

# 개량신약기술 I



5T국제특허법률사무소  
이 처 영 박사

## I. 개량신약기술의 개요

개량신약이라는 용어는 1980년대부터 제약업계에서 흔히 사용되고 있으나 아직 완전한 정의가 내려진 상태는 아니다. 일반적으로 기존 의약품이 구조변경 또는 제형변경 등의 개량과정을 거치거나, 2가지 이상의 의약품을 함께 제형화하여 병용 투여함으로써 약효가 되는 신약, 또는 적용 질환이 변경·확대되어 새롭게 허가·등록할 수 있는 신개념 신약을 의미한다. 개량신약은 크게 기존 약물을 개량한 방법에 따라 물리화학적 방법에 의한 구조변경 개량신약, 제제학적 방법에 의한 제제변경 개량신약 및 복합제제 개량신약 등으로 분류된다.

구조변경 개량신약은 활성물질의 골격을 그대로 유지한 채 물리/화학적인 반응이나 분리 등의 단계를 거쳐서 활성물질의 물성을 개선시켜 약물로서의 활용도를 증대시키거나, 활성이 높은 물질만을 선별적으로 분리하여 활성은 높이고, 부작용은 최소화한 개량신약을 통칭하며 신규염 및 신규용매화물, 광학이성질체, 다형성약물(Polymorphism), 전구약물(Prodrug) 등 크게 4가지로 구분된다. 또한, 제제변경 개량신약은 흡수개선, 투여경로변경, 방출제어 기술 등으로 세분화되며, 제제변경 개량신약 개발은 대부분 약물전달체계(Drug Delivery System, 이하 DDS) 개발을 통하여 이루어지므로 DDS 기술 개발이 성공여부를 좌우한다. 복합제제 개량신약은 두가지 이상의 단일성분을 하나의 제형으로 개발하여 복용을 편리하게 할 뿐만 아니라 각각의 단일 성분들의 함유량을 줄일 수 있는 여지가 매우 많다. 또한 복합제제 개량 신약은 부작용을 최소화하는 반면에 치료효과는 극대화할 수 있는 장점을 가지고 있어 많은 제약 업체들이 관심을 가지고 개발에 박차를 가하고 있다.

개량신약을 크게 “고지혈증치료제”, “당뇨병 치료제”, “바이오 의약품”, “우울증 치료제”, “신경안정제”, 항알러지제”, 고혈압치료제” 7가지로 대분류로 나누어 기술분류체계를 구성하였으며, 12가지 약품으로 중분류를 선정하였다. 하기 표 1과 같이 기술분류체계를 분류하여 각 분류별 특허 동향을 면밀히 분석하였다.

## II. 개량신약 기술발전 추이

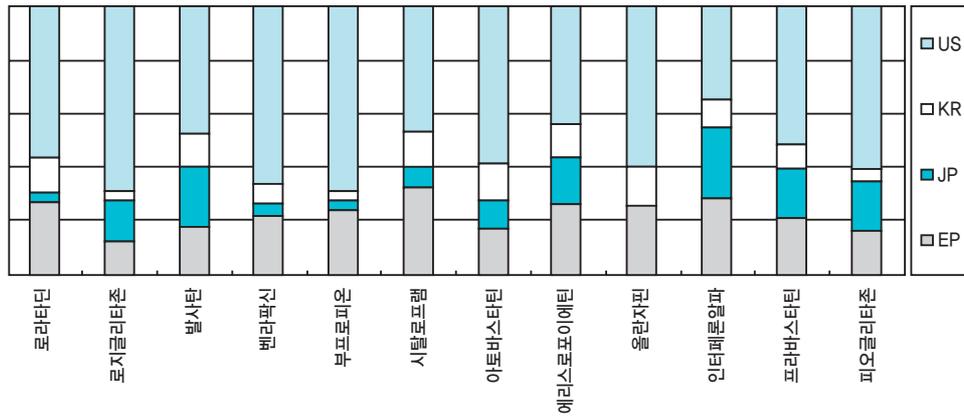
개량신약기술에 대한 특허 동향은 한국, 미국, 일본의 공개된 특허를 중심으로 분석하였으며, 일부 과제에 한해서는 유럽과 PCT의 공개특허를 기준으로 하였다. 분석 범위는

〈표 1〉 개량신약기술이 기술분류체계

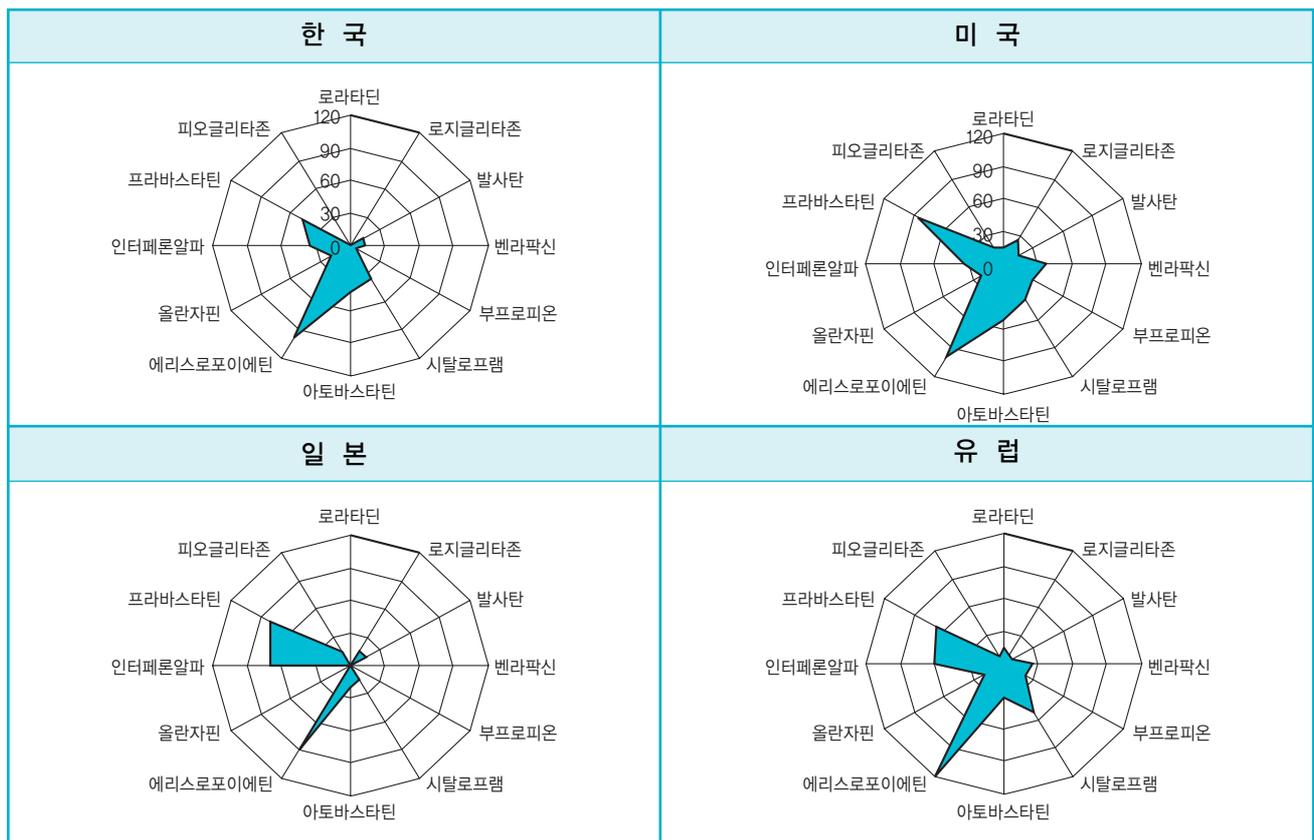
대 분류	중 분류	소 분류
고지혈증 치료제	아토바스타틴 개량기술	원천기술-신물질, 구조변경-광학이성질체, 구조변경-염류, 구조변경-Prodrug, 구조변경-polymorphism, 제형변경-안정화 등, 투여경로, 흡수촉진-가용화 등, 제어방출-지속화 등, 복합제제, 프로세스/제법/중간체, 신규용도
	프라바스타틴 개량기술	원천기술-신물질, 구조변경-광학이성질체, 구조변경-염류, 구조변경-Prodrug, 구조변경-polymorphism, 제형변경-안정화 등, 투여경로, 흡수촉진-가용화 등, 제어방출-지속화 등, 복합제제, 프로세스/제법/중간체, 신규용도
당뇨병치료제	로지글리타존 개량기술	원천기술-신물질, 구조변경-광학이성질체, 구조변경-염류, 구조변경-Prodrug, 구조변경-polymorphism, 제형변경-안정화 등, 투여경로, 흡수촉진-가용화 등, 제어방출-지속화 등, 복합제제, 프로세스/제법/중간체, 신규용도
	피오글리타존 개량기술	원천기술-신물질, 구조변경-광학이성질체, 구조변경-염류, 구조변경-Prodrug, 구조변경-polymorphism, 제형변경-안정화 등, 투여경로, 흡수촉진-가용화 등, 제어방출-지속화 등, 복합제제, 프로세스/제법/중간체, 신규용도
바이오 의약품	인터페론알파 개량기술	원천기술-신물질, 구조변경-유도체(아미노산변경), 구조변경-Prodrug(아미노산변경), 구조변경-Fusion Tech., 제형변경(연질 캡슐, 액체 등)
	에리스로포이에틴 개량기술	원천기술-신물질, 구조변경-유도체(아미노산변경), 구조변경-Prodrug(아미노산변경), 구조변경-Fusion Tech., 제형변경(연질 캡슐, 액체 등)
우울증 치료제	부프로피온 개량기술	원천기술-신물질, 구조변경-광학이성질체, 구조변경-염류, 구조변경-Prodrug, 구조변경-polymorphism, 제형변경-안정화 등, 투여경로, 흡수촉진-가용화 등, 제어방출-지속화 등, 복합제제, 프로세스/제법/중간체, 신규용도
	시탈로프렘 개량기술	원천기술-신물질, 구조변경-광학이성질체, 구조변경-염류, 구조변경-Prodrug, 구조변경-polymorphism, 제형변경-안정화 등, 투여경로, 흡수촉진-가용화 등, 제어방출-지속화 등, 복합제제, 프로세스/제법/중간체, 신규용도
	벤라팍신 개량기술	원천기술-신물질, 구조변경-광학이성질체, 구조변경-염류, 구조변경-Prodrug, 구조변경-polymorphism, 제형변경-안정화 등, 투여경로, 흡수촉진-가용화 등, 제어방출-지속화 등, 복합제제, 프로세스/제법/중간체, 신규용도
신경안정제	올라자핀 개량기술	원천기술-신물질, 구조변경-광학이성질체, 구조변경-염류, 구조변경-Prodrug, 구조변경-polymorphism, 제형변경-안정화 등, 투여경로, 흡수촉진-가용화 등, 제어방출-지속화 등, 복합제제, 프로세스/제법/중간체, 신규용도
항알러지제	로라타딘 개량기술	원천기술-신물질, 구조변경-광학이성질체, 구조변경-염류, 구조변경-Prodrug, 구조변경-polymorphism, 제형변경-안정화 등, 투여경로, 흡수촉진-가용화 등, 제어방출-지속화 등, 복합제제, 프로세스/제법/중간체, 신규용도
고혈압치료제	발사탄 개량기술	원천기술-신물질, 구조변경-광학이성질체, 구조변경-염류, 구조변경-Prodrug, 구조변경-polymorphism, 제형변경-안정화 등, 투여경로, 흡수촉진-가용화 등, 제어방출-지속화 등, 복합제제, 프로세스/제법/중간체, 신규용도

1982년부터 2004년 사이에 출원된 건을 대상으로 하였다. 개량신약기술에 대한 약품별로 각국이 차지하는 특허출원 비중은 도 1과 도 2에 나타난 바와 같이, 전체 12개 약품에

대해 미국이 가장 많이 출원 하였으며, 유럽, 일본, 한국 순위 나타났다. 모든 국가에서 에리스로포이에틴과 프라바스타틴에 대한 특허출원이 가장 많았다. 미국은 벤라팍신과



〈그림 1〉 12개 대상 약품에 대한 각국의 특허출원동향



〈그림 2〉 국가별 / 약품별 특허출원 현황

로지글리타존에서 50% 이상의 높은 비율로 출원하였으며, 바이오 의약품인 인터페론 알파와 발사탄에 대한 특허출원은 절대건수는 많으나, 상대적으로 작은 비중을 차지하는 것으로 나타났다. 또한 유럽의 경우에는 인터페론 알파와 발사탄 등에서 특허 출원비중이 20% 이상인 것으로 나타났다. 일본은 인터페론 알파와 발사탄의 특허출원비중이 20% 이상인 것으로 나타났으며, 상대적으로 로라타딘과 부프로피온에서 매우 낮은 비중을 차지하고 있는 것으로 분석된다. 우리나라는 전반적으로 대부분의 약품에서 10% 내외의

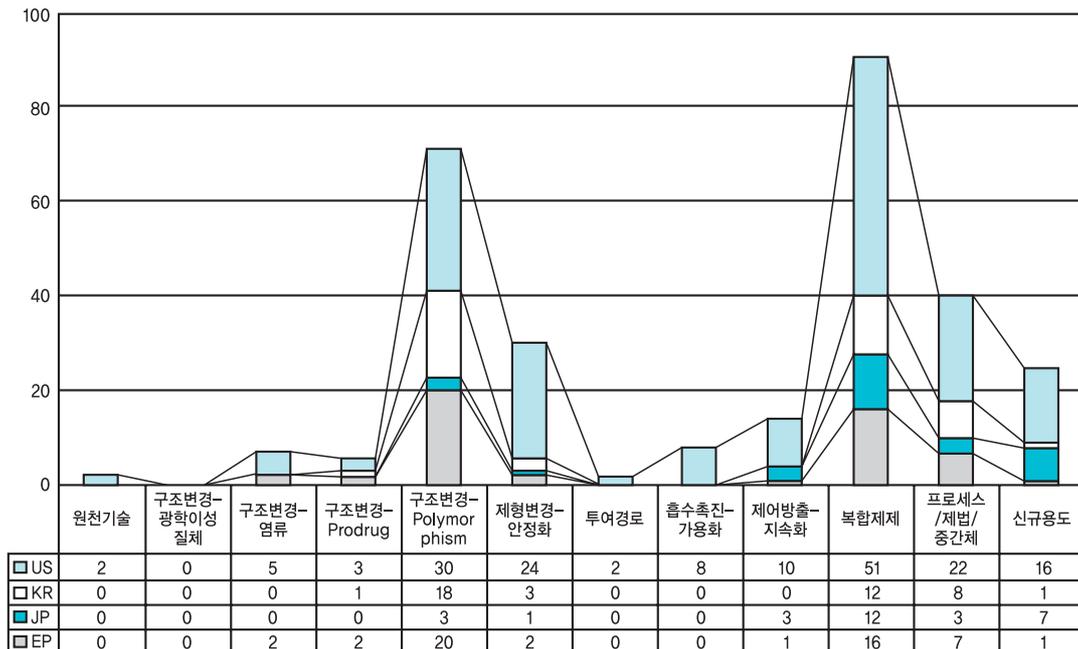
특허출원비중을 차지하고 있으며, 특히 로지글리타존과 부프로피온에 대한 비중이 낮은 것으로 나타났다.

### 1. 약품별 기술개발 추이

#### (1) 고지혈증 치료제-아토바스타틴

아토바스타틴의 관련 특허는 1990년대 초반부터 출원되기 시작하였으며, 90년대 중반부터 특허출원이 활발하게 진행되며 지속적인 상승세가 유지되고 있다. 원천특허를 확보하고 있고, 아토바스타틴 칼슘염을 유효성분으로 한 리피토를 판매하고 있는 미국 제약회사 Pfizer는 한국, 미국, 일본 및 유럽에서의 특허 출원 건수가 각각 17, 30, 7 및 28건으로 자국인 미국뿐만 아니라 타국에도 많은 특허를 출원하면서 관련제품의 특허권 보호와 권리연장에 주력하고 있는 것으로 분석된다. Pfizer가 가장 많은 특허를 출원한 분야는 복합제제(37건)와 구조변경-Polymorphism(23건)로 나타났다(그림 3). 아토바스타틴 개량기술 개발기업 가운데 슬로베니아의 Lek Pharmaceutica & Chemical과 이스라엘

개량신약기술에 대한 약품별로  
각국이 차지하는 특허출원 비중은  
전체 12개 약품에 대해 미국이  
가장 많이 출원 하였으며,  
유럽, 일본, 한국 순위로 나타났다.



〈그림 3〉 아토바스타틴 분야의 세부기술별 출원 점유도

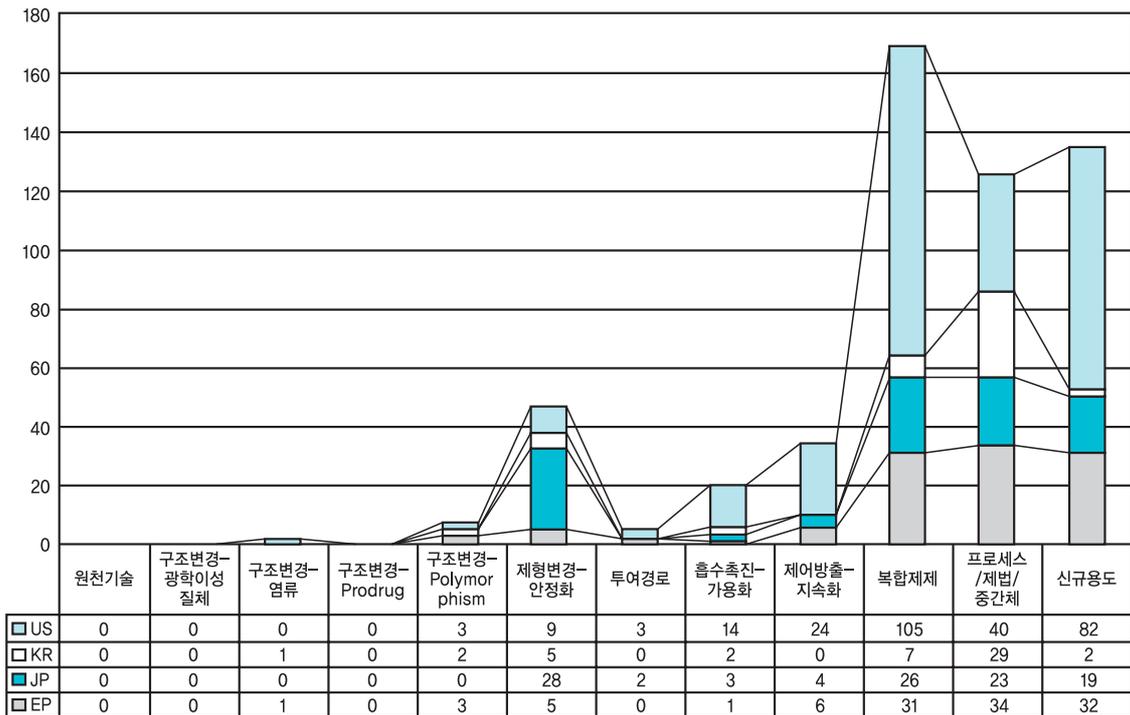
의 Teva Pharmaceutical, 일본의 Sankyo 등이 두각을 나타내고 있으며, 구조변경-Polymorphism, 제형변경-안정화 등, 프로세스/제법/중간체 관련 기술을 개발하기 위해 노력하고 있는 것으로 판단된다.

**(2) 고지혈증 치료제-프라바스타틴**

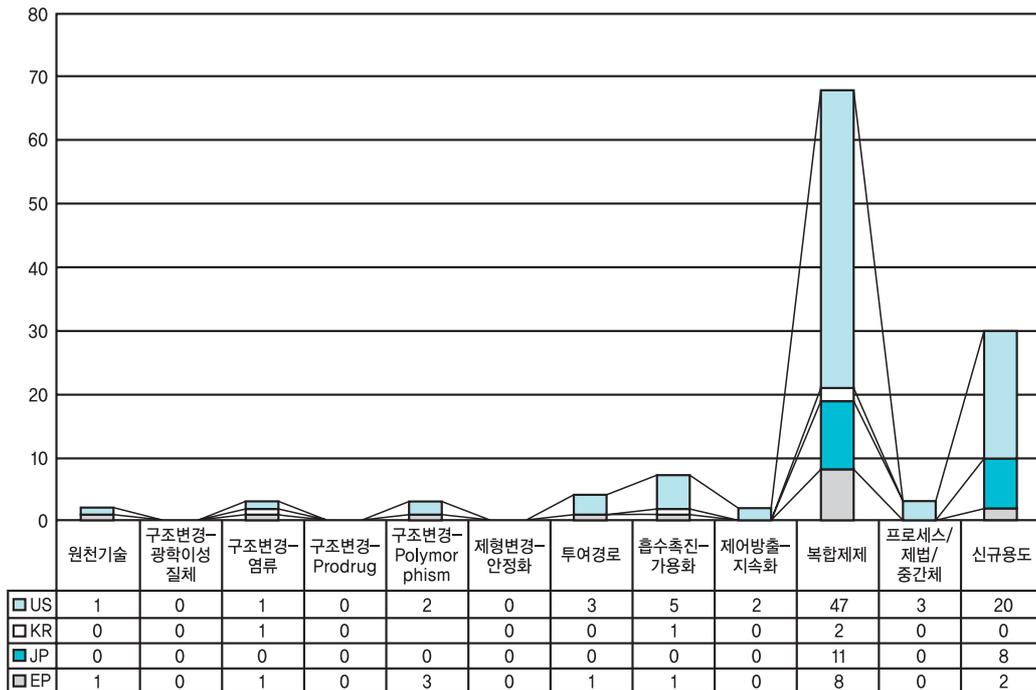
프라바스타틴 관련 특허는 1980년대 중반부터 출원되기 시작하였으며, 90년대 초반부터 특허출원이 활발하게 진행되면서 2000년대 초반부터 급격한 상승세를 보였다. 프라바스타틴의 원천특허를 확보하고 있는 Bristol-Myers Squibb가 102건으로 가장 많은 특허를 출원하였으며, 국가별로는 유럽 50건, 미국 39건, 일본 15건, 한국 8건으로 유럽과 미국에 상대적으로 많은 특허를 출원한 것으로 나타났다. Bristol-Myers Squibb가 가장 많은 특허를 출원한 기술분야는 복합제제와 신규용도 분야로 각각 50건 및 49건의 특허를 출원하면서 지난 2005년 9월 20일 만료된 물질 특허의 대안으로 프라바스타틴을 이용한 복합제제 개발과

프라바스타틴의 원천특허를 확보하고 있는 Bristol-Myers Squibb가 102건으로 가장 많은 특허를 출원하였으며, 특허를 출원한 기술분야는 복합제제와 신규용도 분야로 각각 50건 및 49건의 특허를 출원하였다.

신규용도를 찾는 데 주력하고 있는 것으로 판단된다(그림 4). 프라바스타틴 개량기술 개발은 미국과 유럽에 15건씩의 특허를 출원한 Sankyo가 활발하게 진행하고 있는 것으로 나타났으며, 국내기업 가운데 코바이오텍과 영진약품도 각각 13건 및 12건의 특허를 출원하여 국내 시장 개척을 위해 노력하고 있는 것으로 분석된다.



〈그림 4〉 프라바스타틴 분야의 세부기술별 출원 점유도



〈그림 5〉 로지글리타존 분야의 세부기술별 출원 점유도

**(3) 당뇨병 치료제-로지글리타존**

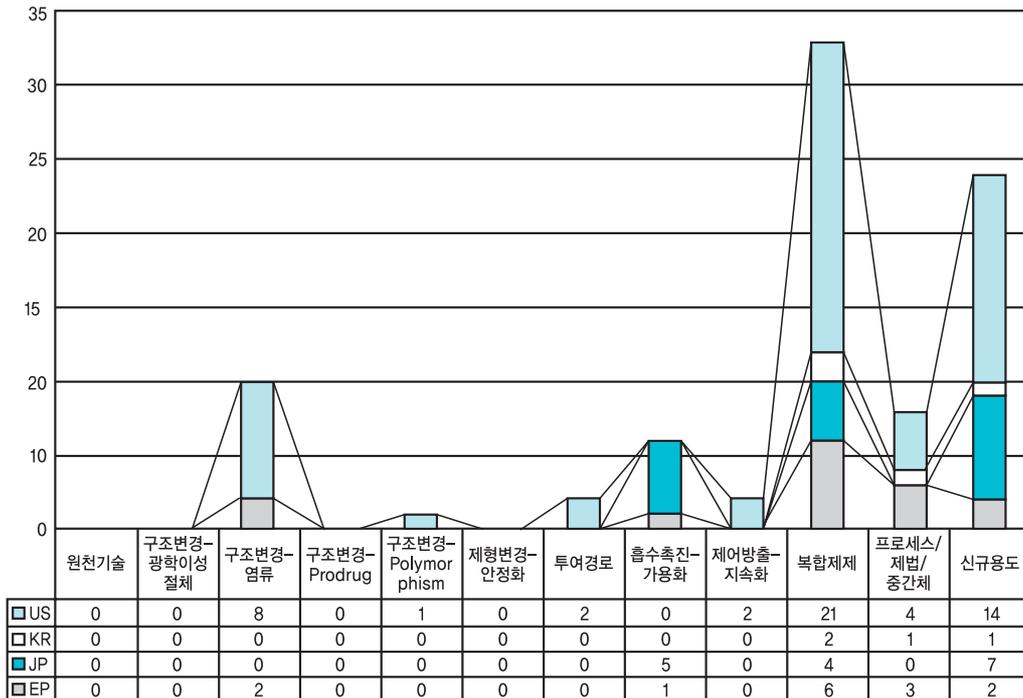
로지글리타존 관련특허는 1980년대 말부터 출원되기 시작하였으며, 90년대 말부터는 특허출원이 급증하면서 2002년도에 가장 많이 출원되었다. 원천특허를 확보하고 있는 Glasxo Smith Kline의 특허출원건수는 12건으로 일본의 Sankyo(13건)보다 적은 것으로 나타났지만, Sankyo의 특허출원은 일본에서 많이 이루어진 것으로 나타났다. Glasxo Smith Kline이 가장 많은 특허를 출원한 분야는 복합제제 분야로 나타났으며(그림 5), 이는 전체 로지글리타존 출원 동향과 유사하다. 후발업체인 Pfizer, Bristol-Myers Squibb, Takeda가 6~11건의 특허를 출원하여, 로지글리타존 관련 개량신약 기술을 개발하고 있는 것으로 나타났다.

**(4) 당뇨병 치료제-피오글리타존**

피오글리타존 관련 특허는 1980년대 중반부터 출원되면서 꾸준한 상승세를 보이다가 90년대 중반부터 급증하기 시작하였으며, 이후 2001년도에 감소가 잠시 있었으나 2002년 이후에 다시 증가세로 전환되었다. 피오글리타존

관련 개발기술 가운데 가장 활발하게 출원되고 있는 분야는 복합제제(39%)와 신규용도(28%) 분야이다(그림 6). 원천특허를 확보하고 있고, 피오글리타존 염화수소를 유효성분으로 한 ‘액토스’를 판매하고 있는 일본 제약회사 Takeda의 피오글리타존 관련 특허출원건수는 17건이었으며, 신규용도, 흡수촉진-가용화, 복합제제 관련 기술에 5~6건의 특허를 출원하였고, 특허활동지수도 10.56으로 매우 높게 나타났다. Takeda 이외에 피오글리타존 개량기술 개발기업

피오글리타존 염화수소를  
 유효성분으로 한 ‘액토스’를 판매하고 있는  
 일본 제약회사 Takeda의 특허출원건수는  
 17건이었으며, 신규용도, 흡수촉진-가용화,  
 복합제제 관련 기술에  
 5~6건의 특허를 출원하다.



〈그림 6〉 피오글리타존 분야의 세부기술별 출원 점유도

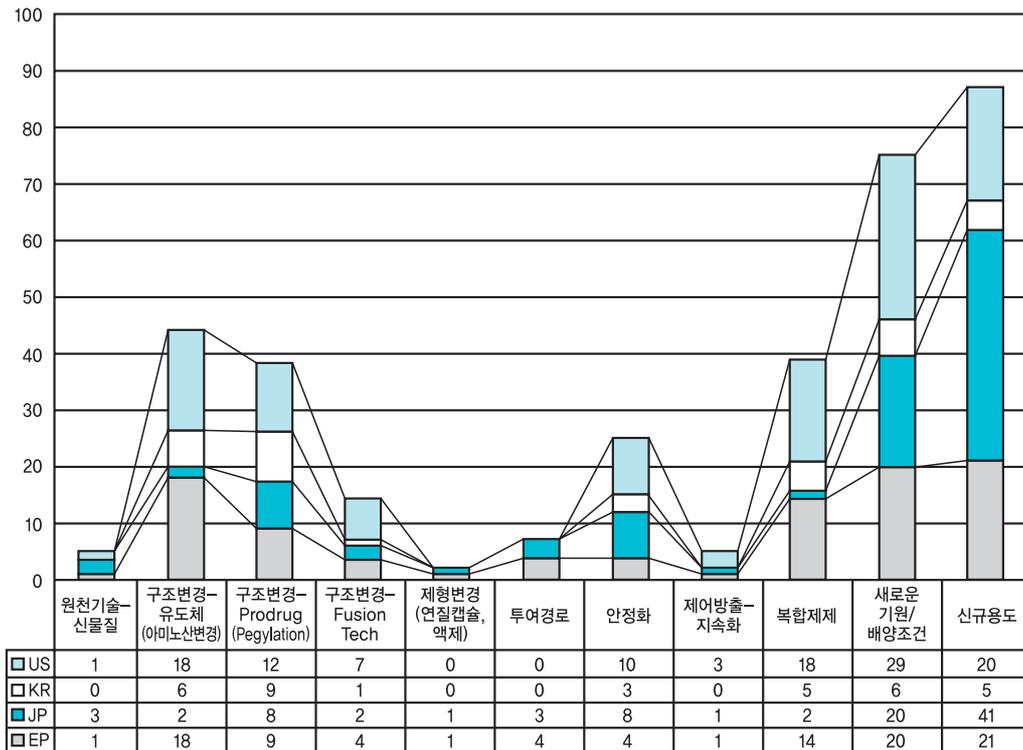
가운데 가장 두각을 나타내고 있는 기업은 Pfizer와 Sankyo로 각각 17건 및 12건의 특허를 출원하였으며, Takeda와 마찬가지로 복합제제와 신규용도 분야에 3~7건을 출원한 것으로 나타났고, Aeropharm Technology와 Bristol-Myers Squibb도 복합제제 분야에 3~4건의 특허를 출원한 것으로 나타났다.

**(5) 바이오 의약품-인터페론 알파**

인터페론 알파 관련 특허는 1980년대 초반에도 10여건 안팎의 출원되었으며, 90년대 초반에 잠시 감소세를 보이다가 이후부터 특허출원이 증가하면서 1999년과 2000년에 가장 많은 특허가 출원되었다. 인터페론은 알파 외에도 베타, 감마, 타우 등의 여러 가지 유도체들이 존재하고 있으므로 연구의 범위를 넓혀 인터페론에 관한 개량신약의 연구를 포괄적으로 수행될 것으로 예상된다. 인터페론 관련 개량기술 가운데 가장 활발하게 출원되고 있는 분야는 신규용도(87건, 27%), 새로운기원 / 배양조건 / 제법(75건, 22%), 구조변경-

바이오 의약품-인터페론은 알파 외에도 베타, 감마, 타우 등의 여러 가지 유도체들이 존재하므로 연구의 범위를 넓혀 인터페론 관련 개량신약의 연구가 포괄적으로 수행될 것으로 예상된다.

유도체(44건, 13%)로 전체 기술 중 66%를 차지하였다(그림 7). 이들 분야와 관련하여 Toray(신규용도, 8건), Green, Cross(새로운기원 / 배양조건 / 제법, 5건), Cetus Corporation(구조변경, 7건) 등이 많은 관심을 기울이고 있는 것으로 분석된다. 인터페론 알파를 유효성분으로 한 '인트론-A'를 판매하고 있는 Schering과 Schering-Plough는 62건의 특허를 출원하였으며, 그 중 복합제제(19건), 신규용



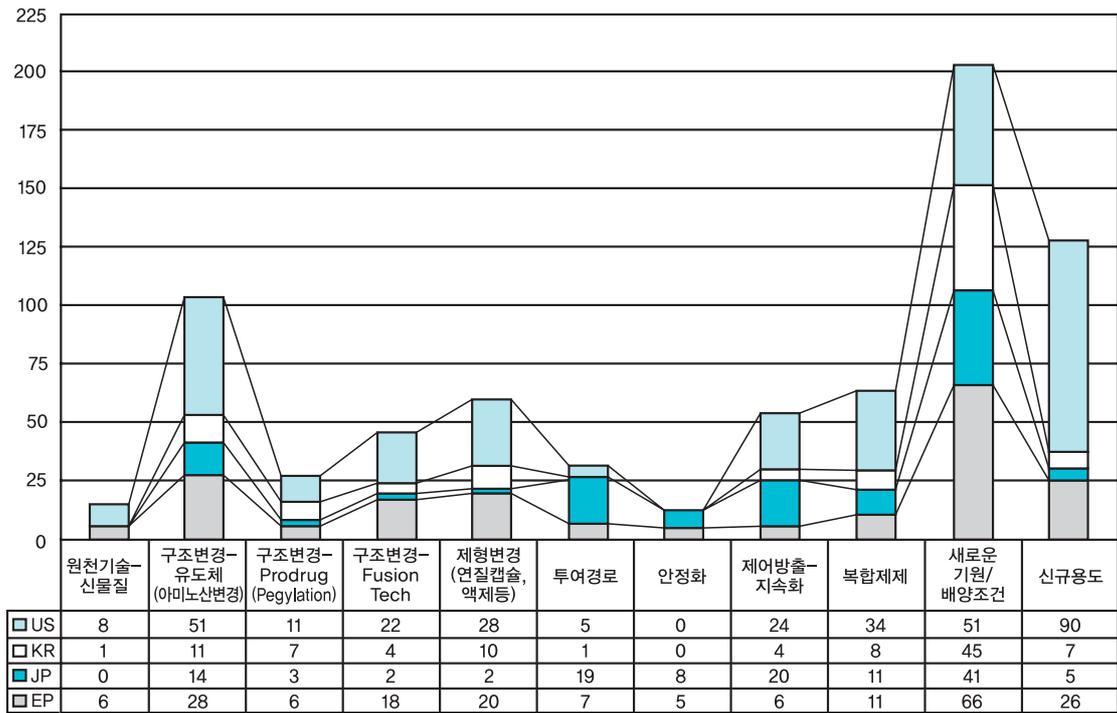
〈그림 7〉 인터페론알파 분야의 세부기술별 출원 점유도

도(15건), 구조변경-Prodrug(14건), 안정화(8건), 구조변경-유도체(3건)등에 치중하여 인터페론 알파 개량신약을 개발하고 있는 것으로 분석된다. Schering과 Schering-Plough 이외에 인터페론 알파 관련 개량기술 개발에 많은 관심을 두고 있는 후발 제약업체는 Roche, Toray, Boehringer Ingelheim, Novartis, Cetus Corporation, Green Cross 등으로 제형변경, 투여경로, 제어방출-지속화 분야를 제외한 다양한 분야의 기술을 개발하고 있는 것으로 나타났다.

**(6) 바이오 의약품-에리스로포이에틴**

에리스로포이에틴 관련 특허출원은 1990년대 초반까지 일정하였으나, 이후 가파른 증가세를 보였으며, 2000년대 초반에도 많은 특허가 출원되면서, 향후 활발한 기술 개발 추세에 따른 특허출원은 증가세가 지속될 것으로 예상된다. 에리스로포이에틴 관련 개량기술 가운데 가장 활발하게 특허 출원이 되고 있는 분야는 새로운기원/배양조건/제법

(203건, 27%), 신규용도(128건, 17%), 구조변경-유도체(104, 14%)로 전체 기술 중 58%를 차지하였다(그림 8). 이들 분야와 관련하여 Roche(새로운기원/배양조건/제법, 구조변경-유도체, 신규용도), Genetics Institute(구조변경-유도체) 등이 많은 관심을 기울이고 있는 것으로 분석된다. 에리스로포이에틴을 유효성분으로 한 '에포젠'을 판매하고 있는 Amgen은 22건의 특허를 출원하였으며, 신규용도(7건), 구조변경-유도체(6건) 등에 치중하였고, Kirin-Amgen은 새로운기원/배양조건/제법(11건), 구조변경-유도체(11건) 등에 많은 특허를 출원하면서 에리스로포이에틴 개량신약 개발을 시도하고 있는 것으로 분석된다. Amgen과 Kirin-Amgen 이외에 에리스로포이에틴 관련 개량기술 개발에 많은 관심을 두고 있는 후발 제약업체는 Roche, Chugai, Genetics Institute, CJ, Ortho-McNeil 등이며, 특히 Roche는 새로운기원/배양조건/제법(14건), 복합제제(11건), 구조변경-유도체(10건), 신규용도(8건) 등 에리스



〈그림 8〉 에리스로포이에틴 분야의 세부기술별 출원 점유도

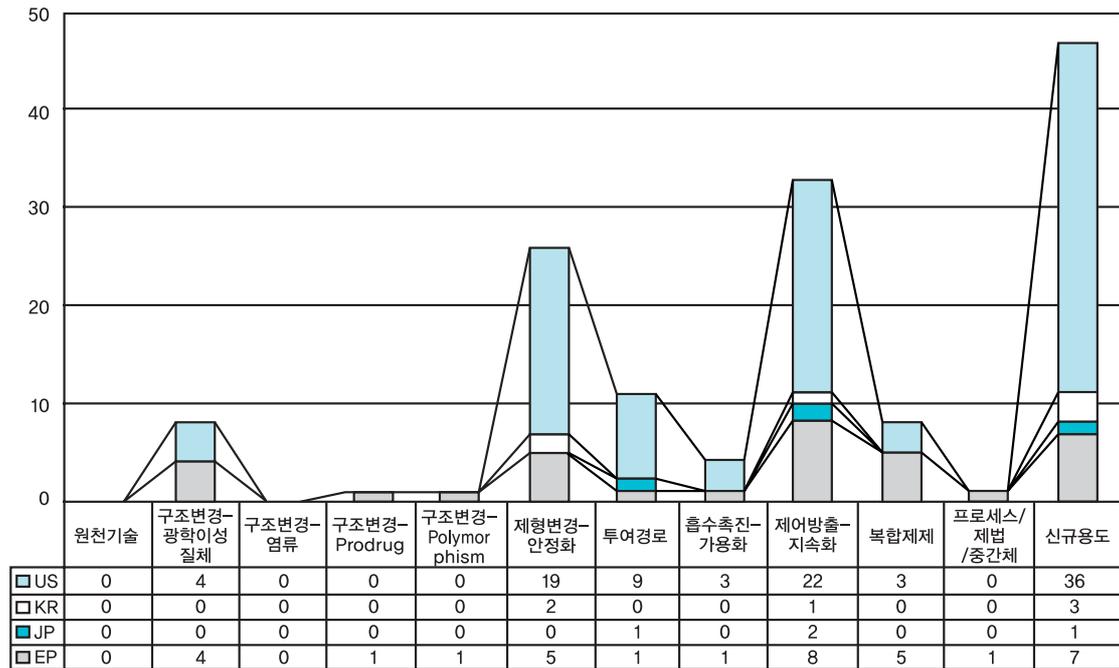
로포이에틴 관련 특허(61건)를 가장 많이 출원하였다.

(7) 우울증 치료제-부프로피온

부프로피온 관련특허는 1980년대 초반부터 출원되기 시작했으며, 90년대 초반까지는 특허출원건수가 미미하였으나, 90년대 중반부터 가파른 증가세를 보였고, 2002년도에 절정에 달했으며, 향후 특허 출원 증가 추세가 지속될 것으로 예상된다. 부프로피온 관련 개량기술 가운데 가장 활발하게 특허 출원이 되고 있는 분야는 신규용도(33%), 제어방출-지속화(23%), 제형변경-안정화(18%)로 전체 기술 중 74%를 차지하였다(그림 9), 이들 분야와 관련하여 Sepracor (신규용도), Glaxo Smith Kline(제형변경-안정화), Cary Medical Corporation (신규용도), American Home Products(제형변경-안정화) 등 많은 관심을 기울이고 있는 것으로 분석된다(그림 9). 원천특허를 확보하고 있고, 부프로피온 염화수소를 유효성분으로 한 '웰부트린'을 판매하고 있는 Glaxo Smith Kline은 13건의 특허를 출원하였으며,

Glaxo Smith Kline은  
부프로피온 염화수소를 유효성분으로 한  
'웰부트린'을 판매하고 있으며,  
14건의 특허를 출원하였다.  
그 중 '제형변경-안정화'와 '제어방출-지속화'  
관련 특허가 Glaxo Smith Kline이 중점적으로  
연구개발한 분야인 것으로 분석된다.

그 가운데 제형변경-안정화(7건)와 제어방출-지속화(4건) 관련 특허가 84%로 Glaxo Smith Kline이 중점적으로 연구개발한 분야인 것으로 분석된다. Glaxo Smith Kline 이외에 부프로피온 관련 개량기술 개발에 많은 관심을 두고 있는 기업으로는 Sepracor, Pfizer, Cary Medical Corporation, American Home Products 등이 있으며, 이 가운데 Sepracor는 전체 21건의 특허를 구조변경-이성질체(8건),



〈그림 9〉 부프로피온 분야의 세부기술별 출원 점유도

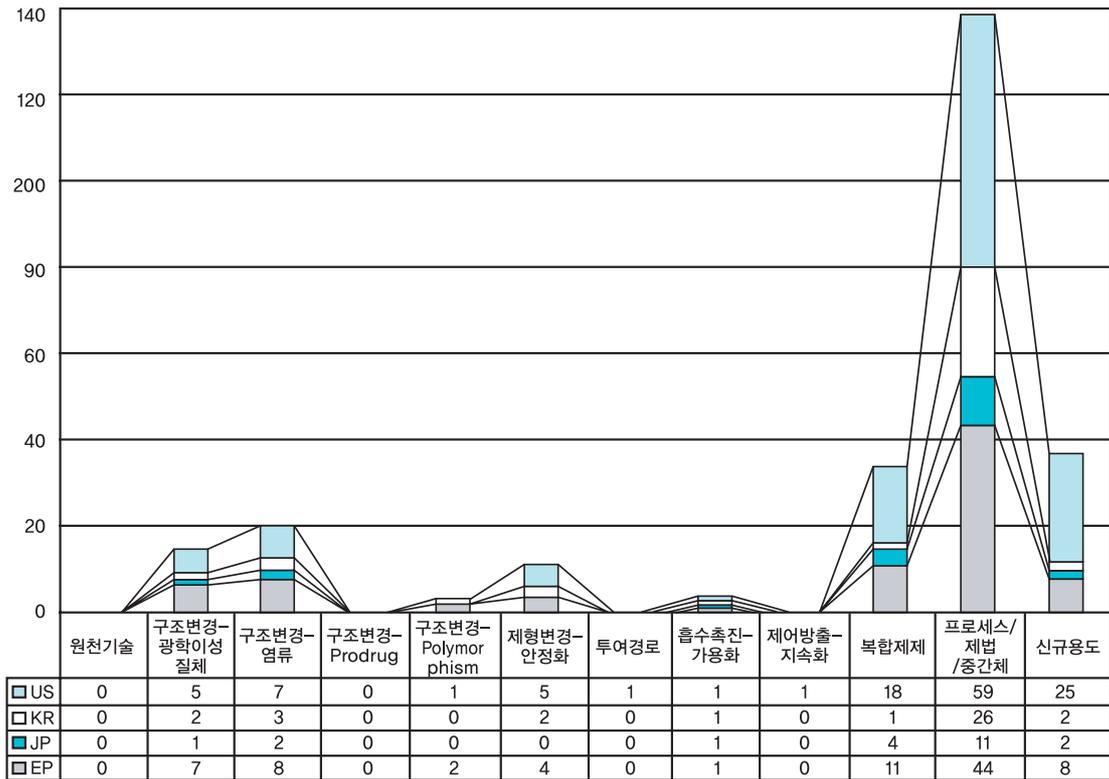
신규용도(13건)에만 출원하여 이들 분야기술을 집중적으로 개발하고 있는 것으로 분석된다.

**(8) 우울증 치료제-시탈로프람**

시탈로프람 관련 특허출원은 1990년대 초반까지도 부진하였으나, 그 이후부터 가파른 증가세를 보이며 2000년대부터는 급증세를 보이고 있다. 시탈로프람 관련 개량기술 가운데 가장 활발하게 출원되고 있는 분야는 프로세스/제법/중간체(52%), 복합제제(18%), 신규용도(14%)로 전체 기술중 84%를 차지하였다(그림 10). 이들 분야와 관련하여 Sumika(프로세스/제법/중간체), Eli Lilly(복합제제, 신규용도), Infosint(프로세스/제법/중간체) 등이 많은 관심을 기울이고 있는 것으로 분석된다. 시탈로프람을 개발한 덴마크 제약회사 Lundbeck은 118건의 특허를 출원하였으며, 프로세스/제법/중간체(75건) 관련 특허를 가장 많이 출원하였으나, 신규용도(12건), 구조변경-광학이성질체(11건), 구조변경-염류(9건), 제형변경-안정화(5건), 복합제제(6건) 등에도 많은 특허를 출원하면서 다양한 분야에 걸쳐

시탈로프람 개량 신약개발을 시도하고 있는 것으로 나타났다. Lundbeck 이외에 시탈로프람 관련 개량기술 개발에 많은 관심을 두고 있는 후발 제약업체는 Sumika, Eli Lilly, Infosint, Cephalon 등인 것으로 나타났으며, 프로세스/제법/중간체, 복합제제, 신규용도 분야에 집중하고 있는 것으로 분석된다.

시탈로프람 관련 개량기술 가운데 가장 활발하게 출원되고 있는 분야는 프로세스/제법/중간체, 복합제제, 신규용도로 전체 기술중 84%를 차지하였다. 이들 분야와 관련하여 Sumika, Eli Lilly, Infosint 등이 많은 관심을 기울이고 있는 것으로 분석된다.



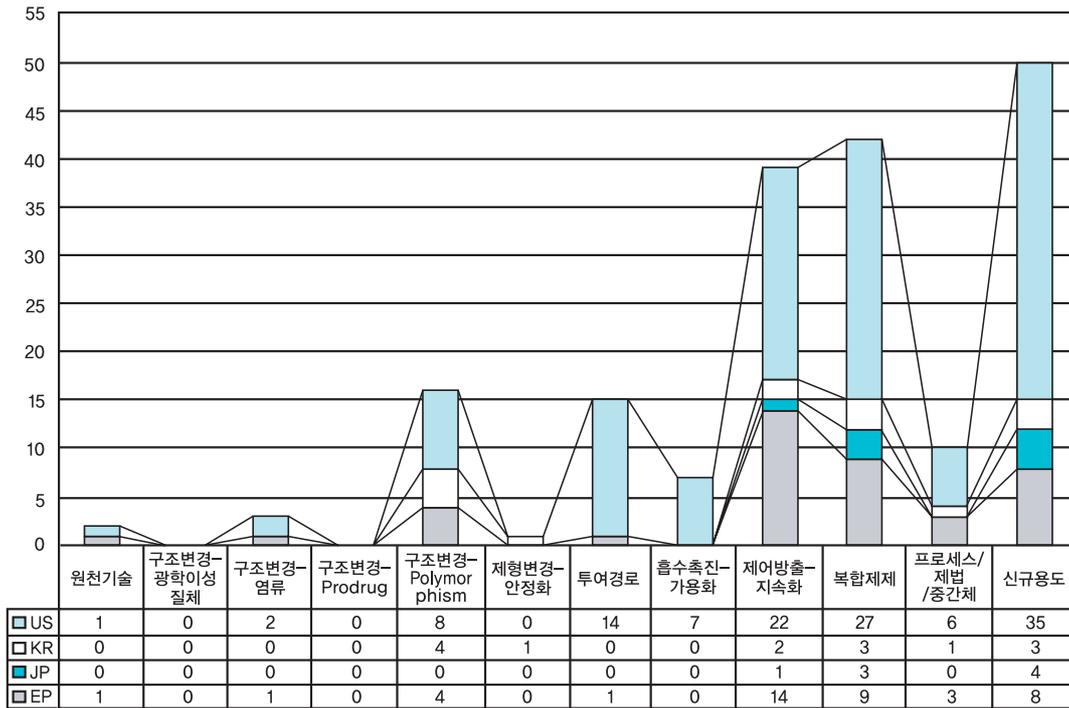
〈그림 10〉 시탈로프람 분야의 세부기술별 출원 점유도

(9) 우울증 치료제-벤라팍신

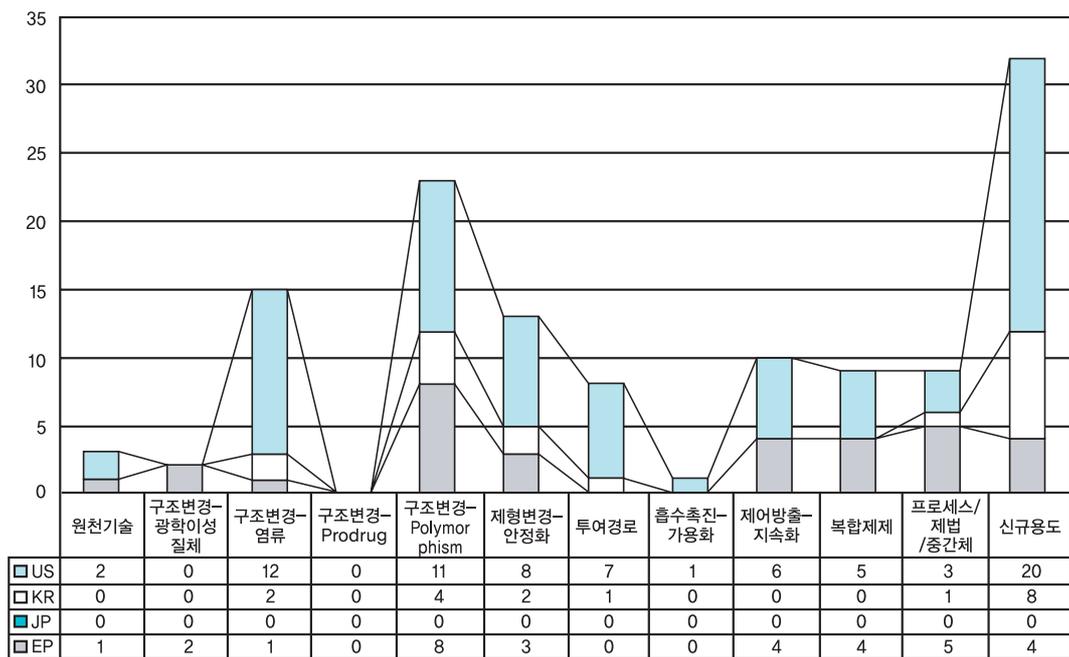
벤라팍신 관련 특허출원은 1983년 2건 이후 소강상태를 보이다가 94년부터 5건 이상의 특허가 출원되면서 상승 추세가 지속되다가 2000년부터 급증하고 있는 것으로 나타났다. 벤라팍신 관련 개량 기술 가운데 가장 활발하게 출원되고 있는 분야는 신규용도(26%), 복합제제(23%), 제어방출-지속화(21%)로 전체 기술 중 70%를 차지하였다(그림 11). 이들 분야와 관련하여 Eli Lilly(복합제제, 신규용도), American Home Products(제어방출-지속화, 신규용도) 등이 많은 관심을 기울이고 있는 것으로 분석된다. 원천특허를 확보하고 있고, 벤라팍신 염화수소를 유효성분으로 한 ‘이팍사’와 ‘이팍사 엑스알’을 판매하고 있는 Wyeth는 18건의 특허를 출원하였으며, 제어방출-지속화(7건, 신규용도(6건), 구조변경-Polymorphism(5건)에만 관련 특허를 출원하여, 이들 분야에 치중하여 벤라팍신 개

벤라팍신 관련 개량 기술 가운데 가장 활발하게 출원되고 있는 분야는 신규용도, 복합제제, 제어방출-지속화로 전체 기술 중 70%를 차지하였다.

량신약 개발을 시도하고 있는 것으로 분석된다. Wyeth 이외에 벤라팍신 관련 개량기술 개발에 많은 관심을 두고 있는 후발 제약업체는 Eli Lilly, American Home Products, Pfizer, Ostmotica 등인 것으로 나타났으며, 신규용도, 복합제제, 제어방출-지속화 분야에 집중하고 있는 것으로 분석된다.



〈그림 11〉 벤라팍신 분야의 세부기술별 출원 점유도



〈그림 12〉 올란자핀 분야의 세부기술별 출원 점유도

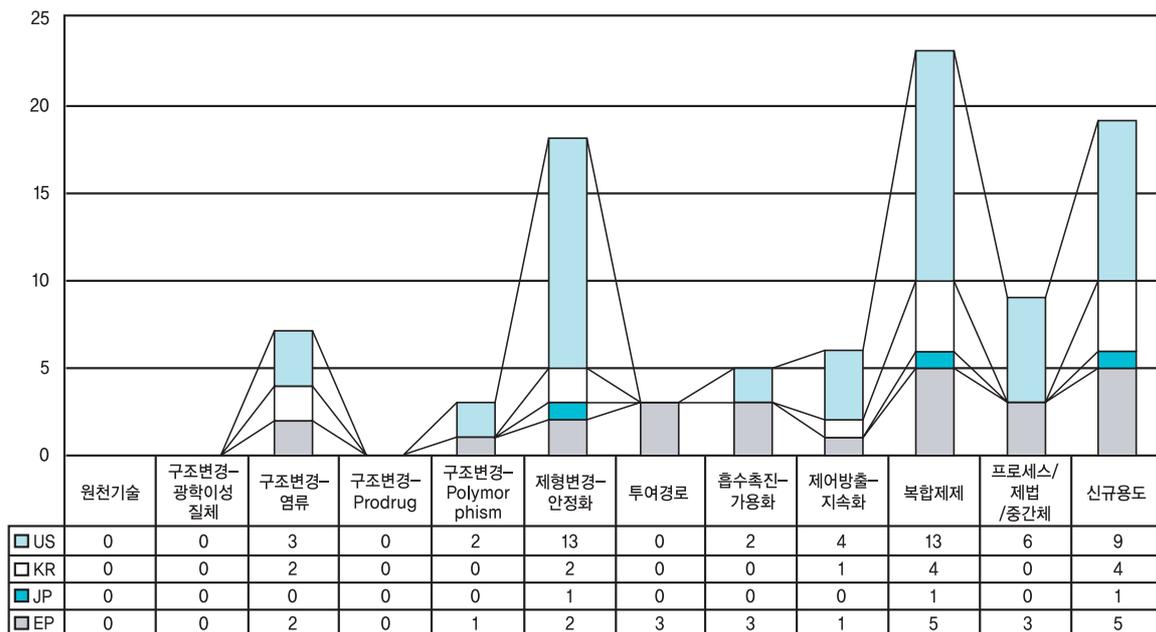
(10) 신경안정제-올란자핀

올란자핀 관련 특허는 1990년대 초반부터 출원되기 시작하였으며, 90년대 중반에 특허출원이 급증하였으나, 90년대 말부터 감소세를 보이다가 2001년부터 증가세로 나타났다. 올란자핀 관련 개량기술 가운데 가장 활발하게 출원되고 있는 분야는 신규용도(32건, 27%), 구조변경-Polymorphism(23건, 18%), 구조변경-염류(15건, 12%)로 전체 기술 중 57%를 차지하였다(그리 12). 이들 분야와 관련하여 Sepracor(구조변경-염류, 7건)가 많은 관심을 기울이고 있는 것으로 분석된다. 원천특허를 확보하고 있으며, 올란자핀을 유효성분으로 한 '자이프렉사'를 판매하고 있는 Eli Lilly는 69건의 특허를 출원하였으며, 신규용도(26건), 구조변경-Polymorphism(12건), 체형변경-안정화(7건), 프로세스/제법/중간체(7건) 외에도 구조변경-Prodrug과 흡수촉진-가용화 관련 기술을 제외한 전 분야에 특허를 출원하여, 광범위한 분야에서 올란자핀 개량신약을 개발하고 있는 것으로 나타났다. Eli Lilly 이외에 올란자핀 관련 개량기술 개발에 많은 관심을 두고 있는 후발 제약업체로는 Sepracor, Southern Biosystems, Cygnus,

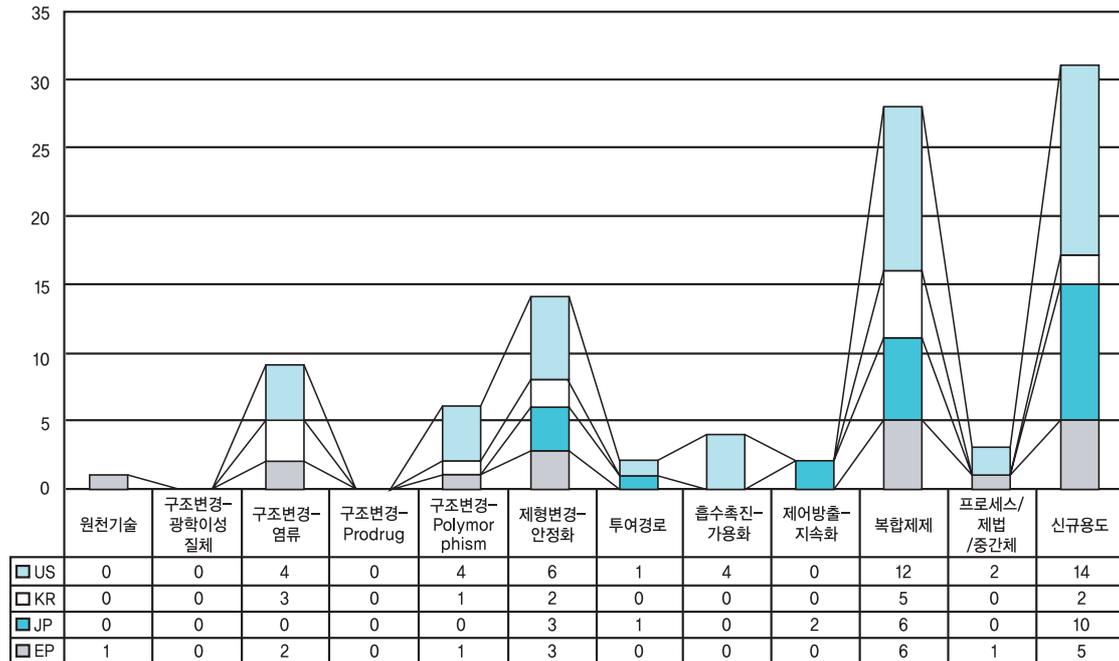
Alexa Molecular Delivery 등이 있지만, Eli Lilly와 비교하면 특허출원건수는 미미하다.

(11) 항알러지제-로라타딘

로라타딘 관련 특허출원은 1980년대 중반부터 시작되어 등락을 반복하다가 2000년 이후 10건 이상의 특허가 출원되면서 증가 추세로 나타났다. 로라타딘 관련 개량기술 가운데 가장 활발하게 출원되고 있는 분야는 복합제제(23건, 26%), 신규용도(19건, 20%), 체형변경-안정화(18건, 19%)로 전체 기술 중 65%를 차지하였다(그림 13). 이 분야와 관련하여 Sepracor(신규용도, 4건), Analgesic Associates(복합제제, 5건) 등이 많은 관심을 기울이고 있는 것으로 분석된다. 원천특허를 확보하고 있으며, 로라타딘을 유효성분으로 한 '클라리틴', '클라리틴 레디탭', '글라리틴-디', '클라리틴-디 24시간'을 판매하고 있는 Schering과 Schering-Plough가 35건의 특허를 출원하였으며, 복합제제(8건), 프로세스/제법/중간체(5건), 신규용도(5건) 관련 특허가 많았고, 구조변경-광학이성질체를 제외한 모든 분야에 1건 이상의 특허를 출원하여, 다양한 분야에서 로라



〈그림 13〉 로라타딘 분야의 세부기술별 출원 점유도



〈그림 14〉 발사탄 분야의 세부기술별 출원 점유도

타던 개량기술 개발이 이루어지고 있는 것으로 조사되었다. Scherign과 Schering-Plough 이외에 로라타딘 관련 개량 기술 개발에 많은 관심을 두고 있는 후발 제약업체는 Sepracor, Oramon Arzneimittel, Analgesic Associates, Ranbaxy, Pfizer, Merck, 유한양행 등인 것으로 나타났다.

**(12) 고혈압 치료제-발사탄**

발사탄 관련 특허출원은 1995년까지 부진하였으나, 이후 5건 안팎의 특허가 출원되면서 2001년부터는 급상승세를 보이고 있다. 발사탄 관련 개량기술 가운데 가장 활발하게 특허 출원이 되고 있는 분야는 신규용도(31%), 복합제제(28%), 제형변경-안정화(14%)로 전체 기술 중 73%를 차지하였다(그림 14). 이들 분야와 관련하여 Takeda가 신규용도 분야에 4건, 복합제제 분야에 3건의 특허를 출원하여 많은 관심을 기울이고 있는 것으로 분석된다. 원천특허를 확보하고 있고, 발사탄을 유효성분으로 한 '디오반'을 판매하고 있는 Novartis는 38건의 특허를 출원하였으며, 그 중 복합제제(11건), 신규용도(9건), 제형변경-안정화(9건), 구조변경-염류(5건) 등에 치중하여 발사탄 개량신약 개발을 시

발사탄을 유효성분으로 한  
 '디오반'을 판매하고 있는 Novartis는  
 38건의 특허를 출원하였으며,  
 그 중 복합제제, 신규용도, 제형변경-안정화,  
 구조변경-염류 등에 치중하여  
 발사탄 개량신약 개발을  
 시도하고 있는 것으로 분석된다.

도하고 있는 것으로 분석된다. Novartis 이외에 발사탄 관련 개량기술 개발에 많은 관심을 두고 있는 후발 제약업체는 Takeda, Sankyo, G. D. Searle & Co. 등인 것으로 나타났다으며, 제어방출-지속화, 복합제제, 신규용도 분야에 집중하고 있는 것으로 분석된다. ㉔

(다음 호에 계속)

※ 본고는 2005년 특허청 개량신약기술 특허 동향 보고서를 발췌·정리한 것이다.