



FIGURA 1. Hoja e inflorescencia de *Galphimia glauca*. Foto: Salvador Cañigueral.

Potencial antialérgico y ansiolítico de la *Galphimia glauca*

José M^o Prieto

Cristina Monturiol

UCL School of Pharmacy
Londres
Reino Unido

Dirección de contacto

José M^o Prieto
UCL School of Pharmacy
29-39 Brunswick Square
W1CN 1AX Londres, Reino Unido
j.prieto@ucl.ac.uk

Resumen

Las hojas de *Galphimia glauca* Cav., un arbusto nativo de Centroamérica, proveen efectos duales antialérgicos y sedantes/ansiolíticos por vía oral. El polifenol ácido tetragaloilquínico es su principio activo antiasmático y antialérgico. Su mecanismo de acción está ligado al antagonismo específico sobre los efectos del leucotrieno D4 y actúa a dosis de 5 mg/kg en modelos *in vivo*.

La actividad ansiolítica reside en su contenido en *nor*-secotriterpenos llamados galfiminas. Las galfiminas A y B son los principios activos con mayor actividad ansiolítica en modelos conductuales *in vivo*. Estos metabolitos pasan la barrera hematoencefálica y actúan en modelos *in vivo* a dosis de 15 mg/kg.

Estudios clínicos han demostrado una eficacia equiparable al lorazepam en el tratamiento de los trastornos de ansiedad generalizada según dos ensayos clínicos a corto y largo plazo. Los tratamientos fueron bien tolerados y no indujo ningún efecto adverso serio.

Dichos antecedentes podrían justificar el desarrollo de fitofármacos a partir de fracciones polares a partir de las hojas de *G. glauca*, estandarizadas en ácido tetragaloilquínico, como agente preventivo de alergias y asma. Por otro lado las fracciones apolares, estandarizadas según el contenido en galfiminas A y B, podrían ser de utilidad en el tratamiento del trastorno de ansiedad generalizada.

Palabras clave

Galphimia glauca, antiasmático, antialérgico, ansiolítico, ácido tetragaloilquínico, galfimina B.

Potencial antialérgico e ansiolítico de *Galphimia glauca*

Resumo

As folhas de *Galphimia glauca* Cav., um arbusto originário da América Central, apresentam uma dupla actividade, com efeitos antialérgicos e sedativos / ansiolíticos quando administradas por via oral. O polifenol ácido tetragaloilquinico é o princípio activo com acção antiasmática e antialérgica. O seu mecanismo de acção está relacionado com o antagonismo específico sobre os efeitos do Leucotrieno D4 (LTD4), agindo em doses de 5 mg/kg em modelos murinos *in vivo*.

A atividade ansiolítica deve-se à presença de *nor*-secotriterpenos chamados galfiminas. As galfiminas A e B são as mais ativas em modelos comportamentais *in vivo*. Estes compostos atravessam a barreira hemato-encefálica e são ativos em modelos murinos *in vivo* em doses de 15 mg/kg.

Estudos clínicos demonstraram uma eficácia semelhante ao lorazepam no tratamento da perturbação da ansiedade generalizada, tanto a curto como a longo prazo. Os tratamentos foram bem tolerados e não provocaram efeitos secundários graves.

Estas características podem justificar, por um lado, o desenvolvimento de medicamentos à base de plantas com base em frações polares extraídas a partir das folhas de *G. glauca*, padronizadas em ácido tetragaloilquinico, para prevenção de problemas de alergias e asma. Por outro lado, as frações apolares, padronizadas relativamente ao conteúdo de galfiminas A e B, poderiam ser de utilidade no tratamento da perturbação da ansiedade generalizada.

Palavras chave

Galphimia glauca, actividades anti-asmática, anti-alérgica, ansiolítica, ácido tetragaloilquinico, galfimina B.

Antiallergic and anxiolytic potential of *Galphimia glauca*

Abstract

Leaves of *Galphimia glauca* Cav., a Centroamerican medicinal shrub, are endowed with dual antiallergic and anxiolytic effects when administered orally. The polyphenol tetragalloylquinic acid is the antiasthmatic and antiallergic active principle. Its mechanism of action is related to the specific antagonism upon the LTD4 receptors, acting at doses of 5 mg/mL in murine *in vivo* models.

The anxiolytic activity is due to the presence of the *nor*-secotriterpenes 'galphimines'. Galphimines A and B are the most active in conductual models *in vivo*. This metabolites are able to cross the blood-brain barrier and are active in murine *in vivo* models at doses of 15 mg/kg.

Clinical studies demonstrated a similar efficacy to lorazepam in the treatment of generalised anxiety disorder both at short and long term. The treatment is well tolerated and no safety concerns were raised.

These antecedents may justify on the one hand the development of phytopharmaceutical preparations based on polar fractions from the leaves of *G. glauca*, standardized in tetragalloylquinic acid, as a preventative agent of allergies and asthma. On the other hand, apolar fractions, enriched and standardized in Galphimines A and B, could be made into medicines for the treatment of generalised anxiety disorder.

Key words

Galphimia glauca, anti-asthmatic, anti-allergic, anti-anxiety, tetragaloilquinic acid, galphimine B.