

특 허 법 원

제 5 부

판 결

사 건 2017허5917 거절결정(특)

원 고 삼아제약 주식회사

피 고 특허청장

변 론 종 결 2018. 4. 13.

판 결 선 고 2018. 6. 8.

주 문

원고의 청구를 기각한다.

소송비용은 원고가 부담한다.

청 구 취 지

특허심판원이 2017. 6. 22.자로 2015원7912 사건에 관하여 한 심결을 취소한다.

이 유

## 1. 기초사실

### 가. 원고의 출원발명

1) 원고는 2012. 2. 3. 우선권 주장일을 2011. 8. 1.로, 발명의 명칭을 "실데나필 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염을 유효성분으로 함유하는 신규한 속용성 과립제형"으로 하여 총 9개의 청구항으로 된 발명을 피고에게 출원하였는데, 피고는 2015. 2. 16. 원고에게 "원고의 출원발명 중 청구항 제1항은 특허법 제29조 제1항 제2호에 해당하여 신규성이 부정되고, 모든 청구항이 특허법 제29조 제2항에 해당하여 진보성이 부정된다."는 이유로 거절이유를 통지하였다.

2) 원고는 이에 따라 2015. 4. 16.과 2015. 10. 23. 두 번에 걸쳐 보정서를 제출하면서 종전 청구항 제3항과 제5항을 삭제하고 제1항의 내용 등을 수정하였는데(이하 위와 같이 보정한 최종적인 출원내용을 '이 사건 출원발명'이라 한다), 그중 보정된 청구항 제1항의 내용은 다음과 같다.

**【청구항 1】 실데나필<sup>1)</sup> 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염(이하 '구성요소 1'이라 한다) 및 자일리톨, 만니톨, 이소말트, 소르비톨, 말티톨, 정제백당, 유당, 이노시톨, 에리스리톨, 결정과당, 트레할로스, 리비톨, 아라비톨, 갈락티톨, 락티톨 및 말토트리톨 및 이들의 혼합물로 이루어지는 균으로부터 선택되는 당 또는 당 알코올인 속용담체(이하 '구성요소 2'라고 한다)를 포함하는 속용성 경구투여용 과립제형(이하 '구성요소 3'이라 한다)으로서, 상기 속용담체는 하기 조건 (1), (2) 및 (3)을 만족하는 당 또는 당 알코올인 것(이하 '구성요소 4'라고 한다)을 특징으로 하는 경구투여용 속용성 과립제형.**

---

1) 실데나필(sildenafil)은 사이클릭 구아노신 3',5'- 모노포스페이트 포스포디에스테라제 5형(cGMP PDE5)의 선택적 억제제로 발기부전의 치료에 사용된다. 해당 물질은 체제화시 신속한 흡수와 양호한 생물학적 이용률을 확보하기 위해 수용성 염인 시트레이트염(구연산염)의 형태로 사용되며 경구용 발기부전치료제로서 정제로 시판되고 있다.

- (1) 순간용해도가 30mg/ml 이상
- (2) 5분용해도가 50mg/ml 이상
- (3) 순간용해도가 최대용해도의 90% 이하

3) 이 사건 출원발명 명세서의 주요 내용은 아래 표 기재와 같다.

① 기술분야

본 발명은 실데나필 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염을 유효성분으로 함유하며, 경구투여시 구강 내에서 20초 이내에 신속하게 용해되며 이물감 및 잔류감이 없는 것을 특징으로 하는 속용성 과립제형에 관한 것이고, 보다 구체적으로는 특정 조건을 만족하는 속용담체를 조립하여 얻어지는 신규한 속용성 과립제형에 관한 것으로, 유효성분의 용해 및 흡수가 촉진되는 동시에 최고 혈중농도에 이르는 시간( $T_{max}$ , 이하 'Tmax'라고 한다)<sup>2)</sup>이 1시간 이내로 개체 간 발현되는 Tmax의 편차를 줄여 R( $T_{max}$ , 1h)가 80% 이상이며 쓴맛이 제거된 제형임(문단번호 [0001] 참조).

② 배경기술

일반적으로 약효의 발현시간을 빠르게 하기 위해서는 경구 투여 후 위장에서 신속하게 붕해가 이루어져 활성성분이 빠르게 흡수되도록 하는 방법이 가능함. 또한, 투여 제형의 신속한 붕해를 위하여 위장관에 도달하기 전, 구강 내에서 쉽게 붕해가 이루어지도록 설계하거나(구강 내 속붕해정), 구강내 점막에 부착 또는 비부착되어 구강내에서 필름이 붕해되어 약물의 흡수가 빠르도록 하는 필름형태(스트립 제형)로 설계가 가능함(문단번호 [0004] 참조).

한국특허 제435514호에서는 실데나필 젯산염의 속효제형에 대해 개시하고 있으며, 약제학적으로 허용 가능한 담체로서 해당분야에서 통상적으로 사용하는 당류, 붕해제, 결합제, 부형제 또는 활택제를 개시하고 있음. 사용가능한 당류로는 유당, 만니톨, 소르비톨, 크실리톨(자일리톨), 에리스리톨, 덱스트로스, 수크로스, 과당, 레볼로즈, 말토덱스트린, 파리티노즈 등을 예시하고 있으며, 특히 상기 당류로는 분무건조 등에 의해 다공화된 것을 사용하는 것이 구강 내에서 용해성을 증가시킬 수 있으므로 바람직하다고 개시하고 있음(문단번호 [0007] 참조).

이상의 선행문헌으로부터, 본 기술분야에 있어서는, 실데나필을 유효성분으로 함유하면서 약효의 발현시간을 단축시키고자 하는 많은 시도가 행해져 왔지만, 과립을 최종 투여제형으

로 하면서 약효의 발현시간을 단축시킴과 아울러 이물감, 잔류감을 없애면서 쓴맛을 제거하여 복용편의성을 증진시키고자 한 시도는 존재하지 않음을 알 수 있음(문단번호 [0015] 참조).

### ③ 발명의 내용

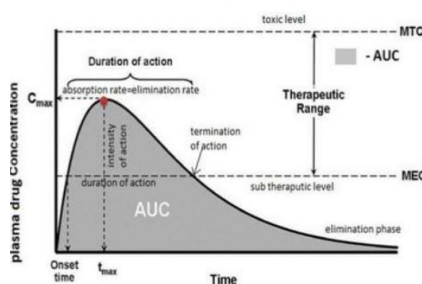
실데나필 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염과 당 및 당 알코올로 이루어지는 군으로부터 선택되는 속용담체를 조립하여 얻어지며, 경구투여시 구강 내에서 신속하게 용해되는 것을 특징으로 하는 속용성 과립제형이며, 속용성 과립제형에 있어 상기 당 또는 당알코올은 자일리톨, 만니톨, 이소말트, 소르비톨, 말티톨, 정제백당, 유당, 이노시톨, 에리스리톨, 결정과당, 트레할로스, 아라비톨, 갈락티톨, 락티톨 및 말토트리톨 및 이들의 혼합물로 이루어지는 군으로부터 선택되는 것을 특징으로 함(문단번호 [0019], [0021] 각 참조).

본 발명자들은 실데나필을 유효성분으로 포함하는 약제학적 제형으로서, 구강 내 속봉해정, 스트립 제형 및 종래의 과립제형의 단점을 모두 극복하는 신규한 속용성 과립제형을 개발하였으며, 놀랍게도 특정 조건을 만족하는 속용담체를 이용하는 경우, 이물감과 잔류감이 제거되고, 구강 내 속봉해정이나 스트립제형과 비교해서 Tmax가 단축되면서도, 개체간의 편차가 적어진다는 신규한 지건을 얻어 본 발명에 이룸(문단번호 [0050] 참조).

## 나. 피고의 거절결정 및 이 사건 심결 내용

1) 피고는 2015. 12. 1. "이 사건 출원발명은 이 발명이 속하는 기술분야에서 통상의 지식을 가진 자(이하 '통상의 기술자'라고 한다)가 용이하게 발명할 수 있는 것이므로 특허법 제29조 제2항에 따라 진보성이 부정되어 특허를 받을 수 없다."는 이유로

2) 최고혈중농도 도달시간(Tmax) : 생체이용률은 의약품으로부터 유효성분이 흡수되어 작용부위에 전달되는 양과 속도를 의미하는데 이 때 통상 약물동태학적 파라미터(AUC, Cmax, Tmax)가 활용되며, 이를 표현하는 일반적인 플롯은 이하와 같다. 하기 그래프에서, 최고혈중농도 도달시간(Tmax)은 약물이 흡수되어 유효성분이 혈중에서 최대의 농도수치(Cmax)에 도달할 때의 시점을 의미하는 것으로 약물의 흡수속도를 반영한다.



원고에게 거절결정을 하였다.

2) 이에 원고가 2015. 12. 31. 특허심판원에 위 거절결정의 취소를 구하는 심판을 청구하자 특허심판원은 이를 2015원7912호 사건으로 심리한 다음, 2017. 6. 22. "이 사건 출원발명 중 청구항 제1항 발명(이하 '이 사건 제1항 발명'이라 한다)은 이 사건 출원 전인 2003. 9. 26. 공개된 '실데나필 젯산염의 속효제형'이라는 명칭의 발명(국내공개특허공보 제2003-76051호, 이하 '선행발명'이라 한다)에 비하여 이물감, 잔류감 및 쓴 맛 감소효과가 현저히 우수하다고 인정할 수 없고, 이 사건 제1항 발명의 용해조건을 충족하였을 때 나타나는 효과가 선행발명에 비하여 우수하다고 인정되지 않아 그 용해조건 한정에 기술적 의의가 있다고 할 수 없으며, Tmax 및 그 표준편차의 감소효과 역시 선행발명에 비하여 우수하다는 점을 인정할 증거가 없으므로 이 사건 제1항 발명은 통상의 기술자가 선행발명에 의하여 용이하게 발명할 수 있어 그 진보성이 부정되고, 특허출원에서 어느 하나의 청구항에라도 거절이유가 있으면 그 출원은 일체로서 거절되어야 한다."는 이유로 원고의 위 심판청구를 기각하는 심결을 하였다(이하 '이 사건 심결'이라 한다).

#### 다. 선행발명의 구체적 내용

이 사건 출원 전에 공개된 선행발명의 주요 내용은 아래 표 기재와 같다.

<p>선행발명은 발기부전 치료제인 실데나필을 젯산염의 형태로 함유시켜 구강 내에서 신속하게 용해되는 속효제형에 관한 것으로 복용이 간편하고 쓴맛을 나타내지 않아 복용순응도<sup>3)</sup>를 높일 수 있으며 구강 내에서 용해성이 우수하므로 신속히 약효를 발현시킬 수 있는 실데나필 젯산염의 속효제형에 관한 것으로, 종래의 실데나필 함유 속효성 제제가 고미차폐 혹은 양호한 생체이용률 측면에서 한계를 보이는 단점을 극복하여, 실데나필을 젯산염의 형태로 함유시켜 구강 내에서 신속하게 용해되는 속효성 제형으로 제조함.</p>
--

또한 약제학적으로 허용가능한 담체로서 해당분야에서 통상적으로 사용하는 당류, 붕해제, 결합제, 부형제 또는 활택제 등을 함유시키는데, 당류는 입안에서의 단맛, 용해성 및 촉감 등에 영향을 주는 성분으로, 이러한 효과를 나타내기 위해서는 단맛과 수용해성이 좋아야 함. 사용가능한 당류로는 유당, 만니톨, 솔비톨, 크실리톨, 에리스리톨, 글루코즈, 수크로즈, 과당, 레부로스, 말토덱스트린, 파라티노즈 등이 있고 특히, 분무건조 등에 의해 다공화된 것을 사용하는 것이 구강 내에서 용해성을 증가시킬 수 있으므로 바람직함.

상기 붕해제 성분은 선행발명에 따른 속효제형에 다공성 공극(pore)을 생성시켜 경구투여 시 구강 내에서 타액에 의해 쉽게 용해될 수 있도록 하기 위해 공극(pore) 형성물질을 사용하여 다공성의 제형으로 제조하는 것이 바람직하며, 공극(pore) 형성물질은 승화성 물질, 즉 멘톨, 캄파, 치몰, 유기산, 저급 지방산 및 이들의 혼합물 중에서 선택된 1종 이상의 것을 사용할 수 있고 바람직하게는 멘톨이 좋음.

【인정 근거】 다통 없는 사실, 갑 제1호증, 갑 제2호증, 갑 제9호증, 갑 제12호증, 을 제2호증, 을 제3호증, 을 제5호증의 각 기재, 변론 전체의 취지

## 2. 원고의 주장 요지

이 사건 제1항 발명은 다음과 같은 이유로 선행발명으로부터 쉽게 도출될 수 없는 것이어서 그 진보성이 인정되어야 함에도 이를 부정한 이 사건 심결은 위법하다.

가. 이 사건 제1항 발명은 경구투여용 과립제형으로서 선행발명인 기존의 속붕해정(Orally Disintegrating Tablet, 줄여서 'ODT'라고 한다)<sup>4)</sup>이 쓴 맛을 차단하고 빠른 약효를 제공하는 것을 목적으로 함에 비해 이 사건 제1항 발명은 여기에 더하여 그 속용담체의 용해도를 미시적으로 구분하여 이물감과 잔류감까지 해소하는 효과를 나타내는

3) 복약순응도(compliance) : 환자가 의사의 처방과 약사의 복약지도에 따라 약물을 복용하는 것을 말한다. 환자의 복약순응이 이루어지지 않는 경우 약물에 의한 질환통제가 이루어지지 않으므로, 제제 개발 시 환자의 복약순응도를 고려해야 한다.

4) 속붕해정(Orally Disintegrating Tablet, ODT) : 속붕해정은 구강 내 속붕해정, 속용정 등 다양한 명칭으로 불리워지는데, 미국 orange book에 의하면 '혀 위에 놓았을 때, 보통 몇 초 내에 신속하게 붕해하는 의약품을 함유한 고휘제제'라고 정의된다. 속붕해정은 구강에서 용해하는데 1분 이상 소요되는 기존의 설하정, 구강정과는 달리 물 없이도 단순히 침에 의하여 입안에서 1분, 어떤 것은 10초 이내에 붕해하거나 녹은 후 주약이 구강 및 위장관 점막을 통하여 흡수되어 전신혈관계로 이행한다.

데, 선행발명에서는 이러한 효과를 의도하게 할 만한 동기가 부여되어 있지 않다.

나. 이 사건 제1항 발명이 속용담체인 당 또는 당알코올의 자체적 성질을 활용하는 것과 달리, 선행발명은 멘톨과 같은 승화성 물질을 이용하여 다공성 공극(pore)을 생성하는 방법으로 용해도를 증진시키는 구성을 채택하고 있으므로, 양 발명의 기술구성이 상이하야 통상의 기술자가 선행발명으로부터 실테나필의 속용성 과립제형을 착안하는 것이 용이하지 않다.

다. 선행발명에는 실테나필 유리염기(free base)<sup>5)</sup>가 아닌 실테나필 젯산염이 유효성분으로 포함되나, 이 사건 제1항 발명은 용해도가 낮은 실테나필 유리염기를 포함하여 높은 용해도 및 생체이용률을 보이므로 현저한 효과가 인정된다.

라. 선행발명의 실시예 1, 2의 Tmax는 토끼를 상대로 실험한 약동학적 파라미터이므로 인간을 대상으로 한 이 사건 제1항 발명의 Tmax 수치와 비교할 수 없고, 의약품의 Tmax는 약효발현시간에 비례하는 것으로 이 사건 제1항 발명 실시예 2의 평균 Tmax가 0.7시간이고, 이와 같은 수치는 실시예 2의 대조군(비교예 3)인 기존 비아그라 제품<sup>6)</sup>의 평균 Tmax 1.1시간에 비해 0.4시간이 단축된 것으로, Tmax의 표준편차 및 변동계수<sup>7)</sup> 역시 줄어들어 현저한 효과를 나타낸다.

### 3. 판단: 이 사건 제1항 발명의 진보성 여부

#### 가. 이 사건 제1항 발명과 선행발명의 구성요소 대비

5) 유리염기(free base) : 프로톤과 결합하여 염을 형성하지 않고 염기 상태 그대로 존재하는 유기염기인데, 유리상태의 산이나 염기보다는 그들의 염(salt)을 사용하면 약물의 용해속도가 증가하는 것으로 알려져 있다. 유리염기와 달리 염(salt)은 산의 음이온과 염기의 양이온이 정전기적 인력으로 결합하고 있는 이온성 물질인 화합물로서, 대개 약물의 용해도를 개선시키고 약물의 녹는점을 높여 약품제조 용이성을 향상시키므로 많이 사용되어 진다.

6) 제품명: Viagra®, 성분명 : Sildenafil citrate, 판매자 : 화이자의 제품을 말하는데, 이하 "기존 비아그라 제품"이라 한다.

7) 변동계수(coefficient of variation) : 표준편차를 평균값으로 나눈 것을 말한다.

구성요소	이 사건 제1항 발명	선행발명
1	실데나필 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염	실데나필 젯산염 실데나필 시트레이트 염 실데나필 유리염기
2	자일리톨, 만니톨, 이소말트, 소르비톨, 말티톨, 정제백당, 유당, 이노시톨, 에리스리톨, 결정과당, 트레할로스, 리비톨, 아라비톨, 갈락티톨, 락티톨 및 말토티리톨 및 이들의 혼합물로 이루어지는 군으로부터 선택되는 당 또는 당 알코올인 속용담체	유당, 만니톨, 솔비톨, 크실리톨(자일리톨), 에리스리톨, 글루코즈, 수크로즈(백당), 과당, 레볼로즈, 말토덱스트린, 파라티노즈 등의 당류
3	를 포함하는 속용성 경구투여용 과립제형	정제, 캡슐제, 과립제 등의 속용제형
4	상기 속용담체는 하기 조건 (1), (2) 및 (3)을 만족하는 당 또는 당 알코올인 것을 특징으로 하는 경구투여용 속용성 과립제형. (1) 순간용해도가 30mg/ml 이상 (2) 5분용해도가 50mg/ml 이상 (3) 순간용해도가 최대용해도의 90% 이하	상기 당류는 입안에서의 단맛, 용해성 및 촉감 등에 영향을 주는 중요한 성분으로, 이러한 효과를 나타내기 위해서는 단맛과 수용해성이 좋아야함

## 나. 구성요소별 상세 비교

### 1) 기술분야 및 목적 비교

이 사건 제1항 발명은 실데나필 또는 약제학적으로 허용가능한 염을 유효성분으로 함유하며 구강 내에서 신속하게 용해되는 것을 특징으로 하는 속용성 과립제형에 관한 것으로 이물감 및 잔류감이 없고 쓴맛을 제거하여 복용순응도를 높이는 동시에 약효의 발현이 신속하게 나타나는 것을 목적으로 하고, 선행발명 역시 그 명세서에 기재된 바와 같이<sup>8)</sup> 실데나필 젯산염을 함유하여 구강 내에서 신속하게 용해되는 속효성



제형으로서 복용 시 쓴맛을 나타내지 않아 복용순응도를 높일 수 있으며 구강 내 용해성이 좋아 신속히 약효를 발현시키는 것을 목적으로 하므로, 양 발명은 그 기술 분야 및 목적에서 차이가 없다.

원고는 이에 대하여, 선행발명은 속봉해정 제형이므로 쓴 맛을 차단하고 신속하게 용해되는 효과를 제공하는 것 외에 이물감과 잔류감의 해소를 의도하게 할 만한 동기가 나타나 있지 않다고 주장하나, 선행발명 역시 입안의 관능(단맛, 용해성 및 촉감)을 유지하여 복용순응도를 저해하지 않을 목적으로 속봉해정에 통상적으로 사용되는 당류를 함유하고 있고, 통상의 기술자라면 물을 복용할 필요 없는 속봉해정 제형의 경우 입안에서 '촉감'<sup>9)</sup>이 좋아야 한다는 주지의 사실을 고려할 것으로 보이므로, 원고의 위 주장은 이유 없다.

## 2) 구성요소 1 비교

이 사건 제1항 발명의 구성요소 1과 선행발명의 대응구성은 실테나필 유리염기 혹은 실테나필 염을 유효성분으로 포함하는 속용성 제형이라는 점에서 차이가 없다.

원고는 이에 대하여, 이 사건 제1항 발명은 용해도가 낮은 실테나필 유리염기를 포함하고 선행발명은 실테나필 젯산염만을 유효성분으로 하므로 구성의 차이가 있다는 취지로 주장하지만, 구성요소 1이 실테나필 유리염기는 물론 실테나필염을 유효성분으로 포함하고 있고, 선행발명 역시 실테나필 젯산염 외에 실테나필 유리염기 및 시트레

---

8) 구체적으로 선행발명의 명세서에 "본 발명은 유효성분으로 발기부전치료제인 실테나필을 쓴맛이 없으며 용해성이 뛰어난 실테나필 젯산염의 형태로 함유시켜 속효제형으로 제조하여 복용 시 쓴맛을 나타내지 않아 복용순응도를 높일 수 있으며 구강 내에서 용해성이 좋아 신속히 약효를 발현시킬 수 있는 실테나필 젯산염의 속효제형에 관한 것이다."라고 기재하고 있다.

9) 입안의 '촉감'이란 입자가 입안에 머무를 때 구강 내 조직에 마찰되면서 발생하는 저촉감 내지 이물감을 포함하는 것으로, 이는 약물입자의 용해도와 밀접한 관련이 있어 선행발명에서도 이물감과 잔류감을 제거할 동기가 존재한다고 볼 수 있다.

이트염을 각 개시하고 있으므로 양자 사이에 기술적으로 유의미한 차이가 있다고 볼 수 없다. 원고의 이 부분 주장 역시 이유 없다.

### 3) 구성요소 2 비교

이 사건 제1항 발명의 구성요소 2와 선행발명의 대응구성은 자일리톨, 만니톨, 소르비톨 등의 '당알코올' 혹은 유당 등과 같은 '당'을 담체로서 포함한다는 점에서 공통되고, 이 부분에 관하여서는 당사자 사이에 다툼이 없다.

### 4) 구성요소 3 비교

이 사건 제1항 발명의 구성요소 3과 선행발명의 대응구성은 모두 과립제형을 포함한 속용제제라는 점에서 동일하다.

원고는 이에 대하여, 선행발명이 속봉해정(ODT)에 한정되므로 과립제형인 이 사건 제1항 발명과 구성상의 차이가 있다고 주장하지만, 선행발명은 속효제형으로서 정제(tablet) 외에도 캡슐제, 과립제를 포함한다고 명시하고 있어 선행발명의 속효제형이 반드시 정제에 한정된다고 할 수 없으므로, 원고의 이 부분 주장 역시 이유 없다.

### 5) 구성요소 4 비교

이 사건 제1항 발명의 구성요소 4와 선행발명의 대응구성은 속용제제의 담체로 당류(당 또는 당알코올)를 사용하는 것에서는 공통된다. 다만, 이 사건 제1항 발명의 구성요소 4에서는 당 또는 당알코올의 순간용해도와 5분 용해도를 각 30mg/ml 이상과 50mg/ml 이상으로, 순간용해도를 최대용해도의 90% 이하를 만족하는 것으로 수치범위를 한정시킨 반면, 선행발명의 대응구성은 수용해성이 좋은 당류이기는 하나, 그 용해조건이 구체적인 수치로 한정되어 있지 않다는 점에서 차이가 있다(이하 이러한 수치한정의 차이점을 '이 사건 차이점'이라 한다).

## 다. 이 사건 차이점에 대한 평가

### 1) 관련 법리

어떠한 출원발명이 그 출원 전에 공지된 발명이 가지는 구성요소의 범위를 수치로서 한정하여 표현한 경우에는 그 출원발명에 진보성을 인정할 수 있는 다른 구성요소가 부가되어 있어서 그 출원발명에서의 수치한정이 보충적인 사항에 불과한 것이 아닌 이상, 그 한정된 수치범위 내외에서 이질적이거나 현저한 효과의 차이가 생기지 않는다면 그 출원발명은 그 기술분야의 통상의 기술자가 통상적이고 반복적인 실험을 통하여 적절히 선택할 수 있는 정도의 단순한 수치한정에 불과하여 진보성이 부정된다고 할 것이고(대법원 1993. 2. 12. 선고 92다40563 판결, 대법원 2005. 4. 15. 선고 2004후448 판결 등 참조), 그 출원발명이 공지된 발명과 과제가 공통되고 수치한정의 유무에서만 차이가 있는 경우에는 그 출원발명의 명세서에 한정된 수치를 채용함에 따른 현저한 효과 등이 기재되어 있지 않다면 특별한 사정이 없는 한 그와 같이 한정된 수치범위 내외에서 현저한 효과의 차이가 생긴다고 보기 어렵다(대법원 1994. 5. 13. 선고 93후657 판결, 대법원 2005. 4. 15. 선고 2004후448 판결, 대법원 2007. 11. 16. 선고 2007후1299 판결 등 참조).

### 2) 구체적 판단

앞서 인정한 사실 및 앞서 든 증거들에 의하여 인정되는 다음의 사정 등을 위 법리에 비추어 보면, 이 사건 차이점은 통상의 기술자가 통상적이고 반복적인 실험을 통하여 적절히 선택할 수 있는 정도의 단순한 수치한정에 불과하여 구성의 곤란성이 인정되지 아니하고, 그 수치한정에 따른 이질적인 효과나 임계적 의의도 인정되지 아니하므로, 이 사건 차이점을 이유로 이 사건 제1항 발명의 진보성이 인정된다고 보기 어

럽다.

### 가) 구성의 곤란성 여부

이 사건 출원발명은 그 명세서에서 이 사건 순간용해도 및 5분용해도에 관련된 조건이 속용담체의 비표면적<sup>10)</sup>이나 입자크기와는 다른 별도의 개념이라고 설명하고 있으나(문단번호 [0055]), 이 사건 출원발명의 나머지 부분에 설명된 내용(문단번호 [0037] 내지 [0040])과 명세서 표 1, 표 2 및 표 5의 내용을 살펴보면, 이 사건 출원발명의 용해도 조건은 속용담체로 사용되는 당 또는 당알코올을 사용용도에 맞게 분쇄하여 입자경<sup>11)</sup>에 따라 분류한 뒤(D50, 30.7~144.0um/ 108.1~447.8um/ 192.2~648.3um),<sup>12)</sup> 일반적으로 시행되는 용출시험법 및 선형회귀법에 따라 용해도 또는 용출속도를 산출하여 비교한 결과<sup>13)</sup>이므로, 결국 위 용해도 조건을 조율하는 주된 기술적 수단은 담체로 활용된 당 또는 당알코올의 입자경임을 알 수 있다. 그런데 을 제3호증의 기재 등에 의하면, 제제의 입자경이 감소할수록 표면적이 증대하고 이에 따라 높은 용출속도를 얻을 수 있다는 사실은 이 사건 출원발명의 우선권 주장일 당시 널리 알려진 주지의 사실임이 인정되고, 선행발명의 명세서 기재<sup>14)</sup>에서 보듯이 선행발명의 발명자 역

10) 비표면적이란 어떤 입자의 단위질량 또는 단위부피당 겉넓이(전표면적)을 말한다.

11) 입자경이란 입자의 크기를 말한다.

12) 입도분포(particle size distribution) : 여기서 D50은 분립체의 입자경을 표시하는 방법의 일종으로 입도분포곡선의 중앙치(50%)에 상당한 경이다. 분체를 구성하는 입자의 크기는, 전부의 입자가 동일한 것은 아니고 반드시 어느 크기의 입자경을 중심으로 분포한다. 평균입자경보다 큰 입자와 작은 입자가 같은 비율일 때는 정규분포이나, 일반적으로 좌우 대칭의 분포가 되지 않는 경우가 많다. 입도분포는 빈도 분포 곡선(모달경) 또는 누적 분포 곡선(median경) 중 어느 하나의 형태로 나타내는 것이 통상적이다.

13) 이 사건 출원발명의 제조예 1 내지 33 각각의 용해도는 대한약전 용출시험법 중 제2법에 따라 실시되었는데, 발명자는 검체를 1, 3, 5, 10, 15분 단위로 채취하여 각 시간별 용해도를 측정하고, 5분 이내로 측정한 검체들의 용해도를 별도로 그래프에 플롯한 뒤 선형회귀곡선의 y절편값을 순간용해도로 정의하였다.

14) 구체적인 기재 부분을 요약하면 아래와 같다. "① 본 발명은 유효성분으로 발기부전치료제인 실데나필을 쓴맛이 없으며 용해성이 뛰어난 실데나필 젯산염의 형태로 함유시켜 속효제형으로 제조하여 복용 시 쓴맛을 나타내지 않아 복용순응도를 높일 수 있으며 구강 내에서 용해성이 좋아 신속히 약효를

시 속용성 담체로 이루어지는 속효 제제의 용해도가 구강 내 촉감 및 생체이용률에 중요한 역할을 한다는 점을 분명히 인식하고 있었으므로, 결국 통상의 기술자라면 국내에 공급되는 당 또는 당알코올 원료를 사용용도에 맞게 분쇄하여 용해속도 및 구강 내 촉감을 비교하는 실험을 함으로써, 실데나필 속용성 과립제형에 적합한 용해도 조건을 선별하는데 별다른 어려움이 없을 것으로 보인다. 결국 당 또는 당알코올의 용해도 혹은 용해속도와 관련하여 입자경을 조절하는 것에는 이 사건 출원발명의 우선일 당시 널리 활용되었던 분쇄기술(milling 등)을 이용할 수 있으므로<sup>15)</sup> 여기에 구성의 곤란성이 존재하지 아니하며 당 또는 당알코올의 용해도를 한정하는 것의 임계적 의의를 확인할 수 있는 명세서의 기재도 존재한다고 볼 수 없다.

원고는 이에 대하여, 선행발명은 멘톨 등과 같은 공극(pore)형성제를 사용함으로써 제제 내 공극(pore)을 형성하는 구성이 포함된 반면, 이 사건 출원발명은 속용성 과립제형으로 입자의 표면적을 증대시키는 구성을 포함하고 있다는 점에서, 양 발명은 서로 다른 구성을 갖는다고 주장한다. 그러나 선행발명의 명세서에는 제제에 붕해제(폴리비닐피롤리돈 등)를 필수적으로 함유하도록 하는 대신 공극(pore)형성제(멘톨 등)의 사용이 바람직하다고만 기재하고 있어 공극(pore)형성제가 필수적 구성요소라고 보기 어렵고, 공극(pore)형성제는 제제 내 공극(pore)을 형성하여 정제의 붕해 내지 분해(disintegrating)를 돕는 물질로서 정제 등의 붕해를 촉진시켜 제제의 표면적을 늘리는

---

발현시킬 수 있는 실데나필 젯산염의 속효제형에 관한 것이다. ② 상기 당류는 입안에서의 단맛, 용해성 및 촉감 등에 영향을 주는 중요한 성분으로, 이러한 효과를 나타내기 위해서는 단맛과 수용해성이 좋아야 한다. 사용가능한 당류로는 유당, 만니톨, 솔비톨, 크실리톨, 에리스리톨, 글루코즈, 수크로즈, 과당, 레볼로즈, 말토덱스트린, 파라티노즈 등이 있다. 특히, 상기 당류는 분무건조 등에 의해 다공화된 것을 사용하는 것이 구강 내에서 용해성을 증가시킬 수 있으므로 바람직하다. ③ 도 1에 나타난 바와 같이, 본 발명에 따른 실데나필 젯산염 속효성 정제인 실시예 1과 2는 용해도가 높아 투여시 신속히 효과를 발휘하여 높은 생체이용률을 나타냄을 확인할 수 있었다."

15) 을 제2호증 참조

기술적 수단이므로, 입자의 표면적을 증대시켜 용해도 및 생체이용률을 향상시키려는 과립제형의 원리와도 유사한 측면이 있다고 볼 수 있다. 특히 과립은 정제의 원료를 압축성형하기 전의 중간단계로 조립되는 제형이기 때문에, 정제 제조단계의 일부인 타정을 생략하는 것에 어떠한 기술적 구성의 어려움이 있다고 볼 수도 없다. 따라서 원고의 위 주장은 이유 없다.<sup>16)</sup>

#### 나) 잔류감 및 이물감 제거의 현저한 효과 여부

이 사건 제1항 발명의 효과는 기존의 과립제형이 아니라 선행발명의 효과와 대비하여 판단되어야 하는데, 앞서 본 바와 같이 선행발명은 잔류감 및 이물감에 대응되는 입안의 '촉감'을 고려하여 당류 담체의 구성을 채택하고 있고, 이는 이 사건 제1항 발명이 당 또는 당알코올을 속용담체로 사용하는 것과 동일한 원리에 해당한다.<sup>17)</sup>

이 사건 제1항 발명의 이물감과 잔류감 제거효과는 구성요소 4의 당 또는 당알코올의 용해도와 밀접하게 관련되는데, 당 또는 당알코올의 용해도는 앞서 본 바와 같이 입자경에 의하여 용이하게 조절될 수 있으므로, 입자경이 줄어들수록 용해도가 증가한다는 주지의 사실을 숙지하고 있는 통상의 기술자라면 위 잔류감 및 이물감의 제거 효과를 예측할 수 있다고 봄이 타당하다.

16) 이와 관련하여, 이 사건 출원발명의 명세서에는 "과립은 정제를 타정하기 위해서 필요한 중간물질이나 캡슐에 충전하기 위한 중간물질로 보는 것이 통상적이었으며, 이를 최종 투여제형으로 하는 경우에는 복용편의성이 크게 떨어진다는 지견이 일반적이었고, 따라서, 과립제를 독립적인 투여제형으로 하여 복용의 편의성을 증가시키거나 또는 유효성분의 체내동태를 향상시킨 예는 찾아보기 어렵다."라고 기재되어 있으나, 제제를 만드는데 있어 제조단계를 추가하는 것이 아니라 일부의 제조단계를 생략하는 것이 어렵다고 평가할 수는 없다.

17) 구체적으로 이 사건 출원발명 문단번호 [0055]에는 "본 발명에서 사용하는 구체적인 속용담체로서는, 한정되지 아니하나, 바람직하게는 당 또는 당 알코올을 사용할 수 있다. 그 구체적인 예로서는, 자일리톨, 만니톨, 이소말트, 소르비톨, 말티톨, 정제백당, 유당, 이노시톨, 에리스리톨, 결정과당, 트레할로스, 리비톨, 아라비톨, 갈락티톨, 락티톨 및 말토트리톨 등 약제학적으로 허용가능한 당 또는 당 알코올 및 이들의 혼합물을 들 수 있으며, 이와 같은 당 또는 당 알코올 중 순간용해도 30mg/ml 이상, 5분용해도 50mg/ml 이상 및 순간용해도가 최대용해도의 90% 이하라면, 이물감과 잔류감이 없다는 본 발명의 효과를 달성할 수 있다."라고 기재되어 있다.

다만 제조예 10, 11(만니톨)의 용해도 값을 대조해 보면 아래의 표와 같이 순간 용해도 및 5분용해도가 입자경에 반비례하지 않는 현상을 일부 관찰할 수 있기는 하다.18)

제조예 9	말리톨	2852	제조예 9	23.2	50	X
제조예 10	만니톨	400	제조예 10	62.5	78	○
제조예 11	만니톨	542.5	제조예 11	74.2	76	X (순간용해도가 50%를 초과)
제조예 12	만니톨	381.1	제조예 12	30.3	49	X
제조예 13	인도말로스	474	제조예 13	52.2	74	○
제조예 14	인도말로스	355.1	제조예 14	33.4	78	○

그러나 을 제2, 3호증의 각 기재 및 변론 전체의 취지에 의하면, 이 사건 출원 발명의 우선권 주장일 당시 "미분말의 경우 부착성과 응집성이 강하여 약물 입자의 크기를 감소시키더라도 경우에 따라서는 불완전한 습윤이나 응집 때문에 용매에 대한 유효표면적이 감소하여 입자도와 용출이 반대의 경향을 나타낸다."는 사실은 널리 알려진 주지의 사실임이 인정되므로,19) 통상의 기술자라면 제조예 10, 11의 만니톨이 미립화(141.5um⇒ 40um)되더라도 오히려 용해도 저하현상(74.2⇒ 62.5)이 일어날 수 있다는 점을 인식할 수 있고, 따라서 만니톨 입자가 미립자 범위를 벗어날 경우에 비로소 당류 담체의 용해도가 부착현상의 방해 없이 입자경에 반비례할 것을 예상할 수 있으므로, 위 현상 역시 통상의 기술자의 예측범위에서 벗어난 결과가 아니다.

결국 제제를 적정한 입자경 범위 내에서 과립화시킬 경우 용해도가 증가됨으로써 잔류감 및 이물감이 제거될 것이라는 사실은 통상의 기술자가 용이하게 예측할 수

18) 이 사건 출원발명 명세서의 문단번호 [0076] 표 1, [0089] 표 5 각 기재 참조

19) 을 제2, 3호증 중 이에 대응하는 부분의 기재를 구체적으로 요약하면 다음과 같다. "때때로 용출의 입자경과 역수관계는 약물의 표면 성질에 기인하여 나타난다. 경우에 따라서 표면전하 및 응집이 약물 입자의 크기를 감소시키더라도 불완전한 습윤이나 응집 때문에 용매에 대한 유효표면적이 감소하여 입자도와 용출이 반대의 경향을 나타낼 수 있다. 제형화 연구의 초기에는 다양한 첨가제가 약물의 용출에 미치는 영향을 고려하는 연구가 선행되어야 한다."

있으므로, 이 사건 제1항 발명에서 과립제형의 잔류감 및 이물감이 제거된 것은 선행 발명에 비해 현저하게 개선된 효과에 해당한다고 볼 수 없다.

#### 다) Tmax 및 그 표준편차의 현저한 개선 효과 여부

원고의 이 부분 주장은 이 사건 제1항 발명의 Tmax와 그 표준편차가 신테나필 유효성분을 포함한 기존 비아그라 제품보다 뛰어나고, 선행발명의 Tmax가 기존 비아그라 제품과 유사하거나 그보다 열등한 수준이라는 점을 전제로 하고 있다.

먼저 이 사건 제1항 발명이 기존 비아그라 제품에 비하여 Tmax 감소 및 표준편차 감소효과가 현저한지 여부에 관하여 보건대, Tmax를 포함한 약물동태학적 파라미터에 영향을 미치는 요인에는 체내인자 뿐만 아니라 제제의 용해성, 붕해성과 같은 물리적 인자 역시 포함되고, 이와 같은 물리적 성질이 제제에 포함된 첨가제(부형제, 붕해제, 결합제 등)의 종류 및 비율에 따라 결정된다는 점은 제형분야에 널리 알려진 주지의 사실이므로, 양 제형 간 첨가제의 종류 및 비율이 일정 정도의 유사성을 갖추고 있지 아니하다면 그 생체이용률 파라미터를 비교하는 것은 약동학적으로 의미가 없다고 할 것이다. 그런데 만니톨을 과량함유하고 있는 시험군 실시예 220)와 달리 대조군인 기존 비아그라 제품은 이 사건 출원발명의 명세서에 그 부형제의 종류 및 첨가량이 정확히 나타나 있지 않고 속붕해 제제에 해당하지 아니하여 당류를 주된 부형제로 쓰는 속붕해 제형과 그 구성 및 비율이 다르다고 봄이 상당하므로,<sup>21)</sup> 이와 같은 부적

20) 이 사건 출원발명 실시예 2의 만니톨 함량(w/w%)은 전체 정제 중량 대비 86.7%(=390.3/450)라고 되어 있다(문단번호 [0092] 내지 [0094] 각 기재 참조).

21) 기존 비아그라 제품의 부형제 구성은 이 사건 명세서에 그 내용이 구체적으로 나타나지 않는다(문단번호 [0160] 내지 [0164] 각 기재 참조). 다만 일반적으로 조립과정을 거치는 압축정제에는 미세결정 셀룰로오스(microcrystalline cellulose, 분말형 결정셀룰로오스라고도 한다) 및 유당 등의 부형제가 빈번히 선호되는 것으로 알려져 있고(을제5호증 참조), 실제로도 기존 비아그라 제품에는 미세결정셀룰로오스가 포함되어 있다.



절한 실험설계에 기초하여 산출된 Tmax와 그 표준편차를 기초로 이 사건 제1항 발명이 기존 속봉해정보다 Tmax와 그 표준편차에서 현저한 효과가 있다고 단정하기 어렵다.22)

무엇보다 이 사건 제1항 발명의 효과의 현저성을 인정하기 위해서는 이 사건 제1항 발명이 선행발명의 Tmax보다 현저하게 좋다는 점이 인정되어야 할 텐데, 이 점을 인정할 증거가 없다. 이와 관련하여 원고는 선행발명의 Tmax가 기존 비아그라 제품의 Tmax와 유사하거나 열등하다고 주장하나, 앞서 본 바와 같이 기존 비아그라 제품의 부형제의 종류 및 첨가량이 정확히 밝혀지지 아니한 이상 선행발명의 실시예 1, 223)와 기존 비아그라 제품을 직접적으로 대조하는 것은 부적절하고, 설령 원고의 주장대로 양 제제 간 부형제의 구성 및 비율을 무시하고 선행발명 실시예 1, 2의 Tmax 수치24)와 기존 비아그라 제품의 Tmax의 수치25)를 대조해 보더라도, 선행발명의 실시예

22) 이 사건 출원발명의 출원인은 실테나필을 구강 내 속봉해정으로 구성하는 경우, 약효의 발현시간이 통상의 정제보다 오히려 늦어지는 현상이 있음을 발견하였고, 따라서 구강 내 속봉해정은 실테나필에 적합한 제형이 아니라고 명세서에 기재하였으나(문단번호 [0045]), 그렇다고 하여 이 사건 출원발명 시험예 6에서 부형제의 종류 및 비율에 대한 고려 없이 기존 비아그라 제품을 대조군으로 정한 것이 정당화된다고 볼 수도 없다. 이는 출원인이 명세서에서 구강 내 속봉해정이나 스트립제형과 비교해서 Tmax가 단축되면서도 개체간의 편차가 적어진다는 신규한 지견을 얻어 본 발명에 이르렀다고 기재한 점([0050])에 비추어 보면, 더욱 명백하다.

23) 정제 전체중량 대비 당류의 첨가비율이 실시예 1의 경우 57.5%(=90/156.5)이고, 실시예 2의 경우 60.8%(=208.8/343.3)이다.

24) 몸무게 3.5kg정도의 토끼 각각 3마리씩에 경구투여하여 얻은 결과로, 그 내용은 아래 표와 같다.

실테나필 유리염기 및 실테나필 시트레이트와 실테나필 젤산염의 약물동력학적인 파라미터			
	Cmax <sup>1</sup> (ng/ml)	Tmax <sup>2</sup> (min)	AUC 3h <sup>3</sup> (ng·min/ml)
실시예 1	554.1	15	49566.1
실시예 2	1898.5	45	135502.8
비교예 1	40.7	45	6561.4
비교예 6	88.3	30	8017.7
비교예 7	54.2	30	6892.5

1(Cmax): 약물의 최고 혈중 농도  
2(Tmax): 약물이 최고 혈중 농도에 도달한 시간  
3(AUC 3h): 혈중 농도 곡선하 면적

25) 3.0-4.0kg의 뉴질랜드 흰토끼(New Zealand white rabbits) 3마리를 대상으로 경구투여(PO)한 결과로,

1의 경우 기존 비아그라 제품보다 Tmax가 5분 단축된 결과를 나타내므로, 그 효과가 기존 비아그라 제품과 유사하거나 그보다 열등하다고 단정할 수 없다.

한편 이 사건 심결에서는 이 사건 제1항 발명의 Tmax가 0.7시간이고, 선행발명의 Tmax가 0.25~0.75시간으로 나타나 이 사건 제1항 발명의 Tmax수치가 선행발명과 유사하거나 그보다 열등하다고 판단하였으나, 선행발명의 Tmax는 토끼를 대상으로 실험한 결과이고 이 사건 출원발명의 Tmax는 사람을 대상으로 한 것이어서 이를 직접 대비하는 것은 부적절하므로 이 부분 판단은 이를 그대로 받아들이기 어렵다.<sup>26)</sup> 다만 앞서 본 바와 같이 이 사건 제1항 발명의 효과의 현저성을 인정할 증거가 없는 이상 그러한 잘못이 이 사건 심결을 위법하게 만드는 것은 아니라고 할 것이다.

#### 라) 소결

이상의 검토결과를 종합해 보면, 이 사건 제1항 발명은 통상의 기술자가 선행발명에 주지관용기술을 결합하여 쉽게 발명할 수 있는 것이므로, 그 진보성이 부정된다고 할 것이다.

#### 4. 결론

앞서 본 바와 같이 이 사건 제1항 발명의 진보성이 부정된다고 보는 이상 이 사

아래 표 기재와 같다.

	Dose (mg)	Duration		T <sub>max</sub> (min)	C <sub>max</sub> (nM)	K <sub>e</sub> (h <sup>-1</sup> )	T <sub>1/2</sub> (h)	AUC <sub>0-∞</sub> (nM h)	F (%)
		T <sub>max</sub> (min)	(min)						
IV	5.6	—	180	—	4395.1 (772.8)	0.55 (0.22)	1.37 (0.45)	2045.0 (646.8)	100.0
PO	50.0	1.5 (0.5)	238	20.0 (0.0)	8013.5 (552.5)	0.35 (0.07)	2.06 (0.40)	8580.3 (978.1)	33.6

26) Tmax를 포함하는 약물동태학적 파라미터들은 실험개체의 약물흡수, 분포, 대사, 배설과 관련된 체내 인자(클리어런스, 체적 등)들의 영향을 받게 되므로, 시험대상의 종(種)이 다를 경우 약물 대사에 미치는 체내 인자가 달라지고, 특히 경구투여의 경우 이종(異種) 간의 생체이용률의 차이가 존재한다는 사실이 잘 알려져 있었으므로(갑 제9호증 참조), 토끼와 인간의 Tmax를 도출한 양 실험결과를 곧바로 대비할 수는 없다.

건 출원발명 전체에 대하여 특허등록이 거절되어야 하므로<sup>27)</sup> 같은 취지의 이 사건 심결은 적법하다. 따라서 이 사건 심결의 취소를 구하는 원고의 청구는 이유 없으므로 이를 기각하기로 하여 주문과 같이 판결한다.

재판장	판사	서승렬
	판사	정윤형
	판사	김동규

---

27) 특허출원에 있어 특허청구범위가 여러 개의 청구항으로 되어 있는 경우 그 하나의 항이라도 거절이 유가 있는 때에는 그 출원은 전부가 거절되어야 한다(대법원 1992. 2. 25. 선고 91후578 판결, 대법원 1997. 4. 25. 선고 96후603 판결, 대법원 2001. 12. 24. 선고 99후2181 판결 등 참조).