2026年11月改訂（第3版）
2025年10月改訂（第2版）

貯　　法：室温保存
有効期間：3年

日本標準商品分類番号
871319

承認番号	30700AMX00203
販売開始	2025年10月

二環式プロスタグランジン誘導体緑内障・高眼圧症治療剤

セペタプロスト点眼液

処方箋医薬品注）

セタネオ®点眼液0.002%

SETANEO®ophthalmic solution

注）注意－医師等の処方箋により使用すること

Santen

2．禁忌（次の患者には投与しないこと）

2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

3．組成・性状

3.1 組成

販売名	セタネオ点眼液0.002%
有効成分	1mL中 セペタプロスト 20μg
添加剤	ポリソルベート80、D-マンニトール、クエン酸ナトリウム水和物、ベンザルコニウム塩化物、エデト酸ナトリウム水和物、pH調節剤

3.2 製剤の性状

販売名	セタネオ点眼液0.002%
pH	6.2～6.8
浸透圧比	0.9～1.1
性　状	無色澄明、無菌水性点眼剤

4．効能・効果

緑内障、高眼圧症

6．用法・用量

1回1滴、1日1回点眼する。

8．重要な基本的注意

8.1 本剤の投与により、虹彩や眼瞼への色素沈着（メラニンの増加）による色調変化、あるいは眼周囲の多毛化があらわれることがある。これらは投与の継続によって徐々に進行し、投与中止により停止する。眼瞼色調変化及び眼周囲の多毛化については、投与中止後徐々に消失、あるいは軽減する可能性があるが、虹彩色調変化については投与中止後も消失しないことが報告されている。混合色虹彩の患者では虹彩の色調変化は明確に認められるが、暗褐色の単色虹彩の患者（日本人に多い）においても変化が認められている。特に片眼投与の場合、左右眼で虹彩の色調に差が生じる可能性がある。これらの症状については、長期的な情報が十分に得られていないので、患者を定期的に診察し、十分観察すること。投与に際しては、これらの症状について患者に十分説明し、また、眼瞼色調変化、眼周囲の多毛化の予防あるいは軽減のため、投与の際に液が眼瞼皮膚等についた場合には、よくふき取るか、洗顔するよう患者を指導すること。[11.1.1、14.1参照]

8.2 角膜上皮障害（点状表層角膜炎、糸状角膜炎、角膜びらん）があらわれることがあるので、しみる、そう痒感、眼痛等の自覚症状が持続する場合には、直ちに受診するよう患者に指導すること。

9．特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 無水晶体眼又は眼内レンズ挿入眼の患者

嚢胞様黄斑浮腫を含む黄斑浮腫、及びそれに伴う視力低下を起こすおそれがある。

9.1.2 眼内炎（虹彩炎、ぶどう膜炎）のある患者

FP受容体作動薬で眼圧上昇がみられたとの報告がある。

9.1.3 閉塞隅角緑内障の患者

使用経験がない。

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。妊娠ウサギに静脈内投与した場合、母動物への影響として、0.04μg/kg/日（ヒト点眼時の2倍の曝露量（AUC））で、流産及び外陰部出血が認められ、0.1μg/kg/日（ヒト点眼時の5.8倍の曝露量（AUC））では黄体退行が認められた。胚・胎児への影響としては0.1μg/kg/日（ヒト点眼時の5.8倍の曝露量（AUC））で全胚死亡や高頻度の着床後胚死亡に伴う胎児生存率の減少が認められ、胎児体重の減少も認められた。また、非妊娠のサルを用いて静脈内投与した場合の子宮収縮への影響を評価したところ、0.2μg/kg/日（ヒト点眼時の4倍の曝露量（AUC））で軽微な自発収縮の亢進が認められた。

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。動物実験（ラット：静脈内投与）で乳汁中への移行が報告されている。

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

11．副作用

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

11.1 重大な副作用

11.1.1 虹彩色素沈着(0.3%) [8.1参照]

11.2 その他の副作用

	5%以上	1～5%未満	1%未満	頻度不明
眼	結膜充血(29.6%)、睫毛の異常(睫毛が長く、太く、多くなる等)(18.2%)、眼瞼部多毛	眼瞼色素沈着、眼瞼炎、点状角膜炎等の角膜障害、眼乾燥感、眼刺激	眼のそう痒感、結膜浮腫、眼脂	黄斑浮腫、眼瞼溝深化

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

患者に対し以下の点に注意するよう指導すること。

・本剤に含まれているベンザルコニウム塩化物はソフトコンタクトレンズに吸着されることがあるので、ソフトコンタクトレンズを装用している場合には、点眼前にレンズを外し、点眼後少なくとも5～10分間の間隔をあけて再装用すること。

・薬液汚染防止のため、点眼のとき、容器の先端が直接目に触れないように注意すること。

・患眼を開瞼して結膜嚢内に点眼し、1～5分間閉瞼して涙嚢部を圧迫させた後、開瞼すること。

・点眼したときに液が眼瞼皮膚等についた場合には、すぐにふき取るか、洗顔すること。[8.1参照]

・他の点眼剤を併用する場合には、少なくとも5分以上間隔をあけてから点眼すること。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

本剤を健康成人(8例)の両眼に1回1滴、1日1回7日間反復点眼したとき、セペタプロストの血漿中濃度はすべての被験者及び測定時点において定量下限(5.00pg/mL)未満であった。活性代謝物であるONO-AG-367の薬物動態パラメータは下表のとおりであった[1)]。

表　本剤点眼時の血漿中ONO-AG-367の薬物動態パラメータ

測定日	C_{max} (pg/mL)	T_{max} (h)[a)]	$T_{1/2}$ (h)	AUC_{inf} (pg·h/mL)
1日目	16.0±4.58	0.17 (0.17, 0.33)	0.51±0.12	11.9±3.29
7日目	11.5±3.38	0.17 (0.08, 0.33)	0.40±0.17	6.91±2.17

平均値±標準偏差、a)中央値(最小値，最大値)

16.3 分布

16.3.1 組織移行性

0.008% ^{3}H-セペタプロスト点眼液をサルの両眼に単回点眼したとき、眼組織中^{3}H濃度は角膜、虹彩、眼瞼結膜で高く、房水では点眼後2時間、その他の眼組織では点眼後0.5時間にC_{max}に達した後、減少した[2)]。

16.3.2 蛋白結合及び血球移行

ONO-AG-367のヒト血清蛋白結合率は83.9% ～85.4%であり、ヒト血球移行率は0%～0.4%であった(*in vitro*)[3)]。

16.4 代謝

セペタプロストは生体内のエステラーゼにより活性代謝物のONO-AG-367に代謝される。次いでβ酸化によりONO-AG-450に代謝されたのち、さらに水酸化、還元、タウリン抱合、グルクロン酸抱合及びそれらの反応の組み合わせによって代謝されると推測された[4)]。

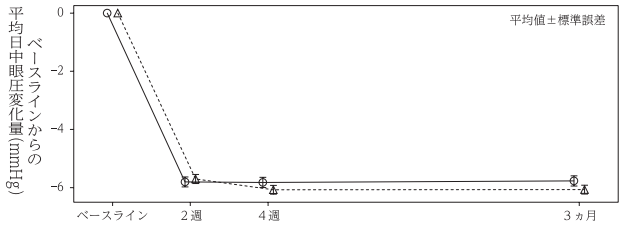
17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 国内第Ⅲ相試験

原発開放隅角緑内障又は高眼圧症患者を対象に、0.005%ラタノプロスト点眼液を対照とした無作為化評価者遮蔽並行群間比較試験において、本剤又は0.005%ラタノプロスト点眼液を1回1滴、1日1回、両眼に3ヵ月間点眼した。有効性の主要評価項目である投与4週後のベースラインからの平均日中眼圧値(9時、13時及び17時の3時点の眼圧値の平均値)の変化量は下表のとおりであり、本剤群と対照薬群の群間差の95%信頼区間の上限値(0.769mmHg)が非劣性マージン1.5mmHgを下回ったことから、本剤群の対照薬群に対する非劣性が検証された。また、ベースラインからの平均日中眼圧変化量の推移は下図のとおりであった。

副作用は、本剤群162例中59例(36.4%)に認められ、主な副作用は結膜充血29.6%(48/162例)であった[5)]。



○：本剤群　△：0.005% ラタノプロスト点眼液群

表　眼圧値の比較(mmHg)

	本剤 (N=162)	対照薬 (N=163)
ベースラインの平均日中眼圧 (平均値±標準偏差)	23.32±1.473	23.12±1.224
投与後4週のベースラインからの平均日中眼圧変化量 (平均値±標準偏差)	−5.82±2.203	−6.07±1.902
投与後4週のベースラインからの平均日中眼圧変化量の調整済み平均値[注)] (最小二乗平均値±標準誤差)	−5.77±0.160	−6.10±0.159
投与後4週の群間差(本剤－対照薬)[注)] [95%信頼区間]	0.32 [−0.120, 0.769]	

注)投与群、評価時点、投与群と評価時点の交互作用を固定効果、ベースラインの平均日中眼圧を共変量としたMixed-effects Model for Repeated Measures(MMRM)

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

18.1.1 プロスタノイド受容体に対する親和性

活性代謝物であるONO-AG-367は、ヒトFP及びヒトEP3受容体に対して結合(FP受容体に対するKi値は0.727nmol/L、EP3受容体に対するKi値は25.0nmol/L)し、アゴニスト活性(FP受容体に対するEC_{50}値は22.3nmol/L、EP3受容体に対するEC_{50}値は28.6nmol/L)を示した(*in vitro*)[6)]。

18.1.2 房水動態

レーザー誘発高眼圧サルを用いて、0.002%セペタプロスト点眼液を1日1回7日間反復点眼した時の房水動態をフルオロフォトメトリー法により検討したところ、房水産生量に変化は認められず、房水流出率(線維柱帯流出路を介すると推測される)及びぶどう膜強膜流出量を増大させた[7)]。

18.2 眼圧下降作用

正常眼圧イヌ及び正常眼圧サルにセペタプロスト点眼液を単回投与したとき、0.0001%以上の濃度において、濃度依存的な、有意な眼圧下降作用が認められた。正常眼圧サルにセペタプロスト点眼液を1日1回14日間反復点眼したとき、

0.0001%以上の濃度において、濃度依存的な、有意な眼圧下降作用が認められ、投与期間を通じて眼圧下降作用が持続した[7]。

19．有効成分に関する理化学的知見

一般名：セペタプロスト(Sepetaprost)

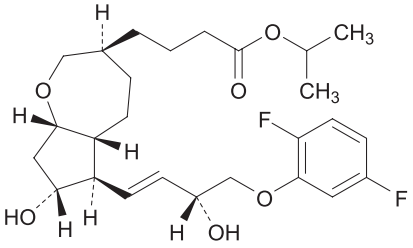
化学名：Propan-2-yl 4-{(3*S*,5a*R*,6*R*,7*R*,8a*S*)-6-[(1*E*,3*R*)-4-(2,5-difluorophenoxy)-3-hydroxybut-1-en-1-yl]-7-hydroxyoctahydro-2*H*-cyclopenta[*b*]oxepin-3-yl}butanoate

分子式：$C_{26}H_{36}F_2O_6$

分子量：482.56

性　状：本品は白色の結晶性の粉末又は粉末である。
本品はメタノールに極めて溶けやすく、1-メチル-2-ピロリジノン又はエタノール(99.5)に溶けやすく、水にほとんど溶けない。

構造式：



21．承認条件

医薬品リスク管理計画を策定の上、適切に実施すること。

22．包装

プラスチック点眼容器：2.5mL×10本

23．主要文献

1)社内資料：第Ⅰ相PK試験(101260007LT)(2025年8月25日承認、CTD2.7.2.2.2.1)　[67101]

2)社内資料：サル眼組織及び全身組織分布(2025年8月25日承認、CTD2.6.4.4.1)　[67102]

3)社内資料：ヒト生体材料を用いた*in vitro*試験(2025年8月25日承認、CTD2.7.2.2.1)　[67116]

4)社内資料：推定代謝経路(2025年8月25日承認、CTD2.6.4.5.3)　[67103]

5)社内資料：第III相検証試験(101260005LT)(2025年8月25日承認、CTD2.7.6.5)　[67104]

6)社内資料：受容体親和性及び選択性に関する試験(2025年8月25日承認、CTD2.6.2.2.1)　[67105]

7)社内資料：眼圧下降作用に関する試験(2025年8月25日承認、CTD2.6.2.2.2)　[67106]

24．文献請求先及び問い合わせ先

参天製薬株式会社　製品情報センター

〒530-8552(個別郵便番号)　大阪市北区大深町4-20

TEL 0120-921-839　06-7664-8624

受付時間 9:00～17:00(土・日・祝日を除く)

26．製造販売業者等

26.1 製造販売元

参天製薬株式会社

大阪市北区大深町4－20