

單次口服4mg 3H-galantamine 7天後，在尿液中發現90~97%的放射活性，糞便中則為2.2~6.3%。靜脈注射及口服後，18~22%的劑量在24小時內以galantamine原型自尿液排出，其腎廓清率約為65 ml/min，總血漿清除率為20~25%。

主要的代謝途徑為N-氧化、N-去甲基作用、O-去甲基作用、糖苷酸化及epimerization。O-去甲基作用對大量的CYP2D6代謝病人尤其重要。尿液及糞便中的總放射活性排泄濃度對少量及大量代謝病人未有差異。離體試驗證明cytochrome P450 2D6及3A4為galantamine代謝主要的cytochrome P450 isoenzymes。藥物之緩慢及快速代謝病人血漿中的原型 galantamine 及糖苷酸化合物含有大部份有檢體放射活性。快速代謝病人血漿中的O-去甲基galantamine糖苷酸化合物也很重要。

單次給藥後，緩慢及快速代謝病人的血漿無法找到未連結型的galantamine活性代謝物(norgalantamine、O-desmethylgalantamine及O-desmethyl-norgalantamine)。重覆給藥病人的血漿可偵測到norgalantamine，但其量不超過10%的galantamine投與量。

由臨床試驗病人所得之數據顯示Alzheimer's症患者的galantamine血漿濃度較健康年輕人高30~40%。

輕度肝功能不全病人(CHILD值為5~6)的galantamine藥物動力學與健康個體相同。中度肝功能不全病人(CHILD值為7~9)的galantamine AUC及半衰期約增加30%(見用法用量欄)。

曾於腎功能程度不等的年輕個體研究galantamine的排除。Galantamine的排除會隨肌酐清除率的下降而減少。與年齡及體重相符的健康個體 ($\text{Cl}_{\text{CR}} \geq 121 \text{ ml/min}$)相較，中度腎功能不全病人($\text{Cl}_{\text{CR}} = 52\text{-}104 \text{ ml/min}$)或重度腎功能不全病人($\text{Cl}_{\text{CR}} = 9\text{-}51 \text{ ml/min}$)的galantamine血漿濃度會增加38%或67%。人口藥物動力學分析顯示腎功能不全的Alzheimer患者若其 Cl_{CR} 不低於9 ml/min便毋需調整劑量(見用法用量欄)，即使Alzheimer病人的galantamine清除率較低。

與血漿蛋白之結合：Galantamine與血漿蛋白的結合低： $17.7 \pm 0.8\%$ 。於全血中，galantamine主要分佈到血球細胞(52.7%)及漿液(39.0%)，galantamine與血漿蛋白質的結合比例僅有8.4%。Galantamine的血球到血漿濃度比值為1.17。

上市後經驗

比薩症候群(Pisa syndrome)

臨床試驗前安全性資料

所有與處方者相關之臨床試驗前安全性資料皆已涵蓋於適當的項目內容。

置於兒童接觸不到之處

包裝:4-1000錠鋁箔盒裝、塑膠瓶裝

儲存:25°C以下貯藏

藥商及製造廠：

健亞生物科技股份有限公司

新竹縣湖口鄉中興村19鄰工業一路1號

IT090D2