

Proskalin

1. Namn, gatunamn, synonymer, CAS-nr

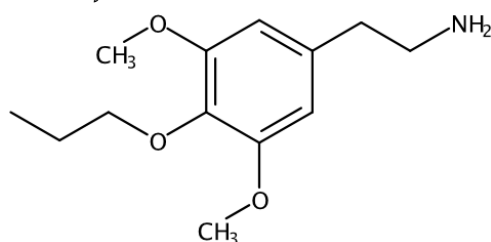
IUPAC: 2-(3,5-dimethoxy-4-propoxyphenyl)ethanamine

CAS: 39201-78-0

Övrigt: 3,5-dimetoxi-4-propoxifenyletylamin, 3,5-dimethoxy-4-propoxyphenethylamine, 4-propoxy-3,5-DMPEA, 3,5-dimethoxy-4-propoxy-benzeneethanamine, proscaline (EMCDDA, 2017; NFC, 2017; PubMed, 2017; Scifinder, 2017; TVL, 2017).

2. Summaformel, kemisk struktur

Summaformel: $C_{13}H_{21}NO_3$



Familje/Grupptillhörighet: psykotropa substanser, fenetylaminer

Strukturlika substanser: Meskalin som är internationellt reglerad enligt 1971 års psykotropkonvention, eskalin, allyleskalin och metallyleskalin som sedan tidigare är narkotika reglerade i Sverige. (EMCDDA, 2017; Scifinder, 2017)

3. Fysikaliska data

Fysikaliskt tillstånd: -

Molekylvikt (g/mol): 239,31

Kokpunkt (°C): 342,9±37,0

Densitet (g/cm³): 1,036±0,06

Föreningar/blandningar: Detektion av förekomst som gröna och rosa tabletter, som vitt pulver samt ljusgult pulver (EMCDDA, 2017; NFC, 2017; Scifinder, 2017; TVL, 2017).

4. Framställning

Metoder för framställning av syntetiska fenetylaminer inklusive proskalin finns beskrivna i den vetenskapliga litteraturen (EMCDDA, 2017; A. Shulgin & Shulgin, 2000).

5. Verkningsmekanism/effekt

Substansen proskalin är en substituerad fenetylamin som är strukturellt relaterad till meskalin som är internationellt reglerad enligt 1971 års psykotropkonvention. Substanserna skiljer sig genom att vara 4-propoxi respektive 4-metoxi substituerad på fenylingen. Proskalin uppvisar även strukturella likheter med narkotika reglerade eskalin som är substituerad med en 4-etoxi grupp på fenylingen.

Det har konkluderats att hallucinogen aktivitet generellt återfinns hos fenetylaminer med en primär aminogrupp och som har 3,5- eller 2,5 dimetoxi substituenten samt en hydrofob grupp i 4 positionen av den aromatiska ringen. Även om inte 4 substitueringen har studerats lika extensivt vad gäller 3,4,5 orienteringen så har ett stort antal olika grupper utvärderats hos 2,4,5 trisubstituerade substanser. Substitutions mönstret hos

meskalin (3,4,5-trimetoxi) i den aromatiska ringen har konstaterats göra substanserna med detta mönster till de minst potenta av studerade substitutioner. Men genom att flytta 3-metoxi substituenten till position 2 och/eller ersätta 4-metoxigruppen med en mer hydrofob grupp så fås substanser med högre aktivitet (David E Nichols, 1994). Unika egenskaperna hos fenetylaminer har bl.a. konstaterats beror av substituten i position 4 av fenytringen. Om exempelvis 4-metoxigruppen hos meskalin ersätts med en 4-etoxigrupp som hos eskalin så ökar den orala aktiviteten hos substansen jämfört med meskalin (David E. Nichols, 1986).

Genom en *in silico* studie konstaterades att bulkiga substituenten i fjärde positionen av fenytringen skulle vara fördelaktigt för ökad biologisk aktivitet. Studien konkluderar vidare att detta skulle kunna förklara varför eskalin är 5 gånger mer aktiv än meskalin (Zhang, An, Hu, & Xiang, 2007).

En *in vitro* studie har påvisat att både proskalin och eskalin är potentare än meskalin (David E. Nichols & Dyer, 1977). Proskalin har hävdats vara 5-10 gånger potentare än meskalin och oralt aktiv hos människor i doser kring 40-80mg och eskalin i dosintervallet 40-60mg (A. T. Shulgin, 1978).

Kemisten Otkar Leminger hävdade i en studie på sig själv att proskalin var mer potent än eskalin (Countyourculture, 2012). Andra studier har indikerat att 4-propoxi substitutionen hos proskalin gör substansen något mindre aktiv än eskalin (David E. Nichols, 1986).

I boken "PiHKAL: A Chemical Love Story" av (A. Shulgin & Shulgin, 2000) beskrivs effekterna av proskalin vid oral administration. Proskalin beskrivs smärtlindrande vid doser kring 30mg med sinnes påverkande effekter, känslor av att vara lätt och avslappnad. Vid 40mg beskrivs den euforiska effekten av proskalin som växande i flera timmar och att den håller i sig hela dagen och upplevs angenämt. Vid 60mg beskrivs intoxikationen av substansen som fullständig efter några timmar och de fysiska effekterna som mer påtagliga än de mentala. Känslor av att vara berusad och insomniä men utan bakrus påföljande dag. Effekterna av substansen vid dosering upp till 60mg beskrivs som ihållande i 12 h (A. Shulgin & Shulgin, 2000). En jämförelse av aktiviteten hos fenetylaminer har gjorts genom data från boken "PiHKAL: A Chemical Love Story" av (A. Shulgin & Shulgin, 2000) genom meskalin enheter. Aktiviteten i meskalin enheter definieras som kvoten av den aktiva dosen av substansen till den av meskalin. I meskalin enheter har aktiviteten för eskalin och metallyleskalin bestämts till 6 och för proskalin till 7 medan för allyleskalin har aktiviteten bestämts till 11 meskalinenheter (Clare, 2002).

6. Exponeringsätt, missbruksdos

Proskalin hävdas vara oralt aktiv hos människor i doser kring 40-80mg (A. T. Shulgin, 1978). Vid doser kring 30-60mg har verkningstiden beskrivits vara uppemot 12h och att en dos inte bör överskrida 60mg (A. Shulgin & Shulgin, 2000). Användare har rapporterat intag av krossade tablett i doser kring 60mg genom att "bomba"(Flashback, 2016b), en lätt dos proskalin uppges vara 15-30mg, en vanlig dos av substansen kring 30-40mg och en stark dos 40-60mg (Tripsit, 2017).

7. Kombinationsmissbruk

Användare av syntetiska cannabinoider har rapporterat kombinationsintag av proskalin, intag av proskalin tillsammans med andra hallucinogena substanser samt även proskalin tillsammans med dissociativa substanser (Flashback, 2016b).

8. Hälsorisker

Individuella risker

Giftinformationscentralen har rapporterat om 2 sjukhusfall med proskalin. Symtom i ett av fallen var hög puls, stora pupiller samt att personer var "lite plockig." Det andra fallet var en blandintoxikation. (GIC, 2017). Insomnia och euforiska effekter vid intag av substansen (A. Shulgin & Shulgin, 2000). Användare har beskrivit att effekterna av proskalin liknar de för narkotikareglade MDMA, obehagskänslor, förlorad verklighetsuppfattning, påtaglig insomnia, minnesluckor, illamående, vomering, svettningar, stimulerande effekter, eufori, ökad energi, psykedeliska effekter vid högre doser, att effekten av proskalin påminner om centralstimulantia, hjärtpåverkan, hög puls, så kallad "ego-död"-fullständig förlust av subjektiv självindentitet (Flashback, 2016b), blixtar i huvudet efter intag av proskalin, att man blir helt skev av proskalin i höga doser, förvirring, förståndsförlust, ryckningar i ansiktet, ont i kroppen (Flashback, 2016a), liknande effekter som meskalin men mer potent, eufori, hallucinationer m.m (Tripsit, 2017).

Folkhälsorisker

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

9. Dokumenterad förekomst

Medicinsk och industriell förekomst

Ingen medicinsk användning är känd men användning kan förekomma inom farmakologisk forskning.

Rapporterad förekomst i Sverige

Uppgiftslämnare	2015	2016	2017
Nationellt forensiskt centrum (NFC)	-	8 beslag	13 beslag
Rättsmedicinalverket (RMV)	-	-	
Tullverkets laboratorium	-	-	
Giftinformationscentralen (GIC)	-	2 fall (sjukhus)	

(GIC, 2017; NFC, 2017; RMV, 2017; TVL, 2017)

Folkhälsomyndigheten har yttrat sig enligt Förstörelagen 13 § lag (2011:111). Beslut om förstörande har inkommit till myndigheten.

EMCDDA

Beslag har gjorts i Sverige och Norge under år 2016, under år 2015 i Tyskland, under år 2014 i Frankrike, under år 2013 i Nederländerna.

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

Reglerad i Polen och Slovenien (EMCDDA, 2017).

13. Konventioner

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

14. Övrig information

-

15. Rekommendation

3,5-dimetoxi-4-propoxifenetylamin 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 3,5-dimetoxi-4-propoxifenetylamin *med kortnamn* proskalin 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

- Clare, B. W. (2002). QSAR of benzene derivatives: comparison of classical descriptors, quantum theoretic parameters and flip regression, exemplified by phenylalkylamine hallucinogens. *J. Comput.-Aided Mol. Des.*, 16(8/9), 611-633.
- Countyourculture. (2012). Leminger's Scalines.
- EMCDDA. (2017). European database on new drugs. Retrieved 2014, from <https://ednd.emcdda.europa.eu/html.cfm/>
- Flashback. (2016a). helt skev av proscaline Retrieved from <https://www.flashback.org/t2706970>
- Flashback. (2016b). Proskalin. Retrieved from <https://www.flashback.org/p56459403>
- GIC. (2017). Giftinformationscentralen
- NFC. (2017). Nationellt forensiskt centrum
- Nichols, D. E. (1986). Studies of the relationship between molecular structure and hallucinogenic activity. *Pharmacology Biochemistry and Behavior*, 24(2), 335-340. doi:[http://dx.doi.org/10.1016/0091-3057\(86\)90362-X](http://dx.doi.org/10.1016/0091-3057(86)90362-X)
- Nichols, D. E. (1994). Medicinal chemistry and structure-activity relationships. *Amphetamine and its analogs*, 3-41.
- Nichols, D. E., & Dyer, D. C. (1977). Lipophilicity and serotonin agonist activity in a series of 4-substituted mescaline analogs. *J. Med. Chem.*, 20(2), 299-301. doi:10.1021/jm00212a022
- PubMed. (2017). PubMed. <http://www.ncbi.nlm.nih.gov/pubmed/>
- RMV. (2017). Rättsmedicinalverket
- Scifinder. (2017). Scifinder. Retrieved 2014, from <https://scifinder.cas.org/scifinder/view/scifinder>
- Shulgin, A., & Shulgin, A. (2000). *PiHKAL A CHEMICAL LOVE STORY*. Berkely, CA: Transform Press.
- Shulgin, A. T. (1978). PSYCHOTOMIMETIC DRUGS: STRUCTURE - ACTIVITY RELATIONSHIPS *In Handbook of Psychopharmacology* (Vol. 11, pp. 243-333). New York: Plenum Press.
- Tripsit. (2017). Proscaline. Retrieved from <http://drugs.tripsit.me/proscaline>
- TVL. (2017). Tullverket.
- Zhang, Z., An, L., Hu, W., & Xiang, Y. (2007). 3D-QSAR study of hallucinogenic phenylalkylamines by using CoMFA approach. *J. Comput.-Aided Mol. Des.*, 21(4), 145-153. doi:10.1007/s10822-006-9090-y