

**Allegato n. 1 al verbale n. 3 della Relazione finale riassuntiva**

**CODICE CONCORSO 2020PAR021**

**PROCEDURA VALUTATIVA DI CHIAMATA PER LA COPERTURA DI N 1 POSTO DI PROFESSORE DI II FASCIA AI SENSI DELL'ART. 24, COMMA 6 DELLA LEGGE N.240/2010 - PER IL SETTORE CONCORSUALE 03/D1 SETTORE SCIENTIFICO DISCIPLINARE CHIM/08 PRESSO IL DIPARTIMENTO DI CHIMICA E TECNOLOGIE DEL FARMACO INDETTA CON D.R. N. 2177/2020 DEL 27/08/2020**

**Candidato Dott. LUIGI SCIPIONE**

**Profilo curriculare**

Il Dott. Luigi Scipione ha conseguito la laurea in Chimica e Tecnologia Farmaceutiche nel 1990 presso l'Università degli Studi di Roma "La Sapienza".

Nel 1995 ha conseguito il titolo di Dottore di ricerca in Scienze Farmaceutiche discutendo una tesi su agenti che modulano il rilascio di sostanze bioattive a livello cerebrale. Nello stesso anno ha usufruito di una borsa di studio presso il Centro di Elettrochimica e Chimica-Fisica delle Interfasi del CNR

Dal 1996 al 1999 ha ricoperto il ruolo di ricercatore presso l'Università degli Studi di Roma "La Sapienza", e dal 2000 ad oggi è in servizio come ricercatore confermato.

Nel 2018 ha conseguito l'Abilitazione Scientifica Nazionale per la II fascia, per il Settore concorsuale 03/D1.

L'*attività didattica* del dott. Luigi Scipione è stata svolta presso l'Università degli Studi di Roma "La Sapienza".

Dal 1999 al 2004 il dott. Scipione ha tenuto l'insegnamento di "Metodologie Avanzate in Chimica Farmaceutica" del corso di laurea in Chimica e Tecnologia Farmaceutiche.

Dal 2002 al 2012 ha tenuto l'insegnamento di "Analisi Chimico-Farmaceutica e Tossicologica" del corso di laurea in Farmacia.

Dal 2013 al 2020 ha tenuto il corso di "Analisi dei Medicinali I" del corso di laurea in Farmacia.

Tra il 2013 e il 2020 è stato tutor di due studenti di dottorato di ricerca, e di studenti per tesi di laurea sperimentali e compilative.

Negli anni 2019 e 2020 è stato *membro di società*, quali la Divisione di Chimica Farmaceutica della Società Chimica Italiana e la Federazione Europea di Chimica Farmaceutica.

A partire dal 1998 il dott. Luigi Scipione ha partecipato a *progetti di ricerca* che sono risultati finanziati:

1998-1999, PRIN 1997, Prot. 9703228605\_020, investigatore;  
2001-2002, PRIN 2001, Prot. 2001033877\_005, investigatore;  
2003-2004, PRIN 2003, Prot. 2003034531\_003, investigatore e PI;  
2006-2008, PRIN 2005, Prot. 2005037894\_005, investigatore principale;  
2010-2012, PRIN 2008, Prot. 2008CE75SA\_001, investigatore;  
2013-2016, PRIN 2010-11, Prot. 2010W2KM5L\_002, investigatore;  
2015, Ateneo Sapienza, Prot. C26H15WYPW, investigatore;  
2016, Ateneo Sapienza, Prot. RM116154C9A02AC1, investigatore;  
2016, Startup Sapienza, Prot. AR116154A4BD65F8;  
2017, MIUR, Agenzia nazionale valutazione sistema universitario;  
2017, Ateneo Sapienza, Prot. RG11715C7EB6A275, investigatore;  
2018, Startup Sapienza, Prot. AR118164316B59CC;  
2018, Ateneo Sapienza, Prot. RG118164363A8632, investigatore;  
2019, Ateneo Sapienza, Prot. RP11916B6ECA91C1, principale investigatore.

L'*attività di ricerca* del dott. Luigi Scipione è stata incentrata su diversi aspetti della chimica farmaceutica, in particolare sulla progettazione e sulla sintesi di molecole bioattive, inclusa la loro

purificazione e caratterizzazione delle proprietà chimico-fisiche, nel campo dei farmaci del sistema nervoso centrale, antifungini, antiparassitari, antivirali, antibatterici e antitubercolari, e antitumorali. Nella prima parte l'attività di ricerca del dott. Scipione è stata incentrata su progettazione e sintesi di sistemi di delivery di molecole ad attività redox come neurotrasmettitori ed agenti colinergici. Successivamente la ricerca è ha riguardato composti colinergici potenzialmente utili nel trattamento di disordini neurologici come la malattia di Alzheimer. La ricerca nel campo degli antifungini ha riguardato inibitori azolici del CYP51 attivi verso il biofilm di *Candida* spp, ed estratti di piante come coadiutori degli antifungini. Nel campo degli agenti antiprotozoari la ricerca è stata focalizzata su inibitori azolici inibitori della tripanotione reduttasi. Nel campo degli antivirali sono stati sintetizzati inibitori dell'integrasi e della ribonucleasi H dell'HIV. Parte del lavoro è stato dedicato ad agenti antitumorali aventi come target TDT, eparinasi, Pcd4 e p300. Nel campo degli agenti antibatterici la ricerca è stata orientata all'ottenimento di nuovi agenti antitubercolari. Per l'attività di ricerca il dott. Luigi Scipione si è avvalso di varie collaborazioni con gruppi di ricerca nazionali e internazionali.

#### *Produzione scientifica complessiva*

Il dott. Luigi Scipione è autore complessivamente di 53 lavori scientifici pubblicati tra il 1996 e il 2020.

#### *Indici bibliometrici dichiarati dal candidato nella domanda*

Impact factor totale 184.641

Citazioni 666

Media citazioni per prodotto 12.6

Indice di Hirsch (H) 16

Indice H normalizzato\* 0.67

\* Indice H diviso per l'anzianità accademica

#### *Pubblicazioni selezionate dal candidato*

##### Pubblicazione n. 1.

Autori: Bortolami, M; Pandolfi, F; De Vita, D; Carafa, C; Messori, A; Di Santo, R; Feroci, M; Costi, R; Chiarotto, I; Bagetta, D; Alcaro, S; Colone, M; Stringaro, A; Scipione, L

Titolo: New deferiprone derivatives as multi-functional cholinesterase inhibitors: design, synthesis and in vitro evaluation

Rivista: EUROPEAN JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY. 2020, 198, art n. 112350

IF della rivista: 5,572

Citazioni: 0

ISSN: 02235234

Editore: Elsevier

*Il lavoro riporta la sintesi di derivati piridinici e pirimidinici del deferiprone, valutazione in vitro della loro attività come inibitori multifunzionali delle colinesterasi, delle loro capacità chelante di biometalli, e della citotossicità. Studio in silico per valutare il binding mode su AChE e BChE e la capacità di superare la BEE. Il candidato è corresponding author. Il suo contributo ha riguardato la progettazione dei composti e la sintesi chimica, la valutazione dell'inibizione enzimatica e di chelazione dei metalli. Il contributo del candidato è enucleabile. Il lavoro è coerente con le declaratorie del Settore Concorsuale 03/D1 e le tematiche del SSD CHIM/08. Sono apprezzabili originalità e rigore metodologico.*

##### Pubblicazione n. 2

Autori: Pandolfi, F; D'Acerno, F; Bortolami, M; De Vita, D; Gallo, F; De Meo, A; Di Santo, R; Costi, R; Simonetti, G; Scipione, L

Titolo: Searching for new agents active against *Candida albicans* biofilm: A series of indole derivatives, design, synthesis and biological evaluation

Rivista: EUROPEAN JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY. 2019,165, 93-106

IF della rivista: 5,572

Citazioni: 8

ISSN: 02235234

Editore: Elsevier

*Il lavoro descrive la sintesi di derivati indolici, a struttura amminica o ammidica o incorporanti FANS, come potenziali interferenti con il quorum sensing fungino e valutazione della loro attività su biofilm*

*in formazione o preformato di Candida albicans. Il candidato è corresponding author, il suo contributo ha riguardato la progettazione e la sintesi dei composti. Il contributo del candidato è enucleabile. Il lavoro è coerente con le declaratorie del Settore Concorsuale 03/D1 e le tematiche del SSD CHIM/08. Il lavoro è originale e condotto con rigore metodologico.*

Pubblicazione n. 3

Autori: Pandolfi, F; De Vita, D; Bortolami, M; Coluccia, A; Di Santo, R; Costi, R; Andrisano, V; Alabiso, F; Bergamini, C; Fato, R; Bartolini, M; Scipione, L

Titolo: New pyridine derivatives as inhibitors of acetylcholinesterase and amyloid aggregation

Rivista: EUROPEAN JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY. 2017, 141, 197-210

IF della rivista: 4,816

Citazioni: 9

ISSN: 02235234

Editore: Elsevier

*La pubblicazione riporta la sintesi di derivati piridinici, la valutazione in vitro della loro attività come inibitori multifunzionali delle colinesterasi, delle loro capacità di inibizione dell'aggregazione amiloide e della citotossicità. Studi di molecular modeling per valutare il binding mode su AChE e BChE e predizione in silico delle proprietà ADME e capacità di superare la BEE. Il candidato è corresponding autor. Il suo contributo ha riguardato la progettazione dei composti, la sintesi chimica e la valutazione dell'inibizione enzimatica. Il contributo del candidato è enucleabile. Il lavoro è coerente con le declaratorie del Settore Concorsuale 03/D1 e le tematiche del SSD CHIM/08. Il lavoro è stato condotto con originalità e rigore metodologico.*

Pubblicazione n. 4

Autori: De Vita, D; Angeli, A; Pandolfi, F; Bortolami, M; Costi, R; Di Santo, R; Suffredini, E; Ceruso, M; Del Prete, S; Capasso, C; Scipione, L; Supuran, CT

Titolo: Inhibition of the alpha-carbonic anhydrase from Vibrio cholerae with amides and sulfonamides incorporating imidazole moieties

Rivista: JOURNAL OF ENZYME INHIBITION AND MEDICINAL CHEMISTRY. 2017, 32(1), 798-804

IF della rivista: 3,638

Citazioni: 20

ISSN: 1475-6366

Editore: Taylor & Francis

*Questo lavoro descrive la sintesi di nuovi derivati solfonamidici a base imidazolica, la valutazione delle loro attività come inibitori selettivi dell' $\alpha$ -anidrasi carbonica di Vibrio cholerae e delle proprietà antibatteriche, al fine di un loro potenziale utilizzo nelle infezioni da V. cholerae. Il candidato è corresponding autor, il suo contributo ha riguardato la progettazione dei composti e la sintesi chimica. Il lavoro è coerente con le declaratorie del Settore Concorsuale 03/D1 e le tematiche del SSD CHIM/08. Il lavoro appare condotto con originalità e rigore metodologico.*

Pubblicazione n. 5

Autori: De Vita, D; Simonetti, G; Pandolfi, F; Costi, R; Di Santo, R; D'Auria, FD; Scipione, L

Titolo: Exploring the anti-biofilm activity of cinnamic acid derivatives in Candida albicans

Rivista: BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS. 2016, 26(24), 5931-5935

IF della rivista: 2,454

Citazioni: 13

ISSN: 0960-894X

Editore: Elsevier

*Il lavoro riporta la progettazione e la sintesi di una serie di esteri ed ammidi dell'acido cinnamico e valutazione in vitro della loro attività verso le cellule planctoniche e verso il biofilm di C. albicans, preformato ed in formazione. Il candidato è corresponding autor. Il suo contributo ha riguardato la progettazione dei composti e la sintesi chimica. Il lavoro è coerente con le declaratorie del Settore Concorsuale 03/D1 e le tematiche del SSD CHIM/08. Originalità e rigore metodologico del lavoro sono identificabili.*

Pubblicazione n. 6

Autori: De Vita, D; Moraca, F; Zamperini, C; Pandolfi, F; Di Santo, R; Matheussen, A; Maes, L; Tortorella, S; Scipione, L

Titolo: In vitro screening of 2-(1H-imidazol-1-yl)-1-phenylethanol derivatives as antiprotozoal agents and docking studies on Trypanosoma cruzi CYP51

Rivista: EUROPEAN JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY. 2016, 113, 28-33

IF della rivista: 4,519 Citazioni: 15

ISSN: 02235234

Editore: Elsevier

*La pubblicazione descrive la progettazione e la sintesi di una serie di derivati fenilettilimidazolici come potenziali inibitori del CYP51 e valutazione in vitro della loro attività antiparassitaria con identificazione di composti attivi a concentrazioni nM su T. cruzi; studio di molecular docking volto a razionalizzare la selettività dell'azione antiparassitaria. Il candidato è ultimo autore. Il suo contributo ha riguardato la progettazione dei composti e la sintesi chimica. Il lavoro è coerente con le declaratorie del Settore Concorsuale 03/D1 e le tematiche del SSD CHIM/08. Sono apprezzabili originalità e rigore metodologico.*

Pubblicazione n. 7

Autori: De Vita, D; Pandolfi, F; Ornano, L; Feroci, M; Chiarotto, I; Sileno, I; Pepi, F; Costi, R; Di Santo, R; Scipione, L

Titolo: New N,N-dimethylcarbamate inhibitors of acetylcholinesterase: design synthesis and biological evaluation

Rivista: JOURNAL OF ENZYME INHIBITION AND MEDICINAL CHEMISTRY. 2016, 31 S4, 106-113

IF della rivista: 4,293

Citazioni: 7

ISSN: 1475-6366

Editore: Taylor & Francis

*Il lavoro riporta la sintesi di derivati N,N-dimetil-O-alcil-aril carbammati, la valutazione in vitro della loro attività e del meccanismo di inibizione delle acetilcolinesterasi. Studio di molecular modeling per valutare il binding mode su AChE. Il candidato è corresponding author. Il suo contributo ha riguardato la progettazione dei composti, la sintesi chimica, la valutazione dell'inibizione enzimatica e gli studi di docking molecolare. Il lavoro è coerente con le declaratorie del Settore Concorsuale 03/D1 e le tematiche del SSD CHIM/08. Il lavoro mostra originalità ed è stato condotto con rigore metodologico. L'originalità e il rigore metodologico del lavoro sono apprezzabili.*

Pubblicazione n. 8

Autori: Friggeri, L; De Vita, D; Pandolfi, F; Tortorella, S; Costi, R; Di Santo, R; Scipione, L

Titolo: Design, synthesis and evaluation of 3,4-dihydroxybenzoic acid derivatives as antioxidants, bio-metal chelating agents and acetylcholinesterase inhibitors

Rivista: JOURNAL OF ENZYME INHIBITION AND MEDICINAL CHEMISTRY. 2015, 30(1), 166-172

IF della rivista: 3,428 Citazioni: 6

ISSN: 1475-6366

Editore: Taylor & Francis

*La pubblicazione descrive la sintesi di derivati dell'acido 3,4-diidrossibenzoico, la valutazione in vitro della loro attività e del meccanismo di inibizione delle acetilcolinesterasi, delle loro proprietà antiossidanti e chelanti verso biometalli e studio di molecular modeling per valutare il binding mode su AChE. Il candidato è ultimo autore. Il suo contributo ha riguardato la progettazione dei composti, la sintesi chimica, la valutazione dell'inibizione enzimatica e l'attività antiossidante e di chelazione dei metalli. Il lavoro è coerente con le declaratorie del Settore Concorsuale 03/D1 e le tematiche del SSD CHIM/08. Il lavoro è originale ed è stato condotto con rigore metodologico.*

Pubblicazione n. 9

Autori: Moraca, F; De Vita, D; Pandolfi, F; Di Santo, R; Costi, R; Cirilli, R; D'Auria, FD; Panella, S; Palamara, AT; Simonetti, G; Botta, M; Scipione, L

Titolo: Synthesis, biological evaluation and structure-activity correlation study of a series of imidazol-based compounds as Candida albicans inhibitors

Rivista: EUROPEAN JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY. 2014, 83, 665-673

IF della rivista: 3,447

Citazioni: 18

ISSN: 02235234

Editore: Elsevier

*La pubblicazione descrive la sintesi di derivati fenilettilimidazolici come potenziali inibitori di CYP51 fungino, valutazione in vitro dell'attività su diverse specie fungine e studio 3D-QSAR (CoMFA) per correlare le caratteristiche strutturali alla potenza antifungina. Il candidato è corresponding author, il*

*suo contributo ha riguardato la progettazione dei composti e la sintesi chimica. Il lavoro è coerente con le declaratorie del Settore Concorsuale 03/D1 e le tematiche del SSD CHIM/08. Sono apprezzabili originalità e rigore metodologico.*

Pubblicazione n. 10

Autori: De Vita, D; Friggeri, L; D'Auria, FD; Pandolfi, F; Piccoli, F; Panella, S; Palamara, AT; Simonetti, G; Scipione, L; Santo, R; Costi, R; Tortorella, S

Titolo: Activity of caffeic acid derivatives against *Candida albicans* biofilm

Rivista: BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS. 2014, 24(6), 1502-1505

IF della rivista: 2,420

Citazioni: 34

ISSN: 0960-894X

Editore: Elsevier

*Il lavoro riporta la progettazione e sintesi di una serie di derivati dell'acido caffeico e valutazione in vitro della loro attività verso cellule planctoniche e verso biofilm di C. albicans, preformato ed in formazione. Il candidato è corresponding author. Il suo contributo ha riguardato la progettazione dei composti e la sintesi chimica. Il lavoro è coerente con le declaratorie del Settore Concorsuale 03/D1 e le tematiche del SSD CHIM/08. Il lavoro mostra buona originalità e rigore metodologico.*

Pubblicazione n. 11

Autori: De Vita, D; Scipione, L; Tortorella, S; Mellini, P; Di Rienzo, B; Simonetti, G; D'Auria, FD; Panella, S; Cirilli, R; Di Santo, R; Palamara, AT

Titolo: Synthesis and antifungal activity of a new series of 2-(1H-imidazol-1-yl)-1-phenylethanol derivatives

Rivista: EUROPEAN JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY. 2012, 49, 334-342

IF della rivista: 3,499

Citazioni: 28

ISSN: 02235234

Editore: Elsevier

*La pubblicazione descrive la sintesi di derivati fenilettilimidazolici come potenziali inibitori di CYP51 fungino, la valutazione in vitro dell'attività su diverse specie di Candida e la valutazione della tossicità in vitro. Il candidato è corresponding author, il suo contributo ha riguardato la progettazione dei composti e la sintesi. Il lavoro è coerente con le declaratorie del Settore Concorsuale 03/D1 e le tematiche del SSD CHIM/08. L'originalità e il rigore metodologico del lavoro sono rilevabili.*

Pubblicazione n. 12

Autori: Scipione, L; De Vita, D; Musella, A; Flammini, L; Bertoni, S; Barocelli, E

Titolo: 4-Aminopyridine derivatives with anticholinesterase and anti-amnesic activity

Rivista: BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS. 2008, 18(1), 309-312

IF della rivista: 2,531

Citazioni: 13

ISSN: 0960-894X

Editore: Elsevier

*Il lavoro riporta la sintesi di derivati piridinici, la valutazione in vitro della potenza e del meccanismo di inibizione delle colinesterasi, Valutazione in vivo delle loro capacità anti-amnesiche in modelli animali della malattia di Alzheimer. Il candidato è corresponding author. Il suo contributo ha riguardato la progettazione dei composti, la sintesi chimica e la valutazione dell'inibizione enzimatica. Il lavoro è coerente con le declaratorie del Settore Concorsuale 03/D1 e le tematiche del SSD CHIM/08. L'originalità del lavoro e il rigore metodologico del lavoro sono rilevabili.*

### **Valutazione collegiale del profilo curricolare**

Il dott. Luigi Scipione è ricercatore a tempo indeterminato dal 1996 (ricercatore confermato dal 1999) per il settore CHIM/08 presso l'Università degli Studi di Roma "La Sapienza". Ha conseguito la laurea in Chimica e tecnologia del farmaco nel 1990 e il Dottorato di ricerca in Scienze farmaceutiche 1995 presso l'Università di Roma "La Sapienza"; nello stesso anno ha usufruito di una borsa di studio del CNR. La Commissione valuta la formazione del candidato di buon livello. Il candidato ha svolto con intensità e continuità attività didattica in materie del settore chimico farmaceutico: dal 1999 al 2004 "Metodologie avanzate in chimica farmaceutica" per il corso di laurea in CTF; dal 2002 al 2012 "Analisi chimico-farmaceutica e tossicologica" per il corso di laurea in Farmacia; dal 2013 al 2020 "Analisi dei medicinali I" del corso di laurea in Farmacia. Ha partecipato come organizzatore al

convegno italiano XXII NMMC "National Meeting on Medicinal Chemistry, Roma, 10-13 settembre 2013 e dal 2018 al 2020 ha partecipato alla Commissione qualità del corso di laurea in Farmacia. Nel 2018 ha conseguito l'Abilitazione Scientifica Nazionale per la II fascia, per il Settore concorsuale 03/D1. Il candidato possiede un ottimo curriculum scientifico con pubblicazioni su riviste internazionali ad alto impatto. L'attività di ricerca e la didattica sono pienamente congruenti sia con il settore concorsuale 03/D1 sia con le tematiche del settore chimico farmaceutico oggetto della presente procedura. Complessivamente, la Commissione ritiene che i titoli del candidato siano di livello ottimo.

#### **Valutazione di merito complessiva dell'attività di ricerca**

La produzione scientifica del dott. Luigi Scipione è focalizzata sul settore concorsuale 03/D1, e in particolare sulle tematiche del settore scientifico disciplinare CHIM/08. L'attività di ricerca è stata incentrata particolarmente su progettazione e sintesi di molecole bioattive nel campo dei farmaci del sistema nervoso centrale, antifungini, antiparassitari, antivirali, antibatterici e antitubercolari, e antitumorali. La produzione complessiva del dott. Luigi Scipione è di 53 pubblicazioni scientifiche a stampa in riviste internazionali ad elevato fattore di impatto. Le pubblicazioni del candidato relative agli ultimi 5 anni e allegate alla domanda, ammontano a 26. La produzione scientifica, considerando l'arco temporale, appare intensa e continuativa. Gli indici bibliometrici dichiarati dal candidato (IF = 184,641; H-index = 16; citazioni totali = 666) sono ottimi. La Commissione ritiene che la produzione scientifica complessiva del candidato sia di livello ottimo. Il candidato ha presentato 12 pubblicazioni per la valutazione analitica. I 12 lavori sono pubblicati su riviste internazionali ad alto impatto scientifico. Il ruolo del candidato è sempre enucleabile, come si evince dal curriculum complessivo presentato. Il candidato dimostra una buona autonomia scientifica come si evince dai lavori selezionati. La Commissione ritiene che le 12 pubblicazioni presentate dal candidato siano di livello ottimo.

#### **Lavori in collaborazione**

Il candidato non presenta lavori in collaborazione con i membri della Commissione.

Letto, approvato e sottoscritto.

Roma, 3 novembre 2020

LA COMMISSIONE:

Prof. Romano Silvestri, Presidente

Prof.ssa Patrizia Diana, Componente

Prof. Sandro Cosconati, Componente segretario

**N.B. Tutte le suindicate valutazioni fanno parte integrante del verbale e pertanto devono essere siglate da tutti i commissari.**