

## CURRÍCULUM VITAE

**NOMBRE:** Roy J. Little

**DIRECCIÓN:** Apartado 20, Ipostel La Hechicera, Mérida 5251

**LUGAR DE NACIMIENTO:** Reno, Nevada, Estados Unidos

**FECHA DE NACIMIENTO:** 9 de Junio de 1948

**NACIONALIDAD:** Norteamericana, Pasaporte Z7144569

**CI:** E-82055865, Residente

**ESTADO CIVIL:** Casado

**EDUCACIÓN:** **Diploma de Graduación**, Sparks Senior High School, Sparks, Nevada. Miembro National Honor Society; Entre los diez mejores graduados; comendación especial de la facultad y administración. Año 1966.

**Bachelor of Science in Chemistry**, mención Química Orgánica, University of Nevada, Reno. Año 1971.

**Bachelor of Arts**, mención Psicología Social, University of Nevada. Año 1971.

**Doctor of Philosophy (Ph.D.)**, mención Ciencias Farmacéuticas, University of Florida Gainesville, Florida. Año 1983  
Tesis de Doctorado: Diseño y Síntesis de varios Esteroides anti-inflamatorios y Análisis de sus actividades biológicas (traducción)  
Director de Tesis: Dr. Nicholas Bodor

**Licenciado en Química (por reválida)**, Universidad de Los Andes, Octubre, 1992.

**EXPERIENCIA:** **1968-1971:** Asistente de Investigación Departamento de Bioquímica Agrícola, Universidad de Nevada.  
**1971-1973:** Asistente de Laboratorio, Departamento de Química, Universidad de Arizona, Tucson.  
**1973-1979:** Investigador Científico, Interx Research Corporation, Lawrence, Kansas.  
**1979-1980:** Químico, Departamento de Química Medicinal, Facultad de Farmacia, Universidad de Florida.  
**1980-1983:** Asistente de Investigación, Departamento de Química Medicinal, Facultad de Farmacia, Universidad de Florida, Gainesville, Florida.  
**1984-1985:** Doctor Asociado (post-doctor), Departamento de Química Medicinal, Facultad de Farmacia, Universidad de Florida, Gainesville, Florida.  
**1986-1988:** Investigador Científico (Senior Research Scientist) Pharmatec, Inc., Alachua, FL, 32615, U.S.A.

**1989-1990:** Investigador Científico, Post-grado en Química de medicamentos, Instituto de Investigaciones Químicas, Facultad de Farmacia, Universidad de Los Andes.

**1990-1993:** Profesor Contratado, Nivel Asistente, Facultad de Farmacia, Universidad de Los Andes. Inscrito en el Instituto de Investigación.

**1993-1999:** Profesor Ordinario por concurso de oposición, Nivel Agregado, Facultad de Ciencias, Universidad de Los Andes.

**1999-:** Ascenso a Profesor Asociado, Facultad de Ciencias, Universidad de Los Andes.

**PATENTE:**

Co-inventor de Mannich-Base Hydroxamic Acid Prodrugs for the Improved Delivery of Non-steroidal Antiinflammatory Agents and a Pharmaceutical Preparation Containing Them. U.S. Patent Appl. 143,520. 24 April 1980.

**CONGRESOS:**

Asistencia y presentación del trabajo: Brain-Targeting of Azidothymidine, 27th Annual Interscience Conference on Antimicrobial Agents and Chemotherapy (ICAAC), Nueva York, Octubre, 1987.

Conferencia: Investigación en el Desarrollo de Nuevos Fármacos (en Venezuela)  
Encuentro Hispanoamericano de Facultades de Farmacia  
Mérida, Venezuela, 1992

Asistencia y presentación del trabajo: Análogos Acíclicos del Ribósido del Alopurinol y Pruebas de su Actividad Biológica  
XLIII Convención Anual AsoVac, Mérida, Venezuela, 1993

Asistencia y presentación del trabajo: Glucación No Enzimática de Proteínas en presencia de Aminoguanidina in vitro  
XLIV Convención Anual AsoVAC, Falcón, Venezuela, 1994

Conferencia: Drogas Blandas sus aplicaciones terapéuticas  
Simposio IV Jornadas Científicas del Instituto de Investigaciones de la Facultad de Farmacia,  
Mérida, Venezuela, 1995

Asistencia y presentación del trabajo: Relative reactivity of the nitrogens of a heterocyclic base. Reassessment of the acid catalyzed alkylation of allopurinol, Tercer Congreso Venezolano de Química, Caracas, Nov. 1996.

Asistencia y presentación del trabajo: Prodrugs of acyclic analogs of allopurinol riboside. Preliminary studies on [(2-acyloxymethoxy)methyl]allopurinol derivatives.  
1<sup>st</sup> Drug optimization via retrometabolism conference,

Amelia Island, Florida, Mayo 1997.

Asistencia y presentación del trabajo: Structure-Activity relationships in corticosteroids. Receptor binding, X-ray crystal analysis and theoretical studies on some 17- $\alpha$ , $\beta$ -diesters of cortienic acid. 16<sup>th</sup> Conference on Chemistry, Santiago de Cuba, Dic. 1999.

Asistencia y presentación del trabajo: Modeling of Human Corticosteroid Binding Globulin. Use of Structure - Activity Relations in Soft Steroid Binding to Refine the Structure. 51 Retrometabolism Based Drug Design and Targeting Conference. Kowaki-En, Japón. 8-11, Mayo, 2005

#### PUBLICACIONES:

1. Micellar Acceleration of Phosphorylation of Hydroxamic Acid: Effect of Chain Length and of an Intramolecular Tertiary Amino Group, Sloan, K.B., N.S. Bodor, T. Higuchi, R.J. Little, M.S. Wu, J.Chem. Res.(S), 1977,290.
2. Acid Catalyzed Rearrangements of the Dihydroxyacetone Side Chain in Steroids During Ketal Exchange, Sloan, K.B., R.J. Little, N.S. Bodor, J. Org. Chem., 43, 3405-3408 (1978).
3. Carbon-13 NMR Spectroscopy of 4,5- and 5,6-Double Bond Isomers of Spiro-3-Steroid Ketone Derivatives. The Determination of the Structures of Steroidal Thiazolidines, Sloan, K.B., N.S. Bodor, R.J. Little, Tetrahedron, 37, 3467-3471 (1981).
4. Soft Drugs. 4. 3-Spirothiazolidines of Hydrocortisone and its Derivatives, Bodor, N.S., K.B. Sloan, R.J. Little, S.H. Selk, L. Caldwell, Int. J. Pharm., 10, 307-321, (1982).
5. Brain-Targeting of Azidothymidine, Little, R.J., M.E. Brewster, N.S. Bodor, Abstracts the Twenty-Seventh Interscience Conference on Antimicrobial Agents and Chemotherapy, pg. 163 (Abst. no. 380), (1987).
6. Brain-Enhanced Delivery of Antiviral Agents, Brewster, M.E., R.J. Little, V. Venkatraghavan, and N. Bodor, Antiviral Research, 9, 127 (1988).
7. Improved Delivery Through Biological Membranes XXXVIII. Brain-Targeted Delivery of Azidothymidine, Little, R.J., D. Bailey, M.E. Brewster, K.E. Estes, R. Clemmons, A. Saab, N.S. Bodor, Journal of Biopharmaceutical Sciences, 1, 1-18 (1990).
8. Improved delivery through biological membranes. Synthesis and antiviral activity of a series of ribavirin chemical delivery systems: 2' and 3' derivatives, Deyrup, M., R. Sidwell, R. Little, P. Druzgala, N. Bodor y M.E. Brewster, Antiviral Chemistry & Chemotherapy, 2(6), 337-355 (1991).
9. Prodrugs of Acyclic Analogs of Allopurinol Riboside. Preliminary Studies on 1-[(2-acyloxyethoxy)methyl]Allopurinol Derivatives Little, R.J. and R. Aragort, Die Pharmazie, 52, S27 (1997).
10. Soft drugs based on Hydrocortisone. Toward the synthesis of 17-chloromethyl-17-sulfonates of Cortienic Acid, Little, R.J. and G. Meccia, Die Pharmazie, 52, S26 (1997).
11. Soft drugs based on Hydrocortisone. The inactive metabolite approach and its application to steroidal antiinflammatory agents, Little, R.J. N. Bodor and T. Loftsson, Pharmaceutical Research, 16, 961-967 (1999).

12. The 17-spiro lactide of Cortienic Acid. A probe for studying the active sites of steroidal receptors, Mora, A., B. Ramírez, G. Delgado and R.J. Little, Acta Crystallographica, C55, 1870-1873 (1999).

13. Intento de síntesis de fármacos blandos basados en el cortisol, Meccia, G. and R.J. Little, Ciencia, 7, 201-209 (1999).

14. A Short Path Synthesis of [<sup>13</sup>C / <sup>15</sup>N] multi-labeled Pyrimidine Nucleosides starting from Glucopyranose Nucleosides, Lagoja, Irene M., Sylvie Pochet, Valerie Boudou, Roy Little, Eveline Lescrinier, Jef Rozenski and Piet Herdewijn, Journal of Organic Chemistry, 68, 1867-1871 (2003).

15. Artículo **enviado** para publicación  
Modeling of Human Corticosteroid Binding Globulin. Use of Structure-Activity Relations in Soft Steroid Binding to Refine the Structure  
Roy John Little and C. G. Rodriguez  
Pharmaceutical Research, June 2005

#### TESIS DIRIGIDAS

Co-tutor de tesis de Maestría de María Eugenia Chalbaud, Síntesis de algunos derivados de la aminoguanidina para el tratamiento de los efectos secundarios de la diabetes mellitus., Junio, 1994, Facultad de Farmacia-ULA.

Tutor de tesis de Maestría de Thamara Mender, Síntesis de profármacos del análogo acíclico del ribósido del alopurinol, Julio, 1995, Facultad de Farmacia-ULA.

Tutor de tesis de Licenciatura de Alexis Pestano, Estudios teóricos de la interacción no-covalente entre artemisina y derivados con elementos biológicos, Noviembre, 2004, Facultad de Ciencias - ULA.

Tutor de tesis de Licenciatura de Clorybeth Rodriguez, Estudio Teórico de ligación con la globulina transportadora de corticoesteroides (CBG) y comparación con estudios experimentales, Noviembre, 2004, Facultad de Ciencias - ULA.