, nel settore disciplinare delle Scienze Chimiche.

**1999** Conseguimento del titolo di Dottore di Ricerca in Chimica del Farmaco presso l'Università degli Studi di Milano.

**1996** Abilitazione alla Professione di Farmacista.

**1995** Laurea in Chimica e Tecnologia Farmaceutiche conseguita presso l'Università degli Studi di Milano, con votazione 110/110 e lode.

**1989** Diploma di maturità scientifica conseguito presso il Liceo Scientifico "E. Majorana" di Rho (MI), con votazione 60/60.

## **FORMAZIONE PROFESSIONALE**

**2005-presente** Professore associato di Chimica Farmaceutica, Dipartimento di Scienze Farmaceutiche, Università degli Studi di Milano.

**2000-2005** Ricercatore a tempo indeterminato, Facoltà di Farmacia, Università degli Studi di Milano.

**1999-2000** Post-doc titolare di una borsa di studio "NATO-CNR" presso il gruppo di ricerca diretto dal Prof. A. P. Kozikowski, Institute for Cognitive and Computational Sciences, Georgetown University Medical Center (Washington-DC, USA).

**1995-1998** Dottoranda, con borsa dell'Università degli Studi di Milano, nel corso di dottorato in "Chimica del Farmaco" presso l'Istituto di Chimica Farmaceutica e Tossicologica dell'Università degli Studi di Milano. Docente guida: Prof. Carlo De Micheli.

**1995** Consulente della ditta Lepetit nell'ambito di un progetto di ricerca riguardante la messa a punto di nuove matrici per la separazione elettroforetica di biopolimeri. La consulenza è stata svolta presso l'Istituto di Chimica degli Ormoni (attualmente Istituto di Chimica del Riconoscimento Molecolare) del CNR di Milano.

**1994-1995** Tesista presso il laboratorio di ricerca diretto dal Prof. Donato Pocar, Istituto di Chimica Organica, Facoltà di Farmacia, Università degli Studi di Milano.

## **LINGUE STRANIERE**

Ottima conoscenza della lingua inglese sia scritta che parlata.

Buona conoscenza della lingua francese sia scritta che parlata.

## **INTERRUZIONI DI CARRIERA**

25 Agosto 2004 - 25 Febbraio 2005: congedo per maternità.

## **ATTIVITÀ DIDATTICA E ISTITUZIONALE**

### **ATTIVITÀ DIDATTICA SVOLTA PER L'UNIVERSITÀ DEGLI STUDI DI MILANO**

#### **A.A. 2017/2018 e 2018/19**

- Chimica Farmaceutica e Tossicologica II, corso di Laurea in Farmacia. Compito didattico
- Preparazioni estrattive e sintetiche dei farmaci + Laboratorio di Preparazioni estrattive e sintetiche dei farmaci, corso di Laurea in CTF. Compito didattico

#### **A.A. 2016/2017**

- Preparazioni estrattive e sintetiche dei farmaci + Laboratorio di Preparazioni estrattive e sintetiche dei farmaci, corso di Laurea in CTF. Compito didattico
- Preparazione e sviluppo di farmaci con metodi biotecnologici, modulo: Sviluppo di farmaci con metodi biotecnologici, corso di Laurea Magistrale in Biotecnologie del farmaco, Università degli Studi di Milano. Compito didattico
- Farmaci biotecnologici innovativi, modulo: Approcci biotecnologici nella progettazione e ottimizzazione di farmaci, corso di Laurea Magistrale in Biotecnologie del farmaco, Università degli Studi di Milano. Compito didattico

#### **A.A. 2015/2016**

- Preparazioni estrattive e sintetiche dei farmaci + Laboratorio di Preparazioni estrattive e sintetiche dei farmaci, corso di Laurea in CTF. Compito didattico
- Preparazione e sviluppo di farmaci con metodi biotecnologici, modulo: Sviluppo di farmaci con metodi biotecnologici, corso di Laurea Magistrale in Biotecnologie del farmaco, Università degli Studi di Milano. Compito didattico
- Farmaci biotecnologici innovativi, modulo: Approcci biotecnologici nella progettazione e ottimizzazione di farmaci, corso di Laurea Magistrale in Biotecnologie del farmaco, Università degli Studi di Milano. Compito didattico
- Chimica Farmaceutica e Tossicologica, corso di Laurea triennale in Biotecnologie farmaceutiche. Compito didattico

#### **A.A. 2014/2015,**

- Preparazioni estrattive e sintetiche dei farmaci + Laboratorio di Preparazioni estrattive e sintetiche dei farmaci, corso di Laurea in CTF. Compito didattico
- Preparazione e sviluppo di farmaci con metodi biotecnologici, modulo: Sviluppo di farmaci con metodi biotecnologici, corso di Laurea Magistrale in Biotecnologie del farmaco. Compito didattico

#### **A.A.2013/2014**

- Preparazioni estrattive e sintetiche dei farmaci + Laboratorio di Preparazioni estrattive e sintetiche dei farmaci, corso di Laurea in CTF. Compito didattico
- Farmaci biotecnologici (corso avanzato)
- Sviluppo, produzione e analisi di Farmaci biotecnologici, corso di Laurea Magistrale in Biotecnologie del farmaco. Compito didattico

#### **A.A.2012/2013**

- Preparazioni estrattive e sintetiche dei farmaci + Laboratorio di Preparazioni estrattive e sintetiche dei farmaci, corso di Laurea in CTF. Compito didattico
- Farmaci biotecnologici, modulo Sviluppo di farmaci biotecnologici, corso di Laurea Magistrale in Biotecnologie del farmaco. Compito didattico

- Farmaci biotecnologici (corso avanzato), corso di Laurea Magistrale in Biotecnologie del farmaco. Compito didattico

#### **A.A.2011/2012**

- Farmaci biotecnologici, modulo Sviluppo di farmaci biotecnologici, corso di Laurea Magistrale in Biotecnologie del farmaco. Compito didattico

Farmaci biotecnologici (corso avanzato), corso di Laurea Magistrale in Biotecnologie del farmaco. Compito didattico

#### **A.A.2010/2011**

- Analisi delle sostanze inorganiche di impiego farmaceutico e Laboratorio di Analisi qualitativa, corso di laurea in Farmacia. Compito didattico.

- Farmaci biotecnologici , modulo Sviluppo di farmaci biotecnologici, corso di Laurea Magistrale in Biotecnologie del farmaco. Compito didattico

#### **A.A.2009/2010**

- Farmaci biotecnologici 1, modulo Sviluppo di farmaci biotecnologici, corso di Laurea Magistrale in Biotecnologie del farmaco. Compito didattico

-Farmaci biotecnologici 2, corso di Laurea Magistrale in Biotecnologie del farmaco. Compito didattico.

#### **A.A.2008/2009**

Farmaci biotecnologici 1, corso di Laurea Magistrale in Biotecnologie del farmaco. Compito didattico

#### **A.A. 2006/2007, 2007/2008**

- Laboratorio di Preparazioni Estrattive e Sintetiche dei Farmaci, corso di laurea in CTF. Compito didattico

#### **A.A. 2005/2006**

- Laboratorio di preparazioni Estrattive e Sintetiche dei Farmaci, corso di laurea in CTF. Compito didattico.

-Chimica Farmaceutica, Facoltà di Scienze Matematiche, Fisiche e Naturali, Corso di Laurea in Scienze Chimiche. Affidò.

#### **A.A. 2004/2005**

- Laboratorio di preparazioni Estrattive e Sintetiche dei Farmaci, corso di laurea in CTF. Compito didattico

#### **A.A. 2001/2002, 2002/2003, 2003/2004**

- Analisi dei Medicinali e Laboratorio di Analisi dei Medicinali, corso di laurea in CTF. Affidò.

#### **ATTIVITÀ DIDATTICA PER CORSI DI DOTTORATO**

**A.A. 2016/2017:** responsabile del corso “Is biocatalysis a real option for chemists?” nell’ambito del quale ha tenuto 2 ore di lezione dal titolo “Biocatalytic approaches to generate new analogues of natural products”, per il Dottorato in Chimica e Chimica industriale, presso l’Università degli Studi di Milano.

**A.A. 2013/2014:** ha tenuto 4 ore di lezione dal titolo “Novel strategies for drug targeting” nell’ambito del corso “New methodologies in medicinal chemistry” per il Dottorato in Chimica e in Chimica Industriale presso l’Università degli Studi di Milano.

**A.A. 2008/2009:** ha tenuto un'ora di lezione dal titolo "I recettori del glutammato quali *targets* per il trattamento di patologie del SNC: strategie per la progettazione di ligandi selettivi" per il Dottorato in Scienze Farmaceutiche, presso l'Università degli Studi di Salerno.

#### **ALTRE ATTIVITÀ DIDATTICHE**

Responsabile delle esercitazioni pratiche sulla "Chimica degli Eterocicli" nell'ambito della *V Edizione del Laboratorio di Metodologie Sintetiche in Chimica Farmaceutica*, Università di Siena, 12-17 Febbraio 2006.

#### **PARTECIPAZIONE A COMMISSIONI D'ESAME DI DOTTORATO (PhD)**

**Giugno 2017** Membro del PhD Assessment Committee, University of Copenhagen, Faculty of Health and Medical Sciences.

**Febbraio 2016** Membro della commissione per l'esame finale di Dottorato in Chimica Farmaceutica e Tossicologica, Università degli Studi di Pavia.

**Marzo 2015** Presidente della commissione per l'esame finale di Dottorato in Scienze Farmaceutiche, Università di Salerno.

**Maggio 2014:** Membro della commissione per l'esame finale di Dottorato in Bioscienze, Università degli Studi di Verona.

**Febbraio 2012:** Membro del PhD Assessment Committee, University of Copenhagen, Faculty of Health and Medicine Sciences

**Giugno 2011:** Membro del PhD Assessment Committee, University of Copenhagen, Faculty of Pharmaceutical Sciences

**Novembre 2009:** Membro del PhD Assessment Committee, University of Copenhagen, Faculty of Pharmaceutical Sciences

#### **PARTECIPAZIONE AD ALTRE COMMISSIONI**

**A.A. 2007/2008** Membro della Commissione giudicatrice per gli esami di Stato di abilitazione alla professione di Farmacista

#### **COMPITI ISTITUZIONALI**

**A.A. 2017-2019** Membro della giunta del Dottorato di Ricerca in Chimica

**A.A. 2015-2019** Componente del Collegio Docenti del Dottorato di Ricerca in Chimica

**A.A. 2013-2017** Componente della commissione paritetica per il corso di Laurea in Biotecnologie del Farmaco

**A.A. 2012-2014** Componente del Collegio Docenti del Dottorato di Ricerca in Chimica del Farmaco

#### **SUPERVISIONE DI DOTTORANDI, BORSISTI, LAUREANDI**

- Docente di riferimento di 3 borse di studio per giovani promettenti bandite dall'Università degli Studi di Milano.

- Relatore di due tesi di Dottorato in Chimica del Farmaco e di una tesi di Dottorato in Chimica. Attualmente tutor di un dottorando in Chimica.

- Relatore di 26 tesi di Laurea in Chimica e Tecnologie Farmaceutiche, 5 tesi di Laurea specialistica in Biotecnologie del farmaco, 1 tesi di Laurea in Farmacia e 1 tesi di Laurea triennale in Biotecnologie farmaceutiche.

- Correlatore di 9 tesi di Laurea in Chimica e Tecnologie Farmaceutiche e di 1 tesi di Laurea specialistica in Biotecnologie del farmaco

## ATTIVITÀ SCIENTIFICA

### PREMI E RICONOSCIMENTI PER L'ATTIVITÀ SCIENTIFICA

- 2019** Riconoscimento “Top downloaded article 2017-2018” ricevuto da *Chemistry Open*, ed. Wiley, per la pubblicazione “Chemoenzymatic synthesis in flow reactors: a rapid and convenient preparation of Captopril” *Chem. Open* **2017**, *6*, 668-673.
- 2017** Riconoscimento “Highly Read Article of 2015” ricevuto dal *Journal of Medicinal Chemistry* per la pubblicazione “Characterization of 2,4-Diamino-6-oxo-1,6-dihydropyrimidin-5-yl Ureido Based Inhibitors of *Trypanosoma brucei* FOLD and Testing for Antiparasitic Activity”, *J. Med. Chem.* **2015**, *58*, 7938–7948.
- 2016** Premio per il miglior poster per l'innovazione chimica e le tecnologie. “The chemoenzymatic flow synthesis of Captopril”, F. Dall'Oglio, A. Pinto, V. De Vitis, F. Molinari, D. Romano, P. Conti, L. Tamborini, “XXIV National Meeting on Medicinal Chemistry”, Perugia (consegnato alla Dott.ssa Federica Dall'Oglio).
- 2005** Vincitrice del “Premio Farindustria” per l'eccellenza nella ricerca Chimico-Farmaceutica.
- 2001** Vincitrice del “Noordwijkerhout-Camerino Award”.

### FINANZIAMENTI OTTENUTI COME RESPONSABILE SCIENTIFICO

- 2018** Finanziamenti di Ateneo per la ricerca - Piano sviluppo Unimi - Linea 2. Optimization of recently discovered inhibitors of glyceraldehyde-3-phosphate dehydrogenases to improve their antimalarial properties.
- 2016** Fondazione Cariplo, Ricerca integrate sulle biotecnologie industriali e sulla bioeconomia 2016. BIOFLOW: an innovative platform for the in-flow biocatalytic preparation of high value chemicals.
- 2015** Finanziamenti di Ateneo per la ricerca, “H2020 Transition grant”
- 2015** European Huntington's Disease network. Functional Studies on Glutamate Signaling, in a Drosophila model for HD, using analogs of Glutamate or Glutamine to Ameliorate the Pathology of the Disease. (co-proponente, con prof.ssa Paola Bellostà e prof. Antonietta Vanoni)
- 2008** Programma dell'Università per la Ricerca, PUR 2008. Sintesi e valutazione biologica di nuovi inibitori della CTP sintetasi utilizzabili per il trattamento della malattia del sonno (Trypanosomiasi africana)

### PARTECIPAZIONE SCIENTIFICA A PROGETTI DI RICERCA FINANZIATI

- 2015** PRIN 2015. Towards multi-stage drugs to fight poverty related and neglected parasitic diseases: synthetic and natural compounds directed against Leishmania, Plasmodium and Schistosoma life stages and assessment of their mechanisms of action.
- 2015** Finanziamenti di Ateneo per la ricerca - Piano sviluppo Unimi - Linea 2. Development of selective antagonist targeting subunit GluN2A of NMDA receptors as novel pharmacological tools to investigate Parkinson's disease.
- 2014** Fondazione Cariplo, Ricerca integrate sulle biotecnologie industriali 2014. INBOX-INnovative Biocatalytic Oxidations.
- 2012** PGR00102, progetto di grande rilevanza 2012 Italia-Albania (Ministero degli Affari Esteri). Progettazione e sviluppo di inibitori enzimatici utilizzabili nel trattamento di parassitosi da protozoi.

**2012 PRIN 2012.** Progettazione e sviluppo di nuovi agenti per il trattamento di malattie parassitarie.

**2009 PRIN 2009.** Progettazione e sviluppo di nuovi agenti per il trattamento di malattie parassitarie.

**2007 PRIN 2007.** Progettazione, sintesi e valutazioni biofarmacologiche preliminari di ligandi del sistema glutammatergico e dei recettori sigma.

**2007 FIRST 2007.** Sintesi di nuovi ligandi attivi sui trasportatori del Glutammato.

**2006 FIRST 2006.** Sintesi di nuovi ligandi attivi sui trasportatori del Glutammato.

**2005 PRIN 2005.** Progettazione, sintesi e valutazioni biofarmacologiche preliminari di ligandi del sistema glutammatergico e dei recettori sigma.

**2005 FIRST 2005.** Sintesi di nuovi ligandi attivi sui trasportatori del Glutammato.

**2005 FIRB 2005** Sviluppo di metodologie innovative per l'identificazione e la sintesi di nuove molecole a scopo terapeutico: applicazioni nel campo della malattia di Alzheimer.

#### ATTIVITÀ DI REVISORE

- Revisore per il MIUR, progetti SIR 2014
- Revisore per il MIUR, VQR 2004-2010

#### ATTIVITÀ EDITORIALE

- Regional Editor della rivista *Mini-Reviews in Medicinal Chemistry* (Bentham Science Publishers).
- Traduttrice di tre capitoli del libro di testo G.L. Patrick, "Introduzione alla Chimica Farmaceutica"
- Autrice di due capitoli del libro di testo G.L. Patrick, "Chimica Farmaceutica", Edizione integrata a cura di G. Costantino.
- Revisore abituale di articoli scientifici per riviste quali: *ACS Chemical Neuroscience*, *Bioorganic & Medicinal Chemistry*, *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters*, *ChemMedChem*, *European Journal of Medicinal Chemistry*, *European Journal of Organic Chemistry*, *Journal of Medicinal Chemistry*, *Tetrahedron*, *Tetrahedron Asymmetry*.

#### ORGANIZZAZIONE DI EVENTI

- Membro del comitato organizzatore del "4th International Workshop on Pericyclic Reactions and Synthesis of Hetero- and Carbocyclic systems", Milano, 28-30 giugno 2017.
- Membro del comitato organizzatore del workshop "Innovation and sustainability in organic synthesis and drug development", che si terrà a Pavia il prossimo 16-17 settembre 2019.

#### PRINCIPALI COLLABORAZIONI IN ATTO

- Prof. J. S. Kastrup e Prof. D. Pickering (Department of Drug Design and Pharmacology, University of Copenhagen, Denmark), prof. K. Hansen (Department of Biomedical/pharmaceutical Sciences, University of Montana).

Progetto: progettazione, sintesi e valutazione farmacologica di nuovi antagonisti dei recettori del glutammato NMDA, AMPA e KA.

- Dott. M. G. Pomper (Johns Hopkins University, Baltimore, Maryland).

Progetto: sviluppo di nuovi ligandi per l'imaging del sistema nervoso centrale.

- Dr. M. Barrett, Wellcome Trust Centre of Molecular Parasitology-Glasgow, Prof. S. Bruno (Dipartimento di Farmacia, Università di Parma), Prof. M. P. Costi (Dipartimento di Scienze della Vita, Università di Modena e Reggio Emilia), Prof. C. Fattorusso (Dipartimento di Farmacia, Università degli Studi di Napoli Federico II), Prof. D. Taramelli (Dipartimento di Scienze Farmacologiche e Biomolecolari, Università degli Studi di Milano).

Progetto: progettazione, sintesi e studio delle relazioni struttura/attività di nuovi inibitori enzimatici ad attività antiparassitaria

- Prof. P. Ciana (Dipartimento di Oncologia ed Emato-Oncologia), Prof. I. Eberini (Dipartimento di Scienze Farmacologiche e Biomolecolari, Università degli Studi di Milano).

Progetto: sviluppo di composti ad attività modulatoria su SIRT-1

- Prof. M. Donadelli (Dipartimento di Neuroscienze, Biomedicina e Movimento, Università degli Studi di Verona)

Progetto: studio del ruolo della modulazione di GAPDH nei tumori.

- Prof. F. Molinari (Dipartimento di Scienze per gli Alimenti la Nutrizione, l'Ambiente, Università degli Studi di Milano), Dott.ssa D. Monti e Dott. S. Riva (Istituto di Chimica del Riconoscimento Molecolare (ICRM) - CNR, Milano), Prof. E. Calleri, Prof. M. Terreni, Prof. D. Ubiali (Dipartimento di Scienze del Farmaco, Università di Pavia).

Progetto: studio di reazioni biocatalizzate in sistemi a flusso continuo.

- Prof. M. Terreni (Dipartimento di Scienze del Farmaco, Università di Pavia).

Progetto: sintesi ecosostenibile di nuovi potenziali vaccini anti-tubercolari.

- Prof. P. Bellosta (Dipartimento di Biologia Cellulare, Computazionale e Integrata, Università di Trento)

Progetto: studio della modulazione del ciclo glutammato/glutamina in modelli in vivo di malattia di Huntington.

## PRINCIPALI INTERESSI DI RICERCA

L'attività di ricerca di Paola Conti è incentrata su tre tematiche principali.

**Tematica 1: Progettazione di inibitori enzimatici quali agenti chemioterapici utilizzabili nel trattamento di malattie parassitarie o come antitumorali.**

**Tematica 2: Strategie di neuroprotezione basate sulla modulazione del sistema glutammatergico.**

**Tematica 3: Sviluppo di processi chemo-enzimatici innovativi per la preparazione di composti di interesse farmaceutico e nutraceutico, con un approccio eco-sostenibile.**

Accanto a queste tre tematiche di ricerca principali, alcune pubblicazioni, specie relative ai primi anni di attività scientifica, hanno riguardato altri argomenti di Chimica Farmaceutica, quali ad esempio lo studio delle relazioni struttura-attività di ligandi attivi a livello dei recettori colinergici, adrenergici e gabaergici e dei trasportatori della serotonina.



## **Tematica 1: Progettazione di inibitori enzimatici quali agenti chemioterapici utilizzabili nel trattamento di malattie parassitarie o come antitumorali.**

### *a) Inibitori enzimatici covalenti*

Una significativa parte della ricerca è stata incentrata sullo sviluppo di nuovi inibitori enzimatici covalenti diretti verso enzimi contenenti una cisteina catalitica, sfruttando la particolare reattività del nucleo 3-Br-isossazolinico, opportunamente legato a porzioni di riconoscimento, in grado di conferire selettività per gli enzimi target. L'idea di utilizzare il nucleo 3-Br-isossazolinico nasce dall'osservazione che un antibiotico naturale, l'Acivicina, prodotto di fermentazione di *S. visceus*, contiene il nucleo 3-Cl-isossazolinico, al quale si deve la sua capacità di reagire covalentemente con la cisteina catalitica di enzimi appartenenti alla famiglia delle glutammina-ammido trasferasi (GAT). La specificità per questa classe di enzimi è conferita dall'analogia strutturale con il substrato glutammina. Paola Conti ha sintetizzato l'analogo non naturale, la 3-Br-acivicina e, in collaborazione con i professori Mike Barrett e Terry Smith, è riuscita a dimostrare che il bromoderivato è in grado di inibire con maggiore potenza l'enzima citidina trifosfato sintetasi, appartenente alla famiglia delle GAT, rispetto all'acivicina stessa, in accordo con il meccanismo d'azione, considerato il maggiore carattere elettrofilo dell'anello 3-Br-isossazolinico rispetto a quello 3-Cl-isossazolinico.

La sintesi dei derivati a nucleo 3-Br-isossazolinico viene realizzata sfruttando la reazione di cicloaddizione 1,3-dipolare del bromonitrilossido con opportuni dipolarofili. Particolare attenzione è rivolta alla valutazione dell'impatto della stereochimica sull'attività biologica e alla preparazione, ove possibile, di composti in forma enantiopura.

Successivamente, Paola Conti ha realizzato la sintesi di nuovi inibitori covalenti di CTPS, dato l'interesse di questo enzima quale potenziale target per il trattamento della Tripanosomiasi africana umana. La progettazione di inibitori covalenti è stata successivamente estesa ad altri promettenti target. Uno di questi enzimi è la rodesaina, una cisteina proteasi espressa da *Trypanosoma brucei rhodesiense*, essenziale nei processi di immunoevasione e di invasione del sistema nervoso centrale. Un altro interessante target è la gliceraldeide-3-fosfato deidrogenasi (GAPDH), un enzima glicolitico identificato come potenziale target per il trattamento della malaria. In questo ambito sono stati recentemente sviluppati alcuni inibitori dotati di attività antimalarica a concentrazioni submicromolari.

E' inoltre in atto una collaborazione con l'università di Verona per lo studio dell'effetto della modulazione di GAPDH nelle cellule tumorali.

### *b) Inibitori enzimatici non-covalenti.*

Passando invece ad approcci basati sul disegno di inibitori reversibili, sono stati sintetizzati nuovi inibitori della  $N^5,N^{10}$ -metilenetetraidrofolato deidrogenasi (FolD), un enzima bifunzionale essenziale per la sopravvivenza del *Trypanosoma brucei* (Tb). Uno dei composti sintetizzati ha mostrato una buona attività antiparassitaria ed è stato co-cristallizzato con TbFolD, ottenendo la prima struttura a raggi X dell'enzima in presenza di NADP<sup>+</sup> e dell'inibitore.

La ricerca di potenziali agenti antitumorali è stata invece rivolta alla progettazione e sintesi di inibitori degli enzimi istone deacetilasi (HDAC) e DNA metiltrasferasi 1. In questo ambito, la chimica è stata supportata dalla tecnologia della flow chemistry, al fine di migliorare l'efficienza e l'economia dei protocolli sintetici.

Più di recente, sono stati sviluppati nuovi composti in grado di modulare l'attività di un'altra deacetilasi, l'enzima SIRT-1, la cui inibizione è stata recentemente correlata all'attività chemopreventiva mostrata da alcuni farmaci antiinfiammatori non-steroidi, grazie ad uno studio in collaborazione, guidato dal Dipartimento di Oncologia ed Emato-Oncologia dell'Università degli Studi di Milano.

## **Tematica 2: Strategie di neuroprotezione basate sulla modulazione del sistema glutammatergico.**

### *a) Nuovi ligandi dei recettori del Glutammato quali agenti neuroprotettivi e anticonvulsivanti.*

L'acido L-glutammico (L-Glu) è il principale neurotrasmettitore eccitatorio del sistema nervoso centrale (SNC) ed è coinvolto nella modulazione di numerosi processi fisiologici quali l'apprendimento, la memoria e la plasticità sinaptica. L'iperattività eccitatoria è correlata ad alcune patologie acute del SNC, quali l'epilessia e l'ischemia cerebrale, e a varie malattie neurodegenerative croniche quali il morbo di Parkinson, la corea di Huntington, la sclerosi laterale amiotrofica e il morbo di Alzheimer. Pertanto, il complesso sistema della trasmissione glutammatergica si è dimostrato un target biologico di rilievo per il trattamento di diverse patologie neurodegenerative e di alcuni disturbi neurologici. L'acido L-glutammico è in grado di attivare recettori specifici appartenenti a due diverse famiglie: i recettori ionotropici (AMPA, KA, NMDA) e i recettori metabotropici (mGluR1-8). La ricerca di nuovi aminoacidi in grado di stabilire interazioni selettive con alcuni sottotipi dei recettori di L-Glu ha lo scopo di contribuire a precisarne il ruolo fisio-patologico. Inoltre, dal punto di vista di un potenziale impiego terapeutico, la selettività per specifici sottotipi recettoriali, che si traduce in un'azione mirata in determinati distretti del sistema nervoso centrale, rappresenta un requisito fondamentale per minimizzare gli effetti collaterali.

Le strategie utilizzate nella progettazione di nuovi ligandi includono:

- la rigidificazione conformazionale, al fine di aumentare la selettività d'azione
- l'omologazione della catena amminoacidica, quale strumento per modulare il profilo farmacologico ed ottenere così composti ad attività antagonista
- la bioisosteria per aumentare la potenza.

Questi studi hanno portato all'identificazione di ligandi selettivi per diversi tipi e sottotipi di recettori dell'acido glutammico, che includono i recettori AMPA, KA, NMDA e i diversi sottotipi di recettori metabotropici mGluR. Tra i risultati più recenti, di particolare rilievo la sintesi di nuovi antagonisti competitivi del recettore NMDA caratterizzati da selettività per il sottotipo recettoriale GluN2A e lo sviluppo di ligandi radiomarcanti come potenziali agenti di imaging per il SNC, in collaborazione con la Johns Hopkins University, negli Stati Uniti.

### *b) Inibizione dei trasportatori degli aminoacidi eccitatori, quale nuovo potenziale approccio al trattamento dell'ischemia cerebrale.*

E' stato dimostrato che lo spegnimento della trasmissione glutammatergica è dovuto in prevalenza alla ricaptazione dell'acido L-glutammico all'interno delle cellule gliali e neuronali. Questo processo, mediato dai trasportatori Na<sup>+</sup>-dipendenti degli aminoacidi eccitatori (EAATs), consente di mantenere i livelli extracellulari di L-Glu al di sotto delle concentrazioni tossiche. In condizioni ischemiche, gli EAATs rilasciano L-Glu, aumentando la concentrazione dello stesso nella fessura sinaptica e provocando una condizione di eccitotossicità. Gli EAATs rappresentano pertanto un bersaglio molecolare per lo sviluppo di nuove strategie terapeutiche, utili in patologie quali l'epilessia o l'ischemia cerebrale. In questo ambito, Paola Conti ha identificato nuovi bloccanti dei trasportatori (**HIP-A** e **HIP-B**) dotati di un peculiare profilo farmacologico, che li rende promettenti dal punto di vista di un potenziale impiego come agenti neuroprotettivi, in quanto capaci di ridurre il danno causato da ischemia cerebrale. Queste molecole, in forma racema, sono state inserite nel catalogo Tocris e sono commercialmente disponibili quali *tools* farmacologici (Tocris, cat. N. 2217/2218).

Dal punto di vista sintetico, l'aspetto caratterizzante le ricerche nell'ambito della tematica 2 (punti a e b) è l'impiego della reazione di cicloaddizione 1,3-dipolare di nitrilossidi e nitrilimine con opportuni dipolarofili, al fine di generare nuovi aminoacidi contenenti nuclei eterociclici

quali la  $\Delta^2$ -isossazolina, l'isossazolo, la  $\Delta^2$ -pirazolina e il pirazolo. In questo ambito, è stata anche sfruttata la tecnologia della *flow chemistry* per aumentare la produttività e l'efficienza delle procedure di sintesi. Particolare attenzione è rivolta alla valutazione dell'impatto della stereochimica sull'attività biologica e alla preparazione, ove possibile, di composti in forma enantiopura.

c) *Inibizione dell'enzima NAALADasi, quale strategia di neuroprotezione alternativa.* L'enzima NAALADasi (N-acetylated- $\alpha$ -linked-acidic dipeptidase) è una neuropeptidasi in grado di idrolizzare il dipeptide N-acetil-L-aspartil-L-glutammato (NAAG), ampiamente diffuso nel SNC dei mammiferi, trasformandolo in N-acetilaspartato e glutammato. Il dipeptide NAAG è un ligando endogeno per alcuni recettori dell'acido glutammico, svolgendo nel complesso un'azione neuroprotettiva. L'inibizione dell'enzima NAALADasi rappresenta pertanto un'efficace strategia per ottenere neuroprotezione, ad esempio in casi di ischemia cerebrale, mediante il contemporaneo aumento dei livelli di NAAG e la diminuzione della concentrazione di glutammato. Durante il periodo trascorso presso il gruppo di ricerca del prof. Alan Kozikowski, Paola Conti ha messo a progettato e sintetizzato nuovi inibitori dell'enzima NAALADasi.

### **Tematica 3: Sviluppo di processi chemo-enzimatici innovativi per la preparazione di composti di interesse farmaceutico e nutraceutico, con un approccio eco-sostenibile.**

Il gruppo di ricerca guidato dalla Prof.ssa Pola Conti si occupa dello sviluppo di metodologie sintetiche innovative basate sull'utilizzo di reattori per *flow chemistry* come complemento, o come alternativa ai classici metodi di sintesi in batch. Il fine ultimo è lo sviluppo di processi multi step in continuo per la sintesi di molecole complesse dotate di attività biologica o di intermedi sintetici ad alto valore aggiunto. La tecnologia della *flow chemistry* rappresenta una notevole innovazione nel campo della sintesi organica e offre vantaggi in termini di sicurezza, costi e inquinamento ambientale (minimizzazione della produzione di rifiuti). Inoltre, al fine di evitare i passaggi di purificazione, costosi e ripetitivi, viene anche sfruttato l'impiego di reattivi e *scavengers* immobilizzati.

Al fine di rendere questo approccio sempre più eco-sostenibile, in linea con i principi della bioeconomia, lo studio dei processi *in-flow* è stato esteso a reazioni bio-catalizzate, utilizzando enzimi immobilizzati o cellule intere. Per quanto riguarda l'isolamento, la purificazione e l'immobilizzazione di enzimi o la produzione di cellule intere, utilizzabili per biotrasformazioni in continuo, il gruppo della Prof.ssa Paola Conti collabora in maniera stabile con il gruppo del Prof. Francesco Molinari (Dipartimento di Scienze per gli Alimenti la Nutrizione e l'Ambiente, Università di Milano) e con il gruppo del Prof. Marco Terreni (Dipartimento di Scienze Farmaceutiche, Università di Pavia).

Le ricerche svolte in tale ambito sono state finanziate da Fondazione Cariplo nell'ambito dei bandi "Ricerca integrata sulle biotecnologie industriali 2014" e "Ricerca integrata sulle biotecnologie industriali e sulla bioeconomia 2016".

#### **COMUNICAZIONI ORALI E SEMINARI SU INVITO**

**2019** "Development of covalent inhibitors of glyceraldehyde-3-phosphate dehydrogenase, an anti-protozoan and anti-cancer drug target". Mini-simposio "Proteins: Structure, Function and Biomedical Applications", Abbazia di Valserena, Parma, 29 marzo 2019.

**2013** "Sviluppo di inibitori enzimatici covalenti per il trattamento di infezioni protozoarie" Mini-simposio "Farmaci antitumorali, medicinali orfani e malattie rare: criticità e prospettive" Università di Salerno, 12 Aprile 2013.

**2011** "Synthesis and Biological Activity of 4,5-Dihydro-1H-pyrazol-5-yl Glycines as Glutamate or Glutamine Analogs" University of Copenhagen, 23 giugno 2011.

**2009.** "Design and synthesis of new neuroprotective agents targeting the glutamatergic system" University of Copenhagen, 27 novembre 2009

**2006** "Design and synthesis of novel acidic amino acids acting at glutamate receptors and transporters", COST Meeting "Enzymatic approaches to the synthesis and manipulation of non-natural amino acids" Barcellona, 18 novembre 2006.

**2005** "Design, synthesis and pharmacological profile of selective ligands for glutamate receptors or transporters". *Second Joint Italian-Swiss Meeting*, Modena, 13 settembre 2005, cerimonia di consegna del *Premio Farindustria* 2005.

#### COMUNICAZIONI ORALI A CONGRESSO A SEGUITO DI SELEZIONE DA PARTE DEL COMITATO SCIENTIFICO

**2010** "CTP synthetase inhibitors as new potential agents for the treatment of African Trypanosomiasis: synthesis and in vitro/in vivo evaluation of trypanocidal activity of 3-Br-Acivicin" 1st iDDi Workshop in Neglected and Orphan Diseases, Siena, 29 Maggio-1 Giugno 2010.

**2008** "Progettazione e sintesi di nuovi agenti neuroprotettivi diretti verso il Sistema glutamatergico" 2° Meeting "Nuove prospettive in chimica farmaceutica", Catanzaro, 16-17 Maggio 2008.

**2005** "(–)-HIP-A and (+)-HIP-B: investigation of the pharmacological profile and potential therapeutic applications", 5<sup>th</sup> *Joint Meeting on Medicinal Chemistry*, Portorož, Slovenia, 17-21 Giugno 2007.

**2003** "Synthesis and pharmacological profile of novel enantiopure NMDA receptor antagonists", *Noordwijkerhout-Camerino Symposium*, Camerino, 7-11 Settembre 2003.

**2002** "Design, Synthesis and pharmacological profile of novel conformationally constrained glutamic acid analogues", *XVI Convegno Nazionale della Divisione di Chimica Farmaceutica*, Sorrento, 18-22 Settembre 2002.

**2001** "Design of novel conformationally constrained amino acids and investigation of their activity at the glutamate receptor subtypes", 13<sup>th</sup> *Noordwijkerhout-Camerino Symposium*, Noordwijkerhout, 6-11 Maggio 2001.

**2000** "Progettazione e sintesi di nuovi analoghi dell'acido glutammico a ridotta libertà conformazionale", *XX Congresso Nazionale della SCI*, Rimini, 4-9 Giugno 2000.

**1998** "Sintesi e valutazione farmacologica di nuovi amminoacidi biciclici ad attività glutamatergica" (relazione sui risultati ottenuti durante il triennio di Dottorato di ricerca), *XVIII Corso Avanzato in Chimica Farmaceutica e Seminario Nazionale per Dottorandi "E. Duranti"*, Urbino, 29 Giugno-3 Luglio 1998.

#### ALTRE COMUNICAZIONI A CONGRESSO

Paola Conti è autrice di 59 comunicazioni a congresso in forma di Poster o comunicazione orale tenuta da altri relatori.

## PUBBLICAZIONI SCIENTIFICHE

Dal 1996 ad oggi, l'attività scientifica della Prof.ssa Paola Conti trova riscontro nella **Tesi di Dottorato**, in **93 pubblicazioni** su rinomate riviste a diffusione internazionale *peer reviewed* e indicizzate, **4 contributi in atti di convegno pubblicati** su riviste con ISSN

## INDICATORI BIBLIOMETRICI (ALLA DATA DEL 02/07/2019) (IF DEDOTTI DA INCITES-JOURNAL CITATION REPORTS - ANNO 2018)

Numero pubblicazioni totali: **93**

Impact factor totale = 374.314

Impact factor medio = 4.025

Numero citazioni totali: **1562** (Scopus)

H-index: **22** (Scopus)

## ELENCO COMPLETO DELLE PUBBLICAZIONI

1. "Electrophoretic separation of biopolymers in a matrix of polyacrylamide covalently linked to agarose" M. Chiari, A. Campoleoni, P. Conti, C. Felli, M. C. Patrosso, C. H. Brogren. *Electrophoresis* **1996**, 17, 473-478. (Impact factor 2.754)
2. "Synthesis and pharmacological characterization of enantiomerically pure muscarinic agonists: difluoromuscarines" P. Angeli, F. Cantalamessa, R. Cavagna, P. Conti, M. De Amici, C. De Micheli, A. Gamba, G. Marucci. *J. Med. Chem.* **1997**, 40, 1099-1103. (Impact factor 6.054)
3. "Synthesis and binding affinity of new muscarinic ligands structurally related to oxotremorine" P. Conti, C. Dallanoce, M. De Amici, C. De Micheli, B. Ebert. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **1997**, 7, 1033-1036. (Impact factor 2.448)
4. "Chemoenzymatic synthesis of the enantiomers of desoxymuscarine" P. Conti, C. Dallanoce, M. De Amici, C. De Micheli, G. Carrea, F. Zambianchi. *Tetrahedron-Asymmetry* **1998**, 9, 657-665. (Impact factor 2.126, anno 2016)
5. "Synthesis of new  $\Delta^2$ -isoxazoline derivatives and their pharmacological characterization as b-adrenergic receptor antagonists" P. Conti, C. Dallanoce, M. De Amici, C. De Micheli, K. N. Klotz. *Bioorg. Med. Chem.* **1998**, 6, 401-408. (Impact factor 2.802)
6. "Synthesis and pharmacology of a new AMPA-Kainate receptor agonist with potent convulsant activity" P. Conti, M. De Amici, G. De Sarro, T. Bryan Stensbøl, H. Bräuner-Osborne, U. Madsen, C. De Micheli. *J. Med. Chem.* **1998**, 41, 3759-3762. (Impact factor 6.054)
7. "Synthesis of new bicyclic analogues of glutamic acid" P. Conti, C. Dallanoce, M. De Amici, C. De Micheli, R. Fruttero. *Tetrahedron* **1999**, 55, 5623-5634. (Impact factor 2.379)
8. "Synthesis and functional characterization of novel derivatives related to Oxotremorine and Oxotremorine-M" C. Dallanoce, P. Conti, M. De Amici, C. De Micheli, E. Barocelli, M. Chiavarini, V. Ballabeni, S. Bertoni, M. Impicciatore. *Bioorg. Med. Chem.* **1999**, 7, 1539-1547. (Impact factor 2.802)
9. "Synthesis and enantiopharmacology of new AMPA-Kainate receptor agonists" P. Conti, M. De Amici, G. De Sarro, M. Rizzo, T. Bryan Stensbøl, H. Bräuner-Osborne, U. Madsen, L. Toma, C. De Micheli. *J. Med. Chem.* **1999**, 42, 4099-4107. (Impact factor 6.054)
10. "Design of new analogues of glutamic acid with a conformationally restricted structure" P. Conti, M. De Amici, C. De Micheli. *Farmaco* **2000**, 55, 162-164. (Impact factor 0.79, anno 2002)

11. "Synthesis and pharmacological characterization of new analogues of Broxaterol" M. De Amici, P. Conti, C. Dallanoce, L. Kassi, S. Castellano, G. Stefancich, C. De Micheli. *Med. Chem. Res.* **2000**, *10*, 69-80. (*Impact factor* 1.72)
12. "New synthesis of 2-aminobicyclo[2.1.1]hexane-2,5-dicarboxylic acid-I (ABHxD-I), a potent metabotropic receptor agonist" P. Conti, A. P. Kozikowski. *Tetrahedron Lett.* **2000**, *41*, 4053-4056. (*Impact factor* 2.259)
13. "A convenient procedure for the synthesis of nonsymmetrical bivalent selective serotonin reuptake inhibitors using polymer-supported reagents" A. P. Tamiz, P. Conti, M. Zhang, K. M. Johnson, A. P. Kozikowski. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2000**, *10*, 2741-2743. (*Impact factor* 2.448)
14. "Design of remarkably simple, yet potent urea-based inhibitors of Glutamate Carboxypeptidase II (NAALADase)" A. P. Kozikowski, F. Nan, P. Conti, J. Zhang, E. Ramadan, T. Bzdega, B. Wroblewska, J. H. Neale, S. Pshenichkin, J. T. Wroblewski. *J. Med. Chem.* **2001**, *44*, 298-301. (*Impact factor* 6.054)
15. "An improved synthesis of enantiomerically pure CIP-AS, a potent and selective AMPA-Kainate receptor agonist" P. Conti\*, G. Roda, F. F. Barberis Negra. *Tetrahedron-Asymmetry* **2001**, *12*, 1363-1367. (*Impact factor* 2.126, anno 2016)
16. "Synthesis and structure-activity relationships in a set of new antimuscarinic agents" M. De Amici, P. Conti, G. Vistoli, G. Carrea, G. Ottolina, C. De Micheli. *Med. Chem. Res.* **2001**, *10*, 615-633. (*Impact factor* 1.72)
17. "Selective agonists and antagonists for kainate receptors" P. Conti\*, M. De Amici, C. De Micheli. *Mini-Reviews in Medicinal Chemistry* **2002**, *2*, 177-184. (*Impact factor* 2.842)
18. "Synthesis and pharmacology of 3-hydroxy- $\Delta^2$ -isoxazoline-cyclopentane analogues of glutamic acid" P. Conti\*, M. De Amici, H. Bräuner-Osborne, U. Madsen, L. Toma, C. De Micheli. *Farmaco* **2002**, *57*, 889-895. (*Impact factor* 0.79, anno 2002)
19. "Design of novel conformationally restricted analogues of glutamic acid" P. Conti, M. De Amici, G. Roda, G. Vistoli, T. B. Stensbøl, H. Bräuner-Osborne, U. Madsen, L. Toma, C. De Micheli. *Tetrahedron* **2003**, *59*, 1443-1452. (*Impact factor* 2.379)
20. "Synthesis and biological evaluation of new amino acids structurally related to the antitumor agent Acivicin" P. Conti\*, G. Roda, H. Stabile, M. A. Vanoni, B. Curti, M. De Amici. *Farmaco* **2003**, *58*, 683-690. (*Impact factor* 0.79, anno 2002)
21. "Synthesis and in vitro pharmacology of novel heterocyclic muscarinic ligands" M. De Amici, P. Conti, E. Fasoli, E. Barocelli, V. Ballabeni, S. Bertoni, M. Impicciatore, B. L. Roth, P. Ernsberger, C. De Micheli. *Farmaco* **2003**, *58*, 739-748. (*Impact factor* 0.79, anno 2002)
22. "Synthesis and anticonvulsant activity of novel bicyclic acidic amino acids" P. Conti, M. De Amici, S. Joppolo di Ventimiglia, T. B. Stensbøl, U. Madsen, H. Bräuner-Osborne, E. Russo, G. De Sarro, G. Bruno, C. De Micheli. *J. Med. Chem.* **2003**, *46*, 3102-3108. (*Impact factor* 6.054)
23. "Design of cyclopentaisoxazoline amino acids as conformationally constrained agonists at glutamate receptors" P. Conti, M. De Amici, G. Grazioso, G. Roda, T. B. Stensbøl, H. Bräuner-Osborne, U. Madsen, L. Toma, C. De Micheli. *Eur. J. Org. Chem.* **2003**, *22*, 4455-4461. (*Impact factor* 3.029)
24. "Enantiopure stereoisomeric homologues of glutamic acid: chemoenzymatic synthesis and assignment of their absolute configurations" G. Roda, P. Conti, M. De Amici, J. He, P. L. Polavarapu, C. De Micheli. *Tetrahedron-Asymmetry* **2004**, *15*, 3079-3090. (*Impact factor* 2.126, anno 2016)
25. "Design, synthesis, and pharmacological characterization of novel, potent NMDA receptor antagonists" P. Conti, M. De Amici, G. Grazioso, G. Roda, F. Barberis Negra, B. Nielsen, T. B. Stensbøl, U. Madsen, H. Bräuner-Osborne, K. Frydenvang, G. De Sarro, L. Toma, C. De Micheli. *J. Med. Chem.* **2004**, *47*, 6740-6748. (*Impact factor* 6.054)

26. "Dissociation of [ $^3\text{H}$ ]L-glutamate uptake from L-glutamate-induced [ $^3\text{H}$ ]D-aspartate release by 3-hydroxy-4,5,6,6a-tetrahydro-3aH-pyrrolo[3,4-d]isoxazole-4-carboxylic acid and 3-hydroxy-4,5,6,6a-tetrahydro-3aH-pyrrolo[3,4-d]isoxazole-6-carboxylic acid, two conformationally constrained aspartate and glutamate analogs" M. Funicello, P. Conti, M. De Amici, C. De Micheli, T. Mennini, M. Gobbi. *Mol. Pharmacol.* **2004**, *66*, 522-529. (Impact factor 3.853)
27. "Synthesis of novel N1-substituted pyrazole amino acids and evaluation of their interaction with glutamate receptors" P. Conti\*, G. Grazioso, S. Joppolo di Ventimiglia, A. Pinto, G. Roda, U. Madsen, H. Bräuner-Osborne, B. Nielsen, C. Costagli, A. Galli. *Chem. Biodivers.* **2005**, *2*, 748-757. (Impact factor 1.449)
28. "Synthesis, binding affinity at glutamic acid receptors, neuroprotective effects, and molecular modeling investigation of novel dihydroisoxazole amino acids" P. Conti, M. De Amici, G. Grazioso, G. Roda, A. Pinto, K. Bø Hansen, B. Nielsen, U. Madsen, H. Bräuner-Osborne, J. Egebjerg, V. Vestri, D. E. Pellegrini-Giampietro, P. Sibille, F. C. Acher, C. De Micheli. *J. Med. Chem.* **2005**, *48*, 6315-6325. (Impact factor 6.054)
29. "Synthesis of 3-hydroxy- and 3-carboxy- $\Delta^2$ -isoxazoline amino acids and evaluation of their interaction with GABA receptors and transporters" P. Conti\*, M. De Amici, A. Pinto, L. Tamborini, G. Grazioso, B. Frølund, B. Nielsen, C. Thomsen, B. Ebert, C. De Micheli. *Eur. J. Org. Chem.* **2006**, *24*, 5533-5542. (Impact factor 3.029)
30. "Synthesis and pharmacological characterization at glutamate receptors of erythro- and threo-tricholomic acid and homologues thereof" P. Conti, M. De Amici, G. Roda, A. Pinto, L. Tamborini, U. Madsen, B. Nielsen, H. Bräuner-Osborne, C. De Micheli. *Tetrahedron* **2007**, *63*, 2249-2256. (Impact factor 2.379)
31. "Synthesis and pharmacological evaluation of novel conformationally constrained homologues of glutamic acid" P. Conti, A. Caligiuri, A. Pinto, G. Roda, L. Tamborini, B. Nielsen, U. Madsen, K. Frydenvang, A. Colombo, C. De Micheli. *Eur. J. Med. Chem.* **2007**, *42*, 1059-1068. (Impact factor 4.833)
32. "A regioselective route to 5-substituted pyrazole- and pyrazoline-3-phosphonic acids and esters" P. Conti\*, A. Pinto, L. Tamborini, V. Rizzo, C. De Micheli. *Tetrahedron* **2007**, *63*, 5554-5560. (Impact factor 2.379)
33. "Stereoselective synthesis of 4-amino-3-hydroxy-4,5,6,6a-tetrahydro-3aH-cyclopenta[d]isoxazole-4-carboxylic acid, a conformationally constrained analogue of aspartic Acid" P. Conti, A. Pinto, G. Roda, L. Tamborini, D. Arosio, C. De Micheli. *Synthesis* **2007**, *14*, 2145-2148. (Impact factor 2.867)
34. "Synthesis of conformationally constrained glutamic acid homologues and investigation of their pharmacological profile" P. Conti\*, A. Pinto, L. Tamborini, G. Grazioso, G. De Sarro, H. Bräuner-Osborne, G. Szabo, L. G. Hársing, C. De Micheli. *ChemMedChem* **2007**, *2*, 1639-1647. (Impact factor 3.016)
35. "Synthesis and pharmacological characterization at glutamate receptors of the four enantiopure isomers of tricholomic acid" A. Pinto, P. Conti\*, M. De Amici, L. Tamborini, U. Madsen, B. Nielsen, T. Christesen, H. Bräuner-Osborne, C. De Micheli. *J. Med. Chem.* **2008**, *51*, 2311-2315. (Impact factor 6.054)
36. "Synthesis of enantiomerically pure HIP-A and HIP-B and investigation of their activity as inhibitors of excitatory amino acid transporters" A. Pinto, P. Conti\*, M. De Amici, L. Tamborini, G. Grazioso, S. Colleoni, T. Mennini, M. Gobbi, C. De Micheli. *Tetrahedron-Asymmetry* **2008**, *19*, 867-875. (Impact factor 2.126, anno 2016)
37. "Enzymatic synthesis of  $\omega$ -carboxy-B-hydroxy-(L)- $\alpha$ -amino acids" F. Sagui, P. Conti, G. Roda, R. Contestabile, S. Riva. *Tetrahedron* **2008**, *64*, 5079-5084. (Impact factor 2.379)
38. "Synthesis of novel pyrrolo[3,4-d]pyrazole-dicarboxylic acids and evaluation of their interaction with glutamate receptors" P. Conti\*, S. Joppolo di Ventimiglia, A. Pinto, L. Tamborini,

F. S. Menniti, J. T. Lazzaro, C. De Micheli. *Chem. Biodivers.* **2008**, *5*, 657-663. (Impact factor 1.449)

39. "Neuroprotective effects of the novel glutamate transporter inhibitor (-)-HIP-A which preferentially inhibits reverse transport (glutamate release) compared to glutamate reuptake" S. Colleoni, A. A. Jensen, E. Landucci, E. Fumagalli, P. Conti, A. Pinto, M. De Amici, D. E. Pellegrini-Giampietro, C. De Micheli, T. Mennini, M. Gobbi. *J. Pharmacol. Exp. Ther.* **2008**, *326*, 646-656. (Impact factor 3.615)

40. "A regioselective route to 5-substituted isoxazole- and isoxazoline-3-phosphonates" P. Conti\*, A. Pinto, L. Tamborini, P. Dunkel, V. Gambaro, G. L. Visconti, C. De Micheli. *Synthesis*, **2009**, *45*, 591-596. (Impact factor 2.867)

41. "A novel simplified synthesis of acivicin" A. Pinto, P. Conti\*, L. Tamborini, C. De Micheli. *Tetrahedron-Asymmetry* **2009**, *20*, 508-511. (Impact factor 2.126, anno 2016)

42. "Synthesis of new  $\beta$ - and  $\gamma$ -benzyloxy-S-glutamic acid derivatives and evaluation of their activity as inhibitors of excitatory amino acid transporters" L. Tamborini, P. Conti\*, A. Pinto, S. Colleoni, M. Gobbi, C. De Micheli. *Tetrahedron* **2009**, *65*, 6083-6089. (Impact factor 2.379)

43. "A highly efficient flow reactor process for the synthesis of N-Boc-3,4-dehydro-L-proline methyl ester" L. Tamborini, P. Conti, A. Pinto, C. De Micheli. *Tetrahedron-Asymmetry* **2010**, *21*, 222-225. (Impact factor 2.126, anno 2016)

44. "Novel 3-carboxy- and 3-phosphono-pyrazoline amino acids acting as potent and selective NMDA antagonists: design, synthesis and pharmacological characterization" P. Conti\*, A. Pinto, L. Tamborini, U. Madsen, B. Nielsen, H. Bräuner-Osborne, K. B. Hansen, E. Landucci, D. E. Pellegrini-Giampietro, G. De Sarro, E. Donato Di Paola, C. De Micheli. *ChemMedChem* **2010**, *5*, 1465-1475. (Impact factor 3.016)

45. "Design and synthesis of novel isoxazole-based HDAC inhibitors" P. Conti\*, L. Tamborini, A. Pinto, L. Sola, R. Ettari, C. Mercurio, C. De Micheli. *Eur. J. Med. Chem.* **2010**, *45*, 4331-4338. (Impact factor 4.833)

46. "Synthesis of 3-aryl/benzyl-4,5,6,6a-tetrahydro-3aHpyrrolo[3,4-d]isoxazole derivatives: a comparison between conventional, microwave-assisted and flow-based methodologies" S. Castellano, L. Tamborini, M. Viviano, A. Pinto, G. Sbardella, P. Conti\*. *J. Org. Chem.* **2010**, *75*, 7439-7442. (Impact factor 4.745)

47. "Regioselective preparation of functionalized isoxazoline derivatives, key intermediates in the synthesis of selective NMDA receptor antagonists" L. Tamborini, A. Pinto, P. Conti, M. Gallanti, M. C. Iannuzzi, L. Lo Presti, C. De Micheli. *Synthesis* **2011**, *8*, 1255-1260. (Impact factor 2.867)

48. "Synthesis of new isoxazoline-based acidic amino acids and investigation of their affinity and selectivity profile at ionotropic glutamate receptors" A. Pinto, P. Conti\*, G. Grazioso, L. Tamborini, U. Madsen, B. Nielsen, C. De Micheli. *Eur. J. Med. Chem.* **2011**, *46*, 787-793. (Impact factor 4.833)

49. "Synthesis and in vitro/in vivo evaluation of the anti-trypanosomal activity of 3-Br-Acivicin, a potent CTP synthetase inhibitor" P. Conti\*, A. Pinto, P. E. Wong, L. L. Major, L. Tamborini, M. C. Iannuzzi, C. De Micheli, M. P. Barrett, T. K. Smith. *ChemMedChem* **2011**, *6*, 329-333. (Impact factor 3.016)

50. "The Glial Glutamate Transporter 1 (GLT1) is expressed by pancreatic  $\beta$ -Cells and prevents glutamate-induced  $\beta$ -cell death" E. S. Di Cairano, A. M. Davalli, L. Perego, S. Sala, V. F. Sacchi, S. La Rosa, G. Finzi, C. Placidi, C. Capella, P. Conti, V. E. Centonze, F. Casiraghi, F. Bertuzzi, F. Folli, C. Perego. *J. Biol. Chem.* **2011**, *286*, 14007-14018. (Impact factor 4.106)

51. "Synthesis and biochemical evaluation of  $\Delta^2$ -isoxazoline derivatives as DNA Methyltransferase 1 inhibitors" S. Castellano, D. Kuck, M. Viviano, J. Yoo, F. López-Vallejo, P. Conti, L. Tamborini, A. Pinto, J. L. Medina-Franco, G. Sbardella. *J. Med. Chem.* **2011**, *54*, 7663-7677. (Impact factor 6.054)



52. "Drug discovery targeting amino acid racemases" P. Conti, L. Tamborini, A. Pinto, A. Blondel, P. Minoprio, A. Mozzarelli, C. De Micheli. *Chem. Rev.* **2011**, *111*, 6919-6946. (*Impact factor* 54.301)
53. "An efficient method for the lipase-catalysed resolution and in-line purification of racemic flurbiprofen in a continuous-flow reactor" L. Tamborini, D. Romano, A. Pinto, A. Bertolani, P. Conti, F. Molinari. *J. Mol. Catal. B-Enzym.* **2012**, *84*, 78-82. (*Impact factor* 2.269, anno 2016)
54. "Evading Pgp Activity in drug-resistant cancer cells: a structural and functional study of antitubulin furan metotica compounds" T. L. Nguyen, M. R. Cera, A. Pinto, L. Lo Presti, E. Hamel, P. Conti, R. Gussio, P. De Wulf. *Mol. Cancer Ther.* **2012**, *11*, 1103-11011. (*Impact factor* 4.856)
55. "One-pot chemoenzymatic synthesis of aldoximes from primary alcohols in water" P. Zambelli, E. Crotti, D. Romano, P. Conti, A. Pinto, L. Tamborini, R. Villa, F. Molinari. *Green Chemistry* **2012**, *14*, 2158-2161. (*Impact factor* 9.405)
56. "Synthesis and biological evaluation of CTP synthetase inhibitors as potential agents for the treatment of African Trypanosomiasis" L. Tamborini, A. Pinto, T. K. Smith, L. L. Major, M. C. Iannuzzi, S. Cosconati, L. Marinelli, E. Novellino, L. Lo Presti, P.E. Wong, M. P. Barrett, C. De Micheli, P. Conti\*. *ChemMedChem* **2012**, *7*, 1623-1634. (*Impact factor* 3.016)
57. "Inhibition of Rhodesain as a novel therapeutic modality for Human African Trypanosomiasis" R. Ettari, L. Tamborini, I. C. Angelo, N. Micale, A. Pinto, C. De Micheli, P. Conti. *J. Med. Chem.* **2013**, *56*, 5637-5658. (*Impact factor* 6.054)
58. "Biotransformation with whole microbial systems in a continuous flow reactor: resolution of (RS)-flurbiprofen using *Aspergillus oryzae* by direct esterification with ethanol in organic solvent" L. Tamborini, D. Romano, A. Pinto, M. Contente, M. C. Iannuzzi, P. Conti, F. Molinari. *Tetrahedron Lett.* **2013**, *54*, 6090-6093. (*Impact factor* 2.259)
59. "Development of rhodesain inhibitors with a 3-bromoisoxazoline warhead" R. Ettari, L. Tamborini, I.C. Angelo, S. Grasso, T. Schirmeister, L. Lo Presti, C. De Micheli, A. Pinto, P. Conti. *ChemMedChem* **2013**, *8*, 2070-2076. (*Impact factor* 3.016)
60. "3-Carboxy-pyrazolinalanine as a new scaffold for developing potent and selective NMDA receptor antagonists" L. Tamborini, A. Pinto, F. Mastronardi, M.C. Iannuzzi, G. Cullia, B. Nielsen, C. De Micheli, P. Conti. *Eur. J. Med. Chem.* **2013**, *68*, 33-37. (*Impact factor* 4.833)
61. "Discovery of covalent inhibitors of glyceraldehyde-3-phosphate dehydrogenase, a target for the treatment of malaria" S. Bruno, A. Pinto, G. Paredi, L. Tamborini, C. De Micheli, V. La Pietra, L. Marinelli, E. Novellino, P. Conti\*, A. Mozzarelli. *J. Med. Chem.* **2014**, *57*, 7465-7471. (*Impact factor* 6.054)
62. "Efficient synthesis of novel glutamate homologues and investigation of their affinity and selectivity profile at ionotropic glutamate receptors" A. Pinto, L. Tamborini, F. Mastronardi, R. Ettari, D. Romano, B. Nielsen, C. De Micheli, P. Conti. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2014**, *24*, 1980-1982. (*Impact factor* 2.448)
63. "Synthesis of (3-hydroxy-pyrazolin-5-yl)glycine based ligands interacting with ionotropic glutamate receptors" A. Pinto, L. Tamborini, F. Mastronardi, R. Ettari, Y. Safoz, L. Bunch, B. Nielsen, A.A. Jensen, C. De Micheli, P. Conti. *Eur. J. Med. Chem.* **2014**, *75*, 151-158. (*Impact factor* 4.833)
64. "Synthesis and biological evaluation of papain-family cathepsin L-like cysteine protease inhibitors containing a 1,4-benzodiazepine scaffold as antiprotozoal agents" R. Ettari, A. Pinto, L. Tamborini, I.C. Angelo, S. Grasso, M. Zappalà, N. Capodicasa, L. Yzeiraj, E. Gruber, M.N. Aminake, G. Pradel, T. Schirmeister, C. De Micheli, P. Conti. *ChemMedChem* **2014**, *9*, 1817-1825. (*Impact factor* 3.016)
65. "Marine microorganisms as source of stereoselective esterases and ketoreductases: kinetic resolution of a prostaglandin intermediate" V. De Vitis, B. Guidi, M.L. Contente, T. Granato, P. Conti, F. Molinari, E. Crotti, F. Mapelli, S. Borin, D. Daffonchio, D. Romano, *Mar. Biotechnol.* **2015**, *17*, 144-152. (*Impact factor* 2.798)

66. "Use of an O-benzyl-(S)-serine containing eluent for the efficient ligand-exchange chromatography-based enantioseparation of constrained glutamate receptor ligands" F. Ianni, R. Sardella, A. Lisanti, N. Giacchè, P. Conti, A. Pinto, L. Tamborini, B. Natalini. *Anal. Lett.* **2015**, *48*, 383-395. (Impact factor 1.248)
67. "Sweet-and-salty biocatalysis: fructooligosaccharides production using *Cladosporium cladosporioides* in seawater" P. Zambelli, I. Serra, F. J. Plou, L. Fernandez-Arrojo, L. Tamborini, P. Conti, M. L. Contente, F. Molinari, D. Romano. *Process Biochem.* **2015**, *50*, 1086-1090. (Impact factor 2.883)
68. "A new chemoenzymatic approach to the synthesis of Latanoprost and Bimatoprost" M. L. Contente, P. Zambelli, S. Galafassi, L. Tamborini, A. Pinto, P. Conti, F. Molinari, D. Romano. *J. Mol. Catal. B-Enzym.* **2015**, *214*, 7-12. (Impact factor 2.269, anno 2016)
69. "Synthesis and pharmacological evaluation of  $\alpha$ 4B2 nicotinic ligands with a 3-fluoropyrrolidine nucleus" L. Tamborini, A. Pinto, R. Ettari, C. Gotti, F. Fasoli, P. Conti, C. De Micheli. *ChemMedChem* **2015**, *6*, 1071-1078. (Impact factor 3.016)
70. "Synthesis of unusual isoxazoline containing  $\beta$  and  $\gamma$ -dipeptides as potential glutamate receptor ligands" L. Tamborini, F. Mastronardi, F. Dall'Oglio, C. De Micheli, B. Nielsen, L. Lo Presti, P. Conti, A. Pinto. *MedChemComm* **2015**, *6*, 1260-1266. (Impact factor 2.394)
71. "Characterization of 2,4-diamino-6-oxo-1,6-dihydropyrimidin-5-yl ureido based inhibitors of *Trypanosoma brucei* FoD and testing for antiparasitic activity" T. C. Eadsforth, A. Pinto, R. Luciani, L. Tamborini, G. Cullia, C. De Micheli, L. Marinelli, S. Cosconati, E. Novellino, L. Lo Presti, A. Cordeiro da Silva, P. Conti\*, W. N. Hunter, M. P. Costi. *J. Med. Chem.* **2015**, *58*, 7938-7948. (Impact factor 6.054)
72. "Development of novel dipeptide-like rhodesain inhibitors containing the 3-bromoisoxazoline warhead in a constrained conformation" R. Ettari, A. Pinto, S. Previti, L. Tamborini, I. C. Angelo, V. La Pietra, L. Marinelli, E. Novellino, T. Schirmeister, M. Zappalà, S. Grasso, C. De Micheli, P. Conti. *Bioorg. Med. Chem.* **2015**, *23*, 7053-7060. (Impact factor 2.802)
73. "Bicyclic  $\gamma$ -amino acids as inhibitors of  $\gamma$ -aminobutyrate aminotransferase" A. Pinto, L. Tamborini, E. Pennacchietti, A. Coluccia, R. Silvestri, G. Cullia, C. De Micheli, P. Conti\*, D. De Biase. *J. Enzyme Inhib. Med. Chem.* **2016**, *31*, 295-301. (Impact factor 4.027)
74. "An efficient continuous flow process for the synthesis of a non-conventional mixture of fructooligosaccharides" P. Zambelli, L. Tamborini, S. Cazzamalli, A. Pinto, S. Arioli, S. Balzaretti, F. J. Plou, L. Fernandez-Arrojo, F. Molinari, P. Conti, D. Romano. *Food Chem.* **2016**, *190*, 607-613. (Impact factor 5.399)
75. "Development of radiolabeled ligands targeting the glutamate binding site of the N-methyl-D-aspartate receptor as potential imaging agents for brain" L. Tamborini, Y. Chen, C. A. Foss, A. Pinto, A. G. Horti, S. F. Traynelis, C. De Micheli, R. C. Mease, K. B. Hansen, P. Conti\*, M. G. Pomper. *J. Med. Chem.* **2016**, *59*, 11110-11119. (Impact factor 6.054)
76. " $\gamma$ -Glutamyl-dipeptides: easy tools to rapidly probe the stereoelectronic properties of the ionotropic glutamate receptor binding pocket", L. Tamborini, V. Nicosia, P. Conti, F. Dall'Oglio, C. De Micheli, B. Nielsen, A. A. Jensen, D. S. Pickering, A. Pinto. *Tetrahedron* **2016**, *72*, 8486-8492. (Impact factor 2.379)
77. "Synthesis and pharmacological evaluation of conformationally constrained glutamic acid higher homologues" L. Tamborini, G. Cullia, B. Nielsen, C. De Micheli, P. Conti, A. Pinto. *Bioorg. Med. Chem.* **2016**, *22*, 5741-5747. (Impact factor 2.802)
- 78 "Synthesis and pharmacological characterization of the selective GluK1 radioligand (: S)-2-amino-3-(6-[<sup>3</sup>H]-2,4-dioxo-3,4-dihydrothieno[3,2- d] pyrimidin-1(2 H)-yl)propanoic acid ([<sup>3</sup>H]-NF608)" A. Alcaide, L. Marconi, A. Marek, I. Haym, B. Nielsen, S. Møllerud, M. Jensen, P. Conti, D. S. Pickering, L. Bunch. *MedChemComm* **2016**, *7*, 2136-2144. (Impact factor 2.394)

79. "Inspired by Nature: the 3-halo-4,5-dihydroisoxazole moiety as a novel molecular warhead for the design of covalent inhibitors", A. Pinto, L. Tamborini, G. Cullia, P. Conti, C. De Micheli, *ChemMedChem* **2016**, *11*, 10-14. (Impact factor 3.016)
80. "Selectivity of 3-bromo-isoxazoline inhibitors between human and *Plasmodium falciparum* glyceraldehyde-3-phosphate dehydrogenases" S. Bruno, M. Margiotta, A. Pinto, G. Cullia, P. Conti, C. De Micheli, A. Mozzarelli. *Bioorg. Med. Chem.* **2016**, *24*, 2654-2659. (Impact factor 2.802)
81. "Synthesis of L-tricholomic acid analogues and pharmacological characterization at ionotropic glutamate receptors" L. Tamborini, F. Mastronardi, L. Lo Presti, B. Nielsen, C. De Micheli, P. Conti, A. Pinto. *ChemistrySelect* **2017**, *2*, 10295-10299. (Impact factor 1.716)
82. "Structure and affinity of two bicyclic glutamate analogues at AMPA and kainate receptors" S. Møllerud, A. Pinto, L. Marconi, K. Frydenvang, T. Seneca Thorsen, S. Laulumaa, R. Venskutonytė, S. Winther, A. M. Cuñado Moral, L. Tamborini, P. Conti\*, D. S. Pickering, J. S. Kastrop *ACS Chem Neurosci.* **2017**, *8*, 2056-2064. (Impact factor 3.861)
83. "Structural basis of subunit selectivity for competitive NMDA receptor antagonists with preference for GluN2A over GluN2B subunits" G. E. Lind, T.-C. Mou, L. Tamborini, M. G. Pomper, C. De Micheli, P. Conti, A. Pinto, K. B. Hansen. *Proc. Natl. Acad. Sci. U. S. A.* **2017**, *114*, E6942-E6951. (Impact factor 9.580)
84. "Chemoenzymatic synthesis in flow reactors: a rapid and convenient preparation of Captopril" V. De Vitis, F. Dall'Oglio, A. Pinto, C. De Micheli, F. Molinari, P. Conti, D. Romano, L. Tamborini. *ChemistryOpen* **2017**, *6*, 668-673. (Impact factor 2.205)
85. "Flow-based stereoselective reduction of ketones using an immobilized ketoreductase/glucose dehydrogenase mixed bed system" F. Dall'Oglio, M. L. Contente, P. Conti, F. Molinari, D. Monfredi, A. Pinto, D. Romano, D. Ubiali, L. Tamborini, I. Serra. *Catal. Commun.* **2017**, *93*, 29-32. (Impact factor 3.674)
86. "UCP2 inhibition induces ROS/Akt/mTOR axis: Role of GAPDH nuclear translocation in genipin/everolimus anticancer synergism" I. Dando, R. Pacchiana, E. D., Pozza, I. Cataldo, S. Bruno, P. Conti, M. Cordani, A. Grimaldi, G. Butera, M. Caraglia, A. Scarpa, M. Palmieri, M. Donadelli. *Free Radic. Biol. Med.* **2017**, *13*, 176-189. (Impact factor 5.657)
87. "Molecular basis for covalent inhibition of glyceraldehyde-3-phosphate dehydrogenase by a 2-phenoxy-1,4-naphthoquinone small molecule" S. Bruno, E. Uliassi, M. Zaffagnini, F. Prati, C. Bergamini, R. Amorati, G. Paredi, M. Margiotta, P. Conti, M. P., Costi, M. Kaiser, A. Cavalli, R. Fato, R., M. L. Bolognesi. *Chem. Biol. Drug Des.* **2017**, *90*, 225-235 (Impact factor 2.256)
88. "Folates in *Trypanosoma brucei*: achievements and opportunities" G. Cullia, L. Tamborini, P. Conti, C. De Micheli, A. Pinto. *ChemMedChem* **2018**, *13*, 2150-2158. (Impact factor 3.016)
89. "Flow-based biocatalysis: application to peracetylated arabinofuranosyl-1,5-arabinofuranose synthesis" T. Bavaro, A. Pinto, F. Dall'Oglio, M. J. Hernáiz, C. F. Morelli, P. Zambelli, C. De Micheli, P. Conti, L. Tamborini, M. Terreni, *Process Biochem.* **2018**, *72*, 112-118. (Impact factor 2.883)
90. Mutant p53 prevents GAPDH nuclear translocation in pancreatic cancer cells favoring glycolysis and 2-deoxyglucose sensitivity. G. Butera, R. Pacchiana, N. Mullappilly, M. Margiotta, S. Bruno, P. Conti, C. Riganti, M. Donadelli, *Biochim. Biophys. Acta-Mol. Cell Res.* **2018**, *1865*, 1914-1923. (Impact factor 4.739)
91. "Inhibition of SIRT1 deacetylase and p53 activation uncouples the anti-inflammatory and chemopreventive actions of NSAIDs" G. Dell'Omo, D. Crescenti, C. Vantaggiato, C. Parravicini, A. P. Borroni, N. Rizzi, M. Garofalo, A. Pinto, C. Recordati, E. Scanziani, F. D. Bassi, G. Pruneri, P. Conti, I. Eberini, A. Maggi, P. Ciana, *Br. J. Cancer* **2019**, *120*, 537-546. (Impact factor 5.416)
92. "Covalent inhibitors of *Plasmodium falciparum* glyceraldehyde 3-phosphate dehydrogenase with antimalarial activity in vitro" G. Cullia, S. Bruno, S. Parapini, M. Margiotta, L. Tamborini, A.

Pinto, A. Galbiati, A. Mozzarelli, M. Persico, A. Paladino, C. Fattorusso, D. Taramelli, P. Conti\*  
*ACS Med Chem Lett.* **2019**, *10*, 590-595. (*Impact factor* 3.737)

93. "Development of an integrated chromatographic system for  $\omega$ -transaminase-IMER characterization useful for flow-chemistry applications" M. Corti, F. Rinaldi, D. Monti. E. E. Ferrandi, G. Marrubinia, C. Temporini, G. Tripodo. T. Kupfer, P. Conti, M. Terreni, G. Massolini, E. Calleri. *J. Pharm. Biomed. Anal.* **2019**, *169*, 260-268. (*Impact factor* 2.983)

#### TESI DI DOTTORATO

"Sintesi e valutazione farmacologica di nuovi amminoacidi biciclici ad attività glutammatergica"  
Docente guida: Prof. Carlo De Micheli.

#### ABSTRACT PUBBLICATI SU RIVISTE

1. "CIP-A, a new potent AMPA/Kainate receptor agonist, induces glutamate release in astrocytes: comparison with AMPA" A. A. Volterra, P. Bezzi, P. Panzarasa, M. De Amici, P. Conti, C. De Micheli. *Eur. J. Pharm. Sci.* **1998**, *6/Suppl. 1*, 6.

2. "Synthesis and pharmacology of a potent AMPA/Kainate receptor agonist" P. Conti, M. De Amici, G. De Sarro, T. B. Stensbøl, H. Bräuner-Osborne, U. Madsen, C. De Micheli *Eur. J. Pharm. Sci.* **1998**, *6/Suppl. 1*, 33.

3. "From potent AMPA/KA agonists to either selective NMDA antagonists or to inhibitors of the glutamate transporters" C. De Micheli, P. Conti, A. Pinto, L. Tamborini. *Amino Acids* **2011**, *41*, S44-S45.

4. The Glial Glutamate Transporter 1 (GLT1) is expressed by pancreatic  $\beta$ -Cells and prevents glutamate-induced  $\beta$ -cell death" E. S. Di Cairano, A. M. Davalli, L. Perego, S. Sala, V. F. Sacchi, S. La Rosa, C. Placidi, C. Capella, P. Conti, V. E. Centonze, F. Casiraghi, F. Bertuzzi, F. Folli, C. Perego. *Endocrine Reviews* **2011**, *32*, P2-479.

Data

02/07/2019

Luogo

Milano