(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2010 年 12 月 23 日(23.12.2010)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2010/147169 A1

(51) 国際特許分類:
A61K 31/444 (2006.01) *A61K 47/32* (2006.01)
A61K 9/20 (2006.01) *A61K 47/36* (2006.01)
A61K 9/32 (2006.01) *A61K 47/38* (2006.01)
A61K 9/36 (2006.01) *A61P 7/02* (2006.01)
A61K 47/10 (2006.01) *C07D 513/04* (2006.01)
A61K 47/26 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2010/060261

(22) 国際出願日: 2010 年 6 月 17 日(17.06.2010)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願 2009-145112 2009 年 6 月 18 日(18.06.2009) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 第一三共株式会社(DAIICHI SANKYO COMPANY, LIMITED) [JP/JP]; 〒1038426 東京都中央区日本橋本町三丁目５番１号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 釜田 信(KAMADA, Makoto). 木所 資典(KIDOKORO, Motonori). 関口 学(SEKIGUCHI, Gaku).

(74) 代理人: 石橋 公樹, 外(ISHIBASHI Koki et al.); 〒1340081 東京都江戸川区北葛西一丁目１６番１３号 第一三共株式会社内 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 国際調査報告（条約第 21 条(3)）

WO 2010/147169 A1

(54) **Title**: PHARMACEUTICAL COMPOSITION HAVING IMPROVED SOLUBILITY

(54) 発明の名称 : 溶出性の改善された医薬組成物

(57) **Abstract**: Provided is a solid pharmaceutical composition that exhibits an inhibitory effect on activated coagulation factor X (FXa), is useful as a preventative and/or therapeutic agent for thrombotic disease, and exhibits good solubility. Said pharmaceutical composition contains a compound represented by formula (I), a pharmacologically-permitted salt thereof, or a solvate of either. The content of the compound represented by formula (I) is at least 0.5% and less than 15% of the total weight of the pharmaceutical composition.

(57) 要約: 活性化血液凝固第Ｘ因子（ＦＸａ）の阻害作用を示し血栓性疾患の予防剤および／または治療剤として有用な式（Ｉ）で表される化合物、その薬理上許容される塩またはそれらの溶媒和物を含有する医薬組成物であって、良好な溶出性を示す医薬組成物の提供が求められている。本発明は、式（Ｉ）で表される化合物、その薬理上許容される塩またはそれらの溶媒和物を含有する固形の医薬組成物であって、式（Ｉ）で表される化合物の含有量が、医薬組成物全重量に対して０．５重量%以上１５重量%未満である医薬組成物に関する。