

Propylfenidat⁸¹

1. Namn, gatunamn, synonymer, CAS-nr

IUPAC: propyl-2-phenyl-2-(piperidin-2-yl)acetate

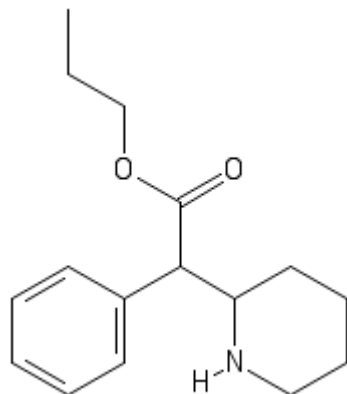
CAS: 1071564-47-0

Övrigt: PPH,

(EMCDDA, 2015; PubMed, 2015; Scifinder, 2015)

2. Summaformel, kemisk struktur

Summaformel: C₁₆ H₂₃ N O₂



Familje/Grupptillhörighet: Psykotropa substanser, piperidiner

Strukturlika substanser: Metylfenidat som är listad, klass II, Narkotikakonventionen (UN) 1971 och 3,4-diklorometylfenidat, metylnaftidat (HDMP-28), isopropylfenidat samt etylfenidat som samtliga är reglerade som narkotika i Sverige. (EMCDDA, 2015; PubMed, 2015; Scifinder, 2015)

3. Fysikaliska data

Fysikaliskt tillstånd: -

Molekylvikt (g/mol): 261,36

Kokpunkt (°C): 358,3±17,0

Densitet (g/cm³): 1,041±0,06

Föreningar/blandningar: Detektion av förekomst som vitt pulver. (EMCDDA, 2014; NFC, 2015; TVL, 2015)

4. Framställning

Metoder för framställning av piperidiner inklusive propylfenidat finns beskrivna i den vetenskapliga litteraturen. Substansen propylfenidat kan framställas med metylfenidat som utgångsmaterial (Bourland, 1997; EMCDDA, 2015).

5. Verkningsmekanism/effekt

Substansen propylfenidat är strukturellt relaterad till isopropylfenidat, metylfenidat och etylfenidat som är narkotikareglerade (EMCDDA, 2015). Substansen marknadsförs via internetsidor och 1 gram av substansen går att köpa för ca £20 (idag ca 257 SEK) (ACMD, 2015).

⁸¹ Uppgifterna är i sin helhet hämtade från Folkhälsomyndighetens klassificeringsdokument (dnr 03811-2015).

Den metylfenidat-relaterade substansen propylfenidat kan förväntas ha psykoaktiva effekter som liknar de för metylfenidat (ACMD, 2015). Metylfenidat är ett potent läkemedel som bland annat används som psykostimulerande behandlingsmetod för ADHD (attention-deficit hyperactivity disorder). Bland andra kända biverkningar med metylfenidat så kan substansen orsaka beroende (FASS, 2014). Metylfenidat verkar huvudsakligen genom att hämma återupptaget av dopamin och noradrenalin (ACMD, 2015).

Substansen isopropylfenidat har liksom metylfenidat konstaterats ha stimulerande effekter. Isopropylfenidat har hög affinitet för DAT och potenta effekter på dopaminåterupptaget i likhet med metylfenidat och etylfenidat. Metylfenidat, isopropylfenidat och etylfenidat har påvisats ha liknade och signifikanta bindningsaffiniteter för DAT medan interaktion med SERT istället visat sig vara liten och inte av signifikant betydelse för substanserna (ACMD, 2015; Markowitz, Zhu, & Patrick, 2013).

En studie har konkluderat att relativt metylfenidat är substanserna propylfenidat och isopropylfenidat in vitro omkring en tredjedel så potenta jämfört med metylfenidat. In vivo har en annan studie med råttor uppgivit att relativt metylfenidat är propylfenidat och isopropylfenidat en femtedel respektive en tredjedel så potenta som metylfenidat. Etylfenidat påvisades in vitro vara något mindre än hälften så potent som metylfenidat och in vivo nästan lika potent (fyra femtedelar så potent som metylfenidat). Genom studierna konkluderas att en ökning av storleken på estergruppen hos metylfenidat (e.g. ersättning av metylgruppen med haloalkyl eller alkyl substituent) signifikant reducerar substansernas potenta egenskaper jämfört med metylfenidat (Schweri et al., 1985). Lite är idag känt kring de neurokemiska egenskaperna för propylfenidat men dessa förväntas vara liknade som de för narkotikareglade isopropylfenidat (ACMD, 2015).

6. Exponeringssätt, missbruksdos

Administration av substansen propylfenidat med varierande administrationssätt har rapporterats av användare i doser kring 25-60mg (Tripsit, 2015).

7. Kombinationsmissbruk

-

8. Hälsorisker

Individuella risker

Metylfenidat-relaterade substanser inklusive propylfenidat som marknadsförs som NPS kan förväntas ha psykoaktiva effekter som är så lika de för metylfenidat att de kan antas innebära liknade risker för användare (ACMD, 2015). Metylfenidat kan orsaka beroende och har kända biverkningar såsom hjärtklappning, förändringar i humör, humörsvängningar eller personlighetsförändringar, utslag, klåda, känna sig ovanligt exalterad, överaktiv eller ohämmad (mani), se, känna eller höra saker som inte finns (tecken på psykos) m.fl (FASS, 2014). Användare rapporterar en stark vilja att åter dosera med stimulerande substanser (ACMD, 2015). Propylfenidat beskrivs av användare ha stimulerande effekter, varningar har utfärdas eftersom informationen kring propylfenidat är begränsad i kombination med att substansen sägs ha en högre risk att kunna orsaka vanebildande beteende

samt att substansen har en kort historisk användning av människor, användare uppmanas vara vaksam med doser och frekvens vid användning av propylfenidat. Vidare uppges att propylfenidat har en verkningsstid på 1,5-3 h (Tripsit, 2015). Användare har rapporterat att substansen propylfenidat ger känslor av ökat välbefinnande, diskret stimulering, ökat fokus, ökad motivation (Bluelight, 2015).

Folkhälsorisker

Beslag har gjorts i Sverige och inom EU. Information från expertnätverk och Internet visar att användning av substansen ökar. Med den spridning som finns i Sverige och närliggande länder kan det inte bortses från att bruket av propylfenidat kan få konsekvenser för folkhälsan och medföra sociala problem.

9. Dokumenterad förekomst

Medicinsk och industriell förekomst

Ingen medicinsk användning är känd (ACMD, 2015) men användning kan förekomma inom farmakologisk forskning.

Rapporterad förekomst i Sverige

Uppgiftslämnare	2013	2014	2015
Nationellt forensiskt centrum (NFC)			
Rättsmedicinalverket (RMV)			
Tullverkets laboratorium (TVL)			1 beslag
Giftinformationscentralen (GIC)			

(GIC, 2015; NFC, 2015; RMV, 2015; TVL, 2015)

Folkhälsomyndigheten har yttrat sig enligt Förstörelagen 13 § lag (2011:111).

EMCDDA

Beslag har förekommit under år 2015 i Sverige, Danmark och Slovenien.

10. 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.

11. Missbruksprofil

-

12. Nuvarande kontrollstatus

Substansen propylfenidat har upptagits på Statsrådets förordning om för konsumentmarknaden förbjudna psykoaktiva ämnen (19.12.2014/1130) (EMCDDA, 2015; FINLEX, 2015). En temporär klassificering (temporary class drug order (TCDO)) av metylfenidat relaterade substanser, däribland propylfenidat har föreslagits i Storbritannien (ACMD, 2015).

13. Konventioner

Återfinns varken på 1961 års narkotikakonvention eller på 1971 års psykotropkonvention.

14. Övrig information

-

15. Rekommendation

propyl-2-fenyl-2-(piperidin-2-yl)acetat rekommenderas för narkotikaförklaring:

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

För att förhindra ytterligare skada rekommenderar Folkhälsomyndigheten, i samråd med berörda instanser, att propyl-2-fenyl-2-(piperidin-2-yl)acetat med kortnamn propylfenidat förs upp på förordningen (1992:1554) om kontroll av narkotika.

16. 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 direktiv 98/34 EG bör åberopas.

17. Referenser

ACMD. (2015). Methylphenidate-based NPS: A review of the evidence of use and harm. In H. OFFICE (Ed.).

Bluelight. (2015). Novel stimulant, Propylphenidate (PPH) from [http://www.bluelight.org/vb/threads/749138-Novel-stimulant-Propylphenidate-\(PPH\)](http://www.bluelight.org/vb/threads/749138-Novel-stimulant-Propylphenidate-(PPH))

Bourland, J. A. (1997). The influence of ethanol on drug metabolism and disposition via carboxylesterase-mediated transesterification (cocaine, meperidine, methylphenidate). (Copyright (C) 2015 American Chemical Society (ACS). All Rights Reserved.).

EMCDDA. (2014). Report on the risk assessment of 1-(1,3-benzodioxol-5-yl)-2-(pyrrolidin-1-yl) pentan-1-one (3,4-methylenedioxypropylvalerone, MDPV) in the framework of the Council Decision on new psychoactive substances RISK ASSESSMENTS.

EMCDDA. (2015). European database on new drugs. Retrieved 2014, from <https://ednd.emcdda.europa.eu/html.cfm/>

FASS. (2014). Metylfenidat. Retrieved 2014-09-05, from <http://www.fass.se/LIF/substance?userType=2&substanceId=IDE4POC3U98BGVERT1>

FINLEX. (2015). Statsrådets förordning om för konsumentmarknaden förbjuda psykoaktiva ämnen. Retrieved from <http://www.finlex.fi/sv/laki/ajantasa/2014/20141130>.

GIC. (2015). Giftinformationscentralen

Markowitz, J. S., Zhu, H. J., & Patrick, K. S. (2013). Isopropylphenidate: an ester homolog of methylphenidate with sustained and selective dopaminergic activity and reduced drug interaction liability. *J Child Adolesc Psychopharmacol*, 23(10), 648-654. doi: 10.1089/cap.2013.0074

NFC. (2015). Nationellt forensiskt centrum

PubMed. (2015). PubMed. <http://www.ncbi.nlm.nih.gov/pubmed/>

RMV. (2015). Rättsmedicinalverket

Schweri, M. M., Skolnick, P., Rafferty, M. F., Rice, K. C., Janowsky, A. J., & Paul, S. M. (1985). [3H]Threo-(±)-methylphenidate binding to 3,4-dihydroxyphenylethylamine uptake sites in corpus striatum: correlation with

the stimulant properties of ritalinic acid esters. *J. Neurochem.*, 45(4), 1062-1070. doi: 10.1111/j.1471-4159.1985.tb05524.x
Scifinder. (2015). Scifinder. Retrieved 2014, from
<https://scifinder.cas.org/scifinder/view/scifinder>
Tripsit. (2015). Propylphenidate. from
<http://drugs.tripsit.me/propylphenidate>