

특 허 법 원

제 4 부

판 결

사 건 2019허1377 거절결정(특)

원 고 A

대표자 B

소송대리인 특허법인(유한) 다래

담당변호사 강승욱, 최영민, 박승문, 김정국

피 고 특허청장

소송수행자 김동석

변 론 종 결 2019. 9. 6.

판 결 선 고 2019. 10. 4.

주 문

1. 원고의 청구를 기각한다.
2. 소송비용은 원고가 부담한다.

청 구 취 지

특허심판원이 2018. 11. 16. 2017원2375호 사건에 관하여 한 심결을 취소한다.

## 이 유

### 1. 기초 사실

#### 가. 이 사건 출원발명

1) 발명의 명칭: 결정

2) 국제출원일/ 우선권주장일/ 출원번호: 2010. 6. 25./ 2009. 6. 26./ 제10-2012-7000526호

3) 청구범위(2017. 2. 24. 보정된 것, 갑 제3호증)

청구항 1. 분말 X선 회절도가 CuK $\alpha$  방사선을 이용하여 얻어지는 것으로서, 분말 X선 회절 스펙트럼에 있어서, 적어도 다음의 회절각 2 $\theta$ :9.4도, 9.8도, 17.2도 및 19.4도에 회절 피크를 나타내는, 2-(4-[N-(5,6-디페닐피라진-2-일)-N-이소프로필아미노]부틸옥시)-N-(메틸술포닐)아세트아미드의 I형 결정(이하 '청구항 1' 또는 '이 사건 제1항 발명'이라 하고, 나머지 청구항에 대해서도 같은 방식으로 부른다).

청구항 2, 3. 삭제

청구항 4. 제1항에 기재된 결정을 유효 성분으로서 함유하는, 당뇨병성 신경 장애, 당뇨병성 괴저, 말초 순환 장애, 만성 동맥 폐색증, 간혈성 파행, 강피증, 혈전증, 폐고혈압증, 심근경색, 협심증, 사구체 신염, 당뇨병성 신증, 만성 신부전, 기관지 천식, 간질성 폐렴, 만성 폐색성 폐질환, 뇨세관 간질성 신염, 염증성 장질환, 또는 척추관 협착증에 따르는 증상의 치료제.

청구항 5. 내지 13. 기재 생략

#### 4) 이 사건 출원발명의 개요(갑 제2호증)

##### 가) 기술분야

[0001] 본 발명은, 2-(4-[N-(5,6-디페닐피라진-2-일)-N-이소프로필아미노]부틸옥시)-N-(메틸술포닐)아세트아미드(이하 '화합물 A'라고 부른다)의 신규 결정에 관한 것이다.

##### 나) 배경기술

[0004] 화합물 A는, 우수한 PGI<sub>2</sub> 수용체 작동 작용을 가지며, 혈소판 응집 억제 작용, 혈관 확장 작용, 기관지근 확장 작용, 지질 침착 억제 작용, 백혈구 활성화 억제 작용 등, 여러 가지의 약효를 나타내는 것이 알려져 있다(예컨대 특허문헌 1 참조).

[0005] 구체적으로는, 화합물 A는, 일과성 뇌허혈 발작(TIA), 당뇨병성 신경 장애, 당뇨병성 괴저, 말초 순환 장애(예컨대 만성 동맥 폐색증, 간헐성 파행, 말초 동맥 색전증, 진동병, 레이노병), 교원병(예컨대 전신성 에리테마토데스, 강피증, 혼합성 결합조직병, 혈관염 증후군), 경피적 관동맥 형성술(PTCA) 후의 재폐색·재협착, 동맥 경화증, 혈전증(예컨대 급성기 뇌혈전증, 폐색전증), 고혈압, 폐고혈압증, 허혈성 질환(예컨대 뇌경색, 심근경색), 협심증(예컨대 안정 협심증, 불안정 협심증), 사구체 신염, 당뇨병성 신증, 만성 신부전, 알레르기, 기관지 천식, 궤양, 욕창(bedsore), 아테렉토미 및 스텐트 유치 등의 관동맥 인터벤션 후의 재협착, 투석에 의한 혈소판 감소, 장기 또는 조직의 섬유화가 관여하는 질환[예컨대 신장 질환(예컨대 뇨세관 간질성 신염), 호흡기 질환(예컨대 간질성 폐렴(폐섬유증), 만성 폐색성 폐질환 등), 소화기 질환(예컨대 간경

변, 바이러스성 간염, 만성체염, 스킨스 위암), 심혈관 질환(예컨대 심근섬유증), 뼈·관  
 절 질환(예컨대 골수섬유증, 류마티스 관절염), 피부 질환(예컨대 수술 후의 반흔, 열상  
 성 반흔, 켈로이드, 비후성 반흔), 산과 질환(예컨대 자궁근종), 비뇨기 질환(예컨대 전  
 립선 비대증), 그 외 질환(예컨대 알츠하이머병, 경화증 복막염, I형 당뇨병, 수술 후 장  
 기 유착)], 발기 부전(예컨대 당뇨병성 발기 부전, 심인성 발기 부전, 정신병성 발기 부  
 전, 만성 신부전에 의한 발기 부전, 전립선 적출을 위한 골반내 수술 후의 발기 부전,  
 가령(加齡)이나 동맥 경화에 따르는 혈관성 발기 부전), 염증성 장질환(예컨대 궤양성  
 대장염, 크론병, 장결핵, 허혈성 대장염, 베체트증에 따르는 장궤양), 위염, 위궤양, 허  
 혈성 안질환(예컨대 망막 동맥 폐색증, 망막 정맥 폐색증, 허혈성 시신경증), 돌발성 난  
 청, 무혈관성 골괴사, 비스테로이드성 항염증제(NSAIDs)(예컨대 디클로페낙, 멜록시캄,  
 옥사프로진, 나부메톤, 인도메타신, 이부프로펜, 케토프로펜, 나프록센, 셀레콕시브) 투  
 여에 따르는 장관 상해(예컨대 십이지장, 소장, 대장에서 발증하는 상해이면 특별히 제  
 한되지 않지만, 예컨대 십이지장, 소장, 대장에서 발생하는 등의 점막 상해나 궤양), 척  
 주관 협착증(예컨대 경부 척주관 협착증, 흉부 척주관 협착증, 요부 척주관 협착증, 광  
 범 척주관 협착증, 선골 협착증)에 따르는 증상(예컨대 마비, 지각 둔마, 동통, 저림, 보  
 행 능력의 저하)의 예방제 또는 치료제로서 유용한 것이 알려져 있다(예컨대 특허문헌  
 1~6 참조). 또한, 화합물 A는, 유전자 치료 또는 자기 골수 세포 이식 등의 혈관 신생  
 요법의 촉진제, 말초 혈관 재건술 또는 혈관 신생 요법에서의 혈관 형성 촉진제로서도  
 유용한 것이 알려져 있다(예컨대 특허문헌 1 참조).

[0006] 상기한 바와 같이, 화합물 A가 각종 질환에 대한 치료약 등으로서 유용한 것이 알려져 있지만, 결정의 존재 유무 등에 대해서는 기재도 시사도 되어 있지 않다.

#### 다) 발명의 내용

[0008] 본 발명은, 우수한 약효를 갖는 화합물 A의 신규 결정을 제공하는 것을 목적으로 하는 것이다. 또한, 본 발명은, 상기 결정의 제법, 상기 결정을 유효 성분으로서 함유하는 의약 조성물을 제공하는 것을 목적으로 하는 것이다.

[0009] 의약품 원말은, 항상 일정한 작용 효과를 기대할 수 있는 고품질의 것으로서, 공업적으로 취급하기 쉬운 형태의 것이 요구되고 있다.

[0010] 그래서 본 발명자들은 예의 연구를 거듭한 결과, 화합물 A의 신규 결정을 발견하여 본 발명을 완성하였다.

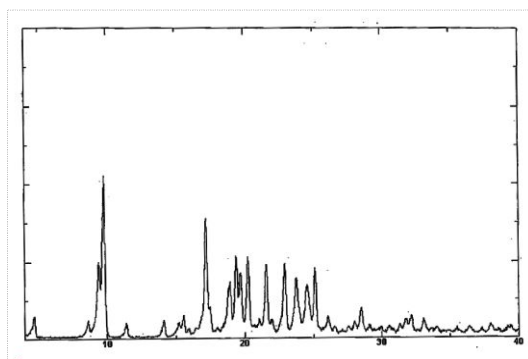
[0018] 본 발명 I형 결정은, 분말 X선 회절 스펙트럼에 있어서, 적어도 9.4도, 9.8도, 17.2도 및 19.4도에 회절 피크를 나타내는 것을 특징으로 한다.

[0071] 본 발명에 따른 화합물 A는, 우수한 PGI<sub>2</sub> 수용체 작동 작용을 가지며, 혈소판 응집 억제 작용, 혈관 확장 작용, 기관지근 확장 작용, 지질 침착 억제 작용, 백혈구 활성화 억제 작용 등, 여러 가지의 약효를 나타낸다(예컨대 특허문헌 1 참조).

#### [0097] 실시예 1 본 발명 I형 결정의 제조

[0098] 화합물 A(40g)에 에탄올(440mL)을 가하여, 100℃~110℃의 유욕에서 가열하면서 교반하고, 화합물 A를 용해한 후, 에탄올(280mL)을 증류 제거하였다. 얻어진

농축액을 80℃의 수욕에서 가열 환류시키면서 1시간 교반하였다. 교반하면서 10℃까지 20시간 들여 서냉하고, 석출한 결정을 여과하여 취했다. 얻어진 결정을 소량의 에탄올(48mL)로 세정하고, 60℃에서 감압 건조하여 본 발명 I형 결정(38.93g, 97.3%)을 얻었다. 본 발명 I형 결정의 분말 X선 회절 스펙트럼을 도 1에 도시한다.



[도 1]

#### [0100] 실시예 2 본 발명 I형 결정의 제조

[0101] 화합물 A(20g)에 에탄올(99g)과 메틸에틸케톤(11g)을 가하여, 77℃로 가열하고 화합물 A를 용해한 후, 10℃까지 20시간 들여 서냉하였다. 냉각 중에, 본 발명 I형 결정을 소량 첨가하였다. 냉각 후, 석출한 결정을 여과하여 취하고, 에탄올로 세정한 후, 60℃에서 감압 건조하여 본 발명 I형 결정(18.72g, 93.6%)을 얻었다.

[0123] 상기 (1) 및 (2)의 결과로부터, 본 발명 I형 결정은, 다른 본 발명 II형 결정, 본 발명 III형 결정보다 입자 직경이 큰 것을 알았다.

[0135] 어느 본 발명 결정에서도, 그 결정중에 높은 레벨의 잔류 용매를 포함하지는 않지만, 그 중에서도 본 발명 I형 결정은, 결정중에 포함되는 잔류 용매가 다른 본

발명 II형 결정, 본 발명 III형 결정과 비교하여 가장 적다.

[0152] 상기 결과로부터, 본 발명 I형 결정은, 다른 본 발명 II형 결정, 본 발명 III형 결정과 비교하여, 재결정 공정에서의 불순물 제거 효과가 높다.

[0169] 상기 (1), (2)의 검토 결과로부터, 본 발명 II형 결정 및 본 발명 III형 결정은 여러 가지의 결정화 용매를 이용하는 것에 의해 취득할 수 있는 것을 알 수 있다.

[0170] 한편, 본 발명 I형 결정을 포함하는 결정은, 결정화 용매로서 알코올계 용매를 사용한 경우에 취득할 수 있고, 고순도의 본 발명 I형 결정은, 에탄올을 사용한 경우에 취득할 수 있었다.

#### 나. 선행발명(갑 제4호증)<sup>1)</sup>

선행발명은 2004. 2. 18. 공개되고 대한민국 공개특허공보 제2004-15174호로 게재된 '복소환 유도체 및 의약'에 관한 것으로서, 주요내용 및 도면은 다음과 같다.

##### (1) 기술분야

본 발명은 의약으로서 유용한 신규 복소환 유도체 또는 그 염, 및 그것을 유효 성분으로서 함유하는 PGI<sub>2</sub> 수용체 작동제에 관한 것이다(제2면 2~3행).

##### (2) 발명의 상세한 설명

본 발명의 목적은 신규한 PGI<sub>2</sub> 수용체 작동제, 및 신규한 복소환 유도체를 제공하는 데 있다(제2면 30행).

**실시예 84.** 2-{4-[N-(5,6-디페닐피라진-2-일)-N-이소프로필아미노]부틸옥시}-N-(메틸술포닐)아세트아미드

아르곤 분위기하에, 실시예 42에서 얻어진 2-{4-[N-(5,6-디페닐피라진-2-일)-N-이소프로필

1) 원고에 의하여 출원, 등록된 발명으로서, 이 사건 출원발명 심사과정에서의 의견제출통지서에 기재된 비교대상 발명과 동일하다.

아미노]부틸옥시}초산 300mg의 무수 테트라히드로푸란 5ml 용액에 1,1'-카르보닐디이미다졸 128mg을 첨가하고, 실온 30분 교반한 후, 30분 가열 환류하였다. 실온까지 방냉하고, 메탄술폰아미드 69mg을 첨가하여, 10분 교반한 후, 1,8-디아자비시클로[5.4.0]-7-운데센 0.11ml를 적하하였다. 실온에서 밤새 교반한 후, 반응액을 물로 희석하고, 디에틸에테르로 추출하였다. 무수 황산마그네슘으로 건조한 후, 감압하에 용매를 증류 제거하고, 잔류물을 실리카 겔의 컬럼 크로마토그래피로 정제하여, 목적 화합물 272mg을 얻었다.

원소 분석치(C<sub>26</sub>H<sub>32</sub>N<sub>4</sub>O<sub>4</sub>S로서)

계산치(%) C : 62.88 H : 6.49 N : 11.28,

실측치(%) C : 63.06 H : 6.47 N : 10.98(53면 9~19행)

#### 시험예 5. 원숭이 생체외(ex vivo) 혈소판 응집 억제 실험

실시에 84의 화합물을 0.3 또는 1mg/kg의 용량으로 각각 2마리의 게잡이 원숭이(Macaca fascicularis, 수컷, 3~5세)에 경구 투여하고, 투여 전 및 투여로부터 2, 4, 8시간 후에, 3.8% 시트르산 수용액을 채혈량의 1/10 함유하는 주사기를 사용하여 각 4.5ml 채혈하였다. 시트르산 가혈액을 200×g으로 10분간 원심 분리하고, 상층의 혈소판 농후혈장(PRP)을 채취하고, 나머지 혈액을 1500×g으로 10분간 더 원심 분리한 후, 상청을 회수하여, 혈소판 결핍 혈장(PPP)을 얻었다. PRP 190μl를 측정용 큐벳에 넣고, 37°C에서 1분간 가온한 후, 5~30μM ADP 용액 10μl을 첨가하여 응집을 야기하였다. PPP를 맹검으로 하여, 혈소판 응집 측정 장치(PM8C, 메바닉스, 동경)로 혈소판 응집율을 측정하고, 약제 투여전의 응집율과 투여후의 응집율의 비교로부터 하기 식에 의해 혈소판 응집 억제율을 구하였다. 그 결과를 표 3에 나타낸다. 실시에 84의 화합물은 투여 2~8시간에 걸쳐 지속적이고 또한 용량 의존적으로 혈소판 응집을 억제하고, 약효 지속이 긴 것이 분명하다(제58면 21행 내지 제59면 8행).

혈소판 응집 억제율(%) = 100-(약제 투여후의 응집율)/(약제 투여전의 응집율) ×100

#### 다. 이 사건 심결의 경위

1) 특허청 심사관은 2016. 7. 5. '이 사건 제1항 내지 제11항 발명은 그 발명이 속하는 기술분야에서 통상의 지식을 가진 사람(이하 '통상의 기술자'라 한다)이 선행발명으

로부터 쉽게 발명할 수 있고, 이 사건 제4항 내지 제8항 발명은 특허법 제42조 제4항 제2호의 청구범위 기재요건을 위반하였다'라는 의견제출통지를 하였다.

2) 원고는 2016. 9. 13. 기존의 청구항 4 내지 11을 삭제하고, 청구항 4 내지 11을 신설하는 내용의 보정서와, '이 사건 제1항 내지 제3항 발명의 결정형은 선행발명에 전혀 기재 또는 암시되어 있지 않고, 의약품 원말로서 고품질이며 공업적으로 취급하기 용이한 형태에 해당하는 점에서 진보성이 있다'라는 취지의 의견서를 제출하였으나, 특허청 심사관은 2017. 1. 2. 여전히 이 사건 제1항 내지 제13항 발명에 대한 진보성 부정의 거절이유가 해소되지 아니하였다는 이유로 이 사건 출원발명에 대해 거절결정을 하였다.

3) 이에 원고는 2017. 2. 24. 청구항 2 및 3을 삭제하는 내용의 보정서와 의견서를 제출하고 재심사를 청구하였으나, 특허청 심사관은 2017. 4. 14. '이 사건 제1항, 제4항 내지 제13항 발명은 2016. 7. 5.자 의견제출통지서의 거절이유를 여전히 해소하지 못하였다'라는 이유로 이 사건 출원발명에 대해 이 사건 거절결정을 하였다.

4) 원고는 2017. 5. 16. 특허심판원에 피고를 상대로, '이 사건 출원발명은 통상의 기술자가 선행발명에 의하여 쉽게 발명할 수 없어 진보성이 인정되므로 특허등록이 되어야 한다'라고 주장하면서 거절결정불복심판(2017원2375호)을 청구하였다.

5) 특허심판원은 2018. 11. 16. '이 사건 제4항 발명은 선행발명에 의하여 진보성이 부정된다'고 판단하여 원고의 위 심판청구를 기각하는 이 사건 심결을 하였다.

**【인정 근거】** 다툼 없는 사실, 갑 제1 내지 4호증의 각 기재, 변론 전체의 취지

## 2. 이 사건의 쟁점 및 당사자들의 주장 요지

### 가. 이 사건의 쟁점

1) 이 사건 제4항 발명과 그 종속항 발명인 이 사건 제5 내지 13항 발명은 이 사건 제1항 발명에 기재된 화합물 A의 I형 결정을 유효 성분으로 함유하는 치료제에 관한 것으로서 용도 발명에 해당하는데, 그 약학적 효과가 선행발명의 그것과 동질의 효과인 점에 대해서는 당사자 사이에 별다른 다툼이 없다. 나아가 화합물 A가 우수한 PGI2 수용체 작동 작용을 가지며, 혈소판 응집 억제 작용, 혈관 확장 작용, 기관지근 확장 작용, 지질 침착 억제 작용, 백혈구 활성화 억제 작용 등 여러 가지의 약효를 나타낸다는 점, 구체적으로 화합물 A가 이 사건 제4항 발명과 그 종속항 발명인 이 사건 제5 내지 13항 발명에 기재된 질환의 예방제 또는 치료제로서 유용하다는 점은 이미 공지되어 있으므로(이 사건 출원발명 명세서 식별번호 [0004], [0005] 참조), 이 사건 제4항 발명과 그 종속항 발명인 이 사건 제5 내지 13항 발명의 효과가 선행발명의 그것에 비해 현저하다고 볼 수도 없다.

2) 따라서 이 사건 제4항 발명의 진보성이 부정된다고 한 이 사건 심결의 당부를 판단하는 이 사건에서, 이 사건 제4항 발명의 의약조성물이 유효성분으로 삼은 결정, 즉 이 사건 제1항 발명의 청구범위에 기재된 화합물 A의 I형 결정까지 선행발명으로부터 쉽게 도출할 수 있는지 여부가 쟁점이다.

### 나. 원고의 주장 요지

이 사건 제1항 발명의 청구범위에 기재된 화합물 A의 I형 결정은 아래와 같은 이유로 통상의 기술자가 선행발명으로부터 쉽게 도출할 수 없으므로, 이 사건 심결은 취소되어야 한다.

1) 이 사건 출원발명은 다른 결정형보다 우수한 효과를 갖는 화합물 A의 신규한 I형

결정에 관한 것으로, 이는 분말 X선 회절 스펙트럼에서의 특정 피크값들에 의해 한정된 결정이다. 반면, 선행발명에는 화합물 A의 결정형이 개시되어 있지 않은데, 어떤 화합물의 특정 결정형은 그 구조 및 특성은 물론, 존재 여부조차 예측이 불가능하고, 화합물 A의 I형 결정의 경우 구체적인 결정화 조건이나 제조방법을 찾아내는 데에 수많은 실험과 시행착오가 필요하다. 따라서 통상의 기술자라도 선행발명으로부터 이 사건 출원발명의 I형 결정을 도출해낼 수 없다.

2) 이 사건 출원발명의 명세서에 따르면 화합물 A의 I형 결정은 통상의 기술자가 선행발명으로부터 예측하기 어려운 ① 큰 입자 직경, ② 낮은 잔류 용매 농도, ③ 재결정에서의 불순물 농도, ④ 높은 안정성에 있어서 선행발명에 비해 양적으로 현저한 효과를 가진다.

3) 선행발명의 출원인이자 이 사건 출원발명의 출원인인 원고는 선행발명의 실시예 84에 기재된 방법에 따라 합성한 화합물 A를 회사 내에서 관리·보존하고 있었는데, 2014. 4. 14. X선 분말 회절법(X-Ray Diffraction: XRPD)을 수행한 결과, 위 화합물은 III형 결정으로 확인되었다(갑 제5호증). 또한, 2007. 3. 26.~2010. 4. 12.에 수행된 실험 결과에 따르면, 화합물 A의 I형 결정은 화합물 A의 III형 결정에 비해 높은 순도 및 불순물 제거율을 가지는 것이 확인되고(갑 제16호증), 2007. 9. 10~2010. 5. 31.에 수행된 실험결과에 따르면, 화합물 A의 I형 결정은 화합물 A의 III형 결정에 비해 우수한 안정성을 가지는 것이 확인된다(갑 제17호증).

#### 다. 피고의 주장 요지

이 사건 제1항 발명의 청구범위에 기재된 화합물 A의 I형 결정은 통상의 기술자가 선행발명으로부터 쉽게 도출할 수 있으므로, 이 사건 심결은 정당하다.

1) 이 사건 출원발명이 속하는 의약 화합물 기술분야에서 원료 의약품의 결정다형을 얻고 이를 검토하는 것은 통상적인 과정이고, 이 사건 출원발명에 적용된 용매인 에탄올, 메틸에틸케톤은 유기화합물의 결정 제조에 통상적으로 사용되는 용매에 불과하며, 화합물 A에 대하여 결정화가 불가능하다거나 통상적인 결정화 방법들로 결정다형이 얻어지지 않는다는 등의 특별한 사정이 알려져 있었던 것도 아니므로, 통상의 기술자가 화합물 A의 I형 결정을 도출하는 데에 기술적 어려움이 있다고 보기 어렵다.

2) 결정형에 따라 입자 크기가 달라지는 것과 결정을 제조하면서 잔류 용매 함량을 최적화하는 것은 이 기술분야의 기술상식에 해당하고, 이 사건 출원발명에 기재된 불순물 제거율은 다른 결정형에 비하여 현저하다고 보기 어렵다. 또한, 이 사건 출원발명의 명세서에는 원고가 주장하는 우수한 안정성에 대한 명시적인 기재가 없기 때문에 이러한 효과는 이 사건 출원발명의 진보성 판단에 고려대상이 될 수 없다.

### 3. 이 사건 심결의 적법 여부에 관한 판단

가. 이 사건 제1항 발명의 청구범위에 기재된 화합물 A의 I형 결정이 선행발명으로부터 쉽게 도출될 수 있는지 여부

#### 1) 구성의 대비

가) 이 사건 제1항 발명과 선행발명의 대응구성

구성 요소	이 사건 제1항 발명	선행발명(갑 제4호증)
1	분말 X선 회절도가 CuK $\alpha$ 방사선을 이용하여 얻어지는 것으로서, 분말 X선 회절 스펙트럼에 있어서, 적어도 다음의 회절각	(대응 기재 없음)

	2θ: 9.4도, 9.8도, 17.2도 및 19.4도에 회절 피크를 나타내는	
2	2-(4-[N-(5,6-디페닐피라진-2-일)-N-이소프로필아미노]부틸옥시)-N-(메틸술포닐)아세트아미드의	2-(4-[N-(5,6-디페닐피라진-2-일)-N-이소프로필아미노]부틸옥시)-N-(메틸술포닐)아세트아미드(실시예 84 참조)
3	I형 결정	(대응 기재 없음)

이 사건 제1항 발명과 선행발명은 모두 동일한 화학구조를 갖는 2-(4-[N-(5,6-디페닐피라진-2-일)-N-이소프로필아미노]부틸옥시)-N-(메틸술포닐)아세트아미드(화합물 A) 화합물이라는 점에서 공통된다.

다만 이 사건 제1항 발명은 '분말 X선 회절도가 CuKα 방사선을 이용하여 얻어지는 것으로서, 분말 X선 회절 스펙트럼에 있어서, 적어도 다음의 회절각 2θ : 9.4도, 9.8도, 17.2도 및 19.4도에 회절피크를 나타내는 것으로 특정된 I형 결정'임에 비하여, 선행발명은 위 대응구성이 결정형인지, 결정형이라면 어떠한 결정형인지를 개시하고 있지 않다는 점에서 차이가 있다.

#### 나) 결정형 발명에 있어서 진보성 판단 기준에 관한 법리

동일한 화합물이 여러 결정 형태를 가질 수 있고 그 결정 형태에 따라서 용해도, 안정성 등의 약제학적 특성이 다를 수 있음은 의약화합물 기술분야에서 널리 알려져 있어 의약화합물의 제제설계(製劑設計)를 위하여 그 결정다형(結晶多形)의 존재를 검토하는 것은 통상 행해지는 일이므로, 의약화합물 분야에서 선행발명에 공지된 화합물과 결정 형태만을 달리하는 특정 결정형의 화합물을 특허청구범위로 하는 이른바 결정형 발명은, 특별한 사정이 없는 한 선행발명에 공지된 화합물이 갖는 효과와 질적으로 다른 효과를 갖고 있거나 질적인 차이가 없더라도 양적으로 현저한 차이가 있는 경우에

한하여 그 진보성이 부정되지 아니한다. 이때 결정형 발명의 상세한 설명에는 선행발명과의 비교실험자료까지는 아니라고 하더라도 위와 같은 효과가 있음이 명확히 기재되어 있어야만 진보성 판단에 고려될 수 있으며, 만일 그 효과가 의심스러울 때에는 출원일 이후에 출원인 또는 특허권자가 신뢰할 수 있는 비교실험자료를 제출하는 등의 방법에 의하여 그 효과를 구체적으로 주장·입증하여야 한다(대법원 2011. 7. 14. 선고 2010후2865 판결 등 참조).

다) 구성의 곤란성을 인정할 수 있는지 여부

이 사건 제1항 발명은 화합물 A 결정다형체 중 분말 X선 회절 스펙트럼에 있어서 회절각 2θ: 9.4도, 9.8도, 17.2도 및 19.4도에 회절피크를 나타내는 I형 결정을 특정하고 있는 발명으로서, 이 사건 제1항 발명의 결정형 화합물인 화합물 A는 선행발명에 개시된 화합물과 화학구조가 동일하고 결정형 형태인 점에서 차이가 있다.

그런데 위 법리에 비추어 볼 때, 이 사건 제1항 발명이 화합물 A의 I형 결정 자체를 특허청구범위로 하는 물질특허로서 결정형의 존재가 알려진 바 없었던 화합물 A의 신규한 결정형을 규명한 것이라고 하더라도, 여전히 화합물 A의 I형 결정은 선행발명에 개시된 화합물과 화학구조가 동일하고, 의약화합물의 제제설계를 위하여 그 결정다형의 존재를 검토하는 것은 통상 행해지는 일이므로, 특별한 사정이 없는 한 위와 같은 차이점만으로는 이른바 결정형 발명에 해당하는 이 사건 제1항 발명에 구성의 곤란성이 있다고 볼 수 없다.

라) 원고의 주장에 대한 판단

(1) 원고는 의약용도를 갖는 일부 화합물에 관하여 결정다형이 보고된 예만을 가지고 모든 신약물질의 경우에도 마찬가지로 결정다형이 존재한다는 전제하에 다형성

을 확인해 보는 것이 통상적이라고 일반화할 수 없고, 결정다형 내지 다형성의 존재 가능성을 예측할 수 있는 해당 기술분야에 수용된 화학법칙 또는 원리는 존재하지 아니하며, 이 사건 출원발명 이전에는 화합물 A가 다형성을 갖는다는 아무런 단서도 없었던 점에 비추어 볼 때, 이 사건 출원발명의 우선권주장일 당시 화합물 A의 다형성을 확인하여 I형 결정을 인식하는 것은 통상의 기술상식을 벗어나는 일이었으므로 구성의 곤란성을 인정해야 한다고 주장한다.

살피건대, 을 제1 내지 5호증, 을 제13호증의 각 기재에 변론 전체의 취지를 더해 보면, 이 사건 출원발명의 우선권주장일 당시 통상의 기술자에게 신약 물질의 결정형의 차이가 의약품의 품질이나 성능, 생흡수성 또는 안정성 등에 영향을 줄 수 있다는 점, 다형체의 신뢰할 수 있는 대량 생산 방법이 개발되어야 한다는 점, 다형체 순도가 최적화되어야 한다는 점, 공업적으로 쉽게 취급할 수 있도록 결정형이 일정한 입자 크기 및 모폴로지를 가져야 한다는 점은 널리 알려져 있었던 사실, 미국 FDA가 발간한 지침서에는 '일부 신약 물질들은 물리적 성질을 달리 하는 별도의 결정형들로 존재하는데, 각각의 결정 형태의 차이가 신약 제품의 품질 또는 성능에 영향을 미치기 때문에 적절한 고체 형태가 특정되어야 한다'라고 기재되어 있는 사실, 약학적인 개발을 위해 고체상 화합물로부터 결정다형을 동정하고 특정하여 최적의 형태를 선택하고, 적절한 고체 형태가 선택된 후에는 그 형태를 생산하기 위하여 신뢰할 수 있는 대량 생산 공정을 개발하는 점 또한 의약 화합물 분야에서 널리 알려진 사실, 나아가 최적의 고체상 형태를 선택하여 제조하는 것은 원하는 물리적 특성, 제조 및 취급의 용이성, 안정성, 인허가, 특허로서의 보호 등을 위해 대단히 중요한 사항이라는 점도 이 발명이 속하는 기술분야에서 널리 알려진 사실, 통상의 기술자가 의약화합물의 모든 관

련된 다형체와 수화물을 확인하고 그들을 특정하며 추가적인 화학적 및 약학적 개발을 위한 최적의 형태를 선택하기 위하여 다형체 스크리닝을 시도해보는 것은 해당 기술분야에 잘 확립되어 있는 통상적인 연구개발 과정에 속하였던 사실, 결정다형 관련 서적에 의하면 어떤 화합물이 다형체, 용매화물 등 고체형태로 존재할 확률이 100%에 가깝다고 기재되어 있는 사실, 1999년 유럽 약전의 각 화합물에 대한 모든 문헌정보를 수집하여 다형체에 대한 언급을 조사한 결과 135종의 화합물에서 58%가 다형성이었고, 바이엘 사에 의하여 개발된 62종의 활성성분을 조사한 결과 80%가 다형성을 나타냈으며, 2006년 출간된 문헌에서 시판 중인 의약품의 약 80%가 실험적으로 접근 가능한 조건에서 다형성을 나타내는 것으로 시사한 사실이 인정된다. 이러한 사실에 더하여 아래 (2)항에서 보는 바와 같이 청구항 1의 결정 형태를 제조하기 위하여 특별히 새로운 지식이나 기술이 부가되었다고 평가할 만한 사정을 찾아볼 수 없는 점을 고려하면, 비록 선행발명에 화합물 A의 다형성에 대해 개시 또는 시사되어 있지 않더라도, 이 사건 출원발명의 우선권주장일 당시 선행발명의 화합물 A의 다형성을 확인하여 I형 결정을 인식하려는 시도가 기술상식을 벗어날 만큼 통상의 기술자에게 자명하지 않았다고 보기 어렵다. 이와 전제를 달리한 원고의 위 주장은 받아들이지 아니한다.

(2) 원고는 화합물 A의 I형 결정을 순수하게 얻는 데에는 용매의 선택, 용매양의 결정, 재결정 조건의 설정 등 수많은 조건의 설정이 필요하기 때문에 선행발명으로부터 이 사건 제1항 발명이 쉽게 도출되기 어렵다고 주장한다.

살피건대, 물질특허인 이 사건 제1항 발명의 구성의 곤란성을 판단함에 있어서 그 물질의 제조방법은 구성요소로 볼 수 없다. 통상의 기술자가 이 사건 제1항 발명의 제조방법을 도출하기가 용이하지 않다는 등의 사정은, 그러한 제조 방법이 방법발명이

될 수 있는지 여부는 별론으로 하고, 결정형 발명에 있어서 구성의 곤란성을 인정할 특별한 사정에 해당하지 아니하고, 달리 그와 같은 특별한 사정을 인정할 만한 증거도 없다. 설령 이와 달리 보더라도, 결정화와 관련된 핸드북(을 제4호증)에는 "결정화를 위해서는 당연히 평형 용해도 값이 용액 중의 용질 농도 값보다 낮은 조건이 만들어져야 한다. (중략) 결정화는 냉각 결정화 장치에서처럼 온도를 낮추거나, 증발 결정화 장치에서처럼 용매를 제거하거나, 혹은 침전 결정화 장치에서처럼 산 또는 염기, 혼합 가능한 반응매 또는 비용매 또는 염을 첨가하여 용액 조성을 변화시키는 것에 의해 달성될 수 있다. 원하는 용해도 감소를 달성하기 위해 이러한 방법들은 종종 복합적으로 사용된다"라고 기재된 사실이 인정되고(249면 우측 칼럼 32~45행), 이로부터 결정화 방법은 기본적으로 과포화된 상태와 평형 상태의 용해도 차이를 이용하는 것이고, 구체적인 방법으로서 용액의 냉각과 함께 용매 제거, 침전 등의 다양한 방법이 사용되고 있음을 알 수 있다. 또한, 화학자의 기초적 실험기법에 관한 핸드북(을 제5호증)에도 "용매에서 용질의 용해도는 용매와 용질의 화학적 구조뿐만 아니라 온도의 함수이기도 하다. 대부분의 경우에 용매에서 용질의 용해도는 온도가 증가함에 따라 증가한다"라고 기재된 사실이 인정되고(241면 28행 내지 242면 3행), 이로부터 일반적으로 온도가 증가하면 용질의 용해도도 증가한다는 것을 알 수 있다. 나아가 위 핸드북(을 제5호증)에는 이 사건 출원발명에서 화합물 A의 I형 결정의 분리에 사용된 용매인 에탄올을 비롯하여 비극성 용매인 석유에테르에서부터 극성 용매인 물까지 다양한 종류의 용매가 개시되어 있는바(표 13-1 참조), 이 사건 출원발명의 화합물 A의 I형 결정에 관한 제조 과정은 통상의 기술자가 해당 기술 분야에 잘 알려진 결정화방법과 용매를 선택한 것에 불과할 뿐, 결정화 방법이나 용매를 선택하는 데 있어서 특별한 기술적 어려움이

있다고 볼 수 없다.

원고의 위 주장은 어느 모로 보나 받아들일 수 없다.

## 2) 효과의 대비

가) 이 사건 제1항 발명의 화합물 A가 선행발명에 공지된 화합물이 갖는 효과와 질적으로 다른 효과를 갖고 있지 않다는 점에 대해서는 당사자 사이에 별다른 다툼이 없다. 따라서 이하에서는 이 사건 제1항 발명의 화합물 A가 선행발명에 공지된 화합물이 갖는 효과에 비해 양적으로 현저한 차이가 있는 경우에 해당하는지 여부를 살핀다.

나) 이 사건 출원발명의 명세서에는 이 사건 제1항 발명의 효과에 대해 다음과 같이 기재되어 있다.

### 이 사건 출원발명의 명세서

#### [0112]~[0123] 시험예 1. 입자 직경 측정

20mg의 본 발명에 결정에 분산매 10mL를 가하여 섞은 후, 초음파를 이용하여 분산시켰다. 이 분산액에 대해 LA-910[(주)호리바제작소재]을 이용하여 입자 직경 분포를 구하였다. 그 결과를 표 1에 나타낸다.

[표 1]

	결정형	D 1 0	D 5 0	D 9 0
1	본 발명 I형 결정	5. 6	1 2. 8	2 5. 8
2	본 발명 II형 결정	5. 2	1 1. 3	2 2. 0
3	본 발명 III형 결정	4. 3	8. 0	1 4. 4

D10: 체적 기준의 적산 입경 분포의 체하(undersize) 10%의 입경( $\mu\text{m}$ )을 나타낸다.

D50: 체적 기준의 적산 입경 분포의 체하 50%의 입경( $\mu\text{m}$ )을 나타낸다.

D90: 체적 기준의 적산 입경 분포의 체하 90%의 입경( $\mu\text{m}$ )을 나타낸다.

상기 결과로부터 **본 발명 I형 결정은 다른 본 발명 II형 결정, 본 발명 III형 결정보다 입자 직경이 큰 것을 알았다.**

#### [0124]~[0135] 시험예 2. 본 발명 결정중에 포함되는 잔류 용매 농도의 측정

본 발명 결정 중에 포함되는 잔류 용매 농도를 이하의 측정 조건을 이용하여 측정하였다.

그 결과를 표 2에 나타낸다.

[표 2]

	결정형	용매	함유량(ppm)
1	본 발명 I형 결정	에탄올 메틸에틸케톤	371 82
2	본 발명 II형 결정	에탄올 메틸에틸케톤	2169 246
3	본 발명 III형 결정	초산이소프로필 초산 n-부틸	93 2781

어느 본 발명 결정에서도, 그 결정 중에 높은 레벨의 잔류 용매를 포함하지는 않지만, 그 중에서도 본 발명 I형 결정은, 결정 중에 포함되는 잔류 용매가 다른 본 발명 II형 결정, 본 발명 III형 결정과 비교하여 가장 적다.

[0136]~[0152] **시험예 3. 재결정에서의 불순물 제거 효과**

각 결정에서의 화합물 A의 순도(%) =

$$(\text{각 결정에서의 화합물 A의 피크 면적}) / (\text{전체 피크 면적의 총합}) \times 100$$

다음에, 각 결정에서의 불순물 제거율(%)은 이하의 식에 의해 산출하였다.

각 결정에서의 불순물 제거율(%) =

$$[(\text{각 결정에서의 화합물 A의 순도}) - (\text{원료에서의 화합물 A의 순도})] / \{100 - (\text{원료에서의 화합물 A의 순도})\} \times 100$$

그 결과를 표 3에 나타낸다.

[표 3]

	결정형	각 결정에서의 화합물 A의 순도(%)	각 결정에서의 불순물 제거율(%)
	원료	98.04	
1	본 발명 I형 결정	99.51	75
2	본 발명 II형 결정	99.33	66
3	본 발명 III형 결정	98.97	47

상기 결과로부터 본 발명 I형 결정은 다른 본 발명 II형 결정, 본 발명 III형 결정과 비교하여, 재결정 공정에서의 불순물 제거 효과가 높았다.

다) 입자의 직경에 대한 효과

① 이 사건 출원발명에는 화합물 A의 I형 결정이 II형, III형 결정에 비해 입자의

직경이 큰 것을 확인하였다는 내용의 실험데이터가 기재되어 있다. 그러나 이 사건 출원발명이 속한 기술분야에서는 결정형에 따라 입자 크기가 달라질 수 있는 점(을 제6호증 제15면 우측 컬럼 제26행~제16면 좌측 컬럼 제2행), 결정의 입자 크기가 결정화 공정의 조건에 따라 영향을 받는다는 점(을 제7호증 제386면 제15~20행)이 알려져 있었고, I형 결정과 II형 결정의 입자 직경의 차이는 가장 큰 경우라도 14.7% 수준에 불과하므로<sup>2)</sup>, 위 기재만으로는 화합물 A의 I형 결정의 입자의 크기가 다른 결정형에 비하여 양적으로 현저한 효과를 가져온다고 인정하기 어렵다.

② 한편 원고는 2014년경 선행발명 실시예 84의 방법으로 합성되어 사내에서 보존·관리되어 있던 샘플을 사용하여 측정한 실험(갑 제5호증)에 의하여 화합물 A가 III형 결정인 사실을 확인하였는데, 이 사건 제1항 발명은 D90이 25.8 $\mu$ m로, 선행발명에 개시된 화합물 A인 III형 결정의 D90인 14.4 $\mu$ m에 비하여 약 1.8배 큰 입자 직경을 갖기 때문에 선행발명에 비해 이 사건 제1항 발명은 양적으로 현저한 효과를 나타낸다는 취지의 주장을 한다.

그러나 위 실험결과(갑 제5호증)의 신뢰성을 담보할 만한 근거가 없을 뿐만 아니라<sup>3)</sup>, 원고는 원고의 주장에 따르더라도 선행발명의 화합물 A가 III형 결정임을 알게 된 후인 2016. 9. 13.에 이 사건 출원발명에 관한 의견제출통지서에 대한 의견서를 제출하였는데, 그 의견서에는 "2-4-[N-(5,6-디페닐피라진-2-일)-N-이소프로필아미노]부틸옥시]N-(메틸술포닐)아세트아미드의 I형 결정, II형 결정, 및 III형 결정은, 본원 명세서의 시험예 1 내지 3에 나타난 바와 같이 각 결정의 입자 직경의 크기(표 1), 각 결정 중에

2) 입자의 직경 차이는 다음 식에 의해 산출하였다 [(I형-II형(또는 III형))/I형] $\times$ 100(%)

3) 원고는 변론종결 후 제출한 2019. 9. 27.자 참고서면에서도 최적의 조건에서 보존·관리한 샘플을 가지고 실험하였다고만 주장할 뿐 달리 이를 확인할 객관적 자료는 제출하지 않았다.

포함되는 잔류 용매의 농도(표 2), 및 각 결정의 제조에 있어서의 불순물의 제거 효과(표 3)에 있어서 모두 현저히 향상된 효과를 갖는 것으로서, 선행발명의 화합물에 비해 의약품 원말(原末)로서 고품질이며, 또한 공업적으로 취급하기 용이한 형태임이 분명하다."라고 기재되어 있다. 위 의견서의 기재는 결국 이 사건 출원발명의 화합물 A의 'Ⅲ형 결정'이 선행발명의 화합물 A의 'Ⅲ형 결정'에 비해 현저히 향상된 효과를 가진다는 것을 뜻하게 되어 그 자체로 모순이다.

나아가 선행발명의 실시예 84에 기재된 화합물 A의 제조방법을 살펴보면, 반응액을 물로 희석하고, 디에틸에테르로 추출하고, 무수 황산마그네슘으로 건조한 후, 감압하에 용매를 증류 제거하고, 잔류물을 실리카 겔의 컬럼 크로마토그래피로 정제하는 총 5단계의 과정을 거치고 있음을 알 수 있는데, 목적으로 하는 화합물인 화합물 A을 최종적으로 수득하는 과정에서 용매를 증류 제거한 후 잔류물을 실리카 겔의 컬럼크로마토그래피로 정제하였을 뿐, 결정화 과정을 거쳤거나 결정을 제조하였다는 기재가 없으므로(이에 대해서는 원고도 다투지 아니한다), 선행발명의 실시예 84의 방법에 의해 합성된 화합물 A가 Ⅲ형 결정인지도 명확하지 않다.

위와 같은 사정을 종합하면, 선행발명의 화합물 A가 Ⅲ형 결정인 것을 전제로 한 원고의 위 주장은 나아가 살필 필요 없이 받아들일 수 없다.

③ 원고는 또한 이 사건 제1항 발명이 큰 입자 직경을 가짐으로써 여과성, 건조성이 우수하여 제조 시간이 단축되는 효과 및 의약품 제조시 원약의 비산이 억제되어 고도의 안전성이 확보되는 효과가 있다고 주장하나, 이 사건 출원발명의 명세서에 위와 같은 효과가 있음이 기재되어 있지 않고, 위 효과가 현저한지 여부를 확인할 수 있는 어떠한 정량적 기재도 없다. 원고의 위와 같은 주장은 받아들일 수 없다.

#### 라) 잔류 용매의 농도에 대한 효과

이 사건 출원발명 명세서에는, 화합물 A의 I형, II형, III형 결정의 결정 중에 포함되는 잔류 용매 농도를 확인한 실험 결과에 관하여 "본 발명 I형 결정은, 결정 중에 포함되는 잔류 용매가 다른 본 발명 II형 결정, 본 발명 III형 결정과 비교하여 가장 적다."라고 기재되어 있기는 하다(식별번호 [0135]). 그러나 한편 위 명세서에는 "어느 본 발명 결정에서도, 그 결정 중에 높은 레벨의 잔류 용매를 포함하지는 않"다는 기재 또한 존재하는 점(식별번호 [0135]), 앞서 본 바와 같이 선행발명의 화합물 A가 III형 결정인지 여부가 명확하지 아니한 점에 비추어 볼 때, 위와 같은 기재만 가지고는 이 사건 출원발명의 명세서에 위와 같은 잔류 용매의 농도에 대한 효과가 있음이 명확히 기재되었다거나 화합물 A의 I형 결정이 선행발명의 III형 결정에 비하여 잔류 용매의 농도에 있어 양적으로 현저한 효과를 가진다고 볼 수 없다.

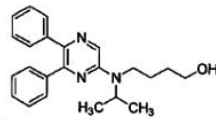
#### 마) 재결정 공정에서의 불순물 제거에 대한 효과

① 이 사건 출원발명의 명세서에는 화합물 A의 I형, II형, III형 결정의 재결정 공정에서의 불순물 제거율을 HPLC 장치로 확인한 결과가 기재되어 있는데, 이로부터 화합물 A의 I형 결정(순도: 99.51%, 불순물 제거율: 75%)은 다른 II형 결정(순도: 99.33%, 불순물 제거율: 66%), III형 결정(순도: 98.97%, 불순물 제거율: 47%)과 비교하여 재결정 공정에서의 불순물 제거율이 가장 높다는 점을 알 수 있다. 그러나 결정다형 관련 문헌(을 제1호증)<sup>4)</sup>에 따르면, 결정화 방법은 고순도의 의약 물질을 얻기 위한 가장 일반적인 방법임을 알 수 있는 점, I형 결정의 불순물 제거율은 75%로 II형 결정의 불순물 제거율에 비해 11% 더 높은 정도에 불과하고, I형 결정의 순도(99.51%)를

4) 을 제1호증 제12면 제34-35행: 의약 물질 전구체에 대해서도 결정화는 일반적으로 화학적으로 순수한 화합물을 얻는 단연 가장 효율적이고도 경제적인 방법이다.

II형 결정의 순도(99.33%)와 대비하여 보면 그 차이는 0.18% 정도인 점에 비추어 볼 때, 위와 같은 사정만으로는 화합물 A의 I형 결정이 갖는 높은 불순물 제거율에 관한 효과가 다른 결정형에 비하여 양적으로 현저한 수준에 이르는 것이라고 추론하기에 부족하다.

② 원고는, 원약 중에 어떠한 특정 불순물 화합물이 0.15% 이상으로 포함되어 있는 경우 그 화합물은 안전성 확인이 필요한데, 실험성적증명서(갑 제16호증)에 따르면,



I형 결정은 불순물인 화합물 a( )를 0.11%만 포함하므로 화합물 a를 0.46%나 포함하는 III형 결정과 달리 안전성 기준에 부합한다고 주장한다. 살피건대, 결정화 방법은 고순도의 의약 물질을 얻기 위한 가장 일반적으로 사용되는 방법인 점, I형 결정에 있어서의 불순물의 비율은 0.49%인데, 여기서 화합물 a의 불순물의 비율인 0.11%를 제외한 나머지 불순물의 비율인 0.38%에 특정 불순물이 0.15% 이상 포함될 가능성도 있는 점(갑 제16호증)을 고려하면, 그러한 사실만으로 화합물 A의 I형 결정이 갖는 재결정 공정에서의 높은 불순물 제거에 대한 효과가 다른 결정형에 비하여 양적으로 현저한 수준에 이르는 것이라고 추론하기에 부족하고 달리 이를 인정할 증거가 없다. 원고의 위 주장은 받아들일 수 없다.

바) 원고의 그 밖의 주장에 대한 판단

(1) 원고는, 이 사건 출원발명 명세서 식별번호 [0009]의 "항상 일정한 작용 효과"는 '안정성'을 의미한다는 것이 제약업계의 기술상식에 비추어 자명하므로, 이 사건 출원발명의 명세서에는 안정성에 대한 효과가 명확히 기재된 것이고, 비교실험자료(갑 제 17호증)에 따르면 일반적으로 입자 직경이 작을수록 안정성이 나빠진다고 알려져 있음

에도 불구하고, 화합물 A의 I형 결정은 입자 직경이 III형 결정보다 큰 경우(샘플 4)는 물론이고, III형 결정보다 작은 경우(샘플 3)라도 화합물 A의 가수분해물(MRE-269)을 생성하는 비율이 III형 결정(샘플 1)보다 낮았는데, 이처럼 화합물 A의 I형 결정의 안정성은 선행발명에 해당하는 III형 결정과 비교해 볼 때 양적으로 현저한 차이가 있는 효과라는 취지의 주장을 한다.

앞서 보았듯이 결정형 발명은 선행발명에 공지된 화합물이 갖는 효과와 질적으로 다른 효과를 갖고 있거나 질적인 차이가 없더라도 양적으로 현저한 차이가 있는 경우에 한하여 그 진보성이 부정되지 아니하고, 이때 결정형 발명의 상세한 설명에는 위와 같은 효과가 있음이 명확히 기재되어 있어야만 진보성 판단에 고려될 수 있다. 이 사건 출원발명의 명세서 '과제의 해결수단' 단락의 식별번호 [0009]에 제시된 '항상 일정한 작용 효과를 기대할 수 있는 고품질의 것'은 해당 기술분야에서 의약품 원말로서 기본적으로 가져야 할 요구사항에 관한 것으로 보일 뿐, 이 사건 출원발명의 '화합물 A의 I형 결정이 가지는 안정성에 관한 효과'를 명확히 기재한 것으로 보기 어렵다. 설명 이와 달리 보더라도 앞서 본 바와 같이 선행발명의 화합물 A가 III형 결정이라고 단정할 수 없다. 나아가 아래에서 보는 바와 같이 비교실험자료(갑 제17호증)의 습도가촉시험(표 4)에서 2주의 보존 조건에서 샘플 1(III형)과 샘플 3(I형)의 MRE-269 증가량은 각각 0.93%, 0.84%로 유사하고, 1개월의 보존 조건에서는 샘플 2(II형)와 샘플 4(I형)의 MRE-269 증가량이 각각 1.12%, 0.92%로 유사하다.

갑 제17호증 표 1, 4, 5

표 1 시험 샘플 중의 화합물 A의 결정형(화합물 A의 정제 200 $\mu$ g)

샘플 번호	화합물 A의 결정형	결정의 메디안 직경
1	III형	4.5 $\mu\text{m}$
2	II형	5.0 $\mu\text{m}$
3	I형	3.1 $\mu\text{m}$
4		6.7 $\mu\text{m}$
5		6.3 $\mu\text{m}$

도 1에 MRE-269<sup>5)</sup>의 증가량의 변화를 나타낸다. 도 2에 MRE-269 이외의 유연물질의 증가량의 변화를 나타낸다. **일반적으로 입자 직경이 작을수록 안정성이 나빠진다고 말해진다. 그러나, I형 결정은, 입자 직경이 II형 결정, III형 결정보다 작은 경우라도, MRE-269를 생성하는 비율이 낮았다.** 또한 III형 결정에서는, I형 결정과 비교하여, MRE-269 이외의 유연물질의 생성이 인지되었다.

즉, 화합물 A의 안정성에 대해서, **I형 결정은 III형 결정보다 우수했다.**

따라서, 화합물 A의 I형 결정은 물리화학적으로 뛰어나며, 명세서에 기재한 항상 일정한 작용 효과를 나타낸다(한국특허출원 제10-2012-7000526호 명세서의 단락 [0009], 국제공개 공보 WO2010/150865 A1 명세서의 단락 [0005]).

표 4 습도 가속시험 후 MRE-269의 증가량

분해물	보존 조건	샘플 1 (III형, 4.5 $\mu\text{m}$ )	샘플 2 (II형, 5.0 $\mu\text{m}$ )	샘플 3 (I형, 3.1 $\mu\text{m}$ )	샘플 4 (I형, 6.7 $\mu\text{m}$ )
MRE-269	초기	0.24%	0.06%	0.35%	0.18%
	2주간	0.93% (+0.69%)*	0.52% (+0.46%)*	0.84% (+0.49%)*	0.50% (+0.32%)*
	1개월	1.73% (+1.49%)*	1.12% (+1.06%)*	1.39% (+1.04%)*	0.92% (+0.74%)*

\*괄호 안은 초기값으로부터의 증가량

표 5 열 가속시험 후 MRE-269 이외의 유연물질 총량의 증가량

5) 화합물 A의 가수분해물이다.

샘플 번호	결정형	결정의 메디안 직경	MRE-269 이외의 유연물질 총량의 증가량 (%)					
			60℃ 밀봉			80℃ 밀봉		
			초기	2 주간	1 개월	초기	2 주간	1 개월
1	III 형	4.5 μm	0	1.17	1.59	0	3.67	4.79
2	II 형	5.0 μm	0	0.76	1.15	0	2.87	3.59
3	I 형	3.1 μm	0	0.75	0.91	0	2.90	3.67
4		6.7 μm	0	0.45	0.68	0	2.08	2.90
5		6.3 μm	0	0.49	0.76	0	2.07	2.69

따라서 원고 주장 사실만으로 화합물 A의 I형 결정이 갖는 안정성 효과가 다른 결정형에 비하여 양적으로 현저한 수준에 이르는 것이라고 추론하기에는 부족하고 달리 이를 인정할 증거가 없다. 원고의 위 주장은 어느 모로 보나 받아들일 수 없다.

(2) 원고는 또한 전 세계 모든 나라에서 화합물 A 제제는 I형 결정으로 허가를 받았는바, 이는 의약화합물로서 I형 결정의 우수성을 입증해 주는 것이라고 주장한다. 그러나 출원발명의 등록 가부는 우리 법에 따라 독립적으로 판단할 것이지 법제와 실무를 달리하는 외국의 상업화 사례에 구애받을 것이 아니므로, 이와 다른 전제에 선 원고의 위 주장은 이를 받아들일 수 없다.

### 3) 검토 결과의 정리

이상의 검토결과를 종합하면, 이 사건 제1항 발명의 청구범위에 기재된 화합물 A의 I형 결정은 통상의 기술자가 선행발명으로부터 쉽게 도출할 수 있다.

#### 나. 이 사건 심결의 적법 여부

그렇다면, 이 사건 제1항 발명뿐만 아니라 위 화합물 A의 I형 결정을 유효성분으로 삼은 이 사건 제4항 발명도 통상의 기술자가 선행발명으로부터 쉽게 발명할 수 있는 것으로서 그 진보성이 부정된다고 보아야 한다.

그런데 하나의 특허출원에 여러 개의 청구항이 있는 경우 그 중 어느 하나의 항에서라도 거절이유가 있는 때에는 그 출원 전부가 거절되어야 하므로(대법원 2001. 12. 24. 선고 99후2181 판결 등 참조), 이 사건 제1항 및 제4항 발명의 진보성이 부정되어 특허를 받을 수 없는 이상, 이 사건 출원발명의 나머지 청구범위에 대하여 나아가 살필 필요 없이 이 사건 출원발명은 그 전부가 특허를 받을 수 없다. 따라서 이 사건 거절결정은 정당하고, 이와 결론을 같이하여 이 사건 거절결정을 유지한 이 사건 심결은 적법하다.

#### 4. 결론

그렇다면, 이 사건 심결의 취소를 구하는 원고의 청구는 이유 없어 이를 기각하기로 한다.

재판장            판사            윤성식

                  판사            권순민

                  판사            정택수