

**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 сульфамідну 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.*

Інструкцію завантажено з сайту [www.dovgolit.com](http://www.dovgolit.com)

**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; гастроєзофагеальна 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, фуразолідоном 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> (CYP<sub>450</sub>). 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 (CYP<sub>2C9</sub> та CYP<sub>3A</sub>) 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

Інструкцію завантажено з сайту [www.dovgolit.com](http://www.dovgolit.com)

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

ТЕМІС ЛАБОРАТОРИС Пвт. Лтд.

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