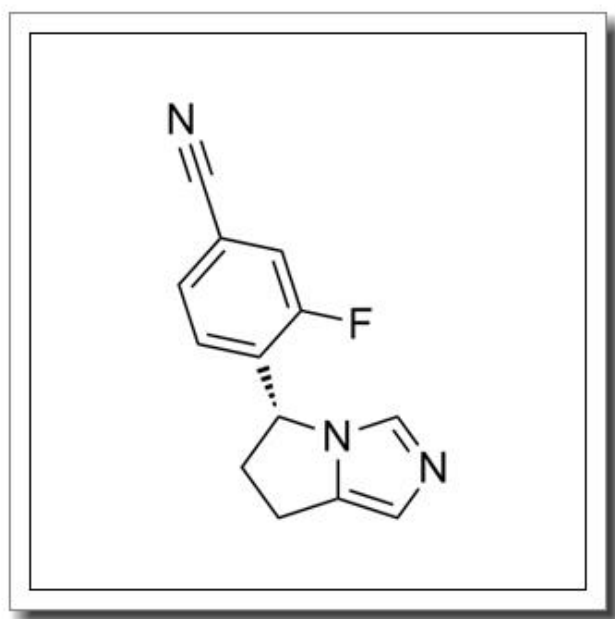


Osilodrostat

4-[(5R)-6,7-Dihydro-5H-pyrrolo[1,2-c]imidazol-5-yl]-3-fluorobenzonitrile



产品基本信息

属性	值
化学名称	4-[(5R)-6,7-Dihydro-5H-pyrrolo[1,2-c]imidazol-5-yl]-3-fluorobenzonitrile
中文名称	Osilodrostat
CAS 号	928134-65-0
分子式	C ₁₃ H ₁₀ FN ₃
分子量	227.237
纯度	≥96%

产品说明

1. 产品概述与化学特性

本品为 4-[(5R)-6,7-二氢-5H-吡咯并[1,2-c]咪唑-5-基]-3-氟苯甲脞 (Osilodrostat), CAS 号 928134-65-0, 分子式 C₁₃H₁₀FN₃, 分子量 227.237。该化合物是一种高纯度 (≥96%) 的杂环芳香族衍生物, 具有独特的立体选择性结构 (5R 构型), 其氟原子和脞基的引入显著增强了生物活性与代谢稳定性。常温下为白色至类白色结晶性粉末, 易溶于有机溶剂如 DMSO 和甲醇, 微溶于水。

2. 生物化学功能与重要性

Osilodrostat 是一种强效且选择性的 11β-羟化酶 (CYP11B1) 抑制剂, 通过阻断皮质醇合成的最终步骤, 显著降低内源性糖皮质激素水平。其作用机制涉及与酶活性中心的血红素铁结合, 竞争性抑制肾上腺皮质激素前体向皮质醇的转化。该特性使其成为研究下丘脑-垂体-肾上腺轴调控的核心工具化合物, 并为库欣综合征的靶向治疗提供分子基础。

3. 主要应用领域与具体用途

在科研领域, 本品广泛应用于内分泌疾病模型构建、类固醇合成通路研究及药物耐药性机制探索。临床上, 作为 FDA 批准的孤儿药 (商品名 Isturisa), 用于治疗成人库欣综合征。实验室应用中, 建议工作浓度为 0.1-10 μM (需根据细胞模型优化), 可用于体外酶活性检测、原代肾上腺细胞培养及动物模型诱导。

4. 储存条件与使用建议

长期储存需避光密封保存于 -20℃ 干燥环境, 短期使用可置于 4℃ (≤1 个月)。配制溶液时建议使用无血清培养基或生理盐水 (含 0.1% BSA 可增强溶解性), 避免反复冻融。操作时需在通风橱中进行, 佩戴防尘口罩及丁腈手套。开封后建议充氮保存以延长稳定性。

5. 质量控制与安全信息

本产品经 HPLC-UV 检测纯度 ≥96%, 残留溶剂符合 ICH Q3C 标准。急性毒性数据 (大鼠口服 LD₅₀ > 2000 mg/kg) 显示低急性风险, 但长期暴露可能影响肾上腺功

能。废弃物处理需遵循危险化学品规程，不得直接排入下水系统。安全数据表（SDS）包含完整毒理学信息，实验前请务必查阅。

注：本说明仅限科研用途，不适用于诊断或治疗人类疾病。临床使用需获得监管机构批准。