



di Luisa Mosti  
Presidente SCI-Divisione  
di Chimica Farmaceutica  
mosti@unige.it

## LA DIVISIONE DI CHIMICA FARMACEUTICA NEL CENTENARIO DELLA SOCIETÀ CHIMICA ITALIANA

*Il 2009 ha, per tutti i chimici italiani, uno speciale significato: è l'anno in cui la Società Chimica Italiana (SCI) celebra il centenario e la Divisione di Chimica Farmaceutica, parte integrante della SCI, ha operato per onorare questa ricorrenza, curando con particolare attenzione tutti gli eventi da essa sponsorizzati.*

**S**empre più precisi, capaci di colpire dove necessario, concentrando i propri effetti su un preciso target che sta alla base di una determinata patologia, costruiti grazie anche alle più moderne tecnologie informatiche, che consentono di disegnare la molecola attiva direttamente sullo schermo, visualizzarne le interazioni a livello molecolare con il target biologico e addirittura personalizzarla inserendo sostituenti individuati in funzione del patrimonio genetico individuale: questo l'identikit dei farmaci del prossimo futuro, che promettono di aiutarci a controllare i sintomi e, nel migliore dei casi, a curare e risolvere patologie quali le tumorali, le cardiovascolari, le neurodegenerative, le metaboliche ed anche quelle definite "rare".

Queste speranze non appaiono utopistiche, considerando quanta strada hanno fatto le scienze farmaceutiche negli ultimi anni. I ricercatori del settore sono, in tutto il mondo, impegnati per migliorare ancora la qualità di vita dell'uomo, sia sano che malato.

La Divisione di Chimica Farmaceutica e tutti i chimici farmaceutici italiani sono impegnati in questa sfida. Ne sono prova le numerose iniziative scientifiche e didattiche che la Divisione ha sponsorizzato e coordinato in particolare nel 2009. Tali iniziative sono state realizzate nello spirito non solo dello sviluppo di una ricerca farmaceutica mirata, ma anche con una particolare attenzione alla formazione di giovani e validi ricercatori che, come in ogni realtà scientifica, sono la base e la garanzia per il successo della ricerca.

Dal 13 al 14 febbraio 2009, i chimici farmaceutici della Facoltà di Far-

macchia dell'Università di Pisa, con il patrocinio della Divisione di Chimica Farmaceutica hanno riproposto ed organizzato il *III Meeting - Nuove Prospettive in Chimica Farmaceutica* - presso lo stupendo centro residenziale "il Ciocco" di Castelvecchio Pascoli (Lucca).

Anche questa terza edizione, proseguendo la tradizione delle precedenti tenutesi a Salerno e Catanzaro, ha avuto come principale obiettivo quello di riunire giovani ricercatori ed esponenti accademici ed industriali operanti nella chimica farmaceutica e nelle discipline ad essa affini, di facilitare il più possibile l'interscambio di informazioni creando nuovi sinergismi e nuove collaborazioni tra i gruppi di ricerca partecipanti.

Al fine di coinvolgere quanto più attivamente i giovani ricercatori al meeting, sono state organizzate tavole rotonde introdotte e moderate da parte di un ricercatore attivo ed esperto nella specifica tematica trattata, cui hanno fatto seguito interventi programmati riservati ai giovani e discussioni estese a tutti i partecipanti.

Si è trattato quindi di un evento dedicato ai giovani, differente dai tradizionali convegni o congressi, dove anche i giovani non strutturati hanno avuto ampio spazio per promuovere le loro ricerche, discuterle criticamente con i loro colleghi, dare e ricevere nuove idee.

La validità dell'iniziativa è stata confermata anche dal sostegno economico che numerosi enti ed aziende hanno voluto portare, in particolare la Fondazione Sanofi-Aventis.

Il meeting è stato concluso dall'interessante tavola rotonda "Quali prospettive per i giovani?" alla quale sono intervenuti esponenti della politica, dell'industria e dell'accademia, risultata essere un momento idea-

le di discussione per disegnare il futuro di un settore dove, pur essendo presenti potenziali prospettive, i giovani trovano sovente difficoltà ad inserirsi.

Dall'incontro è emerso chiaramente come, anche il mondo dell'industria, ed in particolare quello dell'industria farmaceutica, giochi un ruolo determinante, soprattutto se inserito in un contesto di collaborazione con gli altri centri di studio e con il mondo accademico, nella promozione del valore "ricerca" in Italia.

Anche per l'anno 2009, la Divisione di Chimica Farmaceutica ha sponsorizzato le Scuole che costituiscono un fiore all'occhiello della Divisione stessa, organizzate come sempre con particolare attenzione e professionalità dai direttori Gloria Cristalli, Vincenza Andrisano e Federico Corelli.

L'ottava edizione del "Laboratorio di Metodologie Sintetiche in Chimica Farmaceutica", si è svolta sotto la direzione di Federico Corelli presso l'Università di Siena nel periodo 15-19 febbraio 2009.

Con questa attività formativa, la Divisione di Chimica Farmaceutica intende annualmente fornire a giovani ricercatori dell'università e dell'industria un'importante occasione per l'acquisizione teorica e pratica di nuove metodologie per la sintesi di farmaci.

Le metodologie sintetiche svolgono un ruolo fondamentale sia nella ricerca farmaceutica industriale che accademica. La rapida evoluzione ed innovazione di una varietà di tecniche e di approcci metodologici rende necessario un costante aggiornamento teorico-pratico per chiunque sia impegnato nella ricerca chimico-farmaceutica avanzata.

A tutti i partecipanti è stata offerta l'occasione di seguire lezioni teoriche di alto contenuto scientifico ma soprattutto di lavorare in laboratorio di sintesi applicata con l'utilizzo di metodologie avanzate.

I relatori ed i tutori sono stati eminenti ricercatori dell'università e dell'industria operanti nel campo della chimica farmaceutica di sintesi sia italiana che europea. L'"VIII Laboratorio" ha trattato: Chimica di processo, Flow chemistry, Reazioni e catalisi in liquidi ionici, Reazioni radicaliche, Reazioni domino, Highlights nella sintesi di molecole bioattive.

La particolare strutturazione del "Laboratorio di Metodologie Sintetiche in Chimica Farmaceutica" continua ad essere considerata di fondamentale utilità dai partecipanti ai fini della loro preparazione professionale.

Dal 3 al 6 giugno 2009, l'European Directorate for the Quality of Medicines, (EDQM) in collaborazione con l'Università di Pavia e l'Italian Biocatalysis Center (IBC), ha organizzato, con il patrocinio della Divisione di Chimica Farmaceutica, di AIDIC, della società di biotecnologie spagnola (SEBIOT) e dell'associazione ita-

liana dei produttori di principi attivi (Chemical Pharmaceutical generic Association; CPA), il meeting "Active Pharmaceutical Ingredients from Bioprocesses-AIDIC: from research to industrial and regulatory issues" (APIB-2009).

L'evento scientifico ha avuto come obiettivo quello di divulgare le più recenti innovazioni nel campo delle biotecnologie applicate, dalla ricerca allo sviluppo ed alla produzione di farmaci. Oltre a presentazioni (orali e poster) e lezioni monografiche a carattere prettamente scientifico, sono state anche affrontate tematiche inerenti aspetti tecnologici e regolatori relativi al controllo della produzione in Good Manufacturing Practices (GMP) e della qualità dei principi attivi prodotti mediante bioprocessi.

Al meeting hanno partecipato infatti più di cento iscritti da diversi paesi europei, portando contributi tecnico-scientifici provenienti dal mondo accademico, industriale e dalle autorità regolatorie europee coinvolte nel controllo ed approvazione di prodotti farmaceutici.

Questo ha permesso momenti di contatto e di approfondito scambio di informazioni tra diversi mondi che concorrono tutti attivamente alla ricerca e allo sviluppo di nuovi farmaci e/o di bioprocessi per la produzione di principi attivi farmaceutici. Sono stati affrontati ed in particolare trattati i seguenti argomenti:

- ricerca applicata allo studio di nuovi biocatalizzatori efficienti;
- sviluppo di ceppi microbici efficienti e processi fermentativi per lo studio e la produzione di principi attivi;
- sviluppo di processi industriali per la biosintesi di farmaci;



Un momento della SSPA 2009



Un momento della ESMEC 2009

- impatto dell'impiego di bioprocessi sulla qualità dei principi attivi;
- tecnologie applicate alla produzione di prodotti di fermentazione, proteine ricombinanti e prodotti sterili.

La quattordicesima edizione della *Summer School on Pharmaceutical Analysis (SSPA 2009)*, si è svolta sotto la direzione di Vincenza Andriano ed alla presenza del presidente della European Federation for Medicinal Chemistry, Gerhard Ecker, presso l'Aula Magna dell'Istituto di Chimica Farmaceutica e Tossicologica "P. Pratesi" dell'Università di Milano, nei giorni 7-9 settembre 2009.

La scuola è mirata, in particolare, ai giovani ricercatori strutturati e non che ne costituiscono parte attiva in quanto presentano e discutono i risultati delle loro ricerche nel settore. Nella sua nuova struttura, la scuola prende in esame, per la durata di un triennio, le metodologie analitiche innovative legate alle fasi successive dello sviluppo del farmaco (progettazione, selezione degli hits, ottimizzazione del lead, metabolismo, farmacocinetica e studi di stabilità, pre-formulazione e controllo di qualità). Nell'edizione 2009 la Scuola è stata intitolata 'Advanced analytical methodologies in drug development: ADMET studies and biomarkers'.

La prima parte è stata dedicata ai metodi analitici innovativi per gli studi ADMET (absorption, distribution, metabolism, excretion, toxicity). Infatti, negli ultimi 15 anni, più del 40% dei nuovi composti chimici, attivi in sistemi modello, non sono riusciti a superare le fasi cliniche a causa di problemi legati al metabolismo e alla farmacocinetica. Di riflesso, molte aziende farmaceutiche hanno inserito gli studi di metabolismo e farmacocinetica nella fase dell'ottimizzazione del 'lead', riducendo l'incidenza di insuccessi. Gli screening metabolici infatti rendono più facile e veloce la eliminazione di candidati farmaci che non soddisfano i requisiti ADMET e direzionano le modifiche chimiche strutturali in modo da migliorare i composti rispetto alle proprietà metaboliche e farmacocinetiche.

La seconda parte è stata dedicata a lezioni concernenti i metodi analitici innovativi per la selezione dei 'Biomarkers in drug discovery and development'. Inoltre sono state discusse l'applicabilità e la convalida dei metodi di proteomica.

Hanno presenziato conferenzieri provenienti da università e centri di ricerca italiani ed europei (Svizzera, Francia, Inghilterra, Spagna, Paesi Bassi) ed extra-europei (Giappone) oltre a esponenti di importanti compagnie farmaceutiche italiane, inglesi e giapponesi.

A seguire la quattordicesima edizione della SSPA, in data 9-12 settembre 2009, si è svolto, presso l'Università degli Studi di Milano, il XIII convegno "*Recent Developments in Pharmaceutical Analysis: RDPA 2009*".

La manifestazione, che si svolge tradizionalmente con cadenza biennale, ha avuto luogo nell'aula magna della Sede centrale dell'Ateneo milanese, nella suggestiva cornice cinquecentesca della Ca' Granda, edificata all'epoca da Francesco Sforza.

Il convegno ha raccolto un numero lusinghiero di partecipanti, rappresentanti qualificati nelle scienze applicate alla Pharmaceutical Analysis, ed ha avuto come oggetto una panoramica approfondita su vari aspetti delle scienze bioanalitiche. Dall'analisi convenzionale alla genomica, dalla proteomica alla metabolomica, dall'analisi di prodotti naturali e fitoterapici alle recenti innovazioni della spettrometria di massa ed infine alla messa a punto di biosensori per l'analisi preclinica e clinica. L'inizio dei lavori è stato introdotto da una coinvolgente e prospettica conferenza, tenuta da Marco Scatigna, Direttore Scientifico di Sanofi-Aventis, sull'importanza della ricerca di nuovi biomarkers predittivi nella panoramica del drug discovery, definendo lo stato dell'arte internazionale e le prospettive future del mondo dell'industria farmaceutica. Tutte le relazioni svolte, plenary lectures, key notes, oral communications e poster presentations sono state di qualificato ed elevato contenuto scientifico ed hanno riscosso un'entusiastica attenzione da parte di tutti i partecipanti.

Il Convegno ha avuto l'indubbio merito di interfacciare, in modo omogeneo, argomenti diversificati, promuovendo scambi collaborativi e riscuotendo l'assidua attenzione di un pubblico internazionale proveniente da paesi europei ed extra-europei.

Hanno presenziato infatti autorità accademiche e studiosi da numerose università e industrie italiane ed europee (Francia, Inghilterra, Germania, Spagna, Paesi Bassi, Svizzera, Polonia, Repubblica Ceca,

Croazia, Serbia, Romania) ed extra-europee (Australia, Stati Uniti, Giappone, Israele, Iran, Tunisia, Turchia).

La *European School of Medicinal Chemistry (ESMEC)* si è svolta sotto la direzione di Gloria Cristalli ed alla presenza del delegato della European Federation for Medicinal Chemistry, Peter Matyus, presso il centro Sogesta dell'Università di Urbino, nei giorni 13-18 settembre 2009. Tale edizione, come sempre, ha avuto un indiscutibile e meritato successo e ha visto la partecipazione di un nutrito numero di giovani ricercatori che, nei cinque giorni previsti, hanno potuto seguire lezioni ad alto livello tenute su topics di grande attualità quali: Neuromuscular diseases: focus on multiple sclerosis, amyotrophic lateral sclerosis and muscular dystrophy, Carbohydrate chemistry, Toxicity and drug discovery, Hot topics. I relatori, di provenienza nazionale ed internazionale hanno presentato e discusso con grande competenza e chiarezza oratoria l'argomento della lezione, ancora una volta grazie alle scelte decise dal comitato scientifico della scuola.

La sempre maggiore partecipazione di studenti non italiani fa sì che l'uso della lingua inglese sia percepito oramai come supporto utile alla comprensione delle problematiche scientifiche e all'interazione con colleghi e relatori.

L'affiancamento di workshops alle lezioni frontali è risultato ancora una volta un successo anche in virtù dell'ambiente meno formale che ha favorito l'interazione degli studenti tra di loro e con i relatori.

I dottorandi italiani e stranieri frequentanti l'ultimo anno di corso, sono stati invitati a presentare un poster con i risultati più significativi delle loro ricerche. Come nelle passate edizioni, dieci posters sono stati selezionati per la presentazione orale ed i giovani relatori hanno confermato il livello di preparazione ed entusiasmo della futura generazione per gli studi e la ricerca nel settore del farmaco.

Sorrento, perla del nostro Mare Mediterraneo, famosa non solo per il suo spirito di accoglienza ma anche e soprattutto per la bellezza e la ricchezza del patrimonio naturale ed artistico che contraddistingue quella terra, ha ospitato dal 5 al 10 luglio 2009 il *XXIII Convegno Nazionale della Società Chimica Italiana*, sotto l'alto patronato del Presidente della Repubblica Italiana, appuntamento scientifico di particolare rilievo in quanto il 2009 è stato dichiarato, come già ricordato, anno in cui ricorrono i cento anni dell'anno fondante la Società Chimica Italiana.

Sorrento è diventata, per sei giorni, capitale di un affascinante e promettente settore di ricerca, quello della medicinal chemistry che si è confrontata, a pari livello, con gli altri settori delle scienze chimiche, quali quelli dell'organica, chimico-fisica, analitica, industriale, inorganica, elettrochimica, dei sistemi biologici e della spettrometria di massa, dell'ambiente e dei beni culturali.

Nell'ambito di questa manifestazione, la Divisione di Chimica Farmaceutica ha partecipato attivamente, organizzando sessioni a tema e chiamando esperti da tutto il mondo per illustrare lo stato dell'arte nel settore del farmaco. Il presidente della Società Chimica Italiana, Luigi Campanella, ha premiato con la medaglia Amedeo Avogadro Roberto Pellicciari (Università di Perugia) per l'impegno profuso, sempre con grande entusiasmo ed ineguagliabile competenza, nella



Laboratorio di Metodologie Sintetiche in Chimica Farmaceutica

promozione della ricerca nel campo della chimica del farmaco sia a livello nazionale che internazionale. La presidente della Divisione di Chimica Farmaceutica, Luisa Mosti, ha inoltre premiato, con il conferimento della medaglia Pietro Pratesi, in una cerimonia dedicata, Ettore Novellino (Università di Napoli) per la sua brillante carriera di ricercatore e per il sostegno dato alla promozione e valorizzazione delle scienze del farmaco.

L'industria, con esponenti di Federfarma, ha presenziato alla cerimonia conferendo due premi a due giovani ricercatrici distintesi per i loro studi su inibitori del virus HIV-1 e su cardioprotettori: Sara Cesarini (Università di Genova) e Simona Rapposelli (Università di Pisa).

Plenary e main lectures, tenute da illustri relatori italiani, europei ed extra europei, hanno messo in luce lo stato dell'arte in alcuni dei settori di punta nella ricerca farmaceutica italiana e mondiale ed hanno promosso dibattiti e confronti produttivi.

Inoltre il 2009 ha visto la Divisione di Chimica Farmaceutica impegnata con suoi autorevoli ricercatori in convegni nazionali ed internazionali quali Biotech.Org. Sfide e Opportunità (Forte dei Marmi - Lucca, May 20-23, 2009) dove è stato dato ampio spazio alle biotecnologie tra cui le farmaceutiche, 27<sup>th</sup> Noordwijkerhout-Camerino-Cyprus Conference (Noordwijkerhout, Netherlands May 3-8, 2009) dove l'aspetto dei trends in drug research è stato particolarmente curato, come nell'Hungarian, Austrian, Czech, German, Greek, Italian, Polish, Slovak, Slovenian Joint Meeting on Medicinal Chemistry (Budapest, June 23-27, 2009) ed in *Frontiers in Medicinal Chemistry: Emerging Targets, Novel Candidates and Innovative Strategies* (Barcelona, Spain, October 4-6, 2009).

Infine la Divisione ha continuato a sponsorizzare importanti iniziative rivolte ai giovani, quali quelle dell'istituzione o della continua attivazione di *Master di I e II livello*, in particolare quello in *Progettazione e Sviluppo dei Farmaci*, organizzato dalla Università degli Studi di Pavia e, nel 2009, giunto alla sua settima edizione.