

Dlaczego warto wybrać miejscową terapię diklofenakiem?

Ból i stan zapalny to jedne z najczęstszych dolegliwości, z jakimi zgłaszają się pacjenci do aptek. W związku z dużą częstością występowania tego problemu wybór odpowiedniej terapii przeciwbólowej i przeciwzapalnej nabiera kluczowego znaczenia. Co trzeba o niej wiedzieć?

Ból i stan zapalny? Wybierz NLPZ! Wybierz miejscowy diklofenak!

Zgodnie z drabiną analgetyczną WHO niesteroidowe leki przeciwzapalne (NLPZ) stanowią fundament pierwszego stopnia leczenia bólu [1]. Mechanizm działania NLPZ związany jest przede wszystkim z zahamowaniem syntezy prostaglandyn uczestniczących w rozwoju stanu zapalnego [2]. Wśród dostępnych NLPZ diklofenak wyróżnia się szczególną skutecznością w terapii bólu zapalnego.

Miejscowe niesteroidowe leki przeciwzapalne (NLPZ) są zalecane jako leki pierwszego wyboru w chorobie zwyrodnieniowej stawów, urazach tkanek miękkich, bólu pleców i szyi [3,4,5,6]. Kluczowe korzyści płynące z miejscowej aplikacji NLPZ obejmują przede wszystkim:

- Niższy stosunek stężenia w osoczu względem stężenia w tkankach [7]
- Mniejsze wchłanianie ogólnoustrojowe [8,9,10]
- Niską częstość występowania zdarzeń niepożądanych ze strony przewodu pokarmowego [6,7,8,9,10]
- Zmniejszone ryzyko interakcji lekowych.

Miejscowe NLPZ są preferowane w porównaniu z doustnymi NLPZ szczególnie u pacjentów w podeszłym wieku z możliwymi przeciwwskazaniami wynikającymi z chorób współistniejących i u pacjentów otrzymujących terapię wielolekową [4].

Miejscowy diklofenak - dowody na skuteczność

Diklofenak charakteryzuje się najniższą wartością IC_{50} spośród stosowanych miejscowo NLPZ [11,12,13]. IC_{50} to stężenie, przy którym substancja czynna hamuje 50% aktywności COX-2, co oznacza, że diklofenak wymaga mniejszej dawki do uzyskania efektu przeciwbólowego w porównaniu z innymi NLPZ. Według systematycznego przeglądu opublikowanego w British Medical Journal w 2021 roku, diklofenak podany miejscowo jest najbardziej obiecującym

miejscowym leczeniem przeciwbólowym w chorobie zwyrodnieniowej stawów [10]. Wśród leków miejscowych, niezależnie od dawki, preparaty diklofenaku wykazują największy efekt zmniejszenia bólu.

Mechanizm działania miejscowego diklofenaku opiera się na tworzeniu skórno-rezerwuaru substancji czynnej. Diklofenak jest preferencyjnie dystrybuowany i pozostaje w głębi tkanek objętych stanem zapalnym, gdzie osiąga stężenie do 20 razy wyższe niż w osoczu krwi [14]. Ta właściwość zapewnia przedłużone działanie przeciwbólowe i przeciwzapalne przy minimalnej ekspozycji systemowej (ogólnoustrojowej).

Voltaren Max versus badania naukowe

Voltaren Max żel stanowi zaawansowaną formułę diklofenaku z promotorem wchłaniania. Kliniczne badania wykazały, że preparat ten efektywnie przenika do stawów – poziom leku był wykrywalny zarówno w tkance maziowej, jak i w płynie maziowym u pacjentów poddanych operacji artroplastyki z powodu choroby zwyrodnieniowej stawu kolanowego [14].

Tym, na co warto zwrócić szczególną uwagę jest promotor wchłaniania (alkohol oleinowy), który zwiększa ilość substancji czynnej przenikającej przez warstwę rogową naskórka. Mechanizm działania alkoholu oleinowego polega na "zmiękczeniu" warstwy lipidowej oraz zwiększeniu jej płynności i przepuszczalności [15,16,17,18]. Rezultatem jest nawet 3-krotnie większe przenikanie diklofenaku w porównaniu z preparatem bez promotora wchłaniania [16,17,18].

Badania farmakokinetyczne z kolei wykazały mierzalne stężenia diklofenaku w tkance maziowej i płynie maziowym 12 godzin po zastosowaniu ostatniej dawki [14]. Stosunek diklofenaku pomiędzy tkanką maziową a osoczem oraz pomiędzy płynem maziowym a osoczem potwierdził preferencyjną dystrybucję leku w tkankach docelowych.

Voltaren Max to maksymalna siła w walce z bólem mięśni i stawów wśród żeli OTC zawierających diklofenak .

Nie zapomnij o plastrach Voltaren Forte

Voltaren Forte plastry stanowią innowacyjną formę podawania diklofenaku, wykorzystującą opatentowaną technologię (Patent europejski EP4153151B1) matrycy PSA (Pressure Sensitive

Adhesive). Matryca zawiera neutralne polimery i jest zoptymalizowana pod kątem ciągłego, stałego i przedłużonego uwalniania składnika aktywnego przez 24 godziny [19].

Badania wykazały, że penetracja substancji czynnej z plastra jest niezależna od BMI pacjenta, co czyni tę formę terapii uniwersalną dla różnych grup pacjentów [14]. Dodatkowo, łatwa aplikacja i doskonałe przyleganie do skóry sprawiają, że plastry są szczególnie odpowiednie dla pacjentów aktywnych fizycznie oraz osób poszukujących wygodnych rozwiązań w terapii bólu.

Plastry Voltaren Forte to jedyne plastry zawierające diklofenak sodowy, działające przez 24 godziny.*

Bibliografia:

1. Woron J. Leczenie bólu w oparciu o drabinę analgetyczną WHO. *Medycyna po Dyplomie* 2011;20(8):52-61
2. <https://www.mp.pl/bol/wytyczne/90989,racjonalne-stosowanie-niesteroidowych-lekow-przeciwzapalnych-w-terapii-bolu>
3. Bruyère O, et al. An updated algorithm recommendation for the management of knee osteoarthritis from the European Society for Clinical and Economic Aspects of Osteoporosis, Osteoarthritis and Musculoskeletal Diseases (ESCEO). *Semin Arthritis Rheum.* 2019;49(3):337-50
4. Derry S, Conaghan P, Da Silva JAP, Wien PJ, Moore RA. Topical NSAIDs for chronic musculoskeletal pain in adults. *Cochrane Database of Systematic Reviews* 2016, Issue 4. Art. No.: CD007400
5. Kloppenburg M, et al. 2018 update of the EULAR recommendations for the management of hand osteoarthritis. *Ann Rheum Dis.* 2019;78(1):16-24
6. Wiffen PJ, Xia J. Topical NSAIDs for chronic pain. *Curr Med Res Opin.* 2020;36(4):637-50
Fragment z załącznika (strona 6): "Miejscowe niesteroidowe leki przeciwzapalne (NLPZ) są zalecane jako leki pierwszego wyboru w chorobie zwyrodnieniowej stawów, urazach tkanek miękkich, bólu pleców i szyi"
7. Hagen M, et al. Diclofenac gel versus diclofenac tablet in ankle sprain. *Br J Sports Med.* 2017;33(9):1623-34
8. Makris UE, et al. Topical NSAIDs for musculoskeletal conditions. *Arch Intern Med.* 2010;37(6):1236-43
9. Rainsford KD, et al. Topical anti-inflammatory drugs in the treatment of rheumatic disorders. *Inflammopharmacology.* 2008;24(10):2967-92
10. da Costa BR, et al. Effectiveness of non-steroidal anti-inflammatory drugs for the treatment of pain in knee and hip osteoarthritis. *BMJ.* 2021;375:n2321

11. Gan T, et al. Diclofenac: an update on its mechanism of action and safety profile. *Curr Med Res Opin.* 2010;26(7):1715-1731
12. Rao P, Knaus EE. Evolution of nonsteroidal anti-inflammatory drugs (NSAIDs): cyclooxygenase (COX) inhibition and beyond. *J Pharm Pharm Sci.* 2008;11(2):81s-110s
13. Pradal J, et al. Importance of the formulation in the skin delivery of topical diclofenac. *J Pain Res.* 2019;12:1149-1154
14. Seefried L, et al. Synovial and plasma drug levels after topical diclofenac treatment. *Ther Adv Musculoskelet Dis.* 2020;12:1759720X20943088
15. Kim B, et al. Enhanced skin permeation of diclofenac by fatty acids. *Biomedical Dermatology.* 2020;4:10
16. Pradal J, et al. Importance of the formulation in the skin delivery of topical diclofenac: not all topical diclofenac formulations are the same. *J Pain Res.* 2019;12:1149-1154
17. Hasler-Nguyen N, et al. Comparison of Voltaren Emulgel (1.16%) versus Voltaren Emulgel (2.32%). GSK Healthcare Company Study Report 1702
18. Zolnay PA. Comparative study of ex vivo transdermal permeation and skin retention of diclofenac from Diclofenac 2.32% gel vs. Diclofenac 5% gel. *Mozgásszervi továbbképzés* 2021
19. ChPL Voltaren Forte 140 mg, plaster leczniczy 29.02.2024

*dotyczy plastrów leczniczych bez recepty z diclofenakiem “patent europejski EP4153151B1” oraz inne przyznane patenty i zgłoszenia w toku. CHPL voltaren Forte 140mg , plaster leczniczy 29.02. 2024r.

PM-PL-VOLT-25-00098