

生物催化法生产 11 α -羟基坎利酮技术

11 α -羟基坎利酮是生产依普利酮的主要原料。依普利酮是一种口服高选择性醛酮受体拮抗剂，通过竞争性抑制醛固酮与盐皮质激素受体结合，拮抗醛固酮与上皮（如肾脏）和非上皮（如脏、血管和脑）组织中的激素受体结合。醛酮通过与盐皮质激素受体的结合诱导肾脏对钠离子的重吸性以及还有其它可能的机制升高血压。因此依普利酮的主要药效表现为减少 Na⁺及液体滞留而降低血压。依普利酮在体外与受体（雄激素受体、黄体酮受体、糖皮质激素受体）的结合活性较螺内酯弱。该品对其它受体基本无影响。

法玛西亚（Pharmacia）公司研制开发的依普利酮于 2002 年 9 月获得美国 FDA 批准上市，商品名为 Inspra，其作用特点是半衰期较长，一天服用一次，即可以在一天内有效控制血压，因此服用较为方便。依普利酮对轻到中度高血压具有良好的疗效，病人的耐受性好。在 2003 年，美国 FDA 又批准了依普利酮治疗急性心肌梗死后充血性心力衰竭的新适应症，临床研究证实依普利酮对于改善急性心肌梗死后左心室收缩功能异常（心脏射血分数 \leq 40%）和有充血性心力衰竭临床依据的稳定病人的生存率有着很好作用。