



Universidade Federal do Rio de Janeiro

# *A criação e o valor do conhecimento científico*

II Encontro Educação e Ciência de Roraima (II EEC)  
III Seminário Institucional do PIBID - UERR



*Uma breve narrativa sobre a criação do conhecimento científico novo, a contribuição da universidade como produtora de Ciência. A valia do conhecimento científico sob a ótica de um setor criador de riqueza e tecnologias avançadas através da inovação.*



*Eliezer J. Barreiro*

Professor Titular  
UFRJ



Laboratório de Avaliação e Síntese de Substâncias Bioativas

Instituto Nacional de Ciência e Tecnologia de Fármacos e Medicamentos  
INCT-INOVAR

<http://www.inct-inovar.ccs.ufrj.br>

Conhecimento  
empírico

Conhecimento  
científico

# Conhecimento científico





# Conhecimento científico

No início...



Hoje...

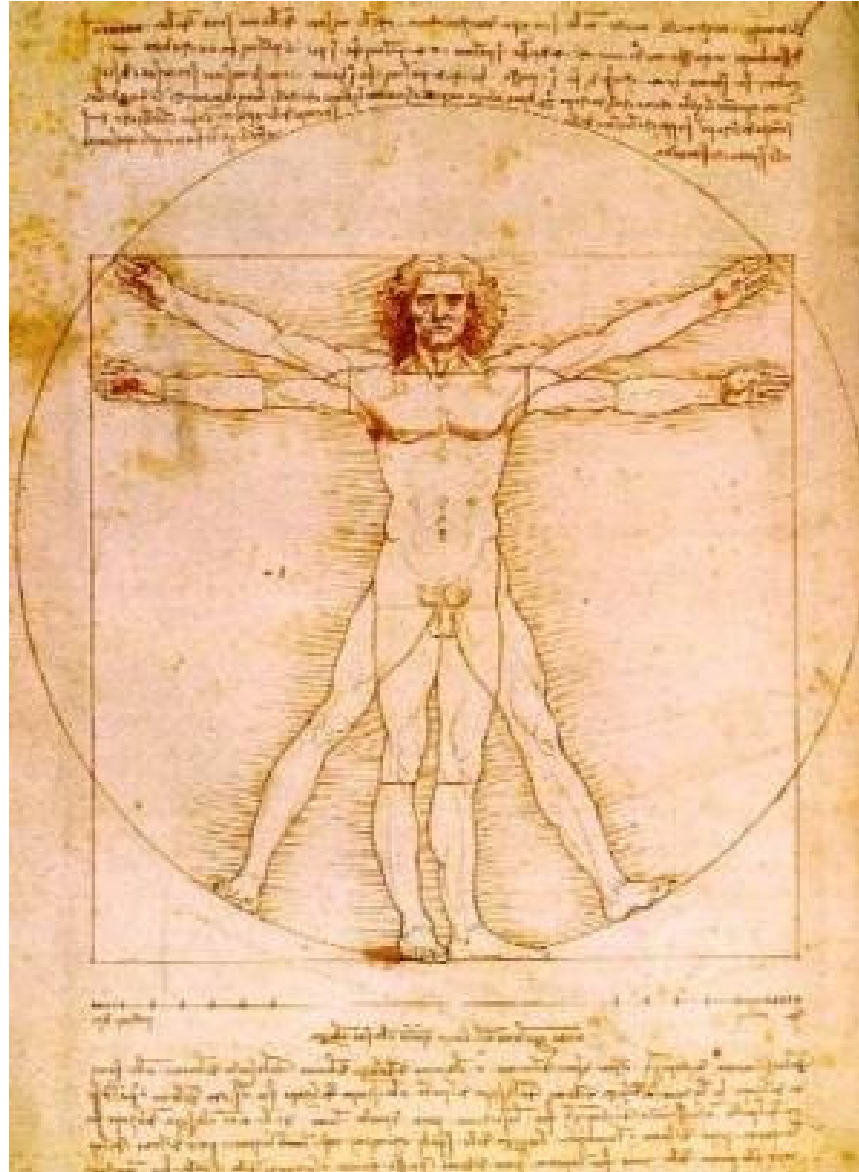
**"Se o conhecimento pode  
criar problemas,  
não é através da ignorância  
que podemos solucioná-los. "**



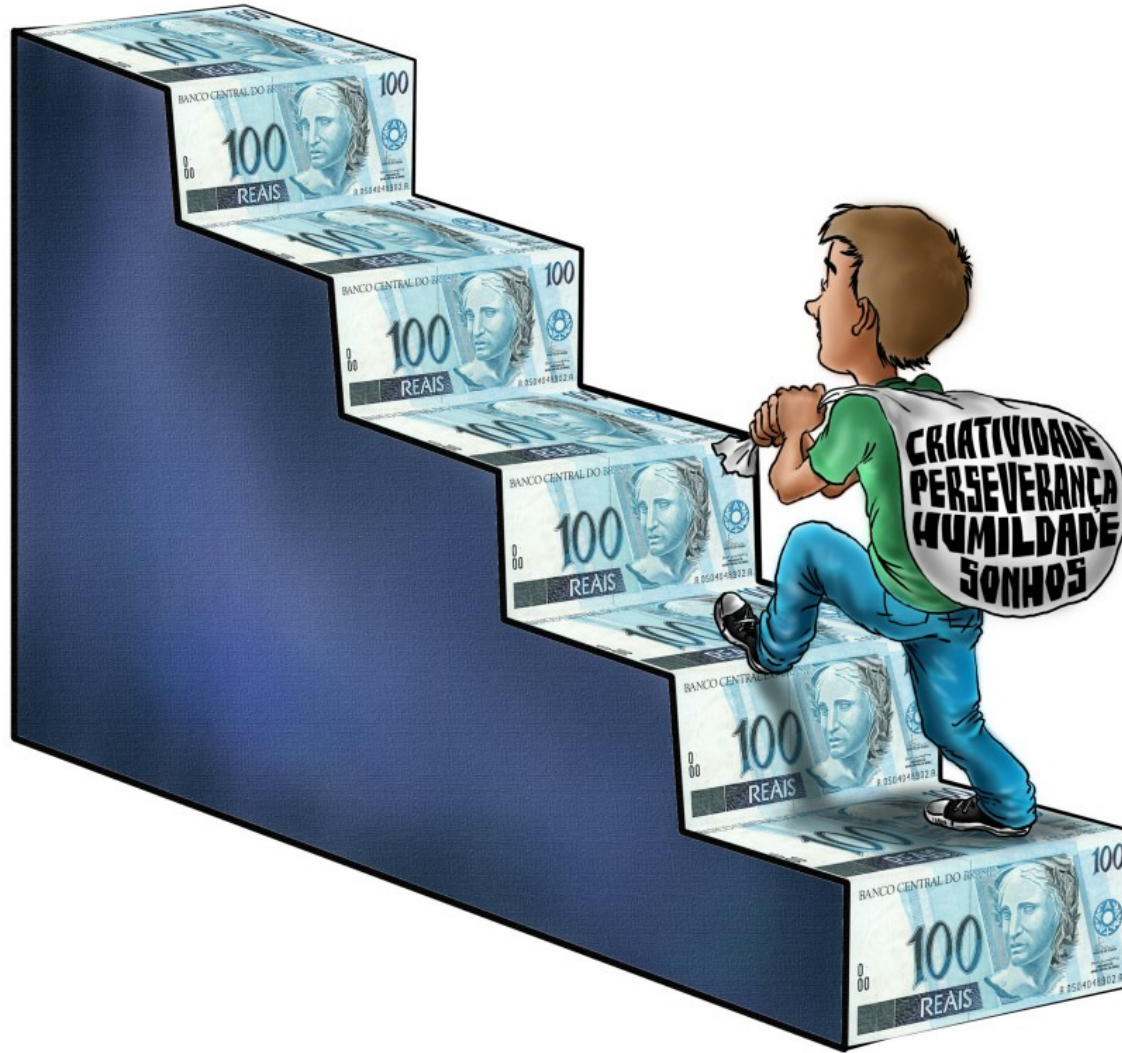
**Isaac Asimov**

(1920-1992)

# Como valorar o conhecimento?











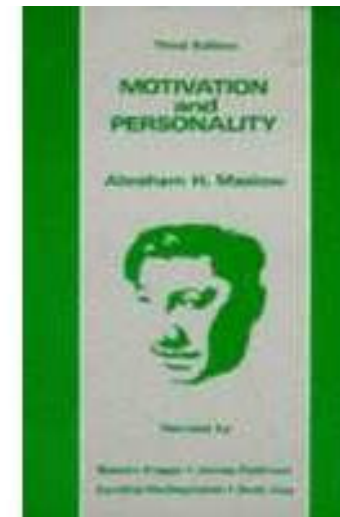


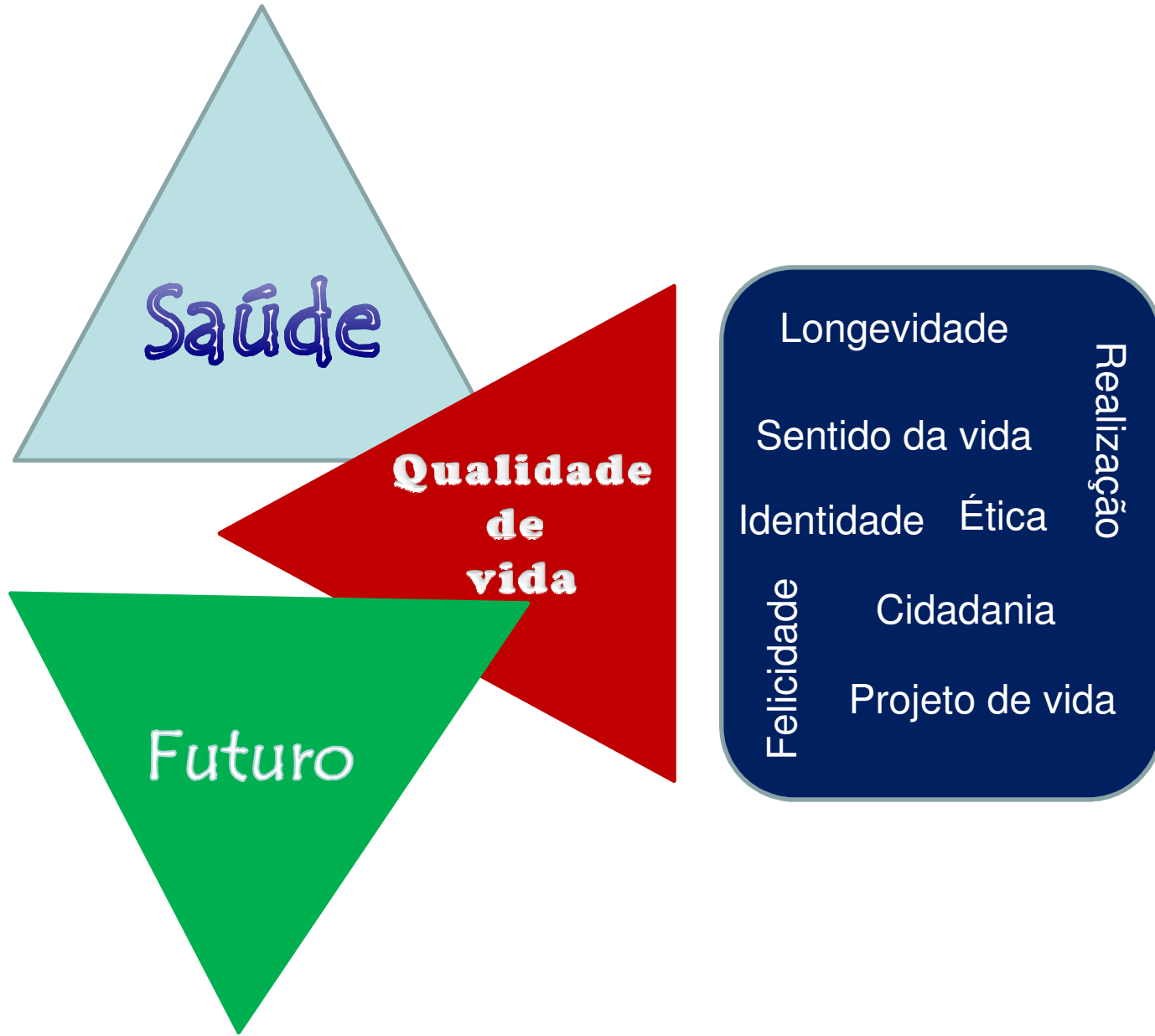
# O conhecimento...

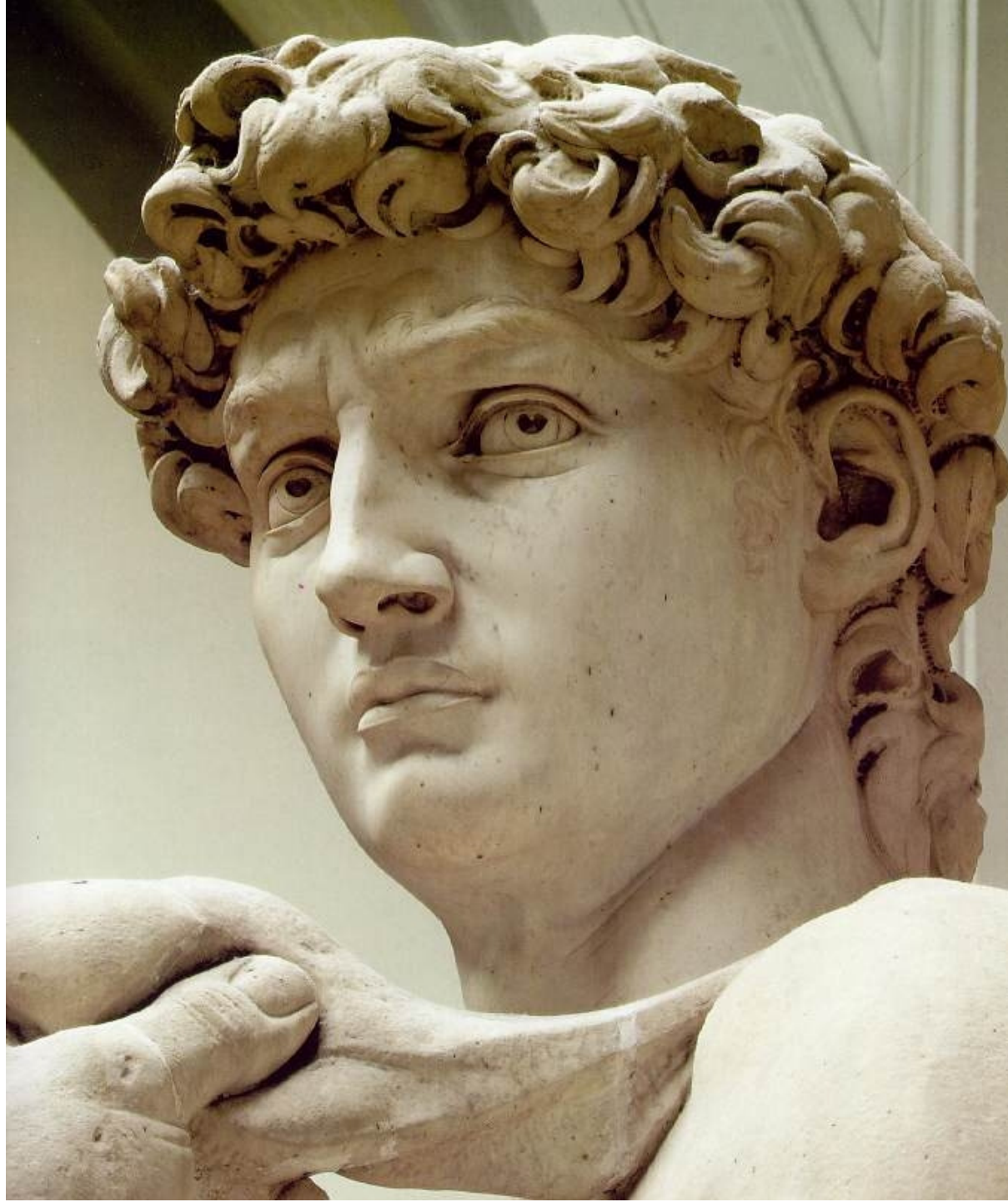


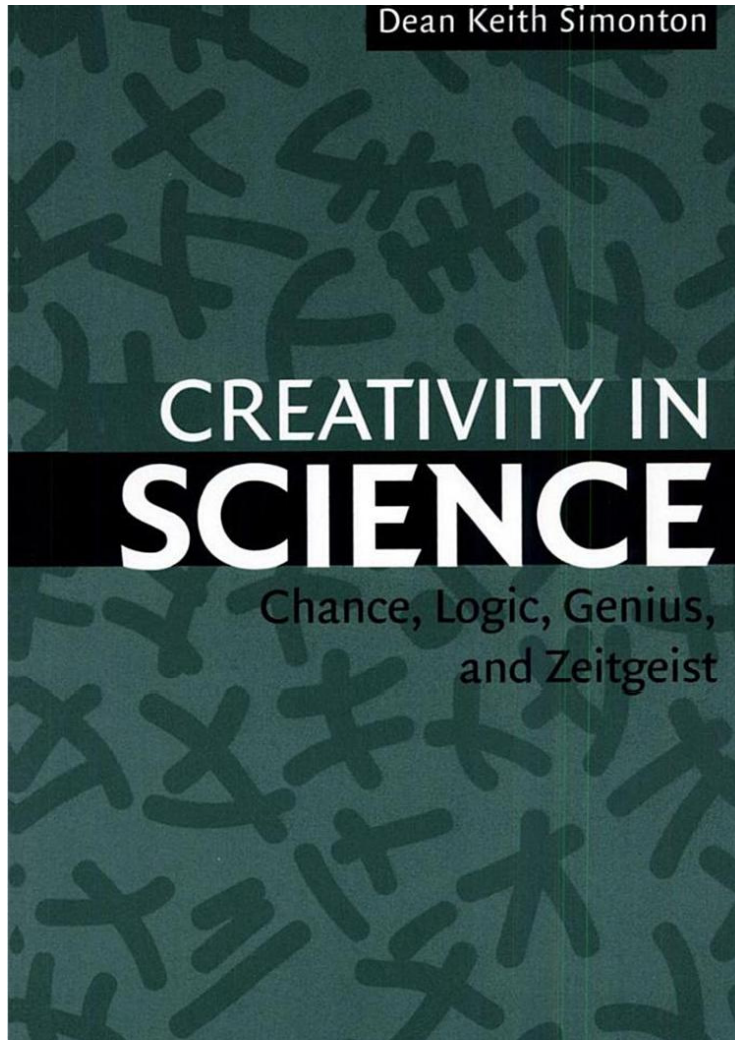
*Teoria da Motivação*

A. Maslow









# Inovação & criatividade



## Inovação criativa

Toda invenção é uma inovação?

Toda inovação é uma invenção?

Toda invenção é criativa?

Toda inovação é criativa?



# Saúde

recuperar

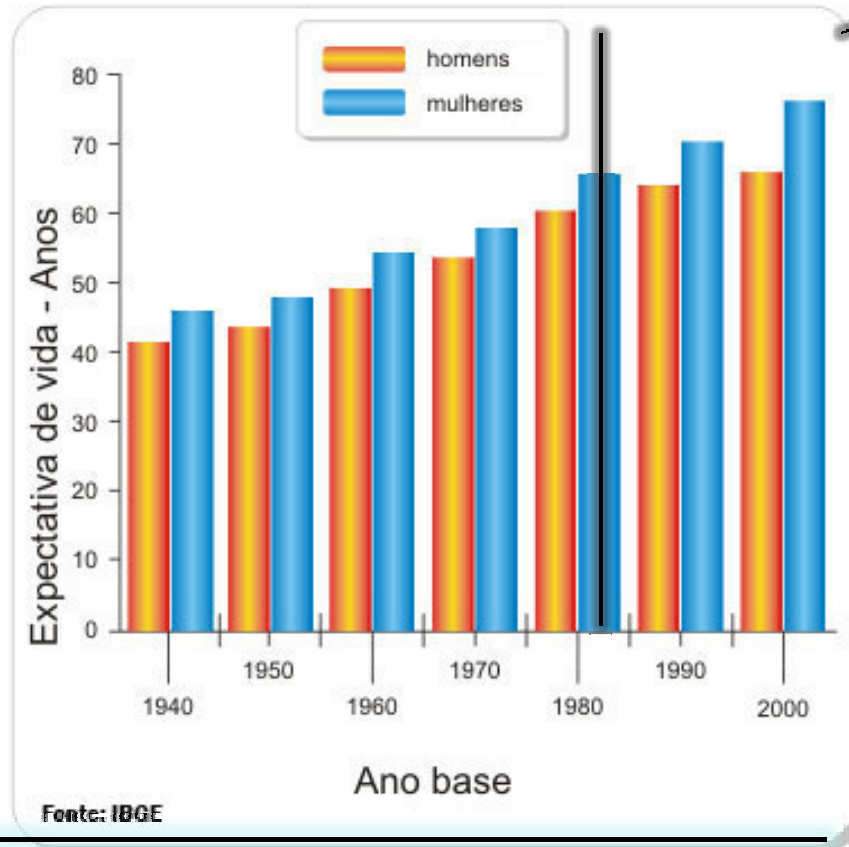


preservar

manter

# Expectativa de vida

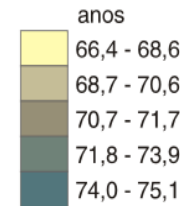
2010 – 73,5 anos (IBGE)



Fonte: IBGE

(<http://ibge.gov.br/>)

Expectativa de vida nos estados brasileiros 2007



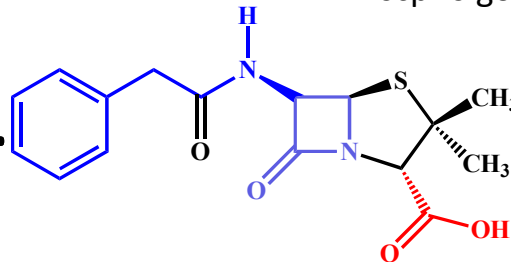
Fonte: IBGE - Síntese de Indicadores Sociais  
Elaboração: SEPLAG/DEPLAN - 11/2008

0 750 1.500 km

[www.scp.rs.gov.br/uploads/Expect\\_Brasil\\_07p.gif](http://www.scp.rs.gov.br/uploads/Expect_Brasil_07p.gif)



Os fármacos...

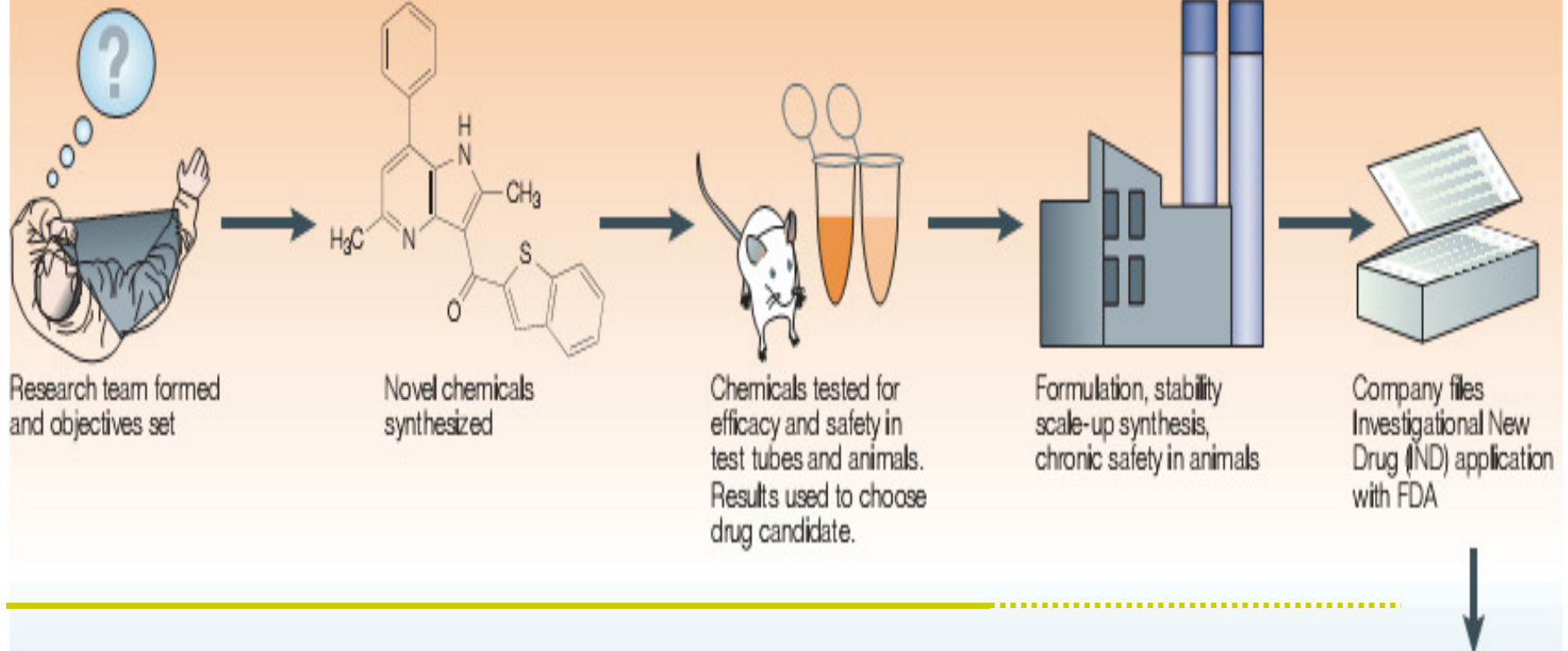


... salvam vidas !

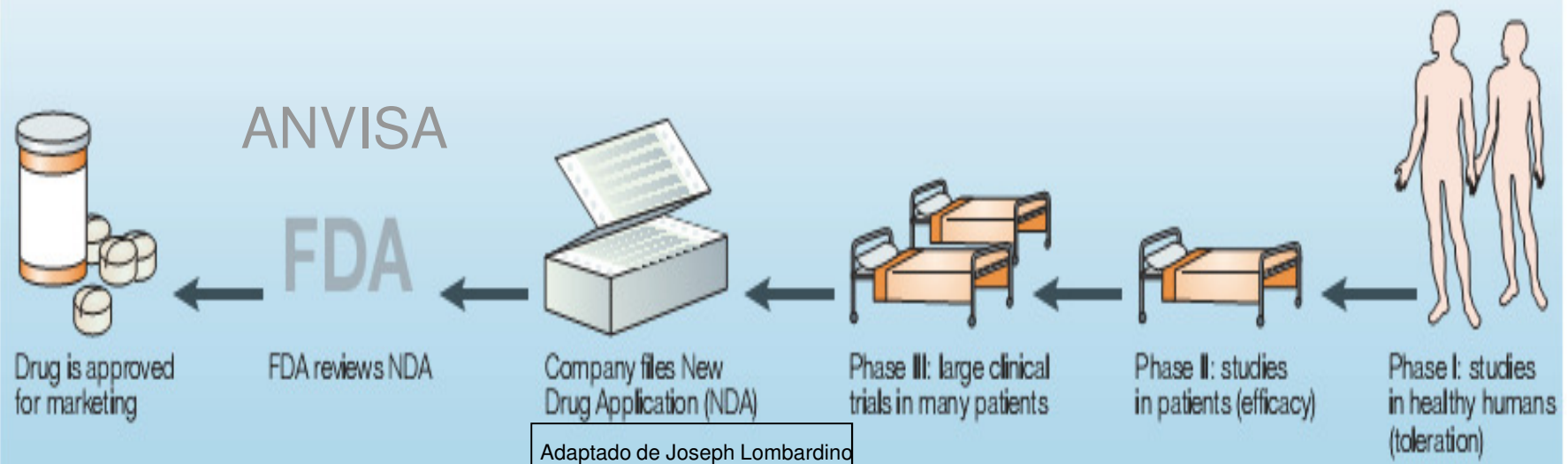
penicillin G



# Preclinical studies O processo da descoberta é complexo...



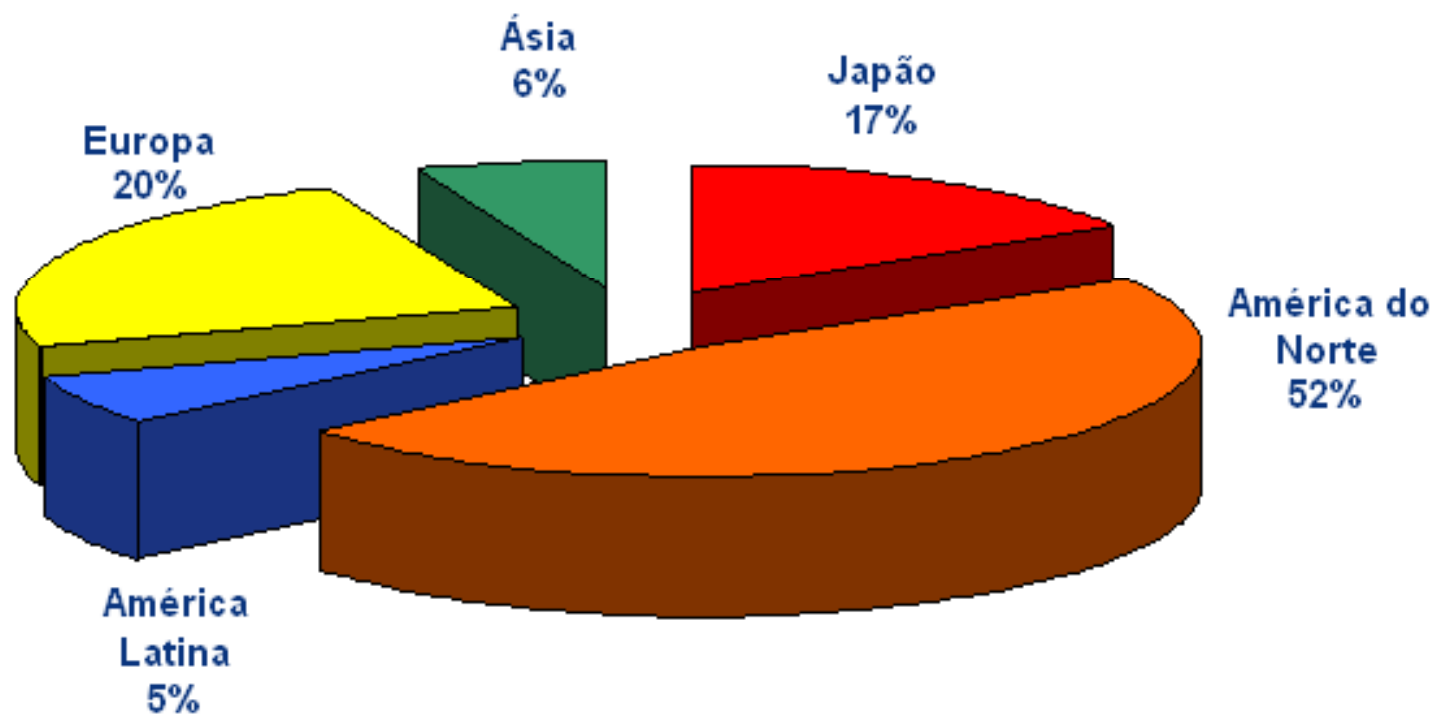
## Clinical studies



Adaptado de Joseph Lombardino



## Mercado farmacêutico mundial % participação por região



→ Brasil 10º lugar mundial com US\$ 15,7 bilhões ,em 2010, com ~20% de fármacos genéricos



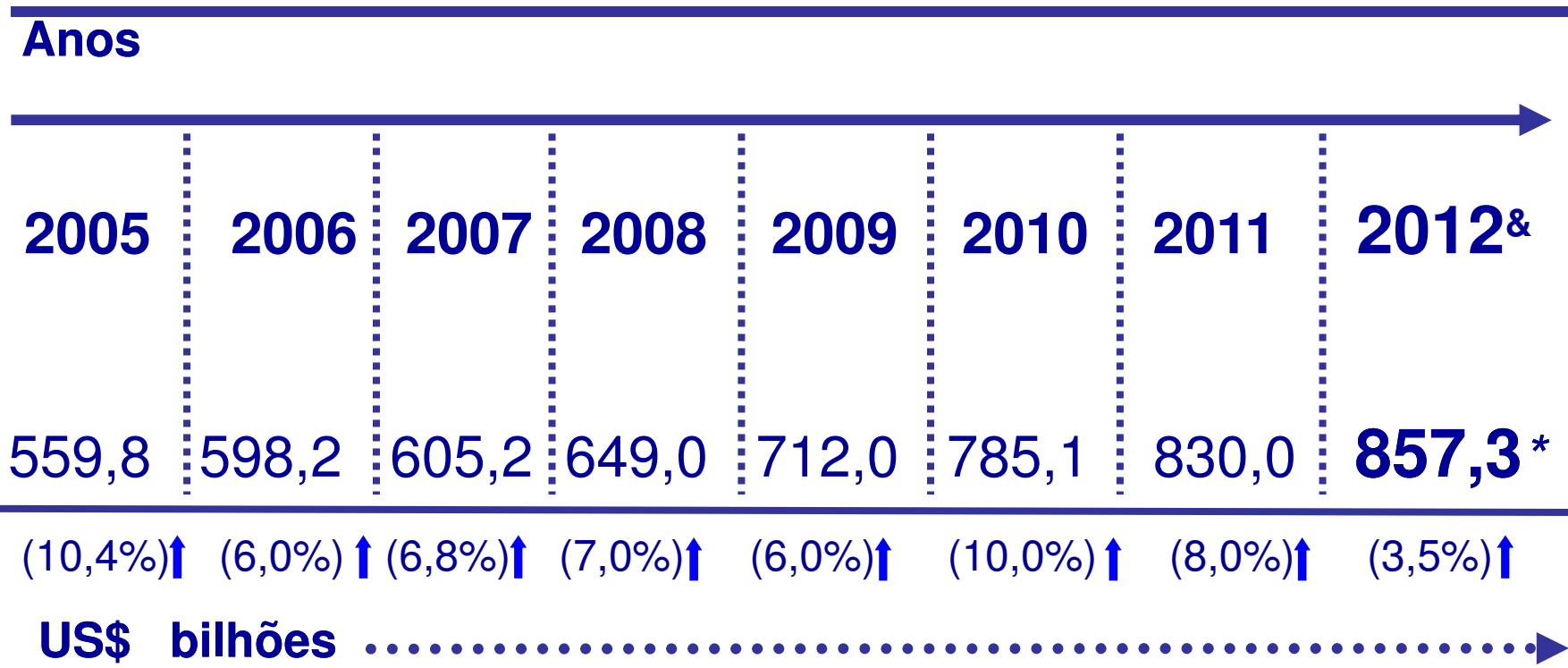


# Aspectos da Indústria Farmacêutica

- a indústria farmacêutica é *intensiva* em pesquisa → **inteligência** estratégica;
- força de trabalho com **postos qualificados**;
- padrão de **competição** = **novos fármacos**;
- **inovação tecnológica**, com *investimentos* em pesquisa e **desenvolvimento** (~ 8-10%);
- intensa atividade de **propriedade intelectual**;
- faturamento **em 2012** estimado em US\$ 895 bilhões.



# Mercado Farmacêutico Mundial



## América Latina:

*Brasil: 2,7% (10º lugar) = US\$ 17,7 bilhões (ca. >20%)*

*Top-10: Co's US\$ 362,2 bilhões (-1,2%) / Fárm. US\$ 76,7 (-2,3%)*

<sup>\*</sup> Fonte: R Mullin *C&EN*, 2012, 90 (Dez. 10), p.15-20 18

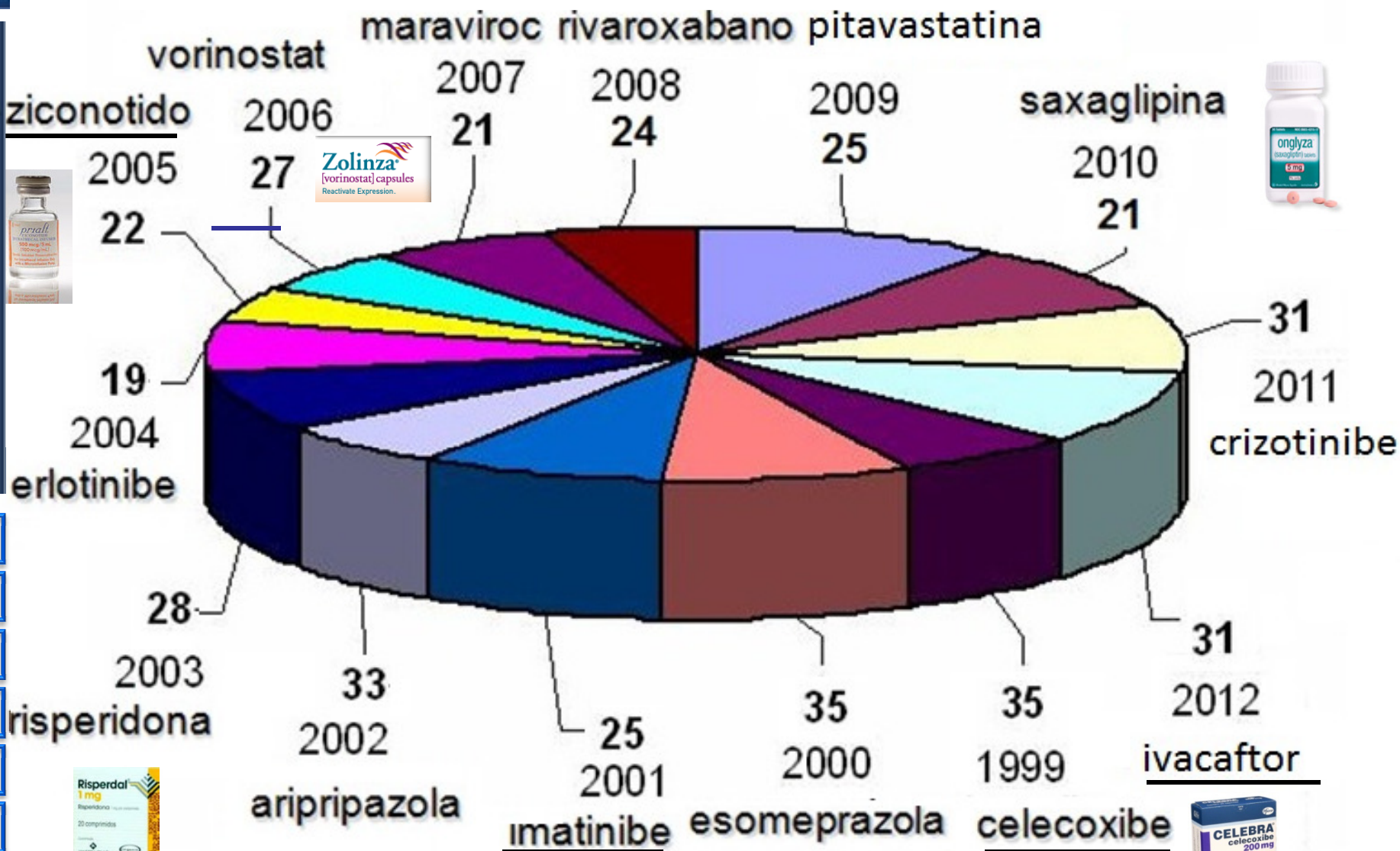
## & Principais classes terapêuticas:

- oncológicos** (6,0%)
- & anti-lipêmicos** (4,1%)



# Novos fármacos lançados por ano / 1999-2012

Universidade Federal do Rio de Janeiro



## Inovações terapêuticas

Fonte: Fonte: Annual Reports in Medicinal Chemistry, Market to Market, Volumes 35-47, ACS, 1999-2012





## Drug Discovery



## Drug Design

“Change is in the air for drug discovery.....

an *interdisciplinary* field at a time of transition.”

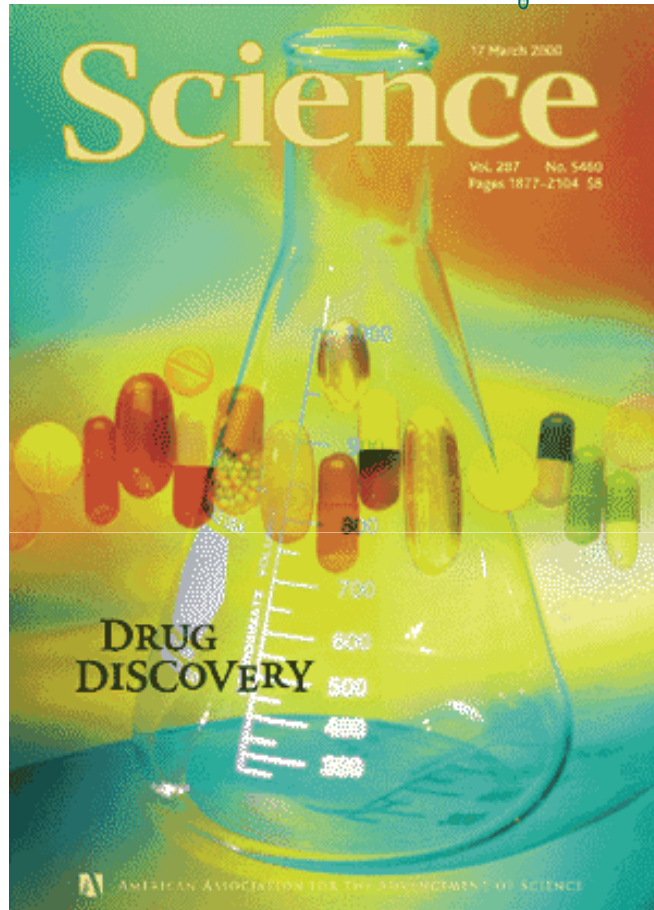
J. Uppenbrink & J. Mervis,  
*Science* 2000, 247, 1951

Special issue “Drug  
Discovery”

Science

( [www.sciencemag.org](http://www.sciencemag.org) )

# A invenção de fármacos ...



- *Science* **2000**, 287, 1951 (J.Uppenbrink & J.Mervis)



- *Science* **2004**, 303, 1713 (D. Kennedy)

...depende da pesquisa científica !

# O início ...



Antoine Laurent de Jussieu  
1748-1832

Os vegetais e sua  
"ordem admirável"

1811



**Farmacognosia**

é uma ciência multidisciplinar que contempla o estudo das propriedades físicas, químicas, bioquímicas e biológicas dos fármacos ou dos fármacos potenciais de origem natural assim como busca novos fármacos a partir de fontes naturais (Soc. Bras. Farmacognosia)

1789



François Magendie

1783-1855



*Formulaire*  
1827

Fisiologia experimental



**Farmacologia**



Joseph B. Caventou

1795-1877

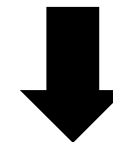


Pierre-Jean Robiquet  
1780-1840



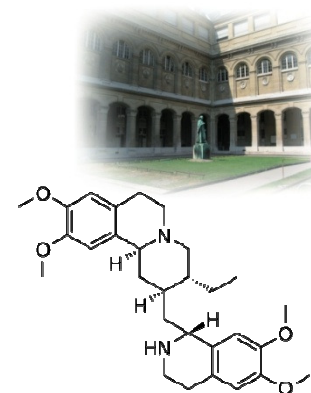
Pierre Joseph Pelletier

1788-1842



Substâncias  
puras

**Fitoquímica**

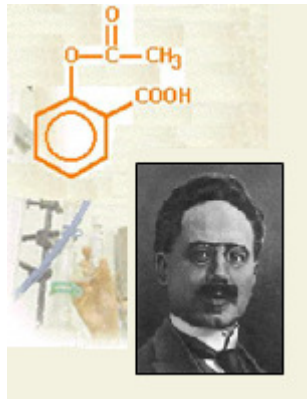




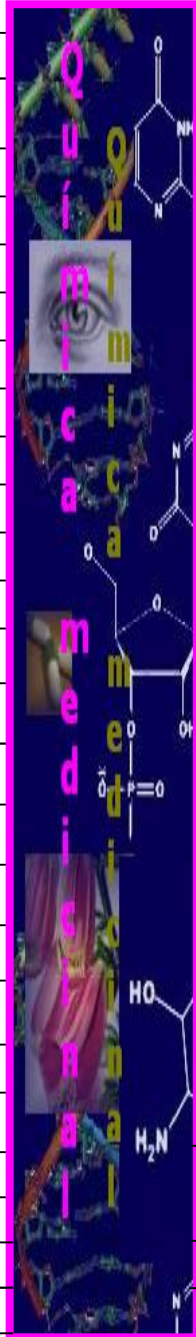
Universidade Federal do Rio de Janeiro

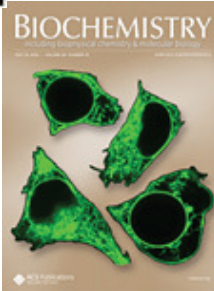


# Cronologia da descoberta de fármacos



Year	Drug(s)
1889	ozagrel mifepristona
1889	AAS *
1923	salmeterol, amlodipina
1923	barbitúricos
1934	alpidem, paroxetina
1934	cloroquina
1935	paclitaxel
1935	sulfonamidas
1942	tacrina, fanciclovir
1942	penicilina
1952	irinotecan, pimobendano
1952	nitrofurano
1953	indinavir, losartano
1953	progesterona
1954	docetaxel, atorvastatina
1954	talidomida
1958	zileuton, olanzapina
1958	haloperidol
1962	zafirlukast, montelukast
1962	verapamil
1963	infiximabe sildenafil efavirenz
1963	indometacina
1964	celecoxibe orlistate
1964	propranolol
1968	galantamina rofecoxibe
1968	salbutamol
1970	imatinibe rosiglitazona
1970	prostaglandinas
1970	oxamniquina
1975	voriconazola, etoricoxibe
1975	cimetidina nifedipina
1976	gefitinibe, aripiprazola
1976	atenolol
1977	rosuvastatina,
1977	captopril
1978	pregabalina, Caduet <sup>R</sup>
1978	tamoxifeno
1979	risperidona, erlotinibe
1979	praziquantel
1980	maraviroc, ambrisentan
1980	oxicams
1981	etravirina
1981	ranitidina aciclovir
1985	pivastatina
1985	mefloquina misoprostol
1986	fingolimod
1986	fluoxetina ciprofloxacina
1987	boceprevir, crizotinibe
1987	lovastatina zidovudina
1988	apixaban, tofacitinibe
1988	cetirizina, enalapril





Biochemistry 1987, 26, 6888–6891

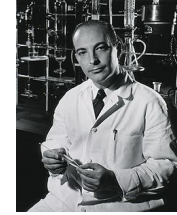
## The Two Cultures: Chemistry and Biology<sup>1</sup>

Arthur Kornberg

Department of Biochemistry, Stanford University, Stanford, California 94305

Received July 14, 1987

Prêmio Nobel, 1959



**Arthur Kornberg**  
1918-2007

**M**uch of life can be understood in rational terms if expressed in the language of chemistry. It is an international language, a language for all of time, and a language that explains where we came from, what we are, and where the physical world will allow us to go. Chemical language has an aesthetic beauty that links the physical sciences to the biological sciences. Unfortunately, the failure to communicate between the two disciplines has driven chemistry from biology.

**Interdisciplinaridade**

<sup>1</sup> Adapted from a lecture at a meeting of the American Association for the Advancement of Science in Chicago on Feb 16, 1987.

*“...the historical roots of*

**chemistry and biology**

*are intertwined in many places...*

**Pharmaceutical chemistry was until recently the bastion of organic chemistry...**

**in the search for alternative or superior drugs for the treatment of various diseases...”**

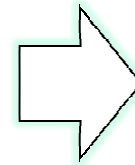


University of Stanford

# Ecônomoia do conhecimento



**Indústria farmacêutica**



**Fármaco**

Capacidade tecnológica || Capacidade industrial

**Mercado**

**Universidade**  
Formação científica  
=  
Curso superior

**Postos de trabalho qualificados**

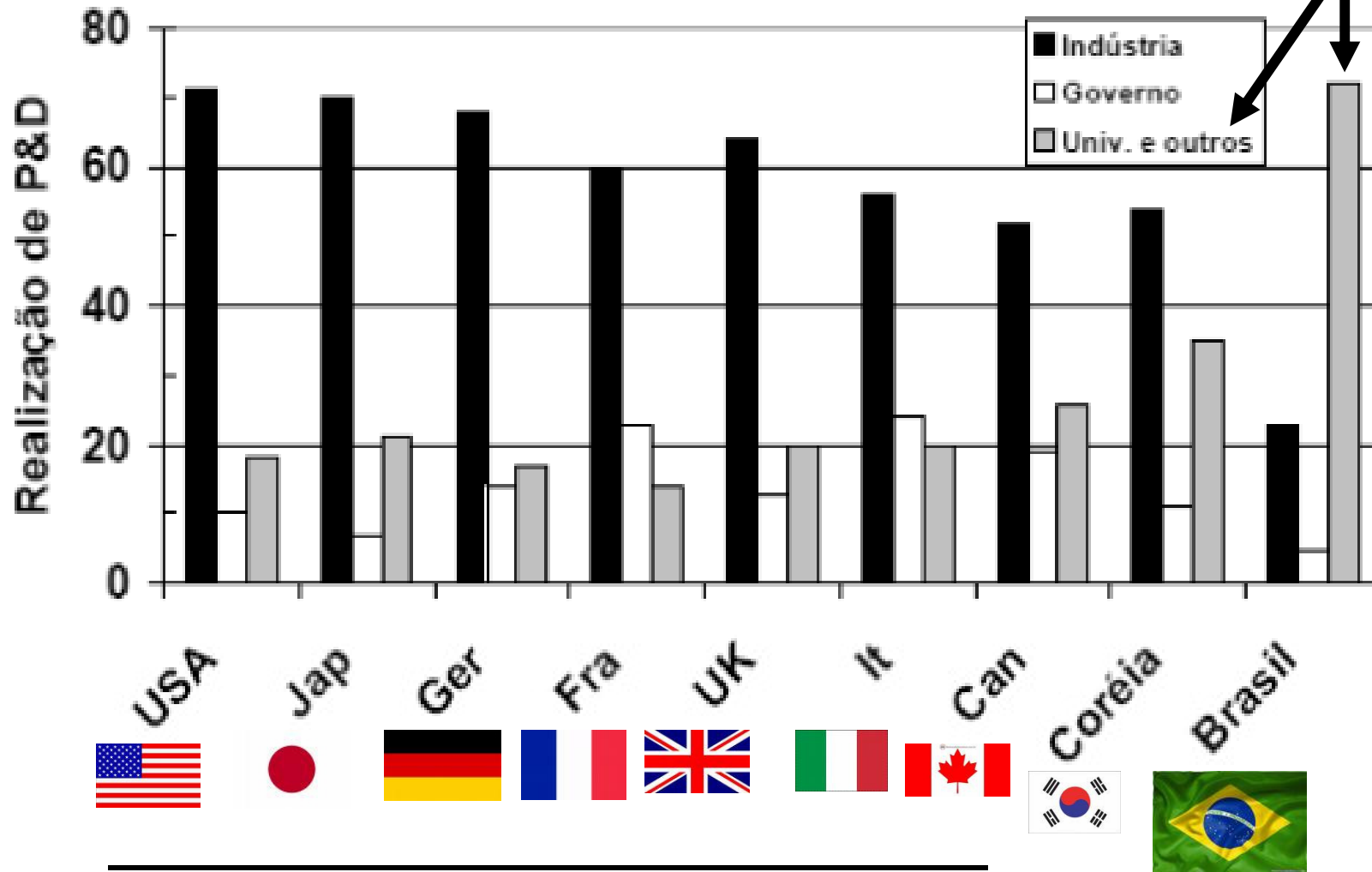
**Inovação**



**Propriedade intelectual**



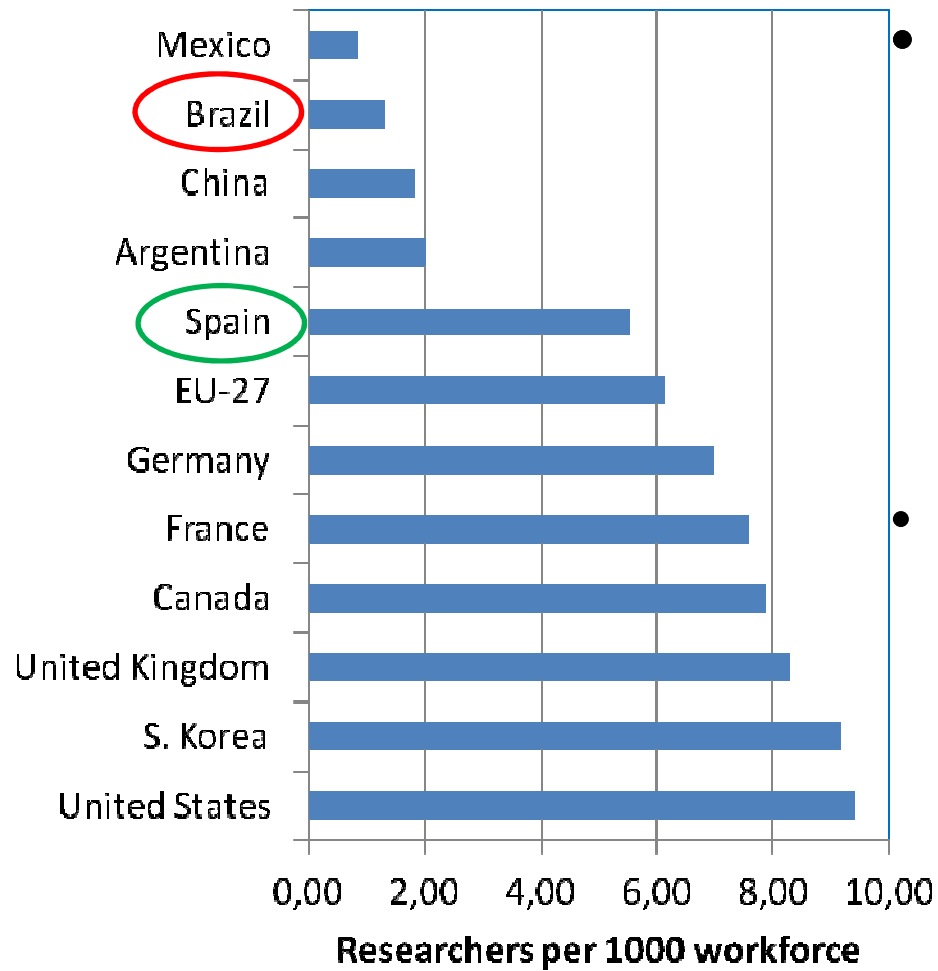
# Aonde se faz pesquisa ?



Adaptado de C. H. Brito Cruz & C. A. Pacheco, "Conhecimento & Inovação: Desafios do Brasil no Século XXI", em [www.inovacao.unicamp.br/report/intc-pacheco-brito.pdf](http://www.inovacao.unicamp.br/report/intc-pacheco-brito.pdf) (2/01/2009)



# Densidade de pesquisadores no Brasil



- 133 mil pesquisadores no Brasil
  - 57% em universidades
  - 37% em empresas
    - PINTEC 2010 mostra diminuição do número de pesquisadores em empresas
- Pesquisadores ativos
  - Brasil tem
    - 1/3 da Espanha;
    - menos de 1/4 da Coréia



# Inovações farmacêuticas

*propranolol*

*cimetidina*

*captopril*

*celecoxibe*

*atorvastatina*

*indinavir*

*losartana*

*imatinibe*

*sildenafil*

*maraviroc*

Química Medicinal

Química Medicinal

Química Medicinal

Química Medicinal

Química Medicinal

Química Medicinal

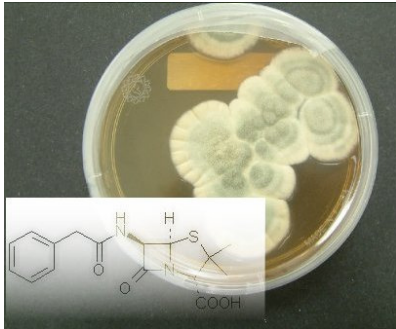
Química Medicinal

Química Medicinal

Química Medicinal



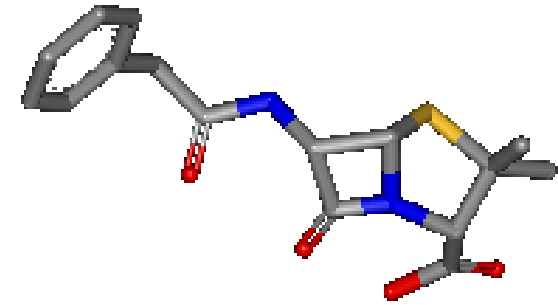
# Os fármacos e o Nobel !



■ 196 pesquisadores  
ganharam o Prêmio  
Nobel de Medicina  
(1901-2010)



**Alexander Fleming**  
1881-1955



**Penicilina**



**Howard W. Florey**  
1898-1968



<http://nobelprize.org>

**1945**



**Ernest B. Chain**  
1906-1979

# Uma descoberta marcante...



**Ernest Duchesne**

(1874 – 1912)

1896 - Médico na *Ecole du Service de Santé Militaire de Lyon*, com tese intitulada “*Contribution à l’étude de la concurrence vitale chez les micro-organismes: antagonisme entre les moisissures et les microbes*”, 1897

*Penicillium glaucum*



**Howard Florey**

(1898 – 1968)

**Ernst B Chain**

(1906 – 1979)

(1911 – 2004)

**Norman G Heatley**

(1899 – 1959)



**John C Sheehan**

(1915 – 1992) – Síntese total da penicilina (MIT, 1957)



**Alexander Fleming**

(1881 – 1955)

1928 - St. Mary's Hospital em King Cross, Londres

Prêmio Nobel de Medicina em 1945

1939 – Un Oxford equipe envolvida nos estudos de substâncias antibacterianas de fungos

Prêmio Nobel de Medicina em 1945

1942 – Un Oxford elucidada a estrutura por difração de raios-X

Prêmio Nobel de Química em 1964



**Dorothy C Hodgkin**

(1910 – 1995)

## Alexander von Humboldt



1769 - 1859

Existem três estágios  
para a descoberta  
científica:

Primeiro, as pessoas  
duvidam que seja  
verdade, em seguida,  
elas negam que seja  
importante e finalmente  
elas a creditam à pessoa  
errada.

Idéia



**" Success isn't about finding the best idea.  
It's about doing something with it. "**

# Criatividade

Abstração



C

H

N

O

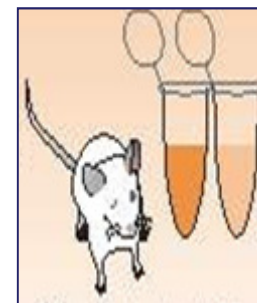
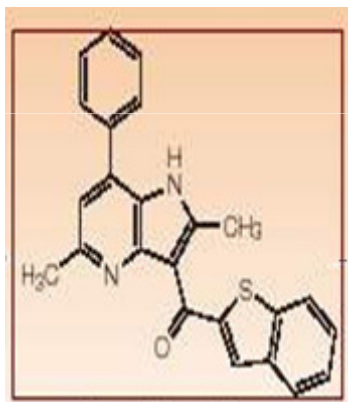
S

F

Cl

Método

Experiência



Am J Physiol 1948, 153, 586



Raymond Ahlquist (1914)

## A STUDY OF THE ADRENOTROPIC RECEPTORS

RAYMOND P. AHLQUIST

*From the Department of Pharmacology, University of Georgia School of Medicine*

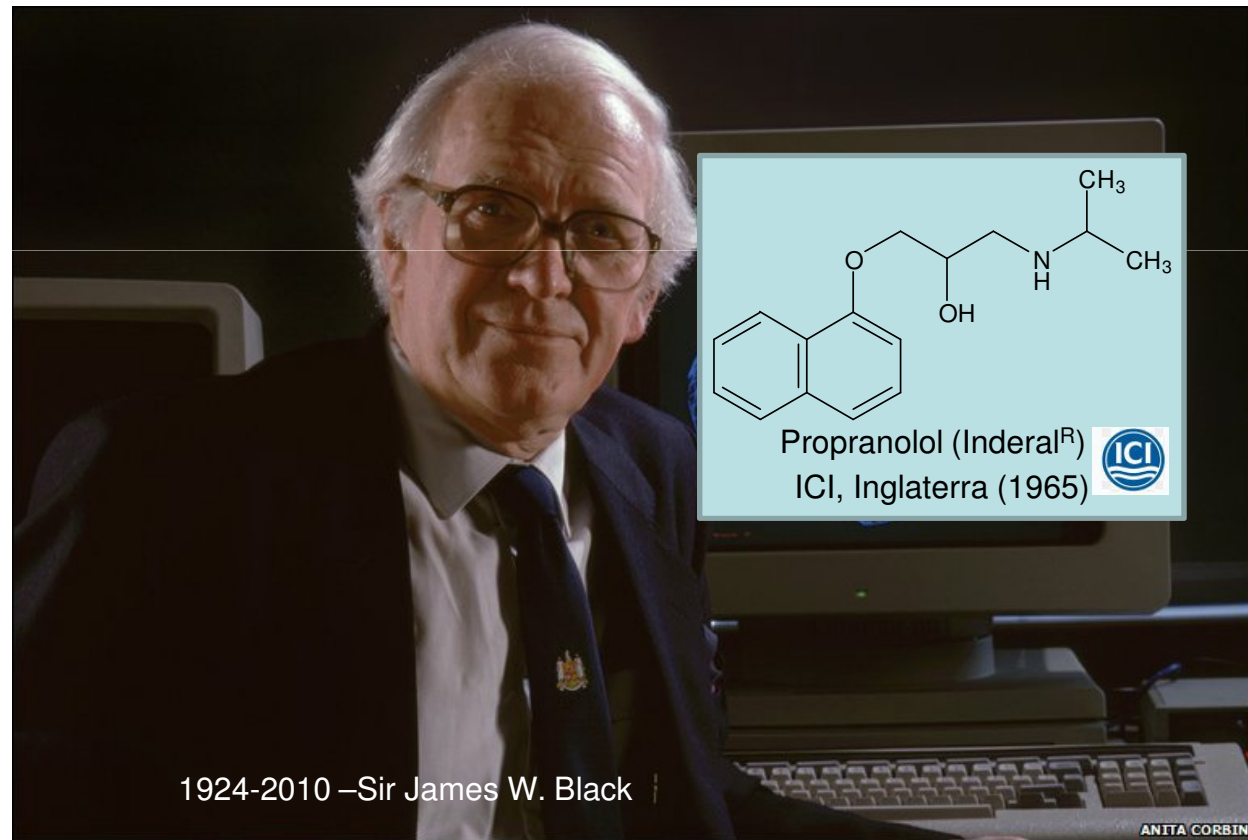
AUGUSTA, GEORGIA



1905 – Henry Dale



**Premio Nobel  
1988**



R Ganellin, W Duncan, Obituary James Black (1924-2010), *Nature* **2010**, 464, 1292; CPPage, J Schaffhausen, NP Shankley, The scientific legacy of Sir James W. Black, *TiPS* **2011**, 32, 181;

# Atorvastatina

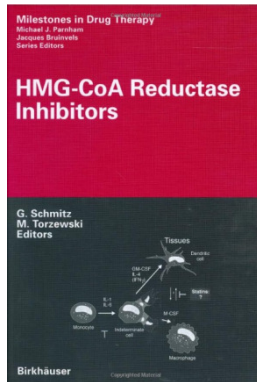


1985 - Bruce Roth



# Estatinas

Top \$elling  
drug in hi\$tory



Premio Nobel  
1985

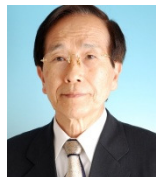


JL Goldstein MS Brown



Inovação  
radical

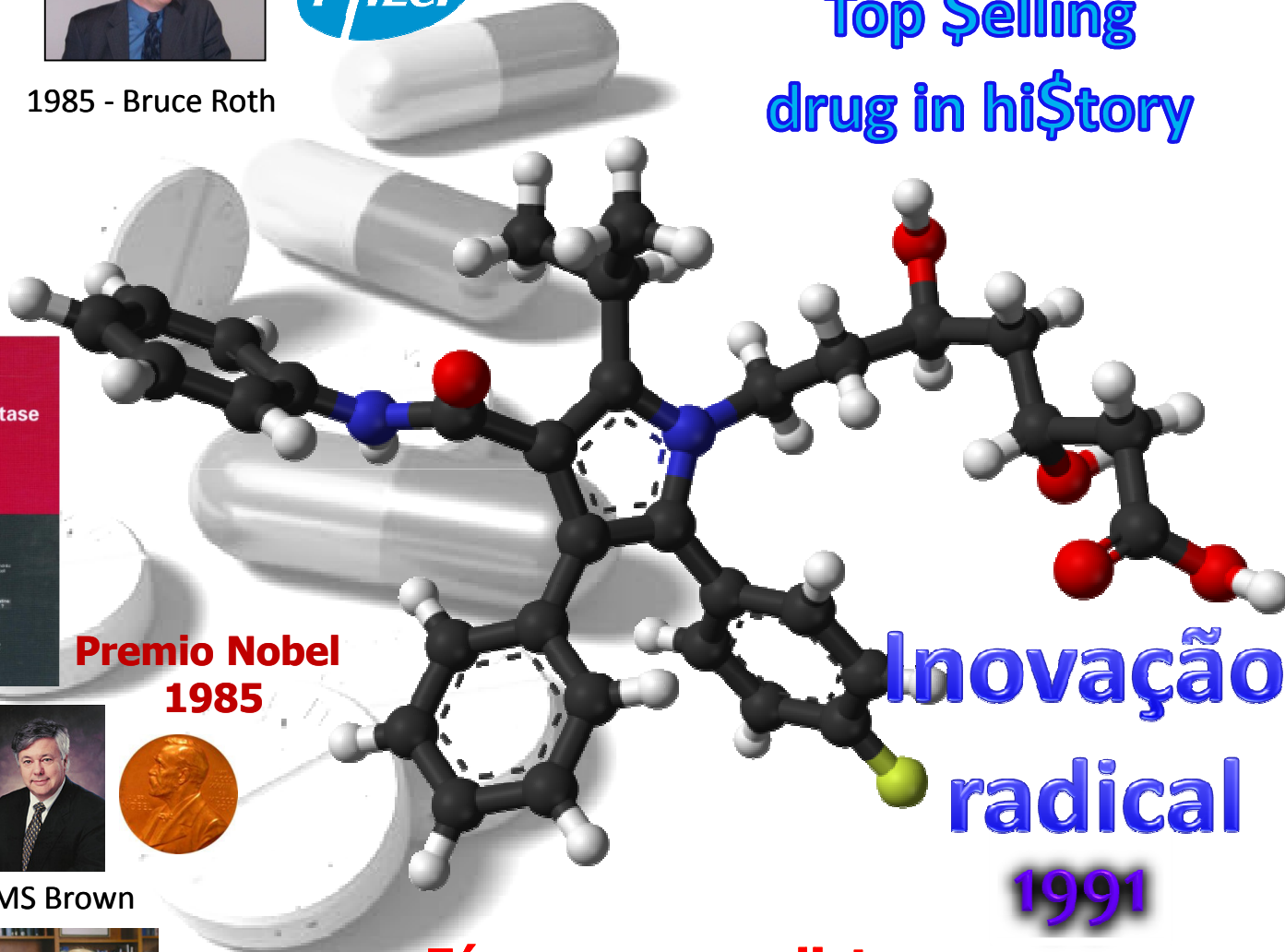
1991



A Endo AA Patchett



Fármaco recordista  
mundial em vendas:  
US\$ 150 bilhões





**veja**  
www.veja.com.br

**IMPOTÊNCIA  
DIABETES  
AIDS  
DEPRESSÃO  
COLESTEROL ALTO  
DORES**

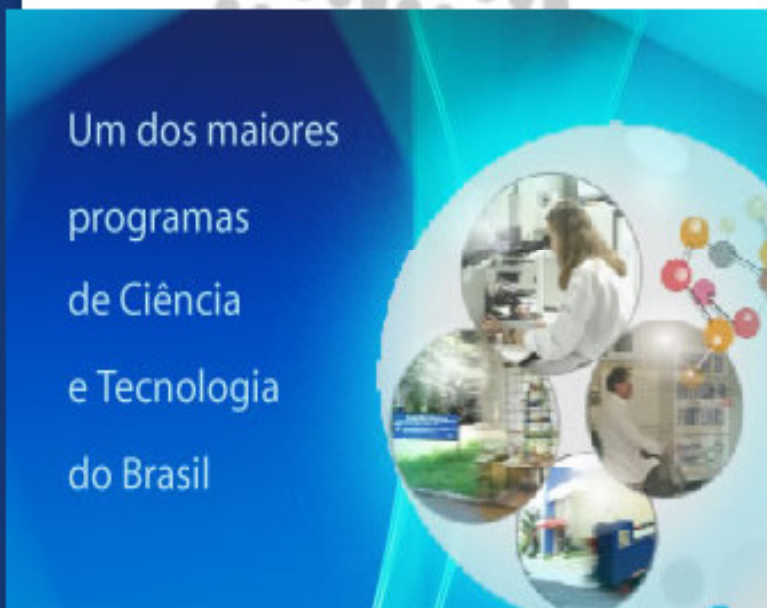
A revolução no tratamento  
desses males na era dos

**SUPER-REMÉDIOS**





- ▶ Apresentação
- ▶ Institutos
- ▶ Notícias
- ▶ Contato



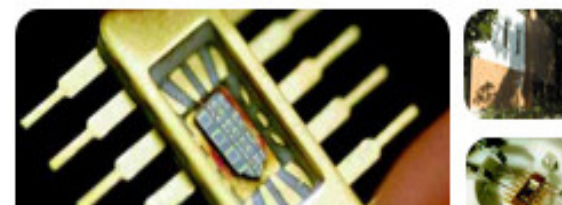
São 122 os INCT's;  
19 no ERJ !

### ▶ Notícias

[Pesquisadores do IICT de Astrofísica publicam 100 artigos em oito meses](#)

[UFMG faz pesquisa pioneira para tratamento da dengue](#)

[IICT de Fixação Biológica de Nitrogênio promove simpósio internacional em setembro](#)





# Sumário

desta  
apresentação

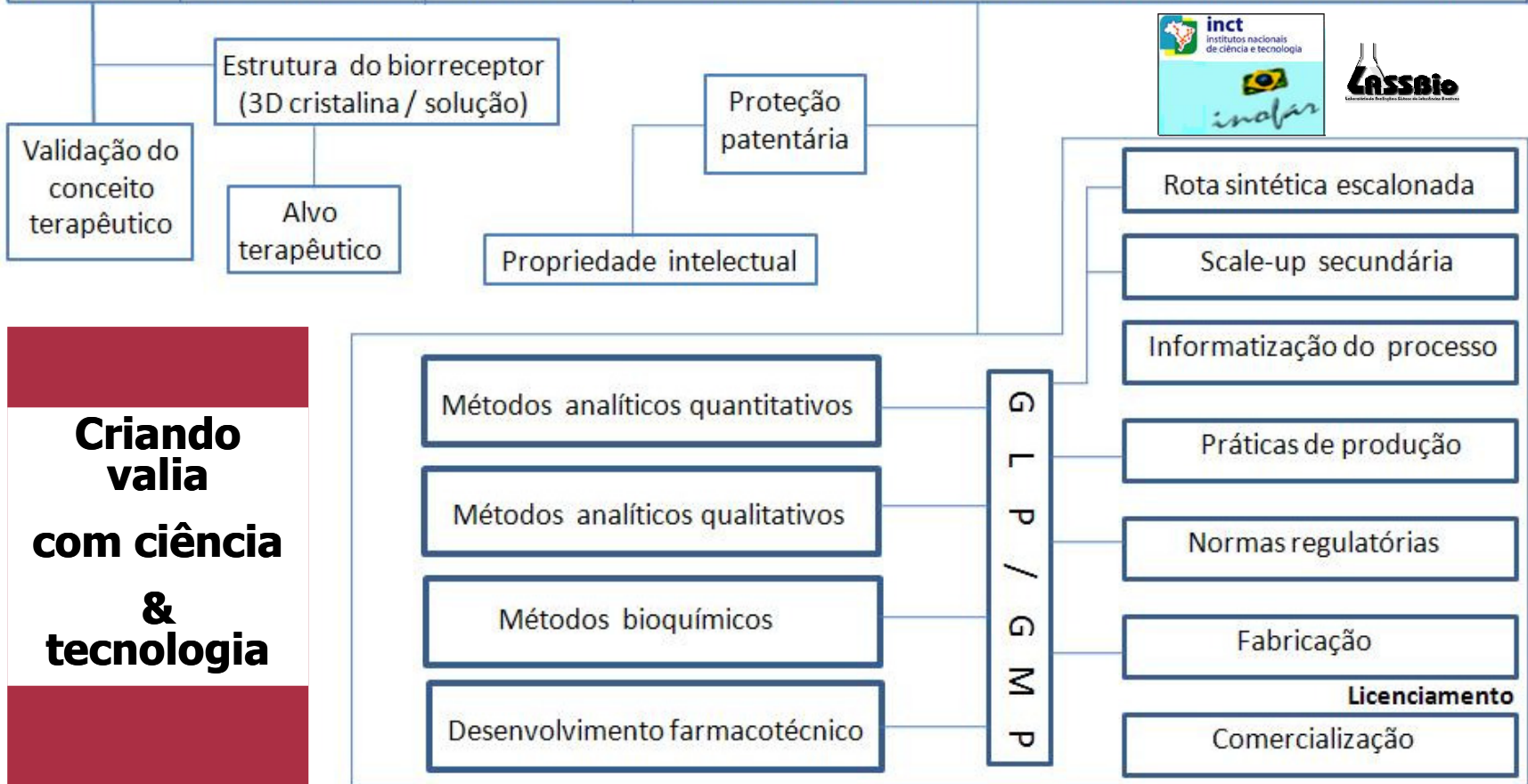
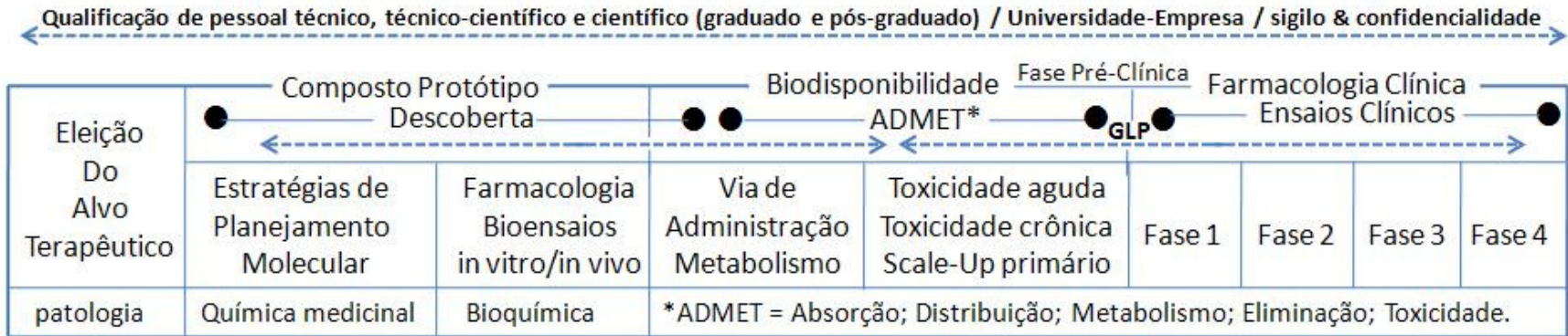


INCT DE FÁRMACOS E MEDICAMENTOS  
INCT-INOVAR

- Preâmbulo
- Missão do INCT-INOVAR
- Comitê de Governança & Acompanhamento (CGA)
- Competências regionais & equipes de pesquisa associadas
- Cadeia de inovação em fármacos:
  - Oportunidades na inovação radical
  - Oportunidades na inovação incremental
- Considerações finais



# Cadeia de inovação em fármacos e medicamentos



**Criando  
valia  
com ciência  
&  
tecnologia**





# Visão atual da cadeia de Inovação em fármacos

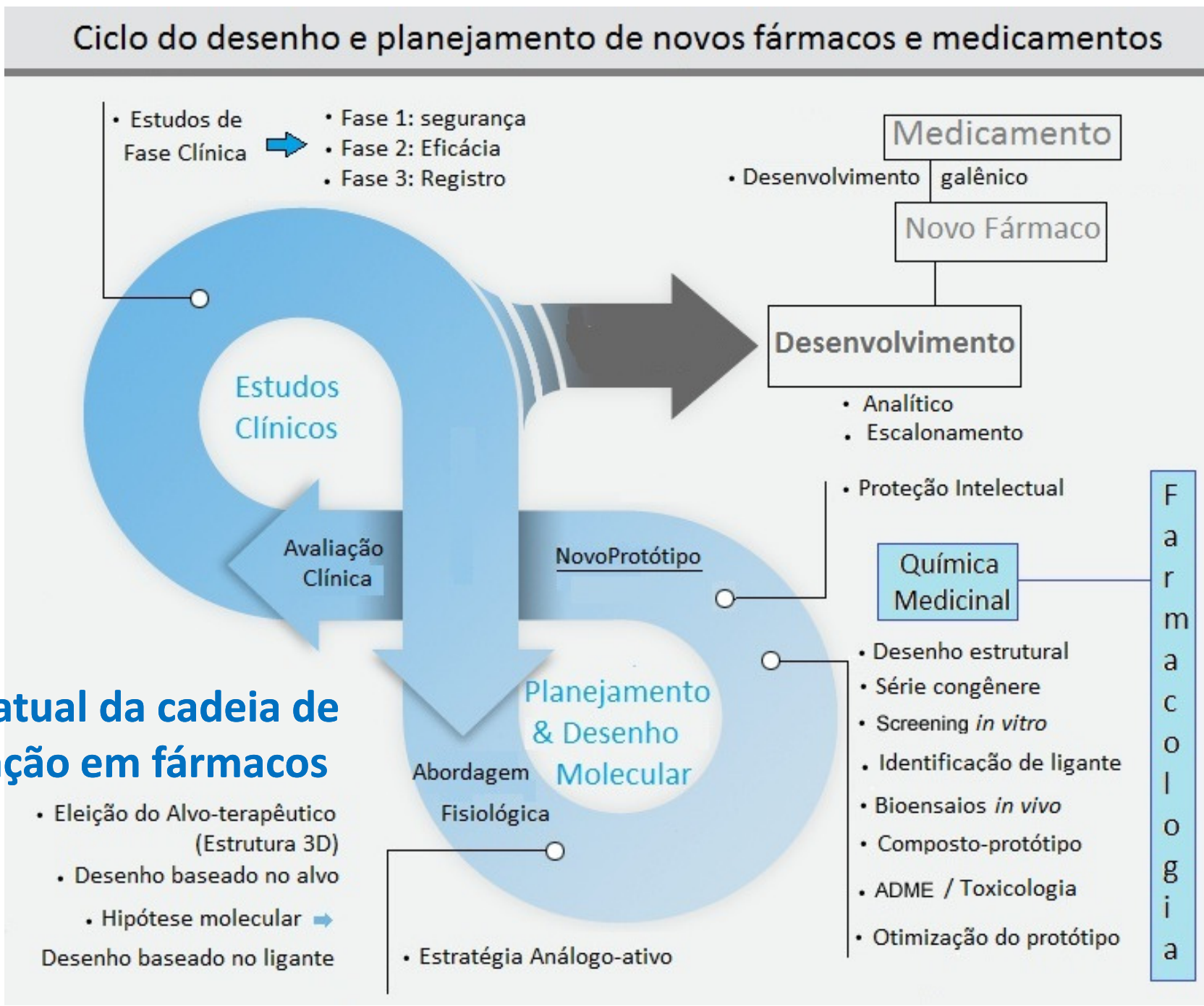


Figura adaptada do Website da Eli Lilly Co.



 **inct**  
 **inofar**

instituto nacional de Fármacos e Medicamentos  
de ciência e tecnologia

www.inct-inofar.ccs.ufrj.br



Project CNPq 573.564/2008-6

- Home
- INCT-INOVAR
- Team
- Scientific adviser board (SAB)
- Research groups
- Research people
- Useful articles
- Publications
- Meetings
- Videos

## A missão do INCT-INOVAR

- Organizar as competências científicas nacionais em uma rede efetiva de pesquisa em fármacos;
- Apoiar projetos de pesquisa científica multi-institucionais voltados para novos fármacos;
- Contribuir para a inovação incremental e radical em novos fármacos e genéricos;
- Estudar e desenvolver a síntese total de genéricos, intermediários avançados e matérias-primas;
- Contribuir para a formação científica qualificada de pessoal em química medicinal & farmacologia;
- Promover a divulgação das ciências dos fármacos e dos medicamentos, assim como seu uso racional e seguro;



## WORKSHOP INAUGURAL

Por Lúcia Beatriz Torres

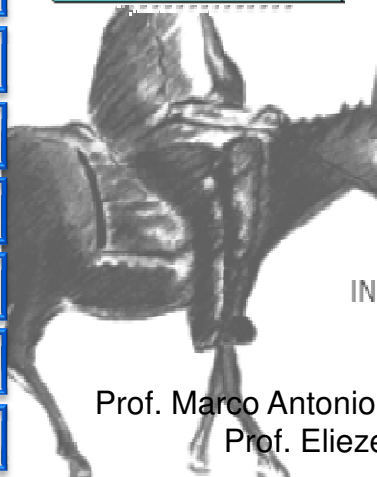
### **INCT de Fármacos e Medicamentos reúne lideranças científicas para traçar Plano de Metas 2009**

*Presidentes do CNPq e FAPERJ participaram do Workshop Inaugural realizado no RJ*

Herdeiro científico do Instituto do Milênio Inovação e Desenvolvimento de Fármacos e Medicamentos (IM-INOFAR), o Instituto Nacional de Ciência e Tecnologia de Fármacos e Medicamentos (INCT-INFOAR) realizou, em 06 de março de 2009, o seu Workshop Inaugural, na cidade do Rio de Janeiro.

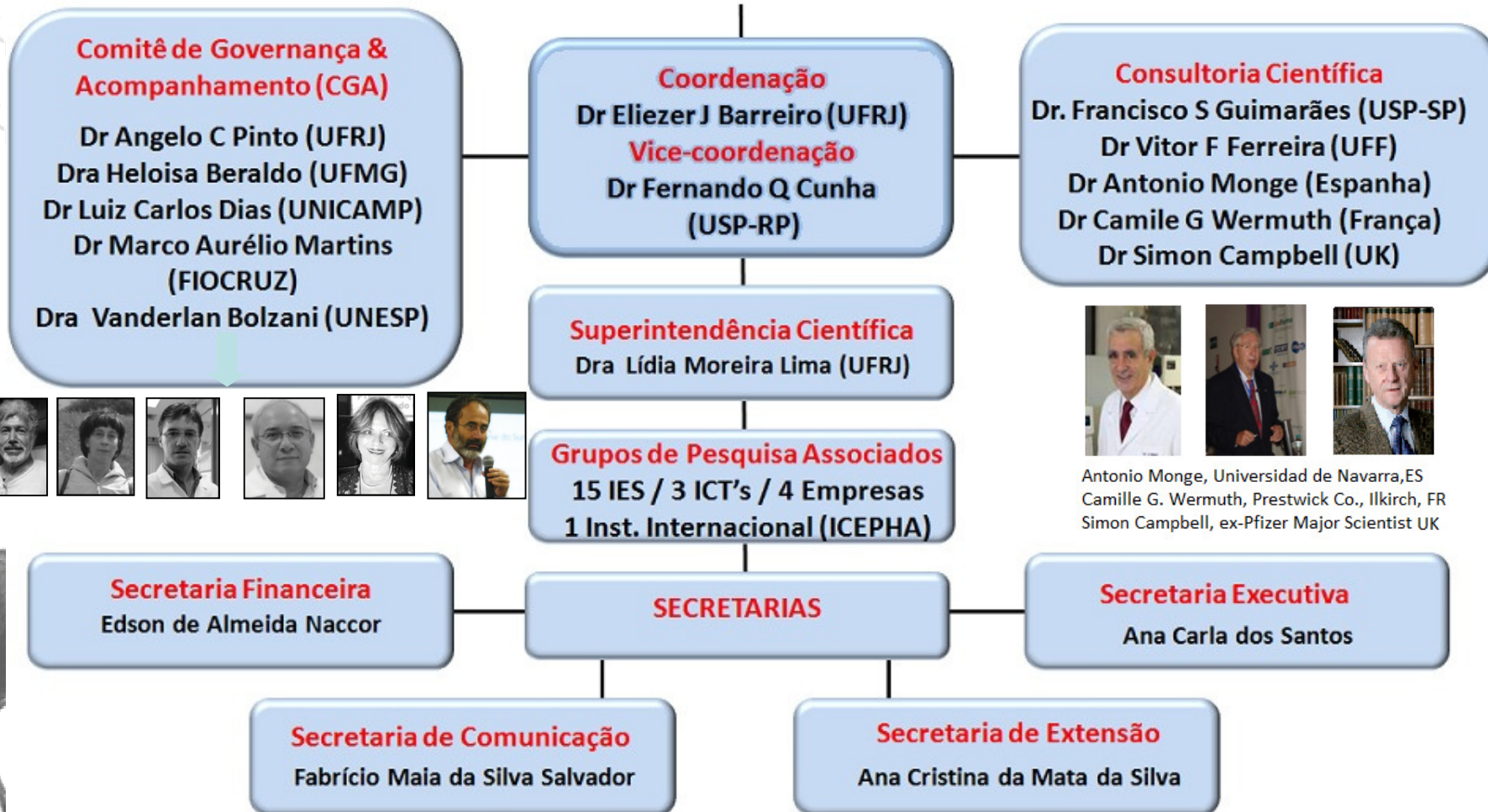


Prof. Marco Antonio Zago, Presidente do CNPq; Prof. Fernando de Q. Cunha, Vice-Coordenador do INCT-INNOFAR; Prof. Eliezer J. Barreiro, Coordenador do INCT-INFOAR; Prof. Ruy Garcia, Presidente da FAPERJ.





# Estrutura organizacional



Antonio Monge, Universidad de Navarra, ES  
Camille G. Wermuth, Prestwick Co., Ilkirch, FR  
Simon Campbell, ex-Pfizer Major Scientist UK

# Governance Committee



From left to right: Professor Angelo da Cunha Pinto (Institute of Chemistry, UFRJ) , Professor Fernando Q ueiroz Cunha (Vice-Coordinator), Faculty of Medicine, USP-RP), Professor Luis Carlos Dias (Institute of Chemistry, UNICAMP), Professor Eliezer J. Barreiro (Coordinator, LASSBio, UFRJ), Professor Vanderlan da S. Bolzani (Institute of Chemistry, UNESP), Professor Lidia M. Lima (LASSBio, UFRJ), Dr Simon Campbell (External Advisor), Professor Heloisa O Beraldo (Institute of Chemistry, UFMG), Professor Marco Aurélio Martins (FIOCRUZ-RJ).



# Laboratórios associados



# Laboratórios associados

Siquim / COPPE-UFRJ



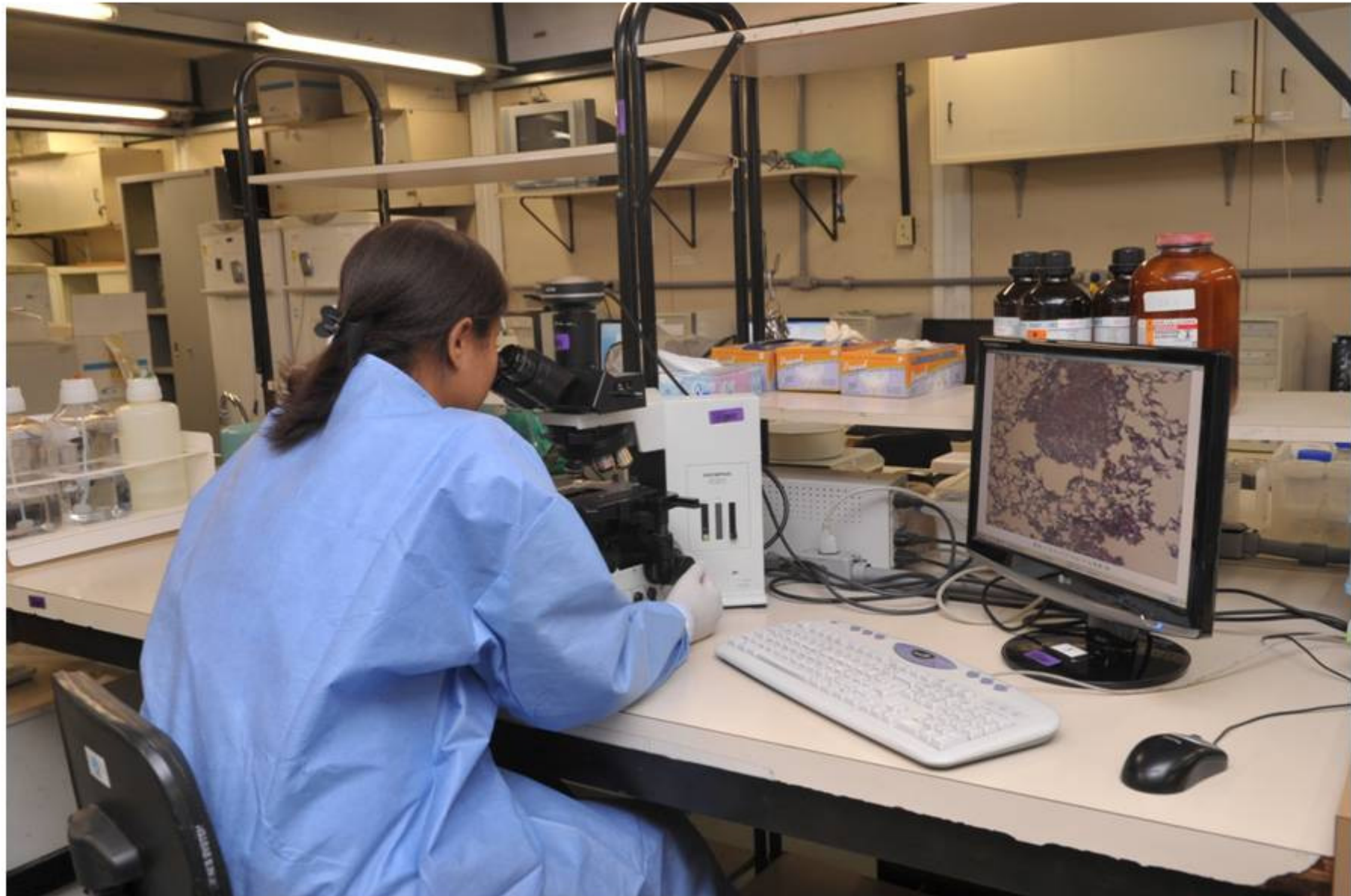
# Laboratórios associados



# Laboratórios associados



# Laboratórios associados



Avaliação histológica e estereologia pulmonar – Laboratório de Inflamação – IOC-FIOCRUZ.



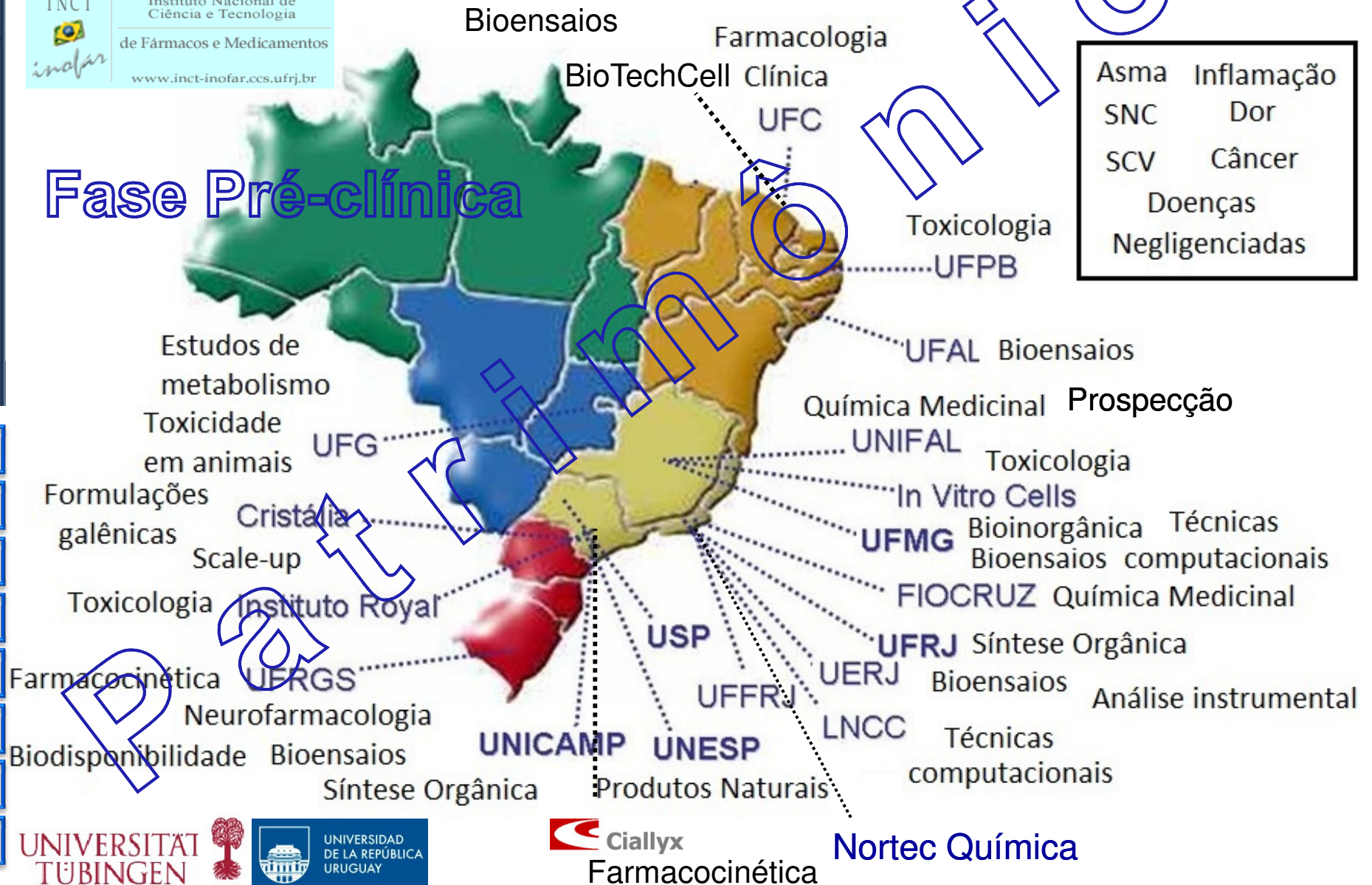
# Parcerias Estratégicas para Inovar

Universidade Federal do Rio de Janeiro

INCT  
 Instituto Nacional de  
 Ciência e Tecnologia  
 de Fármacos e Medicamentos  
 www.inct-inofar.ccs.ufrj.br

## Fase Pré-clínica

- 
- 
- 
- 
- 
- 
- 
- 



Asma	Inflamação
SNC	Dor
SCV	Câncer
	Doenças Negligenciadas





Universidade Federal do Rio de Janeiro



# Pesquisadores líderes associados



Fernando de Queiroz Cunha – Professor Titular – USP/RP, SP  
 Angelo da Cunha Pinto – Professor Titular – UFRJ, RJ  
 Francisco Radler de Aquino Neto – Professor Titular – UFRJ, RJ  
 Marco Aurélio Martins – Pesquisador Titular – FIOCRUZ, RJ  
 Patrícia Rieken Macedo Rocco – Professor Titular – UFRJ, RJ  
 Ronaldo de Albuquerque Ribeiro – Professor Associado – UFC, CE

Heloisa de Oliveira Beraldo – Professor Titular – UFMG, MG  
 Luiz Carlos Dias – Professor Titular – UNICAMP, SP  
 Vanderlan da Silva Bolzani – Professor Titular – UNESP/Araraquara, SP  
 Thereza Christina Barja-Fidalgo – Professor Associada – UERJ, RJ  
 Manoel Odorico de Moraes Filho – Professor Titular – UFC, CE

Carlos Alberto Manssour Fraga – Professor Titular – UFRJ, RJ  
 François Germain Noel – Professor Titular – UFRJ, RJ

## Colaboradores internacionais

Professor Hugo Cerecetto  
 Professor Stefan Laufer



MEDICAMENTOS

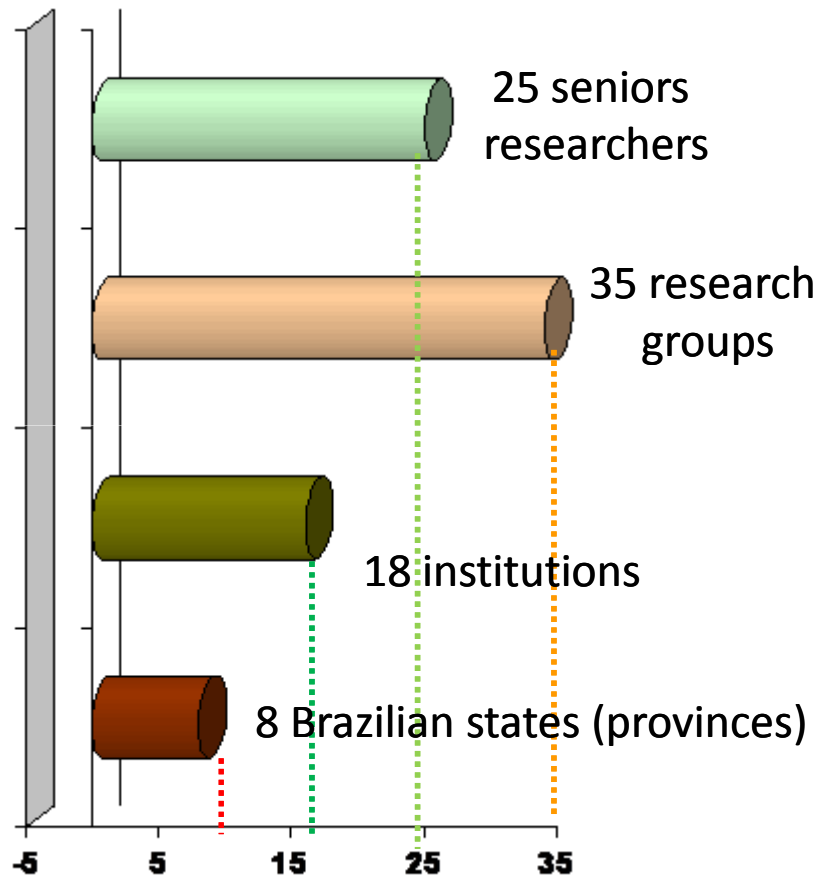
Adelaide Maria de Souza Antunes – Professor Titular – UFRJ, RJ  
 Gisele Zapata Sudo – Professor Associada – UFRJ, RJ  
 Roberto Takashi Sudo – Professor Titular – UFRJ, RJ  
 Stela Maris Kuze Rates - Professor Associada III – UFRGS, RS  
 Carlos Mauricio Rabello de Sant'Anna – Professor Associado III – UFRRJ, RJ  
 Margareth de Fátima Formiga Melo Diniz – Professor Associado – UFPB, PB  
 Francisco José R. Paumgarten - Pesquisador Titular III - ENSP/FIOCRUZ, RJ  
 Lídia Moreira Lima – Professora Associada I – UFRJ, RJ

Cláudio Viegas Jr – Professor Adjunto IV – UNIFAL, MG  
 Valeria de Oliveira – Professor Associada I – UFG, GO  
 Ricardo Menegatti – Professor Adjunto III – UFG, GO  
 Magna Suzana Alexandre Moreira – Professor Adjunta III – UFAL, AL

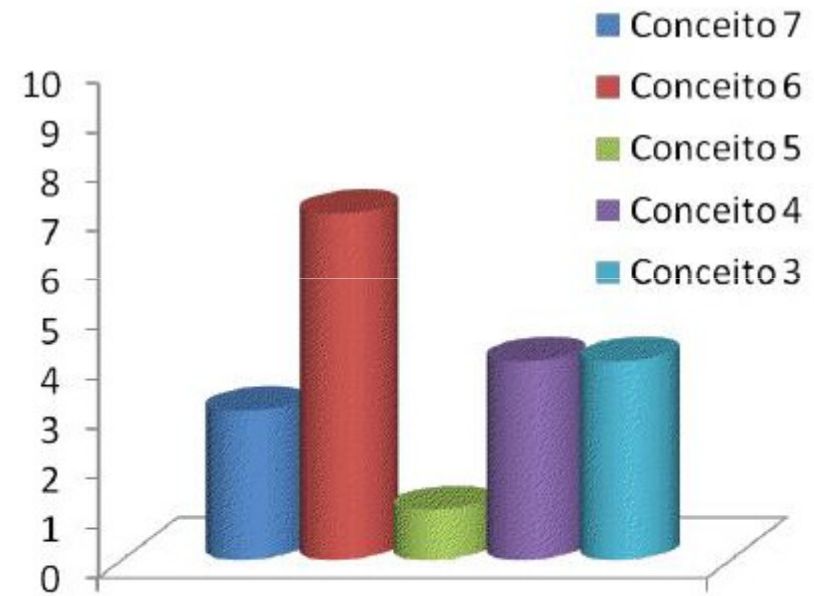
## Empresas associadas



# A equipe do INCT-INOVAR





Graduate Programs Associated

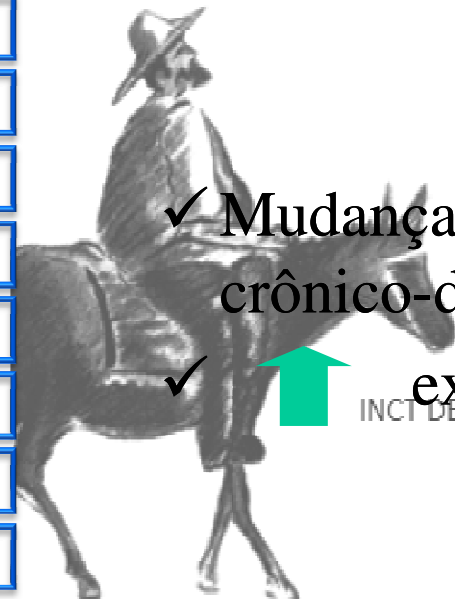




- ✓ Tendência à estagnação em mercados maduros e dinamismo nos emergentes
- ✓ Expiração de patentes ( $\Rightarrow$  US\$ 89 bilhões em vendas até 2015) e esvaziamento de pipelines
- ✓ Grandes empresas buscando novas plataformas tecnológicas e mercados emergentes
- ✓ Aumento dos custos de P&D e recente redução do número de lançamentos de novos medicamentos provenientes da rota química – Innovation Gap.

Ano	Tecnologia	
	Química	Biotecnologia
2008	24	0
2009	19	6
2010	15	6

- ✓ Mudança epidemiológica: maior incidência de doenças crônico-degenerativas (câncer, Alzheimer)
- ✓  expectativa de vida,  qualidade de vida





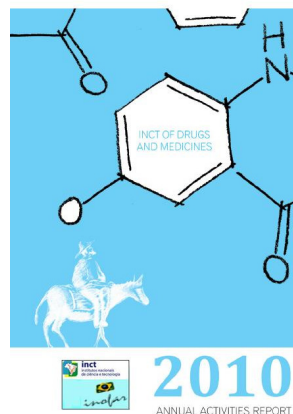
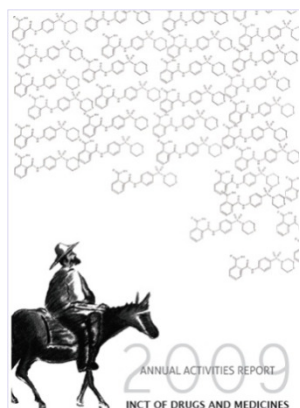
Universidade Federal do Rio de Janeiro



# Resultados: Inovação radical

## Annual Activities Report

(Relatórios públicos)



- [www.inct-inofar.ccs.ufrj.br/download/aar/2009.pdf](http://www.inct-inofar.ccs.ufrj.br/download/aar/2009.pdf)
- [www.inct-inofar.ccs.ufrj.br/download/aar/2010.pdf](http://www.inct-inofar.ccs.ufrj.br/download/aar/2010.pdf)
- [www.inct-inofar.ccs.ufrj.br/download/aar/2011.pdf](http://www.inct-inofar.ccs.ufrj.br/download/aar/2011.pdf)
- [www.inct-inofar.ccs.ufrj.br/download/aar/2012.pdf](http://www.inct-inofar.ccs.ufrj.br/download/aar/2012.pdf)



Study of the anti-inflammatory effect of LASSBio-897 on chronic lung diseases in mice  
Laboratory of Inflammation  
FIOCRUZ, RJ

Discovery of novel anticancer drug candidates designed as novel combretastatin A4 analogues LASSBio-UFRJ / FM-UFC  
**BR 10 2012 007619 5**

Antileishmanial activity of new *N*-acylhydrazone derivatives and analogues  
ICB-UFAL / LASSBio-UFRJ  
**BR 10 2012 019095 8**

*N*-Phenylpiperazine derivatives as prototypes to develop new atypical antipsychotic drugs  
FF-UFRGS / LASSBio-UFRJ

Discovered y of novel anti-inflammatory drug candidates designed as p38 MAPK inhibitor  
Fiocruz/ LASSBio-UFRJ  
**WO2012054996**

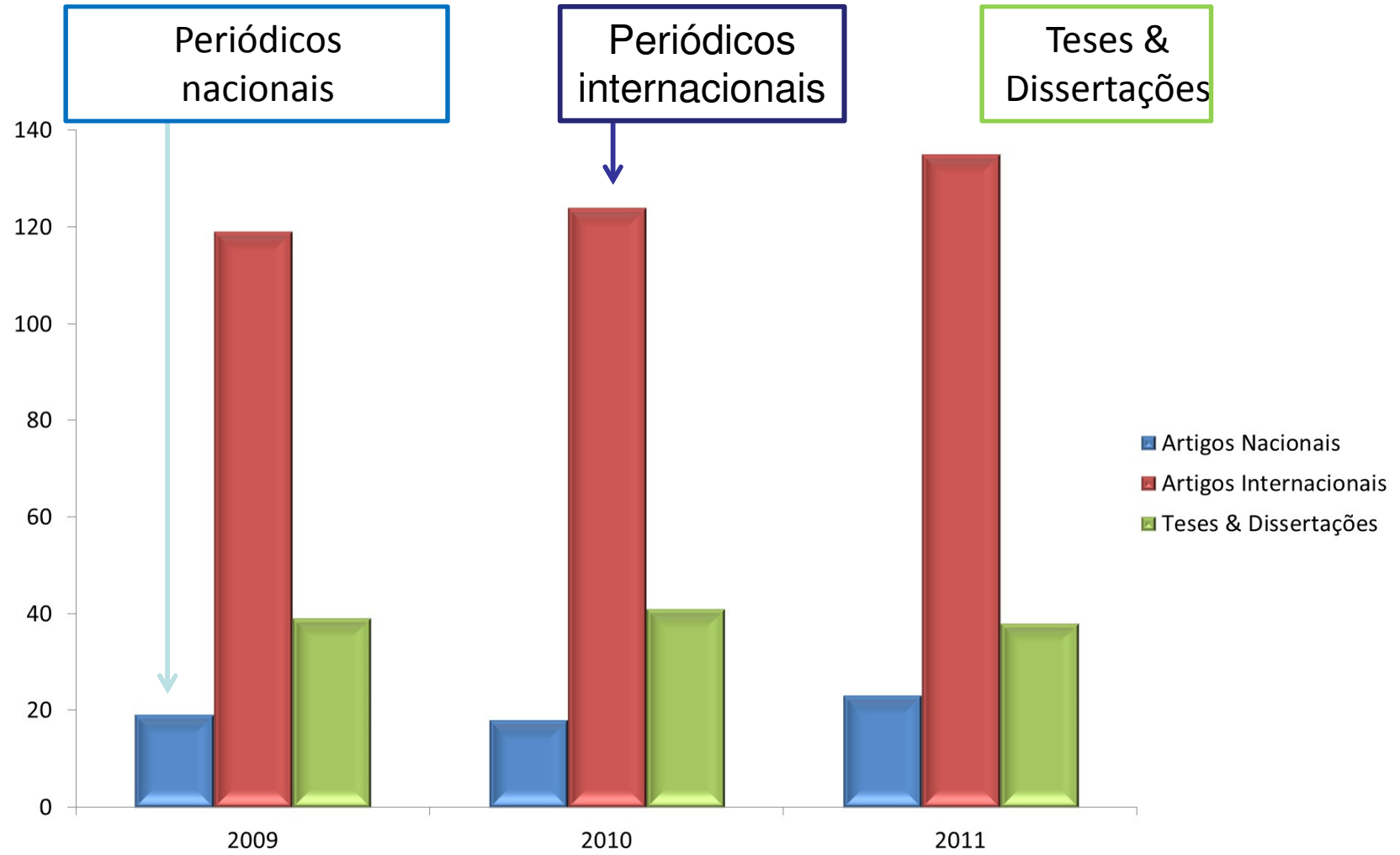




Universidade Federal do Rio de Janeiro



# Produção Científica

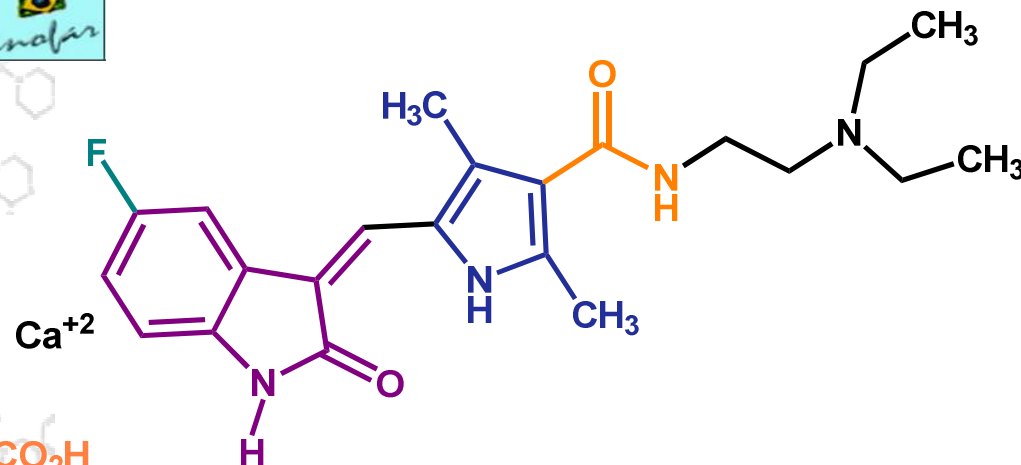
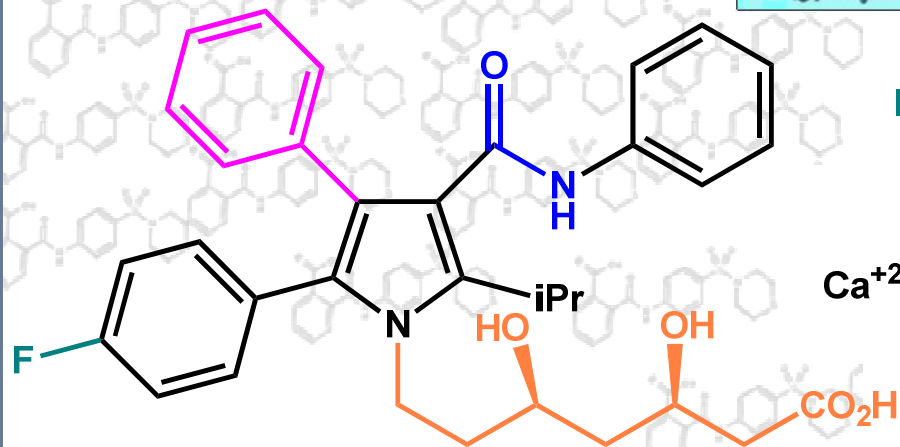


A produção científica do INCT-INOVAR é expressiva



Universidade Federal do Rio de Janeiro

# Inovação Incremental



Prof. Angelo da C. Pinto, Barbara V Silva  
UFRJ

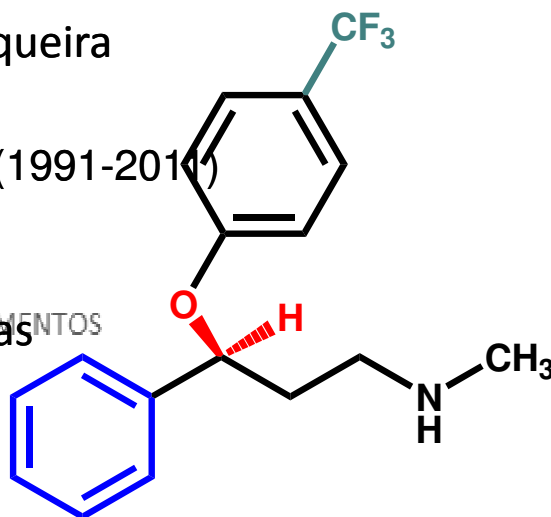


atorvastatina

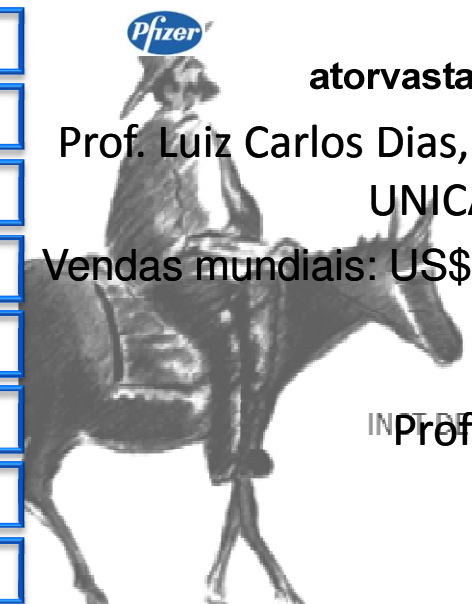
Prof. Luiz Carlos Dias, Dr Adriano Siqueira  
UNICAMP

Vendas mundiais: US\$ >125 bilhões (1991-2014)

INSTITUTO DE FÁRMACOS E MEDICAMENTOS  
INCT/INCOEFAR  
UNICAMP  
SUS



Vendas mundiais: US\$ >1 bilhão (2010)





Universidade Federal do Rio de Janeiro



# VI Reunião de Acompanhamento & Avaliação



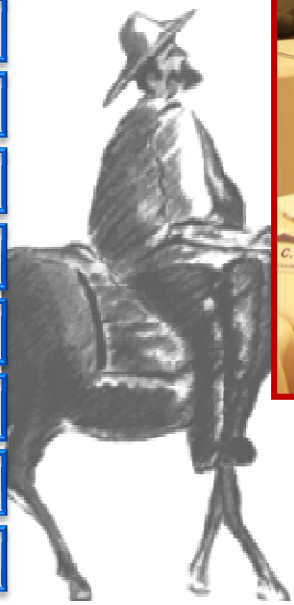
INCT DE FÁRMACOS E MEDICAMENTOS  
INCT-INOFAR

Rio de Janeiro, maio de 2012.

# A equipe



Universidade Federal do Rio de Janeiro



# VII Workshop de Acompanhamento & Avaliação / INCT-INO FAR



INCT DE FARMACOS E MEDICAMENTOS

Rio de Janeiro, 24-25 abril de 2013.

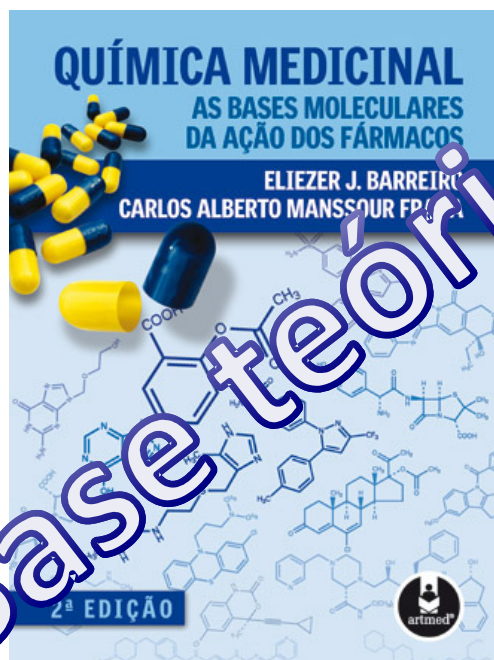
INCT-INO FAR

# A equipe





Universidade Federal do Rio de Janeiro



Base teórica

Química  
m e d  
Medicinal  
c h e m



Lídia M. Lima

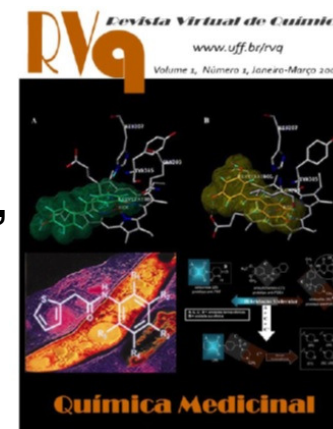
*Quim. Nova* 2007, 30, 1456-1468

**QUÍMICA MEDICINAL MODERNA:  
DESAFIOS E CONTRIBUIÇÃO BRASILEIRA.**



R. S. Bastos, B. V. Silva, A. C. Pinto,  
*Rev. Virtual Quim.*, 2009, 1, 67-86.

**A QUÍMICA MEDICINAL BRASILEIRA DE 1998 A 2008  
NOS PERIÓDICOS JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY,  
BIOORGANIC AND MEDICINAL CHEMISTRY,  
BIOORGANIC AND MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS  
E EUROPEAN JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY.**





Universidade Federal do Rio de Janeiro



Química Medicinal

LASSBio

Laboratório de Avaliação e Síntese de Substâncias Bioativas

Cidade Universitária, ilha do Fundão,  
Rio de Janeiro, RJ

Criado em 19/04/1994 Laboratório de Avaliação e Síntese de Substâncias Bioativas



Pharmacology  
Farmacologia

Molecular  
Modelagem  
Modeling  
Molecular





# Novos Compostos-Protótipos Descobertos no LASSBio

Biochem. Eng. J., 21, 103 (2004)

Bioorg. Med. Chem. Lett, 15, 1169 (2005)

Applied Biochem. Biotechnol., 121, 117 (2005)

Eur. J. Pharmacol., 511, 219 (2005)

INPI # 0401660-2 de 09/04/2004

## LASSBio-881

INPI # 38201866 de 29/04/1999

## LASSBio-552

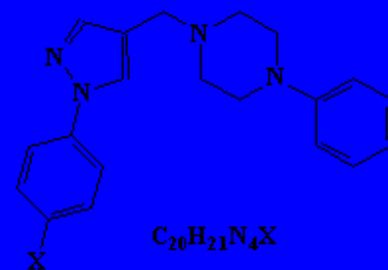


## LASSBio-715



## LASSBio-596

## LASSBio-581



## LASSBio-294

USPTO Patent # 7.091.238  
August 15, 2006

INPI # 0303465-8 de 05/09/2003

Braz. J. Biol. Med. Res., 36, 625 (2003)

Bioorg. Med. Chem., 11, 4807 (2003)

J. Pharm. Biomed. Anal., 33, 1127 (2003)

Quim. Nova, 27, 949 (2004)

J. Mass Spectrometry, 40, 815-820, (2005)

J. Pharmacol. Exper. Therap., 299, 558 (2001)

Br. J. Pharmacol., 134, 603 (2001)

Br. J. Pharmacol., 135, 293 (2002)

Quim. Nova, 25, 1172 (2002)

Eur. J. Pharmacol., 470, 79 (2003)

INPI # 0403363-9 de 20/08/2004





RESULTADO DA PESQUISA (27/08/2011 às 07:21:27)

Pesquisa por: 'ELIEZER J BARREIRO no inventor'

Processo	Depósito	Título
① PI0806985-9	16/10/2008	DERIVADOS N-ACILIDRAZÔNICOS, PROCESSO DE PRODUÇÃO DE COMPOSTOS N-ACILIDRAZÔNICOS, COMPOSIÇÕES FARMACÊUTICAS CONTENDO OS MESMOS, USOS E MÉTODOS DE TRATAMENTO
② PI0711519-9	20/09/2007	DERIVADOS IMIDAZO [1,2-a] PIRIDÍNICOS, COMPOSIÇÕES FARMACÊUTICAS COMPREENDENDO OS MESMOS E PROCESSOS PARA SUA PREPARAÇÃO
③ PI0705051-8	31/05/2007	USO DE COMPOSTOS QUINOXALÍNICOS ACILIDRAZÔNICOS, E COMPOSIÇÕES FARMACÊUTICAS CONTENDO OS MESMOS, NO TRATAMENTO DE QUADROS INFLAMATÓRIOS, DOR AGUDA E CRÔNICA
④ PI0601885-8	15/05/2006	COMPOSIÇÃO FARMACÊUTICA ANTIINFLAMATÓRIA E ANALGÉSICA CONTENDO DERIVADOS N-ACILIDRAZÔNICOS DO SAFROL, USO, E PROCESSO PARA SUA PREPARAÇÃO
⑤ PI0502016-6	03/06/2005	COMPOSTO UREÍDICOS, COMPOSIÇÕES FARMACÊUTICAS CONTENDO OS MESMOS E SEU USO NO TRATAMENTO DE DOENÇAS INFLAMATÓRIAS
⑥ PI0500727-5	03/03/2005	DERIVADOS 1-METIL-3,6,7,8 - TETRAHIDROPIRAZOLO [3,4,-B] PIRROLO [4,3-D] PIRIDINA-6,8-DIONA, PROCESSO DE PREPARAÇÃO, COMPOSIÇÕES FARMACÊUTICAS CONTENDO OS MESMOS E USOS RELACIONADOS
⑦ PI0405418-0	02/09/2004	USO DE DERIVADOS N-FENILPERAZÍNICOS E COMPOSIÇÕES FARMACÊUTICAS CONTENDO OS MESMOS
⑧ PI0403363-9	20/08/2004	RELAXANTES MUSCULARES SELETIVOS E COMPOSIÇÕES FARMACÊUTICAS
⑨ PI0401797-8	20/05/2004	USO DE ANTAGONISTAS A-ADRENÉRGICOS N-FENILPIPERAZÍNICOS, COMPOSIÇÕES FARMACÊUTICAS CONTENDO OS MESMOS E PROCESSOS PARA SUA PREPARAÇÃO
⑩ PI0401660-2	27/04/2004	DERIVADOS N-FENILFTALIMÍDICOS E CARBAMOILBENZÓICOS FUNCIONALIZADOS, PROCESSOS PARA SUA PREPARAÇÃO E COMPOSIÇÕES FARMACÊUTICAS CONTENDO OS MESMOS
⑪ PI0305690-2	08/10/2003	NOVOS DERIVADOS PIPERIDÍNICOS, COMPOSIÇÕES FARMACÊUTICAS CONTENDO OS MESMOS E PROCESSOS PARA SUA PREPARAÇÃO
⑫ PI0303465-8	05/09/2003	NOVOS DERIVADOS N-FENILPIPERAZÍNICOS E COMPOSIÇÕES FARMACÊUTICAS CONTENDO OS MESMOS
⑬ PI0202025-4	20/05/2002	USO DE NOVOS ANTAGONISTAS .a. - ADRENÉRGICOS N-FENILPIPERAZÍNICOS DERIVADOS DO SAFROL, COMPOSIÇÕES FARMACÊUTICAS CONTENDO OS MESMOS E PROCESSOS PARA SUA PREPARAÇÃO
⑭ PI9902960-0	29/04/1999	NOVOS COMPOSTOS BI-PIRAZÓLICOS FUNCIONALIZADOS, NOVA CLASSE DE AGENTES ANTI-INFLAMATÓRIOS NÃO-ESTERÓIDES SINTÉTICOS
⑮ PI8201868-5	31/03/1982	SÍNTESE DE PROSTAGLANDINAS DA SÉRIE DESOXI-11-PGE



Universidade Federal do Rio de Janeiro



XX Reunião Anual de Avaliação LASSBio, Barra Nova, Saquarema, RJ, dez 2012.



# Revista Virtual de Química

<http://www.uff.br/RVQ/index.php/rvq/issue/current>



# RVQ

Revista Virtual de Química

ISSN 1982-0234

Volume 4, Número 2

Março-Abril 2012



[www.uff.br/rvq](http://www.uff.br/rvq)

## O INCT-INOFAR apóia a RVQ.

### Sumário

Editorial	O REUNI e a expansão dos Cursos de Licenciatura de Química, Física, Matemática e Biologia <i>Angelo da Cunha Pinto</i>	101
<hr/>		
Artigos		
	<b>Complexos de Pt<sup>II</sup>: Estratégia Molecular no Combate ao Câncer</b> <i>Gustavo B. da Silva, Maria D. Vargas</i>	102-117
	<b>Produção de Monoacilgliceróis: Rotas e Catalisadores</b> <i>Nikolas B. L. dos Santos, Michelle J. C. Rezende</i>	118-129
	<b>A Teoria da Ressonância Não-Sincronizada das Ligações Covalentes</b> <i>Marconi B. S. Costa, Karina A. Barros</i>	130-145
	<b>Aspectos Químicos e Biológicos do Óleo Essencial de Cravo da Índia</b> <i>Raphael da S. Affonso, Magdalena N. Rennó, Gláucia B. C. A. Slona, Tanois C. C. Franco</i>	146-161
	<b>"A Mata é sua Farmácia" – A Pesquisa de Plantas Brasileiras para o Combate de Doenças Tropicais no Século XIX</b> <i>Nadja Paraense dos Santos, Angelo C. Pinto</i>	162-172
<hr/>		
Perfil Acadêmico e Trajetória Científica		
	<b>Lise Meitner: A Intérprete da Cisão Nuclear</b> <i>Raquel Gonçalves-Maia</i>	173-192
<hr/>		
Resenhas		
	<b>Resenha do Livro "Neither Physics nor Chemistry: a History of Quantum Chemistry"</b> <i>Itamar Borges Jr.</i>	193-194



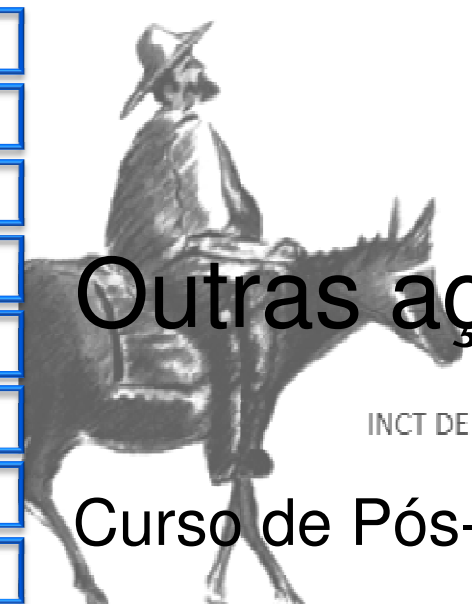
Universidade Federal do Rio de Janeiro

# Popularização e divulgação das Ciências dos Fármacos e Medicamentos



## Portal dos Fármacos

Visitantes  
**521 796**  
15/11/2010



### Outras ações:

INCT DE FÁRMACOS E MEDICAMENTOS

INCT-INOFAR

Curso de Pós-graduação (M&D) em Farmacologia e Química Medicinal, ICB-UFRJ;



# INCT-INO FAR NAS ESCOLAS DO ENSINO FUNDAMENTAL



Universidade Federal do Rio de Janeiro



*Cóias que eu aprendi*

Eu aprendi nesta palestra coisas muito importantes como:  
a diferença das tarjas e local onde devemos guardar os medicamentos  
E que devemos guardar os medicamentos fora do alcance das crianças e animais  
E as funções de cada medicamento e diferente.

Nome: Rafael Freitas B. Ferreira  
professor: Silois, turma: 1.302





Universidade Federal do Rio de Janeiro



NA SOCIEDADE

UFRJ



INCT - INOFAR/ Portal dos Fármacos

© 2009

ISBN 978-85-910137-0-8

promover a inclusão social

Educação & atualização

# USO CORRETO DOS MEDICAMENTOS

## VOCÊ CUIDA DA SUA SAÚDE COM SEGURANÇA?





# De CONVITE fármacos e suas descobertas

Pretende-se tratar de temas, opiniões, comentários sobre a Ciência dos Fármacos, seu uso seguro e benefícios. Aspectos da formação qualificada de universitários e pós-graduandos nas Ciências dos Fármacos também são de interesse.

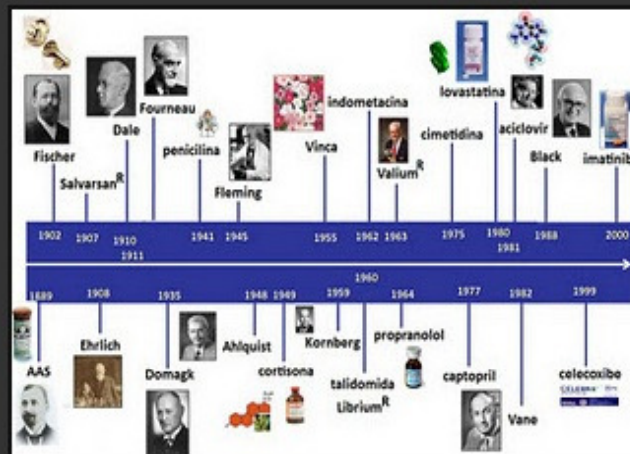
<http://ejb-eliezer.blogspot.com>

SEGUNDA-FEIRA, 14 DE NOVEMBRO DE 2011

## A Linha do Tempo da Química Medicinal: assim nascem os fármacos (III)

A descoberta da penicilina promoveu o desenvolvimento da quimioterapia e inúmeros e diversos antibióticos se somam na composição do atual arsenal

terapêutico. Além da diversidade química destas substâncias bioativas, em termos moleculares, vários são seus os mecanismos farmacológicos de ação. Ao lado dos antibióticos, outros fármacos são classificados como quimioterápicos e entre estes estão os fármacos oncológicos, onde se encontram os antibióticos anti-câncer, como as antraciclínas, e destacam-se a daunomicina (daunorubicina) descoberta nos laboratórios Farmitalia na cidade de Milão, Itália, por Aurelio Di Marco, em 1962, isolada do fungo *Streptomyces peucetius* e seu derivado 14-hidroxilado, adriamicina, que podem ser consideradas as moléculas pioneiras desta classe de agentes oncológicos.





Universidade Federal do Rio de Janeiro

# Os produtos naturais e os fármacos inovadores

## IV Simpósio Nacional de Produtos Naturais

Programa de Produtos Naturais e Sintéticos Bioativos  
Universidade Federal da Paraíba

28 de setembro de 2012

Auditório 1 - Centro de Convenções do Hotel Tambaú, João Pessoa, PB

**Dr Eliezer J. Barreiro**

Professor Titular

Universidade Federal do Rio de Janeiro



Laboratório de Avaliação e Síntese de **Substâncias Bioativas**

[www.farmacia.ufrj.br/lassbio](http://www.farmacia.ufrj.br/lassbio)

Instituto Nacional de Ciência e Tecnologia de Fármacos e Medicamentos  
(INCT-INO FAR)

<http://www.inct-inofar.ccs.ufrj.br/>



# Obrigado



[www.farmacia.ufrj.br/lassbio](http://www.farmacia.ufrj.br/lassbio)  
[ejb-eliezer.blogspot.com.br](http://ejb-eliezer.blogspot.com.br)

Uma das sete maravilhas do mundo moderno!



F i m



Universidade Federal do Rio de Janeiro



1946

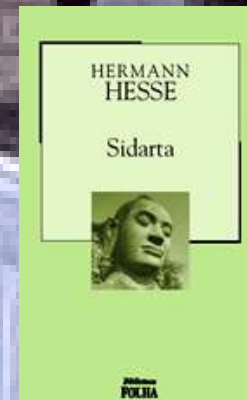
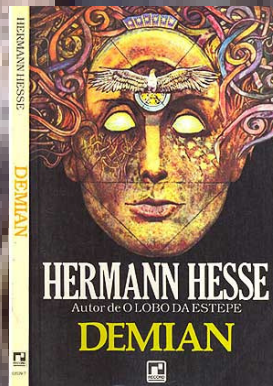


Herman Hesse

1877-1962

*“Quem é pequeno  
vê no maior apenas  
o que um pequeno  
é capaz de perceber.”*

Hermann Hesse



# Patentes a expirar em 2012

Data (mês)	Marca <sup>R</sup>	Nome	Empresa	Vendas 2010 (US\$)
03	Seroquel	quetiapine	AZ	6,8 bi
03	Lexapro	escitalopram	Lundbeck	2,3
04	Provigil	modafanil	Teva	1,1
05	Plavix	clopidogrel	Sanofi/BMS	8,9
08	Singulair	montelukast	Merck	5,5
08	Actos	pioglitazona	Takeda	4,3
09	Diovan	valsartan	Novartis	4,1

Fonte :IMS

Ano	Fármaco	Indicação Terapêutica	Empresa
1997	Montelucaste	Anti-asmático	Merck
1998	Sildenafil	Disfunção erétil	Pfizer
1999	Celecoxibe	Anti-inflamatório	Pfizer
2000	Esomeprazola	Úlcera péptica	Astra-Zeneca
2001	Ziprasidona	SNC	Pfizer
2002	Imatinibe	Câncer	Novartis
2003	Rosuvastatina	Anti-lipêmico	Astra-Zeneca
2004	Erlotinibe	Câncer	Genentech
2005	Eszopiclona	SNC	Aventis
2006	Vorinostat	Câncer	Merck/Patheon
2007	Maraviroc	Anti-viral	Pfizer
2008	Etravirina	Anti-viral	Janssen
2009	Saxagliptina	Diabetes	BMS/Astra-Zeneca
2010	Dabigatrin	Anti-coagulante	Boehringer-Ingelheim
2011	Rivaroxibano	Anti-trombótico	Bayer

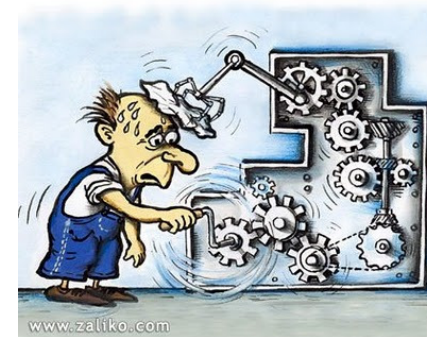
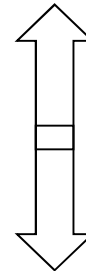
a) SNC = sistema nervoso central



# Descoberta

## (Descobrir)

ato ou efeito de descobrir (algo), retirando-lhe a proteção, a cobertura, a capa ou invólucro que cobre, esconde; descobrimento;

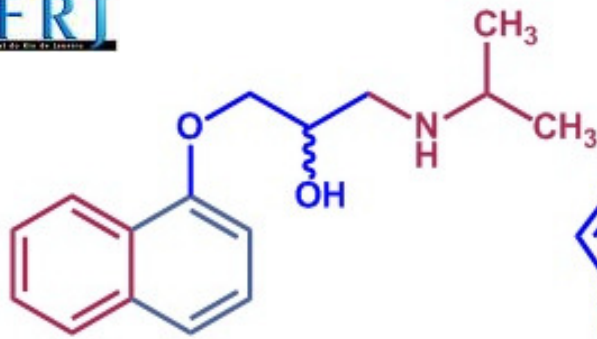


## (Inventar)

criação de algo através do conhecimento científico, técnico; coisa inventada; invento;

# Invenção

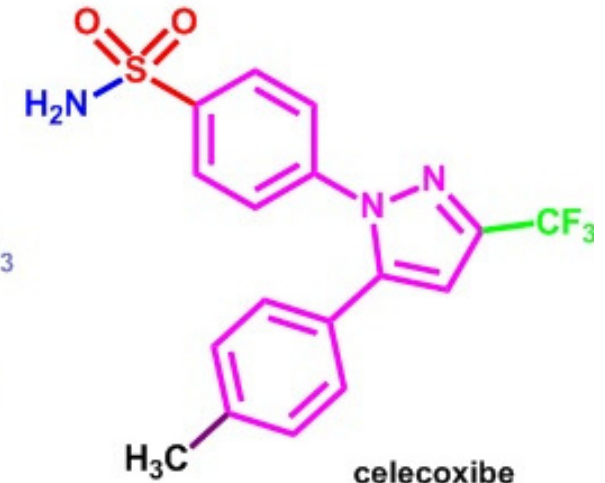
# Inovações Terapêuticas



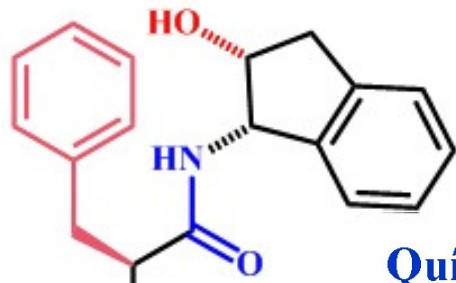
propranolol  
1964



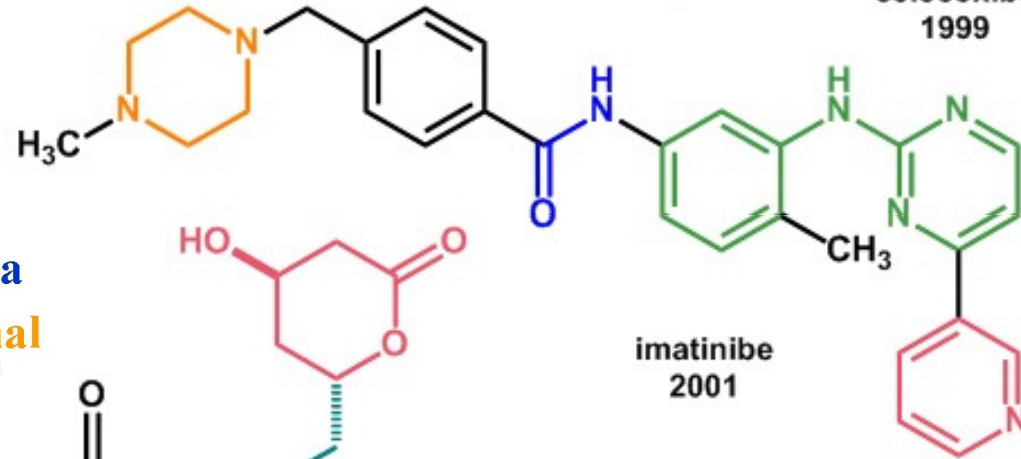
cimetidina  
1975



celecoxibe  
1999

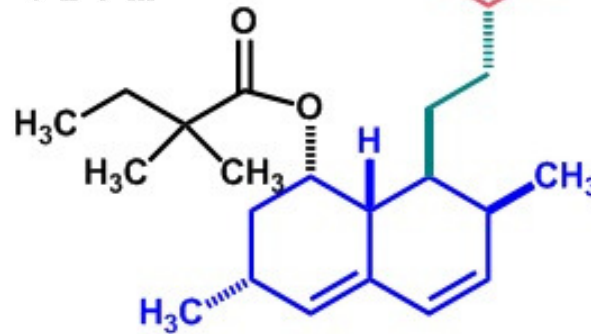
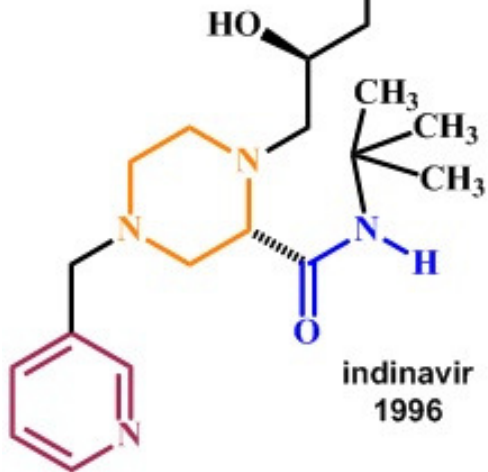


indinavir  
1996

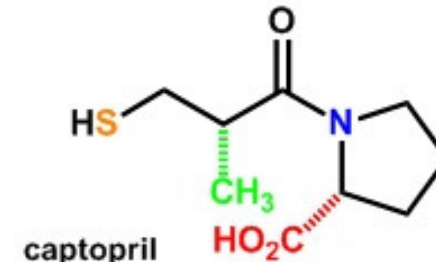


imatinibe  
2001

Química  
med  
Medicinal  
chem

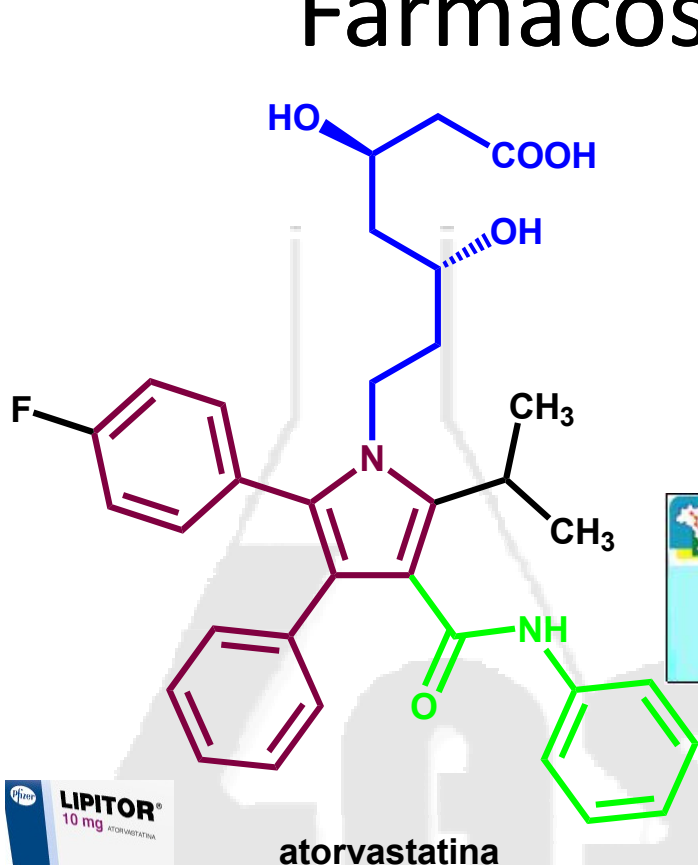


simvastatina  
1986



captopril  
1987

# Fármacos Genéricos



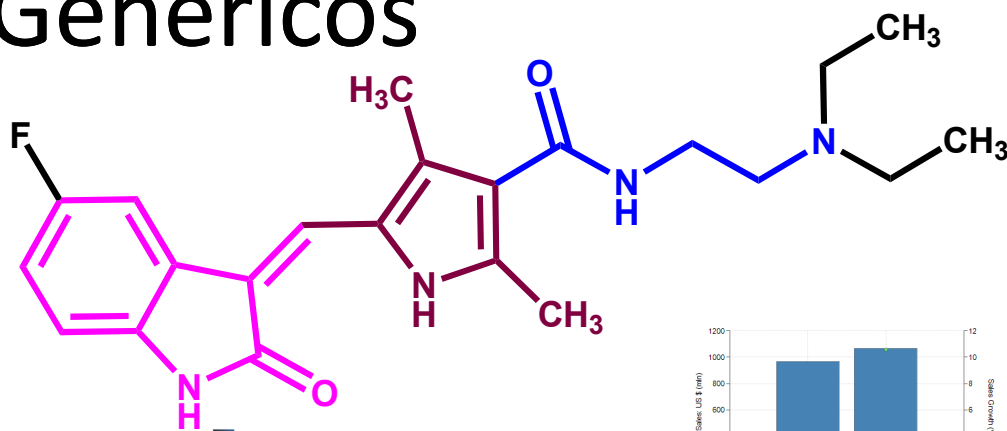
Prof. Luis Carlos Dias  
Dr Adriano Siqueira Vieira



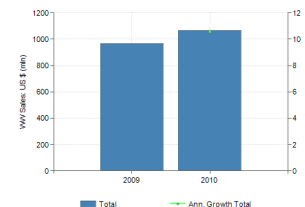
Instituto de Química

INPI Patent, 2011 (BR)

Vendas mundiais: US\$ >125 bilhões (1991-2011)



sunitinibe

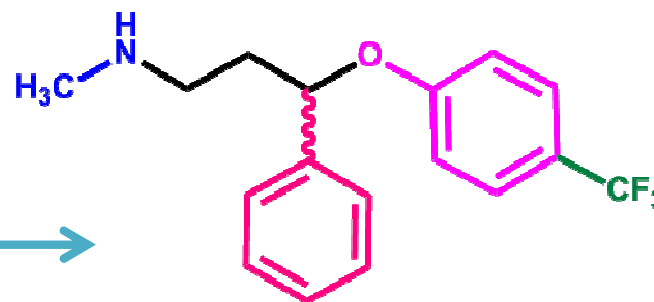


Prof. Angelo C Pinto  
Dr Bárbara Vasconcelos da Silva

Instituto de Química



Vendas mundiais: US\$ >1 bilhão (2010)



fluoxetina

Prof Luis Carlos Dias - 2012

ESTADO DA PARTE

ESTADO DA PARTE

ESTADO DA PARTE

ESTADO DA PARTE

ESTADO DA PARTE

ESTADO DA PARTE

ESTADO DA PARTE

ESTADO DA PARTE

ESTADO DA PARTE

ESTADO DA PARTE

ESTADO DA PARTE

ESTADO DA PARTE

ESTADO DA PARTE

ESTADO DA PARTE

ESTADO DA PARTE

ESTADO DA PARTE

ESTADO DA PARTE

ESTADO DA PARTE

ESTADO DA PARTE

ESTADO DA PARTE

ESTADO DA PARTE

ESTADO DA PARTE

ESTADO DA PARTE

ESTADO DA PARTE

ESTADO DA PARTE

ESTADO DA PARTE

