

透皮给药途径的利弊

详细介绍：

皮肤是人体最大的器官，起着重要的保护作用，具有许多外部化学物质、微生物和颗粒物质(包括胶体成分)

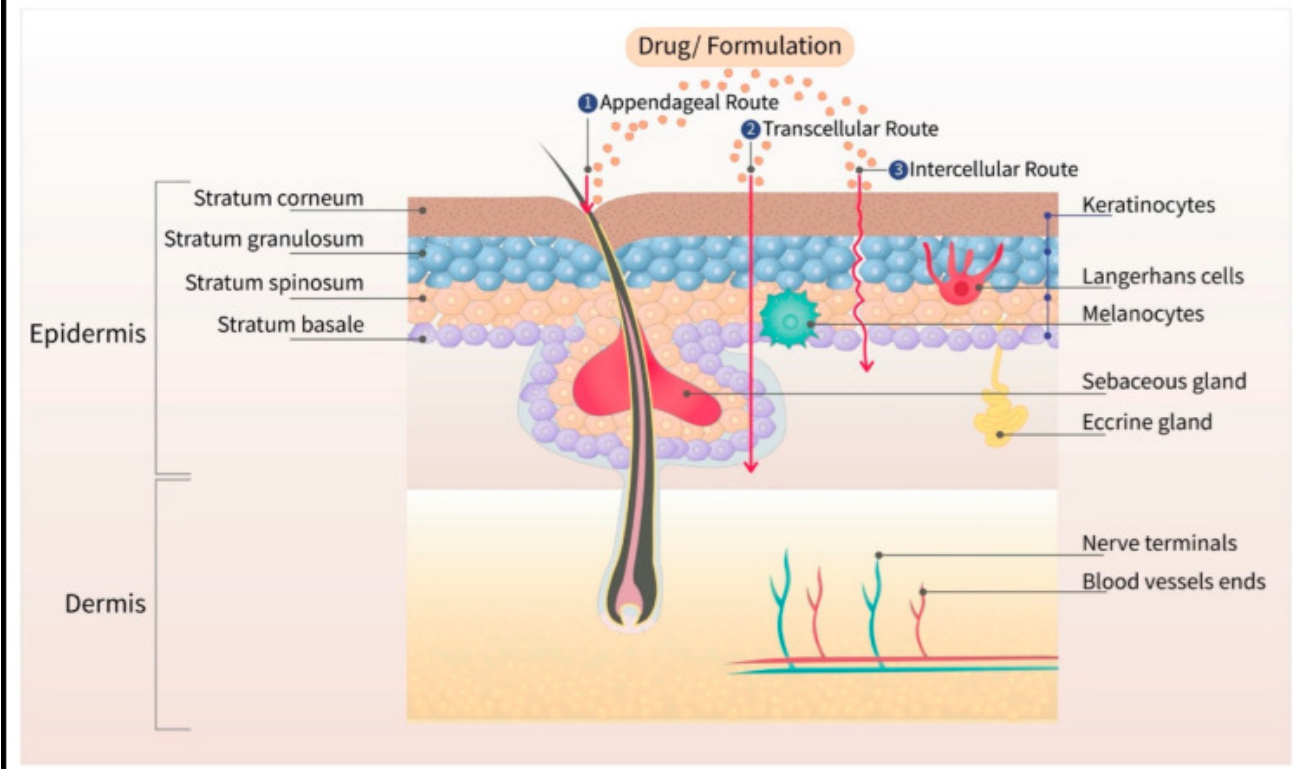


图1：不同的皮肤层有三种主要的药物运输途径
(附肢，跨细胞和细胞内)最外层角质层是透皮给药的主要屏障

透皮给药途径的优点

避免首过效应(尽管皮肤代谢活跃)。首过效应是指某些药物经胃肠道给药，在尚未吸收进入血循环之前，在通过皮肤给药避免了胃肠道运输中出现的pH值变化，同时药物吸收不受消化道内pH、食物、转运时间等因素透皮贴片是非侵入性的，避免了肠外治疗的不便。

同样的药物，经皮贴片给药的剂量与口服给药的剂量相当。

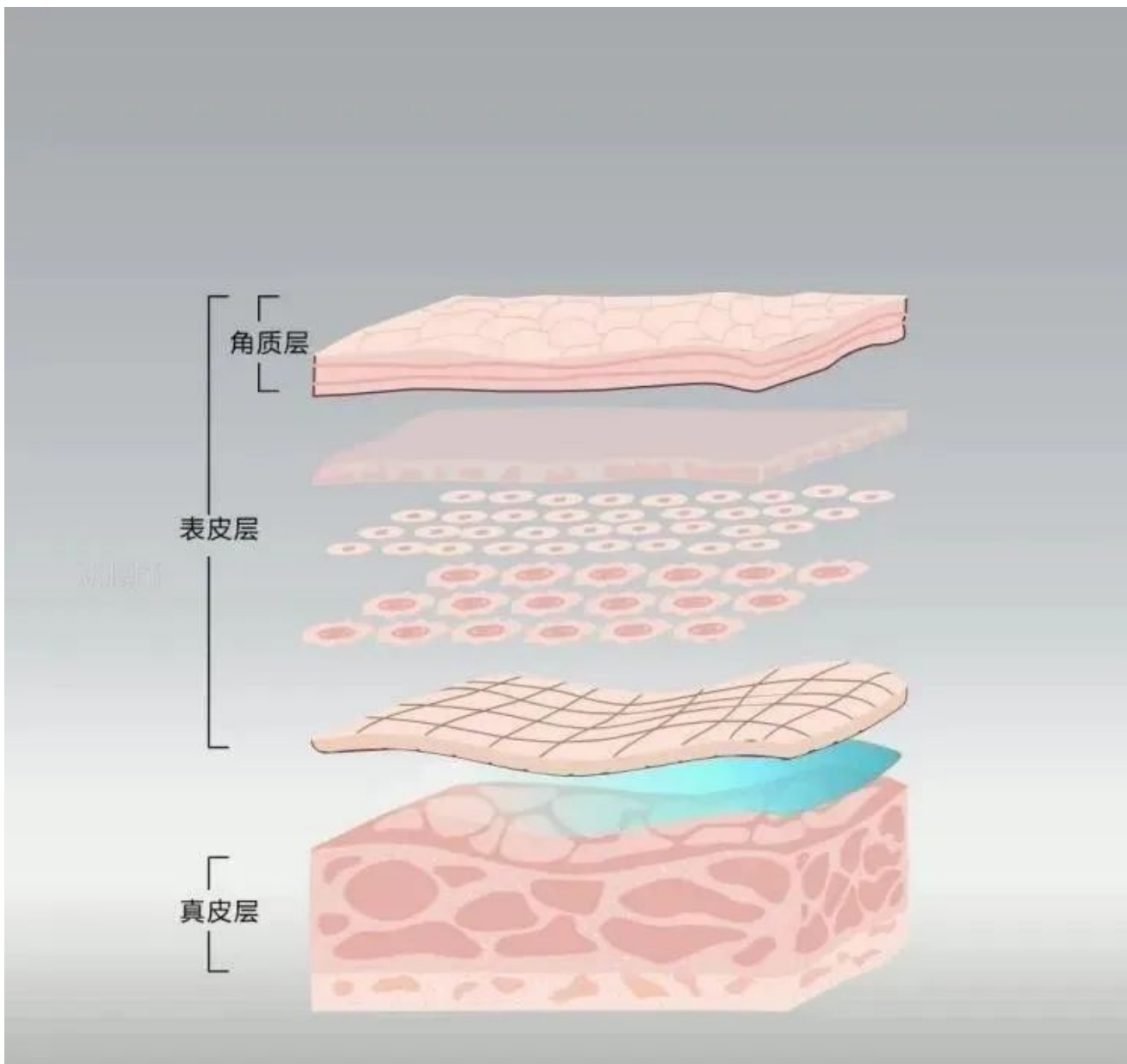
提供平稳的血浆药物浓度，无波动，长时间，克服因吸收过快产生血药浓度过高而引起的不良反应。

可自主用药，简化的用药方案。无需特殊技能和要求，提高了患者的依从性，特别适用于服药依从性较差的灵活给药，只要简单地取下透皮贴片，就可以在任何时候停止药物摄入。

可作为恶心或昏迷病人的给药途径。

透皮给药途径的缺点

透皮给药科技已发展了40多年。但市场并没有如预期那般全线爆发。药融云数据显示，截止目前全球范围内



在局部给药或者特殊人群的使用上，透皮给药方式要明显优于口服、注射给药。但是透皮制剂的研发依然面临剂量小（ $10\sim 15\text{mg}/\text{天}$ ），半衰期短，需频繁给药；分子量小（ <600 ），脂溶性适中； pKa 适中，以分子状态存在。只有具有亲脂性的药物才能有效地穿过角质层，因此药物必须具有理想的物理化学性质才能穿透角质层。只有强效药物才适合透皮贴剂，因为皮肤的不透水性对药物进入有天然的限制。成分通过皮肤角质层比较困难，导致起效慢，一般给药后几小时才能起效。贴片配方中的药物、粘合剂或辅料等可能引起皮疹、局部刺激、红斑或接触性皮炎。贴片粘合性可能不好，容易脱落。很多成分无法达到有效治疗浓度。离子药物不能通过透皮途径给药。随着年龄的增长，衰老细胞在皮肤中积聚并影响邻近细胞衰老，导致皮肤厚度、再生能力和屏障效应能力降低。一些本身对皮肤有刺激性和过敏性的药物不宜设计成透皮给药制剂。