

Diklazepam¹⁷

Grupp: bensodiazepiner.

Sammansättning och former: detektion av förekomst som vita och gröna tabletter.

Benämningar: Diklazepam

Doser: Dosen 1 mg diklazepam uppges vara jämförbar med 10 mg diazepam, som en substans med anxiolytiska, muskelavslappande och humörhöjande effekter. Användare har via internetforum rapporterat doser kring 1-3 mg.

Tillförsätsätt: Bensodiazepiner sväljs vanligen som tabletter men kan även injiceras. Missbruk genom att bensodiazepiner tas nasalt har även rapporterats.

Verkningsmekanism/effekt: Diklazepam är en substituerad bensodiazepin som inte är licensierad för medicinsk användning. Diklazepam en positions isomer av 4-klorodiazepam och är ett 2-kloro derivat av diazepam. Bensodiazepiner används kliniskt för behandling av oro och sömnsvårigheter. Verkningsmekanismen för effekten av bensodiazepiner sker genom modulering av GABA_A-receptorn som utgörs av ett (Cl-kanal) komplex. Bensodiazepiner är en grupp av substanser med anxiolytiska (ångestdämpande), sedativa-hypnotiska, antikonvulsiva och muskelrelaxerande effekter.

Substituering med klor har använts för att optimera kliniska effekter av bensodiazepiner. Det är väl etablerat att halogenatomer i fenytringen hos bensodiazepiner modulerar farmakologisk aktivitet. En kloratom i 2'-positionen av fenytringen (vilket diklazepam har) har påvisats öka antikonvulsiva (antimetrazol) muskel relaxerande effekter hos möss och katter.

I en studie med olika bensodiazepiner utförd på råttor hämmades den lokomotoriska aktiviteten av diklazepam på ett (linjärt) dos-relaterat sätt. Tillräckligt höga doser resulterade i en näst intill fullständig inhibering av rörligheten hos djuren. I samma studie konstaterades att de optimala förutsättningarna för anxiolytiska effekter är en metyl grupp i position 1 av bensodiazepin molekylen, en fluor eller en klor atom i position 2 och ingen substituent i position 3. Dessa krav uppfyller substansen diklazepam. För sedativa effekter konstaterades optimala förutsättningar vara en klor atom i position 2 vilket diklazepam har, ingen substitution i position 1 och en hydroxyl grupp i position 3 av molekylen.

Substansen binder i likhet med diazepam till både centrala och perifera bensodiazepin (BZD) receptorer. Diklazepam har uppvisat hög affinitet för den centrala typen av BZD receptorn.

¹⁷ Uppgifterna är hämtade från Folkhälsomyndighetens klassificeringsdokument (dnr 1573/2014-3.2.4). Se vidare även Bensodiazepiner i almanähet och avsnitt 4.3.

I en in vitro studie med hjärnceller från råttor uppges att diklazepam har mycket hög receptor affinitet, Ki-värde 4,35nM. I samma studie anges för diazepam Ki-värdet 14,0nM.

Användare beskriver diklazepam som jämförbar med etizolam men mer långtidsverkande.

Skadeverkningar-risker: Giftinformationscentralen har vid sjukhusfall med diklazepam noterat symtom som inkluderar medvetandesänkning. Biverkningar som rapporterats med bensodiazepiner inkluderar dåsighet, svaghet, berusningskänsla, överkänslighet, minnes-och koncentrationssvårigheter samt hallucinationer. Kombinationsmissbruk av bensodiazepiner tillsammans med andra CNS depressiva substanser, såsom alkohol och opiater, ökar risken för respiratorisk depression och död. Risk för utveckling av korsberoende till bensodiazepiner. Medicinskt ska bensodiazepiner endast användas för korttids behandling av ångest eller sömnbesvär som är svåra och handikappande. Detta eftersom risk för tolerans och beroende av bensodiazepiner kan utvecklas efter bara några veckor. Bensodiazepiner och cannabis är psykoaktiva substanser som experimentella studier visat påverkar bilkörningsförmågan och som när alkohol även används, ökar risken för att bli inblandad eller ansvarig för trafikolyckor signifikant.

Sammanfattande beskrivning: En bensodiazepin utan känd medicinsk användning.