

**ІНСТРУКЦІЯ**  
**для медичного застосування препарату**

**БАРОЛ 10, БАРОЛ 20**  
**(BAROLE 10, BAROLE 20)**

**Загальна характеристика:**

**міжнародна та хімічна назви:** rabeprazole; 2-[{4-(3-метоксипропокси)-3-метилпiperидин-2-іл}-метилсульфеніл]-1H-бензimidазол натрію;

**основні фізико-хімічні властивості:** (10 мг) тверді непрозорі желатинові капсули №5 червоного/білого кольору, що містять сферичні або овальні пелети коричневого кольору; (20 мг) тверді непрозорі желатинові капсули №3 коричневого/темно-червоного кольору, що містять сферичні або овальні пелети коричневого кольору;

**склад:** 1 капсула містить рабепразолу натрію 10 мг або 20 мг (у вигляді кишковорозчинних пелет);

**допоміжні речовини:** (склад пелет) нейтральні пелети (№16-18), вкриті магнію карбонатом, гіпромелоза, натрію гідроксид, магнію карбонат легкий, тальк очищений, кислоти метакрилової сополімер, макрогол, титану діоксид (E171), заліза оксид червоний (E172), заліза оксид чорний (E172).

**Форма випуску.** Капсули кишковорозчинні.

**Фармакотерапевтична група.** Засоби для лікування пептичної виразки та гастроезофагеальної рефлюксної хвороби. Інгібітори "протонного насоса".

Код АТС А02В С04.

**Фармакологічні властивості.**

*Фармакодинаміка.*

*Механізм дії.* Рабепразол належить до класу антисекреторних сполук, які у хімічному відношенні є заміщеними бензimidазолами. Препарат не має антихолінергічних властивостей і не є антагоністом гістамінових H<sub>2</sub>-рецепторів, але пригнічує секрецію шлункової кислоти шляхом специфічного пригнічення ферменту H<sup>+</sup>/K<sup>+</sup>-АТФази на секреторній поверхні парієтальних клітин шлунка. Ця ферментна система вважається кислотним (протонним) насосом, і, таким чином, рабепразол класифікується як інгібітор протонного насоса шлунка, що блокує фінальну стадію вироблення кислоти. Рабепразол перетворюється в активну сульфанагідну форму шляхом протонування і, таким чином, реагує з доступними залишками цистеїну протонного насоса.

*Антисекреторна активність.* Після перорального прийому рабепразолу антисекреторний ефект спостерігається через годину і досягає максимуму через 2 - 4 год. Ефект пригнічення базальної функції та стимулювання їжею секреції кислоти через 23 год після прийому першої дози рабепразолу становив 62 і 82 % відповідно, а тривалість цього ефекту досягала 48 год. Ефективність рабепразолу відповідно пригнічення секреції кислоти дещо посилюється в процесі щоденного прийому 1 таблетки, але стабільне пригнічення секреції досягається через 3 дні після початку прийому цього препарату. Після завершення прийому рабепразолу секреторна активність нормалізується протягом 2 - 3 днів.

*Вплив на концентрацію гастрину в сироватці.* Після прийому 10 або 20 мг рабепразолу 1 раз на добу протягом 12 місяців у перші 2 - 8 тижнів терапії концентрація гастрину у сироватці збільшувалась, що призводило до пригнічення секреції кислоти. Концентрації гастрину повертаються до початкових рівнів, як правило, протягом 1-2 тижнів після припинення лікування.

*Інші ефекти.* Дотепер немає даних щодо системних ефектів з боку центральної нервової системи, серцево-судинної і дихальної системи, які були б спричинені прийомом рабепразолу.

*Фармакокінетика.*

*Абсорбція.* Капсули, що розчиняються у кишечнику, а не в шлунку. Абсорбція натрію рабепразолу

починається лише після того, як капсула минає шлунок. Рабепразол швидко абсорбується з кишечника. Пікові концентрації рабепразолу у плазмі досягаються приблизно через 3,5 год після прийому дози 20 мг. Пікові концентрації в плазмі ( $C_{max}$ ) та площа під кривою (AUC) рабепразолу мають лінійний характер у діапазоні доз від 10 до 40 мг. Абсолютна біодоступність після перорального прийому 20 мг (у порівнянні з внутрішньовенним введенням) становить близько 52%, значною мірою – через метаболізм першого проходження. Крім того, біодоступність при багаторазовому прийомі рабепразолу не збільшується. У здорових добровольців період напіввиведення з плазми становить приблизно годину (від 0,7 до 1,5 год), а сумарний кліренс дорівнює відповідно до оцінок  $283 \pm 98$  мл/хв. Їжа та час прийому протягом доби не впливають на абсорбцію натрію рабепразолу.

*Розподіл.* Ступінь зв'язування рабепразолу з білками плазми становить майже 97%.

*Метаболізм та екскреція.* Головними метаболітами, присутніми у плазмі, є тіоефір (M1) і карбонова кислота (M6), а другорядні метаболіти, що присутні в низьких концентраціях, представлені сульфеном (M2), диметилтіоефіром (M4) і кон'югатом меркаптурової кислоти (M5). Незначну антисекреторну активність має лише диметилловий метаболіт (M3), однак він не присутній у плазмі.

**Показання для застосування.** Пептична виразка дванадцятипалої кишки; пептична виразка шлунка; астрозофагеальна рефлюксна хвороба (ГЕРХ); невиразкова диспепсія; для ерадикації *Helicobacter pylori* (*H. pylori*) (у комбінації з відповідними антибактеріальними терапевтичними засобами); синдром Золлінгера-Еллісона; хронічний гастрит з підвищеною кислотоутворюючою функцією шлунка в стадії загострення.

**Спосіб застосування та дози.** При пептичній виразці, пептичній виразці шлунка та ГЕРХ призначають приймати по 20 мг 2 рази на добу. Тривалість курсу лікування при пептичній виразці ДПК становить 2 - 4 тижні, при виразці шлунка – 2 - 8 тижнів, а при ГЕРХ – 4 - 8 тижнів; підтримуюча терапія при ГЕРХ становить 10 або 20 мг 1 раз на добу до 12 місяців.

При невиразковій диспепсії призначають по 40 мг 1 раз на добу або по 20 мг двічі на добу протягом 2 - 3 тижнів.

Для ерадикації *H. pylori* необхідно звертатись до схем комплексної терапії відповідними антибіотиками (амоксациліном, кларитроміцином, тетрацикліном), метронідазолом, фуразолідом і препаратами вісмуту.

Барол по 20 мг 2 рази на добу + кларитроміцин по 500 мг 2 рази на добу + амоксицилін по 1 г 2 рази на добу протягом 7 днів.

Барол по 20 мг 2 рази на добу + кларитроміцин по 500 мг 2 рази на добу + метронідазол по 500 мг 2 рази на добу протягом 7 днів.

При синдромі Золлінгера-Еллісона початкова доза препарату становить 60 мг на добу, за необхідності дозу підвищують до 120 мг на добу (добову дозу 80 мг і більше слід розділяти на два прийоми), курс лікування та добір дози визначають індивідуально.

При хронічному гастриті з підвищеною кислотністю шлунка у стадії загострення призначають приймати по 40 мг на добу (по 1 капсулі 2 рази або 2 капсули 1 раз на добу) протягом 2 - 3 тижнів.

Капсули не можна розжовувати або дробити, треба ковтати їх цілими.

**Побічна дія.** Звичайно Барол добре переноситься пацієнтами. Побічні ефекти, що спостерігались, були здебільшого незначними, помірними і швидко минали. Найчастішими негативними проявами з боку травного тракту і печінки можуть бути діарея або запор, біль у животі, нудота, блювання, метеоризм, відрижка; зрідка - підвищення активності печінкових ферментів, порушення смакових відчуттів, сухість у роті.

З боку системи кровотворення в окремих випадках – лейкопенія, тромбоцитопенія.

З боку нервової системи можливі запаморочення, головний біль, збудження або сонливість, депресія.

*Алергічні реакції:* шкірний висип, свербіж, ангіоневротичний набряк, бронхоспазм.

*Інші прояви:* фарингіт, біль у спині, грипоподібний синдром, міалгія, біль у грудях, синусит, судоми

литкових м'язів, інфекція сечовивідних шляхів, у поодиноких випадках спостерігалися збільшення маси тіла, порушення зору, підвищена пітливість.

**Протипоказання.** Підвищена чутливість до рабепразолу, заміщених бензimidазолів або будь-якого іншого інгредієнта цього препарату. Вагітність і лактація. Дитячий вік.

**Передозування.**

*Симптоми:* підвищена пітливість, запаморочення, головний біль, сонливість, сухість у роті, нудота, блювання.

*Лікування:* специфічний антидот не відомий. При передозуванні необхідно проводити симптоматичне та підтримуюче лікування.

**Особливості застосування.** Перед початком застосування необхідно виключити наявність у хворого злякисного новоутворення.

При призначенні Баролу пацієнтам з важкими порушеннями функції нирок і печінки рекомендується бути обережним на ранніх стадіях терапії препаратом.

Не призначається для лікування дітей, оскільки немає досвіду його застосування у пацієнтів цієї вікової групи.

Безпека застосування Баролу в період вагітності не досліджена. Експериментально доведено, що препарат може проникати крізь плацентарний бар'єр, тому застосування його в період вагітності протипоказано. Невідомо, чи здатний рабепразол проникати у грудне молоко, тому Барол не слід призначати жінкам, які годують груддю.

Враховуючи властивий рабепразолу профіль побічних ефектів, можна вважати, що Барол не повинен негативно впливати на керування автотранспортом і роботу з потенційно небезпечними механізмами. Однак у разі виникнення сонливості рекомендується утримуватися від керування автомобілем і роботи з механізмами.

У разі виникнення дерматологічних проявів застосування препарату слід припинити.

**Взаємодія з іншими лікарськими засобами.** Рабепразол, як і інші інгібітори протонного насоса, метаболізується ферментами, що входять до печінкової системи цитохрому P<sub>450</sub> (CYP450). Рабепразол спричиняє сильне і тривале зниження продукування шлункової кислоти. Таким чином, рабепразол може взаємодіяти з препаратами, абсорбція яких залежить від показника рН шлункового вмісту. Прийом рабепразолу викликає зниження концентрацій кетоконазолу на 33 % в плазмі і підвищення на 22% мінімальних концентрацій дигоксину. Таким чином, окремі пацієнти, які застосовують зазначені препарати разом з Баролом, повинні знаходитись під наглядом лікаря для визначення необхідності корекції дози. Дослідження *in vitro* показали, що рабепразол метаболізується ізоферментами (CYP2C9 та CYP3A) системи CYP<sub>450</sub>. Ці дослідження дозволяють вважати, що Барол має низьку здатність взаємодіяти з іншими ліками; при цьому його вплив на метаболізм циклоспорину аналогічний впливу інших інгібіторів протонного насоса.

**Умови та термін зберігання.** Зберігати у недоступному для дітей, сухому, захищеному від світла місці при температурі не вище 25°C. Термін придатності – 2 роки.

**Умови відпуску.** За рецептом.

**Упаковка.** По 10 капсул у стрипі; по 10 стрипів у картонній упаковці.

**Заявник.** MEGA LIFESCIENCES (AUSTRALIA) PTY LTD.

МЕГА ЛАЙФСАЙЕНСІЗ (Австралія) Пті Лтд.

**Адреса.** Fact.2/No.9 Monterey Road, Dandenong, Victoria, Australia, 3175

**Виробник.** THEMIS LABORATORIES Pvt. Ltd.

ТЕМІС ЛАБОРАТОРИС Пвт. Лтд.

**Адреса.** А-214, ROAD No 30, WAGLE INDUSTRIAL ESTATE, THANE - 400 604.  
MAHARASHTRA, India.