

БАРОЛ (BAROL)

RABEPRAZOLUM A02B C04

Mega Lifesciences

СОСТАВ И ФОРМА ВЫПУСКА:

БАРОЛ 10

капс. кишечно-раств. 10 мг, № 10, № 30, № 100

Рабепразол натрий 10 мг

Прочие ингредиенты: pellets нейтральные (№16-18), покрытые магния карбонатом, гипромеллоза, натрия гидроксид, магния карбонат легкий, тальк очищенный, кислоты метакриловой сополимер, макрогол, титана диоксид (E171), железа оксид красный (E172), железа оксид черный (E172).

№ UA/4467/01/01 от 19.04.2006 до 19.04.2011

БАРОЛ 20

капс. кишечно-раств. 20 мг, № 10, № 30, № 100

Рабепразол натрий 20 мг

Прочие ингредиенты: pellets нейтральные (№16-18), покрытые магния карбонатом, гипромеллоза, натрия гидроксид, магния карбонат легкий, тальк очищенный, кислоты метакриловой сополимер, макрогол, титана диоксид (E171), железа оксид красный (E172), железа оксид черный (E172).

№ UA/4467/01/02 от 19.04.2006 до 19.04.2011

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА:

Фармакодинамика. Механизм действия. Рабепразол относится к классу антисекреторных соединений, по химической структуре относящихся к замещенным бензимидазолам. Препарат не обладает холиноблокирующими свойствами и не блокирует H_2 -рецепторы, но угнетает секрецию соляной кислоты в желудке путем специфического угнетения фермента H^+/K^+ -АТФазы на секреторной поверхности париетальных клеток желудка. Эта ферментная система считается кислотным (протонным) насосом, и, таким образом, рабепразол классифицируется как ингибитор протонного насоса желудка, который блокирует конечную стадию синтеза соляной кислоты. Рабепразол превращается в активную сульфонамидную форму путем протонирования и вступает во взаимодействие с доступными остатками цистеина протонного насоса.

Антисекреторная активность. После перорального приема рабепразола антисекреторный эффект развивается через 1 ч и достигает максимума через 2–4 ч. Степень угнетения базальной и стимулированной желудочной секреции через 23 ч после приема первой дозы рабепразола составляет 62 и 82% соответственно, а продолжительность этого эффекта достигает 48 ч. Антисекреторный эффект рабепразола несколько повышается

при курсовом ежедневном применении 1 таблетки в сутки, стабильное угнетение секреции достигается через 3 дня после начала приема. После завершения приема рабепразола секреторная активность желудка восстанавливается на протяжении 2–3 дней.

Влияние на концентрацию гастрина в плазме крови. После приема рабепразола в дозе 10 или 20 мг 1 раз в сутки концентрация гастрина в сыворотке крови в первые 2–8 нед терапии повышается, что способствует угнетению секреции соляной кислоты. Концентрация гастрина возвращается к исходному уровню, как правило, на протяжении 1–2 нед после прекращения лечения.

Другие эффекты. До настоящего времени нет данных относительно системных эффектов со стороны ЦНС, сердечно-сосудистой и дыхательной систем, которые могли бы быть вызваны приемом рабепразола.

Фармакокинетика. Абсорбция. Препарат выпускается в форме кишечнорастворимых капсул; абсорбция активного вещества начинается в кишечнике. Рабепразол быстро абсорбируется в кишечнике. Максимальная концентрация рабепразола в плазме крови достигается приблизительно через 3,5 ч после приема препарата в дозе 20 мг. Максимальная концентрация рабепразола в плазме крови и значение AUC имеют линейный характер в диапазоне доз от 10 до 40 мг. Абсолютная биодоступность после перорального приема в дозе 20 мг (по сравнению с в/в введением) составляет около 52%, в значительной степени в связи с метаболизмом первичного прохождения через печень. Биодоступность рабепразола при многократном приеме не повышается. У здоровых добровольцев период полувыведения из плазмы крови составляет около 1 ч (0,7–1,5 ч), а суммарный клиренс — 283 ± 98 мл/мин. Прием пищи и время приема на протяжении суток не влияют на абсорбцию рабепразола.

Распределение. Степень связывания рабепразола с белками плазмы крови составляет почти 97%.

Метаболизм и экскреция. Основными метаболитами рабепразола, определяемыми в плазме крови, являются тиоэфир (M1) и карбоновая кислота (M6), а к вторичным метаболитам, присутствующим в низких концентрациях, относят сульфон (M2), диметилтиоэфир (M4) и конъюгат меркаптуровой кислоты (M5). Незначительную антисекреторную активность имеет только диметилловый метаболит (M3), однако его не выявляют в плазме крови.

ПОКАЗАНИЯ:

пептическая язва желудка и двенадцатиперстной кишки;
гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь (ГЭРБ); неязвенная диспепсия;
для эрадикации *Helicobacter pylori* (в комбинации с соответствующими антибактериальными средствами); синдром Золлингера — Эллисона;
хронический гастрит с повышенной кислотообразующей функцией желудка в фазе обострения.

ПРИМЕНЕНИЕ:

при пептической язве желудка и ГЭРБ назначают по 20 мг 2 раза в сутки. Продолжительность курса лечения при пептической язве двенадцатиперстной кишки составляет 2–4 нед, язве желудка — 2–8 нед, при ГЭРБ — 4–8 нед; поддерживающая терапия при ГЭРБ — по 10–20 мг 1 раз в сутки до 12 мес.

При неязвенной диспепсии назначают по 40 мг 1 раз в сутки или по 20 мг 2 раза в сутки на протяжении 2–3 нед.

Для эрадикации *Helicobacter pylori* назначают в составе соответствующих комплексных терапевтических схем с антибиотиками (амоксициллином, кларитромицином, тетрациклином), метронидазолом, фуразолидоном и препаратами висмута, например: Барол по 20 мг 2 раза в сутки + кларитромицин по 500 мг 2 раза в сутки + амоксицилин по 1 г 2 раза в сутки на протяжении 7 дней.

Барол по 20 мг 2 раза в сутки + кларитромицин по 500 мг 2 раза в сутки + метронидазол по 500 мг 2 раза в сутки на протяжении 7 дней.

При синдроме Золлингера — Эллисона начальная доза препарата составляет 60 мг/сут, при необходимости дозу повышают до 120 мг/сут (суточную дозу 80 мг и более следует разделять на 2 приема), доза и продолжительность курса лечения определяются индивидуально.

При хроническом гиперацидном гастрите в фазе обострения назначают по 40 мг в сутки (по 1 капсуле 2 раза или по 2 капсулы 1 раз в сутки) на протяжении 2–3 нед.

Капсулы нельзя разжевывать или вскрывать, следует глотать их целиком.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ:

повышенная чувствительность к рабепразолу, замещенным бензимидазолам или другим ингредиентам препарата, период беременности и кормления грудью, детский возраст.

ПОБОЧНЫЕ ЭФФЕКТЫ:

обычно Барол хорошо переносится пациентами. Побочные эффекты, как правило, умеренно выражены и кратковременны. Наиболее частыми побочными эффектами *со стороны ЖКТ и печени* могут быть диарея или запор, боль в животе, тошнота, рвота, метеоризм, отрыжка, редко — повышение активности печеночных ферментов, нарушение вкуса, сухость во рту.

Со стороны системы кроветворения в отдельных случаях отмечают лейкопению, тромбоцитопению.

Со стороны нервной системы возможны головокружение, головная боль, возбуждение или сонливость, депрессия.

Возможны *аллергические реакции* — кожная сыпь, зуд, ангионевротический отек, бронхоспазм.

Другие проявления: фарингит, боль в спине, гриппоподобный синдром, миалгия, боль в груди, синусит, судороги икроножных мышц, инфекция мочевыводящих путей, в единичных случаях — увеличение массы тела, нарушение зрения, повышенная потливость.

ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ:

перед началом применения препарата необходимо исключить наличие у больного злокачественного новообразования.

Рекомендуется соблюдать осторожность в начале применения препарата Барол пациентам с тяжелыми нарушениями функции почек и печени.

Не назначается детям, поскольку нет опыта его применения у пациентов этой возрастной группы.

Безопасность применения Барола в период беременности не установлена.

Экспериментально выявлено, что препарат может проникать через плацентарный барьер, поэтому применение его в период беременности противопоказано. Неизвестно, проникает ли рабепразол в грудное молоко, поэтому Барол не следует назначать в период кормления грудью.

Маловероятно негативное влияние Барола на способность к управлению транспортными средствами и работе с потенциально опасными механизмами, однако в случае развития сонливости рекомендуется воздержаться от подобного рода деятельности.

В случае развития дерматологических проявлений применение препарата следует прекратить.

ВЗАИМОДЕЙСТВИЯ:

рабепразол, как и другие ингибиторы протонного насоса, метаболизируется ферментами системы цитохрома P450 (CYP 450).

Рабепразол вызывает сильное и продолжительное снижение секреции соляной кислоты в желудке, поэтому может влиять на фармакокинетику препаратов, абсорбция которых зависит от показателя pH желудочного содержимого.

Прием рабепразола вызывает снижение концентрации кетоконазола в плазме крови на 33% и повышение на 22% минимальной концентрации дигоксина. Таким образом, пациенты, применяющие указанные препараты вместе с Баролом, должны находиться под врачебным наблюдением для определения необходимости коррекции дозы.

In vitro установлено, что рабепразол метаболизируется изоферментами CYP 2C9 и CYP 3A системы CYP 450. Эти исследования позволяют считать, что Барол имеет низкую способность взаимодействовать с другими лекарственными средствами; при этом его влияние на метаболизм циклоспорина аналогично влиянию других ингибиторов протонного насоса.

ПЕРЕДОЗИРОВКА:

Симптомы: повышенная потливость, головокружение, головная боль, сонливость, сухость во рту, тошнота, рвота.

Лечение: специфический антидот неизвестен. При передозировке необходимо проводить симптоматическое и поддерживающее лечение.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ:

в сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.