

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成24年5月24日 (2012.5.24)

【公表番号】特表2011-527986(P2011-527986A)

【公表日】平成23年11月10日 (2011.11.10)

【年通号数】公開・登録公報2011-045

【出願番号】特願2011-503236(P2011-503236)

【国際特許分類】

C 07 J 7/00 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 3/04 (2006.01)

A 61 P 3/06 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

A 61 P 25/16 (2006.01)

A 61 P 9/00 (2006.01)

A 61 P 37/02 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 19/02 (2006.01)

A 61 P 1/04 (2006.01)

A 61 K 31/569 (2006.01)

【 F I 】

C 07 J 7/00 C S P

A 61 P 29/00

A 61 P 3/10

A 61 P 3/04

A 61 P 3/06

A 61 P 25/28

A 61 P 25/16

A 61 P 9/00

A 61 P 37/02

A 61 P 25/00

A 61 P 19/02

A 61 P 29/00 1 0 1

A 61 P 1/04

A 61 K 31/569

【手続補正書】

【提出日】平成24年3月30日 (2012.3.30)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

結晶性 1,7 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 1,7 - トリオール。

【請求項 2】

非晶質 1,7 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 1,7 - トリオールを実

質的に含まない、請求項 1 に記載の結晶性 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオール。

【請求項 3】

17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールの結晶性形態が無水物である、請求項 2 に記載の結晶性 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオール。

【請求項 4】

前記無水物が、10 . 38 ± 0 . 1、16 . 20 ± 0 . 1 および 17 . 75 ± 0 . 1 度の 2 のピーク位置を有し、ならびに、12 . 66 ± 0 . 1、15 . 10 ± 0 . 1、16 . 73 ± 0 . 1、28 . 92 ± 0 . 1 度の 2 からなる群より選択される 1 つ、2 つもしくは 3 つのピーク位置を有する粉末 X 線回折パターンを特徴とする I 型の 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールである、請求項 3 に記載の結晶性 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオール。

【請求項 5】

前記無水物が、約 2106 および 1674 cm⁻¹ のピーク位置に吸収を示し、ならびに、2887、1467、1437、712、683、247 および 226 cm⁻¹ からなる群より選択されるピーク位置に 1 つ、2 つもしくは 3 つの吸収を示すラマン分光法スペクトル、または図 5 A もしくは図 5 B のものと実質的に同一のラマンスペクトルを特徴とする I 型の 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールである、請求項 3 に記載の結晶性 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオール。

【請求項 6】

前記 I 型の 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールが、(i) 10 / 分の温度傾斜を用いて得られた約 266 におけるシャープな吸熱を示す示差走査熱量測定サーモグラム、または (i i) 本質的に図 6 A または図 6 B に示された形態構造をさらに特徴とする、請求項 4 または 5 に記載の結晶性 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオール。

【請求項 7】

前記無水物が、(i) 2 . 49 ± 0 . 1、5 . 04 ± 0 . 1 および 16 . 20 ± 0 . 1 度の 2 のピーク位置を有し、ならびに、7 . 46 ± 0 . 1、10 . 44 ± 0 . 1、17 . 73 ± 0 . 1、28 . 92 ± 0 . 1 度の 2 からなる群より選択される 1 つ、2 つもしくは 3 つのピーク位置を有する粉末 X 線回折パターンを特徴とする II 型の 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールである、請求項 3 に記載の結晶性 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオール。

【請求項 8】

前記 II 型の 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールが、10 / 分の温度傾斜を用いて得られた約 259 におけるシャープな吸熱を示す示差走査熱量測定サーモグラムをさらに特徴とする、請求項 7 に記載の結晶性 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオール。

【請求項 9】

17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールの結晶性形態が溶媒和物である、請求項 2 に記載の結晶性 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオール。

【請求項 10】

前記溶媒和物が、15 . 25 ± 0 . 1、15 . 64 ± 0 . 1、16 . 60 ± 0 . 1 度の 2 のピーク位置を有し、ならびに、8 . 35 ± 0 . 1、12 . 31 ± 0 . 1 および 27 . 82 ± 0 . 1 度の 2 からなる群より選択される 1 つ、2 つもしくは 3 つのピーク位置を有する粉末 X 線回折パターンを特徴とする III 型の 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールである、請求項 9 に記載の結晶性 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオール。

【請求項 1 1】

前記溶媒和物が、約 2108 および 1666 cm^{-1} のピーク位置に吸収を示し、ならびに、 2950 、 2933 、 1469 、 1437 、 711 、 681 、 251 および 224 cm^{-1} からなる群より選択されるピーク位置に 1 つ、2 つもしくは 3 つの吸収を示すラマン分光法スペクトル、または図 1 3 A もしくは図 1 3 B のものと実質的に同一のラマンスペクトルを特徴とする、III 型の 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールである、請求項 9 に記載の結晶性 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオール。

【請求項 1 2】

前記 III 型の 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールが、 10 / 分の温度傾斜を用いて得られた約 $105 \sim 108$ が中心である広がった吸熱を示す示差走査熱量測定サーモグラム、および 10 / 分の温度傾斜を用いて $20 \sim 100$ まです約 $8 \sim 9.6\%$ の重量減損を示す熱重量分析サーモグラムをさらに特徴とする、請求項 1 1 に記載の結晶性 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオール。

【請求項 1 3】

前記溶媒和物が、 15.24 ± 0.1 、 15.66 ± 0.1 、 16.62 ± 0.1 度の 2 のピーク位置を有し、ならびに、 8.34 ± 0.1 、 10.50 ± 0.1 、 12.30 ± 0.1 、 16.23 ± 0.1 および 27.78 ± 0.1 度の 2 からなる群より選択される 1 つ、2 つもしくは 3 つのピーク位置を有する粉末 X 線回折パターンを特徴とする IV 型の 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールである、請求項 9 に記載の結晶性 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオール。

【請求項 1 4】

前記溶媒和物が、約 2107 および 1666 cm^{-1} のピーク位置に吸収を示し、ならびに、 2950 、 2933 、 1469 、 1437 、 711 、 681 、 467 および 224 cm^{-1} からなる群より選択されるピーク位置に 1 つ、2 つもしくは 3 つの吸収を示すラマン分光法スペクトル、または図 1 6 A もしくは図 1 6 B のものと実質的に同一のラマンスペクトルを特徴とする IV 型の 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールである、請求項 9 に記載の結晶性 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオール。

【請求項 1 5】

前記 IV 型の 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールが、 10 / 分の温度傾斜を用いて得られた約 $105 \sim 108$ が中心である広がった吸熱を示す示差走査熱量測定サーモグラム、および 10 / 分の温度傾斜を用いて $20 \sim 100$ まです約 $9 \sim 9.7\%$ の重量減損を示す熱重量分析サーモグラムをさらに特徴とする、請求項 1 3 または 1 4 に記載の結晶性 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオール。

【請求項 1 6】

結晶性 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールを実質的に含まない非晶質 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオール。

【請求項 1 7】

前記非晶質 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールが、(i) 16 度の 2 が中心である幅広のバンドを有する粉末 X 線回折パターン、もしくは図 2 0 と実質的に同一の粉末 X 線回折パターン、および (ii) 1 / 分の温度傾斜を用いて逆転熱流トレースの変曲点から得られる約 44 の T_g を示す変調型示差熱分析サーモグラムを特徴とする、請求項 1 6 に記載の非晶質 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオール。

【請求項 1 8】

前記非晶質 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールが、2105 および 1673 cm^{-1} のピーク位置に吸収を示し、ならびに、2972、2937、1439、749、684、484、470 および 226 cm^{-1} からなる群より選択される 1 つ、2 つもしくは 3 つのピーク位置を有するラマンスペクトル、または図 19 A もしくは図 19 B のものと実質的に同一のラマンスペクトルを特徴とする、請求項 16 に記載の非晶質 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオール。

【請求項 19】

前記非晶質 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールが、10 / 分の温度傾斜を用いて得られた、約 30 から約 110 まで加熱したとき約 11 % の重量減損、さらに 200 まで加熱したとき約 5 % のさらなる重量減損を示す熱重量分析サーモグラムをさらに特徴とする、請求項 17 または 18 に記載の非晶質 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオール。

【請求項 20】

17 - エチニル - アンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールのメタノール - 水、メタノール - テトラヒドロフランもしくはアセトン溶液の容量を減少させる工程、または 17 - エチニル - アンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールのメタノール - 水溶液からメタノールを、水の添加と同時の蒸留によって除去する工程であって、ここで該溶液の初期容量は実質的に維持される、工程、または 17 - エチニル - アンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールのエタノール溶液からエバポレーションによって溶媒を除去する工程を含む、結晶性 I 型の 17 - エチニル - アンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールの作製方法。

【請求項 21】

炎症状態または代謝異常を処置するための、医薬の製造における、結晶性 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールの使用であって、該結晶性 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールは、非晶質 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールまたは他の結晶性形態の 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールを実質的に含まない I 型の 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールである、使用。

【請求項 22】

前記代謝異常が 2 型糖尿病、高血糖、肥満または高コレステロール血症である、請求項 21 に記載の使用。

【請求項 23】

前記炎症状態がアルツハイマー病、パーキンソン病、または、虚血に関連する炎症、出血または外傷である、請求項 21 に記載の使用。

【請求項 24】

前記炎症状態が自己免疫疾患である、請求項 21 に記載の使用。

【請求項 25】

前記自己免疫疾患が 1 型糖尿病、多発性硬化症、関節リウマチまたは炎症性腸疾患である、請求項 24 に記載の使用。

【請求項 26】

前記炎症性腸疾患が潰瘍性大腸炎である、請求項 25 に記載の使用。

【請求項 27】

被検体における炎症状態または代謝異常を処置するための組成物であって、該組成物は、有効量の結晶性 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールを含み、該結晶性 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールは、非晶質 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールまたは他の結晶性形態の 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールを実質的に含まない I 型の 17 - エチニルアンドロスタ - 5 -

エン - 3 , 7 , 17 - トリオールである、組成物。

【請求項 28】

前記代謝異常が 2 型糖尿病、高血糖、肥満または高コレステロール血症である、請求項 27 に記載の組成物。

【請求項 29】

前記炎症状態がアルツハイマー病、パーキンソン病、または、虚血に関連する炎症、出血または外傷である、請求項 27 に記載の組成物。

【請求項 30】

前記炎症状態が自己免疫疾患である、請求項 27 に記載の組成物。

【請求項 31】

前記自己免疫疾患が 1 型糖尿病、多発性硬化症、関節リウマチまたは炎症性腸疾患である、請求項 30 に記載の組成物。

【請求項 32】

前記炎症性腸疾患が潰瘍性大腸炎である、請求項 31 に記載の組成物。

【請求項 33】

医薬の調製のための、非晶質 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールを実質的に含まない結晶性 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールの使用、または 1 種類以上の薬学的に許容され得る賦形剤と、非晶質 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールを実質的に含まない結晶性 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールとを含む組成物の使用。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0030

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0030】

本発明の他の実施形態および利点は、本明細書（番号付けした実施形態および特許請求の範囲を含む）中の他の箇所に記載したとおりである。

本発明は、例えば以下の項目を提供する。

（項目 1）

結晶性 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオール。

（項目 2）

非晶質 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールを実質的に含まない、項目 1 に記載の結晶性 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオール。

（項目 3）

17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールの結晶性形態が無水物である、項目 2 に記載の結晶性 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオール。

（項目 4）

前記無水物が、(i) 10.38 ± 0.1 、 16.20 ± 0.1 および 17.75 ± 0.1 度の 2 のピーク位置を有し、任意選択で、 12.66 ± 0.1 、 15.10 ± 0.1 、 16.73 ± 0.1 、 28.92 ± 0.1 度の 2 からなる群より選択される 1 つ、2 つもしくは 3 つのピーク位置を有する粉末 X 線回折パターン、(ii) 10 / 分の温度傾斜を用いて得られた約 266 におけるシャープな吸熱を示す示差走査熱量測定サーモグラム、または (iii) (i) および (ii) の特性を有する I 型の 17 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールである、項目 3 に記載の結晶性無水物。

（項目 5）

前記 I 型の 17 - エチルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールが、(i) 約 2106 および 1674 cm^{-1} のピーク位置に吸収を示し、任意選択で、2887、1467、1437、712、683、247 および 226 cm^{-1} からなる群より選択されるピーク位置に 1 つ、2 つもしくは 3 つの吸収を示すラマン分光法スペクトル、または図 5 A もしくは図 5 B のものと実質的に同一のラマンスペクトル、(i i) 本質的に図 6 A または図 6 B に示された形態構造、あるいは (i i i) (i) および (i i) の特性を有する、項目 4 に記載の結晶性無水物。

(項目 6)

前記無水物が、(i) 2.49 ± 0.1 、 5.04 ± 0.1 および 16.20 ± 0.1 度の 2 のピーク位置を有し、任意選択で、 7.46 ± 0.1 、 10.44 ± 0.1 、 17.73 ± 0.1 、 28.92 ± 0.1 度の 2 からなる群より選択される 1 つ、2 つもしくは 3 つのピーク位置を有する粉末 X 線回折パターン、(i i) 10 / 分の温度傾斜を用いて得られた約 259 におけるシャープな吸熱を示す示差走査熱量測定サーモグラム、または (i i i) (i) および (i i) の特性を有する I I 型の 17 - エチルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールである、項目 3 に記載の結晶性無水物。

(項目 7)

17 - エチルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールの結晶性形態が溶媒和物である、項目 2 に記載の結晶性 17 - エチルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオール。

(項目 8)

前記溶媒和物が、(i) 15.25 ± 0.1 、 15.64 ± 0.1 、 16.60 ± 0.1 度の 2 のピーク位置を有し、任意選択で、 8.35 ± 0.1 、 12.31 ± 0.1 および 27.82 ± 0.1 度の 2 からなる群より選択される 1 つ、2 つもしくは 3 つのピーク位置を有する粉末 X 線回折パターン、(i i) 10 / 分の温度傾斜を用いて得られた約 105 ~ 108 が中心である広がった吸熱を示す示差走査熱量測定サーモグラム、(i i i) 10 / 分の温度傾斜を用いて 20 ~ 100 までで約 8 ~ 9.6 % の重量減損を示す熱重量分析サーモグラム、または (i v) (i) および (i i) もしくは (i) および (i i i) の特性を有する I I I 型の 17 - エチルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールである、項目 7 に記載の溶媒和物。

(項目 9)

前記 I I I 型の 17 - エチルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールが、約 2108 および 1666 cm^{-1} のピーク位置に吸収を示し、任意選択で、2950、2933、1469、1437、711、681、251 および 224 cm^{-1} からなる群より選択されるピーク位置に 1 つ、2 つもしくは 3 つの吸収を示すラマン分光法スペクトル、または図 13 A もしくは図 13 B のものと実質的に同一のラマンスペクトルを有する、項目 8 に記載の溶媒和物。

(項目 10)

前記溶媒和物が、(i) 15.24 ± 0.1 、 15.66 ± 0.1 、 16.62 ± 0.1 度の 2 のピーク位置を有し、任意選択で、 8.34 ± 0.1 、 10.50 ± 0.1 、 12.30 ± 0.1 、 16.23 ± 0.1 および 27.78 ± 0.1 度の 2 からなる群より選択される 1 つ、2 つもしくは 3 つのピーク位置を有する粉末 X 線回折パターン、(i i) 10 / 分の温度傾斜を用いて得られた約 105 ~ 108 が中心である広がった吸熱を示す示差走査熱量測定サーモグラム、(i i i) 10 / 分の温度傾斜を用いて 20 ~ 100 までで約 9 ~ 9.7 % の重量減損を示す熱重量分析サーモグラム、または (i v) (i) および (i i)、(i) および (i i i)、もしくは (i)、(i i) および (i i i) の特性を有する I V 型の 17 - エチルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオールである、項目 8 に記載の溶媒和物。

(項目 11)

前記 I V 型の 17 - エチルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 17 - トリオール

ルが、約 2 1 0 7 および 1 6 6 6 cm^{-1} のピーク位置に吸収を示し、任意選択で、2 9 5 0、2 9 3 3、1 4 6 9、1 4 3 7、7 1 1、6 8 1、4 6 7 および 2 2 4 cm^{-1} からなる群より選択されるピーク位置に 1 つ、2 つもしくは 3 つの吸収を示すラマン分光法スペクトル、または図 1 6 A もしくは図 1 6 B のものと実質的に同一のラマンスペクトルを有する、項目 1 0 に記載の溶媒和物。

(項目 1 2)

結晶性 1 7 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 1 7 - トリオールを実質的に含まない非晶質 1 7 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 1 7 - トリオール。

(項目 1 3)

(i) 約 1 6 度の 2 が中心である幅広のバンドを有する粉末 X 線回折パターン、もしくは図 2 0 と実質的に同一の粉末 X 線回折パターン、(i i) 1 / 分の温度傾斜を用いて逆転熱流トレースの変曲点から得られる約 4 4 の T_g を示す変調型示差熱分析サーモグラム、または (i i i) (i) および (i i) の特性を有する、項目 1 2 に記載の非晶質 1 7 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 1 7 - トリオール。

(項目 1 4)

(i) 1 0 / 分の温度傾斜を用いて得られた、約 3 0 から約 1 1 0 まで加熱したとき約 1 1 % の重量減損、さらに 2 0 0 まで加熱したとき約 5 % のさらなる重量減損を示す熱重量分析サーモグラム、(i i) 約 2 1 0 5 および 1 6 7 3 cm^{-1} のピーク位置に吸収を示し；任意選択で、2 9 7 2、2 9 3 7、1 4 3 9、7 4 9、6 8 4、4 8 4、4 7 0 および 2 2 6 cm^{-1} からなる群より選択される 1 つ、2 つもしくは 3 つのピーク位置を有するラマンスペクトル、または図 1 9 A もしくは図 1 9 B のものと実質的に同一のラマンスペクトル、または (i i i) (i) および (i i) の特性を有する、項目 1 3 に記載の非晶質 1 7 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 1 7 - トリオール。

(項目 1 5)

1 7 - エチニル - アンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 1 7 - トリオールのメタノール - 水、メタノール - テトラヒドロフランもしくはアセトン溶液の容量を減少させる工程、または 1 7 - エチニル - アンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 1 7 - トリオールのメタノール - 水溶液からメタノールを、水の添加と同時の蒸留によって除去する工程であって、ここで該溶液の初期容量は実質的に維持される、工程、または 1 7 - エチニル - アンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 1 7 - トリオールのエタノール溶液からエバポレーションによって溶媒を除去する工程を含む、結晶性 I 型の 1 7 - エチニル - アンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 1 7 - トリオールの作製方法。

(項目 1 6)

被検体に有効量の結晶性 1 7 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 1 7 - トリオールを投与することを含み、任意選択で、該結晶性 1 7 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 1 7 - トリオールは、非晶質 1 7 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 1 7 - トリオールまたは他の結晶性形態の 1 7 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 1 7 - トリオールを実質的に含まない I 型の 1 7 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 1 7 - トリオールである、被検体の炎症状態または代謝異常を処置するための方法。

(項目 1 7)

前記代謝異常が 2 型糖尿病、高血糖、肥満または高コレステロール血症である、項目 1 6 に記載の方法。

(項目 1 8)

前記炎症状態がアルツハイマー病、パーキンソン病、虚血に関連する炎症、出血または外傷、任意選択で、心筋梗塞もしくは脳卒中、自己免疫疾患、任意選択で、1 型糖尿病、多発性硬化症、関節リウマチまたは炎症性腸疾患、任意選択で、潰瘍性大腸炎もしくはクローン病である、項目 1 6 に記載の方法。

(項 目 1 9)

医薬の調製のための、非晶質 1 7 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 1 7 - トリオールを実質的に含まない結晶性 1 7 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 1 7 - トリオールの使用、または 1 種類以上の薬学的に許容され得る賦形剤と、非晶質 1 7 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 1 7 - トリオールを実質的に含まない結晶性 1 7 - エチニルアンドロスタ - 5 - エン - 3 , 7 , 1 7 - トリオールとを含む組成物の使用。