

一文读懂精神科长效针剂

文 / 首都医科大学附属北京安定医院 牛梦溪

对于需要长期服药的患者而言,摆脱每日定时服药的困扰,将一天多次的用药方案转变为每月一次的长效针剂注射,无疑是一个极具吸引力的选择。目前精神科临床常用的长效针剂包括帕利哌酮棕榈酸酯、癸酸氟哌啶醇、阿立哌唑、利培酮等。这些药物通常每月注射一次,其中棕榈酸帕利哌酮注射液甚至可延长至每三个月注射一次。这种给药方式不仅免除了患者每日定时服药的负担,还解决了外出带药不便、容易漏服等问题。更重要的是,长效针剂能维持更稳定的血药浓度,有效降低疾病复发风险,从而提高治疗的可靠性。下面,我们将为大家介绍精神科长效针剂的相关知识。

一、精神科长效针剂的种类

精神科长效针剂主要适用于需要长期、稳定药物治疗的精神疾病患者,如精神分裂症、双相情感障碍等。目前,精神科长效针剂主要分为脂质前体药、微晶技术制剂和微球技术制剂三大类,它们在制备工艺和药物释放机制上各有特色。

1. 脂质前体药

脂质前体药是一种特殊的药物剂型。它通过将药物分子连接到脂肪酸长链上,形成易于存储在脂肪组织中的亲脂性结构。这些药物注射进体内后,大部分会分布在脂肪组织中,并随着时间的推移逐渐释放。这种

缓释机制能够在较长时间内维持稳定的药物浓度。代表性药物包括第一代抗精神病药的长效制剂,如癸酸氟哌啶醇注射液和氟奋乃静癸酸酯注射液。

2. 微晶技术制剂

微晶技术制剂是另一种基于药物自身特性的缓释剂型。它利用难溶性药物制成不同粒径的微小晶体,这些晶体在体内具有不同的溶解度,较小的晶体溶解速度较快,而较大的晶体溶解速度较慢。通过这种方式,药物能够在体内持续释放,实现长效缓释的效果。代表性药物包括棕榈酸帕利哌酮注射液和阿立哌唑注射液。

3. 微球技术制剂

微球技术是一种通过载体控制药物释放的方法。它将固体或液体状态的药物溶解或分散在聚合物材料中,制成粒径在1至1000微米之间的小微囊。通过选择不同的聚合物材料,可以精确控制微囊膜内药物的释放速度和持续时间。这种技术使得药物能够在较长时间内以稳定的速度释放,从而维持治疗效果。代表性药物为注射用利培酮微球。

二、长效针剂的优势

长效针剂最显著的优势在于能大幅降低给药频次,有效规避漏服风险。从临床医学角度来看,这类制剂还具有诸多未被公众广泛认知的治疗优势。



1. 避免首过效应

当我们口服给药时, 药物首先需要通过肠道吸收并进入血液循环, 但在此过程中, 药物会首先经过肝脏。对于许多精神科药物而言, 肝脏中的酶会代谢掉大部分药物, 使其失去活性, 这就是所谓的“首过效应”。更值得注意的是, 如果患者同时服用其他药物, 这些药物间的相互作用可能会进一步影响肝脏酶的代谢能力, 导致药物在体内的浓度变得难以预测, 从而影响疗效并增加不良反应的发生风险。

长效抗精神病药物通过肌肉注射或皮下注射给药。注射后, 药物直接从注射部位缓慢释放进入体循环, 从而避免了肝脏首过效应对药物疗效的影响。这种给药方式不仅提高了药物的生物利用度, 还减少了合并用药或个体差异对血药浓度的影响, 从而使治疗效果更加稳定且可预测。

2. 稳定药效

口服药物在体内的浓度变化通常呈现典型的峰谷波动特征(先上升后下降), 即在给药后达到峰值浓度后逐渐下降, 直至下次给药前降至谷浓度。然而, 在精神疾病治疗中, 为了更有效地缓解症状, 我们希望血药浓度能够保持在一个相对平稳的状态。

相比之下, 长效针剂具有缓慢且平稳的释放特性。在规范的给药方案下, 长效针剂在体内的药物浓度波动幅度较小, 有助于维持稳定的药物治疗效果。

3. 减少不良反应, 提高耐受性

在精神疾病药物治疗中, 药物在体内的浓度变化与药物疗效及不良反应的发生密切相关。过高的峰浓度可能导致患者出现药物不耐受现象, 而过低的谷浓度则提示可能存在疗效不足的风险。

长效针剂在体内的药物浓度相对平稳, 避免了峰浓度过高和谷浓度过低的情况。这种平稳的浓度变化降低了因血药浓度剧烈波动而引起的不良反应风险。对许多患者而言, 这意味着更少的不良反应(如恶心、呕吐、头晕等), 从而提升了他们对药物的耐受性。

综合来看, 长效针剂不仅通过减少给药频次显著降低了漏服风险, 而且有效提升了患者的治疗依从性和临床疗效。

三、常用的精神科长效针剂

目前临床常用的精神科长效针剂在给药方案、储存要求等方面存在差异。表1为三种常用精神科长效针剂的临床应用对比。

表1 三种常用精神科长效针剂的临床应用

药物名称	初始给药方案	给药间隔	注射部位	用药剂量	储存要求
阿立哌唑注射液	首次注射后需继续口服相关药物约14天	每月注射一次	三角肌或臀大肌	推荐的起始剂量和维持剂量为每次400 mg（不耐受可减至300 mg）	无需冷藏
棕榈酸帕利哌酮注射液	第1日注射给药后，第8日再次注射，无需口服补充	每月注射一次	三角肌或臀大肌	起始治疗首日注射150 mg，一周后再次注射100 mg。建议的维持治疗剂量为每月75 mg，可根据患者的耐受情况和疗效进行调整，调整范围为25~150 mg	无需冷藏
注射用利培酮微球	首次注射后无需口服补充	每两周注射一次	三角肌或臀大肌	推荐剂量为25 mg。某些患者可能需要更高的剂量，例如37.5 mg或50 mg。每两周的剂量应不超过50 mg	需要冷藏

四、使用长效针剂的注意事项

1.按时用药

大部分长效针剂需要按时给药，以确保血药浓度的稳定性及疗效的持续性。尽管通常允许一定的给药时间窗（如推荐给药日前后一周内完成注射），但为确保稳定的疗效，建议严格遵循医嘱规定的给药时间进行注射。

2.漏用药的处理方法

长效针剂在漏用后数天内及时补注，通常对治疗效果影响较小。但当错过给药的时间太久时，则需重新启动初始给药方案。例如，对于已规律使用阿立哌唑注射液超过3个月的患者，若距末次注射超过6周末给药，即需重新按照初始方案进行注射，并配合连续14天的阿立哌唑口服制剂补充治疗。需特别注意的是，由于不同长效针剂的释放机制和药物半衰期存在差异，患者漏用后的补救措施应严格参照各药品说明书的具体要求执行。

3.血药浓度监测

尽管长效针剂能够维持相对稳定的血药浓度，但每个患者对药物的耐受性和治疗反应仍存在显著差异。对于首次使用长效针剂的患者，建议在治疗初期加强血药浓度监测（通常需要更密集的检测频次），以便医生及时调整给药方案。

4.关注不良反应并定期检查

尽管长效针剂显著降低了给药频次，但仍可能产生与口服制剂相似的药物不良反应。需要注意的是，使用长效针剂后，注射部位可能会出现短暂性肿胀、疼痛或瘙痒等局部症状。因此，建议患者在治疗期间密切

关注自身反应，出现异常应及时就医。另外，患者需定期进行身体检查（包括血常规、肝肾功能及代谢指标等），以便早期识别和干预潜在药物不良反应。

五、结语

长效针剂作为精神科药物治疗的重要突破，通过独特的缓释技术实现了给药方式的革新。这类制剂不仅显著提升了患者的用药便利性和治疗依从性，更为精神疾病的长期管理提供了更可靠的解决方案。然而，临床使用时需规范给药、加强监测并进行个体化调整，以充分发挥其治疗优势。**药物与人**

