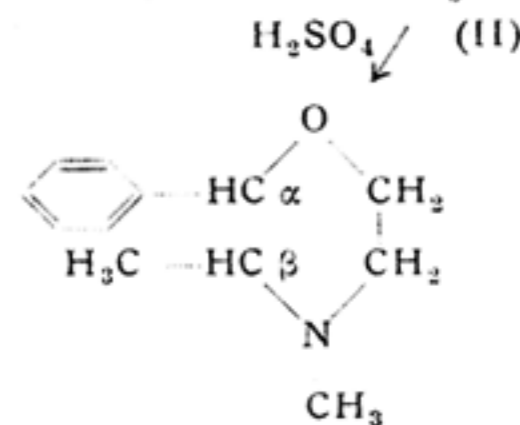
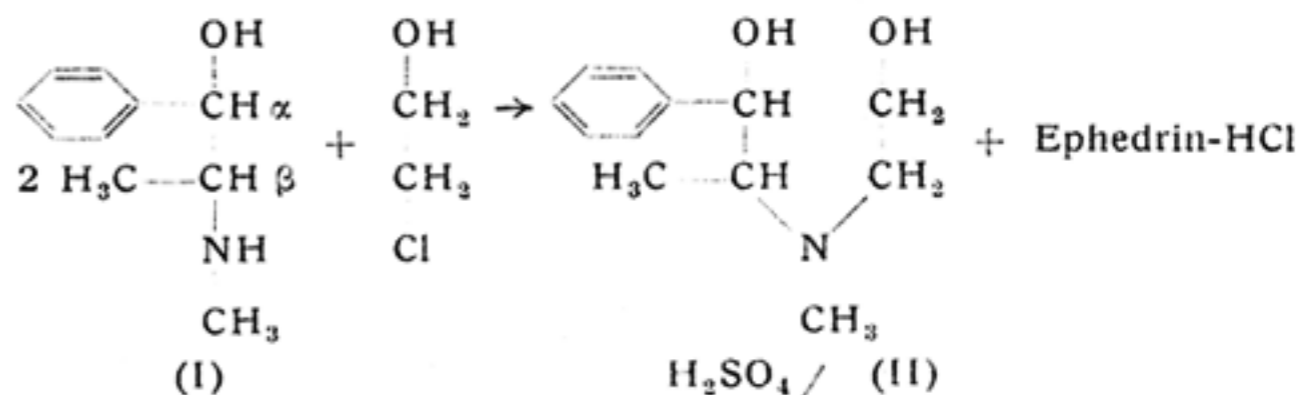


Man gelangt leicht und in guter Ausbeute zu optisch aktiven Morpholin-Derivaten, die in der Literatur noch nicht beschrieben sind, wenn man optisch aktive substituierte Äthanolamine, z. B. das in der Natur vorkommende *l*-Ephedrin oder *d*-Norephedrin als Ausgangsprodukt wählt.

l-Ephedrin (I) wird entweder mit Äthylenoxyd bei Raumtemperatur oder mit Äthylenchlorhydrin in Toluol bei 130° bis 140°C umgesetzt. Dabei entsteht *l*-Oxyäthyl-ephedrin (II). Mit konz. Schwefelsäure bei Raumtemperatur behandelt, bildet sich nach mehrstündigem Einwirken das Morpholin-Derivat (III).

Es zeigt sich, daß durch den Ringschluß aus dem linksdrehenden Oxyäthylephedrin das rechtsdrehende 2-Phenyl-3,4-dimethylmorpholin entsteht.

l-Ephedrin hat zwei Asymmetriezentren, wobei das α -C-Atom stärker nach links dreht, als das β -C-Atom rechts dreht. Insgesamt resultiert eine Linksdrehung. Ob bei der Bildung des Morpholin-Ringes die Änderung des optischen Drehsinnes darauf beruht, daß sich die Drehrichtung des α -C-Atomes ändert, oder die Linksdrehung relativ abgeschwächt wird und damit die Rechtsdrehung des β -C-Atomes dominiert, oder bei gleichbleibendem *l*-Wert der *d*-Wert des β -C-Atomes erhöht wird, bleibt offen.



(III) Kp_{81mm} 122–124°C
 Fp (Hydrochlorid) 191°C
 $[\alpha]_D^{20}$ (Hydrochlorid) + 35,7°

Das *d*-2-Phenyl-3,4-dimethyl-morpholin wird als Arzneistoff, insbes. als zentrales Tonikum verwendet. Gegenüber dem Racemat der Nor-Verbindung ist es weniger toxisch, hat einen günstigeren therapeutischen Index und steigert selbst bei Verabreichung der dreifachen therapeutischen Dosis den Blutdruck nicht. Die Pulsfrequenz bleibt unbeeinflusst.