

Etakvalon

Namn, CAS-nr

IUPAC: 3-(2-ethylphenyl)-2-methylquinazolin-4(3H)-one

Kemiskt namn: 3-(2-etylfenyl)-2-metylkinazolin-4(3H)-on

Kortnamn: etakvalon

CAS: 7432-25-9

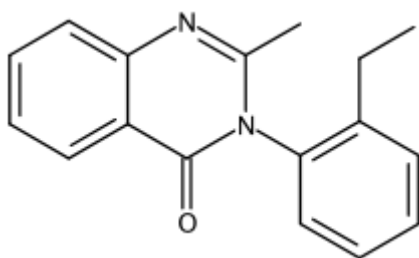
Övriga namn: Aolan, athinazone, etaqualone och ethinazone

(EMCDDA, 2019b; NFC, 2019; Scifinder, 2019; TVL, 2019)

Summaformel, kemisk struktur, strukturelika substanser

Summaformel:

Kemisk struktur:



Grupptillhörighet: Övriga

Strukturelika substanser: Metakvalon som är internationellt reglerad enligt 1971 års psykotropkonvention.

Etakvalon skiljer sig från metakvalon genom att ha en etyl- istället för en metylgrupp i position 2 på fenylingen. Etakvalon liknar också metylmetakvalon, aflakvalon och mebrokvalon som är formellt noterade i EMCDDA.

(EMCDDA, 2019b; *Förordning (1992:1554) om kontroll av narkotika (t.o.m. SFS 2019:611)*; Läkemedelsverket, 2019)

Fysikaliska data

Fysikaliskt tillstånd: Fast form. Etakvalon har identifierats i pulver.

Molekylvikt (g/mol): 264,32

Kokpunkt (°C): 421,1±38,0 (beräknad)

Densitet (g/cm³): 1,14±0,1 (beräknad)

Föreningar/blandningar: -

(EMCDDA, 2019b; Scifinder, 2019)

Framställning

Framställning finns beskriven i patent (Beiersdorf, 1962).

Verkningsmekanismer, effekter

Substansspecifika

Etakvalon syntetiserades och patenterades i början av 1960-talet och har marknadsförts som ett sömnmedel (Beiersdorf, 1962). Det finns idag ingen medicinsk användning av etakvalon. Det finns dokumentation på verkningsmekanism och toxicitet.

- LD₅₀ efter intravenös injektion på mus har bestämts till 320 mg/kg (NIH, 2019).
- I en *in vitro*-studie definierades minst nio olika gamma-aminobutyrinsyra (GABA)_A-receptorkomplex med hjälp av ämnen som påverkade bindningen av [³H]muscimol (en GABA_A-receptoragonist som binder till samma ställe som GABA på receptorn). Tjugosex substanser, däribland etakvalon och metakvalon, ökade inbindningen av muscimol (EC₅₀= 84 och 95 μM för etakvalon respektive metakvalon) (Felt Squires & Saederup, 2000).

Användare på drogforum beskriver effekter som eufori, lugn, tappad kroppskontroll (koordinationssvårigheter), ökad socialisering, ökad sexlust och temporär minnesförlust (Drogforum).

Gruppsspecifika

Farmakologiskt tillhör etakvalon ångestdämpande eller lugnande-sömngivande substanser. Hit hör också barbiturater, bensodiazepiner och flera kinazolinonderivat som tex metakvalon och etakvalon vars verkningsmekanismer är kopplade till GABA_A-receptorer. GABA_A-receptoragonister binder till olika ställen på receptorn och modulerar GABA_A-receptorkomplexet, vilket ökar GABAs affinitet till receptorn och förstärker dess dämpande effekt i hjärnan (EMCDDA, 2019b; Hammer et al., 2015; Sieghart, 2015).

Dokumenterad förekomst

a) *Rapporterad förekomst (antal ärenden) i Sverige*

Uppgiftslämnare	2011-2012	2013	2014	2019 (till december)
Nationellt forensiskt centrum	0	1 (pulver)	0	0
Tullverkets laboratorium		6 (pulver)		0
Rättsmedicinalverket*	-	-	-	-
Giftinformationscentralen	0	0	0	0

*Rättsmedicinalverket saknar analytisk referens och därmed kan inte etakvalon bekräftas i dödsfall eller i deras övriga ärenden.

Folkhälsomyndigheten har yttrat sig enligt förstörandelagen 13 § lag (2011:111). Fyra beslut om förstörande har inkommit till myndigheten.

Identifierad i Sverige första gången 2013.

(GIC, 2019; NFC, 2019; RMV, 2019; TVL, 2019)

b) *Rapporterad förekomst i Europa*

Formellt noterad i november 2009 hos EMCDDA. Har identifierats i beslag (Sverige, Storbritannien, Frankrike, Belgien, Danmark, Tyskland, Italien, Norge, Ryssland, Spanien, Schweiz och Turkiet).

(EMCDDA, 2019b; UNODC, 2019)

c) *Rapporterad förekomst i övriga världen*

Formellt noterad i 2009 hos UNODC. Har identifierats i beslag (Australien, Brasilien, Kanada, Kina, och USA).

(UNODC, 2019)

d) *Medicinsk, vetenskaplig och industriell användning*

Etakvalon har använts som sömnmedel på 1960-talet. Ingen medicinsk användning är känd idag men användning kan förekomma inom farmakologisk forskning (EMCDDA, 2019).

Beredningsform, exponering, administrering, dos

Identifierad i pulver, (EMCDDA, 2019b; NFC, 2019; TVL, 2019)

Säljs som pulver i olika kvantiteter bl.a. 1g och 100 g (Webbshop).

Personer som skriver på drogforum berättar om intag av 50-500 mg. Administrerings sättet är vanligtvis oralt men även rökning har prövats (Drogforum, 2019).

Missbruksdosen för en ej tillvand brukare är okänd.

Kombinationsmissbruk

-

Hälsorisker

Substansspecifika

Det finns ingen kännedom om dödsfall eller förgiftningar kopplade etakvalon. Användare på drogforum beskriver effekter som eufori, lugn, tappad kroppskontroll (koordinationssvårigheter), ökad socialisering, ökad sexlust och temporär minnesförlust (Drogforum, 2019).

Gruppspecifika

Lugnande, sömngivande och ångestlösande substanser som bensodiazepiner, barbiturater och vissa kinazolinonderivat, medför risk för utveckling av tolerans och beroende. Kombinationer med andra CNS-depressiva medel ökar risk för överdos och allvarliga intoxikationer (Bailey, 1981; EMCDDA, 2019a; Pascarelli, 1973).

Med den spridningsmöjlighet som finns i och med försäljning via webshoppar och utbyte av information på nät drogforum i det svenska samhället kan det inte bortses från att drogen etakvalon kan påverka folkhälsan negativt och medföra sociala problem. En samlad bedömning utifrån information från expertnätverk (NADiS) är att användning av lugnande, sömngivande och ångestlösande substanser förekommer och att det finns ett intresse att inhandla och bruka psykoaktiva substanser. Därmed finns ett samhällsbekymmer som är kopplat till dessa substansers potential för beroende och missbruk (NADiS, 2019).

Tillgänglighet

Substansen kan införas, hanteras och säljas lagligt i avsaknad av klassificering. Ökad tillgänglighet och därmed ökad användning kan befaras då bruk och införsel inte är straffbart.

Nuvarande kontrollstatus

Oreglerad i Sverige. Reglerad i Ungern, Finland och Turkiet (EMCDDA, 2019b).

Övrig information

-

Rekommendation

Folkhälsomyndigheten rekommenderar att 3-(2-etylfenyl)-2-metylkinazolin-4(3H)-on förklaras som narkotika:

- Tillgängligt underlag ger stöd för att ämnet har euforiska effekter eller beroendeframkallande egenskaper.
- Tillgängligt underlag ger stöd för att ämnet har hälsofarliga egenskaper.
- Missbruk förekommer och kan komma att öka i Sverige.

För att förhindra negativa konsekvenser rekommenderar Folkhälsomyndigheten att 3-(2-etylfenyl)-2-metylkinaolin-4(3H)-on med kortnamn etakvalon förs upp på förordningen (1992:1554) om kontroll av narkotika.

Notifiera EU-kommissionen

Risken för att produkter styrs över till den oreglerade svenska marknaden samt den snabba spridningen via etablerade kanaler gör att det är angeläget att agera med snabbhet. Brådskande skäl enligt Europaparlamentets och rådets direktiv (EU) 2015/1535 bör åberopas.

Referenser

- Bailey, D. N. (1981). Methaqualone Ingestion: Evaluation of Present Status. *J Anal Toxicol*, 5(6), 279-282.
- Beiersdorf. *Assignee*: P. Beiersdorf & Co. A.-G. . (1962). *Patent*: Therapeutically useful quinazolinone derivatives. BE615282.
- EMCDDA. (2019a). Tillgängligt från: <http://www.emcdda.europa.eu/drug-profiles> (inhämtat december 2019)
- EMCDDA. (2019b). European Monitoring Centre for Drugs and Drug Addiction (EMCDDA). The European information system and database on new drugs (EDND) (login database). Tillgängligt från: <http://www.emcdda.europa.eu/index.cfm> (inhämtat september 2019)
- Felt Squires, R. & Saederup, E. (2000). Additivities of Compounds that Increase the Numbers of High Affinity [3H]Muscimol Binding Sites by Different Amounts Define More than 9 GABAA Receptor Complexes in Rat Forebrain: Implications for Schizophrenia and Clozapine Research. *Neurochem Res*, 25(12), 1587-1601.
- Förordning (1992:1554) om kontroll av narkotika (t.o.m. SFS 2019:611)*. Tillgängligt från: http://www.riksdagen.se/sv/dokument-lagar/dokument/svensk-forfattningssamling/forordning-19921554-om-kontroll-av-narkotika_sfs-1992-1554.
- GIC. (2019). Giftinformationscentralen. Information delat inom Nätverket för den aktuella drogsituationen i Sverige (NADiS).
- Hammer, H., Bader, B. M., Ehnert, C., Bundgaard, C., Bunch, L., Hoestgaard-Jensen, K., Schroeder, O. H., Bastlund, J. F., Gramowski-Voss, A. & Jensen, A. A. (2015). A Multifaceted GABAA Receptor Modulator: Functional Properties and Mechanism of Action of the Sedative-Hypnotic and Recreational Drug Methaqualone (Quaalude). *Mol Pharmacol*, 88(2), 401-420.
- Läkemedelsverket. (2019). *Läkemedelsverkets föreskrifter (LVFS 2011:10) om förteckningar över narkotika*. Tillgängligt från: https://lakemedelsverket.se/upload/lvfs/LVFS_2011-10.pdf
- NADiS. (2019). Nätverket för den aktuella drogsituationen i Sverige.
- NFC. (2019). Nationellt forensiskt centrum. Information delat inom Nätverket för den aktuella drogsituationen i Sverige (NADiS).

- NIH. (2019). Tillgängligt från: <https://chem.nlm.nih.gov/chemidplus/rn/7432-25-9>
(inhämtat Nov 2019 2019).
- Pascarelli, E. F. (1973). Methaqualone Abuse, The Quiet Epidemic. *JAMA*, 224(11), 1512-1514.
- RMV. (2019). Rättsmedicinalverket. Information delat inom Nätverket för den aktuella drogsituationen i Sverige (NADiS).
- Scifinder. (2019). Tillgängligt från:
<https://scifinder.cas.org/scifinder/view/scifinder/scifinderExplore.jsf>
(inhämtat september 2019)
- Sieghart, W. (2015). Allosteric modulation of GABAA receptors via multiple drug-binding sites. *Adv Pharmacol*, 72, 53-96.
- TVL. (2019). Tullverkets laboratorium. Information delat inom Nätverket för den aktuella drogsituationen i Sverige (NADiS).
- UNODC. (2019). Tillgängligt från: <https://www.unodc.org/LSS/Home/NPS>
(inhämtat september 2019)