



Giuseppe La Regina *Curriculum Vitae et Studiorum*

□ **Dati Personali**

Cognome e nome: La Regina Giuseppe

Indirizzo professionale e recapiti telefonici: Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco, Sapienza Università di Roma, Piazzale Aldo Moro 5, 00185, Roma (RM), Italia.

Studio: edificio CU019, piano 2, stanza 208, Tel +39 0649913893 (int. 23893), Fax +39 0649913789 (int. 23789).

Laboratorio di ricerca: edificio CU020, piano 1, stanza 5A, Tel +39 0649913404, Fax +39 0649913993.

Laboratorio didattico: edificio CU019, piano 1, stanza 1.

E-mail: giuseppe.laregina@uniroma1.it

E-mail certificata: giuseppe.laregina@postecert.it

Skype: giuseppe.laregina

Sito web personale: <https://sites.google.com/a/uniroma1.it/giuseppelaregina/>

Sito web didattica: <https://elearning.uniroma1.it/course/view.php?id=461>

□ **Posizione Attuale**

Settembre 2019: Professore Associato in Chimica Farmaceutica (SSD CHIM/08 – Chimica Farmaceutica), Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco, Sapienza Università di Roma.

□ **Principali Interessi di Ricerca**

Progettazione, sintesi e sviluppo di agenti anti-infettivi (HIV-1, HCV, Rhinovirus, Dengue, Norovirus, *Mycobacterium tuberculosis*, *Candida albicans*), anti-tumorali (tubulina, apoptosi, istone demetilasi, metalloproteinasi di matrice, membri della famiglia BCL-2, Frizzled4, anidrasi carbonica, indolamina 2,3-diossigenasi 1, MDM2/MDM4, NHERF1, beta-catenina, Dishevelled 1, Gab2) e attivi sul sistema nervoso centrale (monoammino ossidasi, sistema endocannabinoide, glicogeno sintasi chinasi 3 beta); sintesi microonde-assistita; studi di modellistica molecolare.

□ **Esperienze Lavorative**

Novembre 2008 – Settembre 2020: Ricercatore universitario a tempo indeterminato, Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco, Sapienza Università di Roma.

Aprile 2007 - Novembre 2008: Progettazione, sintesi e sviluppo di nuovi inibitori della polimerizzazione della tubulina, Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco,



Sapienza Università di Roma, sotto la guida del Prof. Romano Silvestri (borsa di studio triennale finanziata da Associazione Italiana per la Ricerca sul Cancro, Milano (MI)).

Aprile 2005 - Marzo 2007: Post-dottorato presso la Welsh School of Pharmacy, Cardiff University, Regno Unito, Molecular modelling studies to design new inhibitors of tubulin polymerization as anticancer agents, sotto la guida del Dott. Andrea Brancale (borsa di studio biennale per ricerche all'estero finanziata da Istituto Pasteur – Fondazione Cenci Bolognetti, Roma (RM)).

Anni Accademici 2001/2002, 2002/2003 e 2003/2004: Corso di Dottorato in Scienze Farmaceutiche (Ciclo XVII) presso il Dipartimento di Studi Farmaceutici, Sapienza Università di Roma, sotto la guida del Prof. Romano Silvestri.

Luglio 2000 - giugno 2001: Tirocinio professionale presso Farmacia Celestini Dott. Gianfranco, via dei Banchi Vecchi 24, 00186 – Roma (RM), secondo normativa vigente.

Anno Accademico 2000/2001: Attività di orientamento presso lo sportello SOrT (Servizio Orientamento, Tutorato e Placement) della Facoltà di Farmacia, Sapienza Università di Roma, per un totale di 150 ore.

Anni Accademici 1999/2000 e 2000/2001: Attività di sintesi chimica di nuovi chemioterapici ad azione anti-HIV-1 a struttura indolica ed imidazolica presso il Dipartimento di Studi Farmaceutici, Sapienza Università di Roma, sotto la guida del Prof. Romano Silvestri.

▣ Studi

Master di II livello in Progettazione e Sviluppo dei Farmaci conseguito in data 25 maggio 2007 presso il Dipartimento di Chimica Farmaceutica, Facoltà di Farmacia, Università degli Studi di Pavia, Pavia (PV), discutendo una tesi sperimentale dal titolo "Arylthioindoles, potent inhibitors of tubulin polymerization" con relatore la Prof.ssa Ornella Azzolina e correlatore il Prof. Romano Silvestri.

Dottorato in Scienze Farmaceutiche (Ciclo XVII) conseguito in data 11 marzo 2005 presso il Dipartimento di Studi Farmaceutici, Sapienza Università di Roma, discutendo una tesi sperimentale dal titolo "Indolyl aryl sulfones, potent non- nucleoside reverse transcriptase inhibitors of WT HIV-1 and clinically relevant resistant mutants. SAR studies on substituents at the 2-carboxamide function and at position 5 of the indole nucleus." con relatore il Prof. Romano Silvestri.

Abilitazione alla Titolarità di Farmacia conseguita in data 24 marzo 2004 tramite concorso pubblico, per titoli ed esami, per il conferimento di cinque sedi farmaceutiche di nuova istituzione disponibili per il privato esercizio nella provincia di Bologna, indetto con Determina Dirigenziale n. 1482/2003 del 10.04.2003 PG n. 63575 e pubblicato sul B.U.R. dell'Emilia Romagna n. 59 del 23.04.2003 (votazione prova scritta: 95/100; posizione finale in graduatoria n. 270).

Abilitazione all'Esercizio della Professione di Farmacista conseguita in data 17 dicembre 2001 presso la Facoltà di Farmacia, Sapienza Università di Roma (votazione finale: 401/450).

Laurea in Farmacia (Nuovissimo ordinamento, NNO) conseguita in data 17 luglio 2001 presso la Facoltà di Farmacia, Sapienza Università di Roma, discutendo una tesi sperimentale in Chimica Farmaceutica e Tossicologica I dal titolo "Sintesi ed attività biologica anti-HIV-1 di analoghi azotati e solforati di 1-2-(diarilmetossi)etil-2- metil-5-



nitroimidazoli (DAMNI)” con relatore il Prof. Romano Silvestri e conseguendo votazione finale di 110/110 e lode (durata degli studi: 5 anni; media degli esami: 29,4).

Maturità classica conseguita presso il Liceo Classico Statale “Marco Tullio Cicerone” di Sala Consilina (SA) nell’Anno Scolastico 1995/1996 con votazione 60/60 (durata degli studi: 5 anni).

□ **Lingue straniere**

Conoscenza della lingua inglese scritta e parlata. Superamento dell’esame di conoscenza pratica e comprensione dell’inglese scientifico farmaceutico durante il Corso di Laurea in Farmacia. Certificazione della conoscenza della lingua inglese scritta e parlata presso Trinity College (Londra) (Grade 8) in giugno 2004.

□ **Corsi di Perfezionamento Post-Lauream**

- Corso di Primo Soccorso*, 16 gennaio 2020, Roma (RM).
- Progetto di Ateneo per la Formazione dei Docenti Sapienza*, 2019, Roma (RM).
- Twelfth European Workshop in Drug Design*, 19-24 maggio 2019, Siena (SI).
- Protezione di tecnici e ricercatori esposti a rischio chimico in laboratorio: cappe chimiche e armadi di sicurezza*, 14 dicembre 2018, Roma (RM).
- Aggiornamenti su materiali e tecnologie per sviluppo processo*, 13 settembre 2018, Roma (RM).
- Seventh European Workshop in Drug Synthesis*, 20-24 maggio 2018, Siena (SI).
- Corso di formazione per RADRL*, Art. 18, 37, co. 7, D.Lgs. 81/2008 - Accordo Stato-Regioni 21/12/2011 - Direttiva Europea 89/391/EEC, 20-27 marzo 2018, Roma (RM).
- Progetto di Ateneo per la Formazione dei Docenti Sapienza*, 2018, Roma (RM).
- Fifth European Workshop in Drug Synthesis*, 18-23 maggio 2014, Siena (SI).
- Fourth European Workshop in Drug Synthesis*, 27-31 maggio 2012, Siena (SI).
- Nono Laboratorio di Metodologie Sintetiche in Chimica Farmaceutica*, 14-18 febbraio 2010, Siena (SI).
- Seventh European Workshop in Drug Design*, 24-30 maggio 2009, Siena (SI).
- Prodotti Medicinali di Origine Naturale*, 5 e 12 maggio 2006, Pavia (PV).
- 3° Seminario Scientifico, Proprietà e applicazioni delle microonde nel processo di drug discovery*, 31 marzo 2006, Pavia (PV).
- ESMEC - European School of Medicinal Chemistry - XXIV Advanced Course of Medicinal Chemistry and “E. Durante” National Seminar for PhD Students*, 4-8 luglio 2004, Urbino (PU).
- XXIII Corso Avanzato in Chimica Farmaceutica e Seminario Nazionale per Dottorandi “E. Durante”*, 30 giugno - 4 luglio 2003, Urbino (PU).
- XXII Corso Avanzato in Chimica Farmaceutica e Seminario Nazionale per Dottorandi “E. Durante”*, 1-5 luglio 2002, Urbino (PU).



❑ Riconoscimenti e Concorsi

Anno 2019: Vincitore della procedura valutativa di chiamata per n. 1 posto di Professore di ruolo di II fascia presso il Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco, Facoltà di Farmacia e Medicina, settore scientifico-disciplinare CHIM/08, settore concorsuale 03/D1 emanato con D.R. n. 2659/2018 del 9 novembre 2018.

Anno 2018: Publons Peer Review Award 2017.

Anno 2017: Conseguimento dell'Abilitazione Scientifica Nazionale alle funzioni di Professore Universitario di Prima Fascia, Settore Concorsuale 03/D1, Bando 2016 (D.D. n. 1532/2016).

Anno 2014: Conseguimento dell'Abilitazione Scientifica Nazionale alle funzioni di Professore Universitario di Seconda Fascia, Settore Concorsuale 03/D1, Bando 2012 (D.D. n. 222/2012).

Anno 2008: Vincitore della procedura di valutazione comparativa per la copertura di n. 1 posto di ricercatore universitario, settore CHIM/08, presso la Facoltà di Farmacia, Sapienza Università di Roma, bandito sulla Gazzetta Ufficiale n. 08 del 29/01/2008.

Anno 2007: Vincitore del Premio Farindustria 2007 per la Ricerca Farmaceutica.

Anno 2007: Vincitore del bando di concorso per il conferimento di 40 borse di studio triennali (2007-2009) per la Ricerca sul Cancro, promosso dall'Associazione Italiana per la Ricerca sul Cancro (AIRC), Milano (MI).

Anno 2006: Vincitore di una borsa di studio per titoli quale contributo di iscrizione al Master Universitario di II Livello in Progettazione e Sviluppo dei Farmaci presso il Dipartimento di Chimica Farmaceutica, Facoltà di Farmacia, Università degli Studi di Pavia, Pavia (PV).

Anni 2005-2006: Vincitore del bando di concorso 2004 per l'assegnazione di borse di studio annuali per ricerche all'estero, promosso dall'Istituto Pasteur – Fondazione Cenci Bolognetti, Roma (RM).

Anno 2001: Vincitore del bando di concorso per l'ammissione al Corso di Dottorato di Ricerca in Scienze Farmaceutiche (XVII ciclo) con borsa di studio presso il Dipartimento di Studi Farmaceutici, Sapienza Università di Roma, (votazione prova scritta 56/60, votazione prova orale: 58/60; votazione finale: 114/120).

Anno Accademico 2000/2001: Vincitore del bando di concorso per 55 borse di collaborazione per il servizio SOrT, Sapienza Università di Roma.

❑ Attività Didattica e Compiti Organizzativi Interni

Attività didattica

Docente del Corso di Analisi Chimico Farmaceutica e Tossicologica I (SSD CHIM/08, 10 CFU), Canale M-Z, Corso di Laurea in Chimica e Tecnologia Farmaceutiche, Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco, Sapienza Università di Roma, a partire dall'Anno Accademico 2011/2012.

Docente del Corso di Monitoraggio delle Prescrizioni ed Analisi dei Consumi dei Farmaci in Ambito Ospedaliero (SSD CHIM/08, 1 CFU), Scuola di Specializzazione in Farmacia Ospedaliera, Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco, Sapienza Università di Roma, a partire dall'Anno Accademico 2012/2013.



Docente del Corso di Analisi dei Medicinali II (SSD CHIM/08, 92 ore), Corso di Laurea in Farmacia, Facoltà di Medicina e Chirurgia, "A. Gemelli", Università Cattolica del Sacro Cuore, Roma (RM), Anno Accademico 2021/2022.

Docente del Corso di Principi di Nutraceutica (SSD CHIM/08, 1 CFU), Master di II livello in Ricerca, Sviluppo e Management dell'Azienda Nutraceutica e Cosmetica, Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco, Sapienza Università di Roma, Anno Accademico 2021/2022.

Docente del Corso di Principi di Nutraceutica (SSD CHIM/08, 1 CFU), Master di II livello in Nutraceutica e Cosmeceutica di Prodotti di Origine Vegetale, Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco, Sapienza Università di Roma, Anno Accademico 2015/2016.

Docente del Corso di Acquisizione di Capacità Informatiche (SSD CHIM/08, 1 CFU), Scuola di Specializzazione in Farmacia Ospedaliera, Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco, Sapienza Università di Roma, Anni Accademico 2012/2013 e 2013/2014.

Docente del Corso di Chimica Tossicologica (SSD CHIM/08, 8 CFU), Corso di Laurea in Chimica e Tecnologia Farmaceutiche, Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco, Sapienza Università di Roma, Anni Accademici 2009/2010 e 2010/2011.

Docente del Master di II Livello in Progettazione e Sviluppo dei Farmaci, Facoltà di Farmacia, Università degli Studi di Pavia, Anno Accademico 2010/2011.

Altre attività

Esami di profitto: a) in qualità di Presidente della commissione d'esame: Corso di Analisi Chimico Farmaceutica e Tossicologica I, Corso di Laurea in Chimica e Tecnologia Farmaceutiche, Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco, Sapienza Università di Roma; b) in qualità di Presidente della commissione d'esame: Corso di Monitoraggio delle Prescrizioni ed Analisi dei Consumi dei Farmaci in Ambito Ospedaliero (SSD CHIM/08, 1 CFU), Scuola di Specializzazione in Farmacia Ospedaliera, Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco, Sapienza Università di Roma; c) in qualità di Presidente della commissione d'esame, Corso di Analisi dei Medicinali II, Corso di Laurea in Farmacia, Facoltà di Medicina e Chirurgia, "A. Gemelli", Università Cattolica del Sacro Cuore; d) in qualità di Membro della commissione d'esame: Corso di Chimica Farmaceutica e Tossicologica I (Canale A-L, Corso di Laurea in Farmacia), di Chimica Farmaceutica e Tossicologica II (Corso di Laurea in Scienze Farmaceutiche Applicate), Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco, Sapienza Università di Roma.

Membro commissione di Laurea, Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco, Sapienza Università di Roma.

Membro del Collegio dei Docenti del Master di II livello in Ricerca, Sviluppo e Management dell'Azienda Nutraceutica e Cosmetica, Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco, Sapienza Università di Roma.

Membro del Collegio dei Docenti del Corso di Dottorato Internazionale in Molecular design and characterization for the promotion of health and well-being: from drug to food, Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco, Sapienza Università di Roma.



Membro commissione esame finale di Dottorato in Scienze Farmaceutiche (Doctor Europaeus), Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco, Sapienza Università di Roma, 2017.

Attività di relatore/tutor di studenti universitari nella preparazione, nello svolgimento e nella stesura finale di: a) tesi sperimentali e compilative di Laurea, Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco, Sapienza Università di Roma; b) tesi sperimentali di Dottorato in Scienze Farmaceutiche, Scienze della Vita e Molecular design and characterization for the promotion of health and well-being: from drug to food, Sapienza Università di Roma.

Attività di ricevimento, orientamento e tutorato di studenti universitari: Corso di Analisi Chimico Farmaceutica e Tossicologica I (Canale M-Z, Corso di Laurea in Chimica e Tecnologia Farmaceutiche, Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco, Sapienza Università di Roma), Corso di Monitoraggio delle Prescrizioni ed Analisi dei Consumi dei Farmaci in Ambito Ospedaliero (Scuola di Specializzazione in Farmacia Ospedaliera, Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco, Sapienza Università di Roma), Corso di Analisi dei Medicinali II (Corso di Laurea in Farmacia, Facoltà di Medicina e Chirurgia, "A. Gemelli", Università Cattolica del Sacro Cuore).

Compiti organizzativi interni

Presidente della commissione trasferimenti studenti, Corso di Laurea in Chimica e Tecnologia Farmaceutiche, Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco, Sapienza Università di Roma.

Coordinatore del Chlorophyll Program – Programma di collaborazione fra Patheon/ Thermo Fisher Scientific Italia Spa e Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco, Sapienza Università di Roma.

Responsabile unico della gestione elettronica di riassunti e presentazioni di Laurea, Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco, Sapienza Università di Roma.

Addetto al Primo Soccorso Aziendale, Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco, Sapienza Università di Roma.

Membro della commissione biblioteca, Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco, Sapienza Università di Roma.

Membro della commissione del personale, Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco, Sapienza Università di Roma.

Membro della commissione ricerca, Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco, Sapienza Università di Roma.

Membro della commissione web, Corso di Laurea in Chimica e Tecnologia Farmaceutiche, Dipartimento di Chimica e Tecnologie del Farmaco, Sapienza Università di Roma.

Membro del Gruppo di Lavoro Qualità e Innovazione della Didattica (GDL-QuID), Sapienza Università di Roma, 2018-2020.

□ Pubblicazioni Scientifiche

Co-Autore di 100 lavori scientifici pubblicati su riviste internazionali peer-reviewed con alto impact factor e di 3 brevetti riguardanti la progettazione, la sintesi microonde-



assistita e lo sviluppo di agenti antitumorali (tubulina, apoptosi, istone demetilasi, metalloproteinasi di matrice, membri della famiglia BCL-2, Frizzled4, anidrasi carbonica, indolamina 2,3-diossigenasi 1, MDM2/MDM4, NHERF1, beta-catenina, Dishevelled 1, Gab2), anti-infettivi (HIV-1, HCV, Rhinovirus, Dengue, Norovirus, *Mycobacterium tuberculosis*, *Candida albicans*) e attivi sul sistema nervoso centrale (inibitori delle monoammino ossidasi e della glicogeno sintasi chinasi 3 beta; ligandi dei recettori dei cannabinoidi) (22 primo Autore; 11 Autore corrispondente; 5 ultimo Autore).

Articoli su rivista

1. Coluccia, A.; Bufano, M.; La Regina, G.; Puxeddu, M.; Toto, A.; Paone, A.; Bouzidi, A.; Musto, G.; Badolati, N.; Orlando, V.; Biagioni, S.; Masci, D.; Cantatore, C.; Cirilli, R.; Cutruzzola, F.; Gianni, S.; Stornaiuolo, M.; Silvestri, R. Anticancer Activity of (S)-5-Chloro-3-((3,5-dimethylphenyl)sulfonyl)-N-(1-oxo-1-((pyridin-4-ylmethyl)amino)propan-2-yl)-1H-indole-2-carboxamide (RS4690), a New Dishevelled 1 Inhibitor. *Cancers* **2022**, *14*, e1358 (doi: [10.3390/cancers14051358](https://doi.org/10.3390/cancers14051358); Pubmed ID: 35267666; Scopus ID: non disponibile; ISI Accession Number: WOS:000773498900001; 7 marzo 2022; ISSN: 2072-6694; MDPI, Basilea, Svizzera).
2. Cantatore, C.; La Regina, G.; Ferretti, R.; Silvestri, R.; Cirilli, R. Single-run chemo- and enantio-selective high-performance liquid chromatography separation of tramadol and its principal metabolite, O-desmethyltramadol, using a chlorinated immobilized amylose-based chiral stationary phase under multimodal elution conditions. *Sep. Sci. Plus* **2022**, 1–6 (doi: [10.1002/sscp.202200009](https://doi.org/10.1002/sscp.202200009); Pubmed ID: non disponibile; Scopus ID: non disponibile; ISI Accession Number: WOS:000757674000001; 27 gennaio 2022; ISSN: 2573-1815; Wiley-V C H Verlag GmbH, Weinheim, Germania).
3. Passirani, C.; Vessieres, A.; La Regina, G.; Link, W.; Silvestri, R. Modulating undruggable targets to overcome cancer therapy resistance. *Drug Resist. Update* **2022**, *60*, e100788 (doi: [10.1016/j.drug.2021.100788](https://doi.org/10.1016/j.drug.2021.100788); Pubmed ID: 35168144; Scopus ID: 2-s2.0-85124496115; ISI Accession Number: WOS:000758804000001; 3 dicembre 2021; ISSN: 1368-7646; Churchill Livingstone, Edinburgo, Scozia).
4. Altman, R. A.; Brai, A.; Golden, J.; La Regina, G.; Li, Z.; Moore, T. W.; Pomerantz, W. C. K.; Rajapaksa, N. S.; Adams, A. M. An Innovation 10 Years in the Making: The Stories in the Pages of ACS Medicinal Chemistry Letters. *ACS Med. Chem. Lett.* **2022**, *13*, 540–545 (doi: [10.1021/acsmchemlett.1c00623](https://doi.org/10.1021/acsmchemlett.1c00623); Pubmed ID: 35450346; Scopus ID: 2-s2.0-85124312162; ISI Accession Number: non disponibile; 1 dicembre 2021; ISSN: 1948-5875; American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
5. Nalli, M.; Puxeddu, M.; La Regina, G.; Gianni, S.; Silvestri, R. Emerging therapeutic agents for colorectal cancer. *Molecules* **2021**, *26*, e7463 (doi: [10.3390/molecules26247463](https://doi.org/10.3390/molecules26247463); Pubmed ID: 34946546; Scopus ID: 2-s2.0-85121522712; ISI Accession Number: WOS:000736380500001; 9 dicembre 2021; ISSN: 1420-3049; MDPI, Basilea, Svizzera).
6. Nardella, C.; Visconti, L.; Malagrino, F.; Pagano, L.; Bufano, M.; Nalli, M.; Coluccia, A.; La Regina, G.; Silvestri, R.; Gianni, S.; Toto, A. Targeting PDZ



- domains as potential treatment for viral infections, neurodegeneration and cancer. *Biol. Direct* **2021**, *16*, e15 (doi: [10.1186/s13062-021-00303-9](https://doi.org/10.1186/s13062-021-00303-9); Pubmed ID: 34641953; Scopus ID: 2-s2.0-85117321017; ISI Accession Number: WOS:000706722300001; 12 ottobre 2021; ISSN: 1745-6150, BMC, Londra, Regno Unito).
7. Van Dycke, J.; Puxeddu, M.; La Regina, G.; Mastrangelo, E.; Tarantino, D.; Rymenants, J.; Sebastiani, J.; Nalli, M.; Matthijnsens, J.; Neyts, J.; Silvestri, R.; Rocha-Pereira, J. Discovery of a novel class of norovirus inhibitors with high barrier of resistance. *Pharmaceuticals* **2021**, *14*, e1006 (doi: [10.3390/ph14101006](https://doi.org/10.3390/ph14101006); Pubmed ID: 34512148; Scopus ID: 2-s2.0-85116529403; ISI Accession Number: WOS:000711764700001; 30 settembre 2021; ISSN: 1424-8247, MDPI, Basilea, Svizzera).
 8. Liu, T.; Wu, J.; Han, C.; Gong, Z.; La Regina, G.; Chen, J.; Dou, F.; Silvestri, R.; Chen, C.; Yu, Z. RS-5645 attenuates inflammatory cytokine storm induced by SARS-CoV-2 spike protein and LPS by modulating pulmonary microbiota. *Int. J. Biol. Sci.* **2021**, *17*, 3305–3319 (doi: [10.7150/ijbs.63329](https://doi.org/10.7150/ijbs.63329); Pubmed ID: 34512148; Scopus ID: 2-s2.0-85113771922; ISI Accession Number: WOS:000685459400004; 25 luglio 2021; ISSN: 1449-2288, Ivyspring Int Publ, Lake Haven, Australia).
 9. Puxeddu M.; Shen, H.; Bai, R.; Coluccia, A.; Bufano, M.; Nalli, M.; Sebastiani, J.; Brancaccio, D.; Da Pozzo, E.; Tremolanti, C.; Martini, C.; Orlando, V.; Biagioni, S.; Sinicropi, M. S.; Ceramella, J.; Iacopetta, D.; Coluccia, A. M. L.; Hamel, E.; Liu, T.; Silvestri, R.; La Regina, G. (Autore corrispondente). Discovery of pyrrole derivatives for the treatment of glioblastoma and chronic myeloid leukemia. *Eur. J. Med. Chem.* **2021**, *221*, e113532 (doi: [10.1016/j.ejmech.2021.113532](https://doi.org/10.1016/j.ejmech.2021.113532); Pubmed ID: 34052717; Scopus ID: 2-s2.0-85106600720; ISI Accession Number: WOS:000661282500029; 5 maggio 2021; ISSN: 0223-5234, Elsevier France-Editions Scientifiques Medicales Elsevier, Parigi, Francia).
 10. Li, S.; Xu, A.; Li, Y.; Tan, C.; La Regina, G.; Silvestri, R.; Wang, H.; Qi, W. RS4651 suppresses lung fibroblast activation via the TGF- β 1/SMAD signalling pathway. *Eur. J. Pharmacol.* **2021**, *903*, e174135 (doi: [10.1016/j.ejphar.2021.174135](https://doi.org/10.1016/j.ejphar.2021.174135); Pubmed ID: 33940030; Scopus ID: 2-s2.0-85105328489; ISI Accession Number: WOS:000657380100001; 1 maggio 2021; ISSN: 0014-2999, Elsevier, Amsterdam, Paesi Bassi).
 11. Daniele, S.; La Pietra, V.; Piccarducci, R.; Pietrobono, D.; Cavallini, C.; D'Amore, V. M.; Cerofolini, L.; Giuntini, S.; Russomanno, P.; Puxeddu, M.; Nalli, M.; Pedrini, M.; Fragai, M.; Luchinat, C.; Novellino, E.; Taliani, S.; La Regina, G.; Silvestri, R.; Martini, C.; Marinelli, L. CXCR4 antagonism sensitizes cancer cells to novel indole-based MDM2/4 inhibitors in glioblastoma multiforme. *Eur. J. Pharmacol.* **2021**, *897*, e173936 (doi: [10.1016/j.ejphar.2021.173936](https://doi.org/10.1016/j.ejphar.2021.173936); Pubmed ID: 33581134; Scopus ID: 2-s2.0-85102892586; ISI Accession Number: WOS:000628752700009; 10 febbraio 2021; ISSN: 0014-2999, Elsevier, Amsterdam, Paesi Bassi).
 12. Malagrino, F.; Coluccia, A.; Bufano, M.; La Regina, G.; Puxeddu, M.; Toto, A.; Visconti, L.; Paone, A.; Magnifico, M. C.; Troilo, F.; Cutruzzolà, F.; Silvestri, R.; Gianni, S. Targeting the interaction between the SH3 domain of Grb2 and Gab2.



- Cells* **2020**, *11*, e2435 (doi: [10.3390/cells9112435](https://doi.org/10.3390/cells9112435); Pubmed ID: 33171874; Scopus ID: 2-s2.0-85096028884; ISI Accession Number: WOS:000592940700001; 7 novembre 2020; ISSN: 2073-4409, MDPI, Basilea, Svizzera).
13. La Regina, R.; Pandolfi, D.; Stabile, N.; Beloni, L.; Glisenti, F.; Griggio, P.; La Regina, M.; La Regina, G. A new case manager for diabetic patients: a pilot observational study of the role of community pharmacists and pharmacy services in the case management of diabetic patients. *Pharmacy* **2020**, *8*, e193 (doi: [10.3390/pharmacy8040193](https://doi.org/10.3390/pharmacy8040193); Pubmed ID: 33086680; Scopus ID: non disponibile; ISI Accession Number: WOS:000601871900001; 17 ottobre 2020; ISSN: 2226-4787, MDPI, Basilea, Svizzera).
14. Di Magno, L.; Di Pastena, F.; Puxeddu, M.; La Regina, G.; Coluccia, A.; Ciogli, A.; Manetto, S.; Maroder, M.; Canettieri, G.; Silvestri, R.; Nalli, M. Sulfonamide inhibitors of β -catenin signaling as anticancer agents with different output on c-MYC. *ChemMedChem* **2020**, *15*, 2264–2268 (doi: [10.1002/cmdc.202000594](https://doi.org/10.1002/cmdc.202000594); Pubmed ID: 32946182; Scopus ID: 2-s2.0-85092511066; ISI Accession Number: WOS:000577594900001; 18 settembre 2020; ISSN: 1860-7179, Wiley-V C H Verlag GmbH, Weinheim, Germania).
15. Nalli, M.; Armijos Rivera, J. I.; Masci, D.; Coluccia, A.; Badia, R.; Riveira-Muñoz, E.; Brambilla, A.; Cinquina, E.; Turriziani, O.; Falasca, F.; Catalano, M.; Limatola, C.; Esté, J. A.; Maga, G.; Silvestri, R.; Crespan, E.; La Regina, G. (Autore corrispondente). New indolylarylsulfone non-nucleoside reverse transcriptase inhibitors show low nanomolar inhibition of single and double HIV-1 mutant strains. *Eur. J. Med. Chem.* **2020**, *208*, e112696 (doi: [10.1016/j.ejmech.2020.112696](https://doi.org/10.1016/j.ejmech.2020.112696); Pubmed ID: 32883642; Scopus ID: 2-s2.0-85090028457; ISI Accession Number: non disponibile; 11 agosto 2020; ISSN: 0223-5234, Elsevier France-Editions Scientifiques Medicales Elsevier, Parigi, Francia).
16. Coluccia, A.; Puxeddu, M.; Nalli, M.; Wei, C. K.; Wu, Y. H.; Mastrangelo, E.; Elamin, T.; Tarantino, D.; Bugert, J. J.; Schreiner, B.; Nolte, J.; Schwarze, F.; La Regina, G.; Lee, J. C.; Silvestri, R. Discovery of Zika virus NS2B/NS3 inhibitors that prevent mice from life-threatening infection and brain damage. *ACS Med. Chem. Lett.* **2020**, *11*, 1869–1874 (doi: [10.1021/acsmchemlett.9b00405](https://doi.org/10.1021/acsmchemlett.9b00405); Pubmed ID: 33062166; Scopus ID: 2-s2.0-85089122411; ISI Accession Number: WOS:000580567800013; 15 gennaio 2020; ISSN: 1948-5875; American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
17. Puxeddu, M.; Shen, H.; Bai, R.; Coluccia, A.; Nalli, M.; Mazzoccoli, C.; Da Pozzo, E.; Cavallini, C.; Martini, C.; Orlando, V.; Biagioni, S.; Mazzoni, C.; Coluccia, A. M. L.; Hamel, E.; Liu, T.; Silvestri, R.; La Regina, G. (Autore corrispondente). Structure-activity relationship studies and *in vitro* and *in vivo* anticancer activity of novel 3-aryl-1,4-diarylpyrroles against solid tumors and hematological malignancies. *Eur. J. Med. Chem.* **2020**, *185*, e111828 (doi: [10.1016/j.ejmech.2019.111828](https://doi.org/10.1016/j.ejmech.2019.111828); Pubmed ID: 31727471; Scopus ID: 2-s2.0-85075503012; ISI Accession Number: WOS:000503099900046; 2 novembre 2019; ISSN: 0223-5234, Elsevier France-Editions Scientifiques Medicales Elsevier, Parigi, Francia).



18. La Regina, G.; Puxeddu, M.; Nalli, M.; Vullo, D.; Gratteri, P.; Supuran, C. T.; Nocentini, A.; Silvestri, R. Discovery of new 1,1'-biphenyl-4-sulfonamides as selective subnanomolar human carbonic anhydrase II inhibitors. *ACS Med. Chem. Lett.* **2020**, *11*, 633–637 (doi: [10.1021/acsmchemlett.9b00437](https://doi.org/10.1021/acsmchemlett.9b00437); Pubmed ID: 32435363; Scopus ID: 2-s2.0-85075123548; ISI Accession Number: WOS:000535281200005; 11 novembre 2019; ISSN: 1948-5875; American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
19. Filipović, N. R.; Bjelogrić, S. K.; Pelliccia, S.; Jovanović, V. B.; Kojić, M.; Senćanski, M.; La Regina, G.; Silvestri, R.; Muller, C. D.; Todorović, T. R. Selenotriapine - An isostere of the most studied thiosemicarbazone with pronounced pro-apoptotic activity, low toxicity and ability to challenge phenotype reprogramming of 3-D mammary adenocarcinoma tumors. *Arabian J. Chem.* **2020**, *13*, 1466–1489 (doi: [10.1016/j.arabic.2017.11.017](https://doi.org/10.1016/j.arabic.2017.11.017); Pubmed ID: non disponibile; Scopus ID: 2-s2.0-85037552505; ISI Accession Number: WOS:000505076000109; 28 novembre 2017; ISSN: 1878-5352; Elsevier Science BV, Amsterdam, Paesi Bassi).
20. Masci, D.; Hind, C.; Islam, M. K.; Toscani, A.; Clifford, M.; Coluccia, A.; Conforti, I.; Touitou, M.; Memdouh, S.; Wei, X.; La Regina, G.; Silvestri, R.; Sutton, J. M.; Castagnolo, D. Switching on the activity of 1,5-diaryl-pyrrole derivatives against drug-resistant ESKAPE bacteria: structure-activity relationships and mode of action studies. *Eur. J. Med. Chem.* **2019**, *178*, 500–514 (doi: [10.1016/j.ejmech.2019.05.087](https://doi.org/10.1016/j.ejmech.2019.05.087); Pubmed ID: 31202995; Scopus ID: 2-s2.0-85067210411; ISI Accession Number: WOS:000480664100037; 29 maggio 2019; ISSN: 0223-5234, Elsevier France-Editions Scientifiques Medicales Elsevier, Parigi, Francia).
21. Pippa, S.; Mannironi, C.; Licursi, V.; Bombardi, L.; Colotti, G.; Cundari, E.; Mollica, A.; Coluccia, A.; Naccarato, V.; La Regina, G.; Silvestri, R.; Negri, R. Small molecule inhibitors of KDM5 histone demethylases increase the radiosensitivity of breast cancer cells overexpressing JARID1B. *Molecules* **2019**, *24*, e1739 (doi: [10.3390/molecules24091739](https://doi.org/10.3390/molecules24091739); Pubmed ID: 31060229; Scopus ID: 2-s2.0-85065652898; ISI Accession Number: WOS:000469518100098; 4 maggio 2019; ISSN: 1420-3049; MDPI, Basilea, Svizzera).
22. La Regina, G.; Coluccia, A.; Naccarato, V.; Silvestri, R. Towards modern anticancer agents that interact with tubulin. *Eur. J. Pharm. Sci.* **2019**, *131*, 58–68 (doi: [10.1016/j.ejps.2019.01.028](https://doi.org/10.1016/j.ejps.2019.01.028); Pubmed ID: 30690185; Scopus ID: 2-s2.0-85061343987; ISI Accession Number: WOS:000460399800006; 25 gennaio 2019; ISSN: 0928-0987; Elsevier Science BV, Amsterdam, Paesi Bassi).
23. Coluccia, A.; La Regina, G.; Naccarato, V.; Nalli, M.; Orlando, V.; Biagioni, S.; De Angelis, M. L.; Baiocchi, M.; Gautier, C.; Gianni, S.; Di Pastena, F.; Di Magno, L.; Canettieri, G.; Coluccia, A. M. L.; Silvestri, R. Drug design and synthesis of first in class PDZ1 targeting NHERF1 inhibitors as anticancer agents. *ACS Med. Chem. Lett.* **2019**, *10*, 499–503 (doi: [10.1021/acsmchemlett.8b00532](https://doi.org/10.1021/acsmchemlett.8b00532); Pubmed ID: 30996786; Scopus ID: 2-s2.0-85064264813; ISI Accession Number: WOS:000464767700019; 14 gennaio 2019; ISSN: 1948-5875; American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).



24. Da Costa, L.; Scheers, E.; Coluccia, A.; Casulli, A.; Roche, M.; Di Giorgio, C.; Neyts, J.; Terme, T.; Cirilli, R.; La Regina, G.; Silvestri, R.; Mirabelli, C.; Vanelle, P. Structure-based drug design of potent pyrazole derivatives against *Rhinovirus* replication. *J. Med. Chem.* **2018**, *61*, 8402–8416 (doi: [10.1021/acs.jmedchem.8b00931](https://doi.org/10.1021/acs.jmedchem.8b00931); Pubmed ID: 30153009; Scopus ID: 2-s2.0-85053181101; ISI Accession Number: WOS:000446142000022; 28 agosto 2018; ISSN: 0022-2623; American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
25. La Regina, G.; Bai, R.; Coluccia, A.; Naccarato, V.; Famiglini, V.; Nalli, M.; Masci, D.; Verrico, A.; Rovella, P.; Mazzoccoli, C.; Da Pozzo, E.; Cavallini, C.; Martini, C.; Vultaggio, S.; Dondio, G.; Varasi, M.; Mercurio, C.; Hamel, E.; Lavia, P.; Silvestri, R. New 6- and 7-heterocyclyl-1*H*-indole derivatives as potent tubulin assembly and cancer cell growth inhibitors. *Eur. J. Med. Chem.* **2018**, *152*, 283–297 (doi: [10.1016/j.ejmech.2018.04.042](https://doi.org/10.1016/j.ejmech.2018.04.042); Pubmed ID: 29730191; Scopus ID: 2-s2.0-85046738606; ISI Accession Number: WOS:000435048900023; Aprile 25, 2018; ISSN: 0223-5234, Elsevier France-Editions Scientifiques Medicales Elsevier, Parigi, Francia).
26. Saponaro, C.; Sergio, S.; Coluccia, A.; De Luca, M.; La Regina, G.; Mologni, L.; Famiglini, V.; Naccarato, V.; Bonetti, D.; Gautier, C.; Gianni, S.; Vergara, D.; Salzet, M.; Fournier, I.; Bucci, C.; Silvestri, R.; Gambacorti Passerini, C.; Maffia, M.; Coluccia, A. M. L. β -catenin knockdown promotes NHERF1-mediated survival of colorectal cancer cells: implications for a double-targeted therapy. *Oncogene* **2018**, *37*, 3301–3316 (doi: [10.1038/s41388-018-0170-y](https://doi.org/10.1038/s41388-018-0170-y); Pubmed ID: 29551770; Scopus ID: 2-s2.0-85044095990; ISI Accession Number: WOS:000435526600009; Marzo 19, 2018; ISSN: 0950-9232; Nature Publishing Group, Londra, Regno Unito).
27. Riccio, G.; Bottone, S.; La Regina, G.; Badolati, N.; Passacantilli, S.; Rossi, G. B.; Accardo, A.; Dentice, M.; Silvestri, R.; Novellino, E.; Stornaiuolo, M. A negative allosteric modulator of WNT receptor frizzled 4 switches into an allosteric agonist. *Biochemistry* **2018**, *57*, 839–851 (doi: [10.1021/acs.biochem.7b01087](https://doi.org/10.1021/acs.biochem.7b01087); Pubmed ID: 29293331; Scopus ID: 2-s2.0-85041457316; ISI Accession Number: WOS:000424723300047; 2 gennaio 2018; ISSN: 0006-2960; American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
28. Daniele, S.; Pietrobono, D.; Costa, B.; Giustiniano, M.; La Pietra, V.; Giacomelli, C.; La Regina, G.; Silvestri, R.; Taliani, S.; Trincavelli, M. L.; Da Settimo, F.; Novellino, E.; Martini, C.; Marinelli, L. Bax activation blocks self-renewal and induces apoptosis of human glioblastoma stem cells. *ACS Chem. Neurosci.* **2018**, *9*, 85–99 (doi: [10.1021/acschemneuro.7b00023](https://doi.org/10.1021/acschemneuro.7b00023); Pubmed ID: 28368610; Scopus ID: 2-s2.0-85040673427; ISI Accession Number: WOS:000407425300618; 3 aprile 2017; ISSN: 1948-7193; American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
29. Giustiniano, M.; Daniele, S.; Pelliccia, S.; La Pietra, V.; Pietrobono, D.; Brancaccio, D.; Cosconati, S.; Messere, A.; Giuntini, S.; Cerofolini, L.; Fragai, M.; Luchinat, C.; Taliani, S.; La Regina, G.; Da Settimo, F.; Silvestri, R.; Martini, C.; Novellino, E.; Marinelli, L. Computer-aided identification and lead optimization of dual murine double minute 2 and 4 binders: structure-activity relationship studies and pharmacological activity. *J. Med. Chem.* **2017**, *60*, 8115–8130 (doi:



- [10.1021/acs.jmedchem.7b00912](https://doi.org/10.1021/acs.jmedchem.7b00912); Pubmed ID: 28921985; Scopus ID: 2-s2.0-85031292289; ISI Accession Number: WOS:000413131400012; 12 ottobre 2017; ISSN: 0022-2623; American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
30. Pelliccia, S.; Wub, Y. H.; Coluccia, A.; La Regina, G.; Tseng, C. K.; Famiglini, V.; Masci, D.; Hiscott, J.; Lee, J. C.; Silvestri, R. Inhibition of *Dengue* virus replication by novel inhibitors of RNA-dependent RNA polymerase and protease activities. *J. Enzyme Inhib. Med. Chem.* **2017**, *32*, 1091–1101 (doi: [10.1080/14756366.2017.1355791](https://doi.org/10.1080/14756366.2017.1355791)); Pubmed ID: 28776445; Scopus ID: 2-s2.0-85026861941; ISI Accession Number: WOS:000408991900004; 13 luglio 2017; ISSN: 1475-6366; Taylor & Francis Ltd, Oxon, Regno Unito).
31. Famiglini, V.; La Regina, G. (Autore corrispondente); Coluccia, A.; Masci, D.; Brancale, A.; Badia, R.; Riveira-Munoz, E.; Este, J. A.; Crespan, E.; Brambilla, A.; Maga, G.; Catalano, M.; Limatola, C.; Formica, F. R.; Cirilli, R.; Novellino, E.; Silvestri, R. Chiral indolylarylsulfone non-nucleoside reverse transcriptase inhibitors as new potent and broad spectrum anti-HIV-1 agents. *J. Med. Chem.* **2017**, *60*, 6528–6547 (doi: [10.1021/acs.jmedchem.6b01906](https://doi.org/10.1021/acs.jmedchem.6b01906)); Pubmed ID: 28628334; Scopus ID: 2-s2.0-85027261384; ISI Accession Number: WOS:000407656700004; 19 giugno 2017; ISSN: 0022-2623; American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
32. La Regina, G.; Bai, R.; Coluccia, A.; Famiglini, V.; Passacantilli, S.; Naccarato, V.; Ortar, G.; Mazzoccoli, C.; Ruggieri, V.; Agriesti, F.; Piccoli, C.; Tataranni, T.; Nalli, M.; Brancale, A.; Vultaggio, S.; Mercurio, C.; Varasi, M.; Saponaro, C.; Sergio, S.; Maffia, M.; Coluccia, A. M. L.; Hamel, E.; Silvestri, R. 3-Aroyl-1,4-diarylpyrroles inhibit chronic myeloid leukemia cell growth through an interaction with tubulin. *ACS Med. Chem. Lett.* **2017**, *8*, 521–526 (doi: [10.1021/acsmedchemlett.7b00022](https://doi.org/10.1021/acsmedchemlett.7b00022)); Pubmed ID: 28523104; Scopus ID: 2-s2.0-85018898332; ISI Accession Number: WOS:000401402900010; 26 aprile 2017; ISSN: 1948-5875; American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
33. Di Cesare, E.; Verrico, A.; Miele, A.; Giubettini M.; Rovella, P.; Cundari, E.; Lavia, P.; Miele, A.; Giubettini, M.; Coluccia, A.; Famiglini, V.; La Regina, G.; Silvestri, R. Mitotic cell death induction by targeting the mitotic spindle with tubulin-inhibitory indole derivative molecules. *Oncotarget* **2017**, *8*, 19738–19759 (doi: [10.18632/oncotarget.14980](https://doi.org/10.18632/oncotarget.14980)); Pubmed ID: 28160569; Scopus ID: 2-s2.0-85015806343; ISI Accession Number: WOS:000396879200088; 1 febbraio 2017; ISSN: 1949-2553; Impact Journals LLC, New York, Stati Uniti).
34. Soriani, A.; Borrelli, C.; Ricci, B.; Molfetta, R.; Zingoni, A.; Fionda, C.; Carnevale, S.; Abruzzese, M. P.; Petrucci, M. T.; Ricciardi, M. R.; La Regina, G.; Di Cesare, E.; Lavia, P.; Silvestri, R.; Paolini, R.; Cippitelli, M.; Santoni, A. p38 MAPK differentially controls NK activating ligands at transcriptional and post-transcriptional level on multiple myeloma cells. *Oncolmmunology* **2017**, *6*, e1264564 (doi: [10.1080/2162402X.2016.1264564](https://doi.org/10.1080/2162402X.2016.1264564)); Pubmed ID: 28197392; Scopus ID: 2-s2.0-85015270684; ISI Accession Number: WOS:000397069400020; 17 novembre 2016; ISSN: 2162-402X; Taylor & Francis Inc, Philadelphia, Stati Uniti).
35. Coluccia, A.; La Regina, G.; Barilone, N.; Lisa, M. N.; Brancale, A.; Andre-Leroux, G.; Alzari, P. M.; Silvestri, R. Structure-based virtual screening to get new scaffold



- inhibitors of the Ser/Thr protein kinase PknB from *Mycobacterium tuberculosis*. *Lett. Drug Des. Discov.* **2016**, *13*, 1012–1018 (doi: [10.2174/1570180813666160801162204](https://doi.org/10.2174/1570180813666160801162204); Pubmed ID: non disponibile; Scopus ID: 2-s2.0-84995937420; ISI Accession Number: WOS:000389464700004; 3 ottobre 2016; ISSN: 1570-1808, Bentham Science Publishers B.V., Sharja, Emirati Arabi).
36. Coluccia, A.; Passacantilli, S.; Famiglioni, V.; Sabatino, M.; Patsilnakos, A.; Ragno, R.; Mazzoccoli, C.; Sisinni, L.; Okuno, A.; Takikawa, O.; Silvestri, R.; La Regina, G. (Autore corrispondente). New inhibitors of indoleamine 2,3-dioxygenase 1: molecular modeling studies, synthesis, and biological evaluation. *J. Med. Chem.* **2016**, *59*, 9760–9773 (doi: [10.1021/acs.jmedchem.6b00718](https://doi.org/10.1021/acs.jmedchem.6b00718); Pubmed ID: 27690429; Scopus ID: 2-s2.0-84994853619; ISI Accession Number: WOS:000387737600010; 3 ottobre 2016; ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
37. Masuelli, L.; Pantanella, F.; La Regina, G.; Benvenuto, M.; Fantini, M.; Mattera, R.; Di Stefano, E.; Mattei, M.; Silvestri, R.; Schippa, S.; Manzari, V.; Modesti, A.; Bei, R. Violacein, an indole-derived purple-colored natural pigment produced by *Janthinobacterium lividum*, inhibits the growth of head and neck carcinoma cell lines both *in vitro* and *in vivo*. *Tumor Biol.* **2016**, *37*, 3705–3717 (doi: [10.1007/s13277-015-4207-3](https://doi.org/10.1007/s13277-015-4207-3); Pubmed ID: 26462840; Scopus ID: 2-s2.0-84944704386; ISI Accession Number: WOS:000374903500096; 13 ottobre 2015; ISSN: 1010-4283, Springer, Dordrecht, Paesi Bassi).
38. La Regina, G.; Coluccia, A.; Famiglioni, V.; Pelliccia, S.; Monti, L.; Vullo, D.; Nuti, E.; Alterio, V.; De Simone, G.; Monti, S. M.; Pan, P.; Parkkila, S.; Supuran, C. T.; Rossello, A.; Silvestri, R. Discovery of 1,1'-biphenyl-4-sulfonamides as a new class of potent and selective carbonic anhydrase XIV inhibitors. *J. Med. Chem.* **2015**, *58*, 8564–8572 (doi: [10.1021/acs.jmedchem.5b01144](https://doi.org/10.1021/acs.jmedchem.5b01144); Pubmed ID: 26497049; Scopus ID: 2-s2.0-84947266183; ISI Accession Number: WOS:000364796100017; 25 ottobre 2015; ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
39. Stornaiuolo, M.; Bruno, A.; Botta, L.; La Regina, G.; Cosconati, S.; Silvestri, R.; Marinelli, L.; Novellino, E. Endogenous vs exogenous allosteric modulators in GPCRs: a dispute for shuttling CB₁ among different membrane microenvironments. *Sci Rep.* **2015**, *5*, e15453 (doi: [10.1038/srep15453](https://doi.org/10.1038/srep15453); Pubmed ID: 26482099; Scopus ID: 2-s2.0-84945193701; ISI Accession Number: WOS:000363036200001; ottobre 20, 2015; ISSN: 2045-2322, Nature Publishing Group, Londra, Regno Unito).
40. La Regina, G.; Bai, R.; Coluccia, A.; Famiglioni, V.; Pelliccia, S.; Passacantilli, S.; Mazzoccoli, C.; Ruggieri, V.; Verrico, A.; Miele, A.; Monti, L.; Nalli, M.; Alfonsi, R.; Di Marcotullio, L.; Gulino, A.; Ricci, B.; Soriani, A.; Santoni, A.; Caraglia, M.; Porto, S.; Da Pozzo, E.; Martini, C.; Brancale, A.; Marinelli, L.; Novellino, E.; Vultaggio, S.; Varasi, M.; Mercurio, C.; Dondio, G.; Bigogno, C.; Hamel, E.; Lavia, P.; Silvestri, R. New indole tubulin assembly inhibitors cause stable arrest of mitotic progression, enhanced stimulation of natural killer cell cytotoxic activity and repression of Hedgehog-dependent cancer. *J. Med. Chem.* **2015**, *58*, 5789–5807 (doi: [10.1021/acs.jmedchem.5b00310](https://doi.org/10.1021/acs.jmedchem.5b00310); Pubmed ID: 26132075; Scopus ID: 2-s2.0-



- 84939138196; ISI Accession Number: WOS:000359683700008; 1 luglio 2015; ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
41. Santamaria, S.; Nuti, E.; Cercignani, G.; La Regina, G.; Silvestri, R.; Supuran, C. T.; Rossello, A. Kinetic characterization of 4,4'-biphenylsulfonamides as selective non-zinc binding MMP inhibitors. *J. Enzyme Inhib. Med. Chem.* **2015**, *30*, 947–954 (doi: [10.3109/14756366.2014.1000889](https://doi.org/10.3109/14756366.2014.1000889); Pubmed ID: 25694065; Scopus ID: 2-s2.0-84945914800; ISI Accession Number: WOS:000369915500012; 19 febbraio 2015; ISSN: 1475-6366, Taylor & Francis Ltd, Oxon, Regno Unito).
42. Stornaiuolo, M.; La Regina, G.; Passacantilli, S.; Grassia, G.; Coluccia, A.; La Pietra, V.; Giustiniano, M.; Cassese, H.; Di Maro, S.; Brancaccio, D.; Taliani, S.; Ialenti, A.; Silvestri, R.; Martini, C.; Novellino, E.; Marinelli, L. Structure-based lead optimization and biological evaluation of BAX direct activators as novel potential anticancer agents. *J. Med. Chem.* **2015**, *58*, 2135–2148 (doi: [10.1021/jm501123r](https://doi.org/10.1021/jm501123r); Pubmed ID: 25668341; Scopus ID: 2-s2.0-84924664711; ISI Accession Number: WOS:000351186500007; 10 febbraio 2015; ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
43. Generoso, S. F.; Giustiniano, M.; La Regina, G.; Bottone, S.; Passacantilli, S.; Di Maro, S.; Cassese, H.; Bruno, A.; Mallardo, M.; Dentice, M.; Silvestri, R.; Marinelli, L.; Sarnataro, D.; Bonatti, S.; Novellino, E.; Stornaiuolo, M. Pharmacological folding chaperones act as allosteric ligands of Frizzled4. *Nat. Chem. Biol.* **2015**, *11*, 280–286 (doi: [10.1038/nchembio.1770](https://doi.org/10.1038/nchembio.1770); Pubmed ID: 25751279; Scopus ID: 2-s2.0-84924362536; ISI Accession Number: WOS:000351666500011; 9 marzo 2015; ISSN: 1552-4450, Nature Publishing Group, New York, Stati Uniti).
44. Manvar, D.; Pelliccia, S.; La Regina, G.; Famigliani, V.; Coluccia, A.; Ruggieri, A.; Anticoli, S.; Lee, J.-C.; Basu, A.; Cevik, O.; Nencioni, L.; Palamara, A. T.; Zamperini, C.; Botta, M.; Neyts, J.; Leyssen, P.; Kaushik-Basu, N.; Silvestri, R. New 1-phenyl-5-(1H-pyrrol-1-yl)-1H-pyrazole-3-carboxamides inhibit hepatitis C virus replication via suppression of cyclooxygenase-2. *Eur. J. Med. Chem.* **2015**, *90*, 497–506 (doi: [10.1016/j.ejmech.2014.11.042](https://doi.org/10.1016/j.ejmech.2014.11.042); Pubmed ID: 25483263; Scopus ID: 2-s2.0-84914680268; ISI Accession Number: WOS:000348951900040; 27 novembre 2014; ISSN: 0223-5234, Elsevier France-Editions Scientifiques Medicales Elsevier, Parigi, Francia).
45. Famigliani, V.; La Regina, G. (Autore corrispondente); Coluccia, A.; Pelliccia, S.; Brancale, A.; Maga, G.; Crespan, E.; Badia, R.; Riveira-Munoz, E.; Este, J. A.; Ferretti, R.; Cirilli, R.; Zamperini, C.; Botta, M.; Schols, D.; Limongelli, V.; Agostino, B.; Novellino, E.; Silvestri, R. Indolylarylsulfones carrying a heterocyclic tail as very potent and broad spectrum HIV-1 non-nucleoside reverse transcriptase inhibitors. *J. Med. Chem.* **2014**, *57*, 9945–9957 (doi: [10.1021/jm5011622](https://doi.org/10.1021/jm5011622); Pubmed ID: 25418038; Scopus ID: 2-s2.0-84918566396; ISI Accession Number: WOS:000346321200017; 13 novembre 2014; ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
46. La Regina, G. (Autore corrispondente); Famigliani, V.; Passacantilli, S.; Pelliccia, S.; Punzi, P.; Silvestri, R. New, simple and high-yielding synthesis of 2,9-dihydro-1H-pyrido[3,4-b]indol-1-ones. *Synthesis* **2014**, *46*, 2093–2097 (doi: [10.1055/s-0033-1339155](https://doi.org/10.1055/s-0033-1339155); Pubmed ID: non disponibile; Scopus ID: 2-s2.0-84904763883; ISI



- Accession Number: WOS:000340874800016; 2 giugno 2014; ISSN: 0039-7881, Georg Thieme Verlag Kg, Stuttgart, Germania).
47. La Regina, G.; Bai, R.; Coluccia, A.; Famiglini, V.; Pelliccia, S.; Passacantilli, S.; Mazzoccoli, C.; Ruggieri, V.; Sisinni, L.; Bolognesi, A.; Rensen, W. M.; Miele, A.; Nalli, M.; Alfonsi, R.; Di Marcotullio, L.; Gulino, A.; Brancale, A.; Novellino, E.; Dondio, G.; Vultaggio, S.; Varasi, M.; Mercurio, C.; Hamel, E.; Lavia, P.; Silvestri, R. New pyrrole derivatives with potent tubulin polymerization inhibiting activity as anticancer agents including Hedgehog-dependent cancer. *J. Med. Chem.* **2014**, *57*, 6531–6552 (doi: [10.1021/jm500561a](https://doi.org/10.1021/jm500561a); Pubmed ID: 25025991; Scopus ID: 2-s2.0-84906094556; ISI Accession Number: WOS:000340445900020; 15 giugno 2014; ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
48. Famiglini, V.; La Regina, G. (Autore corrispondente); Coluccia, A.; Pelliccia, S.; Brancale, A.; Maga, G.; Crespan, E.; Badia, R.; Clotet, B.; Esté, J. A.; Cirilli, R.; Novellino, E.; Silvestri, R. New indolylarylsulfones as highly potent and broad spectrum HIV-1 non-nucleoside reverse transcriptase inhibitors. *Eur. J. Med. Chem.* **2014**, *80*, 101–111 (doi: [10.1016/j.ejmech.2014.04.027](https://doi.org/10.1016/j.ejmech.2014.04.027); Pubmed ID: 24769348; Scopus ID: 2-s2.0-84899103627; ISI Accession Number: WOS:000337985400009; 12 aprile 2014; ISSN: 0223-5234, Elsevier France-Editions Scientifiques Medicales Elsevier, Parigi, Francia).
49. Marzaro, G.; Coluccia, A.; Ferrarese, A.; Brun, P.; Castagliuolo, I.; Conconi, M. T.; La Regina, G.; Bai, R.; Silvestri, R.; Hamel, E.; Chilin, A. Discovery of biaryl aminoquinazolines as novel tubulin polymerization inhibitors. *J. Med. Chem.* **2014**, *57*, 4598–4605 (doi: [10.1021/jm500034j](https://doi.org/10.1021/jm500034j); Pubmed ID: 24801610; Scopus ID: 2-s2.0-84902438483; ISI Accession Number: WOS:000337336600014; 6 maggio 2014; ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
50. Mannironi, C.; Cundari, E.; Proietto, M.; Bufalieri, F.; Alagia, A.; Danovska, S.; Rinaldi, T.; Negri, R.; Famiglini, V.; Coluccia, A.; La Regina, G.; Silvestri, R. An high-throughput *in vivo* screening system to select H3K4-specific histone demethylase inhibitors. *PLoS One* **2014**, *9*, e86002 (doi: [10.1371/journal.pone.0086002](https://doi.org/10.1371/journal.pone.0086002); Pubmed ID: 24489688; Scopus ID: 2-s2.0-84900435770; ISI Accession Number: WOS:000330570000022; 29 gennaio 2014; ISSN: 1932-6203, Public Library Science, San Francisco, Stati Uniti).
51. La Pietra, V.; La Regina, G. (Autore corrispondente); Coluccia, A.; Famiglini, V.; Pelliccia, S.; Plotkin, B.; Eldar-Finkelman, H.; Brancale, A.; Ballatore, C.; Crowe, A.; Brunden, K. R.; Marinelli, L.; Novellino, E.; Silvestri, R. Design, Synthesis, and biological evaluation of 1-phenylpyrazolo[3,4-e]pyrrolo[3,4-g]indolizine-4,6(1*H*,5*H*)-diones as new glycogen synthase kinase-3 β inhibitors. *J. Med. Chem.* **2013**, *56*, 10066–10078 (doi: [10.1021/jm401466v](https://doi.org/10.1021/jm401466v); Pubmed ID: 24295046; Scopus ID: 2-s2.0-84891341466; ISI Accession Number: WOS:000329331600018; 2 dicembre 2013; ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
52. Famiglini, V.; Coluccia, A.; Brancale, A.; Pelliccia, S.; La Regina, G.; Silvestri, R. Arylsulfone-based HIV-1 non-nucleoside reverse transcriptase inhibitors. *Future Med. Chem.* **2013**, *5*, 2141–2156 (doi: [10.4155/fmc.13.174](https://doi.org/10.4155/fmc.13.174); Pubmed ID: 24261891; Scopus ID: 2-s2.0-84889578221; ISI Accession Number:



- WOS:000327222400008; 21 novembre 2013; ISSN: 1756-8919, Future Sci Ltd, Londra, Regno Unito).
53. La Regina, G.; Bai, R.; Rensen, W. M.; Di Cesare, E.; Coluccia, A.; Piscitelli, F.; Famigliani, V.; Reggio, A.; Nalli, M.; Pelliccia, S.; Da Pozzo, E.; Costa, B.; Granata, I.; Porta, A.; Maresca, B.; Soriani, A.; Iannitto, M. L.; Santoni, A.; Li, J.; Miranda Cona, M.; Chen, F.; Ni, Y.; Brancale, A.; Dondio, G.; Vultaggio, S.; Varasi, M.; Mercurio, C.; Martini, C.; Hamel, E.; Lavia, P.; Novellino, E.; Silvestri, R. Toward highly potent cancer agents by modulating the C-2 group of the arylthioindole class of tubulin polymerization inhibitors. *J. Med. Chem.* **2013**, *56*, 123–149 (doi: [10.1021/jm3013097](https://doi.org/10.1021/jm3013097); Pubmed ID: 23214452; Scopus ID: 2-s2.0-84872352365; ISI Accession Number: WOS:000313221600012; 5 dicembre 2012; ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
54. Palermo, V.; Mattivi, F.; Silvestri, R.; La Regina, G.; Falcone, C.; Mazzoni, C. Apple can act as anti-aging on yeast cells. *Oxid. Med. Cell. Long.* **2012**, e491759 (doi: [10.1155/2012/491759](https://doi.org/10.1155/2012/491759); Pubmed ID: 22970337; Scopus ID: 2-s2.0-84867365062; ISI Accession Number: WOS:000308498000001; 30 agosto 2012; ISSN: 1942-0900, Hindawi Publishing Corp, New York, Stati Uniti).
55. La Regina, G.; Coluccia, A.; Brancale, A.; Piscitelli, F.; Famigliani, V.; Cosconati, S.; Maga, G.; Samuele, A.; Gonzales, E.; Clotet, B.; Schols, D.; Este, J.; Novellino, E.; Silvestri, R. New nitrogen containing substituents at the indole-2-carboxamide yield high potent and broad spectrum indolylarylsulfone HIV-1 non-nucleoside reverse transcriptase inhibitors. *J. Med. Chem.* **2012**, *55*, 6634–6638 (doi: [10.1021/jm300477h](https://doi.org/10.1021/jm300477h); Pubmed ID: 22712652; Scopus ID: 2-s2.0-84864247649; ISI Accession Number: WOS:000306764600035; 20 giugno 20; ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
56. Piscitelli, F.; Ligresti, A.; La Regina, G.; Coluccia, A.; Morera, L.; Allarà, M.; Novellino, E.; Di Marzo, V.; Silvestri, R. Indole-2-carboxamides as allosteric modulators of the cannabinoid CB₁ receptor. *J. Med. Chem.* **2012**, *55*, 5627–5631 (doi: [10.1021/jm201485c](https://doi.org/10.1021/jm201485c); Pubmed ID: 22571451; Scopus ID: 2-s2.0-84862272370; ISI Accession Number: WOS:000305356400058; 9 maggio 2012; ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
57. La Regina, G. (Autore corrispondente); Gatti, V.; Famigliani, V.; Piscitelli, F.; Silvestri, R. Venting-while-heating microwave-assisted synthesis of 3-arylthioindoles. *ACS Comb. Sci.* **2012**, *14*, 258–262 (doi: [10.1021/co200165j](https://doi.org/10.1021/co200165j); Pubmed ID: 22432410; Scopus ID: 2-s2.0-84859727783; ISI Accession Number: WOS:000303076400003; 20 marzo 2012; ISSN: 2156-8952, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
58. Samuele, A.; Bisi, S.; Kataropoulou, A.; La Regina, G.; Piscitelli, F.; Gatti, V.; Silvestri, R.; Maga, G. Mechanism of interaction of novel indolylarylsulfone derivatives with K103N and Y181I mutant HIV-1 reverse transcriptase in complex with its substrates. *Antivir. Chem. Chemother.* **2011**, *22*, 107–118 (doi: [10.3851/IMP1855](https://doi.org/10.3851/IMP1855); Pubmed ID: 22095519; Scopus ID: 2-s2.0-84861534913; ISI Accession Number: non disponibile; 19 luglio 2011; ISSN: 0956-3202, Int Medical Press Ltd, Londra, Regno Unito).
59. La Regina, G.; Bai, R.; Rensen, W.; Coluccia, A.; Piscitelli, F.; Gatti, V.; Bolognesi, A.; Lavecchia, A.; Granata, I.; Porta, A.; Maresca, B.; Soriani, A.; Iannitto, M. L.;



- Mariani, M.; Santoni, A.; Brancale, A.; Ferlini, C.; Dondio, G.; Varasi, M.; Mercurio, C.; Hamel, E.; Lavia, P.; Novellino, E.; Silvestri, R. Design and synthesis of 2-heterocyclyl-3-arylthio-1*H*-indoles as potent tubulin polymerization and cell growth inhibitors with improved metabolic stability. *J. Med. Chem.* **2011**, *54*, 8394–8406 (doi: [10.1021/jm2012886](https://doi.org/10.1021/jm2012886); Pubmed ID: 22044164; Scopus ID: 2-s2.0-84055211830; ISI Accession Number: WOS:000297946300016; 1 novembre 2011; ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
60. Piscitelli, F.; Ligresti, A.; La Regina, G.; Gatti, V.; Brizzi, A.; Pasquini, S.; Allarà, M.; Carai, M. A. M.; Novellino, E.; Colombo, G.; Di Marzo, V.; Corelli, F.; Silvestri, R. 1-Aryl-5-(1*H*-pyrrol-1-yl)-1*H*-pyrazole-3-carboxamide: an effective scaffold for the design of either CB₁ or CB₂ receptor ligands. *Eur. J. Med. Chem.* **2011**, *46*, 5641–5653 (doi: [10.1016/j.ejmech.2011.09.037](https://doi.org/10.1016/j.ejmech.2011.09.037); Pubmed ID: 21996466; Scopus ID: 2-s2.0-80054960004; ISI Accession Number: WOS:298120500043; 29 settembre 2011; ISSN: 0223-5234, Elsevier France-Editions Scientifiques Medicales Elsevier, Parigi, Francia).
61. Palermo, V.; Pieri, L.; Silvestri, R.; La Regina, G.; Falcone, C.; Mazzoni, C. Drug-induced inhibition of tubulin polymerization induces mitochondrion-mediated apoptosis in yeast. *Cell Cycle* **2011**, *10*, 3208–3209 (doi: [10.4161/cc.10.18.16514](https://doi.org/10.4161/cc.10.18.16514); Pubmed ID: 21912212; Scopus ID: 2-s2.0-80052908186; ISI Accession Number: WOS:000294954400034; 15 settembre 2011; ISSN: 1538-4101, Taylor & Francis Inc, Philadelphia, Stati Uniti).
62. La Regina, G.; Coluccia, A.; Brancale, A.; Piscitelli, F.; Gatti, V.; Maga, G.; Samuele, A.; Pannecouque, C.; Schols, D.; Balzarini, J.; Novellino, E.; Silvestri, R. Indolylarylsulfones as HIV-1 non-nucleoside reverse transcriptase inhibitors: new cyclic substituents at the indole-2-carboxamide. *J. Med. Chem.* **2011**, *54*, 1587–1598 (doi: [10.1021/jm101614j](https://doi.org/10.1021/jm101614j); Pubmed ID: 21366296; Scopus ID: 2-s2.0-79952792724; ISI Accession Number: WOS:000288400700005; 2 marzo 2011; ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
63. La Regina, G. (Autore corrispondente); Gatti, V.; Piscitelli, F.; Silvestri, R. Open vessel and cooling while heating microwave-assisted synthesis of pyridinyl *N*-aryl hydrazones. *ACS Comb. Sci.* **2011**, *13*, 2–6 (doi: [10.1021/co100015b](https://doi.org/10.1021/co100015b); Pubmed ID: 21247117; Scopus ID: 2-s2.0-78651432876; ISI Accession Number: WOS:288062600001; 9 novembre 2010; ISSN: 2156-8952, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
64. Silvestri, R.; Ligresti, A.; La Regina, G.; Piscitelli, P.; Gatti, V.; Lavecchia, A.; Brizzi, A.; Pasquini, S.; Allarà, M.; Fantini, N.; Carai, M. A. M.; Bigogno, C.; Rozio, M. G.; Sinisi, R.; Novellino, E.; Colombo, G.; Di Marzo, V.; Dondio, G.; Corelli, F. Synthesis and biological evaluation of new *N*-alkyl 1-aryl-5-(1*H*-pyrrol-1-yl)-1*H*-pyrazole-3-carboxamides as cannabinoid receptor ligands. *Eur. J. Med. Chem.* **2010**, *45*, 5878–5886 (doi: [10.1016/j.ejmech.2010.09.053](https://doi.org/10.1016/j.ejmech.2010.09.053); Pubmed ID: 20943290; Scopus ID: 2-s2.0-78649319952; ISI Accession Number: WOS:285485000040; 1 ottobre 2010; ISSN: 0223-5234, Elsevier France-Editions Scientifiques Medicales Elsevier, Parigi, Francia).
65. La Regina, G.; Coluccia, A.; Silvestri, R. Looking for an active conformation of the future HIV-1 non-nucleoside reverse transcriptase inhibitors. *Antivir. Chem. Chemother.* **2010**, *20*, 213–237 (doi: [10.3851/IMP1607](https://doi.org/10.3851/IMP1607); Pubmed ID: 20710063;



- Scopus ID: 2-s2.0-77956900680; ISI Accession Number: non disponibile; 19 luglio 2010; ISSN: 0956-3202, Int Medical Press Ltd, Londra, Regno Unito).
66. Cirilli, R.; Ferretti, R.; La Regina, G.; Morelli, G.; Pierini, M.; Piscitelli, F.; Silvestri, R. Enantioselective HPLC combined with spectroscopic methods: a valid strategy to determine the absolute configuration of potential beta-secretase inhibitors. *Talanta* **2010**, *82*, 1306–1312 (doi: [10.1016/j.talanta.2010.06.060](https://doi.org/10.1016/j.talanta.2010.06.060); Pubmed ID: 20801333; Scopus ID: 2-s2.0-77956182621; ISI Accession Number: WOS:282480500032; 15 luglio 2010; ISSN: 0039-9140, Elsevier Science BV, Amsterdam, Paesi Bassi).
67. De Bruyne, S.; La Regina, G.; Staelens, S.; Wyffels, L.; Deleye, S.; Silvestri, R.; De Vos, F. Radiosynthesis and *in vivo* evaluation of [¹¹C]-labelled pyrrole-2-carboxamide derivatives as novel radioligands for PET imaging of monoamine oxidase A. *Nucl. Med. Biol.* **2010**, *37*, 459–467 (doi: [10.1016/j.nucmedbio.2009.09.005](https://doi.org/10.1016/j.nucmedbio.2009.09.005); Pubmed ID: 20447558; Scopus ID: 2-s2.0-77952549176; ISI Accession Number: WOS:277701900010; maggio 2010; ISSN: 0969-8051, Elsevier Science Inc, New York, Stati Uniti).
68. Giansanti, V.; Piscitelli, P.; Camboni, T.; Prosperi, E.; La Regina, G.; Parks, M.; Silvestri, R.; Scovassi, A. I. Arylthioindoles: Promising compounds against cancer cell proliferation. *Oncology Lett.* **2010**, *1*, 109–112 (doi: [10.3892/ol.00000020](https://doi.org/10.3892/ol.00000020); Pubmed ID: 22966266; Scopus ID: 2-s2.0-77955753209; ISI Accession Number: WOS:000284562300020; gennaio-febbraio, 2010; ISSN: 1792-1074, Spandidos Publ Ltd, Atene, Grecia).
69. Giansanti, V.; Cambonia, T.; Piscitelli, P.; Prosperia, E.; La Regina, G.; Lazzè, M. C.; Santin, G.; Silvestri, R.; Scovassi, A. I. Study of the effects of a new pyrazolecarboxamide: changes in mitochondria and induction of apoptosis. *Int. J. Biochem. Cell B.* **2009**, *41*, 1890–1898 (doi: [10.1016/j.biocel.2009.04.008](https://doi.org/10.1016/j.biocel.2009.04.008); Pubmed ID: 19379827; Scopus ID: 2-s2.0-68949092046; ISI Accession Number: WOS:270351100016; ottobre 2009; ISSN: 1357-2725, Pergamon-Elsevier Science Ltd, Oxford, Regno Unito).
70. Silvestri, R.; Ligresti, A.; La Regina, G.; Piscitelli, F.; Gatti, V.; Brizzi, A.; Lavecchia, A.; Allarà, M.; Fantini, N.; Carai, M. A. M.; Novellino, E.; Colombo, G.; Di Marzo, V.; Corelli, F. Synthesis, cannabinoid receptor affinity, molecular modeling studies and *in vivo* pharmacological evaluation of new substituted 1-aryl-5-(1*H*-pyrrol-1-yl)-1*H*-pyrazole-3-carboxamides. 2. Effect of the 3-carboxamide substituent on the affinity and selectivity profile. *Bioorg. Med. Chem.* **2009**, *17*, 5549–5564 (doi: [10.1016/j.bmc.2009.06.027](https://doi.org/10.1016/j.bmc.2009.06.027); Pubmed ID: 19595596; Scopus ID: 2-s2.0-67849084545; ISI Accession Number: WOS:268099700023; 1 agosto 2009; ISSN: 0968-0896, Pergamon-Elsevier Science Ltd, Oxford, Regno Unito).
71. La Regina, G.; Sarkar, T.; Bai, R.; Edler, M. C.; Saletti, R.; Coluccia, A.; Piscitelli, F.; Minelli, L.; Gatti, V.; Mazzoccoli, C.; Palermo, V.; Mazzoni, C.; Falcone, C.; Scovassi, A. I.; Giansanti, V.; Campiglia, P.; Porta, A.; Maresca, B.; Hamel, E.; Brancale, A.; Novellino, E.; Silvestri, R. New arylthioindoles and related bioisosteres at the sulfur bridging group. 4. Synthesis, tubulin polymerization, cell growth inhibition, and molecular modeling studies. *J. Med. Chem.* **2009**, *52*, 7512–7527 (doi: [10.1021/jm900016t](https://doi.org/10.1021/jm900016t); Pubmed ID: 19601594; Scopus ID: 2-s2.0-



- 72249084715; ISI Accession Number: WOS:272338000020; 14 luglio 2009; ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
72. Piscitelli, F.; Coluccia, A.; Brancale, A.; La Regina, G.; Sansone, A.; Giordano, C.; Balzarini, J.; Maga, G.; Zanolli, Z.; Samuele, A.; Cirilli, R.; La Torre, F.; Lavecchia, A.; Novellino, E.; Silvestri, R. Indolyl aryl sulfones bearing natural and unnatural aminoacids. Discovery of potent inhibitors of both HIV-1 non-nucleoside wild type and resistant mutant strains reverse transcriptase, and Coxsackie B4 virus. *J. Med. Chem.* **2009**, *52*, 1922–1934 (doi: [10.1021/jm801470b](https://doi.org/10.1021/jm801470b); Pubmed ID: 19281225; Scopus ID: 2-s2.0-64549155260; ISI Accession Number: WOS:264835800014; 12 marzo 2009; ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
73. La Regina, G.; Piscitelli, F.; Silvestri, R. Synthetic strategies of non-peptidic beta-secretase (BACE1) inhibitors. *J. Heterocycl. Chem.* **2009**, *46*, 10–17 (doi: [10.1002/jhet.24](https://doi.org/10.1002/jhet.24); Pubmed ID: non disponibile; Scopus ID: 2-s2.0-61849126868; ISI Accession Number: WOS:000264349600002; 11 febbraio 2009; ISSN: 0022-152X, Wiley-Blackwell, New York, Stati Uniti).
74. Samuele, A.; Kataropoulou, A.; Viola, M.; Zanolli, S.; La Regina, G.; Piscitelli, F.; Silvestri, R.; Maga, G. Non-nucleoside HIV-1 reverse transcriptase inhibitors dihalo-indolyl aryl sulfones achieve tight binding to drug-resistant mutants by targeting the enzyme-substrate complex. *Antivir. Res.* **2009**, *81*, 47–55 (doi: [10.1016/j.antiviral.2008.09.008](https://doi.org/10.1016/j.antiviral.2008.09.008); Pubmed ID: 18984007; Scopus ID: 2-s2.0-57149112301; ISI Accession Number: WOS:262589900006; gennaio 2009; ISSN: 0166-3542, Elsevier Science BV, Amsterdam, Paesi Bassi).
75. La Regina, G.; Silvestri, R.; Gatti, V.; Lavecchia, A.; Novellino, E. Befani, O.; Turini, P.; Agostinelli, E. Synthesis, structure-activity relationships and molecular modeling studies of new indole inhibitors of monoamino oxidases A and B. *Bioorg. Med. Chem.* **2008**, *22*, 9729–9740 (doi: [10.1016/j.bmc.2008.09.072](https://doi.org/10.1016/j.bmc.2008.09.072); Pubmed ID: 18951803; Scopus ID: non disponibile; ISI Accession Number: WOS:260758200011; 15 novembre 2008; ISSN: 0968-0896, Pergamon-Elsevier Science Ltd, Oxford, Regno Unito).
76. La Regina, G.; D'Auria, F.; Tafi, A.; Piscitelli, F.; Olla, S.; Caporuscio, F.; Nencioni, L.; Cirilli, R.; La Torre, F.; De Melo, N.; Kelly, S.; Lamb, D.; Artico, M.; Botta, M.; Palamara, A.; Silvestri, R. 1-(3-Aryloxy-3-arylpropyl)-1*H*-imidazoles, new imidazoles with potent activity against *Candida albicans* and dermatophytes. Synthesis, structure-activity relationship and molecular modeling studies. *J. Med. Chem.* **2008**, *51*, 3841–3855 (doi: [10.1021/jm800009r](https://doi.org/10.1021/jm800009r); Pubmed ID: 18529046; Scopus ID: 2-s2.0-46849105237; ISI Accession Number: WOS:257391000019; 10 giugno 2008; ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
77. Piscitelli, F.; La Regina, G.; Silvestri, R. An improved synthesis of ethyl 5-chloro-4-fluoro-1*H*-indole-2-carboxylate. *Org. Prep. Proced. Int.* **2008**, *40*, 204–208 (doi: [10.1080/00304940809458086](https://doi.org/10.1080/00304940809458086); Pubmed ID: non disponibile; Scopus ID: 2-s2.0-44149117529; ISI Accession Number: WOS:255310900004; 2 aprile 2008; ISSN: 0030-4948, Taylor & Francis Inc, Philadelphia, Stati Uniti).
78. Silvestri, R.; Cascio, M. G.; La Regina, G.; Piscitelli, F.; Lavecchia, A.; Brizzi, A.; Pasquini, S.; Botta, M.; Novellino, E.; Di Marzo, V.; Corelli, F. Synthesis,



- cannabinoid receptor affinity and molecular modeling studies of substituted 1-aryl-5-(1*H*-pyrrol-1-yl)-1*H*-pyrazole-3-carboxamides. *J. Med. Chem.* **2008**, *51*, 1560–1576 (doi: [10.1021/jm070566z](https://doi.org/10.1021/jm070566z); Pubmed ID: 18293908; Scopus ID: 2-s2.0-41149151354; ISI Accession Number: WOS:254209800005; 27 marzo 2008; ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
79. Marfè, G.; Di Stefano, C.; Silvestri, R.; Abruzzese, E.; Catalano, G.; Di Renzo, L.; Filomeni, G.; Giorda, E.; La Regina, G.; Morgante, E.; Ciriolo, M. R.; Russo, M. A.; Amadori, S.; Sinibaldi-Salimei, P. Pyrrolo[1,2-*b*][1,2,5]benzothiadiazepines (PBTDS) induces apoptosis in K562 cells. *BMC Cancer* **2007**, *7*, e207 (doi: [10.1186/1471-2407-7-207](https://doi.org/10.1186/1471-2407-7-207); Pubmed ID: 17996085; Scopus ID: 2-s2.0-38949085858; ISI Accession Number: WOS:252786900001; 9 novembre 2007; ISSN: 1471-2407, Biomed Central Ltd, Londra, Regno Unito).
80. La Regina, G.; Coluccia, A.; Piscitelli, F.; Bergamini, A.; Sinistro, A.; Cavazza, A.; Maga, G.; Samuele, A.; Zanolì, S.; Novellino, E.; Artico, M.; Silvestri, R. Indolyl aryl sulfones as HIV-1 non-nucleoside reverse transcriptase inhibitors: role of two halogen atoms at the indole ring in developing new analogues with improved antiviral activity. *J. Med. Chem.* **2007**, *50*, 5034–5038 (doi: [10.1021/jm070488f](https://doi.org/10.1021/jm070488f); Pubmed ID: 17803291; Scopus ID: 2-s2.0-34948862163; ISI Accession Number: WOS:249871300022; 4 ottobre 2007; ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
81. La Regina, G.; Edler, M. C.; Brancale, A.; Kandil, S.; Coluccia, A.; Piscitelli, F.; Hamel, E.; De Martino, G.; Matesanz, R.; Díaz, J. F.; Scovassi, A. I.; Ennio, P.; Lavecchia, A.; Novellino, E.; Artico, M.; Silvestri, R. New arylthioindoles inhibitors of tubulin polymerization. 3. Biological evaluation, structure-activity relationships and molecular modeling studies. *J. Med. Chem.* **2007**, *50*, 2865–2874 (doi: [10.1021/jm061479u](https://doi.org/10.1021/jm061479u); Pubmed ID: 17497841; Scopus ID: 2-s2.0-34250869030; ISI Accession Number: WOS:247033900011; 14 giugno 2007; ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
82. Ragno, R.; Coluccia, A.; La Regina, G.; Silvestri, R. Indolyl aryl sulphones as HIV-1 reverse transcriptase inhibitors: docking and 3D QSAR studies. *Exp. Opin. Drug Discovery* **2007**, *2*, 87–114 (doi: [10.1517/17460441.2.1.87](https://doi.org/10.1517/17460441.2.1.87); Pubmed ID: 0.1517/17460441.2.1.87; Scopus ID: 2-s2.0-34447527787; ISI Accession Number: WOS:207616400006; gennaio 2007; ISSN: 1746-0441, Taylor & Francis Ltd, Oxon, Regno Unito).
83. La Regina, G.; Silvestri, R.; Artico, M.; Lavecchia, A.; Novellino, E.; Befani, O.; Turini, P.; Agostinelli, E. New pyrrole inhibitors of monoamine oxidase: synthesis, biological evaluation, and structural determinants of MAO-A and MAO-B selectivity. *J. Med. Chem.* **2007**, *50*, 922–931 (doi: [10.1021/jm060882y](https://doi.org/10.1021/jm060882y); Pubmed ID: 17256833; Scopus ID: 2-s2.0-33847770688; ISI Accession Number: WOS:244530400004; 8 marzo 2007; ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
84. Silvestri, R.; Marfè, G.; Artico, M.; La Regina, G.; De Martino, G.; Lavecchia, A.; Novellino, E.; Morgante, E.; Di Stefano, C.; Catalano, G.; Filomeni, G.; Abruzzese, E.; Ciriolo, M. R.; Russo, M. A.; Amadori, S.; Cirilli, R.; La Torre, F.; Sinibaldi Salimei, P. Pyrrolo[1,2-*b*][1,2,5]benzothiadiazepines (PBTDS): a new class of agents endowed with high apoptotic activity in chronic myelogenous leukemia



- K562 cells and in cells from patients at onset and imatinib-resistant. *J. Med. Chem.* **2006**, *49*, 5840–5844 (doi: [10.1021/jm0602716](https://doi.org/10.1021/jm0602716); Pubmed ID: 16970408; Scopus ID: 2-s2.0-33748877961; ISI Accession Number: WOS:240495600019; 30 novembre 2006; ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
85. De Martino, G.; La Regina, G.; Ragno, R.; Coluccia, A.; Bergamini, A.; Caprini, C.; Sinistro, A.; Maga, G.; Crespan, E.; Artico, M.; Silvestri, R. Indolyl aryl sulphones as HIV-1 non-nucleoside reverse transcriptase inhibitors: synthesis, biological evaluation and binding mode studies of new derivatives at indole-2-carboxamide. *Antivir. Chem. Chemother.* **2006**, *17*, 59–77 (doi: [10.1177/095632020601700202](https://doi.org/10.1177/095632020601700202); Pubmed ID: 17042328; Scopus ID: 2-s2.0-33745100897; ISI Accession Number: non disponibile; febbraio 2006; ISSN: 0956-3202, Int Medical Press Ltd, Londra, Regno Unito).
86. Ragno, R.; Coluccia, A.; La Regina, G.; De Martino, G.; Piscitelli, F.; Lavecchia, A.; Novellino, E.; Bergamini, A.; Ciaprini, C.; Sinistro, A.; Maga, G.; Crespan, E.; Artico, M.; Silvestri, R. Design, molecular modeling, synthesis, and anti-HIV-1 activity of new indolyl aryl sulfones. Novel derivatives of the indole-2-carboxamide. *J. Med. Chem.* **2006**, *49*, 3172–3184 (doi: [10.1021/jm0512490](https://doi.org/10.1021/jm0512490); Pubmed ID: 16722636; Scopus ID: 2-s2.0-33744831188; ISI Accession Number: WOS:237832400018; 1 giugno 2006; ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
87. De Martino, G.; Edler, M. C.; La Regina, G.; Coluccia, A.; Barbera, M. C.; Barrow, D.; Nicholson, R. I.; Chiosis, G.; Brancale, A.; Hamel, E.; Artico, M.; Silvestri, R. New arylthioindoles, potent inhibitors of tubulin polymerization. 2. Structure activity relationship and molecular modeling studies. *J. Med. Chem.* **2006**, *49*, 947–954 (doi: [10.1021/jm050809s](https://doi.org/10.1021/jm050809s); Pubmed ID: 16451061; Scopus ID: 2-s2.0-32344432249; ISI Accession Number: WOS:235826300014; 9 febbraio 2006; ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
88. Cancio, R.; Silvestri, R.; Ragno, R.; Artico, M.; De Martino, G.; La Regina, G.; Crespan, E.; Zanolli, S.; Hübscher, U.; Spadari, S.; Maga, G. High potency of indolyl aryl sulfone non-nucleoside inhibitors towards drug-resistant human immunodeficiency virus type 1 reverse transcriptase mutants is due to selective targeting of different mechanistic forms of the enzyme. *Antimicrob. Agents Chemother.* **2005**, *49*, 4546–4554 (doi: [10.1128/AAC.49.11.4546-4554.2005](https://doi.org/10.1128/AAC.49.11.4546-4554.2005); Pubmed ID: 16251294; Scopus ID: 2-s2.0-27644482321; ISI Accession Number: WOS:233020900016; novembre 2005; ISSN: 0066-4804, American Society for Microbiology, Washington, Stati Uniti).
89. De Martino, G.; La Regina, G.; La Torre, F.; Cirilli, R.; Mereghetti, I.; Cagnotto, A.; Artico, M.; Silvestri, R. Chiral resolution and binding study of 1,3,4,14*b*-tetrahydro-2,10-dimethyl-2*H*,10*H*-pyrazino[2,1-*d*]pyrrolo[1,2-*b*] [1,2,5]benzotriazepine (10-methyl-10-azaaptazepine) and 2-methyl-1,3,4,14*b*-tetrahydro-2*H*-pyrazino[2,1-*d*]pyrrolo[1,2-*b*][1,2,5]-benzothiadiazepine 10,10-dioxide (tiaaptazepine). *Farmaco* **2005**, *60*, 931–937 (doi: [10.1016/j.farmac.2005.07.007](https://doi.org/10.1016/j.farmac.2005.07.007); Pubmed ID: 16223499; Scopus ID: 2-s2.0-27744558834; ISI Accession Number: non disponibile; 7 luglio 2005; ISSN: 0014-827X, Elsevier Science Sa, Losanna, Svizzera).



90. De Martino, G.; La Regina, G.; Ragno, R.; Loddo, R.; La Colla, M.; Mura, M.; La Colla, P.; Maga, G.; Crespan, E.; Artico, M.; Silvestri, R. Novel 1-[2-(Diarylmethoxy)ethyl]-2-methyl-5-nitroimidazoles as HIV-1 non-nucleoside reverse transcriptase inhibitors. A structure-activity relationship investigation. *J. Med. Chem.* **2005**, *48*, 4378–4388 (doi: [10.1021/jm050273a](https://doi.org/10.1021/jm050273a); Pubmed ID: 1597459; Scopus ID: 2-s2.0-21244459659; ISI Accession Number: WOS:230121800023; 30 giugno 2005; ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
91. Cirilli, R.; Ferretti, R.; Gallinella, B.; La Torre, F.; La Regina, G.; Silvestri, R. Comparative study between the polysaccharidebased Chiralcel OJ and Chiralcel OD CSPs in chromatographic enantioseparation of imidazole analogues of Fluoxetine and Miconazole. *J. Sep. Sci.* **2005**, *28*, 627–634 (doi: [10.1002/jssc.200400102](https://doi.org/10.1002/jssc.200400102), Pubmed ID: 15912731; Scopus ID: 2-s2.0-19044400487; ISI Accession Number: WOS:229160400004; maggio 2005; ISSN: 1615-9306, Wiley-V C H Verlag GmbH, Weinheim, Germania).
92. Ragno, R.; Artico, M.; De Martino, G.; La Regina, G.; Coluccia, A.; Di Pasquali, A.; Silvestri, R. Docking and 3-D QSAR studies on indolyl aryl sulfones. binding mode exploration at the HIV-1 reverse transcriptase non-nucleoside binding site and design of highly active *N*-(2-hydroxyethyl)carboxamide and *N*-(2-hydroxyethyl)carbohydrazide derivatives. *J. Med. Chem.* **2005**, *48*, 213–223 (doi: [10.1021/jm040854k](https://doi.org/10.1021/jm040854k); Pubmed ID: 15634015; Scopus ID: 2-s2.0-12144279076; ISI Accession Number: WOS:226212900021; 13 gennaio 2005; ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
93. De Martino, G.; La Regina, G.; Coluccia, A.; Edler, M. C.; Barbera, M. C.; Brancale, A.; Wilcox, E.; Hamel, E.; Artico, M.; Silvestri, R. Arylthioindoles, potent inhibitors of tubulin polymerization. *J. Med. Chem.* **2004**, *47*, 6120–6123 (doi: [10.1021/jm049360d](https://doi.org/10.1021/jm049360d); Pubmed ID: 15566282; Scopus ID: 2-s2.0-10044236627; ISI Accession Number: WOS:000225409400003; 2 dicembre 2004; ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
94. Silvestri, R.; Artico, M.; La Regina, G.; Di Pasquali, A.; De Martino, G.; D'Auria, F. D.; Nencioni, L.; Palamara, A. T. Imidazole analogues of fluoxetine, a novel class of anti-*Candida* agents. *J. Med. Chem.* **2004**, *47*, 3924–3926 (doi: [10.1021/jm049856v](https://doi.org/10.1021/jm049856v); Pubmed ID: 15267229; Scopus ID: 2-s2.0-3242778536; ISI Accession Number: WOS:000222856800004; 29 luglio 2004; ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
95. Silvestri, R.; Artico, M.; De Martino, G.; La Regina, G.; Loddo, R.; La Colla, M.; Mura, M.; La Colla, P. Simple, short peptide derivatives of L-737,126 active *in vitro* Against HIV-1 WT and variants carrying NNRTI resistance mutations. *J. Med. Chem.* **2004**, *47*, 3892–3896 (doi: [10.1021/jm031147e](https://doi.org/10.1021/jm031147e); Pubmed ID: 15239667; Scopus ID: 2-s2.0-3142651936; ISI Accession Number: WOS:222530700019; 15 luglio 2004; ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
96. Silvestri, R.; Artico, M.; La Regina, G.; De Martino, G. Synthetic approaches to difluoroindolecarboxylic acid ethyl esters. *Arkivoc* **2004**, *5*, 26–31 (doi: [10.3998/ark.5550190.0005.503](https://doi.org/10.3998/ark.5550190.0005.503); Pubmed ID: non disponibile; Scopus ID: 2-s2.0-



- 2942631454; ISI Accession Number: WOS:222493900003; 27 dicembre 2003; ISSN: 1551-7004, Arkat USA Inc, Gainesville, Stati Uniti).
97. Silvestri, R.; Artico, M.; La Regina, G.; De Martino, G.; La Colla, M.; Loddo, R.; La Colla, P. Anti-HIV-1 activity of pyrrol aryl sulfone (PAS) derivatives: synthesis and SAR studies of novel esters and amides at the position 2 of the pyrrole nucleus. *Farmaco* **2004**, *59*, 201–210 (doi: [10.1016/j.farmac.2003.11.004](https://doi.org/10.1016/j.farmac.2003.11.004); Pubmed ID: 14987983; Scopus ID: 2-s2.0-1342321756; ISI Accession Number: non disponibile; 4 novembre 2004; ISSN: 0014-827X, Elsevier Science S. A., Losanna, Svizzera).
98. Silvestri, R.; De Martino, G.; La Regina, G.; Artico, M.; Massa, S.; Vargiu, L.; Mura, M.; Loi, A. G.; Marceddu, T.; La Colla, P. Novel indolyl aryl sulfones active against HIV-1 carrying NNRTI resistance mutations: synthesis and SAR studies. *J. Med. Chem.* **2003**, *46*, 2482–2493 (doi: [10.1021/jm0211063](https://doi.org/10.1021/jm0211063); Pubmed ID: 12773052; Scopus ID: 2-s2.0-12444315080; ISI Accession Number: WOS:183220400024; 5 giugno 2003; ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
99. Silvestri, R.; La Regina, G.; De Martino, G.; Artico, M.; Befani, O.; Palumbo, M.; Agostinelli, E.; Turini, P. Simple, Potent, and Selective Pyrrole inhibitors of monoamine oxidase types A and B. *J. Med. Chem.* **2003**, *46*, 917–920 (doi: [10.1021/jm0256124](https://doi.org/10.1021/jm0256124); Pubmed ID: 12620068; Scopus ID: 2-s2.0-0037435063; ISI Accession Number: WOS:000181399100004; 13 marzo 2003; ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti).
100. Silvestri, R.; De Martino, G.; Artico, M.; La Regina, G.; Ragno, R.; Loddo, R.; La Colla, P.; Marongiu, M. E.; La Colla, M.; Pani, A. Anti-HIV-1 NNRT agents: acylamino pyrrol aryl sulfones (APASs) as truncated analogues of tricyclic PBTDS. *Med. Chem. Res.* **2002**, *11*, 195–218 (doi: non disponibile; Pubmed ID: non disponibile; Scopus ID: 2-s2.0-0036439429; ISI Accession Number: WOS:178074100001; novembre 2002; ISSN: 1054-2523, Springer Birkhauser, New York, Stati Uniti).

Patents

1. Brancale, A.; Hamel, E.; La Regina, G.; Lavia, P.; Novellino, E.; Silvestri, R. Indole derivatives as tubulin polymerization inhibitors and their preparation and use for the treatment of cancer. [Pat. Ital. IT 1399130 B1 20130405](https://patent.google.com/patent/IT1399130B1), 2013 (5 aprile 2013).
2. Silvestri, R.; La Regina, G.; Hamel, E.; Brancale, A.; Lavia, P.; Novellino, E. Indole derivatives as tubulin polymerization inhibitors and their preparation and use for the treatment of cancer. [PCT Int. Appl. WO 2011121629 A1](https://patent.google.com/patent/WO2011121629A1), 2011 (World Intellectual Property Organization, Ginevra, Svizzera, 1 aprile 2011).
3. Silvestri, R.; Marfe, G.; Abruzzese, E.; Catalano, G.; Di Stefano, C.; Novellino, E.; Sinibaldi Salimei, P.; La Regina, G.; Lavecchia, A. Preparation of pyrrolobenzothiadiazepines and related compounds as anticancer drugs. [PCT Int. Appl. WO 2007015280](https://patent.google.com/patent/WO2007015280), 2007 (World Intellectual Property Organization, Ginevra, Svizzera, 8 febbraio 2007).



❑ Profili Scientifici

Scopus

Author ID: 6602306518

<https://www.scopus.com/authid/detail.uri?authorId=6602306518>

ISI Web of Knowledge

ResearcherID: I-2161-2012

<http://www.researcherid.com/rid/I-2161-2012>

Orcid

Orcid ID: orcid.org/0000-0003-3252-1161

Ricerc@Sapienza

<https://research.uniroma1.it/researcher/ed9b0bb35e6736c3c3259ab8850e5d318c34f94156d2588dd4f71599>

CINECA IRIS Institutional Research Information System

https://iris.uniroma1.it/cris/rp/rp12048?open=all&sort_byall=1&orderall=desc&rppall=20&etalall=-1&startall=0#.WPnWuojyhS8

Linked in

<https://it.linkedin.com/in/giuseppe-la-regina-273a2620>

❑ Indicatori Bibliometrici

Database: Scopus

Data: maggio 2022

Documenti: 98

H-index: 31

Citazioni: 3357

❑ Editore di Riviste Scientifiche

Guest Editor, 2020, Special issue “Development and Application of Marine-Sourced Anti-Cancer and Cancer Pain Control Agents II”, *Marine Drugs*, ISSN: 1660-3397, MDPI AG, Basilea, Svizzera.

Guest Editor, 2019, Special issue “Development and Application of Marine-Sourced Anti-Cancer and Cancer Pain Control Agents”, *Marine Drugs*, ISSN: 1660-3397, MDPI AG, Basilea, Svizzera.

Guest Editor, 2019, Special issue “The Evolving Role of Natural Products in Drug Discovery”, *Pharmaceutical Frontiers*, ISSN: 2296-858X, Hapres Co., Ltd, Londra, Regno Unito.

Guest Editor, 2018-2019, Special issue “Modern HIV-1 non-nucleoside reverse-transcriptase inhibitors”, *Antiviral Chemistry & Chemotherapy*, ISSN: 0956-3202, Int Medical Press LTD, Londra, Regno Unito.



□ **Membro della Direzione Scientifica di Fondazioni Private**

Da aprile 2022: membro della Direzione Scientifica dell'Istituto Pasteur Italia – Fondazione Cenci Bolognetti, Roma, area Scienza del Farmaco.

□ **Membro Editorial Board di Riviste Scientifiche**

Da novembre 2018: membro dell'Early Career Board, ACS Medicinal Chemistry Letters, ISSN: 1948-5875, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti.

□ **Attività di Reviewer**

Programmi di ricerca e prodotti della ricerca
Regione Umbria, POR-FESR 2014-2020 European funding programme
Ministero dell'Istruzione, dell'Università e della Ricerca, Bando PRIN e Bando Futuro in Ricerca
Agenzia Nazionale di Valutazione del Sistema Universitario e della Ricerca, Valutazione della Qualità della Ricerca

Riviste scientifiche
Profilo Publons: <https://publons.com/author/1199412/giuseppe-la-regina#profile>
ACS Chemical Neuroscience, ISSN: 1948-7193, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti.
ACS Medicinal Chemistry Letters, ISSN: 1948-5875, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti.
ACS Omega, ISSN: 2470-1343, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti.
Acta Crystallographica Section D Structural Biology, ISSN: 2059-7983, Int Union Crystallography, Chester, Regno Unito.
Antiviral Chemistry & Chemotherapy, ISSN: 0956-3202, Int Medical Press LTD, Londra, Regno Unito.
Antiviral Research, ISSN: 0166-3542, Elsevier Science BV, Amsterdam, Paesi Bassi.
Arabian Journal of Chemistry, ISSN: 1878-5352, Elsevier Science BV, Amsterdam, Paesi Bassi.
Biomedicine & Pharmacotherapy, ISSN: 4,545, Elsevier France-Editions Scientifiques Medicales Elsevier, Parigi, Francia.
Bioorganic & Medicinal Chemistry, ISSN: 0968-0896, Ergamon-Elsevier Science Ltd, Oxford, Regno Unito.
Bioorganic Chemistry, ISSN: 0045-2068, Academic Press Inc Elsevier Science, San Diego, Stati Uniti.
Cancers, ISSN: 2072-6694, MDPI AG, Basilea, Svizzera.
Chemical Biology & Drug Design, ISSN: 1747-0277, Wiley-Blackwell, Hoboken, Stati Uniti.
ChemMedChem, ISSN: 1860-7179, Wiley-V C H Verlag GmbH, Weinheim, Germania.



Current Topics in Medicinal Chemistry, ISSN: 1568-0266, Bentham Science Publ Ltd, Sharjah, Emirati Arabi.

European Journal of Medicinal Chemistry, ISSN: 0223-5234, Elsevier France-Editions Scientifiques Medicales Elsevier, Parigi, Francia.

Expert Opinion on Drug Discovery, ISSN: 1746-0441, Taylor & Francis Ltd, Oxon, Regno Unito.

Expert Opinion on Investigational Drugs, ISSN: 1354-3784, Taylor & Francis Ltd, Oxon, Regno Unito.

Expert Opinion on Pharmacotherapy, ISSN: 1465-6566, Taylor & Francis Ltd, Oxon, Regno Unito.

Expert Opinion on Therapeutic Patents, ISSN: 1354-3776, Taylor & Francis Ltd, Oxon, Regno Unito.

Food Reviews International, ISSN: 8755-9129, Taylor & Francis Ltd, Oxon, Regno Unito.

Future Medicinal Chemistry, ISSN: 1756-8919, Future Sci LTD, Londra, Regno Unito.

Gene Reports, ISSN: 2452-0144, Elsevier Science BV, Amsterdam, Paesi Bassi.

International Journal of Molecular Science, MDPI AG, Basilea, Svizzera.

Journal of Asian Natural Products Research, ISSN: 1028-6020, Taylor & Francis Ltd, Oxon, Regno Unito.

Journal of Chemical Information and Modeling, ISSN: 1549-9596, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti.

Journal of Chemistry, ISSN: 2090-9063, Hindawi Publishing Corporation, New York, Stati Uniti.

Journal of Enzyme Inhibition and Medicinal Chemistry, Taylor & Francis Ltd, Oxon, Regno Unito.

Journal of Medicinal Chemistry, ISSN: 0022-2623, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti.

Journal of Organic Chemistry, ISSN: 0022-3263, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti.

Letters in Organic Chemistry, ISSN: 1570-1786, Bentham Science Publ Ltd, Sharjah, Emirati Arabi.

Marine Drugs, ISSN: 1660-3397, MDPI AG, Basilea, Svizzera.

MedChemComm, ISSN: 2040-2503, Royal Soc Chemistry, Cambridge, Regno Unito.

Medicinal Chemistry, ISSN: 1573-4064, Bentham Science Publ Ltd, Sharjah, Emirati Arabi.

Medicinal Chemistry Review, ISSN: 0198-6325, Wiley, Hoboken, USA.

Molecular Cancer Therapeutics, ISSN: 1535-7163, Amer Assoc Cancer Research, Filadelfia, Stati Uniti.

Molecular Diversity, ISSN: 1381-1991, Springer, Dordrecht, Paesi Bassi.

Molecular Omics, ISSN: 2515-4184, Royal Soc Chemistry, Cambridge, Regno Unito.

Molecules, ISSN: 1420-3049, MDPI AG, Basilea, Svizzera.

Oncotarget, ISSN: 1949-2553, Impact Journals LLC, New York, Stati Uniti.

Organic Letters, ISSN: 1523-7060, American Chemical Society, Washington, Stati Uniti.

Pharmaceuticals, ISSN: 1424-8247, MDPI AG, Basilea, Svizzera.



Research on Chemical Intermediates, ISSN: 0922-6168, Springer, Dordrecht, Paesi Bassi.

Scientia Pharmaceutica, ISSN: 2218-0532, MDPI AG, Basilea, Svizzera.

Scientific Reports, ISSN: 2045-2322, Nature Publishing Group, Londra, Regno Unito.

□ Congresses, Meetings and Workshops

Comunicazioni orali

1. Michela Puxeddu, Jessica Sebastiani, Antonio Coluccia, Marianna Bufano, Ernest Hamel, Te Liu, Romano Silvestri, Giuseppe La Regina. New pyrroles derivatives as anti-glioblastoma and anti-chronic myeloid leukemia agents. *XXVII Congresso Nazionale della Società Chimica Italiana*, FAR OR004, 14-23 settembre 2021, online meeting.
2. Giuseppe La Regina, Antonio Coluccia, Valentina Naccarato, Addolorata Maria Luce Coluccia, Ernest Hamel, Ettore Novellino, Romano Silvestri. Treating chronic myeloid leukemia by inhibition of tubulin polymerization. *Italian-Spanish-Portuguese Joint Meeting in Medicinal Chemistry*, SC11, 17-20 luglio 2018, Palermo (PA).
3. La Regina, G. DOACs: aspetti chimico-farmaceutici e tossicologici. *Anticoagulazione senza rischi*, 25 maggio 2018, Forte dei Marmi (LU).
4. La Regina, G. New inhibitors of tubulin polymerization inspired by nature. *Pharma/Natural Products: Tecniche analitiche e nuove tendenze nel mondo dei prodotti naturali*, 19 aprile 2018, Napoli (NA).
5. La Regina, G. Violaceina: un pigmento prodotto dal batterio *Janthinobacterium lividum* ad attività antitumorale. *Natural Products: tecniche analitiche e nuove tendenze nel mondo dei prodotti naturali*, 14 febbraio 2017, Roma (RM).
6. La Regina, G.; Coluccia, A.; Hamel, E.; Novellino, E.; Silvestri, R. New indole tubulin assembly inhibitors with stable arrest of mitotic progression, enhanced stimulation of natural killer cell cytotoxic activity and repression of Hedgehog-dependent cancer. *Spanish-Italian Medicinal Chemistry Congress*, OC 01, 12-15 luglio 2015, Barcellona, Spagna.
7. La Regina G.; Coluccia, A.; Passacantilli, S.; Famigliini, V.; Pelliccia, S.; Hamel, E.; Novellino, E.; Silvestri, R. 3-Aroyl-1-arylpyrroles as new anticancer agents. *XXV Congresso Nazionale della Società Chimica Italiana*, FAR-O26, 7-12 settembre, 2014, Arcavacata di Rende (CS).
8. La Regina, G.; Coluccia, A.; Passacantilli, S.; Famigliini, V.; Pelliccia, S.; Hamel, E.; Novellino, E.; Silvestri, R. 3-Aroyl-1-arylpyrroles: a new class of potent inhibitors of tubulin polymerization. *Fifth European Workshop in Drug Synthesis*, 18-23 maggio 2014, Siena (SI).
9. La Regina, G. 2-Heterocyclyl-3-arylthio-1H-indoles as potent tubulin polymerization inhibitors with improved metabolic stability. *XXI National Meeting on Medicinal Chemistry*, 17-20 luglio 2012, Palermo (PA).
10. La Regina, G. Synthesis of new indole derivatives as potent inhibitors of tubulin polymerization. *Fourth European Workshop in Drug Synthesis*, 27-31 maggio 2012, Siena (SI).



11. La Regina, G.; Piscitelli, F.; Silvestri, R. Indolilarilsolfoni, potenti e selettivi agenti anti-HIV. 7° *Sigma Aldrich Young Chemists Symposium* (S.A.Y.C.S.), O11, 22-24 ottobre 2007, Riccione (RN).
12. La Regina, G. Farindustria 2007 Award. XVIII *Convegno Nazionale della Divisione di Chimica Farmaceutica della Società Chimica Italiana*, 16-20 settembre 2007, Chieti (CH).
13. La Regina, G. Arylthioindoles, potent inhibitors of tubulin polymerization: synthesis and molecular modeling studies. *Nuove Prospettive in Chimica Farmaceutica. 1° Meeting*. 22-23 febbraio 2007, Fisciano (SA).
14. La Regina, G.; Brancale, A.; Silvestri R. Ariltioindoli, potenti inibitori della polimerizzazione della tubulina. 6° *Sigma Aldrich Young Chemists Symposium* (S.A.Y.C.S.), O13, 9-11 ottobre 2006, Riccione (RN).
15. La Regina, G. Nuovi potenti inibitori delle monoamino ossidasi a struttura pirrolica ed indolica. 4° *Sigma Aldrich Young Chemists Symposium* (S.A.Y.C.S.), O9, 17-19 maggio 2004, Riccione (RN).

Organizzazione

1. *Chlorophyll Program – Programma di collaborazione fra Patheon Italia Spa e Sapienza Università di Roma*, 21 marzo 2019, Roma (RM); presidente del comitato scientifico ed organizzatore.
2. *Merck Chemistry Lecture, The Need for Late-Stage Functionalizations, and their Application*, 12 ottobre 2018, Roma (RM); presidente del comitato organizzatore.
3. Secondo Workshop sulla Ricerca, 12 luglio 2018, Roma (RM); membro del comitato scientifico ed organizzatore.
4. *Chimicapisce*, 8 giugno 2018, Roma (RM); membro del comitato organizzatore.
5. *Young Research Ideas in Chemistry*, 7 giugno 2018, Roma (RM); membro del comitato organizzatore.
6. *Automated workflow solution*, 22 febbraio 2018, Roma (RM); president del comitato organizzatore.
7. Carlo Erba Reagents Day, 12 dicembre 2017, Roma (RM); presidente del comitato organizzatore.
8. *Natural Products: tecniche analitiche e nuove tendenze nel mondo dei prodotti naturali*, 14 febbraio 2017, Roma (RM); presidente del comitato scientifico ed organizzatore.
9. *Chlorophyll Program – Programma di collaborazione fra Patheon Italia Spa e Sapienza Università di Roma*, 7 novembre 2016, Roma (RM); presidente del comitato organizzatore.
10. *Young Research Ideas in Chemistry*, 10 giugno 2016, Roma (RM); membro del comitato organizzatore.
11. *Evaporazione dinamica: semplificazione, ottimizzazione e completa automazione del processo*, 1 ottobre 2015, Roma (RM); presidente del comitato organizzatore.
12. *Nuovi orientamenti nel supporto alla ricerca in ambito chimico-farmaceutico*, 29 settembre 2015, Roma (RM); presidente del comitato organizzatore.
13. *Workshop sulla Ricerca*, 21 settembre 2015, Roma (RM); membro del comitato organizzatore.



14. *Young Research Ideas in Chemistry*, 15 dicembre 2014, Roma (RM); membro del comitato organizzatore.
15. *Kjeldahl, Dumas o NIR: Soluzioni per la determinazione dell'azoto e delle proteine a confronto*, 17 giugno 2014, Roma (RM); presidente del comitato organizzatore.
16. *Il Contract Manufacturing in ambito farmaceutico... Una risposta alla necessità di qualità, professionalità ed efficienza*, 3-4 marzo 2014, Roma (RM); presidente del comitato organizzatore.
17. *XXII National Meeting on Medicinal Chemistry*, 10-13 settembre 2013, Roma (RM); membro del comitato scientifico e presidente della segreteria organizzativa.
18. *ESADA Scientific, Exploring Collaborative Opportunities*, 8 novembre 2012, Roma (RM); presidente del comitato organizzatore.

Comunicazioni poster

1. Puxeddu, M.; Coluccia, A.; La Regina, G.; Gianni, S.; Silvestri, R. A new potential target in oncological therapy: the interaction between Gab2 with SH3-domain of Gbr2. *XXVII Congresso Nazionale della Società Chimica Italiana*, FAR PO060, 14-23 settembre 2021, online meeting.
2. Sebastiani, J.; Coluccia, A.; La Regina, G.; Canettieri, G.; Silvestri, R. Novel sulfonamide inhibitors of β -catenin signaling as anticancer agents. *XXVII Congresso Nazionale della Società Chimica Italiana*, FAR PO056, 14-23 settembre 2021, online meeting.
3. Sebastiani, J.; Coluccia, A.; La Regina, G.; Gianni, S.; Silvestri, R. A New potential target in oncological therapy: the interaction between Gab2 with SH3-domain of GBR2. *13th Young Medicinal Chemist Symposium (Nuove Prospettive in Chimica Farmaceutica, NPCF13)*, Abstract Book, 26-29 aprile 2021, online meeting.
4. Michela Puxeddu, Giuseppe La Regina, Antonio Coluccia, Romano Silvestri. New 1,1'-biphenyl-4-sulfonamides as potent and selective human carbonic anhydrase inhibitors. *WG2 Meeting and International Online Symposium on "Synthesis and nanodelivery strategies for new therapeutic tools against Multidrug Resistant Tumours"*, Abstract Book, 15 dicembre 2020, online meeting.
5. Michela Puxeddu, Antonio Coluccia, Marianna Nalli, Ernest Hamel, Giuseppe La Regina, Romano Silvestri. Novel 3-aryl-1,4-diarylpyrroles against solid tumors and hematological malignancies. *Italian Young Medicinal Chemistry Virtual Meeting (I-YMC-VMEET)*, Abstract Book, 22-24 luglio 2020, online meeting.
6. La Regina, G.; Naccarato, V.; Masci, D.; Puxeddu, M.; Nalli, M.; Coluccia, A.; Negri, R.; Silvestri, R. Small molecule inhibitors of kdm5 histone demethylases increase the radiosensitivity of breast cancer cells overexpressing JARID1B. *XXVI National Meeting in Medicinal Chemistry - XII Young Medicinal Chemists' Symposium*, Abstract Book, 16-19 luglio, 2019, Milano (MI).
7. La Regina, G.; Naccarato, V.; Masci, D.; Puxeddu, M.; Bufano, M.; Nalli, M.; Coluccia, A.; Orlando, V.; Canettieri, G.; Gianni, S.; Silvestri, R. Design, synthesis and biological evaluation of PDZ1 targeting NHERF1 inhibitors as anticancer agents. *XXVI National Meeting in Medicinal Chemistry - XII Young Medicinal Chemists' Symposium*, Abstract Book, 16-19 luglio, 2019, Milano (MI).
8. Giuseppe La Regina, Valentina Naccarato, Michela Puxeddu, Marianna Bufano, Marianna Nalli, Antonio Coluccia, Romano Silvestri. First in class PDZ1 targeting



- NHERF1 inhibitors as anticancer agents. *12th European Workshop in Drug Design*, Book of Abstract, 19-24 maggio 2019, Siena (SI).
9. Jana Van Dycke, Valentina Naccarato, Giuseppe La Regina, Eloise Mastrangelo, Delia Tarantino, Johan Neyts, Romano Silvestri, Joana Rocha-Pereira. Inhibition of human Norovirus replication by a novel class of indolylarylsulfones *in vitro* and in zebrafish larvae. *32nd International Conference on Antiviral Research*, Program and Abstracts, 12-15 maggio, 2019, Baltimora, Stati Uniti.
 10. La Regina G, Coluccia A, Naccarato V, Silvestri R. New anti-cancer agents through an interaction with tubulin. *New Diagnostic and Therapeutic Tools against Multidrug-Resistant Tumours - First Working-Group Meeting*, Abstract Book, 30-31 gennaio 2019, Torino (TO).
 11. Filipović NR, Todorović TR, Bjelogrić S, Silvestri R, La Regina G, Pelliccia S, Padron JM, Schembri-Wismayer P, Donard M, Gulea M, Muler CD. Nitrogen donor ligands and their coordination compounds as a tool for treatment of multi drug resistant tumors. *New Diagnostic and Therapeutic Tools against Multidrug-Resistant Tumours - First Working-Group Meeting*, Abstract Book, 30-31 gennaio 2019, Torino (TO).
 12. Masci, Domiziana, La Regina, Giuseppe, Coluccia, Antonio Silvestri, Romano. Indolylarylsulfones with potent anti-HIV-1 activity. *31st International Conference on Antiviral Research*, 171, Program and Abstracts, 11 giugno 2018, Porto, Portogallo.
 13. La Regina G., Naccarato V., Coluccia A., Hamel E., Silvestri R. New 6- and 7-heterocyclyl-1*H*-indole derivatives as potent tubulin assembly and cancer cell growth inhibitors. *Seventh European Workshop in Drug Synthesis*, 20-24 maggio 2018, Siena (SI).
 14. Famigliani, Valeria; La Regina, Giuseppe; Coluccia, Antonio; Lee, Jin-Ching; Silvestri, Romano. New inhibitors of *Dengue* and *Zika* virus protease. *XXVI Congresso Nazionale della Società Chimica Italiana*, Programma del XXVI Congresso Nazionale della Società Chimica Italiana, FAR PO06, 10-14 settembre 2017, Paestum (SA).
 15. Domiziana Masci, Giuseppe La Regina, Valeria Famigliani, Antonio Coluccia, Andrea Brancale, José A. Esté, Romano Silvestri. Drug design and synthesis of new indolylarylsulfones as HIV-1 non-nucleoside reverse transcriptase inhibitors. *XXVI Congresso Nazionale della Società Chimica Italiana*, Programma del XXVI Congresso Nazionale della Società Chimica Italiana, FAR PO12, 10-14 settembre 2017, Paestum (SA).
 16. Valentina Naccarato, Giuseppe La Regina, Antonio Coluccia, Addolorata Maria Luce Coluccia, Ernest Hamel, Romano Silvestri. New pyrrole inhibitors of chronic myeloid leukemia cell growth. *XXVI Congresso Nazionale della Società Chimica Italiana*, Programma del XXVI Congresso Nazionale della Società Chimica Italiana, FAR PO40, 10-14 settembre 2017, Paestum (SA).
 17. Giuseppe La Regina, Valentina Naccarato, Antonio Coluccia, Addolorata Maria Luce Coluccia, Ernest Hamel, Romano Silvestri. 3-Aroyl-1,4-diarylpyrroles inhibit chronic myeloid leukemia cell growth through an interaction with tubulin. *10th Joint Meeting on Medicinal Chemistry*, Book of Abstracts, P77, 25-28 giugno 2017, Dubrovnik, Croazia.



18. Giuseppe La Regina, Valeria Famiglioni, Domiziana Masci, Antonio Coluccia, Jin-Ching Lee, John Hiscott, Romano Silvestri. Inhibition of *Dengue* virus by novel inhibitors of RNA-dependent RNA polymerase and protease activities. *10th Joint Meeting on Medicinal Chemistry*, Book of Abstracts, P78, 25-28 giugno 2017, Dubrovnik, Croazia.
19. Sara Passacantilli, Valeria Famiglioni, Giuseppe La Regina, Antonio Coluccia, Domiziana Masci, José A. Esté, Giovanni Maga, Romano Silvestri. Drug design and synthesis of new indolylarylsulfones as HIV-1 non-nucleoside reverse transcriptase inhibitors. *10th Joint Meeting on Medicinal Chemistry*, Book of Abstracts, P115, 25-28 giugno 2017, Dubrovnik, Croazia.
20. Giuseppe La Regina, Valeria Famiglioni, Valentina Naccarato, Antonio Coluccia, John Hiscott, Jin-Ching Lee. Inhibition of *Dengue* virus by novel inhibitors of RNA-dependent RNA polymerase and protease activity. *30th International Conference on Antiviral Research*, Program and Abstracts, 21-25 maggio 2017, Atlanta, Stati Uniti.
21. Valeria Famiglioni, Giuseppe La Regina, Antonio Coluccia, Domiziana Masci, Roger Badia, José A. Esté, Emmanuele Crespan, Giovanni Maga. Drug design and synthesis of new indolylarylsulfones as HIV-1 non-nucleoside reverse transcriptase inhibitors. *30th International Conference on Antiviral Research*, Program and Abstracts, 21-25 maggio 2017, Atlanta, Stati Uniti.
22. Famiglioni, V.; Pelliccia, S.; La Regina, G.; Coluccia, A.; Lee, J. C.; Silvestri, R. New inhibitors of *Dengue* virus replication. *XXIV National Meeting on Medicinal Chemistry - Nuove Prospettive in Chimica Farmaceutica 10° Meeting*, Abstract eBook, PC66, 11-14 settembre 2016, Perugia (PG).
23. La Regina, G.; Coluccia, A.; Famiglioni, V.; Passacantilli, S.; Mazzoccoli, C.; Takikawa, O.; Silvestri, R. New Inhibitors of indoleamine 2,3-dioxygenase 1: molecular modelling studies, synthesis and biological evaluation. *XXIV National Meeting on Medicinal Chemistry - Nuove Prospettive in Chimica Farmaceutica 10° Meeting*, Abstract eBook, PC100, 11-14 settembre 2016, Perugia (PG).
24. Famiglioni, V.; La Regina, G.; Coluccia, A.; Brancale, B.; Esté, J. A.; Silvestri, R. Drug design, synthesis and biological evaluation of new antiretroviral agents. *Workshop sulla Ricerca*, Abstract Book, P-19, 21 settembre 2015, Roma (RM).
25. La Regina, G.; Famiglioni, V.; Pelliccia, S.; Passacantilli, S.; Creta, M.; Silvestri, R. Microwave-assisted synthesis of arylthioindoles and aroylindoles as potent inhibitors of tubulin polymerization. *Workshop sulla Ricerca*, Abstract Book, P-20, 21 settembre 2015, Roma (RM).
26. Passacantilli, S.; La Regina, G.; Coluccia, A.; Creta, M.; Hamel, E.; Novellino, E.; Silvestri, R. Design and synthesis of new potent tubulin polymerization inhibitors. *Workshop sulla Ricerca*, Abstract Book, P-21, 21 settembre 2015, Roma (RM).
27. Pelliccia, S.; La Regina, G.; Manvar, D.; Kaushik- Basu, N.; Neyts, J.; Silvestri, R. New inhibitors of hepatitis C virus targeting cyclooxygenase-2. *Workshop sulla Ricerca*, Abstract Book, P-22, 21 settembre 2015, Roma (RM).
28. Famiglioni, V.; La Regina, G.; Coluccia, A.; Brancale, A.; Esté, J. A.; Silvestri, R. Drug design and synthesis of new indolylarylsulfones as HIV-1 non-nucleoside reverse transcriptase inhibitors. *XXIII National Meeting on Medicinal Chemistry -*



- Nuove Prospettive in Chimica Farmaceutica 9° Meeting*, Abstract eBook, PC137, 223, 6-9 settembre 2015, Fisciano (SA).
29. Pelliccia, S.; La Regina, G.; Manvar, D.; Kaushik-Basu, N.; Neyts, J.; Silvestri, R. New Pyrazolecarboxamides as Anti-HCV Agents via Targeting Cyclooxygenase-2. *XXIII National Meeting on Medicinal Chemistry - Nuove Prospettive in Chimica Farmaceutica 9° Meeting*, Abstract eBook, PC142, 228, 6-9 settembre 2015, Fisciano (SA).
30. Passacantilli, S.; La Regina, G.; Coluccia, A.; Creta, M.; Hamel, E.; Novellino, E.; Silvestri, R. Synthesis of new indoles with potent tubulin polymerization inhibiting activity including Hedgehog-dependent cancer and enhanced stimulation of NK cell cytotoxic activity. *XXIII National Meeting on Medicinal Chemistry - Nuove Prospettive in Chimica Farmaceutica 9° Meeting*, Abstract eBook, PC145, 6-9 settembre 2015, Fisciano (SA).
31. Coluccia, A.; La Regina, G.; Okuno, A.; Takikawa, O.; Silvestri, R. New modulator of the tumoural immune escape via indoleamin 2,3-dioxygenase (IDO) inhibition. *XXV Congresso Nazionale della Società Chimica Italiana*, Atti del Congresso, FAR-P21, 7-12 settembre 2014, Arcavacata di Rende (CS).
32. Famiglioni, V.; La Regina, G.; Coluccia, A.; Brancale, A.; Novellino, E.; Silvestri, R. New indolylarylsulfones as potent and broad spectrum HIV-1 non-nucleoside reverse transcriptase inhibitors. *Nuove Prospettive in Chimica Farmaceutica - VIII Edizione del Meeting*, Book degli Abstracts, P-14, 9-11 giugno 2014, Parma (PR).
33. Passacantilli, S.; Pelliccia, S.; La Regina, G.; Famiglioni, V.; Punzi, P.; Silvestri, R. Selective synthesis of 2,9-dihydro-1H-Pyrido[3,4-b]indol-1-ones. *Nuove Prospettive in Chimica Farmaceutica - VIII Edizione del Meeting*, Book degli Abstracts, P-32, 9-11 giugno 2014, Parma (PR).
34. Pelliccia, S.; La Regina, G.; Manvar, D.; Kaushik-Basu, N.; Neyts, J.; Silvestri, R. New 1-phenyl-5-(1H-pyrrol-1-yl)-1H-pyrazole-3-carboxamides inhibit hepatitis C virus replication and suppress the expression of cyclooxygenase-2. *Nuove Prospettive in Chimica Farmaceutica - VIII Edizione del Meeting*, Book degli Abstracts, P-34, 9-11 giugno 2014, Parma (PR).
35. Famiglioni, V.; La Regina, G.; Coluccia, A.; Brancale, A.; Esté, J. A.; Silvestri, R. New indolylarylsulfones as potent and broad spectrum HIV-1 non-nucleoside reverse transcriptase inhibitors. *27th International Conference on Antiviral Research*, Program and Abstracts, 42, 12-16 maggio 2014, Raleigh, Stati Uniti.
36. Pelliccia, S.; Manvar, D.; La Regina, G.; Neyts, J.; Kaushik-Basu, N.; Silvestri, R. New 1-phenyl-5-(1H-pyrrol-1-yl)-1H-pyrazole-3-carboxamides inhibit hepatitis C virus replication and suppress the expression of cyclooxygenase-2. *27th International Conference on Antiviral Research*, Program and Abstracts, 66, 12-16 maggio 2014, Raleigh, Stati Uniti.
37. La Regina, G.; Coluccia, A.; Passacantilli, S.; Famiglioni, V.; Pelliccia, S.; Hamel, E.; Novellino, E.; Silvestri, R. 3-Aroyl-1-arylpyrroles: a new class of potent inhibitors of tubulin polymerization. *Fifth European Workshop in Drug Synthesis*, 18-23 maggio 2014, Siena (SI).
38. Pelliccia, S.; La Regina, G.; Coluccia, A.; Famiglioni, V.; Nalli, M.; Brancale, A.; Hamel, E.; Novellino, E.; Silvestri, R. Highly potent cancer agents by modulating the C-2 group of the arylthioindole class of tubulin polymerization inhibitors. *XXII*



- National Meeting on Medicinal Chemistry*, Abstract Book, P.OE.31, 10-13 settembre 2013, Roma (RM).
39. Pelliccia, S.; La Regina, G.; Famiglioni, V.; Punzi, P.; Silvestri, R. A new, simple and high yielding synthesis of 2,9-dihydro-1*H*-pyrido[3,4-*b*]indol-1-ones. *XXII National Meeting on Medicinal Chemistry*, Abstract Book, P.OE.32, 10-13 settembre 2013, Roma (RM).
40. Famiglioni, V.; La Regina, G.; Coluccia, A.; Brancale, A.; Novellino, E.; Silvestri, R. New indolylarylsulfones as potent and broad spectrum HIV-1 non-nucleoside reverse transcriptase inhibitors. *XXII National Meeting on Medicinal Chemistry*, Abstract Book, P.ID.04, 10-13 settembre 2013, Roma (RM).
41. Coluccia, A.; La Regina, G.; Brancale, A.; Silvestri, R. Computational studies of colchicine site compounds. *XXII National Meeting on Medicinal Chemistry*, Abstract Book, P.CS.01, 10-13 settembre 2013, Roma (RM).
42. Famiglioni, V.; Bordoni, C.; La Pietra, V.; La Regina, G.; Coluccia, A.; Pelliccia, S.; Plotkin, B.; Eldar-Finkelman, H.; Brancale, A.; Marinelli, L.; Novellino, E.; Silvestri, R. Drug design and synthesis of GSK-3 β inhibitors. *XXII National Meeting on Medicinal Chemistry*, P.CD.08, Abstract Book, 10-13 settembre 2013, Roma (RM).
43. Pelliccia, S.; La Regina, G.; Coluccia, A.; Famiglioni, V.; Reggio, A.; Brancale, A.; Hamel, E.; Novellino, E.; Silvestri, R. Highly potent cancer agents by modulating the C-2 group of the arylthioindole class of tubulin polymerization inhibitors. *Nuove Prospettive in Chimica Farmaceutica 7*, Abstract Book, P1.20, 29-1 maggio 2013, Savigliano (CN).
44. Famiglioni, V.; La Regina, G.; Coluccia, A.; Brancale, A.; Novellino, E.; Silvestri, R. New indolylarylsulfones as potent and broad spectrum HIV-1 non-nucleoside reverse transcriptase inhibitors. *12° Sigma Aldrich Young Chemists Symposium (S.A.Y.C.S.)*, P12, 1-3 ottobre 2012, Riccione (RN).
45. Pelliccia, S.; La Regina, G.; Coluccia, A.; Brancale, A.; Novellino, E.; Silvestri, R. New 2-heterocyclil-3-arylthio-1*H*-indoles as potent tubulin polymerization and cell growth inhibitors. *12° Sigma Aldrich Young Chemists Symposium (S.A.Y.C.S.)*, P27, 1-3 ottobre 2012, Riccione (RN).
46. Famiglioni, V.; La Regina, G.; Novellino, E.; Silvestri, R. First venting while heating microwave-assisted synthesis of 3-arylthioindoles as potent inhibitors of tubulin polymerization. *Meeting Nuove Prospettive in Chimica Farmaceutica 6*, P1.7, 15-17 aprile 2012, Riccione (RN).
47. Coluccia, A.; La Regina, G.; Piscitelli, F.; Novellino, E.; Silvestri, R. Computer aided drug design approach in the development of PKnB inhibitors as potential antimycobacterial agents. *Meeting Nuove Prospettive in Chimica Farmaceutica 6*, P6.3, 15-17 aprile 2012, Riccione (RN).
48. Coluccia, A.; La Regina, G.; Gatti, V.; Piscitelli, F.; Famiglioni, V.; Brancale, A.; Maga, G.; Balzarini, J.; Novellino, E.; Silvestri, R. Indolylarylsulfones as HIV-1 non-nucleoside reverse transcriptase inhibitors. New cyclic substituents at the indole-2-carboxamide. *XXIV Congresso Nazionale della Società Chimica Italiana, Atti del Congresso*, FAR-PO-20, 11-16 settembre 2011, Lecce (LE).
49. Piscitelli, F.; Ligresti, A.; La Regina, G.; Gatti, V.; Brizzi, A.; Pasquini, S.; Allarà, M.; Carai, M. A. M.; Novellino, E.; Colombo, G.; Di Marzo, V.; Corelli, F.; Silvestri,



- R. 1-Aryl-5-(1*H*-pyrrol-1-yl)-1*H*-pyrazole-3-carboxamide: an effective scaffold for the design of either CB₁ or CB₂ receptor ligands. *XXIV Congresso Nazionale della Società Chimica Italiana*, Atti del Congresso, FAR-PO-63, 11-16 settembre 2011, Lecce (LE).
50. La Regina, G.; Coluccia, A.; Brancale, A.; Maga, G.; Balzarini, J.; Novellino, E.; Silvestri, R. Indolylarylsulfones as HIV-1 non-nucleoside reverse transcriptase inhibitors. New cyclic substituents at the indole-2-carboxamide. *The 24th International Meeting on Antiviral Research*, 165, 7-11 maggio 2011, Sofia, Bulgaria.
51. Gatti, V.; La Regina, G.; Coluccia, A.; Piscitelli, F.; Giordano, C.; Brancale, A.; Balzarini, J.; Maga, G.; Novellino, E.; Silvestri, R. Indolylarylsulfones bearing natural and unnatural amino acids as inhibitors of HIV-1 reverse transcriptase and Coxsackie B4 virus. *Antiviral Congress*, 1,44, 7-9 novembre 2010, Amsterdam, Paesi Bassi.
52. Palermo, V.; Silvestri, R.; La Regina, G.; Falcone, C.; Mazzoni, C. *S. cerevisiae* as a model for the study of new therapeutic molecules. *14th International Biotechnology Symposium and Exhibition*, J. Biotechnol. 2010, 150(S), 412, P. I.190, 14-18 settembre 2010, Rimini (RN).
53. La Regina, G.; Piscitelli, F.; Gatti, V.; Colombo, G.; Di Marzo, V.; Corelli, F.; Lavecchia, A.; Novellino, E.; Silvestri, R. New *N*-Alkyl 1-Aryl-5-(1*H*-pyrrol-1-yl)-1*H*-pyrazole-3-carboxamides as potent cannabinoid receptor ligands. *XX National Meetings on Medicinal Chemistry*, Book of Abstracts, P14, 12-16 settembre 2010, Abano Terme – Padova (PD).
54. Gatti, V.; La Regina, G.; Piscitelli, F.; Colombo, G.; Di Marzo, V.; Corelli, F.; Novellino, E.; La Vecchia, A.; Silvestri, R. Synthesis, *in vivo* pharmacological evaluation and pharmacokinetic studies of *N*-alkyl 1-aryl-5-(1*H*-pyrrol-1-yl)-1*H*-pyrazole-3-carboxamide cannabinoid receptor ligands. *Nuove Prospettive in Chimica Farmaceutica, IV Meeting – Workshop*, 22, 6-7 maggio 2010, Santa Margherita di Pula (CA).
55. Giansanti, V.; Camboni, T.; Tillhon, M.; Parks, M.; Prosperi, E.; Santin, G.; Piscitelli, F.; La Regina, G.; Silvestri, R.; Scovassi A. I. Pirazolocarbosiamidi e morte cellulare: una nuova arma per la chemioterapia. *La morte della cellula: implicazioni fisio-patologiche e terapeutiche*, P7, 2-4 dicembre 2009, Firenze (FI).
56. De Bruyne, S.; Wyffels, L.; Moerman, K.; La Regina, G.; Silvestri, R.; De Vos, F. Radiosynthesis and *in vivo* evaluation of [¹¹C]-(*R*)-*N*-(1-cyclohexylethyl)-*N*-methyl-1*H*-pyrrole-2-carboxamide. *18th International Symposium on Radiopharmaceutical Sciences*, Abstracts of Presentations, P228, 12-17 luglio 2009, Edmonton, Canada.
57. Coluccia, A.; La Regina, G.; Giordano, C.; Sansone, A.; Brancale, A.; Neyts, J.; Leyssen, P.; Novellino, E.; Silvestri, R. Drug design of new NS3/4A HCV serine protease inhibitors. structure-based and ligand-based approaches. *XXIII Congresso Nazionale della Società Chimica Italiana*, Atti del Congresso, FAR-PO-22, 5-10 luglio 2009, Sorrento (NA).
58. Gatti, V.; La Regina, G.; Coluccia, A.; Brancale, A.; Hamel, E.; Scovassi, A.; Maresca, B.; Campiglia, P.; Novellino, E.; Silvestri, R. Arylthioindole bioisosteres as potent tubulin polymerization and MCF-7 cell growth inhibitors. *XXIII*



- Congresso Nazionale della Società Chimica Italiana, Atti del Congresso, FAR-PO-44, 5-10 luglio 2009, Sorrento (NA).*
59. Kieres, K.; Sala, M.; Campiglia, P.; Musella, S.; Giustiniano, M.; Nuti, E.; La Regina, G.; Silvestri, R.; Gomez-Monterrey, I.; Novellino, E.; Rossello, A. Design and synthesis of novel metalloproteinases inhibitors. *XXIII Congresso Nazionale della Società Chimica Italiana, Atti del Congresso, FAR-PO-54, 5-10 luglio 2009, Sorrento (NA).*
60. La Regina, G.; Piscitelli, F.; Ligresti, A.; Brizzi, A.; Pasquini, S.; Colombo, G.; Lavecchia, A.; Corelli, F.; Di Marzo, V.; Novellino, E.; Silvestri, R. New substituted 1-aryl-5-(1*H*-pyrrol-1-yl)-1*H*-pyrazole-3-carboxamides as high affinity hCB₁ ligands. *XXIII Congresso Nazionale della Società Chimica Italiana, Atti del Congresso, FAR-PO-56, 5-10 luglio 2009, Sorrento (NA).*
61. Piscitelli, F.; La Regina, G.; Gatti, V.; Coluccia, A.; Brancale, A.; Giordano, C.; Balzarini, J.; Maga, G.; Lavecchia, A.; Novellino, E.; Silvestri, R. Indolylarylsulfones bearing natural and unnatural amino acids as potent HIV-1 NNRTIs. *XXIII Congresso Nazionale della Società Chimica Italiana, Atti del Congresso, FAR-PO-101, 5-10 luglio 2009, Sorrento (NA).*
62. La Regina, G.; Coluccia, A.; Gatti, V.; Saletti, R.; Brancale, A.; Novellino, E.; Silvestri, R. Molecular modeling studies of arylthioindoles and related bioisosteres, potent inhibitors of tubulin polymerization. *VI European Workshop in Drug Design, 24-30 maggio 2009, Siena (SI).*
63. Piscitelli, F.; Coluccia, A.; Brancale, A.; La Regina, G.; Sansone, A.; Giordano, C.; Balzarini, J.; Maga, G.; Zanolì, S.; Samuele, A.; Cirilli, R.; La Torre, F.; Lavecchia, A.; Novellino, E.; Silvestri, R. Indolylarylsulfones bearing natural and unnatural amino acids are potent HIV-1 reverse transcriptase and Coxsackie B4 virus non-nucleoside inhibitors. *The 22nd International Meeting on Antiviral Research, Abstracts, LB14, 3-7 maggio 2009, Miami Beach, Stati Uniti.*
64. Coluccia, A.; Brancale, A.; La Regina, G.; Lavecchia, A.; Silvestri, R. Molecular modeling applications studies on the indolyl aryl sulphones (IASS) as HIV-1 non-nucleotidic reverse transcriptase inhibitors. *Nuove Prospettive in Chimica Farmaceutica, III Meeting – Workshop, A2.P3, 13-14 febbraio 2009, Castelvecchio Pascoli (LU).*
65. Gatti, G.; La Regina, G.; Silvestri, R. Arylthioindoles as tubulin polymerization and MCF-7 cell growth inhibitors. New bioisosteres at the sulfur bridging group. *Nuove Prospettive in Chimica Farmaceutica, III Meeting – Workshop, B1.P9, 13-14 febbraio 2009, Castelvecchio Pascoli (LU).*
66. La Regina, G.; Piscitelli, F.; Coluccia, A.; Brancale, A.; Hamel, E.; Díaz, J. F.; Scovassi, A. I.; Lavecchia, A.; Novellino, E.; Silvestri, R. Progress in the development of arylthioindoles, potent inhibitors of tubulin polymerization and MCF-7 cell growth. *XIX National Meeting on Medicinal Chemistry, Book of Abstracts, P-027, 14-18 settembre 2008, Verona (VR).*
67. La Regina, G.; Piscitelli, F.; Coluccia, A.; Minelli, L.; Brancale, A.; Kandil, S.; Lavecchia, A.; Novellino, E.; Silvestri, R. Docking and molecular dynamics studies of arylthioindoles. *XIX National Meeting on Medicinal Chemistry, Book of Abstracts, P-085, 14-18 settembre 2008, Verona (VR).*



68. La Regina, G.; Piscitelli, F.; Coluccia, A.; Brancale, A.; Hamel, E.; Díaz, J. F.; Scovassi, A. I.; Lavecchia, A.; Novellino, E.; Silvestri, R. Progress in the development of arylthioindoles, potent inhibitors of tubulin polymerization and MCF-7 cell growth. *Strutture Eterocicliche nella Ricerca Farmaceutica*, Atti, P22, 18-21 maggio 2008, Palermo (PA).
69. La Regina, G.; Piscitelli, F.; Coluccia, A.; Minelli, L.; Brancale, A.; Kandil, S.; Lavecchia, A.; Novellino, E.; Silvestri, R. Docking and molecular dynamics studies of arylthioindoles. *Strutture Eterocicliche nella Ricerca Farmaceutica*, Atti, pg 224, P23, 18-21 maggio 2008, Palermo (PA).
70. Piscitelli, F.; La Regina, G.; Coluccia, A.; Sansone, S.; Giordano, C.; Bergamini, A.; Sinistro, A.; Cavazza, A.; Maga, G.; Samuele, A.; Zanolli, S.; Lavecchia, A.; Novellino, E.; Silvestri, R. Indolyl aryl sulfones with aminoacid units as potent HIV-1 NNRTIs. *Strutture Eterocicliche nella Ricerca Farmaceutica*, Atti, P24, 18-21 maggio 2008, Palermo (PA).
71. Sarkar, T.; La Regina, G.; Silvestri, R.; Hamel, E. Arylcarbonlyindoles: antimitotic agents and potent inhibitors of tubulin polymerization. *American Society for Cell Biology (ASCB) 47th Annual Meeting*, 1-5 dicembre 2007, Washington, Stati Uniti.
72. Scovassi, A. I.; Giansanti, V.; Prosperi, E.; La Regina, G.; Piscitelli, F.; Silvestri, R. Effects of a new arylthioindole on HeLa cell metabolism. *Frontiers in CNS and Oncology Medicinal Chemistry*, Program and Abstracts, P31, 7-9 ottobre 2007, Siena (SI).
73. Scovassi, A. I.; Camboni, T.; Prosperi, E.; La Regina, G.; Piscitelli, F.; Silvestri, R. Induction of Apoptosis in Human Tumor Cells by a New Pyrazolcarboxamide. *Frontiers in CNS and Oncology Medicinal Chemistry*, Program and Abstracts, P33, 7-9 ottobre 2007, Siena (SI).
74. Piscitelli, F.; La Regina, G.; Silvestri, R.; Cascio, M. G.; Lavecchia, A.; Brizzi, A.; Pasquini, S.; Botta, M.; Novellino, E.; Di Marzo, V.; Corelli, F. Substituted 1-Aryl-5-(1H-pyrrol-1-yl)-1H-pyrazole-3-carboxamides as potent pyrrole bioisosteres of Rimonabant and SR144528. *Frontiers in CNS and Oncology Medicinal Chemistry*, Program and Abstracts, P74, 7-9 ottobre 2007, Siena (SI).
75. La Regina, G.; Piscitelli, F.; Coluccia, A.; Brancale, A.; Hamel, E.; Díaz, J. F.; Scovassi, A. I.; Lavecchia, A.; Novellino, E.; Silvestri, R. Arylthioindoles: design, synthesis and biological activity. *XVIII Convegno Nazionale della Divisione di Chimica Farmaceutica della Società Chimica Italiana*, Atti del Convegno, P-69, 16-20 settembre 2007, Chieti (CH).
76. La Regina, G.; Piscitelli, F.; Coluccia, A.; Minelli, L.; Brancale, A.; Kandil, S.; Lavecchia, A.; Novellino, E.; Silvestri, R. Arylthioindoles: docking and molecular dynamics studies. *XVIII Convegno Nazionale della Divisione di Chimica Farmaceutica della Società Chimica Italiana*, Atti del Convegno, P-70, 16-20 settembre 2007, Chieti (CH).
77. Piscitelli, F.; La Regina, G.; Silvestri, R.; Cascio, M. G.; Lavecchia, A.; Brizzi, A.; Pasquini, S.; Botta, M.; Novellino, E.; Di Marzo, V.; Corelli, F. Substituted 1-aryl-5-(1H-pyrrol-1-yl)-1H-pyrazole-3-carboxamides, as potent pyrrole bioisosteres of Rimonabant and SR144528. *XVIII Convegno Nazionale della Divisione di Chimica Farmaceutica della Società Chimica Italiana*, Atti del Convegno, P-99, 16-20 settembre 2007, Chieti (CH).



78. Piscitelli, F.; La Regina, G.; Coluccia, A.; Sansone, S.; Giordano, C.; Bergamini, A.; Sinistro, A.; Cavazza, A.; Maga, G.; Samuele, A.; Zanolì, S.; Lavecchia, A.; Novellino, E.; Silvestri, R. Synthesis of indol aryl sulfones bearing natural and unnatural aminoacids as potent HIV-1 non-nucleoside reverse transcriptase. *XVIII Convegno Nazionale della Divisione di Chimica Farmaceutica della Società Chimica Italiana*, Atti del Convegno, P-100, 16-20 settembre 2007, Chieti (CH).
79. Silvestri, R.; Artico, M.; La Regina, G.; Piscitelli, F.; Coluccia, A.; Ragno, R. Indole nucleus as a selected pharmacophore for the design of novel highly anti-HIV RT inhibitors and also capable to inhibit tumor cell replication. *Istituto Pasteur - Fondazione Cenci Bolognetti. Hosts, Symbionts and Parasites: Molecular and Pharmacological Approaches*, 26-27 ottobre 2006, Roma (RM).
80. Coluccia, A.; Ragno, R.; La Regina, G.; Artico, M.; Silvestri, R. Structure-based and 3-D QSAR drug design of new indolyl aryl sulfones. *XXII Congresso Nazionale della Società Chimica Italiana*, Atti del Congresso, FAR-P-027, 10-15 settembre 2006, Firenze (FI).
81. De Martino, G.; La Regina, G.; Artico, M.; Silvestri, R.; Lavecchia, A.; Novellino, E. Synthesis of pyrrolo[1,2-*b*][1,2,5]benzothiadiazepines (PBTDS): new agents for the treatment of chronic myelogenous leukemia (CML). *XXII Congresso Nazionale della Società Chimica Italiana*, Atti del Congresso, FAR-P-038, 10-15 settembre 2006, Firenze (FI).
82. La Regina, G.; Brancale, A.; De Martino, G.; Artico, M.; Silvestri, R. Arylthioindoles, potent inhibitors of tubulin polymerization: structure-activity relationships and molecular modeling studies. *XXII Congresso Nazionale della Società Chimica Italiana*, Atti del Congresso, FAR-P-074, 10-15 settembre 2006, Firenze (FI).
83. Piscitelli, F.; La Regina, G.; De Martino, G.; Artico, M.; Silvestri, R. New indolyl aryl sulfones (IASs) as potent anti-HIV agents. *XXII Congresso Nazionale della Società Chimica Italiana*, Atti del Congresso, FAR-P-095, 10-15 settembre 2006, Firenze (FI).
84. De Martino, G.; La Regina, G.; Coluccia, A.; Piscitelli, F.; Edler, M. C.; Barbera, M. C.; Brancale, A.; Hamel, E.; Artico, M.; Silvestri, R. Arylthioindoles, potent inhibitors of tubulin polymerization. *Second Joint Italian - Swiss Meeting on Medicinal Chemistry*, Abstracts, P-24, 12-16 settembre 2005, Modena (MO).
85. La Regina, G.; De Martino, G.; Robertaccio, G.; Ragno, R.; Befani, O.; Agostinelli, E.; Turini, P.; Fabi, A.; Artico, M.; Silvestri, R. Design, synthesis and biological evaluation of new pyrrole MAO-B inhibitors. *Second Joint Italian - Swiss Meeting on Medicinal Chemistry*, Abstracts, P-116, 12-16 settembre 2005, Modena (MO).
86. De Martino, G.; La Regina, G.; Ragno, R.; Coluccia, A.; Maga, G.; Artico, M.; Silvestri, R. Dihalo indolyl aryl sulfones (IASs) highly active *in vitro* against HIV-1 WT and variants carrying NNRTI resistance mutations. *20th International Congress Heterocyclic Chemistry*, Book of Abstracts, 2-PO55, 31 luglio – 5 agosto 2005, Palermo (PA).
87. La Regina, G.; De Martino, G.; Di Pasquali, A.; Ragno, R.; Befani, O.; Agostinelli, E.; Turini, P.; Artico, M.; Silvestri, R. Studies on novel agents for depression and Parkinson's disease. Potent pyrrole and indole monoamine oxidase inhibitors.



- Conferenza sulla Ricerca Scientifica Facoltà di Farmacia, Dalle molecole agli organismi*, Riassunti, P43, 9-10 dicembre 2004, Roma (RM).
88. De Martino, G.; La Regina, G.; Barbera, M. C.; Brancale, A.; Hamel, E.; Artico, M.; Silvestri, R. New agents highly active in cancer therapy. Indoles, potent inhibitors of tubulin polymerization. *Conferenza sulla Ricerca Scientifica Facoltà di Farmacia, Dalle molecole agli organismi*, Riassunti, P44, 9-10 dicembre 2004, Roma (RM).
89. La Regina, G.; De Martino, G.; Di Pasquali, A.; D'Auria, F.; Nencioni, L.; Palamara, A. T.; Artico, M.; Silvestri, R. Chemotherapeutic agents for the treatment of fungal infections. Imidazole derivatives highly active against *Candida albicans*. *Conferenza sulla Ricerca Scientifica Facoltà di Farmacia, Dalle molecole agli organismi*, Riassunti, P45, 9-10 dicembre 2004, Roma (RM).
90. De Martino, G.; La Regina, G.; Barbera, M. C.; Brancale, A.; Hamel, E.; Artico, M.; Silvestri, R. Arylthioindoles, potent inhibitors of tubulin polymerization. *Istituto Pasteur – Fondazione Cenci Bolognetti. Giornate Scientifiche Della Fondazione. Molecular Recognition*. 2-3 dicembre 2004, Roma (RM).
91. De Martino, G.; La Regina, G.; Crespan, E.; Maga, G.; Artico, M.; Silvestri, R. Novel indolyl aryl sulfones (IAAs) highly active *in vitro* against HIV-1 WT and variants carrying NNRTI resistance mutations. *Cost D28 MC Action. Natural Products as a Source for Discovery, Synthesis, and Application of New Pharmaceuticals*, Program & Abstracts, P-23, 21-24 ottobre 2004, Siena (SI).
92. La Regina, G.; De Martino, G.; D'Auria, F.; Nencioni, L.; Palamara, A. T.; Artico, M.; Silvestri, R. Imidazole derivatives highly active against *Candida albicans*. *Cost D28 MC Action. Natural Products as a Source for Discovery, Synthesis, and Application of New Pharmaceuticals*, Program & Abstracts, P-24, 21-24 ottobre 2004, Siena (SI).
93. De Martino, G.; La Regina, G.; Crespan, E.; Maga, G.; Artico, M.; Silvestri, R. Nuovi indolil aril solfoni 2-sostituiti attivi su HIV-1 WT e su altri mutanti resistenti. *XVII Convegno Nazionale della Divisione di Chimica Farmaceutica della Società Chimica Italiana*, Atti del Convegno, P-59, 6-10 settembre 2004, Pisa (PI).
94. De Martino, G.; La Regina, G.; Barbera, M. C.; Brancale, A.; Hamel, E.; Artico, M.; Silvestri, R. Potenti inibitori della tubulina a struttura indolica. *XVII Convegno Nazionale della Divisione di Chimica Farmaceutica della Società Chimica Italiana*, Atti del Convegno, P-60, 6-10 settembre 2004, Pisa (PI).
95. La Regina, G.; De Martino, G.; Di Pasquali, A.; D'Auria, F.; Nencioni, L.; Palamara, A. T.; Artico, M.; Silvestri, R. Derivati imidazolici isomeri dell'econazolo ad azione anti-*Candida*. *XVII Convegno Nazionale della Divisione di Chimica Farmaceutica della Società Chimica Italiana*, Atti del Convegno, P-91, 6-10 settembre 2004, Pisa (PI).
96. La Regina, G.; De Martino, G.; Di Pasquali, A.; Ragno, R.; Befani, O.; Palumbo, M.; Agostinelli, A.; Turini, P.; Artico, M.; Silvestri, R. Potenti inibitori delle monoamino ossidasi a struttura pirrolica ed indolica. *XVII Convegno Nazionale della Divisione di Chimica Farmaceutica della Società Chimica Italiana*, Atti del Convegno, P-92, 6-10 settembre 2004, Pisa (PI).
97. D'Auria, F. D.; Silvestri, R.; Artico, M.; La Regina, G.; De Martino, G.; Palamara, A. T. Analoghi azolici della Fluoxetina, una nuova classe di agenti antifungini. 31°



Congresso Nazionale Società Italiana di Microbiologia, Riassunti, 19-22 ottobre 2003, Roma (RM).

98. La Regina, G.; Novel indolyl aryl sulfones (IASs) highly active *in vitro* against HIV-1 WT and variants carrying NNRTI resistance mutations. *European School of Medicinal Chemistry (XXIII Corso Avanzato in Chimica Farmaceutica e Seminario Nazionale per Dottorandi "E. Duranti")*, Relazioni dei Dottorandi, 4-8 luglio 4-8, Urbino (PU).
99. Ragno, R.; Silvestri, R.; De Martino, G.; La Regina, G.; Artico, M.; Massa, S.; Marongiu, M.; Attori, M.; Marongiu, E.; Cabras, A.; Saddi, M.; La Colla, P. Docking and 3-D QSAR studies on indolyl aryl sulfones (IASs). Binding mode exploration at the HIV-1 RT NNBS and structure based drug design. *XXI Congresso Nazionale della Società Chimica Italiana, Atti, Vol. 2, FA-CP-054, 22-27 giugno 2003, Torino (TO).*
100. Silvestri, R.; La Regina, G.; De Martino, G.; Artico, M.; D'Auria, F. D.; Palamara, A. T. Azole analogues of Fluoxetine, a novel class of anti-*Candida* agents. *XXI Congresso Nazionale della Società Chimica Italiana, Atti, Vol. 2, FA-CP-057, 22-27 giugno 2003, Torino (TO).*
101. Silvestri, R.; La Regina, G.; De Martino, G.; Artico, M.; Marfe, G.; Salimei, P. S.; Morgante, E.; Russo, M. A.; Di Stefano, C. Pyrrolo[1,2-*b*]benzothiadiazepines (PBTDS) induce apoptosis in chronic myelogenous K562 leucemic cells. *XXI Congresso Nazionale della Società Chimica Italiana, Atti, Vol. 2, FA-CP-058, 22-27 giugno 2003, Torino (TO).*
102. Silvestri, R.; La Regina, G.; De Martino, G.; Artico, M.; Massa, S.; Marongiu, M.; Attori, M.; Cabras, A.; Saddi, M.; La Colla, P. Synthesis of indole derivatives active against *Flaviviridae* viruses. *XXI Congresso Nazionale della Società Chimica Italiana, Atti, Vol. 2, FA-CP-059, 22-27 giugno 2003, Torino (TO).*
103. Silvestri, R.; De Martino, G.; La Regina, G.; Artico, M.; Ragno, R.; La Colla, M.; Loddò, R.; Marongiu, M. E.; La Colla, P.; Pani, A. Agenti anti-HIV-1: acilamino pirril aril solfoni (APAS), analoghi troncati delle PBTD tricycliche. *XVI Convegno Nazionale della Divisione di Chimica Farmaceutica, Atti del Convegno, P6, 18-22 settembre 2002, Sorrento (NA).*
104. Silvestri, R.; Artico, M.; La Regina, G.; De Martino, G.; Massa, S.; Befani, P.; Palumbo, M.; Agostinelli, E.; Turini, P. *N*-Benzil e *N*-propargil 1*H*-pirrolo-2-carbossiamidi, semplici ed efficaci inibitori delle monoamino ossidasi. *XVI Convegno Nazionale della Divisione di Chimica Farmaceutica, Atti del Convegno, P134, 18-22 settembre 2002, Sorrento (NA).*
105. Silvestri, R.; Artico, M.; La Regina, G.; De Martino, G.; Massa, S.; Befani, O.; Palumbo, M.; Agostinelli, E.; Turini, P. *N*-Benzil and *N*-propargyl 1*H*-pirrolo-2-carboxyamidi, as simple and potent MAO inhibitors. *23rd IUPAC – 2002. International Symposium on the Chemistry of Natural Products, Abstracts Book, P208, 28 luglio – 2 agosto 2002, Firenze (FI).*
106. Silvestri, R.; De Martino, G.; La Regina, G.; Artico, M.; Ragno, R.; La Colla, P.; Marongiu, M. E.; Pani, A. Anti-HIV-1 NNRT agents: acilamino pyrrol aryl sulfones (APASs) as truncated analogues of tricyclic PBTDS. *23rd IUPAC – 2002. International Symposium on the Chemistry of Natural Products, Abstracts Book, P209, 28 luglio – 2 agosto 2002, Firenze (FI).*



□ Partecipazione a Progetti di Ricerca Ammessi al Finanziamento

Principal investigator

1. Finanziamenti di Ateneo 2019, Sapienza Università di Roma: Treatment of chronic myeloid leukemia by inhibition of tubulin polymerization; RM11916B5598E3C4, 18 mesi, 14500 euro.
2. Call 2019, Istituto Pasteur – Fondazione Cenci Bolognetti: Treatment of chronic myeloid leukemia by inhibition of tubulin polymerization; 24 mesi, 40000 euro.
3. Finanziamento delle attività base di ricerca 2017, Agenzia Nazionale di Valutazione del Sistema Universitario e della Ricerca, 3000 euro.
4. Finanziamenti di Ateneo 2017, Sapienza Università di Roma: Hit to lead optimization of arylthioindoles and aroylindoles as modern anticancer agents; RP11715C7D1CF0D1, 18 mesi, 4000 euro.
5. Finanziamenti Ateneo 2016, Sapienza Università di Roma: Targeting colchicine binding site of tubulin by indole- and pyrrole-based anticancer agents; RG116154CF287B95, 18 mesi, 30000 euro.
6. Ricerche Universitarie 2015, Sapienza Università di Roma: New inhibitors of tubulin polymerization as anticancer agents endowed with stimulation of natural killer cell cytotoxic activity and repression of Hedgehog signalling pathway; C26A15J3BB, 18 mesi, 34450 euro.
7. Ricerche Universitarie 2014, Sapienza Università di Roma: Development of new compounds as anticancer and analgesic agents; C26A14TLFT, 18 mesi, 20000 euro.
8. Progetti Awards Ricerche Universitarie 2013, Sapienza Università di Roma: Tubulin and TRP channels as targets for new antitumor and analgesic agents; C26H135FL5, 18 mesi, 55000 euro.
9. FIRB Futuro in Ricerca 2010, Ministero dell'Istruzione, dell'Università e della Ricerca: Mitochondrial medicinal chemistry against cell death-resistant cancers; RBFR10ZJQT_003, 36 mesi, 307671 euro.

Supervisore

1. Finanziamenti di Ateneo 2021, Sapienza Università di Roma: Modern anticancer agents with improved water solubility; AR12117A8A6E80F0, 18 mesi, principal investigator Dott.ssa Jessica Sebastiani.
2. Finanziamenti di Ateneo 2017, Sapienza Università di Roma: New inhibitors of NS2B-NS3 protease as anti-Zika virus agents; AR11715C819399E6, 18 mesi, principal investigator Dott.ssa Domiziana Masci.

Partecipante alla ricerca

1. Finanziamenti di Ateneo 2021, Sapienza Università di Roma: Brain-penetrant microtubule-targeting agents; RM12117A85D9076B, 18 mesi, principal investigator Dott.ssa Marianna Nalli.
2. Call 2020, AIRC: Targeting beta-catenin and Dishevelled protein as a synergistic strategy against colorectal cancer; IG 2020 ID 24703, 60 mesi, principal investigator Prof. Romano Silvestri.



3. Finanziamenti di Ateneo 2020, Sapienza Università di Roma: A system integrating fast chromatography and circular dichroism detection; GA12017306E11961, 18 mesi, principal investigator Prof. Claudio Villani;
4. Finanziamenti di Ateneo 2020, Sapienza Università di Roma: Design, synthesis and biological evaluation of tubulin binding agents as anticancer hybrid compounds; RM120172A7EAD07C, 18 mesi, principal investigator Prof. Romano Silvestri.
5. Finanziamenti di Ateneo 2019, Sapienza Università di Roma: Spettrometria di massa multidimensionale per applicazioni in campo (bio)chimico, farmaceutico e alimentare; MA31916B7482CC6E, 18 mesi, principal investigator Prof. Simonetta Fornarini.
6. Finanziamenti di Ateneo 2018, Sapienza Università di Roma: Tubulin as target in chronic myeloid leukemia treatment; RG11816428A9B4D5, 18 mesi, principal investigator Prof. Romano Silvestri.
7. Istituto Pasteur – Fondazione Cenci Bolognetti 2013: New non-nucleoside antiviral agents targeting HIV-1 reverse transcriptase; 36 mesi, principal investigator Prof. Romano Silvestri.
8. Università degli Studi di Roma “La Sapienza” - Ricerche Universitarie 2011: Citotossicità indotta su cellule tumorali umane dai prodotti di ossidazione enzimatica delle poliamine in associazione ad endocannabinoidi e composti lisosomotropici: nuovi approcci terapeutici; 18 mesi, principal investigator Prof. Enzo Agostinelli.
9. Università degli Studi di Roma “La Sapienza” - Acquisizione di medie e grandi attrezzature scientifiche 2011: Strumentazione integrata spettrometro di massa Orbitrap/cromatografo liquido ultraperformante (orbitrap-MSn/UHPLC). Studi "multi-omics" ad alta efficienza di sistemi biologici complessi; 18 mesi, principal investigator Prof. Francesco Gasparrini.
10. Università degli Studi di Roma “La Sapienza” - Ricerche Universitarie 2010: Citotossicità indotta su cellule tumorali umane dai prodotti di ossidazione enzimatica delle poliamine in associazione ad endocannabinoidi e composti lisosomotropici: nuovi approcci terapeutici; 18 mesi, principal investigator Prof. Enzo Agostinelli.
11. Università degli Studi di Roma “La Sapienza” - Acquisizione di medie e grandi attrezzature scientifiche 2010: Strumentazione integrata spettrometro di massa a Trasformata di Fourier/cromatografo liquida ultraperformante (FT-MSn/UHPLC) per studi avanzati di "omiche" in sistemi biologici; 18 mesi, principal investigator Prof. Maurizio Speranza.
12. Università degli Studi di Roma “La Sapienza” - Ricerche di Ateneo Federato 2009: Terminal transferasi come nuovo target per la terapia anticancro: studi SAR su DKHA come inibitori specifici della TDT; 18 mesi, principal investigator Prof. Roberto Di Santo.
13. Università degli Studi di Roma “La Sapienza” - Ricerche di Ateneo Federato 2009: Nuovi inibitori della funzione ribonucleasica della trascrittasi inversa di HIV-1; 18 mesi, principal investigator Prof. Roberta Costi.
14. Università degli Studi di Roma “La Sapienza” - Progetti di Ricerca Universitari 2009: Sintesi, attività antitumorale e correlazione con specifici geni mitotici di



nuovi inibitori della polimerizzazione della tubulina; 12 mesi, principal investigator Prof. Romano Silvestri.

15. Istituto Pasteur – Fondazione Cenci Bolognetti 2008: Drug design and synthesis of non-nucleoside inhibitors of both HIV-1 wild type and resistant mutant strains reverse transcriptase, and Coxsackie B4 virus; 36 mesi, principal investigator Prof. Romano Silvestri.
16. PRIN 2007: Progettazione, sintesi e attività biologica di inibitori di metalloenzimi coinvolti nelle patologie neurodegenerative, infiammatorie e tumorali; 24 mesi, principal investigator Prof. Stefano Alcaro.
17. FIRB Internazionali 2006: Basi molecolari delle malattie; principal investigator: Prof. Paolo Amati; 36 mesi, unit principal investigator Prof. Romano Silvestri.
18. Istituto Pasteur – Fondazione Cenci Bolognetti 2005: Indole nucleus as a selected pharmacophore for the design of novel highly potent anti-viral agents active against HIV-1 (RT and IN inhibitors) and also capable to inhibit HCV and tumor cell replication; 36 mesi, principal investigator Prof. Romano Silvestri.

❑ Associazioni

Membro della Società Chimica Italiana, Divisione Chimica Farmaceutica (Tessera n. 12999).

❑ Servizio Militare

Richiesta di dispensa accolta per attività di ricerca scientifica svolta in ambito universitario (Ministero della Difesa, Ufficio Reclutamento e Forze di Completamento, Prot. N. RECL/DISP/2392, 19 febbraio 2004).

Autorizzo il trattamento dei miei dati personali ai sensi del Dlgs 196 del 30 giugno 2003. Dichiaro, inoltre, sotto la mia responsabilità che quanto dichiarato corrisponde a verità.

Roma, 6 maggio 2022

In Fede

Prof. Giuseppe La Regina